

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 743 302**

51 Int. Cl.:

C07D 215/227 (2006.01)

A01N 43/42 (2006.01)

C07D 401/04 (2006.01)

A01P 15/00 (2006.01)

A01P 13/02 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **05.02.2016 PCT/EP2016/052492**

87 Fecha y número de publicación internacional: **18.08.2016 WO16128317**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.02.2016 E 16703127 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **05.06.2019 EP 3256447**

54 Título: **Compuestos de 2-oxo-3,4-dihidroquinolina como reguladores del crecimiento vegetal**

30 Prioridad:

09.02.2015 GB 201502067

28.05.2015 GB 201509129

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

18.02.2020

73 Titular/es:

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (100.0%)

Rosentalstrasse 67

4058 Basel, CH

72 Inventor/es:

LACHIA, MATHILDE DENISE;

LOISELEUR, OLIVIER;

WENDEBORN, SEBASTIAN VOLKER;

JUNG, PIERRE JOSEPH MARCEL;

SABBADIN, DAVIDE y

BECK, ANDREAS

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 743 302 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuestos de 2-oxo-3,4-dihidroquinolina como reguladores del crecimiento vegetal

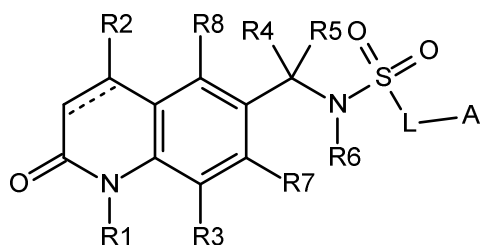
La presente invención se refiere a novedosos derivados de sulfonamida, a procesos e intermediarios para prepararlos, a composiciones reguladoras del crecimiento vegetal que los comprenden y a métodos para usarlas para controlar el crecimiento de plantas, mejorar la tolerancia de las plantas al estrés abiótico (incluidos estreses ambientales y químicos), inhibir la germinación de semillas y/o proteger una planta de los efectos fitotóxicos de productos químicos.

El ácido abscísico (ABA) es una hormona vegetal que tiene un papel importante en el crecimiento, el desarrollo y la respuesta al estrés abiótico de los vegetales. El ABA provoca muchas de sus respuestas celulares mediante unión a una familia soluble de receptores denominada proteínas PIR/PILO que contienen un bolsillo de unión al ligando para el ABA y otros agonistas. La aplicación directa del ABA a las plantas ha demostrado una mejoría en su eficiencia del uso del agua. Sin embargo, el ABA es difícil y costoso de preparar y es inestable en condiciones ambientales y, por lo tanto, inadecuado para aplicaciones agrícolas a gran escala. Es, por lo tanto, deseable buscar agonistas del ABA que puedan ser útiles para mejorar la tolerancia de las plantas al estrés ambiental, tal como sequía, inhibir la germinación de semillas, regular el crecimiento vegetal y mejorar el rendimiento de las cosechas.

El documento WO2013/148339 describió un nuevo agonista de ABA, la quinabactina, que se une a las proteínas receptoras PIR/PRL y provoca una respuesta del ácido abscísico *in vivo*. Se ha descubierto que la quinabactina induce el cierre estomático, suprime la pérdida de agua y promueve la tolerancia a la sequía.

Existe una necesidad de identificar agonistas mejorados de ácido abscísico para mejorar el crecimiento y el desarrollo vegetal y la tolerancia vegetal a los estreses ambientales. La presente invención se refiere a novedosos análogos de quinabactina que tienen propiedades mejoradas. Los beneficios de los compuestos de la presente invención incluyen tolerancia mejorada al estrés abiótico, inhibición mejorada de la germinación de semillas, mejor regulación del crecimiento de las cosechas, rendimiento mejorado de las cosechas y/o propiedades físicas mejoradas que resultan en una mejor captación, solubilidad acuosa, estabilidad química o estabilidad física de la planta.

De acuerdo con la presente invención se proporciona un compuesto de Fórmula (I)



(I),

en donde:

R1 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₇, haloalquilo C₁-C₇, cicloalquilC₃-C₅-alquilo C₁-C₇, alquenilo C₃-C₇, alquinilo C₃-C₇, arilalquilo C₁-C₇, (heterociclilo de 3-6 miembros)-alquilo C₁-C₇, fenilo, cicloalquilo C₃-C₅ y un heterociclilo de 4-6 miembros, cada uno opcionalmente sustituido por uno a tres Rx;

R2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₄;

R3, R7 y R8 se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₄;

R4 y R5 se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₄;

o R4 y R5 pueden formar, junto con el átomo o átomos a los que están directamente unidos, un cicloalquilo C₃-C₄ o heterociclilo C₄;

R6 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₃-C₄, alquinilo C₃-C₄ y alcoxiC₁-C₃-alquilo C₁-C₄;

L se selecciona del grupo que consiste en un enlace, una cadena de alquilo C₁-C₄ lineal, una cadena de alquenilo C₂-C₄ lineal, una cadena de alquinilo C₂-C₄ lineal, una cadena de alcoxi C₁-C₄ lineal en donde el átomo de oxígeno está unido a A, una cadena de aminoalquilo C₁-C₄ lineal en donde el átomo de nitrógeno está unido a A y una cadena de alquiloxiC₁-C₂-alquilo C₁-C₂ lineal, cada una opcionalmente sustituida por uno a tres halógenos, ciano,

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

A es hidrógeno, alquilo C₁-C₇, cicloalquilo C₃-C₅, arilo o heterociclilo de 3-10 miembros, cada uno opcionalmente sustituido por uno a tres Ry;

5 Rx se selecciona, independientemente entre sí, del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxiC₁-C₄carbonilo, ácido carboxílico, aminocarbonilo, aminocarbonilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₄;

10 Ry se selecciona, independientemente entre sí, del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalquiloxi C₁-C₄, alquilC₁-C₄sulfanilo, haloalquilC₁-C₄sulfanilo, alquilC₁-C₄sulfinilo, haloalquilC₁-C₄sulfinilo, alquilC₁-C₄sulfonilo, haloalquilC₁-C₄sulfonilo, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxiC₁-C₄carbonilo, ácido carboxílico, aminocarbonilo, aminocarbonilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₄; dicho cicloalquilo no está sustituido o está sustituido por uno o más Rz; y

Rz se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄;

en donde A no es butilo cuando R4 o R5 es metilo;

y en donde R1 no es metilo cuando R2, R3, R4, R5, R6, R7 y R8 son cada uno hidrógeno;

15 o sales o N-óxidos de los mismos.

Los compuestos de la presente invención pueden existir en diferentes isómeros ópticos (diastereoisómeros y enantiómeros) o geométricos o formas tautoméricas. Esta invención cubre todos estos isómeros y tautómeros y sus mezclas en todas las proporciones, así como formas isotópicas, tales como compuestos deuterados. La invención también abarca todas las sales, N-óxidos y complejos metaloides de los compuestos de la presente invención.

20 Cada resto alquilo, ya sea en forma individual o como parte de un grupo más grande (como alcoxi, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo), es una cadena lineal o ramificada y es, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-butilo, *n*-pentilo, *n*-hexilo, *iso*-propilo, *n*-butilo, *sec*-butilo, *iso*-butilo, *tert*-butilo o *neo*-pentilo. Los grupos alquilo incluyen alquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₄ y alquilo C₁-C₃.

25 El término "alquenilo", tal como se usa en la presente, es un resto alquilo que tiene al menos un enlace carbono-carbono doble, por ejemplo alquenilo C₂-C₆. Ejemplos específicos incluyen vinilo y alilo. El resto alquenilo puede ser parte de un grupo más grande (tal como alquenoxi, alquenoxicarbonilo, alquenilcarbonilo, alquienilaminocarbonilo, dialquenilaminocarbonilo).

El término "acetoxi" se refiere a -OC(=O)CH₃.

30 El término "alquinilo", tal como se usa en la presente, es un resto alquilo que tiene al menos un enlace triple carbono-carbono, por ejemplo alquinilo C₂-C₆. Ejemplos específicos incluyen etinilo y propargilo. El resto alquinilo puede ser parte de un grupo más grande (tal como alquinoxí, alquinoxicarbonilo, alquinilcarbonilo, alquinilaminocarbonilo, dialquinilaminocarbonilo).

Halógeno es flúor (F), cloro (Cl), bromo (Br) o yodo (I).

35 Los grupos haloalquilo (ya sea en forma individual o como parte de un grupo más grande, como haloalcoxi o haloalquilito) son grupos alquilo que se sustituyen por uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes y son, a modo de ejemplo, -CF₃, -CF₂Cl, -CH₂CF₃ o -CH₂CHF₂.

Grupos hidroxialquilo son grupos alquilo que están sustituidos por uno o más grupos hidroxilo y son, por ejemplo, -CH₂OH, -CH₂CH₂OH o -CH(OH)CH₃.

40 Grupos alcoxialquilo son un grupo alcoxi enlazados a un alquilo (R-O-R'), por ejemplo -(CH₂)_rO(CH₂)_sCH₃, en donde r es 1 a 6 y s es 1 a 5.

En el contexto de la presente memoria descriptiva, el término "arilo" refiere a un sistema de anillos que puede ser monocíclico, bicíclico o tricíclico. Ejemplos de dichos anillos incluyen fenilo, naftalenilo, antraceno, indenilo o fenantrenilo.

45 A menos que se indique lo contrario, alquenilo y alquinilo, solos o como parte de otro sustituyente, pueden ser de cadena recta o ramificada y pueden contener de 2 a 6 átomos de carbono y, cuando sea adecuado, pueden tener la configuración (E) o (Z). Ejemplos incluyen vinilo, alilo, etinilo y propargilo.

A menos que se indique lo contrario, cicloalquilo puede ser mono- o bicíclico, puede estar opcionalmente sustituido por uno o más grupos alquilo C₁-C₆ y contener 3 a 7 átomos de carbono. Ejemplos de cicloalquilo incluyen ciclopropilo, 1-metilciclopropilo, 2-metilciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

50 El término "heterociclilo" se refiere a un sistema de anillos que contiene de uno a cuatro heteroátomos que se

- 5 seleccionan de N, O y S, en donde los átomos de nitrógeno y azufre están opcionalmente oxidados y el o los átomos de nitrógeno están opcionalmente cuaternizados. Heterociclilo incluye heteroarilo, análogos saturados y además sus análogos insaturados o parcialmente insaturados tales como 4,5,6,7-tetrahidro-benzotiofenilo, 9H-fluorenilo, 3,4-dihidro-2H-benzo-1,4-dioxepinilo, 2,3-dihidro-benzo-furanilo, piperidinilo, 1,3-dioxolanilo, 1,3-dioxanilo, 4,5-dihidro-isoxazolilo, tetrahidrofuranilo y morfolinilo. Adicionalmente, el término "heterociclilo" incluye heterocicloalquilo, un anillo monocíclico o policíclico no aromático que comprende átomos de carbono e hidrógeno y al menos un heteroátomo que se selecciona de nitrógeno, oxígeno y azufre tal como oxetanilo o tietanilo.
- 10 El término "heteroarilo" se refiere a un sistema de anillos aromáticos que contiene de uno a cuatro heteroátomos que se seleccionan de N, O y S, en donde los átomos de nitrógeno y azufre están opcionalmente oxidados y consisten en un solo anillo o dos o más anillos fusionados. Los anillos simples pueden contener hasta tres heteroátomos y los sistemas bicíclicos hasta cuatro heteroátomos que se seleccionarán, preferiblemente, de nitrógeno, oxígeno y azufre. Ejemplos de dichos grupos incluyen piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, furanilo, tienilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, tiadiazolilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo y tetrazolilo.
- 15 Valores preferidos de R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, L, A, Rx, Ry y Rz son, en cualquier combinación, como se describe a continuación.
- Preferiblemente R1 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilC₃-C₅-alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, fenilo y un heterociclilo de 4-6 miembros, cada uno opcionalmente sustituido por uno a tres Rx.
- 20 Preferiblemente R1 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆ y cicloalquilC₃-C₅-alquilo C₁-C₆. Preferiblemente R1 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₅, cicloalquilC₃-C₅-alquilo C₁-C₂ y haloalquilo C₂-C₄. Preferiblemente, R1 es etilo, isopropilo, *n*-propilo, alilo, ciclopropil-metil o 2,2,2-trifluoro-etilo. La cadena de alquilo puede ser lineal o ramificada. En una realización, R1 es metilo. En una realización, R1 es etilo. En una realización R1 es *n*-propilo o iso-propilo. En una realización R1 es *n*-butilo, iso- butilo, sec- butilo o terc- butilo. En una realización R1 es alilo, ciclopropil-metil o 2,2,2-trifluoro-etilo.
- 25 Preferiblemente R2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄. Preferiblemente, R2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y alquilo C₁-C₄.
- Preferiblemente, R3 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄. Preferiblemente, R3 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno y alquilo C₁-C₄.
- 30 Preferiblemente, cada uno de R4 y R5 se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y alquilo C₁-C₄. Preferiblemente cada uno de R4 y R5 es independientemente hidrógeno o metilo.
- Preferiblemente, R6 es hidrógeno.
- Preferiblemente, cada uno de R7 y R8 se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄.
- 35 Preferiblemente L se selecciona del grupo que consiste en un enlace, una cadena de alquilo C₁-C₄ lineal, una cadena de alquenilo C₂-C₄ lineal y una cadena de alquinilo C₂-C₄ lineal. En una realización, L es un enlace. En una realización, L es una cadena de alquilo C₁-C₄ lineal. En una realización, L es una cadena de alquenilo C₂-C₄.
- 40 Preferiblemente A se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₇, fenilo y heteroarilo de 3-6 miembros, cada uno opcionalmente sustituido por uno a tres Ry. Preferiblemente A es un fenilo o heteroarilo de 5-6 miembros, cada uno opcionalmente sustituido por uno a tres Ry. Preferiblemente A es fenilo opcionalmente sustituido por uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilC₁-C₄sulfanilo y cicloalquilo C₃-C₄. En una realización, A es fenilo opcionalmente sustituido por uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄. En una realización, A es fenilo. En una realización, A es un heteroarilo de 3-6 miembros que se selecciona del grupo que consiste en piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, furanilo, tienilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, tiadiazolilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo y tetrazolilo. En una realización, A es tienilo opcionalmente sustituido por uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.
- 45
- 50 Preferiblemente Rx se selecciona del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄. Preferiblemente Rx se selecciona del grupo que consiste en halógeno y alquilo C₁-C₄. En una realización, Rx es halógeno. En una realización adicional, Rx es metilo. En una realización adicional, Rx es etilo.
- 55 Preferiblemente Ry se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilC₁-C₄sulfanilo y cicloalquilo C₃-C₄. Preferiblemente, Ry se selecciona del grupo que consiste en halógeno, haloalquilo C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄. En una realización, Ry se selecciona del grupo que consiste en ciano, metilo, etilo, ciclopropilo, trifluorometilo, difluorometilo, trifluorometiloxi, difluorometiloxi

y trifluorometilsulfanilo. En una realización, cada uno Ry se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, metilo, etilo, propilo, ciclopropilo y butilo. En una realización adicional, cada uno Ry se selecciona del grupo que consiste en F, Cl y Br. En una realización, Ry es fluoro. En otra realización, Ry es difluorometilo. En otra realización, Ry es trifluorometilo. En otra realización, Ry es haloalquilC₁-C₄sulfanilo.

- 5 Preferiblemente Rz se selecciona del grupo que consiste en halógeno y alquilo C₁-C₄. En una realización, Rz es halógeno.

En una realización de fórmula (I):

R1 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, cicloalquilC₃-C₅-alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆ y haloalquilo C₁-C₆;

- 10 R2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄;

R3, R7 y R8 se selecciona cada uno independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄;

R4 y R5 se selecciona cada uno independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y alquilo C₁-C₄;

R6 es hidrógeno;

- 15 L se selecciona del grupo que consiste en un enlace, una cadena de alquilo C₁-C₄ lineal, una cadena de alquenilo C₂-C₄ lineal y una cadena de alquinilo C₂-C₄ lineal;

A es un arilo o heterociclilo de 3-10 miembros, cada uno opcionalmente sustituido por uno a tres Ry; y

Ry se selecciona del grupo que consiste en ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄.

En una realización adicional de fórmula (I):

- 20 R1 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, cicloalquilC₃-C₅-alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆;

R2, R3, R6, R7 y R8 son hidrógeno;

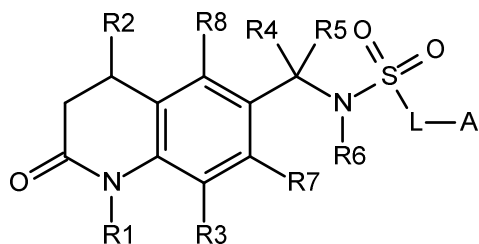
R4 y R5 se selecciona cada uno independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y alquilo C₁-C₄;

L se selecciona del grupo que consiste en un enlace, una cadena de alquilo C₁-C₄ lineal, una cadena de alquenilo C₂-C₄ lineal y una cadena de alquinilo C₂-C₄ lineal;

- 25 A es un arilo o heterociclilo de 3-10 miembros, cada uno opcionalmente sustituido por uno a tres Ry; y

Ry se selecciona del grupo que consiste en ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄.

En una realización de la presente invención se proporciona un compuesto de fórmula (II)



- 30 en donde los sustituyentes son tal como se definen anteriormente; o sales o N-óxidos del mismo. Valores preferidos de R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, L, A, Rx, Ry y Rz para compuestos de fórmula (II) son, en cualquier combinación, tal como se describe anteriormente.

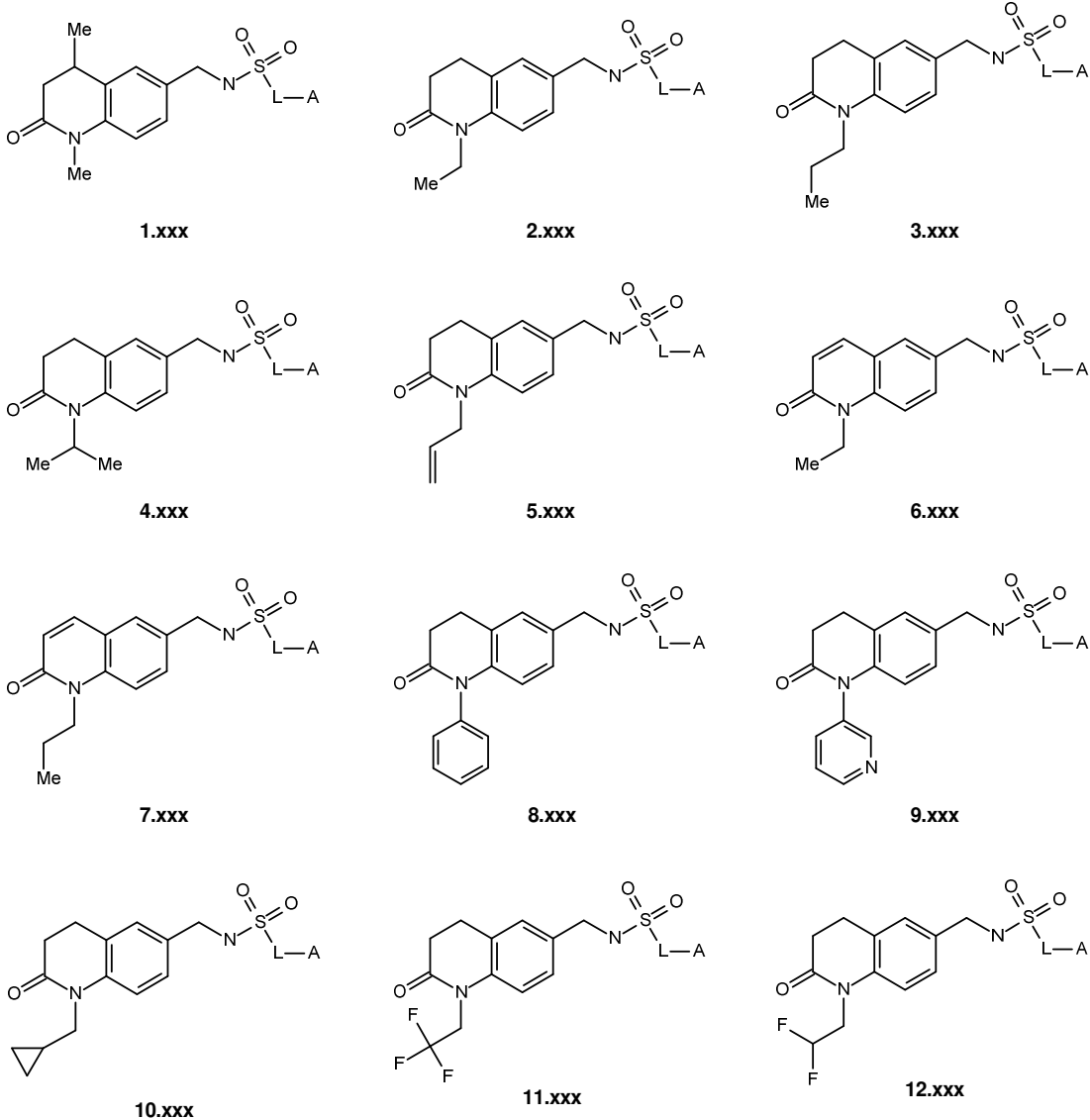
En una realización adicional de la presente invención se proporciona un compuesto de fórmula (III)

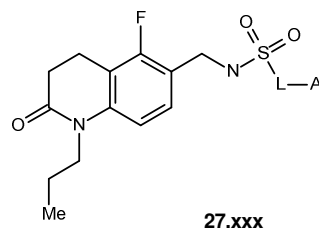
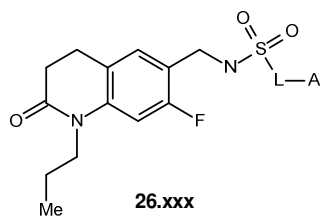
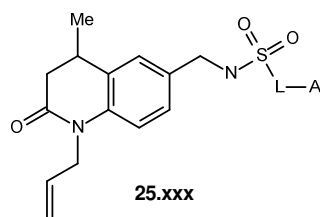
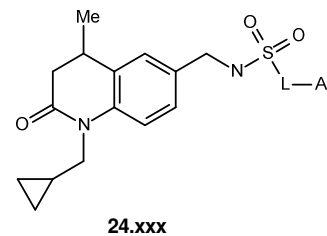
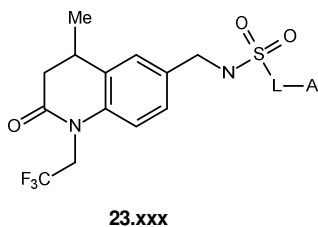
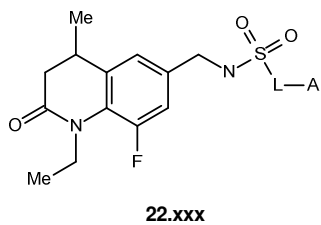
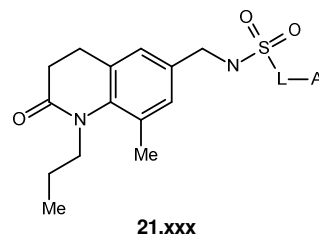
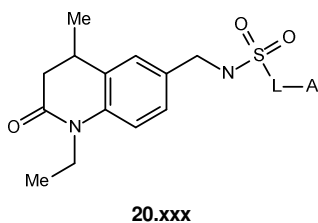
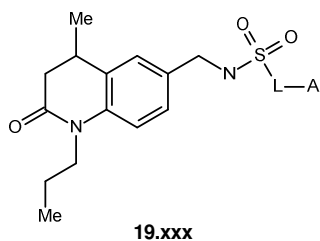
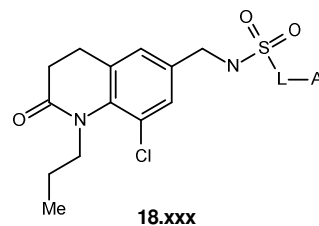
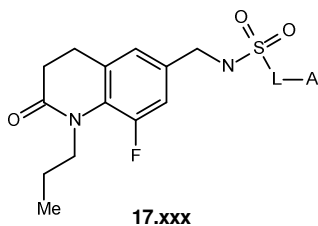
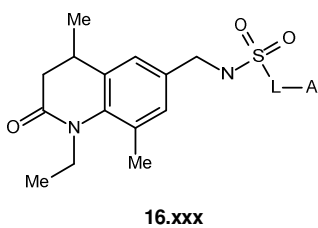
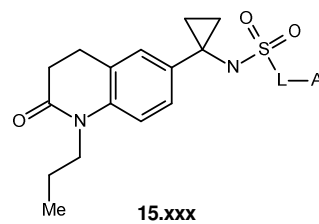
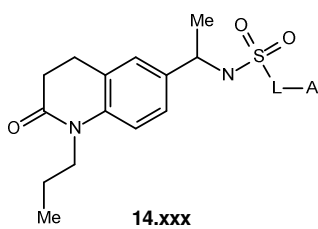
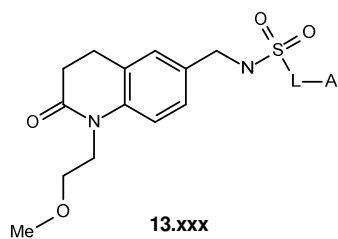
Valores preferidos de R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, A, Rx, Ry y Rz para compuestos de fórmula (IV) son, en cualquier combinación, tal como se describe anteriormente.

La Tabla 1 a continuación incluye ejemplos de compuestos de la presente invención.

TABLA 1

5 Cada una de las siguientes estructuras puede combinarse con las combinaciones de sustituyentes que se muestran en la tabla que figura a continuación, de forma tal que el compuesto específico 1.001 es una estructura 1.xxx combinada con el compuesto x.001, el compuesto específico 5.123 es estructura 5.xxx combinada con el compuesto x.123 en la Tabla y así sucesivamente.





Compuesto	L	A
x.001	enlace	Fenilo
x.002	enlace	4-bromofenilo
x.003	enlace	3-clorofenilo
x.004	enlace	4-clorofenilo
x.005	enlace	2,6-difluorofenilo
x.006	enlace	2,4-difluorofenilo

ES 2 743 302 T3

x.007	enlace	2-fluorofenilo
x.008	enlace	3-fluorofenilo
x.009	enlace	4-fluorofenilo
x.010	enlace	4-metoxifenilo
x.011	enlace	o-tolilo
x.012	enlace	p-tolilo
x.013	enlace	p-tolilmetilo
x.014	enlace	2,4-dimetilfenilo
x.015	enlace	4-(trifluorometil)fenilo
x.016	enlace	4-isopropoxifenilo
x.017	enlace	2-bromofenilo
x.018	enlace	Ciclopropilo
x.019	enlace	Butilo
x.020	enlace	4,4,4-trifluorobutilo
x.021	-CH ₂ -	Fenilo
x.022	-CH ₂ -	4-bromofenilo
x.023	-CH ₂ -	2-fluorofenilo
x.024	-CH ₂ -	p-tolilo
x.025	-CH ₂ -	2,4-difluorofenilo
x.026	-CH ₂ -	2,6-difluorofenilo
x.027	-CH ₂ -	4-(ciclopropil)fenilo
x.028	-CH ₂ -	4-nitrofenilo
x.029	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo
x.030	-CH ₂ -	3-fluorofenilo
x.031	-CH ₂ -	4-clorofenilo
x.032	-CH ₂ -	6-(trifluorometil)-3-piridilo
x.033	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo
x.034	-CH ₂ -	-CH ₂ -metoxicarbonilo
x.035	-CH ₂ -CH ₂ -	Fenilo
x.036	-CH ₂ -	4-bromo-2-fluoro-fenilo
x.037	-CH ₂ -	2,5-difluorofenilo
x.038	-CH ₂ -	2,3-difluorofenilo
x.039	-CH ₂ -	2-bromo-4-fluoro-fenilo
x.040	-CH ₂ -	2-bromo-4-cloro-fenilo
x.041	-CH ₂ -	2-cianofenilo

ES 2 743 302 T3

x.042	-CH ₂ -	4-ciano-2-fluoro-fenilo
x.043	-CH ₂ -	2-cianofenilo
x.044	-CH ₂ -	2-cloro-4-fluoro-fenilo
x.045	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo
x.046	-CH ₂ -	4-(trifluorometoxi)fenilo
x.047	-CH ₂ -	4-(trifluorometil)fenilo
x.048	-CH ₂ -	2-bromofenilo
x.049	-CH ₂ -	3-bromofenilo
x.050	-CH ₂ -	4-(trifluorometilsulfanilfenilo)
x.051	-CH=CH-	Fenilo
x.052	-CH=CH-	4-bromofenilo
x.053	-CH=CH-	4-clorofenilo
x.054	-CH=CH-	5-clorotiazol-2-ilo
x.055	-CH=CH-	5-cloro-2-tienilo
x.056	-CH=CH-	2-fluorofenilo
x.057	-CH=CH-	4-fluorofenilo
x.058	-CH=CH-	5-metil-2-tienilo
x.059	-CH=CH-	p-tolilo
x.060	-CH=CH-	Metilo
x.061	enlace	(5-metil-2-tienilo)
x.062	enlace	Propilo
x.063	enlace	(1-metilimidazol-4-ilo)
x.064	enlace	(2,5-dicloro-3-tienilo)
x.066	-CH ₂ -CH=CH-	Metilo
x.067	enlace	3,3,3-trifluoropropilo
x.068	enlace	3-tienilo
x.069	-CH=CH-	3-clorofenilo
x.070	-CH=CH-	3-bromofenilo
x.071	-CH ₂ -CH=CH-	H
x.072	enlace	2-tienilo
x.073	enlace	(5-cloro-2-tienilo)
x.074	enlace	1-naftilo
x.075	enlace	2-naftilo
x.076	enlace	4-etilfenilo
x.077	enlace	4-propilfenilo

x.078	enlace	4-ciclopropilfenilo
x.079	enlace	2-fluoro-4-metilfenilo

En una realización, los compuestos de la presente invención se aplican en combinación con un adyuvante agrícolamente aceptable. En particular, se proporciona una composición que comprende un compuesto de la presente invención y un adyuvante agrícolamente aceptable. También se mencionará una composición agroquímica que comprende un compuesto de la presente invención.

5 La presente invención proporciona un método para mejorar la tolerancia de una planta al estrés abiótico, en donde el método comprende aplicar a la planta, parte de la planta, material de propagación de la planta o locus del crecimiento de la planta un compuesto, composición o mezcla de acuerdo con la presente invención.

10 La presente invención proporciona un método para regular o mejorar el crecimiento de una planta, en donde el método comprende aplicar a la planta, parte de la planta, material de propagación de la planta o locus del crecimiento de la planta un compuesto, composición o mezcla de acuerdo con la presente invención. En una realización, el crecimiento de una planta se regula o mejora cuando la planta se somete a condiciones de estrés abiótico.

15 La presente invención también proporciona un método para inhibir la germinación de las semillas de una planta, que comprende aplicar a la semilla, o a un locus que contiene semillas, un compuesto, composición o mezcla de acuerdo con la presente invención.

La presente divulgación también proporciona un método para proteger a una planta contra el efecto fitotóxico de productos químicos, que comprende aplicar a la planta, parte de la planta, material de propagación de la planta o locus del crecimiento de la planta un compuesto, composición o mezcla de acuerdo con la presente invención.

20 De forma adecuada el compuesto o composición se aplica en una cantidad suficiente para provocar la respuesta deseada.

De acuerdo con la presente invención, "regular o mejorar el crecimiento de un cultivo" significa una mejora en el vigor de la planta, una mejora en la calidad de la planta, tolerancia mejorada a factores de estrés y/o eficiencia mejorada del uso de insumos.

25 Una "mejora en el vigor de la planta" significa que ciertos rasgos son mejorados cualitativamente o cuantitativamente cuando se comparan con el mismo rasgo en una planta testigo que ha crecido en las mismas condiciones en ausencia del método de la invención. Dichos rasgos incluyen, a modo no taxativo, germinación temprana y/o mejorada, emergencia mejorada, la capacidad de usar menos semillas, mayor crecimiento de las raíces, un sistema de raíces más desarrollado, mayor nodulación de las raíces, mayor crecimiento de brotes, mayor macollamiento, retoños más fuertes, retoños más productivos, una mayor o mejor masa vegetal, menos encamado de las plantas (vuelco de un cultivo), un aumento y/o mejora en la altura de la planta, un aumento en el peso de la planta (fresca o seca), lámina de la hoja más grande, color de la hoja más verde, mayor contenido de pigmento, mayor actividad fotosintética, floración más temprana, panículas más largas, madurez del grano temprana, mayor tamaño de la semilla, fruto o vaina, mayor número de vainas o espigas, mayor número de semillas por vaina o espiga, mayor masa de la semilla, mejor relleno de la semilla, menos hojas basales muertas, retraso de la senescencia, vitalidad de la planta mejorada, mayores niveles de aminoácidos en tejidos de almacenamiento y/o menos necesidad de contribuciones (por ejemplo, se necesita menos fertilizante, agua y/o mano de obra). Una planta con vigor mejorado puede tener un aumento en cualquiera de los rasgos mencionados anteriormente o cualquier combinación o dos o más de los rasgos mencionados anteriormente.

40 Una "mejora en la calidad de la planta" significa que ciertos rasgos son mejorados cualitativamente o cuantitativamente cuando se comparan con el mismo rasgo en una planta testigo que ha crecido en las mismas condiciones en ausencia del método de la invención. Dichos rasgos incluyen, a modo no taxativo, aspecto visual de la planta mejorado, etileno reducido (producción y/o inhibición de recepción reducida), calidad del material cosechado mejorado, por ejemplo semillas, frutas, hojas, vegetales (dicha calidad mejorada puede manifestarse como aspecto visual mejorado del material cosechado), contenido de carbohidratos mejorado (por ejemplo mayores cantidades de azúcar y/o almidón, relación azúcar ácido mejorada, reducción de azúcares de reducción, tasa mejorada de desarrollo de azúcar), contenido de proteínas mejorado, composición y contenido de aceite mejorado, valor nutricional mejorado, reducción de compuestos anti-nutricionales, propiedades organolépticas mejoradas (por ejemplo sabor mejorado) y/o beneficios para la salud del consumidor mejorados (por ejemplo niveles aumentados de vitaminas y anti-oxidantes), características post-cosecha mejoradas (por ejemplo vida útil y/o estabilidad en almacenamiento mejorada, procesamiento más fácil, extracción de compuestos más fácil), mayor desarrollo de cultivos homogéneos (por ejemplo germinación, floración o fructificación de plantas sincronizadas) y/o calidad de semillas mejorada (por ejemplo para su uso en estaciones posteriores). Una planta con calidad mejorada puede tener un aumento en cualquiera de los rasgos mencionados anteriormente o cualquier combinación o dos o más de los rasgos mencionados anteriormente.

55 Una "mayor tolerancia a factores de estrés" significa que ciertos rasgos son mejorados cualitativamente o

cuantitativamente cuando se comparan con el mismo rasgo en una planta testigo que ha crecido en las mismas condiciones en ausencia del método de la invención. Dichos rasgos incluyen, a modo no taxativo, una tolerancia y/o resistencia aumentada a factores de estrés biótico y/o abiótico y en particular factores de estrés abiótico que provocan condiciones de crecimiento subóptimas tal como sequía (por ejemplo cualquier estrés que conduzca a la falta de contenido de agua en plantas, una falta de potencial para la captación de agua o una reducción en la provisión de agua a las plantas), exposición al frío, exposición al calor, estrés osmótico, estrés por UV, inundaciones, salinidad aumentada (por ejemplo en el suelo), exposición mineral aumentada, exposición a ozono, alta exposición a la luz y/o disponibilidad limitada de nutrientes (por ejemplo nutrientes de nitrógeno y/o fósforo). Una planta con tolerancia mejorada a factores de estrés puede tener un aumento en cualquiera de los rasgos mencionados anteriormente o cualquier combinación o dos o más de los rasgos mencionados anteriormente. En el caso de estrés por sequía y nutrientes, dicha tolerancia mejorada puede deberse a, por ejemplo, captación más eficiente, uso o retención de agua y nutrientes. En particular, los compuestos o composiciones de la presente invención son útiles para mejorar la tolerancia al estrés por sequía.

Una 'eficiencia mejorada del uso de insumos' significa que las plantas son capaces de crecer más efectivamente utilizando los niveles dados de insumos en comparación con el crecimiento de las plantas testigo que se cultivan en las mismas condiciones en ausencia del método de la invención. En particular, los insumos incluyen, a modo no taxativo fertilizante (tal como nitrógeno, fósforo, potasio, micronutrientes), luz y agua. Una planta con eficiencia mejorada del uso de insumos puede tener un uso mejorado de cualquiera de los insumos mencionados anteriormente o cualquier combinación de dos o más de los insumos mencionados anteriormente.

Otros efectos para regular o mejorar el crecimiento de un cultivo incluyen una disminución en la altura de la planta o reducción en el macollamiento, que son características beneficiosas en cultivos o condiciones en donde es deseable tener menos biomasa y menos retoños.

Cualquiera o todas las mejoras de cultivo anteriores pueden conducir a un rendimiento mejorado mediante la mejora, por ejemplo, de la fisiología de una planta, del crecimiento y desarrollo de una planta y/o la arquitectura de una planta. En el contexto de la presente invención, 'rendimiento' incluye, a modo no taxativo, (i) un aumento en la producción de biomasa, rendimiento del grano, contenido de almidón, contenido de aceite y/o contenido de proteína, que puede ser el resultado de (a) un aumento en la cantidad producida por la planta en sí misma o (b) una capacidad mejorada para cosechar material vegetal, (ii) una mejora en la composición del material cosechado (por ejemplo, relación azúcar ácido mejorada, composición de aceite mejorada, valor nutricional mejorado, reducción de compuestos anti-nutricionales, más beneficios para la salud del consumidor) y/o (iii) una capacidad aumentada/facilitada para cosechar el cultivo, procesamiento más fácil del cultivo y/o mejor estabilidad en almacenamiento/vida útil. Rendimiento aumentado de una planta agrícola significa que, cuando es posible tomar una medición cuantitativa, el rendimiento de un producto de la planta respectiva se aumenta en una cantidad mensurable con respecto al rendimiento del mismo producto de la planta producido en las mismas condiciones, pero sin aplicación de la presente invención. De acuerdo con la presente invención, se prefiere que el rendimiento aumente al menos 0.5%, más preferiblemente al menos 1%, aún más preferiblemente al menos 2%, aún más preferiblemente al menos 4%, preferiblemente 5% o aún más.

Cualquiera o todas las mejoras de cultivo anteriores también pueden conducir a una utilización mejorada de la tierra, es decir, tierra que previamente no estaba disponible o era sub-óptima para el cultivo puede volverse disponible. Por ejemplo, las plantas que muestran una capacidad aumentada para sobrevivir en condiciones de sequía pueden ser capaces de ser cultivadas en áreas de lluvias sub-óptimas, por ejemplo quizás en el borde de un desierto o incluso el desierto en sí.

En un aspecto de la presente invención, mejoras de cultivo son realizadas en ausencia sustancial de presión de plagas y/o enfermedades y/o estrés abiótico. En un aspecto adicional de la presente invención, las mejoras en vigor de la planta, tolerancia al estrés, calidad y/o rendimiento se obtienen en ausencia sustancial de presión de plagas y/o enfermedades. Por ejemplo las plagas y/o enfermedades pueden controlarse mediante un tratamiento pesticida que se aplica antes o al mismo tiempo que el método de la presente invención. En otro aspecto adicional de la presente invención, las mejoras en el vigor de la planta, tolerancia al estrés, calidad y/o rendimiento se obtienen en ausencia de presión de plagas y/o enfermedad. En una realización adicional, las mejoras en vigor de la planta, calidad y/o rendimiento se obtienen en ausencia o ausencia sustancial de estrés abiótico.

Los compuestos de la presente invención pueden utilizarse solos, pero generalmente se formulan en composiciones utilizando adyuvantes de formulación, tales como portadores, disolventes y agentes tensioactivos (SFAs). De esta forma, la presente invención adicionalmente proporciona una composición que comprende un compuesto de la presente invención y una formulación adyuvante agrícola aceptable. También se proporciona una composición que consiste esencialmente en un compuesto de la presente invención y una formulación adyuvante agrícola aceptable. También se proporciona una composición que consiste en un compuesto de la presente invención y una formulación adyuvante agrícola aceptable.

La presente divulgación adicionalmente proporciona una composición reguladora del crecimiento de planta que comprende un compuesto de la presente invención y una formulación adyuvante agrícola aceptable. También se proporciona una composición reguladora del crecimiento de planta que consiste esencialmente en un compuesto

de la presente invención y una formulación adyuvante agrícolamente aceptable. También se proporciona una composición reguladora del crecimiento de planta que consiste en un compuesto de la presente invención y una formulación adyuvante agrícolamente aceptable.

5 La presente divulgación adicionalmente proporciona una composición para el manejo del estrés abiótico en una planta que comprende un compuesto de la presente invención y una formulación adyuvante agrícolamente aceptable. También se proporciona una composición para el manejo del estrés abiótico en una planta que consiste esencialmente en un compuesto de la presente invención y una formulación adyuvante agrícolamente aceptable. También se proporciona una composición para el manejo del estrés abiótico en una planta que consiste en un compuesto de la presente invención y una formulación adyuvante agrícolamente aceptable.

10 La presente divulgación adicionalmente proporciona una composición inhibidora de la germinación que comprende un compuesto de la presente invención y una formulación adyuvante agrícolamente aceptable. También se proporciona una composición inhibidora de la germinación que consiste esencialmente en un compuesto de la presente invención y una formulación adyuvante agrícolamente aceptable. También se proporciona una composición inhibidora de la germinación que consiste en un compuesto de la presente invención y una formulación adyuvante agrícolamente aceptable.

La composición puede estar en forma de concentrados que se diluyen antes del uso, si bien también se pueden realizar composiciones listas para el uso. La dilución final está hecha usualmente con agua, pero puede estar hecha, en vez o además de con agua, con, por ejemplo, fertilizantes líquidos, micronutrientes, organismos biológicos, aceite o disolventes.

20 Las composiciones generalmente comprenden de 0.1 a 99% en peso, especialmente de 0.1 a 95% en peso, de compuestos de la presente invención y de 1 a 99.9% en peso de una formulación adyuvante que preferiblemente incluye de 0 a 25% en peso de una sustancia tensioactiva.

25 Las composiciones pueden seleccionarse de varios tipos de formulaciones, muchas de las cuales se conocen del Manual Sobre el Desarrollo y Uso de las Especificaciones para Productos para la Protección de Cultivos de la FAO, 5a Edición, 1999. Estas incluyen polvos secos (DP), polvos solubles (SP), gránulos solubles en agua (SG), gránulos dispersables en agua (WG), polvos humectables (WP), gránulos (GR) (de liberación lenta o rápida), concentrados solubles (SL), líquidos miscibles en aceite (OL), líquidos de volumen ultra bajo (UL), concentrados emulsionables (EC), concentrados dispersables (DC), emulsiones (tanto de aceite en agua (EW) como de agua en aceite (EO)), microemulsiones (ME), concentrados de suspensión (SC), sprays, suspensiones en cápsula (CS) y formulaciones de tratamiento de semillas. El tipo de formulación seleccionada en cada caso dependerá del fin particular deseado y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto de la presente invención.

30 Los polvos espolvoreables (DP) se pueden preparar mezclando un compuesto de la presente invención con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo, arcillas naturales, caolín, pirofillita, bentonita, alúmina, montmorillonita, quieselguhr, creta, tierras de diatomeas, fosfatos de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros vehículos sólidos orgánicos e inorgánicos) y moliendo la mezcla mecánicamente hasta obtener un polvo fino.

35 Los polvos solubles (SP) se pueden preparar mezclando un compuesto de la presente invención con una o más sales inorgánicas hidrosolubles (tales como bicarbonato de sodio, carbonato de sodio o sulfato de magnesio) o uno o más sólidos orgánicos hidrosolubles (tales como un polisacárido) y, opcionalmente, uno o más agentes humectantes, uno o más agentes dispersantes o una mezcla de dichos agentes, para mejorar su dispersabilidad/solubilidad en agua. A continuación, la mezcla se muele para obtener un polvo fino. También se pueden granular composiciones similares para formar gránulos solubles en agua (SG).

40 Los polvos humectables (WP) se pueden preparar mezclando un compuesto de la presente invención con uno o más vehículos o diluyentes sólidos, uno o más agentes humectantes y, preferentemente, uno o más agentes dispersantes y, opcionalmente, uno o más agentes de suspensión, para facilitar su dispersión en líquidos. A continuación, la mezcla se muele para obtener un polvo fino. También se pueden granular composiciones similares para formar gránulos dispersables en agua (WG).

45 Los gránulos (GR) pueden formarse granulando una mezcla de un compuesto de la presente invención y uno o más vehículos o diluyentes sólidos en polvo, o a partir de gránulos en blanco preformados absorbiendo un compuesto de la presente invención (o una solución de este en un agente adecuado) en un material granular poroso (tal como piedra pómez, arcillas de atapulgita, tierra de fuller, quieselguhr, tierras de diatomeas o marlos de maíz molidos) o adsorbiendo un compuesto de la presente invención (o una solución de este en un agente adecuado) en un material de núcleo duro (tal como arenas, sílicetos, carbonatos minerales, sulfatos o fosfatos) y secando cuando sea necesario. Los agentes que se emplean habitualmente para facilitar la absorción o adsorción incluyen disolventes (tales como disolventes de petróleo aromáticos y alifáticos, alcoholes, éteres, cetonas y ésteres) y agentes aglutinantes (tales como acetatos de polivinilo, alcoholes polivinílicos, dextrinas, azúcares y aceites vegetales). También se pueden incluir uno o más aditivos diferentes en los gránulos (por ejemplo, un agente emulsionante, agente humectante o agente dispersante).

Los concentrados dispersables (DC) se pueden preparar disolviendo un compuesto de la presente invención en agua o un disolvente orgánico tal como una cetona, alcohol o éter glicólico. Estas soluciones pueden contener un agente tensioactivo (por ejemplo, para mejorar la dilución en agua o evitar la cristalización en un tanque de pulverización).

5 Los concentrados emulsionables (EC) o las emulsiones de aceite en agua (EW) se pueden preparar disolviendo un compuesto de la presente invención en un disolvente orgánico (que contenga opcionalmente uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes o una mezcla de dichos agentes). Los disolventes orgánicos adecuados para emplear en EC incluyen hidrocarburos aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos, por ejemplo, SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO es una marca comercial registrada),
10 cetonas (tales como ciclohexanona o metilciclohexanona) y alcoholes (tales como alcohol bencílico, alcohol furfúrico o butanol), N-alquilpirrolidonas (tales como N-metilpirrolidona o N-octilpirrolidona), dimetilamidas de ácidos grasos (tales como la dimetilamida de un ácido graso C₈-C₁₀) e hidrocarburos clorados. Un producto EC se puede emulsionar espontáneamente al añadir agua para producir una emulsión con suficiente estabilidad para poder aplicarla por pulverización con un equipo adecuado.

15 La preparación de una EW implica obtener un compuesto de la presente invención, ya sea como un líquido (si no es un líquido a temperatura ambiente, se puede fundir a una temperatura razonable, normalmente inferior a 70°C) o en solución (disolviéndolo en un disolvente adecuado) y a continuación emulsionar el líquido o la solución resultante en agua que contenga uno o más SFA, con un cizallamiento elevado, para producir una emulsión. Los disolventes adecuados para emplear en EW incluyen aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobencenos),
20 disolventes aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos) y otros disolventes orgánicos adecuados que presentan una solubilidad baja en agua.

Las microemulsiones (ME) se pueden preparar mezclando agua con una mezcla de uno o más disolventes con uno o más SFA para producir espontáneamente una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Hay un compuesto de la presente invención presente inicialmente en el agua o en la mezcla de disolventes/SFA. Los disolventes adecuados para emplear en ME incluyen los descritos previamente en la presente para emplear en EC o en EW. Una ME puede ser un sistema de aceite en agua o de agua en aceite (se puede determinar qué sistema está presente mediante mediciones de conductividad) y puede ser adecuada para mezclar pesticidas solubles en agua o solubles en aceites en la misma formulación. Una ME se puede diluir en agua, ya sea manteniéndose como una microemulsión o formando una emulsión de aceite en agua convencional.

30 Los concentrados en suspensión (CS) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de la presente invención. Los CS se pueden preparar moliendo el compuesto de la presente invención sólido con un molino de bolas o de microesferas en un medio adecuado, opcionalmente con uno o más agentes dispersantes, para producir una suspensión de partículas finas del compuesto. Se pueden incluir uno o más agentes humectantes en la composición y se puede incluir un agente de suspensión para reducir la velocidad a la cual sedimentan las partículas. Como alternativa, se puede moler un compuesto de la presente invención en seco y añadirlo a agua, la cual contiene los agentes descritos previamente en la presente, para producir el producto final deseado.

Las formulaciones de sprays comprenden un compuesto de la presente invención y un propelente adecuado (por ejemplo, *n*-butano). También se puede disolver o dispersar un compuesto de la presente invención en un medio adecuado (por ejemplo, agua o un líquido miscible en agua tal como *n*-propanol) con el fin de proporcionar composiciones para emplear en bombas de pulverización no presurizadas y activadas manualmente.

Las suspensiones de cápsulas (CS) se pueden preparar de manera similar a la preparación de las formulaciones de tipo EW, pero con una etapa adicional de polimerización, de manera que se obtiene una dispersión acuosa de microgotas de aceite, en la cual cada microgota de aceite está encapsulada en una cubierta polimérica y contiene un compuesto de la presente invención y, opcionalmente, un vehículo o diluyente adecuado para este. La cubierta polimérica se puede producir tanto mediante una reacción de policondensación interfacial como mediante un procedimiento de coacervación. Las composiciones pueden proporcionar una liberación controlada del compuesto de la presente invención y se pueden emplear para el tratamiento de semillas. También se puede formular un compuesto de la presente invención en una matriz polimérica biodegradable para proporcionar una liberación lenta y controlada del compuesto.

La composición puede incluir uno o más aditivos para mejorar el rendimiento biológico de la composición, por ejemplo, mejorando la humectación, retención o distribución en superficies, la resistencia a la lluvia en superficies tratadas o la recaptación o movilidad de un compuesto de la presente invención. Tales aditivos incluyen agentes tensioactivos (SFA), aditivos de pulverización una base de aceites, por ejemplo, ciertos aceites minerales o aceites vegetales naturales (tales como aceite de soja o de colza) y mezclas de estos con otros adyuvantes biomejoradores (ingredientes que pueden ayudar a modificar la acción de un compuesto de la presente invención). Los agentes humectantes, agentes dispersantes y agentes emulsionantes pueden ser agentes tensioactivos de tipo catiónico, aniónico, anfótero o no iónico.

Los SFA adecuados de tipo catiónico incluyen compuestos de amonio cuaternario (por ejemplo, bromuro de

cetiltrimetilamonio), imidazolinas y sales de aminas.

Los SFA aniónicos adecuados incluyen sales de metales alcalinos de ácidos grasos, sales de monoésteres alifáticos de ácido sulfúrico (por ejemplo, lauril sulfato de sodio), sales de compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo, dodecylbencenosulfonato de sodio, dodecylbencenosulfonato de calcio, butilnaftaleno sulfonato y mezclas de di-*isopropil* y tri-*isopropil*-naftalenosulfonatos de sodio), sulfatos de éter, sulfatos de alcohol éter (por ejemplo, lauret-3-sulfato de sodio), carboxilatos de éter (por ejemplo, lauret-3-carboxilato de sodio), ésteres de fosfato (productos de la reacción entre uno o más alcoholes de ácidos grasos y ácido fosfórico (predominantemente monoésteres) o pentóxido de fósforo (predominantemente di-ésteres), por ejemplo la reacción entre alcohol láurico y ácido tetrafosfórico; además, estos productos pueden etoxilarse), sulfosuccinatos, sulfonatos de parafina u olefina, tauratos y lignosulfonatos.

Los SFA adecuados de tipo anfótero incluyen betaínas, propionatos y glicinatos.

Los SFA adecuados de tipo no iónico incluyen productos de la condensación de óxidos de alquileo, tales como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de estos, con alcoholes grasos (tales como alcohol oleílico o alcohol cetílico) o con alquifenoles (tales como octilfenol, nonilfenol u octilcresol); ésteres parciales obtenidos a partir de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol; productos de condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno; polímeros en bloque (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno); alcanolamidas; ésteres simples (por ejemplo, ésteres polietilenglicólicos de ácidos grasos); óxidos de aminas (por ejemplo, óxido de laurildimetilamina); y lecitinas.

Los agentes de suspensión adecuados incluyen coloides hidrófilos (tales como polisacáridos, polivinilpirrolidona o carboximetilcelulosa sódica) y arcillas esponjosas (tales como bentonita o atapulgita).

El compuesto o composición de la presente invención puede aplicarse a una planta, parte de la planta, órgano de la planta, material de propagación de planta o un locus del crecimiento de las plantas.

El término "plantas" se refiere a todas las partes físicas de una planta, incluyendo las semillas, plántulas, plantones, raíces, tubérculos, pedúnculos, tallos, follaje y frutos.

El término "locus", tal como se utiliza en la presente, significa campos en o sobre los cuales están creciendo las plantas o donde se siembran las semillas de plantas cultivadas o donde las semillas se colocarán en el suelo. Incluye suelo, semillas y plántulas, así como vegetación establecida.

La expresión "material de propagación de planta" denota todas las partes generativas de una planta, por ejemplo, semillas o partes vegetativas de plantas tales como esquejes y tubérculos. Incluye semillas en el sentido estricto, así como raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas y partes de plantas.

La aplicación se realiza generalmente pulverizando la composición, típicamente mediante un pulverizador montado en un tractor para áreas más grandes, pero también se pueden usar otros métodos tales como empolvado, riego o empapado. De forma alternativa la composición puede aplicarse en surcos o directamente a una semilla antes o en el momento de plantarla.

El compuesto o composición de la presente invención puede aplicarse pre-emergencia o post-emergencia. De forma adecuada, cuando la composición se utiliza para regular el crecimiento de plantas de cultivo o mejorar la tolerancia al estrés abiótico, puede aplicarse post-emergencia del cultivo. Cuando la composición se utiliza para inhibir o retrasar la germinación de semillas, puede aplicarse pre-emergencia.

La presente invención prevé la aplicación de los compuestos o composiciones de la invención a material de propagación de planta antes, durante o después de la plantación, o cualquier combinación de los mismos.

Aunque pueden aplicarse ingrediente activos al material de propagación de planta en cualquier estado fisiológico, un abordaje común es utilizar semillas en un estado suficientemente duradero para no provocar daño durante el proceso de tratamiento. Generalmente, la semilla sería una semilla que se ha cosechado del campo; se ha quitado de la planta y separado de cualquier mazorca, tallo, vaina externa, pulpa circundante y otro material de planta que no sea semilla. La semilla preferiblemente sería biológicamente estable al punto de que el tratamiento no causaría daño biológico a la semilla. Se cree que el tratamiento puede aplicarse en cualquier momento entre la cosecha de las semillas y la siembra de las semillas incluyendo durante el proceso de siembra.

Métodos para aplicar o tratar los ingredientes activos aplicando o tratando ingredientes activos al material de propagación de planta o al locus de la plantación son conocidos en la técnica e incluyen aplicación de preparación, recubrimiento, granulado e inmersión así como aplicación en bandejas de invernadero, en surcos, riego de suelo, inyección en suelo, irrigación por goteo, aplicación a través de rociadores o pivote central, incorporación en el suelo (al voleo o en banda). De forma alternativa o adicionalmente los ingredientes activos pueden aplicarse sobre un sustrato adecuado sembrado junto con el material de propagación de planta.

Las tasas de aplicación de los compuestos de la presente invención pueden variar dentro de límites amplios y

5 dependen de la naturaleza del suelo, el método de aplicación (pre o post-emergencia; preparación de semillas, aplicación en surcos; sin aplicación de cultivadoras, etc.) la planta de cultivo, las condiciones climáticas presentes y otros factores que se rigen por el método de aplicación, el tiempo de aplicación y el cultivo objetivo. Para la aplicación foliar o por empapado, los compuestos de la presente invención de acuerdo con la invención se aplican generalmente a una tasa de 1 a 2000 g/ha, especialmente de 5 a 1000 g/ha. Para el tratamiento de semillas la tasa de aplicación generalmente se ubica entre 0.0005 y 150g cada 100kg de semilla.

10 Los compuestos y composiciones de la presente invención pueden aplicarse a cultivos dicotiledóneos o monocotiledóneos. Cultivos de plantas útiles en las que puede utilizarse la composición de acuerdo con la invención incluyen cultivos perennes y anuales, tales como plantas de baya como las moras, arándanos, frambuesas y frutillas; cereales, por ejemplo, cebada, maíz, mijo, avena, arroz, centeno, sorgo, triticale y trigo; plantas de fibra, por ejemplo, algodón, lino, cáñamo, yute y sisal; cultivos de campo, por ejemplo, azúcar y remolacha de forraje, café, lúpulos, mostaza, colza (canola), amapola, caña de azúcar, girasol, té y tabaco; árboles frutales, por ejemplo, manzana, damasco, palta, banana, cereza, cítricos, nectarina, durazno, pera y ciruela; pastos, por ejemplo pasto Bermuda, pasto azul, agróstide, ciempiés, festuca, raigrás, césped de San Agustín y césped Zoysia; hierbas, tales como albahaca, borraja, cebollinos, cilantro, lavanda, apio de montaña, menta, orégano, perejil, romero, salvia y tomillo; legumbres, por ejemplo, frijoles, lentejas, arvejas y porotos de soja; nueces, por ejemplo, almendra, cajú, maní, avellana, cacahuete, pistacho y nuez; palmas, por ejemplo, aceite de palma; ornamentales, por ejemplo, flores, arbustos y árboles; otros árboles, por ejemplo, cacao, coco, oliva y caucho; vegetales, por ejemplo, espárrago, berenjena, brócoli, repollo, zanahoria, pepino, ajo, lechuga, calabacín, melón, oca, cebolla, morrón, 20 papa, calabaza, ruibarbo, espinaca y tomate; y vides, por ejemplo, uvas.

Se debe entender por cultivos aquellos que ocurren naturalmente, obtenidos mediante métodos convencionales de reproducción o mediante ingeniería genética. Los mismos incluyen cultivos que contienen las denominadas características genéticas originales (por ejemplo, mejor estabilidad en almacenamiento, valor nutricional más alto y mejor sabor).

25 Se debe entender que los cultivos también incluyen aquellos cultivos que se han vuelto tolerantes a los herbicidas, como el bromoxinil o clases de herbicidas tales como inhibidores de ALS, EPSPS, GS, HPPD y PPO. Un ejemplo de un cultivo que se volvió tolerante a imidazolinonas, por ejemplo, imazamox, mediante métodos convencionales de reproducción es la colza de verano Clearfield®. Ejemplos de cultivos que se han vuelto tolerantes a herbicidas mediante métodos de ingeniería genética incluyen, por ejemplo, variedades de maíz resistentes a glifosato y 30 glufosinato disponibles en el mercado con las marcas RoundupReady®, Herculex I® y Libertilink®.

También debe entenderse que los cultivos son aquellos que son naturalmente resistentes a los insectos dañinos o se han vuelto resistentes a los mismos. Esto incluye plantas transformadas mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, por ejemplo, para ser capaces de sintetizar una o más toxinas de acción selectiva, tal como se conoce, por ejemplo, a partir de las bacterias que producen toxinas. Ejemplos de toxinas que pueden expresarse 35 incluyen δ -endotoxinas, proteínas insecticidas vegetativas (Vip), proteínas insecticidas de nemátodos colonizadores de bacterias y toxinas producidas por escorpiones, arácnidos, avispas y hongos.

Un ejemplo de un cultivo que ha sido modificado para expresar la toxina Bacillus thuringiensis es el maíz Bt KnockOut® (Syngenta Seeds). Un ejemplo de un cultivo que comprende más de un gen que codifica resistencia a los insecticidas y de esa forma expresa más de una toxina es VipCot® (Syngenta Seeds). Los cultivos o el material 40 de semillas de los mismos también pueden ser resistentes a múltiples tipos de plagas (denominados eventos transgénicos apilados cuando se crean mediante modificación genética). Por ejemplo, una planta puede tener la capacidad de expresar una proteína insecticida, siendo al mismo tiempo tolerante a los herbicidas, por ejemplo, Herculex I® (Dow AgroSciences, Pioneer Hi-Bred International).

45 Los compuestos de la presente invención también pueden utilizarse para inhibir o retrasar la germinación de semillas de plantas que no son de cultivo, por ejemplo como parte de un programa de control de malezas integrado. Un retraso en la germinación de semillas de malezas puede proporcionar una plántula de cultivo con un inicio más fuerte mediante la reducción de la competencia con malezas. De forma alternativa los compuestos de la presente invención pueden utilizarse para retrasar la germinación de semillas de plantas de cultivo, por ejemplo para aumentar la flexibilidad del tiempo de plantación para el agricultor.

50 Normalmente, en la gestión de un cultivo, un cultivador utilizaría uno o más productos químicos o biológicos agronómicos además del compuesto o la composición de la presente invención. También se proporciona una mezcla que comprende un compuesto o composición de la presente invención y un ingrediente activo adicional.

55 Ejemplos de productos químicos o biológicos agronómicos incluyen pesticidas, tales como acaricidas, bactericidas, fungicidas, herbicidas, insecticidas, nematocidas, reguladores del crecimiento vegetal, agentes potenciadores de los cultivos, protectores, así como nutrientes de plantas y fertilizantes de plantas. Ejemplos de componentes de mezcla adecuados pueden encontrarse en The Pesticide Manual, 15ª edición (publicado por British Crop Protection Council). Dichas mezclas pueden aplicarse a una planta, material de propagación de planta o locus del crecimiento de la planta simultáneamente (por ejemplo como mezcla pre-formulada o mezcla en tanque), o secuencialmente en una escala temporal adecuada. La co-aplicación de plaguicidas con la presente invención tienen el beneficio adicional de

minimizar el tiempo que el granjero emplea en aplicar los productos a los cultivos. La combinación también puede abarcar rasgos específicos de plantas incorporados en la planta utilizando cualquier medio, por ejemplo, reproducción convencional o modificación genética.

5 También se divulga el uso de un compuesto de fórmula (I), fórmula (II), fórmula (III), o fórmula (IV), o una composición que comprende un compuesto de acuerdo con fórmula (I), (II), (III), o (IV) y una formulación adyuvante agrícolamente aceptable, para mejorar la tolerancia de una planta al estrés abiótico, regular o mejorar el crecimiento de una planta, inhibir la germinación de las semillas y/o proteger una planta contra el efecto fitotóxico de productos químicos.

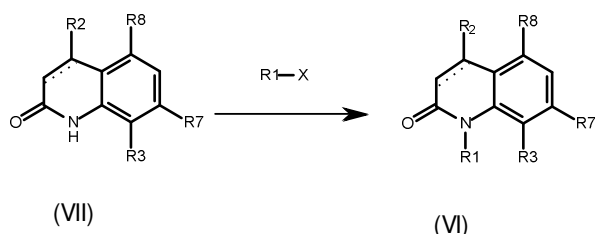
10 También se proporciona el uso de un compuesto, composición o mezcla de la presente invención, para mejorar la tolerancia de una planta al estrés abiótico, regular o mejorar el crecimiento de una planta, inhibir la germinación de las semillas y/o proteger una planta contra el efecto fitotóxico de productos químicos.

Los compuestos de la invención pueden prepararse mediante los siguientes métodos.

Ejemplos de preparación

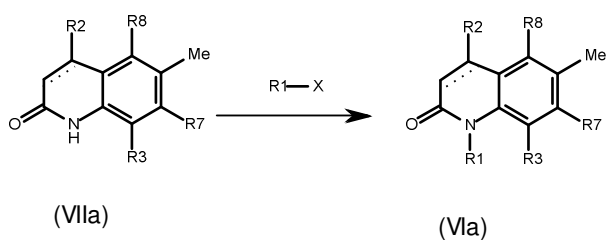
15 Los Esquemas 1-7 proporcionan métodos para preparar los compuestos de fórmula (I), compuestos de fórmula (II) y compuestos de fórmula (III) de la presente invención, en donde R4, R5, R6, R7 y R8 son H cuando están presentes.

ESQUEMA 1:



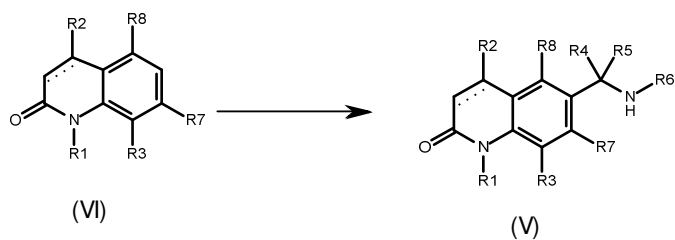
20 Los compuestos de fórmula (VII) están disponibles comercialmente o pueden obtenerse mediante métodos conocidos para el experto en la técnica. Los compuestos de fórmula (VI) pueden prepararse a partir de un compuesto de fórmula (VII) mediante reacción con un agente alquilante de fórmula R1-X, en donde X es un grupo saliente tal como halógeno, mesilato, triflato o tosilato. Por ejemplo, R1-X puede ser yoduro de propilo, yoduro de etilo, bromuro de alilo o yoduro de metilo. Dichas reacciones se llevan a cabo comúnmente en presencia de una base y opcionalmente en presencia de un catalizador nucleófilo.

ESQUEMA 2:



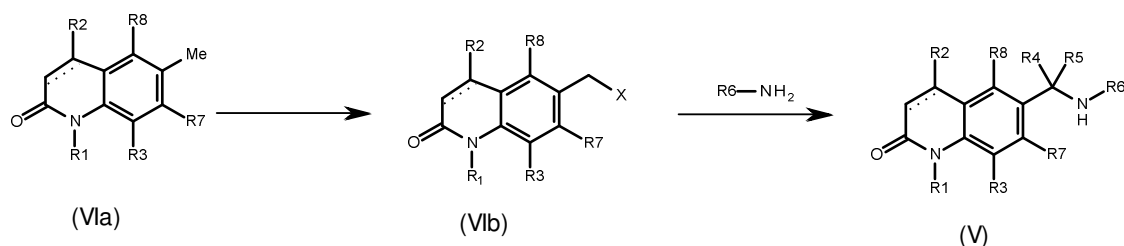
25 Los compuestos de fórmula (VIIa) están disponibles comercialmente o pueden obtenerse mediante métodos conocidos para el experto en la técnica. Los compuestos de fórmula (VIa) pueden prepararse a partir de un compuesto de fórmula (VIIa) mediante reacción con un agente alquilante de fórmula R1-X, en donde X es un grupo saliente tal como halógeno, mesilato, triflato o tosilato. Por ejemplo, R1-X puede ser yoduro de propilo, yoduro de etilo, bromuro de alilo o yoduro de metilo. Dichas reacciones se llevan a cabo comúnmente en presencia de una base y opcionalmente en presencia de un catalizador nucleófilo.

ESQUEMA 3:



Los compuestos de fórmula (V), en donde R4, R5 y R6 son H, pueden prepararse a partir de un compuesto de fórmula (VI) mediante reacción con 2-cloro-*N*-(hidroximetil)acetamida en un disolvente tal como ácido acético y opcionalmente en presencia de un ácido más fuerte tal como ácido sulfúrico, con posterior hidrólisis de la 2-cloroacetamida resultante con un ácido tal como HCl en un disolvente alcohólico. El compuesto (V) puede obtenerse como su sal clorhidrato o una amina libre después de neutralizar con una base.

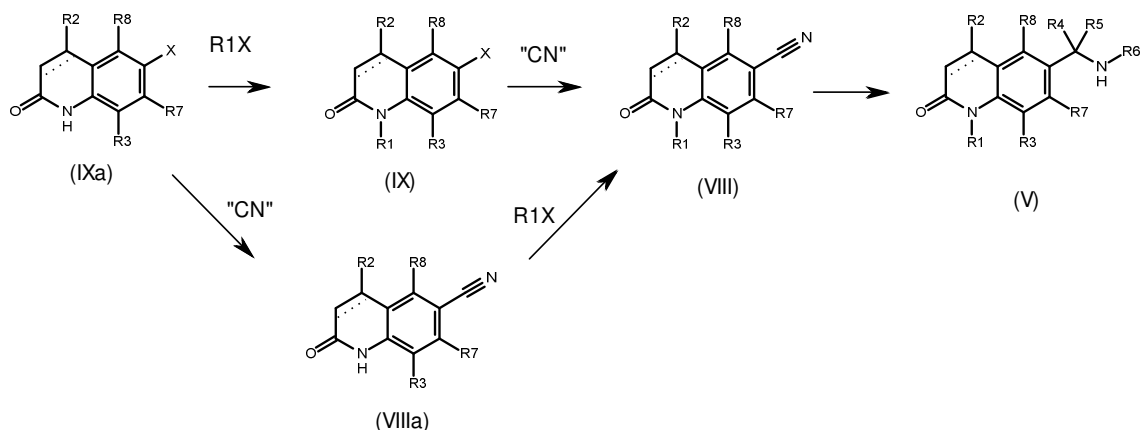
ESQUEMA 4:



Los compuestos de fórmula (V), en donde R4 y R5 son H, pueden prepararse a partir de un compuesto de fórmula (VIb) en donde X es un grupo saliente tal como halógeno, mediante reacción con una amina de fórmula R6NH₂ o su sal clorhidrato de fórmula R6NH₃Cl, en presencia o no de una base tal como trietilamina o diisopropilamina. Por ejemplo, R6NH₂ puede ser amoníaco, metilamina o etilamina.

El compuesto de fórmula (VIb) puede obtenerse a partir de un compuesto de fórmula (VIa) en donde X es un grupo saliente tal como Cl o Br, mediante reacción radical con *N*-bromosuccinimida o *N*-clorosuccinimida en presencia de un iniciador tal como AIBN o peróxido de dibenzoilo.

ESQUEMA 5:



Los compuestos de fórmula (V), en donde R4, R5 y R6 son H, pueden prepararse a partir de un compuesto de fórmula (VIII) mediante reducción del resto ciano bajo atmósfera de hidrógeno en presencia de un catalizador tal como paladio sobre carbón, o mediante un agente reductor tal como borohidruro de sodio en presencia de un catalizador tal como cloruro de níquel o cloruro de cobalto, por ejemplo.

El compuesto de fórmula (VIII) puede obtenerse a partir de un compuesto de fórmula (IX) en donde X es un grupo saliente tal como Cl o Br, I o OTf mediante una reacción de acoplamiento con una sal de cianuro tal como CuCN, NaCN, K₃[Fe(CN)₆], en presencia o no de un catalizador tal como paladio (0) o cobre, eventualmente con un ligante adicional como se describe en la literatura (ver Zanon et al, *J. Am. Chem. Soc.* 2003, 125, 2890-2891, Buchwald, S & all, *Angew. Chem. Int. Ed.* 2013, 52: 10035-10039).

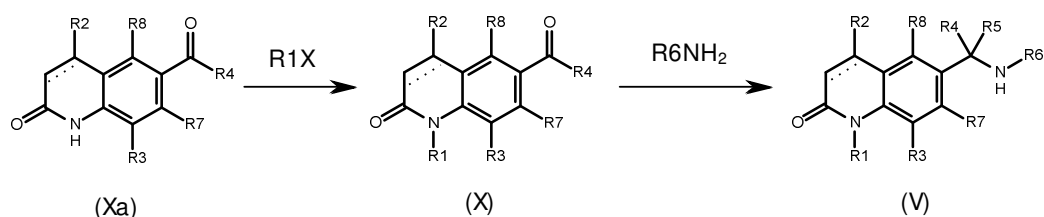
El compuesto de fórmula (IX) puede obtenerse a partir de un compuesto de fórmula (IXa) mediante reacción con un

agente alquilante de fórmula R1-X, en donde X es un grupo saliente tal como halógeno, mesilato, triflato o tosilato. Por ejemplo, R1-X puede ser yoduro de propilo, yoduro de etilo, alilo bromuro, o yoduro de metilo. Dichas reacciones se llevan a cabo comúnmente en presencia de una base y opcionalmente en presencia de un catalizador nucleófilo.

5 De forma alternativa, el compuesto de fórmula (VIII) puede obtenerse a partir de un compuesto de fórmula (VIIIa) mediante reacción con un agente alquilante de fórmula R1-X, en donde X es un grupo saliente tal como halógeno, mesilato, triflato o tosilato. Por ejemplo, R1-X puede ser yoduro de propilo, yoduro de etilo, alilo bromuro, o yoduro de metilo. Dichas reacciones se llevan a cabo comúnmente en presencia de una base y opcionalmente en presencia de un catalizador nucleófilo.

10 El compuesto de fórmula (VIIIa) puede prepararse a partir del compuesto (IXa) en donde X es un grupo saliente tal como Cl o Br, I o OTf mediante una reacción de acoplamiento con una sal de cianuro como se describe para compuesto (VIIIa)

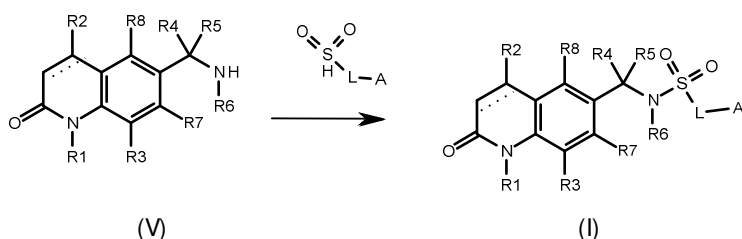
ESQUEMA 6:



15 Los compuestos de fórmula (V) en donde R5 es H, pueden prepararse a partir de un compuesto de fórmula (X) mediante reducción de amina del resto carbonilo en presencia de una amina de fórmula R6NH₂ o su correspondiente sal en presencia de un agente reductor tal como cianoborohidruro de sodio y eventualmente de un ácido orgánico adicional tal como ácido acético.

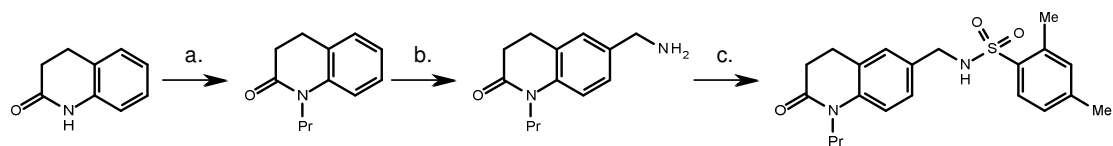
20 El compuesto de fórmula (X) puede obtenerse a partir de un compuesto de fórmula (Xa) mediante reacción con un agente alquilante de fórmula R1-X, en donde X es un grupo saliente tal como halógeno, mesilato, triflato o tosilato. Por ejemplo, R1-X puede ser yoduro de propilo, yoduro de etilo, alilo bromuro, o yoduro de metilo. Dichas reacciones se llevan a cabo comúnmente en presencia de una base y opcionalmente en presencia de un catalizador nucleófilo.

ESQUEMA 7:



25 Los compuestos de fórmula (I) pueden prepararse a partir de un compuesto de fórmula (V) mediante reacción con cloruro de sulfonilo de fórmula A-L-SO₂Cl. Dichas reacciones comúnmente se llevan a cabo en presencia de una base orgánica, tal como N-etildisopropilamina. Por ejemplo, A-L-SO₂Cl puede ser cloruro de bencenosulfonilo, cloruro de bencilsulfonilo o cloruro de butilsulfonilo. Los compuestos de fórmula A-L-SO₂Cl están disponibles comercialmente o pueden obtenerse mediante métodos conocidos para el experto en la técnica.

30 Ejemplo P1: Preparación de 2,4-dimetil-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida (compuesto 3.014)



a. 1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona

35 Se disolvió 3,4-dihidro-1H-quinolin-2-ona (5.00 g, 34 mmol) en dimetilformamida (DMF) (49 mL). Se agregó carbonato de potasio (14.2 g, 102 mmol). A temperatura ambiente, se agregó por goteo 1-bromopropano (12.5 g, 102 mmol, 9.27 mL). La mezcla de reacción se agitó cuatro días a temperatura ambiente y luego se calentó durante 4 h a 60°C. La mezcla de reacción se enfrió hasta alcanzar temperatura ambiente y se vertió en 200 mL de hielo-

agua. La fase acuosa se extrajo con 100ml de acetato de etilo (EtOAc). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera. La fase orgánica se secó con Na₂SO₄, se filtró y se concentró hasta proporcionar 7.3 g de un aceite amarillo claro. El producto bruto se purificó sobre gel de sílice para proporcionar 1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona (5.2 g, 27.5 mmol, 81 %) como un aceite incoloro. ¹H RMN (CDCl₃, 400MHz) δ 0.96 (3H, t); 1.68 (2H, sxt); 2.64 (2H, m); 2.88 (2H, m); 3.90 (2H, t); 6.99 (2H, m); 7.16 (1H, m); 7.24 (1H, m).

b. 6-(aminometil)-1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona

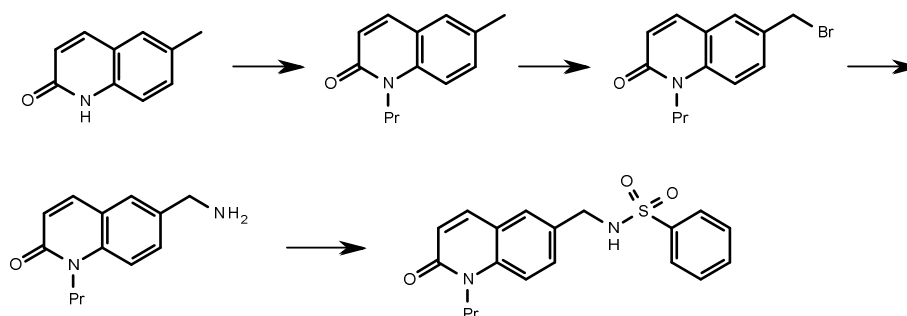
Se agregó 1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona (4.50 g, 23.8 mmol) a una solución de ácido acético (234 mL) y ácido sulfúrico (2.4 mL). A temperatura ambiente, se agregó 2-cloro-N-(hidroximetil)acetamida (3.53 g, 28.5 mmol). La mezcla de reacción se agitó durante 72 h. La mezcla de reacción se vertió en hielo y la mezcla se extrajo con terc-butil metil éter. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con salmuera. La fase orgánica se secó sobre Na₂SO₄, se filtró y se concentró. Se obtuvieron 7.8 g de amida bruta y se purificó sobre gel de sílice para proporcionar 4.1 g de la correspondiente 2-cloroacet- amida, que se agitó adicionalmente en éter de petróleo, se filtró y se secó para proporcionar 3.4 g de un sólido blanco.

La 2-cloroacetamida resultante se disolvió en una mezcla 1:1 de HCl conc./EtOH (25 mL) y luego se calentó hasta alcanzar reflujo durante 3 h, con posterior agitación durante toda la noche. La mezcla de reacción se calentó otra vez a reflujo durante 2 h. El disolvente se evaporó bajo presión reducida y el residuo se agitó en éter, se filtró y se secó para proporcionar 6-(aminometil)-1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona clorhidrato (3.26 g, 12.8 mmol, 54 % de rendimiento) como un sólido beige. ¹H RMN (DMSO, 400MHz) δ 0.87 (3H, t); 1.51 (2H, sxt); 2.53 (2H, m); 2.85 (2H, t); 3.87 (2H, t); 3.94 (2H, c.); 4.86 (2H, s a); 7.18 (1H, d); 7.37 (1H, s); 7.41 (1H, d).

c. 2,4-dimetil-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida (compuesto 3.014)

Se agitó 6-(aminometil)-1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona (0.055 g, 0.216 mmol) en EtOAc (4 mL). La mezcla de reacción se enfrió en hielo. Se agregó diisopropilamina (0.132 mL, 0.756 mmol) y luego cloruro de 2,4-dimetilbencenosulfonilo (0.059 g, 0.281 mmol). La mezcla de reacción se agitó 3 h a 50°C. La mezcla de reacción se concentró. El producto bruto se purificó sobre gel de sílice para proporcionar 2,4-dimetil-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida (59.4 mg, 0.154 mmol, 71 % de rendimiento) como un sólido blanco. P_f: 166°- 167°C; ¹H RMN (CDCl₃, 400MHz) δ 0.94 (3H, t.); 1.62 (2H, sxt); 2.37 (3H, s); 2.58 (4H, m); 2.78 (2H, m); 3.85 (2H, t); 4.05 (2H, d, J = 6.2); 4.89 (1H, t); 6.86 (1H, d); 6.95 (1H, s); 7.04 (1H, dd); 7.10 (2H, m).

Ejemplo P2: Preparación de N-[(2-oxo-1-propil-6-quinolil)metil]bencenosulfonamida (compuesto 7.001)



a. 6-metil-1-propil-quinolin-2-ona

Se disolvió 6-metil-1H-quinolin-2-ona (5.00 g, 31.41 mmol) en DMF (50 mL). Se agregó carbonato de potasio (8.68 g, 62.8 mmol) y luego 1-bromopropano (19.3 g, 157 mmol, 14.3 mL). La mezcla de reacción se agitó durante toda la noche a temperatura ambiente y luego se vertió en 200 mL de hielo-agua. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo y las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera. La fase orgánica se secó con Na₂SO₄, se filtró y se concentró para proporcionar 9.1 g de un aceite amarillo claro. El producto bruto se purificó sobre gel de sílice para proporcionar 6-metil-1-propil-quinolin-2-ona (2.3 g, 11 mmol, 36 %) como un aceite incoloro. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.04 (t, 3 H), 1.73 - 1.82 (m, 2 H), 2.41 (s, 3 H), 4.20 - 4.27 (m, 2 H), 6.65 - 6.70 (m, 1 H), 7.26 (s, 1H), 7.33 - 7.39 (m, 2 H), 7.60 (d, 1 H); LC-MS (Método A): TR 0.90, (202, M+H⁺).

b. 6-(bromometil)-1-propil-quinolin-2-ona

Se disolvió 6-metil-1-propil-quinolin-2-ona (2.5 g, 12 mmol) en una solución de tetracloruro de carbono (5 mL) y 1-bromopirrolidina-2,5-diona (2.5 g, 14 mmol). La mezcla de reacción se agitó y se calentó a 80°C y luego se agregó azobisisobutironitrilo (0.2 g, 1.2 mmol). La solución resultante se agitó a 80°C durante 6 h y luego se enfrió. Se agregó agua y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron con Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron para proporcionar 0.61 g de un aceite amarillo. El producto bruto se purificó sobre gel de sílice para proporcionar 6-(bromometil)-1-propil-quinolin-2-ona (2.6 g, 9.3 mmol, 75%). ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.02 - 1.08 (m, 3 H), 1.77 (sxt, 2 H), 4.19 - 4.29 (m, 2 H), 4.58 (s, 2 H), 6.72 (d, 1

H), 7.31 - 7.36 (m, 1 H), 7.56 - 7.66 (m, 3 H); LC-MS (MétodoA): TR 0.94, (280, M+H⁺).

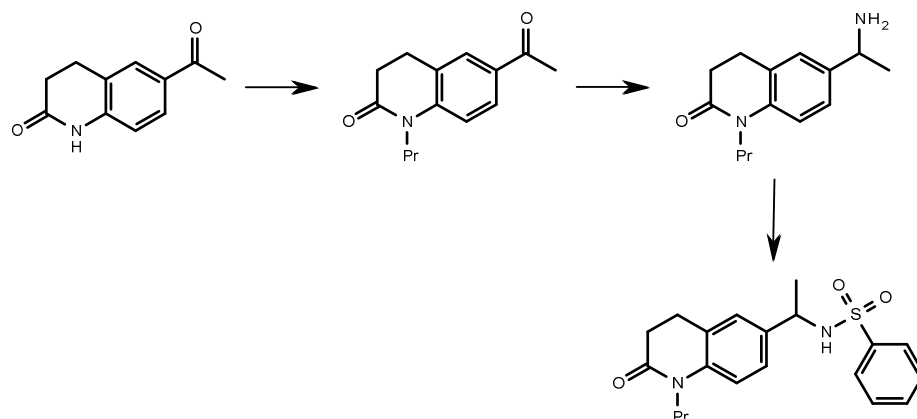
c. 6-(aminometil)-1-propil-quinolin-2-ona

Se disolvió 6-(bromometil)-1-propil-quinolin-2-ona (1.6 g, 5.7 mmol) en una solución de NH₃/MeOH (41 mL, 7 mol/L). La solución amarilla se agitó durante toda la noche, después de la conversión completa la solución se concentró al vacío y se purificó sobre gel de sílice para proporcionar 6-(aminometil)-1-propil-quinolin-2-ona (710 mg, 3.28 mmol, 57%); ¹H RMN (400 MHz, MeOH) δ ppm 1.03 (t, 3 H), 1.72 - 1.81 (m, 2 H), 4.20 (s, 2 H), 4.29 - 4.35 (m, 2 H), 6.72 (d, 1 H), 7.66 - 7.74 (m, 2 H), 7.78 (d, 1 H), 7.92 (d, 1 H); LC-MS (Método A): TR 0.26, (218, M+H⁺).

d. N-[(2-oxo-1-propil-6-quinolil)metil]bencenosulfonamida (compuesto 7.001)

Se agitó 6-(Aminometil)-1-propil-quinolin-2-ona (0.100 g, 0.462 mmol) en EtOAc (4 mL). La mezcla de reacción se enfrió en hielo. Se agregó diisopropiltilamina (0.179 mg, 1.38 mmol) y luego cloruro de bencenosulfonilo (0.089 g, 0.508 mmol). La reacción de reacción se agitó durante toda 1 h y se concentró. El producto bruto se purificó sobre gel de sílice para proporcionar N-[(2-oxo-1-propil-6-quinolil)metil]bencenosulfonamida (86 mg, 52 % de rendimiento) como un sólido blanco. Pf.: 204°- 206°C; ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d6) δ ppm 0.93 (t, 3 H), 1.60 (sxt, 2 H), 4.06 (d, 2 H), 4.11 - 4.21 (m, 2 H), 6.53 - 6.64 (m, 1 H), 7.51 (s, 1 H), 7.41 - 7.48 (m, 2 H), 7.51 - 7.64 (m, 3 H), 7.76 - 7.86 (m, 3 H), 8.21 (t, 1 H); LC-MS (Método A): TR 0.85, (357, M+H⁺).

Ejemplo P3: Preparación de N-[1-(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)etil]bencenosulfonamida (compuesto 14.001)



a. Preparación de 6-acetil-1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona

Se disolvió 6-acetil-3,4-dihidro-1H-quinolin-2-ona (500 mg, 2.64 mmol) en DMF (5 mL) y se agregó carbonato de potasio (0.547 g, 3.96 mmol) y luego 1-bromopropano (0.487 g, 3.96 mmol, 0.36 mL). La mezcla de reacción se agitó durante toda la noche a temperatura ambiente y se agregaron más carbonato de potasio (0.550 g, 1.5 eq.) y 1-bromopropano (0.18 mL, 0.75 eq.). La mezcla de reacción se calentó a 50°C hasta que se completó la conversión, se enfrió hasta alcanzar temperatura ambiente y se vertió en hielo-agua. La fase de agua se extrajo con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua, salmuera, se secaron con Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron. El producto bruto se purificó sobre gel de sílice para proporcionar 6-acetil-1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona (499 mg, 2.15 mmol, 81 %) como un sólido blanco. Pf.: 90-93°C; ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 0.97 (t, 3 H), 1.62 - 1.72 (m, 2 H), 2.57 - 2.59 (m, 3 H), 2.68 (dd, 2 H), 2.93 - 2.98 (m, 2 H), 3.89 - 3.97 (m, 2 H), 7.03 (d, 1 H), 7.77 - 7.88 (m, 2 H); LC-MS (Método A): TR 0.84, (232, M+H⁺).

b. Preparación de 6-(1-aminoetil)-1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona

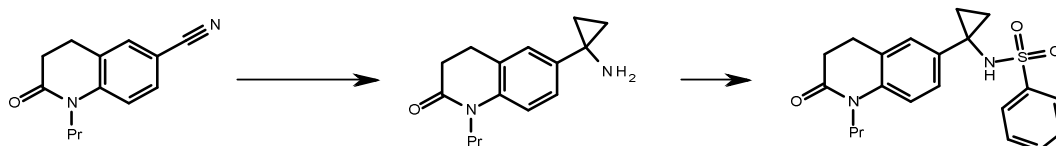
Se disolvió 6-acetil-1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona (480 mg, 2.08 mmol) en metanol (7 mL, 2.08 mmol), luego se agregaron acetato de amonio (1.62 g, 20.8 mmol) y cianoborohidruro de sodio (0.686 g, 10.4 mmol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. El disolvente se eliminó bajo presión reducida y el residuo se disolvió en acetato de etilo y se acidificó con HCl 2M (hasta pH: 2). La capa orgánica se desechó. Luego, la capa acuosa se trató con NaOH 2M (hasta pH: 12) y se extrajo 3x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre Na₂SO₄, se filtró y se evaporó para proporcionar 177 mg de aceite incoloro.

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 0.96 (t, 3 H), 1.38 (d, 3 H), 1.66 - 1.72 (m, 2 H), 2.63 (dd, 2 H), 2.84 - 2.91 (m, 2 H), 3.85 - 3.91 (m, 2 H), 4.06 - 4.16 (m, 2 H), 6.94 (d, 1 H), 7.15 - 7.22 (m, 2 H); LC-MS (Método A): TR 0.76, (234, M+H⁺).

c. N-[1-(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)etil]bencenosulfonamida (compuesto 14.001)

Se agitó 6-(1-aminoetil)-1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona (0.050 g, 0.215 mmol) en EtOAc (2 mL). La mezcla de reacción se enfrió en hielo. Se agregó diisopropiletilamina (0.093 mL, 0.538 mmol) y luego cloruro de bencenosulfonilo (0.039 g, 0.215 mmol). La mezcla de reacción se agitó durante toda la noche y se concentró. El producto bruto se purificó sobre gel de sílice para proporcionar N-[(2-oxo-1-propil-6-quinolil)metil]bencenosulfonamida (49 mg, 61 % de rendimiento) como una goma incolora. ^1H RMN (400 MHz, CLOROFORMO-d) δ ppm 0.94 (t, 3 H), 1.42 (d, 3 H), 1.62 (sxt, 2 H), 2.49 - 2.59 (m, 2 H), 2.64 - 2.81 (m, 2 H), 3.77 - 3.89 (m, 2 H), 4.47 (quin, 1 H), 5.08 - 5.26 (m, 1 H), 6.79 (d, 1 H), 6.84 (d, 1 H), 6.99 (dd, 1 H), 7.33 - 7.42 (m, 2 H), 7.44 - 7.52 (m, 1 H), 7.67 - 7.80 (m, 2 H); LC-MS (Método A): TR 0.93, (373, M+H⁺).

Ejemplo P4: Preparación de N-[1-(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)ciclopropil]bencenosulfonamida (compuesto 15.001)



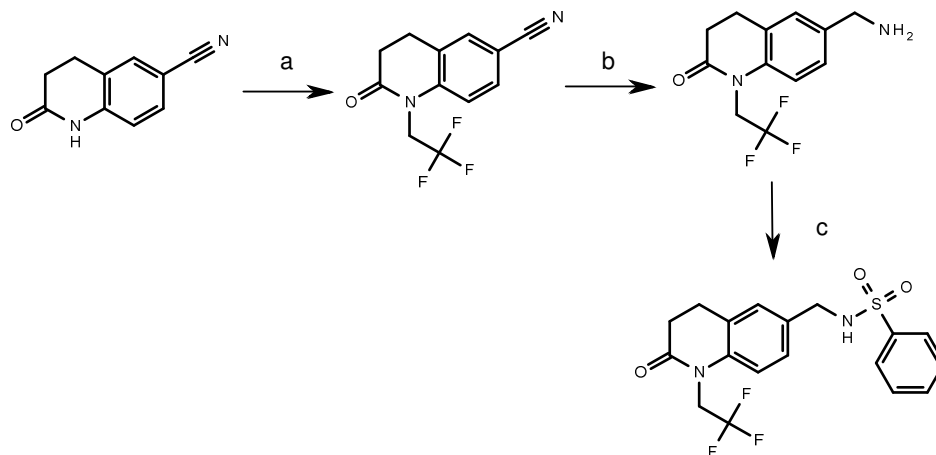
a. Preparación de 6-(1-aminociclopropil)-1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona

Bajo argón, se disolvió 2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolina-6-carbonitrilo (0.215 g, 1 mmol) en éter dietílico (10 ml). Se agregó isopropóxido de titanio(IV) (0.323 g, 1.1 mmol) y la mezcla de reacción se enfrió hasta alcanzar 0°C. Se agregó por goteo bromuro de etilmagnesio (1.0 mol/L) en TBME (2.2 mL, 1.9 g, 2.2 mmol) y se agitó durante 10 min luego se entibió hasta alcanzar temperatura ambiente. Se agregó bortrifluoridietiléterat (0.265 ml, 0.323 g) y se agitó. Se agregó una solución de ácido clorhídrico (1M), luego TBME a la mezcla de reacción, la capa acuosa se recogió y se trató con hidróxido de sodio (2M) hasta pH=10). Luego se extrajo con TBME tres veces. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con salmuera, se secaron sobre Na₂SO₄ y se concentraron al vacío. El residuo se purificó sobre gel de sílice para proporcionar 6-(1-aminociclopropil)-1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona (77 mg, 0.315 mmol) como un aceite incoloro. ^1H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 0.94 (d, 3 H) 1.66 (sxt, 2 H) 2.61 - 2.66 (m, 2 H) 2.85 - 2.90 (m, 2 H) 3.85 - 3.91 (m, 2H) 6.92 (d, 1 H) 7.09 - 7.19 (m, 2 H). LC-MS (Método A): TR 0.55, (245, M+H⁺).

b. N-[1-(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)ciclopropil]bencenosulfonamida (compuesto 15.001)

Se agitó 6-(1-aminociclopropil)-1-propil-3,4-dihidroquinolin-2-ona (0.050 g, 0.204 mmol) en EtOAc (2 mL). La mezcla de reacción se enfrió en hielo. Se agregó diisopropiletilamina (0.087 mL, 0.511 mmol) y luego cloruro de bencenosulfonilo (0.037 g, 0.204 mmol). La mezcla de reacción se agitó durante toda la noche y se concentró. El producto bruto se purificó sobre gel de sílice para proporcionar N-[1-(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)ciclopropil]bencenosulfonamida (57 mg, 72 % de rendimiento) como una goma incolora. ^1H RMN (400 MHz, CLOROFORMO-d) δ ppm 0.87 - 0.98 (m, 3 H), 1.02 - 1.08 (m, 2 H), 1.29 - 1.37 (m, 2 H), 1.59 (sxt, 2 H), 2.48 - 2.57 (m, 2 H), 2.61 - 2.70 (m, 2 H), 3.76 - 3.88 (m, 2 H), 6.11 (s, 1 H), 6.64 - 6.74 (m, 1 H), 6.84 (d, 1 H), 7.01 (dd, 1 H), 7.24 - 7.32 (m, 2 H), 7.36 - 7.44 (m, 1 H), 7.61 - 7.68 (m, 2 H); LC-MS (Método A): TR 0.93, (385, M+H⁺).

Ejemplo P5: Preparación de 6-(aminometil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroquinolin-2-ona (compuesto 11.001)



a. 2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroquinolina-6-carbonitrilo

Se disolvió 2-oxo-3,4-dihidroquinolina-6-carbonitrilo (0.500 g, 2.90 mmol) en DMF (15 mL) y se agregó carbonato de potasio (1.01 g, 7.26 mmol) y luego 2,2,2-trifluoroetil trifluorometanosulfonato (0.604 mL, 4.07 mmol) por goteo. La mezcla de reacción se calentó hasta alcanzar 50°C y se agitó durante 2h. Se agregó otro equivalente 0.5 de 2,2,2-trifluoroetil trifluorometanosulfonato (0.216 mL) y la mezcla de reacción se agitó durante otras 2 h. La mezcla de reacción se vertió en agua y se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua y con salmuera, se secaron sobre Na₂SO₄ y se concentraron. El producto bruto se purificó sobre gel de sílice para proporcionar 2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroquinolina-6-carbonitrilo (0.485 g, 66%) como una goma amarilla clara. ¹H RMN (400 MHz, CLOROFORMO-d) δ ppm 2.73 - 2.81 (m, 2 H), 2.98 - 3.07 (m, 2 H), 4.67 (c, 2 H), 7.15 (d, 1 H), 7.45 - 7.53 (m, 1 H), 7.59 (dd, 1 H); LC-MS (Método A): TR 0.84, (255, M+H⁺).

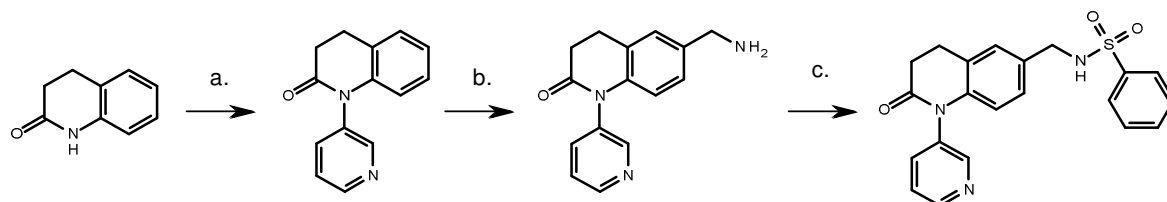
10 b. 6-(aminometil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroquinolin-2-ona

Se colocaron 2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroquinolina-6-carbonitrilo (0.485 g, 1.91 mmol) y Pd/C 10% (0.049 g, 0.046 mmol) en un matraz bajo argón y se agregó etanol desgasificado (19 mL). Se agregó ácido clorhídrico acuoso (32 mas%, 1.404 mL) y la mezcla de reacción se agitó bajo una atmósfera de hidrógeno molecular durante toda la noche. La mezcla de reacción se filtró a través de una almohadilla de celite y se concentró para proporcionar la 6-(aminometil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroquinolin-2-ona bruta (602 mg, cuant) como su sal clorhidrato. El compuesto se utilizó como tal en el siguiente paso. ¹H RMN (400 MHz, METANOL-d4) δ ppm 2.70 (t, 2 H), 2.98 (t, 2 H), 4.08 (s, 2 H), 4.74 - 4.85 (m, 2 H), 7.26 - 7.47 (m, 3 H); LC-MS (Método A): TR 0.30, (255, M+H⁺).

c. N-[[2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]bencenosulfonamida (compuesto 11.001)

20 Se suspendió 6-(aminometil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroquinolin-2-ona clorhidrato (0.150 g, 0.509 mmol) en acetato de etilo (5 mL) y se agregó por goteo *N*-etil-*N*-isopropil-propan-2-amina (0.218 mL, 1.27 mmol). Luego se agregó cloruro de bencenosulfonilo (0.102 g, 0.560 mmol) gota a gota y la mezcla de reacción se agitó durante 3 h a temperatura ambiente. Los disolventes se retiraron al vacío y el compuesto bruto se purificó sobre gel de sílice para proporcionar *N*-[[2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]bencenosulfonamida (144 mg, 71%) de un sólido amarillo claro. ¹H RMN (400 MHz, CLOROFORMO-d) δ ppm 1.26 (t, 1 H), 2.05 (s, 1 H), 2.61 - 2.72 (m, 2 H), 2.82 - 2.91 (m, 2 H), 4.04 - 4.17 (m, 2 H), 4.04 - 4.19 (m, 3 H), 4.61 (c, 2 H), 5.03 (t, 1 H), 6.94 (d, 1 H), 7.01 - 7.06 (m, 1 H), 7.07 - 7.16 (m, 1 H), 7.47 - 7.54 (m, 2 H), 7.55 - 7.66 (m, 1 H), 7.86 (d, 2 H); LC-MS (Método A): TR 0.92, (399, M+H⁺).

Ejemplo P6: Preparación de N-[[2-oxo-1-(3-piridil)-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]bencenosulfonamida 9.001



30 a. 1-(3-piridil)-3,4-dihidroquinolin-2-ona

35 Se agregaron bajo argón 3,4-dihidro-1H-quinolin-2-ona (0.736 g, 5.00 mmol), carbonato de cesio (4.14 g, 12.5 mmol), yoduro de cobre (0.145, 1 mmol) y etil 2-oxociclohexanocarboxilato (0.426 g, 2.25 mmol). Luego se agregó 3-yodopiridina (1.13 g, 5.5 mmol) en dimetilsulfóxido (5 mL) y la mezcla de reacción se calentó a 110°C durante 3 h. La mezcla se vertió en 20 mL de hielo-agua, la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo y las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, se secaron con Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron. El producto bruto se purificó sobre gel de sílice para proporcionar 1-(3-piridil)-3,4-dihidroquinolin-2-ona (746 mg, 3.32 mmol, 66.5 %). ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 2.82 - 2.89 (m, 2 H), 3.06 - 3.13 (m, 2 H), 6.34 (d, 1 H), 7.00 - 7.10 (m, 2 H), 7.24 (d, 1 H), 7.46 (dd, 1 H), 7.64 (dt, 1 H), 8.52 (d, 1 H), 8.66 (dd, 1 H); LC-MS (Método A): TR 0.72, (225, M+H⁺).

b. 6-(aminometil)-1-(3-piridil)-3,4-dihidroquinolin-2-ona

40 1-(3-piridil)-3,4-dihidroquinolin-2-ona (312 mg, 1.39 mmol) en ácido acético (5 mL) se disolvió en ácido sulfúrico (1.5 mL), luego se agregó 2-cloro-*N*-(hidroximetil)acetamida (0.171 g, 1.39 mmol), la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas a 50°C. Se agregaron agua helada y una solución de carbonato de potasio, la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo y la fase orgánica se secó y se concentró al vacío. El producto bruto se purificó mediante cromatografía instantánea para proporcionar 2-cloro-*N*-[[2-oxo-1-(3-piridil)-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]acetamida (177 mg, 38%); ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 2.84 (dd, 2 H), 3.05 - 3.13 (m, 2 H), 4.06 - 4.13 (m, 2 H), 4.43 (d, 2 H), 6.32 (d, 1 H), 6.90 (br. s., 1 H), 6.99 (d, 1 H), 7.19 (s, 1 H), 7.47 (dd, 1 H), 7.62 (dt, 1 H), 8.50 (d, 1 H), 8.67 (dd, 1 H); LC-MS (Método A): TR 0.62, (328, M-H⁺), (329, M+H⁺).

A 2-cloro-*N*-[[2-oxo-1-(3-piridil)-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]acetamida (167 mg, 0.506 mmol) en etanol (1.25 mL) se agregó ácido clorhídrico (1.25 mL). La mezcla de reacción se agitó durante toda la noche a 90-95°C. Se agregó

etanol (10 mL) a esta mezcla y el precipitado se filtró, luego se lavó con etil éter para proporcionar 6-(aminometil)-1-(3-piridil)-3,4-dihidroquinolin-2-ona diclorhidrato (155 mg, 93%) que se utilizó directamente en el siguiente paso; LC-MS (Método A): TR 0.22, (254, M+H⁺).

c. Preparación de N-[[2-oxo-1-(3-piridil)-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]bencenosulfonamida (compuesto 9.001)

- 5 Se suspendió 6-(aminometil)-1-(3-piridil)-3,4-dihidroquinolin-2-ona diclorhidrato (0.163 g, 0.50 mmol) en acetato de etilo (6.5 mL) con diisopropiletilamina (0.226 g, 1.75 mmol) y se agitó a temperatura ambiente durante 15 min. Se agregó cloruro de bencenosulfonilo (0.115 g, 0.65 mmol) y la mezcla de reacción se agitó durante el fin de semana a temperatura ambiente. Se agregó agua y se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con una solución de hidrogenocarbonato de sodio, se secaron y se concentraron para proporcionar N-[[2-oxo-1-(3-piridil)-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]bencenosulfonamida (48 mg, 24%) después de purificar mediante cromatografía instantánea. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 2.76 - 2.85 (m, 2 H), 2.98 - 3.05 (m, 2 H), 4.06 - 4.13 (m, 2 H), 4.83 (t, 1 H), 6.23 (d, 1 H), 6.88 (d, 1 H), 7.11 (s, 1 H), 7.46 (dd, 1 H), 7.49 - 7.56 (m, 2 H), 7.60 (d, 2 H), 7.87 (d, 2 H), 8.42 (d, 1 H), 8.66 (d, J=3.67 Hz, 1 H); LC-MS (Método A): TR 0.79, (392, M-H⁺), (394, M+H⁺).

15 Los compuestos de la presente invención se prepararon utilizando estos métodos, tal como se muestra en la tabla que figura a continuación.

Compuesto	Nombre	TR (min)	[M+H] (medido)	Método	PF (°C)
2.024	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-(p-tolil)metanosulfonamida	0.91	373	A	
3.024	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-(p-tolil)metanosulfonamida	0.96	387	A	
2.015	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-4-(trifluorometil)bencenosulfonamida	0.94	413	A	180-181
2.012	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-4-metil-bencenosulfonamida	0.89	359	A	202-203
3.012	4-metil-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.94	373	A	153-154
3.015	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-4-(trifluorometil)bencenosulfonamida	0.99	427	A	138-140
2.006	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2,4-difluoro-bencenosulfonamida	0.86	381	A	167-168
2.009	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-4-fluoro-bencenosulfonamida	0.85	363	A	190-191
2.017	2-bromo-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.87	425	A	206-207
2.011	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2-metil-bencenosulfonamida	0.88	359	A	203-206
2.014	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2,4-dimetil-bencenosulfonamida	0.93	373	A	199-200
2.001	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.84	346	A	114-124
2.010	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-4-metoxi-bencenosulfonamida	0.85	375	A	147-150
2.007	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2-fluoro-bencenosulfonamida	0.84	364	A	155-163
2.002	4-bromo-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida				176-183
3.006	2,4-difluoro-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-	0.91	395	A	141-

ES 2 743 302 T3

	dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida				144
3.005	2,6-difluoro-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.88	395	A	182-183
3.009	4-fluoro-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.9	377	A	143-144
3.007	2-fluoro-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.89	377	A	155-156
3.001	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.89	359	A	159-161
3.011	2-metil-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.93	373	A	163-165
3.004	4-cloro-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.95	393	A	138-139
3.010	4-metoxi-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.9	390	A	143-144
3.014	2,4-dimetil-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.98	388	A	166-167
3.017	2-bromo-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.93	439	A	157-159
3.016	4-isopropoxi-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.99	417	A	138-139
3.002	4-bromo-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.96	439	A	143-145
3.023	1-(2-fluorofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.41	391	B	
3.025	1-(2,4-difluorofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.44	409	B	
3.026	1-(2,6-difluorofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.42	409	B	
3.036	1-(4-bromo-2-fluoro-fenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.58	469	B	
3.037	1-(2,5-difluorofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.43	409	B	
3.038	1-(2,3-difluorofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.44	409	B	
3.039	1-(2-bromo-4-fluoro-fenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.55	469	B	
3.040	1-(2-bromo-4-cloro-fenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.66	485	B	
3.041	1-(4-cianofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.3	398	B	
3.042	1-(4-ciano-2-fluoro-fenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.35	416	B	

ES 2 743 302 T3

3.043	1-(2-cianofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.31	398	B	
3.044	1-(2-cloro-4-fluoro-fenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.49	425	B	
3.045	1-(4-terc-butilfenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.77	429	B	
3.046	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]metanosulfonamida	1.62	457	B	
3047	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-[4-(trifluorometil)fenil]metanosulfonamida	1.58	441	B	
3.033	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-[3-(trifluorometil)fenil]metanosulfonamida	1.57	441	B	
3.031	1-(4-clorofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.51	407	B	
3.050	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-[4-(trifluorometilsulfanil)fenil]metanosulfonamida	1.7	473	B	
3.032	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-[6-(trifluorometil)-3-piridil]metanosulfonamida	1.4	442	B	
3.022	1-(2-bromofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.52	451	B	
3.035	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2-fenil-etanosulfonamida	1.45	387	B	
3.030	1-(3-fluorofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.41	391	B	
3.029	1-(2,4-diclorofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.64	441	B	
3.049	1-(3-bromofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.53	451	B	
3.028	1-(4-nitrofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.38	418	B	
3.022	1-(4-bromofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.54	451	B	
3.034	metil 3-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metilsulfamoil]propanoato	1.13	369	B	
3.021	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-fenil-metanosulfonamida	1.38	373	B	
3.019	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]butano-1-sulfonamida	1.34	339	B	
3.018	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]ciclopropanosulfonamida	1.15	323	B	
2.023	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-(2-fluorofenil)metanosulfonamida	1.29	377	B	

ES 2 743 302 T3

2.025	1-(2,4-difluorofenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.33	395	B	
2.026	1-(2,6-difluorofenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.31	395	B	
2.036	1-(4-bromo-2-fluoro-fenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.47	455	B	
2.037	1-(2,5-difluorofenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.32	395	B	
2.038	1-(2,3-difluorofenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.33	395	B	
2.039	1-(2-bromo-4-fluoro-fenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.57	455	B	
2.040	1-(2-bromo-4-cloro-fenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.56	471	B	
2.041	1-(2-cianofenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.2	384	B	
2.042	1-(2-cloro-4-fluoro-fenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.39	411	B	
2.045	1-(4-terc-butilfenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.68	415	B	
2.046	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]metanosulfonamida	1.53	443	B	
2.047	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-[4-(trifluorometil)fenil]metanosulfonamida	1.49	427	B	
2.033	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-[3-(trifluorometil)fenil]metanosulfonamida	1.48	427	B	
2.031	1-(4-clorofenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.41	393	B	
2.032	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-[6-(trifluorometil)-3-piridil]metanosulfonamida	1.29	428	B	
2.048	1-(2-bromofenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.41	437	B	
2.035	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2-fenil-etanosulfonamida	1.34	373	B	
2.030	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-(3-fluorofenil)metanosulfonamida	1.3	377	B	
2.029	1-(2,4-diclorofenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.54	427	B	
2.049	1-(3-bromofenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.43	437	B	
2.022	1-(4-bromofenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.44	437	B	
2.034	metil 3-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metilsulfamoi]propanoato	1.01	355	B	
2.021	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-fenil-metanosulfonamida	1.27	359	B	

ES 2 743 302 T3

2.019	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]butano-1-sulfonamida	1.22	325	B	
3.027	1-(4-ciclopropilfenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.7	413	B	
2.027	1-(4-ciclopropilfenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]metanosulfonamida	1.6	399	B	
3.051	(E)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2-fenil-etenosulfonamida	0.94	385	A	165-168
3.053	(E)-2-(4-clorofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]jetenosulfonamida	1.00	419	A	153-154
3.056	(E)-2-(2-fluorofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]jetenosulfonamida	0.95	403	A	139-173
2.051	(E)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2-fenil-etenosulfonamida	0.88	371	A	134-137
3.060	(E)-N-[(2-oxo-1-propil-6-quinolil)metil]prop-1-eno-1-sulfonamida	0.83	323	A	95-99
3.020	4,4,4-trifluoro-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]butano-1-sulfonamida	0.90	393	A	
3.061	5-metil-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]tiofeno-2-sulfonamida	0.95	379	A	151-154
2.059	(E)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2-(p-tolil)etenosulfonamida	0.93	385	A	151-153
2.062	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]propano-1-sulfonamida	0.8	311	A	
3.063	1-metil-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]imidazol-4-sulfonamida	0.73	363	A	168-171
2.063	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-1-metil-imidazol-4-sulfonamida	0.63	349	A	165-167
2.064	2,5-dicloro-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]tiofeno-3-sulfonamida	0.94	421	A	198-201
2.018	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]ciclopropanosulfonamida	0.75	309	A	104-106
3.059	(E)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2-(p-tolil)etenosulfonamida	0.97	399	A	172-174
3.052	(E)-2-(4-bromofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]jetenosulfonamida	1.01	465	A	150-152
3.066	(E)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]but-2-eno-1-sulfonamida	0.88	337	A	
2.060	(E)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]prop-1-eno-1-sulfonamida	0.78	309	A	
3.062	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]propano-1-sulfonamida	0.85	325	A	
2.067	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-3,3,3-trifluoro-propano-1-sulfonamida	0.86	365	A	
3.067	3,3,3-trifluoro-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]propano-1-	0.91	379	A	132-135

ES 2 743 302 T3

	sulfonamida				
2.068	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]tiofeno-3-sulfonamida	0.85	351	A	128-131
3.068	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]tiofeno-3-sulfonamida	0.88	365	A	150-154
2.052	(E)-2-(4-bromofenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]jetenosulfonamida	0.96	451	A	119-124
2.069	(E)-2-(3-clorofenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]jetenosulfonamida	0.93	405	A	149-151
2.020	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-4,4,4-trifluoro-butano-1-sulfonamida	0.85	379	A	
2.070	(E)-2-(3-bromofenil)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]jetenosulfonamida	0.97	451	A	144-147
3.069	(E)-2-(3-clorofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]jetenosulfonamida	0.98	419	A	129-133
3.070	(E)-2-(3-bromofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]jetenosulfonamida	1.00	465	A	148-153
3.060	(E)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]prop-1-eno-1-sulfonamida	0.84	323	A	95-99
3.020	4,4,4-trifluoro-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]butano-1-sulfonamida	0.91	393	A	
3.056	(E)-2-(2-fluorofenil)-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]jetenosulfonamida	0.95	403	A	169-173
2.051	(E)-N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2-fenil-etenosulfonamida	0.87	371	A	134-137
2.061	N-[(1-etil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-5-metil-tiofeno-2-sulfonamida	0.87	365	A	149-152
3.064	2,5-dicloro-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]tiofeno-3-sulfonamida	1.00	433	A	131-134
3.071	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]prop-2-eno-1-sulfonamida	0.80	323	A	
16.001	N-[(1-etil-4,8-dimetil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.93	373	A	
9.001	N-[(2-oxo-1-(3-piridil)-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.78	394	A	
8.001	N-[(2-oxo-1-fenil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.91	393	A	
8.006	2,4-difluoro-N-[(2-oxo-1-fenil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.94	429	A	
7.009	4-fluoro-N-[(2-oxo-1-propil-6-quinolil)metil]bencenosulfonamida	0.86	376	A	
7.001	2,4-difluoro-N-[(2-oxo-1-propil-6-quinolil)metil]bencenosulfonamida	0.85	357	A	
7.006	2,4-difluoro-N-[(2-oxo-1-propil-6-quinolil)metil]bencenosulfonamida	0.88	393	A	

ES 2 743 302 T3

13.006	2,4-difluoro-N-[[1-(2-metoxietil)-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]bencenosulfonamida	0.86	411	A	
13.001	N-[[1-(2-metoxietil)-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]bencenosulfonamida	0.83	375	A	
5.006	N-[(1-alil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2,4-difluoro-bencenosulfonamida	0.9	393	A	
5.001	N-[(1-alil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.88	357	A	
11.006	2,4-difluoro-N-[[2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]bencenosulfonamida	0.94	435	A	
11.001	N-[[2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]bencenosulfonamida	0.92	399	A	
10.006	N-[[1-(ciclopropilmetil)-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]-2,4-difluoro-bencenosulfonamida	0.94	407	A	
10.001	N-[[1-(ciclopropilmetil)-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]bencenosulfonamida	0.92	371	A	
22.001	N-[(1-etil-8-fluoro-4-metil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.91	377	A	
3.073	5-cloro-N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]tiofeno-2-sulfonamida	0.97	399	A	144 - 147
3.072	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]tiofeno-2-sulfonamida	0.88	365	A	151 - 153
17.001	N-[(8-fluoro-2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.93	377	A	
3.074	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]naftaleno-1-sulfonamida	0.96	409	A	176 - 179
3.075	N-[(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]naftaleno-2-sulfonamida	0.96	409	A	169 - 173
14.006	2,4-difluoro-N-[1-(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)etil]bencenosulfonamida	0.95	409	A	
14.009	4-fluoro-N-[1-(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)etil]bencenosulfonamida	0.94	391	A	
14.001	N-[1-(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)etil]bencenosulfonamida	0.93	373	A	
15.006	2,4-difluoro-N-[1-(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)ciclopropil]bencenosulfonamida	0.96	421	A	
15.009	4-fluoro-N-[1-(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)ciclopropil]bencenosulfonamida	0.95	403	A	
15.001	N-[1-(2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)ciclopropil]bencenosulfonamida	0.93	385	A	
20.006	N-[(1-etil-4-metil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2,4-difluoro-bencenosulfonamida	0.95	395	A	
20.001	N-[(1-etil-4-metil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.87	359	A	

23.001	N-[[4-metil-2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]bencenosulfonamida	0.95	413	A	
23.006	2,4-difluoro-N-[[4-metil-2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]bencenosulfonamida	0.97	449	A	
24.001	N-[[1-(ciclopropilmetil)-4-metil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]bencenosulfonamida	0.96	385	A	
24.006	N-[[1-(ciclopropilmetil)-4-metil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il]metil]-2,4-difluoro-bencenosulfonamida	0.98	421	A	
25.001	N-[(1-alil-4-metil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.92	371	A	
25.006	N-[(1-alil-4-metil-2-oxo-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]-2,4-difluoro-bencenosulfonamida	0.92	407	A	
26.001	N-[(7-fluoro-2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.93	377	A	
27.001	N-[(5-fluoro-2-oxo-1-propil-3,4-dihidroquinolin-6-il)metil]bencenosulfonamida	0.92	377	A	

Método - A:

Se registraron los espectros en un espectrómetro de masas de Waters (espectrómetro de masas de cuadrúpolo único SQD o ZQ) equipado con una fuente de electropulverización (Polaridad: iones positivos o negativos, Capilar: 3.00 kV, intervalo del cono: 30-60 V, extractor: 2.00 V, Temperatura de la fuente: 150°C, Temperatura de desolvatación: 350°C, flujo de gas del cono: 0 L/Hr, Flujo de gas de desolvatación: 650 L/Hr, Intervalo de masa: 100 a 900 Da) y un Acquity UPLC de Waters: Bomba binaria, compartimiento de columna calentado y detector de arreglo de diodos. Desgasificador de disolvente, bomba binaria, compartimiento de columna calentado y detector de arreglo de diodos. Columna: Waters UPLC HSS T3, 1.8 mm, 30 x 2.1 mm, Temp: 60°C, Intervalo de longitud de onda de DAD (nm): 210-500, gradiente de disolventes: A = agua + 5% MeOH + 0.05% de HCOOH, B= Acetonitrilo + 0.05% de HCOOH. gradiente: gradiente: 0 min 0% B, 100%A; 1.2-1.5min 100% B; Flujo (ml/min) 0.85.

Método - B:

Se registraron los espectros en un espectrómetro de masas de Waters SQD 2 equipado con una fuente de electropulverización (Polaridad: iones positivos, Capilar: 3.5 kV, intervalo del cono: 30 V, Extractor: 3.00 V, Temperatura de la fuente: 150°C, Temperatura de desolvatación: 400°C, flujo de gas del cono: 60 L/Hr, Flujo de gas de desolvatación: 700 L/Hr, Intervalo de masa: 140 a 800 Da) y un Acquity UPLC de Waters: Bomba binaria, compartimiento de columna calentado y detector de arreglo de diodos. Desgasificador de disolvente, bomba binaria, compartimiento de columna calentado y detector de arreglo de diodos. Columna: Waters UPLC HSS T3, 1.8 micrones, 30 x 2.1 mm, Temp: 60°C, Intervalo de longitud de onda de DAD (nm): 210 a 400, gradiente de disolventes: A = agua + 5% de MeOH + 0.1 % de HCOOH; B= acetónitrilo + 0.1 % de HCOOH; gradiente: 0 min 100% A; 2.5 min 100% B; 2.8 min 100% B; 3.0 min 100% A; Flujo (ml/min) 0.75.

Ejemplos biológicosA) Uso de agua en plantas reducido en soja

Se evaluaron los compuestos por su efecto para reducir el uso de agua en plantas de la siguiente manera. Cada compuesto se disolvió en una formulación de concentrado emulsionable (EC) en blanco que luego se diluyó a la concentración deseada con agua que contenía tensioactivo adicional (EXTRAVON 1g/20L). Se aplicaron los compuestos mediante pulverización foliar a plantas de soja de 12 días de edad (variedad S20-G7) cultivadas en cámaras de crecimiento de plantas de ambiente controlado. El uso de agua en plantas durante el día se evaluó pesando de manera repetida las macetas en que las plantas fueron cultivadas antes y después de la aplicación de los compuestos las veces indicadas (expresadas en días después de la aplicación (DDA)). Los datos de uso de agua antes de la aplicación se utilizaron para corregir cualquier diferencia en el uso de agua que surgiera debido a efectos no relacionados con el tratamiento (por ejemplo, debido a diferencias en el tamaño de la planta). Los valores del uso de agua no transformados fueron sometidos a un análisis de covarianza, ajustando el efecto del tratamiento y utilizando el uso de agua de referencia 1 día antes de la aplicación como una covariable.

Los resultados se expresan en comparación con el tratamiento con testigo negativo (se diluyó formulación EC sin ingrediente activo pero con EXTRAVON 1g/20L).

ES 2 743 302 T3

La aplicación de los químicos (0 DDA) ocurre aproximadamente entre 08:00 y 09:30 a.m. El UA se mide durante el día (la luz de la cámara se enciende de 06:00 a 20:00) en estos puntos de tiempo: 0 DDA a.m. (10:30-12:50), 0 DDA p.m. (14:00-19:50), 1 DDA a.m. (7:30-12:50), 1 DDA p.m. (14:00-19:50), 2 DDA a.m. (07:30-12:50) y 2 DDA p.m. (14:00-19:50). El UA total acumulativo (0-2.5 DDA) se calcula mediante la suma de los datos de los UA mencionados anteriormente.

5

TABLA B1: Aumento o disminución porcentual del uso de agua (UA) durante el día de plantas de soja pulverizadas con los compuestos indicados a 500 μM en comparación con un tratamiento con testigo negativo (por ejemplo, 0 = idéntico al testigo negativo; -8.5 = -8.5% de disminución en uso de agua en comparación con el tratamiento con testigo negativo).

10 Se muestran los valores de UA promedio de 6 macetas (cada una con tres plantas) por tratamiento.

Compuestos	% de UA						
	0 DDA AM	0DDA PM	1DDA AM	1DDA PM	2 DDA AM	2 DDA PM	Total 0 a 2.5 DDA
Testigo sin tratar	0	0	0	0	0	0	0
3.005	-37.5	-32.9	-24.9	-21.9	-12.9	-12.0	-21.9
2.010	-15.2	-5.7	-2.6	-1.7	-3.6	-2.4	-4.3
3.016	-3.6	-5.8	-1.3	-0.5	-1.1	0	-1.2
3.012	-43.9	-17.8	-1.8	2.1	1.7	3.0	-5.8
2.001	-35.3	-34.3	-29.1	-28.1	-19.6	-14.3	-25.7
3.001	-15.0	-13.1	-9.9	-6.7	-7.2	-5.8	-8.8
3.007	-16.1	-14.1	-12.7	-9.7	-7.7	-7.6	-10.8
3.006	-36.5	-35.8	-28.3	-24.2	-17.8	-14.9	-24.5
3.009	-17.5	-14.9	-9.4	-6.4	-5.5	-4.2	-8.5
3.011	-3.6	-4.0	-3.6	-2.3	-3.6	-2.4	-3.0
3.010	-28	-12.5	-3.0	-1.0	-2.1	-1.7	-5.7
2.007	-14.1	-9.5	-7.3	-6.6	-8.8	-5.7	-8.1
2.009	-5.3	-3.0	-2.0	-1.2	-3.1	-1.0	-2.3
2.006	-23.4	-17.6	-13.8	-13.0	-10.4	-7.3	-13.2
2.014	-2.8	-0.7	-0.2	-0.9	-0.9	-1.7	-1.1
3.002	-22.5	-20.6	-13.7	-9.4	-6.7	-4.7	-11.4
2.002	-10.4	-8.5	-6.5	-4.0	-5.6	-4.2	-5.8
2.068	-27.0	-22.4	-18.1	-14.7	-11.6	-7.5	-15.3
3.068	-46.0	-46.5	-39.3	-31.6	-22.3	-15.3	-31.6
3.060	-7.9	-4.6	-5.8	-2.6	-5.4	-2.7	-4.6
3.063	-9.3	-4.7	-5.1	-3.9	-6.6	-5.0	-5.5
3.064	-34.7	-29.8	-23.3	-21.3	-17.2	-13.5	-22.2
2.061	-50.4	-38.6	-7.9	-2.2	-0.5	-1.2	-13.7
3.061	-47.8	-22.2	+1	+3.4	+1.6	1.2	-13.7
3.020	-19.3	-12.3	-10.1	-5.5	-7.4	-4.2	-8.5
3.067	-28.4	-24.3	-19.3	-17.2	-13.3	-9.5	-17.2

ES 2 743 302 T3

3.074	-8.6	-3	0	+1	-1.5	0	-1.4
3.075	-10.8	-5.8	-2.1	-0.6	-2.1	-2	-3.3
15.001	-27.4	-24.2	-14.9	-13.9	-9.5	-7.2	-15.1
15.006	-32.6	-32.2	-23.6	-24.4	-17	-17.8	-23.8
17.001	-41.6	-43.1	-38	-36.3	-27.1	-26.3	-34.7
20.001	-50.1	-54	-58.5	-55.2	-55.8	-50.5	-54.4
3.072	-39.4	-42.4	-45.9	-40.9	-39.8	-32.2	-40.1
3.073	-44.6	-47.9	-54.9	-52.1	-53.3	-48.7	-51
22.001	-46.1	-48.5	-55.8	-53	-55.1	-50.1	-52.1
5.001	-15.1	-19.2	-18.7	-17.4	-16.5	-15.6	-17.1
5.006	-13.6	-13.6	-12.5	-11.5	-9.7	-9.9	-11.4
7.001	-17.1	-14.1	-9.1	-6.9	-6.9	-2.5	-8.8
7.006	-14.6	-12.2	-6.7	-4.2	-4.2	0	-6.1
7.009	-8.1	-7.4	-3.6	-3.5	-4	-1.7	-4.1
10.001	-25.2	-27.8	-23.8	-22.7	-14.9	-14.7	-20.8
10.006	-22.4	-20.3	-18.5	-18.2	-16.9	-17.8	-18.6
11.001	-20.8	-24.4	-26.2	-27.6	-26.9	-26.9	-26.1
11.006	-13	-14.7	-15.3	-15.7	-16.4	-16.5	-15.8
13.001	-15.1	-14.3	-11	-11	-8.9	-9.2	-11.1
13.006	-9.8	-10.2	-9.3	-10.1	-9.6	-10.3	-10.1
16.001	-39	-44.8	-49	-48.1	-45.7	-44.5	-46
24.001	-35.3	-40.3	-42.8	-42.8	-39.9	-38.3	-40.6
23.001	-31.3	-36.9	-39.7	-40.8	-35.9	-37.3	-37.7
25.001	-28.2	-37.2	-41	-39.6	-38.1	-36.7	-37.9

Los resultados muestran que las plantas de soja tratadas con compuestos de la presente invención utilizan menos agua que las plantas sin tratar.

5 TABLA B2: Aumento o disminución porcentual del uso de agua (UA) durante el día de plantas de soja con los compuestos indicados a una tasa indicada en comparación con un tratamiento con testigo negativo (por ejemplo 0 = idéntico al testigo negativo; -8.5 = -8.5% disminución en uso de agua en comparación con un tratamiento con testigo negativo).

Se muestran los valores de UA de 6 macetas (cada una con tres plantas) por tratamiento.

		% de UA						
Compuestos	Tasa	0 DDA AM*	ODDA PM	1DDA AM	1DDA PM	2 DDA AM	2 DDA PM	Total 0 a 2.5 DDA
Quinabactin	31.25uM	-0.3	-0.3	0.2	-0.1	-0.9	-1.3	-0.7
2.001		-0.7	-1.4	-1.8	-0.9	-2.7	-1.5	-1.7
3.001		-4.4	-7.7	-6.9	-5.4	-5.8	-2.2	-5.7
Quinabactin	125uM	-15.3	-5.7	1.8	2.9	2.4	1.1	-0.5
2.001		-10.4	-11.5	-10.1	-10.9	-11.7	-10.1	-11.1
3.001		-23.7	-23.7	-15.7	-15.3	-9.3	-6.3	-14.8
Quinabactin	500uM	-42.0	-41.2	-18.6	-10.8	-3.8	-2.9	-16.9
2.001		-41.2	-43.4	-36.3	-33.2	-24.2	-19.5	-31.8
3.001		-44.6	-45.5	-36.4	-33.3	-21.4	-15.1	-31.1

Los resultados muestran que las plantas tratadas con compuestos de la presente invención utilizan menos agua que

las plantas tratadas con el compuesto de quinabactina testigo.

B) Uso de agua en plantas reducido en maíz

5 Se evaluaron los compuestos por su efecto para reducir el uso de agua en plantas de la siguiente manera. Los compuestos se aplicaron mediante pulverización foliar a plantas de maíz de 12 días de edad (variedad NK OCTET) cultivadas en cámaras de crecimiento de plantas de ambiente controlado. Todos los compuestos se aplicaron utilizando una formulación de concentrado emulsionable (EC) que se diluyó a las concentraciones deseadas con agua que contenía 0.4% de éster metílico de semilla de colza adyuvante. El uso de agua en plantas durante el día se evaluó pesando de manera repetida las macetas en que las plantas fueron cultivadas antes y después de la aplicación de los compuestos las veces indicadas (expresadas en días después de la aplicación (DDA)). Los datos de uso de agua antes de la aplicación se utilizaron para corregir cualquier diferencia en el uso de agua que surgiera debido a efectos no relacionados con el tratamiento (por ejemplo, debido a diferencias en el tamaño de la planta). Los valores del uso de agua sin transformar se sometieron a un análisis de covarianza, ajustando el efecto del tratamiento y utilizando el uso de agua de referencia 1 día antes de la aplicación como una covariable.

15 La aplicación de los químicos (0 DDA) ocurre aproximadamente entre 08:00 y 09:30 a.m. El UA se mide durante el día (la luz de la cámara se enciende de 06:00 a 20:00) en estos puntos de tiempo: 0 DDA a.m. (10:30-12:50), 0 DDA p.m. (14:00-19:50), 1 DDA a.m. (07:30-12:50), 1 DDA p.m. (14:00-19:50), 2 DDA a.m. (07:30-12:50) y 2 DDA p.m. (14:00-19:50). El UA total acumulativo (0-2.5 DDA) se calcula mediante la suma de los datos de UA mencionados anteriormente.

20 TABLA B3: Aumento o disminución porcentual del uso de agua (UA) durante el día de plantas de maíz pulverizadas con los compuestos indicados a 500 µM en comparación con un tratamiento con testigo negativo (por ejemplo 0 = idéntico al testigo negativo; -8.5 = -8.5% de disminución en el uso de agua en comparación con el tratamiento con testigo negativo). Se muestran los valores de UA promedio de 6 macetas (cada una con tres plantas) por tratamiento.

Compuestos	% de UA						
	0 DDA AM	0DDA PM	1DDA AM	1DDA PM	2 DDA AM	2 DDA PM	Total 0 a 2.5 DDA
Testigo sin tratar	0	0	0	0	0	0	0
2.002	-10.8	-3.6	-3.2	-3.9	-1.2	-1.7	-3.2
2.006	-12.5	-6.7	-6.5	-5.5	-3.0	-3.2	-5.4
2.015	-8.9	-3.4	-4.0	-2.6	-1.9	-1.0	-2.9
2.051	-13.2	-8.5	-10.7	-8.6	-8.7	-6.5	-9.1
2.068	-16.6	-15.1	-12.9	-11.4	-9.2	-9.1	-11.8
2.069	-6.5	-3.5	-3.3	-3.7	-2.1	-1.9	-3.2
2.070	-8.1	-4.1	-6.1	-5.5	-4.8	-3.8	-5.0
3.002	-16.3	-12.2	-13.4	-10.5	-9.5	-7.0	-10.9
3.004	-17.3	-12.5	-14.1	-12.9	-11.8	-10.7	-12.8
3.005	-16.2	-10.5	-9.2	-7.9	-5.4	-5.3	-8.2
3.006	-18.0	-14.1	-12.6	-10.2	-6.6	-5.7	-10.3
3.007	-16.0	-12.0	-11.4	-9.5	-6.6	-5.9	-9.4
3.009	-16.9	-13.9	-13.2	-11.9	-9.0	-8.2	-11.6
3.010	-14.4	-8.3	-6.3	-5.4	-2.5	-2.2	-5.5
3.017	-5.8	-3.1	-3.1	-2.5	-1.8	-2.1	-2.7
3.020	-19.2	-13.7	-14.8	-12.1	-11.5	-8.5	-12.7

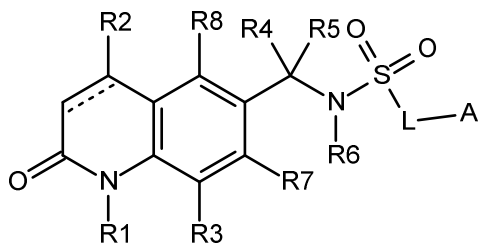
ES 2 743 302 T3

3.051	-11.2	-6.4	-8.1	-5.5	-5.4	-4.3	-6.2
3.052	-9.6	-4.6	-4.5	-4.5	-2.2	-2.5	-4.1
3.053	-8.0	-3.7	-4.1	-3.6	-2.9	-2.4	-3.6
3.056	-8.4	-2.7	-5.6	-4.4	-4.7	-3.2	-4.6
3.060	-14.8	-10.0	-10.6	-8.4	-8.2	-6.4	-9.3
3.062	-17.8	-13.0	-13.0	-9.8	-8.1	-6.3	-10.5
3.063	-8.4	-3.1	-3.0	-1.0	-1.5	+2	-1.4
3.064	-12.6	-14.2	-11.6	-9.9	-5.6	-4.7	-9.3
2.061	-18.8	-10.8	-7.5	-2.8	-1.6	-0.8	-6.2
3.061	-20.8	-19.1	-9.5	-7.5	-2.8	-3.9	-9
3.066	-10.8	-7.1	-7.1	-6.8	-4.7	-5.5	-6.4
3.067	-14.7	-10.7	-12.1	-11.5	-9.9	-10.1	-11.1
3.068	-25.5	-24.9	-15.8	-13.1	-8.9	-9.4	-14.8
3.069	-8.1	-4.1	-6.1	-5.5	-4.8	-3.8	-5.0
3.071	-11.2	-6.5	-4.5	-4.7	-3.5	-2.4	-4.9
3.075	-9.8	-7.9	-8.2	-6.4	-4.9	-3.3	-6.3
15.001	-8.2	-6.5	-6.5	-3.5	-2.8	-1.8	-4.3
15.006	-10.2	-3	-1.4	0.1	1.7	1.1	-1.2
15.009	-10.7	-7.8	-8.7	-5.8	-5.4	-5.7	-7.1
20.001	-21.7	-18.3	-19.2	-10.3	-8.1	-5.5	-12.9
20.006	-15.5	-14.5	-13.2	-7	-5.7	-4.3	-9.4

Los resultados muestran que las plantas de maíz tratadas con compuestos de la presente invención utilizan menos agua que las plantas sin tratar.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I)



(I)

en donde:

- 5 R1 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₇, haloalquilo C₁-C₇, cicloalquilC₃-C₅-alquilo C₁-C₇, alqueno C₃-C₇, alquinilo C₃-C₇, arilalquilo C₁-C₇, (heterociclilo de 3-6 miembros)-alquilo C₁-C₇, fenilo, cicloalquilo C₃-C₅ y un heterociclilo de 4-6 miembros, cada uno opcionalmente sustituido por uno a tres Rx;
- R2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₄;
- 10 R3, R7 y R8 se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₄;
- R4 y R5 se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₄;
- o R4 y R5 pueden formar, junto con el átomo o átomos a los que están directamente unidos, un cicloalquilo C₃-C₄ o heterociclilo C₄;
- 15 R6 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alqueno C₃-C₄, alquinilo C₃-C₄ y alcoxiC₁-C₃-alquilo C₁-C₄;
- L se selecciona del grupo que consiste en un enlace, una cadena de alquilo C₁-C₄ lineal, una cadena de alqueno C₂-C₄ lineal, una cadena de alquinilo C₂-C₄ lineal, una cadena de alcoxi C₁-C₄ lineal en donde el átomo de oxígeno está unido a A, una cadena de aminoalquilo C₁-C₄ lineal en donde el átomo de nitrógeno está unido a A y una cadena de alquilo C₁-C₂-alquilo C₁-C₂ lineal cada una opcionalmente sustituida por uno a tres halógenos, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄;
- 20 A es hidrógeno, alquilo C₁-C₇, cicloalquilo C₃-C₅, arilo o heterociclilo de 3-10 miembros, cada uno opcionalmente sustituido por uno a tres Ry;
- 25 Rx se selecciona, independientemente entre sí, del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxiC₁-C₄carbonilo, ácido carboxílico, aminocarbonilo, aminocarbonilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₄;
- Ry se selecciona, independientemente entre sí, del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquilC₁-C₄sulfanilo, haloalquilC₁-C₄sulfanilo, alquilC₁-C₄sulfinilo, haloalquilC₁-C₄sulfinilo, alquilC₁-C₄sulfonilo, haloalquilC₁-C₄sulfonilo, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxiC₁-C₄carbonilo, ácido carboxílico, aminocarbonilo, aminocarbonilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₄; dicho cicloalquilo no está sustituido o está sustituido por uno o más Rz;
- 30 Rz se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄;
- en donde A no es butilo cuando R4 o R5 es metilo;
- 35 y en donde R1 no es metilo cuando R2, R3, R4, R5, R6, R7 y R8 son cada uno hidrógeno;
- o sales o N-óxidos de los mismos.
2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R1 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆ y ciclopropil C₃-C₅-alquilo C₁-C₆.
3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, en donde R1 es etilo o propilo.
- 40 4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde L es un enlace.

5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde A se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₇, fenilo y heteroarilo de 3-6 miembros, cada uno opcionalmente sustituido por uno a tres R_y.
6. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 5, en donde A es fenilo opcionalmente sustituido por uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, haloalquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.
7. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y alquilo C₁-C₄.
8. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R3 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno y alquilo C₁-C₄.
9. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R2, R3, R4, R5, R6, R7 y R8 son hidrógeno.
10. Una composición que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes y una formulación adyuvante agrícolamente aceptable.
11. Una mezcla que comprende un compuesto tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones precedentes y un ingrediente activo adicional.
12. Un método para mejorar la tolerancia de una planta al estrés abiótico, en donde el método comprende aplicar a la planta, parte de la planta, material de propagación de la planta o locus del crecimiento de la planta un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, una composición de acuerdo con la reivindicación 10 o una mezcla de acuerdo con la reivindicación 11.
13. Un método para inhibir la germinación de las semillas de una planta, en donde el método comprende aplicar a la planta, parte de planta, material de propagación de planta o locus del crecimiento de la planta un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, una composición de acuerdo con la reivindicación 10 o una mezcla de acuerdo con la reivindicación 11.
14. Un método para regular o mejorar el crecimiento de una planta, en donde el método comprende aplicar a la planta, parte de la planta, material de propagación de la planta o locus del crecimiento de la planta un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, una composición de acuerdo con la reivindicación 10 o una mezcla de acuerdo con la reivindicación 11.