

NUEVOS DERIVADOS DE AMINOÁCIDOS NO CODIFICADOS Y SU USO COMO HERBICIDAS

CAMPO DE LA INVENCION

La invención se relaciona con nuevos compuestos químicos con actividad herbicida, proceso para su fabricación y su uso en la protección de cultivos.

ANTECEDENTES DE LA INVENCION

Además de su papel como constituyentes de proteínas, los aminoácidos y sus derivados también participan en una gran cantidad de reacciones celulares y, por lo tanto, influyen en una serie de procesos fisiológicos, como el crecimiento y desarrollo de las plantas, el control del pH intracelular, la generación de energía metabólica o energía redox, y la resistencia al estrés abiótico y biótico. Además, recientemente ha estado en discusión el papel de los aminoácidos en las plantas durante la señalización. En este contexto, la regulación del contenido de aminoácidos, los flujos y el transporte a través de la planta son críticos para la adaptación de la planta al status de carbono y nitrógeno, su desarrollo y su defensa.

Durante periodos de estrés se ven afectados grupos de todos los aminoácidos. Se sabe que el nivel de prolina aumenta significativamente en varias plantas durante la respuesta al estrés y se considera que ésta representa un osmolito compatible. Además, durante diversos tipos de estrés también se induce la generación de aminoácidos de cadena ramificada.

Se necesita saber más sobre los mecanismos subyacentes a la regulación de los grupos de aminoácidos. Las concentraciones locales de aminoácidos dependen de las tasas de síntesis y degradación de las proteínas, así como de los aminoácidos, y de los procesos de transporte. Estos procesos más bien modifican el tamaño total de los grupos, lo que es especialmente relevante cuando se produce una degradación masiva, tal como durante la germinación y la senescencia.

La protección de cultivos con herbicidas es un elemento clave de la sostenibilidad alimentaria mundial. Desafortunadamente, la resistencia a herbicidas puede desarrollarse poco después de la introducción de éstos. Según los mecanismos de resistencia a los herbicidas, todos los

procesos se pueden agrupar de la siguiente manera: resistencia de sitio activo, resistencia fuera del sitio activo, resistencia cruzada y resistencia múltiple. La resistencia de sitio activo generalmente se debe a una o varias mutaciones en el gen que codifica la enzima diana del herbicida, lo que, a su vez, disminuye la afinidad del herbicida a unirse a esa enzima. La resistencia fuera del sitio activo es causada por mecanismos que reducen la cantidad de compuesto herbicida activo antes de que pueda atacar a la planta a través de una absorción reducida o una translocación alterada, un mayor secuestro de herbicida o un metabolismo aumentado del herbicida. La resistencia cruzada significa que un único mecanismo de resistencia causa resistencia a varios herbicidas con algún modo de acción. La resistencia múltiple es una situación en la que dos o más mecanismos de resistencia están presentes dentro de la misma planta, a menudo debido a la selección secuencial de herbicidas con diferentes modos de acción. Actualmente, se ha reportado la presencia de resistencia a herbicidas en multitud de biotipos de malezas en todo el mundo. Muchos de esos biotipos son resistentes a los inhibidores de la acetolactato sintasa (ALS, por sus siglas en inglés), inhibidores de PS I y PS II, inhibidores de ACC-asa e inhibidores de EPSPS (herbicidas de los grupos 2, 1, 22, 5 y 9, respectivamente).

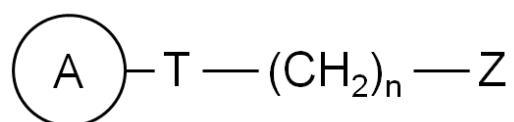
Existe una constante demanda de nuevos compuestos efectivos para controlar el crecimiento de la vegetación no deseada. En la situación más común, se busca obtener compuestos que controlen selectivamente el crecimiento de malezas en cultivos útiles tales como cultivos de algodón, arroz, maíz, trigo y soja, por nombrar sólo algunos. El crecimiento descontrolado de malezas en estos cultivos puede causar pérdidas significativas, reduciendo las ganancias para el agricultor y aumentando los costos para el consumidor. La importancia de controlar las malezas resistentes a una o más clases de herbicidas ha cobrado particular importancia en la última década. En otras situaciones, se desea contar con herbicidas que controlen todo el crecimiento vegetal.

Ejemplos de áreas en las que se desea tener un completo control de toda la vegetación son las áreas alrededor de las vías del tren, los tanques de almacenamiento y las áreas de almacenamiento industrial. La identificación de nuevos compuestos que tengan actividad herbicida, que sean más efectivos, menos costosos y ambientalmente seguros sigue siendo una necesidad de larga data que se encuentra aún insatisfecha.

BREVE COMPENDIO DE LA INVENCION

Un objetivo principal de la presente invención es proporcionar nuevas composiciones agrícolas potentes y seguras que comprenden compuestos químicos, derivados de aminoácidos no codificados que tienen actividad herbicida, procesos para su fabricación y su uso en la protección de cultivos.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona una composición agrícola que comprende un compuesto o una de sus sales que tiene la estructura



o una de sus sales, en donde:

A es un armazón de ciclopentadieno, benceno e indeno que comprende de 1 a 4 heteroátomos; en donde cada uno de los heteroátomos se selecciona independientemente del grupo que consiste en N, S, Se, y O; y en donde uno o más de los átomos de carbono del anillo está opcionalmente unido químicamente a al menos uno de los grupos que consisten en: $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NR}_3^+$, $-\text{SO}_2\text{R}$, $-\text{CX}_3$, CX_2R , $-\text{COX}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COR}$, $-\text{CO}_2\text{R}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}$, $-\text{CONR}_2$, $-\text{N}=\text{O}$, $-\text{N}\equiv\text{N}^+$, $-\text{N}=\text{NR}$, $-\text{CR}=\text{NR}$, $-\text{N}=\text{CR}_2$, $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, y $-\text{I}$, y en donde X se selecciona de F, Cl, Br y I;

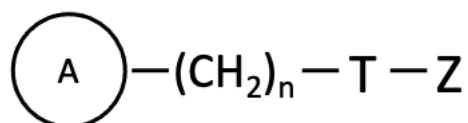
n es 0 a 5;

T es un grupo metileno sustituido o no sustituido con uno o dos haluros, $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NR}_3^+$, $-\text{SO}_2\text{R}$, $-\text{CX}_3$, $-\text{CX}_2\text{R}$, $-\text{COX}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COR}$, $-\text{CO}_2\text{R}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}$, $-\text{CONR}_2$, $-\text{F}$, $-\text{N}=\text{O}$, $-\text{N}\equiv\text{N}^+$, $-\text{N}=\text{NR}$, $-\text{CR}=\text{NR}$, $-\text{N}=\text{CR}_2$, y en donde X se selecciona de $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$ y $-\text{I}$; y,

Z es $-\text{COOH}$, $-\text{COO}-$, $-\text{OH}$, $-\text{O}-\text{R}$, $-\text{COOR}$ con residuos alcohol saturados o no saturados con cadena lineal, ramificada, cíclica, aromática o heteroaromática; $-\text{O}-(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{R}$ ($n \geq 1$); $-\text{O}-(\text{CHMeCH}_2\text{O})_n\text{R}$ ($n \geq 1$); grupo fosfato sustituido o no sustituido, grupo sulfonilo, grupo carbamoilo, amina primaria, amina secundaria, amina terciaria, carboxamida, $-\text{NR}-\text{O}-\text{R}$, $-\text{O}-\text{NR}_2$, hidracina, $-\text{NH}-\text{COR}$, y resto metanimidamida o una de sus sales;

en donde R se selecciona de H, alquilo sustituido o no sustituido y grupo arilo sustituido o no sustituido; y, en donde la composición comprende al menos un portador agrícolamente aceptable.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona además un método para controlar el crecimiento vegetal indeseado, que comprende aplicar al lugar del crecimiento vegetal indeseado una cantidad herbicidamente efectiva de un compuesto que tiene la estructura



o una de sus sales, en donde:

A un armazón de ciclopentadieno, benceno e indeno que comprende de 1 a 4 heteroátomos; en donde cada uno de los heteroátomos se selecciona independientemente del grupo que consiste en N, S, Se, y O; y en donde uno o más de los átomos de carbono del anillo está opcionalmente unido químicamente a al menos uno de los grupos que consisten en: $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NR}_3^+$, $-\text{SO}_2\text{R}$, $-\text{CX}_3$, $-\text{CX}_2\text{R}$, $-\text{COX}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COR}$, $-\text{CO}_2\text{R}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}$, $-\text{CONR}_2$, $-\text{N}=\text{O}$, $-\text{N}\equiv\text{N}^+$, $-\text{N}=\text{NR}$, $-\text{CR}=\text{NR}$, $-\text{N}=\text{CR}_2$, $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, y $-\text{I}$; y en donde X se selecciona de F, Cl, Br y I;

n es 0 a 5;

T es un grupo metileno sustituido o no sustituido con uno o dos haluros, $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NR}_3^+$, $-\text{SO}_2\text{R}$, $-\text{CX}_3$, $-\text{CX}_2\text{R}$, $-\text{COX}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COR}$, $-\text{CO}_2\text{R}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}$, $-\text{CONR}_2$, $-\text{F}$, $-\text{N}=\text{O}$, $-\text{N}\equiv\text{N}^+$, $-\text{N}=\text{NR}$, $-\text{CR}=\text{NR}$, $-\text{N}=\text{CR}_2$, y en donde X se selecciona de F, Cl, Br y I; y,

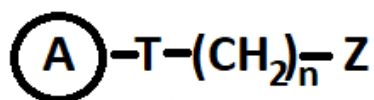
Z es $-\text{COOH}$, $-\text{COO}-$, $-\text{OH}$, $-\text{O}-\text{R}$, $-\text{COOR}$ con residuos alcohol saturados o no saturados con cadena lineal, ramificada, cíclica, aromática o heteroaromática; $-\text{O}-(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{R}$ ($n\geq 1$); $-\text{O}-(\text{CHMeCH}_2\text{O})_n\text{R}$ ($n\geq 1$); grupo fosfato sustituido o no sustituido, grupo sulfonilo, grupo carbamoilo, amina primaria, amina secundaria, amina terciaria,

carboxamida, -NR-O-R, -O-NR₂, hidracina, -NH-COR, y resto metanimidamida o una de sus sales;

en donde R se selecciona de H, alquilo sustituido o no sustituido y grupo arilo sustituido o no sustituido.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona un método para controlar el crecimiento vegetal indeseado que comprende aplicar al lugar del crecimiento vegetal indeseado:

a. Un primer herbicida que tiene la estructura



o una de sus sales, en donde:

A un armazón de ciclopentadieno, benceno e indeno que comprende de 1 a 4 heteroátomos; en donde cada uno de los heteroátomos se selecciona independientemente del grupo que consiste en N, S, Se, y O; y en donde uno o más de los átomos de carbono del anillo está opcionalmente unido químicamente a al menos uno de los grupos que consisten en: -SO₂CF₃, -O-SO₂CF₃, -NR₃⁺, -SO₂R, -CX₃, -CX₂R, -COX, -CHO, -COR, -CO₂R, -CONH₂, -CONHR, -CONR₂, -F, -N=O, -N≡N⁺, -N=NR, -CR=NR, -N=CR₂, -Cl, -Br, y -I; y en donde X se selecciona de F, Cl, Br y I;

n es 0 a 5;

T es un grupo metileno sustituido o no sustituido con uno o dos haluros, -SO₂CF₃, -O-SO₂CF₃, -NR₃⁺, -SO₂R, -CX₃, -CX₂R, -COX, -CHO, -COR, -CO₂R, -CONH₂, -CONHR, -CONR₂, -F, -N=O, -N≡N⁺, -N=NR, -CR=NR, -N=CR₂, y en donde X se selecciona de F, Cl, Br y I; y,

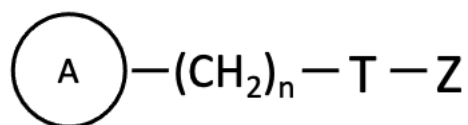
Z es -COOH, -COO-, -OH, -O-R, -COOR con residuos alcohol saturados o no saturados con cadena lineal, ramificada, cíclica, aromática o heteroaromática; -O-

$(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{R}$ ($n \geq 1$); $-\text{O}-(\text{CHMeCH}_2\text{O})_n\text{R}$ ($n \geq 1$); grupo fosfato sustituido o no sustituido, grupo sulfonilo, grupo carbamoilo, amina primaria, amina secundaria, amina terciaria, carboxamida, $-\text{NR}-\text{O}-\text{R}$, $-\text{O}-\text{NR}_2$, hidracina, $-\text{NH}-\text{COR}$, y resto metanimidamida o una de sus sales;

en donde R se selecciona de H, alquilo sustituido o no sustituido y grupo arilo sustituido o no sustituido; y

b. Un segundo herbicida, para controlar efectivamente el crecimiento vegetal indeseado.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona un método para controlar selectivamente la vegetación no deseada, que comprende aplicar a un lugar de la vegetación no deseada y una composición agrícola que comprende un compuesto o sal agrícolamente aceptable, que tiene la estructura



En donde A es un armazón de ciclopentadieno, benceno e indeno que comprende de 1 a 4 heteroátomos; en donde cada uno de los heteroátomos se selecciona independientemente del grupo que consiste en N, S, Se, y O; y en donde uno o más de los átomos de carbono del anillo está opcionalmente unido químicamente a al menos uno de los grupos que consisten en: $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NR}_3^+$, $-\text{SO}_2\text{R}$, $-\text{CX}_3$, $-\text{CX}_2\text{R}$, $-\text{COX}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COR}$, $-\text{CO}_2\text{R}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}$, $-\text{CONR}_2$, $-\text{N}=\text{O}$, $-\text{N} \equiv \text{N}^+$, $-\text{N}=\text{NR}$, $-\text{CR}=\text{NR}$, $-\text{N}=\text{CR}_2$, $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, y $-\text{I}$, y en donde X se selecciona de F, Cl, Br y I;

n es 0 a 5;

T es un grupo metileno sustituido o no sustituido con uno o dos haluros, $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NR}_3^+$, $-\text{SO}_2\text{R}$, $-\text{CX}_3$, $-\text{CX}_2\text{R}$, $-\text{COX}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COR}$, $-\text{CO}_2\text{R}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}$, $-\text{CONR}_2$, $-\text{F}$, $-\text{N}=\text{O}$, $-\text{N} \equiv \text{N}^+$, $-\text{N}=\text{NR}$, $-\text{CR}=\text{NR}$, $-\text{N}=\text{CR}_2$, y en donde X se selecciona de $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$ y $-\text{I}$; y,

Z es $-\text{COOH}$, $-\text{COO}-$, $-\text{OH}$, $-\text{O}-\text{R}$, $-\text{COOR}$ con residuos alcohol saturados o no saturados con cadena lineal, ramificada, cíclica, aromática o heteroaromática; $-\text{O}-(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{R}$ ($n \geq 1$); $-\text{O}-$

(CHMeCH₂O)_nR (n≥1); grupo fosfato sustituido o no sustituido, grupo sulfonilo, grupo carbamoilo, amina primaria, amina secundaria, amina terciaria, carboxamida, -NR-O-R, -O-NR₂, hidracina, -NH-COR, y resto metanimidamida o una de sus sales;

en donde R se selecciona de H, alquilo sustituido o no sustituido y grupo arilo sustituido o no sustituido; y en donde el lugar de la vegetación indeseada es un campo de un cultivo.

BREVE DESCRIPCIÓN DE LOS DIBUJOS

La Figura 1 demuestra el efecto herbicida de preemergencia del compuesto 5666 en *Amaranthus palmeri*, 21 DPA. Puntuación de daño 5;

La Figura 2 demuestra el efecto herbicida posemergencia del compuesto 5679 en *Amaranth tuberculatus*, 14 DPA, aplicación foliar. Puntuación de daño 5;

La Figura 3 demuestra el efecto herbicida de los compuestos 5679, 5666 y 6651 en aplicación por empapado en *Malva nicaeensis*, 14 DPA. Puntuación de daño 4;

La Figura 4 demuestra la selectividad del compuesto 5666 por cereales en aplicación al suelo a una dosis de 0,25 kg/Ha, 21 DPA;

La Figura 5 demuestra la selectividad de los compuestos 5746 y 5666 por maíz en aplicación foliar, 1 kg/Ha, 21 DPA;

La Figura 6 demuestra la selectividad de los compuestos 5657, 5602, 5609, 5629 por cereales (maíz y cebada) en aplicación por empapado (0,05%), 14 DPA;

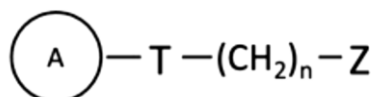
La Figura 7 demuestra el efecto herbicida del compuesto 5679 en aplicación foliar sobre la resistencia al glifosato (Grupo 9) y al Paraquat (Grupo 22) en *Conyza bonariensis*, 14 DPA; y,

La Figura 8 demuestra el efecto herbicida del compuesto 5679 (0,5 kg de i.a./Ha, aplicación foliar) en *Sonchus oleraceus* resistente a la sulfonilurea (herbicida del grupo 2), 14 DPA.

DESCRIPCIÓN DETALLADA DE LA INVENCION

A continuación se describirá con más detalle la presente invención, para ello se hará referencia a los ejemplos y dibujos adjuntos, en los que se muestran realizaciones de la invención. Sin embargo, cabe hacer notar que esta invención puede realizarse de muchas formas diferentes y no debe interpretarse que la invención está limitada a las realizaciones establecidas en este documento; más bien, estas realizaciones se proporcionan para que la presente divulgación sea exhaustiva y completa y pueda transmitir íntegramente el alcance de la invención a los expertos en la materia.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona una composición agrícola que comprende un compuesto o una de sus sales que tiene la estructura



o una de sus sales; en donde:

A un armazón de ciclopentadieno, benceno e indeno que comprende de 1 a 4 heteroátomos; en donde cada uno de los heteroátomos se selecciona independientemente del grupo que consiste en N, S, Se, y O; y en donde uno o más de los átomos de carbono del anillo está opcionalmente unido químicamente a al menos uno de los grupos que consisten en: $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NR}^+$, $-\text{SO}_2$, $-\text{CX}_3$, $-\text{CX}_2\text{R}$, $-\text{COX}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COR}$, $-\text{CO}_2\text{R}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}$, $-\text{CONR}_2$, $-\text{N}=\text{O}$, $-\text{N}=\text{N}^+$, $-\text{N}=\text{NR}$, $-\text{CR}=\text{NR}$, $-\text{N}=\text{CR}_2$, $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, y $-\text{I}$, y en donde X se selecciona de $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, y $-\text{I}$;

n es 0 a 5;

T es un grupo metileno sustituido o no sustituido con uno o dos haluros, $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NR}_3^+$, $-\text{SO}_2\text{R}$, $-\text{CX}_3$, $-\text{CX}_2\text{R}$, $-\text{COX}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COR}$, $-\text{CO}_2\text{R}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}$, $-\text{CONR}_2$, $-\text{F}$, $-\text{N}=\text{O}$, $-\text{N}=\text{N}^+$, $-\text{N}=\text{NR}$, $-\text{CR}=\text{NR}$, $-\text{N}=\text{CR}_2$, y en donde X se selecciona de $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, y $-\text{I}$; y

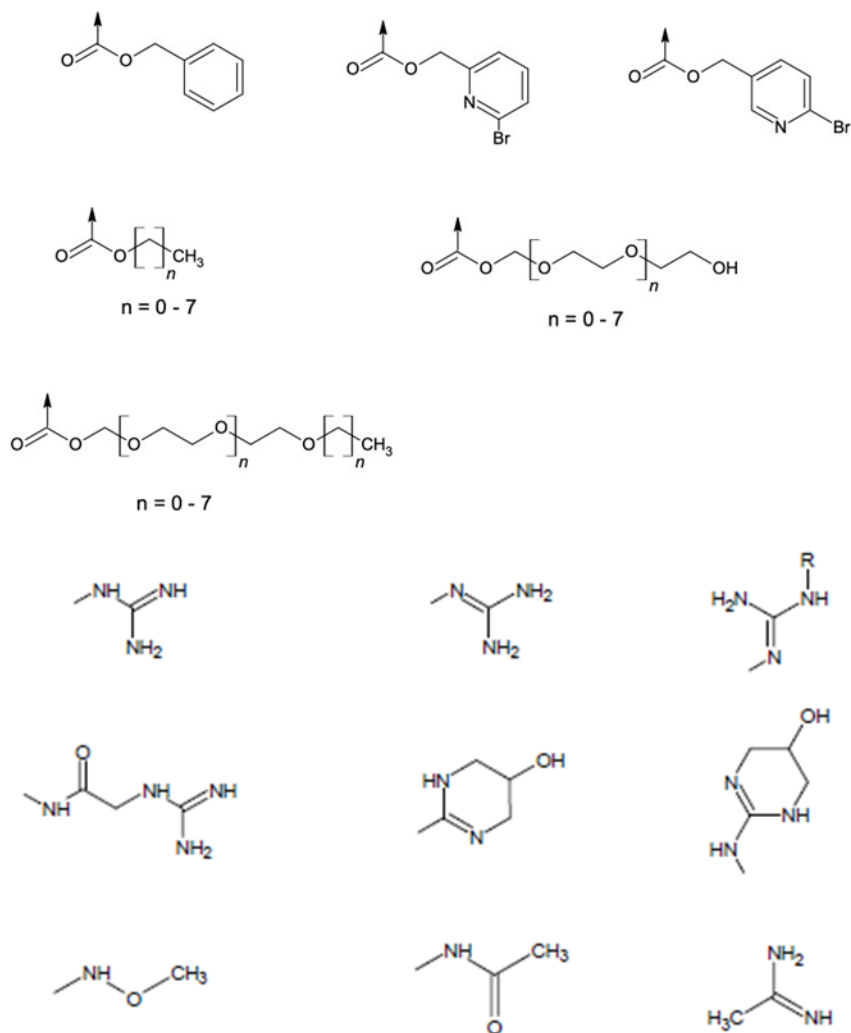
Z es $-\text{COOH}$, $-\text{COO}-$, $-\text{OH}$, $-\text{O}-\text{R}$, $-\text{COOR}$ con residuos alcohol saturados o no saturados con cadena lineal, ramificada, cíclica, aromática o heteroaromática; $-\text{O}-(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{R}$ ($n>1$); $-\text{O}-(\text{CHMeCH}_2\text{O})_n\text{R}$ ($n>1$); grupo fosfato sustituido o no sustituido, grupo sulfonilo, grupo

carbamoilo, amina primaria, amina secundaria, amina terciaria, carboxamida, -NR-O-R, -O-NR₂, hidracina, -NH-COR, y resto metanimidamida o una de sus sales; en donde R se selecciona de H, alquilo sustituido o no sustituido y grupo arilo sustituido o no sustituido; y, en donde la composición comprende al menos un portador agrícolamente aceptable.

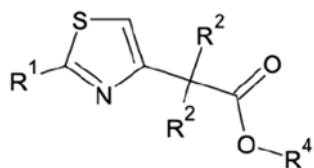
Según algunas realizaciones de la composición anterior, A es un heterociclo sustituido con al menos un grupo electroatractor (EWG, por sus siglas en inglés). Tal como se usa en el presente documento, el término “grupo electroatractor” (EWG) se refiere, sin limitación, a un átomo o un grupo que atrae densidad de electrones desde átomos vecinos o un anillo aromático, generalmente por resonancia y/o efectos inductivos. En el contexto de la invención, la lista no limitativa de los EWG de la invención incluye: grupos trifluorometanosulfonilo y triflato; grupos amonio sustituidos, tales como, entre otros: -NR₃⁺ (R es alquilo/s o H); grupos nitro y nitroso-NO₂, -N=O; ácidos sulfónicos y grupos sulfonilo (-O)-SO₃H, -SO₂R; grupos trihalometilo-CX₃ (X es F, Cl, Br, I); grupos haloformilo-COX (X es F, Cl, Br, I); grupos formilo y acilo-CHO, -COR; grupos aminocarbonilo (sustituidos)-CONH₂, -CONHR, -CONR₂; grupos halo-F, -Cl, -Br, -I; grupos azo-N=N⁺ o -N=NR; grupo imino-CR=NR o -N=CR₂.

Según algunas realizaciones de las composiciones anteriores, Z puede ser, entre otros, carboxilo o sales del mismo-COOH o COO⁻, hidroxilo-OH, éter -O-R, éster COOR con grupos alcohol saturados o no saturados con cadena lineal, ramificada, cíclica o cadena aromática/heteroaromática, etilenglicol y polietilenglicol-O-(CH₂CH₂O)_nR (n>1, R es H o alquilo), propileno y polipropilenglicol-O-(CHMeCH₂O)_nR (n>1, R es H o alquilo), fosfatos (sustituidos y no sustituidos), sulfato/sulfonilo, grupo carbamoilo que consiste en amida primaria, secundaria y terciaria sustituida con cadena alifática cíclica lineal, ramificada, cadena cíclica aromática/heteroaromática, etilenglicol y polietilenglicol (como se indica más arriba), propilenglicol, polipropilenglicol (como se indica más arriba), amina primaria, amina secundaria, amina terciaria, carboxamida, grupos alcoxiamina de tipo-NR-O-R y -O-NR₂, hidracina, grupo acetamida-NH-COR y resto metanimidamida, o sales de los mismos.

Según algunas realizaciones de las composiciones anteriores, Z se selecciona entre



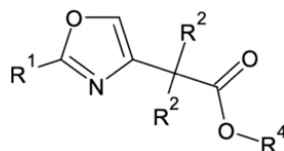
Según algunas realizaciones, la composición anterior comprende un compuesto que tiene la estructura



En donde R^1 se selecciona de Cl; Br; I; y $-CF_3$; R^2 es H o F; y R^4 se selecciona de H, cadena alifática lineal, ramificada, cíclica o aromática, saturada o no saturada; etilenglicol; polietilenglicol; propilenglicol, polipropilenglicol, etilpiridina, etilbenceno, 1-

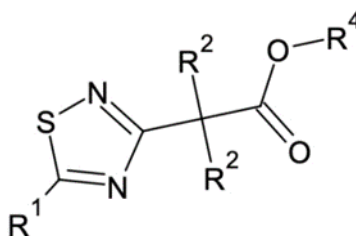
(bromofenil)etan-1-ona, 1-(1H-inden-3-il)etan-1-ona, 1-(2,3-dihidro-1H-inden-1-il)etan-1-ona; 1-(2,3-dihidro-1H-inden-1-il)propan-1-ona; y 1-(1H-inden-3-il)propan-1-ona.

Según algunas realizaciones, la composición anterior comprende un compuesto que tiene la estructura



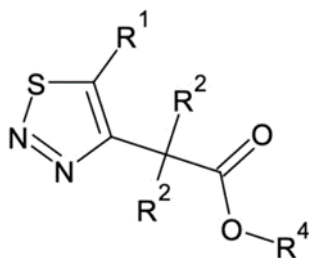
En donde R¹ se selecciona de Cl; Br; I; y -CF₃; R² es H o F; y R⁴ se selecciona de H, cadena alifática lineal, ramificada, cíclica o aromática, saturada o no saturada; etilenglicol; polietilenglicol; propilenglicol, polipropilenglicol, etilpiridina, etilbenceno, 1-(bromofenil)etan-1-ona, 1-(1H-inden-3-il)etan-1-ona, 1-(2,3-dihidro-1H-inden-1-il)etan-1-ona; 1-(2,3-dihidro-1H-inden-1-il)propan-1-ona; y 1-(1H-inden-3-il)propan-1-ona.

Según algunas realizaciones, la composición anterior comprende un compuesto o una sal aceptable del mismo que tiene la estructura



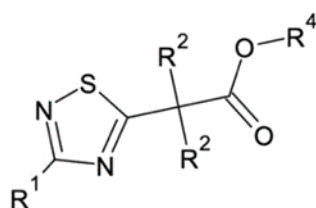
En donde R¹ se selecciona de Cl; Br; I; y -CF₃; R² es H o F; y R⁴ se selecciona de H, cadena alifática lineal, ramificada, cíclica o aromática, saturada o no saturada; etilenglicol; polietilenglicol; propilenglicol, polipropilenglicol, etilpiridina, etilbenceno, 1-(bromofenil)etan-1-ona, 1-(1H-inden-3-il)etan-1-ona, 1-(2,3-dihidro-1H-inden-1-il)etan-1-ona; 1-(2,3-dihidro-1H-inden-1-il)propan-1-ona; y 1-(1H-inden-3-il)propan-1-ona.

Según algunas realizaciones, la composición anterior comprende un compuesto o una sal aceptable del mismo, que tiene la estructura



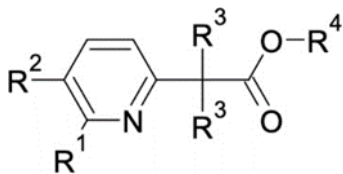
En donde R^1 se selecciona de Cl; Br; I; y $-CF_3$; R^2 es H o F; y R^4 se selecciona de H, cadena alifática lineal, ramificada, cíclica o aromática, saturada o no saturada; etilenglicol; polietilenglicol; propilenglicol, polipropilenglicol, etilpiridina, etilbenceno, 1-(bromofenil)etan-1-ona, 1-(1H-inden-3-il)etan-1-ona, 1-(2,3-dihidro-1H-inden-1-il)etan-1-ona; 1-(2,3-dihidro-1H-inden-1-il)propan-1-ona; y 1-(1H-inden-3-il)propan-1-ona.

Según algunas realizaciones, la composición anterior comprende un compuesto que tiene la estructura



En donde R^1 se selecciona de Cl; Br; I; y $-CF_3$; R^2 es H o F; y R^4 se selecciona de H, cadena alifática lineal, ramificada, cíclica o aromática, saturada o no saturada; etilenglicol; polietilenglicol; propilenglicol, polipropilenglicol, etilpiridina, etilbenceno, 1-(bromofenil)etan-1-ona, 1-(1H-inden-3-il)etan-1-ona, 1-(2,3-dihidro-1H-inden-1-il)etan-1-ona; 1-(2,3-dihidro-1H-inden-1-il)propan-1-ona; y 1-(1H-inden-3-il)propan-1-ona.

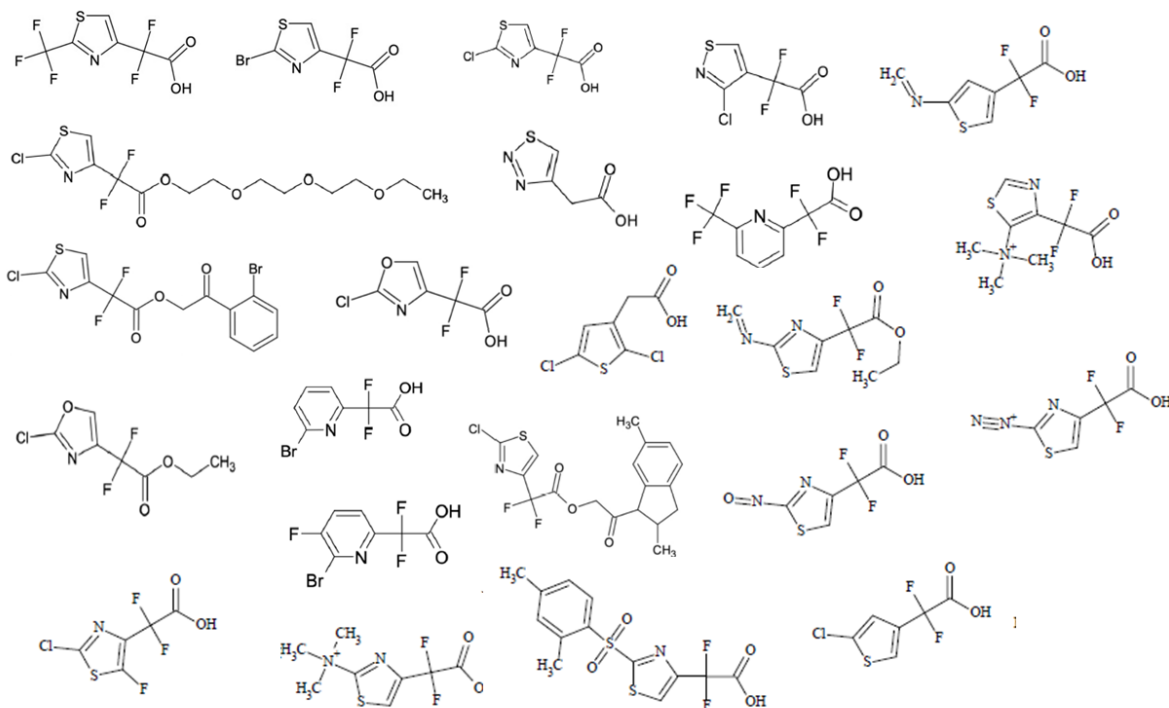
Según algunas realizaciones, la composición anterior comprende un compuesto o una sal aceptable del mismo, que tiene la estructura

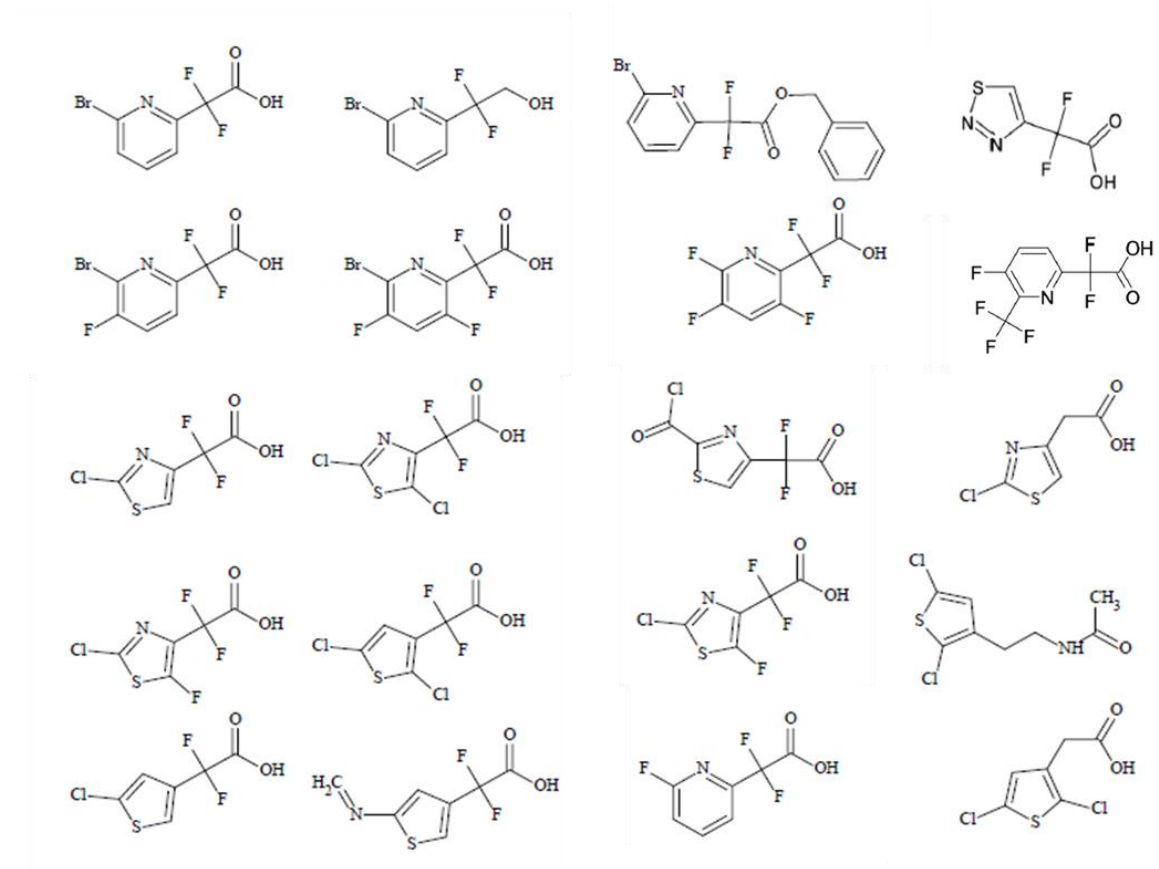


En donde R¹ se selecciona de Cl; Br; I; y -CF₃; R² y R³ se seleccionan cada uno independientemente de H o F; y R⁴ se selecciona de H, cadena alifática lineal, ramificada, cíclica o aromática, saturada o no saturada; etilenglicol; polietilenglicol; propilenglicol, polipropilenglicol, etilpiridina, etilbenceno, 1-(bromofenil)etan-1-ona, 1-(1H-inden-3-il)etan-1-ona, 1-(2,3-dihidro-1H-inden-1-il)etan-1-ona; 1-(2,3-dihidro-1H-inden-1-il)propan-1-ona; y 1-(1H-inden-3-il)propan-1-ona.

Según algunas realizaciones, la composición anterior comprende una lista no limitante de compuestos que incluyen ácido (2-bromo-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acético; ácido difluoro[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]acético; 2-[2-(2-etoxietoxi)etoxi]etilo, (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato; 2-(2-bromofenil)-2-oxoetilo, (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(2,7-metil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-2-oxoetilo; ácido (2-cloro-1,3-oxazol-4-il)(difluoro)acético; (2-cloro-1,3-oxazol-4-il)(difluoro)acetato de etilo; ácido difluoro(1,2,3-tiadiazol-4-il)acético; ácido (1,2,3-tiadiazol-4-il)acético; ácido (3-cloro-1,2-tiazol-4-il)(difluoro)acético.

Según algunas realizaciones de las composiciones anteriores, la lista no limitante de compuestos o sales agrícolamente aceptables incluye:



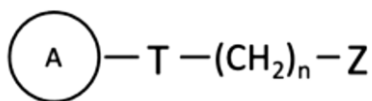


Según algunas realizaciones de la composición anterior, la composición agrícola comprende además al menos un agente protector de cultivos. La lista no limitativa de agentes de protección de cultivos incluye atrazina, terbutilazina, (S)-metolacolor, metolacolor, terbutrina, simazina, dimetenamida, (S)-dimetenamida, flufenacet, acetocloro, alacolor, isoxaflutol, isoxaclorolortol, mesotriona, sulcotriona, metosulam, flumetsulam, pendimetalina, bromoxinila, bentazona, carfentrazona-etilo, clomazona, nicosulfurón, rimsulfurón, halosulfurón-metilo, metribuzina, flumiclorac-pentilo, prosulfurón, primisulfurón-metilo, dicamba, flutiacet-metilo, piridato, 2,4-D, clopiralida, diflufenzopir, fluroxipir, MCPA, MCPB, mecoprop (MCP), metobenzurón, tifensulfurón-metilo, aclonifen, EPTC, glifosato, glufosinato, sulfosato, cianazina, propaquizafop, metamitrón, pyramin, fenmedifam, desmedifam, etofumesato, triasulfurón, cloridazón, lenacil, trialato, fluazifop, setoxidima, quizalofop, clopiralida, cletodima, oxasulfurón, acifluorfen, benazolin-etilo, sulfentrazona, clorimurón-etilo, cloransulam-metilo, fomesafen, imazamox, imazaquina, imazetapir, imazapir, lactofen, fenoxaprop(P-etilo), tidiazurón, tribufos, trifluralin, dimetacolor,

napropamida, quinmerac, metazacloro, carbetamida, dimefurón, propizamida, etametsulfurón-metilo, tebutam, fluometurón, prometrina, norflurazón, piritiobac-sodio, MSMA, DSMA, diurón, flurocloridona, ditiopir, tiazopir, oxifluorfen, etalfluralina, clodinafop, amidosulfurón, diclofop-metilo, diflufenicán, etoxisulfurón, fentrazamida, flazasulfurón, florasulam, fluazolato, flucarbazona, flupirsulfurón-metil sodio, flurtamona, yodosulfurón, isoproturón, clortolurón, clorsulfurón, metsulfurón-metilo, sulfosulfurón, tribenurón-metilo, 2,4-DB, 2,4-DP, bifenox, flamprop-M, imazametabenzo-metilo, ioxinilo, tralkoxidim, fluoroglucofen-etilo, metabenzotiazurón, isoxaben, prosulfocarb, difenzoquat-metilsulfato, pretilacloro, cinosulfurón, fenclorim, bensulfurón-metilo, imazosulfurón, pirazosulfurón-etilo, azimsulfurón, esprocarb, mefenacet, molinato, propanilo, pirazolato, cihalofof-butilo, bispiribac-sodio, piriminobac-metilo, cafenstrol, oxadiargilo, oxadiazón, bromobutida, MY-100, dymron, NB 061, MK243, HW-52, AC 014, ametrina, hexazinona, asulam, azafenidina, tebutiurón, etametsulfurón-metilo o una combinación de los mismos.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona un método para controlar el crecimiento vegetal indeseado que comprende aplicar al lugar de dicho crecimiento vegetal indeseado la composición agrícola según las realizaciones de la composición anterior.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona un método para controlar el crecimiento vegetal indeseado que comprende aplicar al lugar del crecimiento vegetal indeseado una cantidad herbicidamente efectiva de un compuesto que tiene la estructura



o una de sus sales, en donde:

A es un armazón de ciclopentadieno, benceno e indeno que comprende de 1 a 4 heteroátomos; en donde cada uno de los heteroátomos se selecciona independientemente del grupo que consiste en N, S, Se, y O; y en donde uno o más de los átomos de carbono del anillo está opcionalmente unido químicamente a al menos uno de los grupos que consisten en: $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NR}^+$, $-\text{SO}_2$, $-\text{CX}_3$, $-\text{CX}_2\text{R}$, $-\text{COX}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COR}$, $-\text{CO}_2\text{R}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}$, -

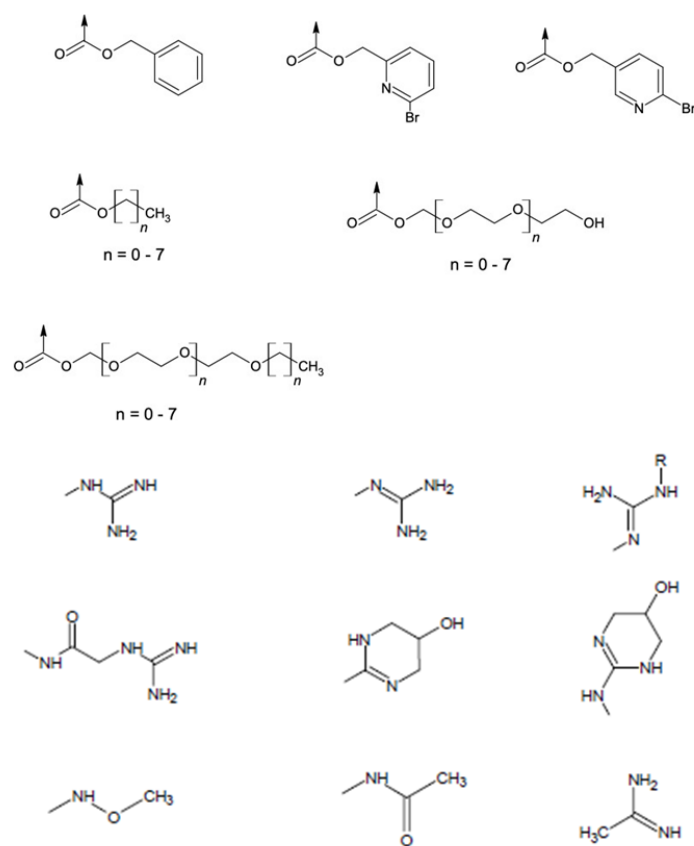
CONR₂, -N=O, -N=N⁺, -N=NR, -CR=NR, -N=CR₂, -F, -Cl, -Br, y -I, y en donde X se selecciona de -F, -Cl, -Br, y -I;

n es 0 a 5;

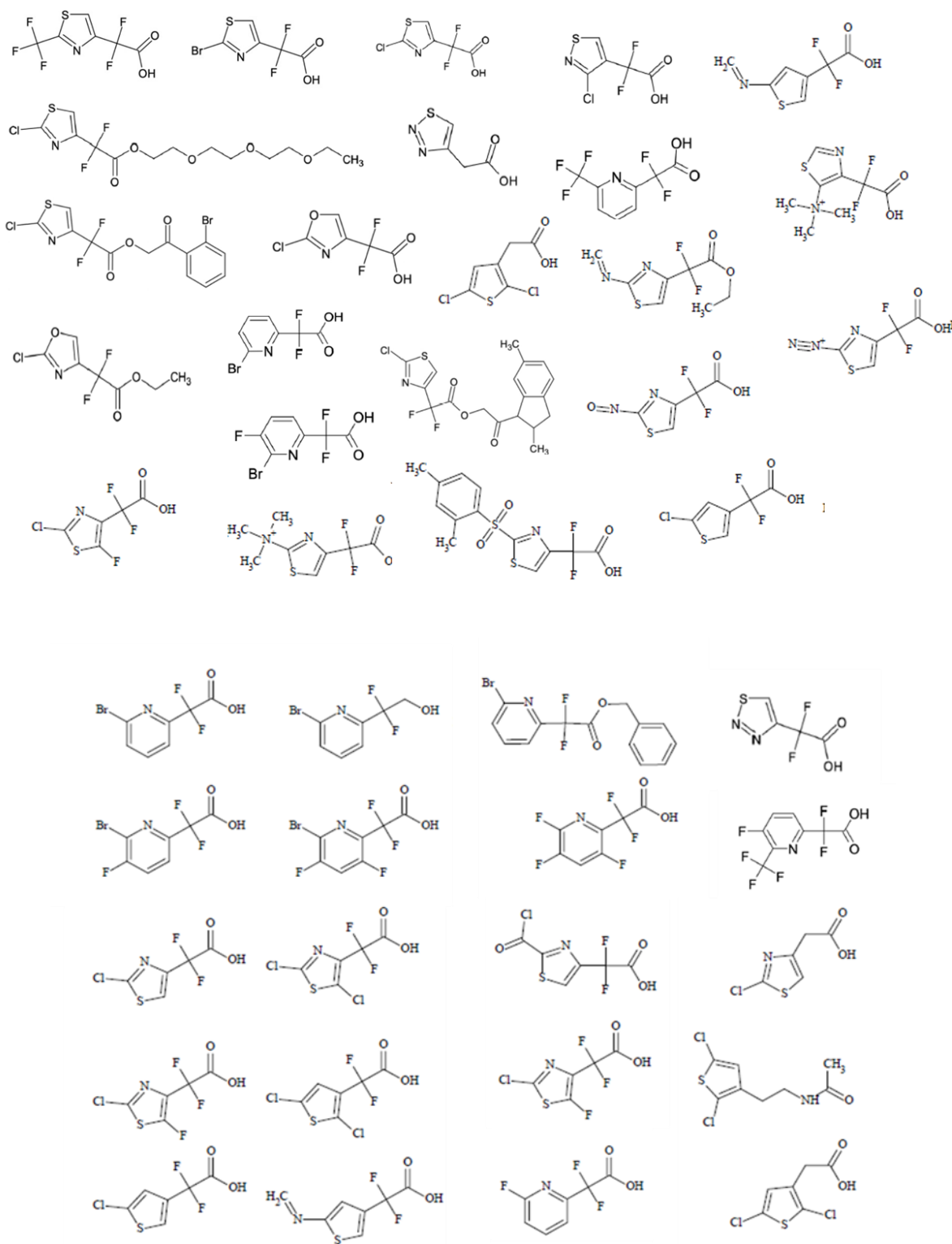
T es un grupo metileno sustituido o no sustituido con uno o dos haluros, -SO₂CF₃, -O-SO₂CF₃, -NR₃⁺, -SO₂R, , -CX₃, -CX₂R-COX, -CHO, -COR, -CO₂R, -CONH₂, -CONHR, -CONR₂, -F, -N=O, -N=N⁺, -N=NR, -CR=NR, -N=CR₂, y en donde X se selecciona de -F, -Cl, -Br, y -I; y

Z es -COOH, -COO-, -OH, -O-R, -COOR con residuos alcohol saturados o no saturados con cadena lineal, ramificada, cíclica, aromática o heteroaromática; -O-(CH₂CH₂O)_nR (n>1); -O-(CHMeCH₂O)_nR (n>1); grupo fosfato sustituido o no sustituido, grupo sulfonilo, grupo carbamoilo, amina primaria, amina secundaria, amina terciaria, carboxamida, -NR-O-R, -O-NR₂, hidracina, -NH-COR, y resto metanimidamida o una de sus sales; en donde R se selecciona de H, alquilo sustituido o no sustituido y grupo arilo sustituido o no sustituido.

Según algunas realizaciones del método anterior, Z podría seleccionarse, sin limitación, del grupo que incluye:



Según algunas realizaciones del método anterior, la lista no limitante de compuestos o sales agrícolas aceptables incluye



Según algunas realizaciones, el método anterior comprende además aplicar al lugar del crecimiento vegetal indeseado al menos un agente protector de cultivos. Según algunas

realizaciones, el agente protector de cultivos se selecciona del grupo que consiste en herbicida, fungicida, insecticida y un regulador del crecimiento vegetal.

Según algunas realizaciones del método anterior, el agente protector de cultivos es un herbicida.

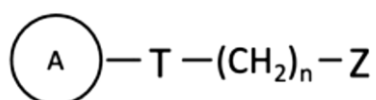
Según algunas realizaciones del método anterior, el agente protector de cultivos es un herbicida inhibidor de la síntesis de aminoácidos. La lista no limitante de herbicidas inhibidores de la síntesis de aminoácidos de la invención incluye: herbicida de sulfonilurea, herbicida de imidazolinona, herbicida de sulfonamida, derivados de aminoácidos, imazamox, imazapic, imazetapir, imazaquina, imazapir e imazametabenzotriazol, Clorimurón, Primisulfurón, Tifensulfurón, Triasulfurón, Nicosulfurón, Metsulfurón, Tribenurón, Rimsulfurón, Triflursulfurón, glifosato o cualquier combinación de los mismos.

Según algunas realizaciones del método anterior, el agente protector de cultivos es un regulador del crecimiento vegetal.

Según algunas realizaciones del método anterior, la lista no limitante de reguladores del crecimiento vegetal de la invención incluye dicamba, 2,4-D, clopiralida y fluroxipir.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona un método para controlar el crecimiento vegetal indeseado que comprende aplicar al lugar del crecimiento vegetal indeseado

a. un primer herbicida que tiene la estructura



o una de sus sales, en donde

A es un armazón de ciclopentadieno, benceno e indeno que comprende de 1 a 4 heteroátomos; en donde cada uno de los heteroátomos se selecciona independientemente del grupo que consiste en N, S, Se, y O; y en donde uno o más de los átomos de carbono del anillo está opcionalmente unido químicamente a al menos uno de los grupos que consisten en: $-\text{SO}_2\text{CF}_3$,

-O-SO₂CF₃, -NR⁺, -SO₂, -CX₃, -CX₂R, -COX, -CHO, -COR, -CO₂R, -CONH₂, -CONHR, -CONR₂, -N=O, -N=N⁺, -N=NR, -CR=NR, -N=CR₂, -F, -Cl, -Br, y -I, y en donde X se selecciona de -F, -Cl, -Br, y -I;

n es 0 a 5;

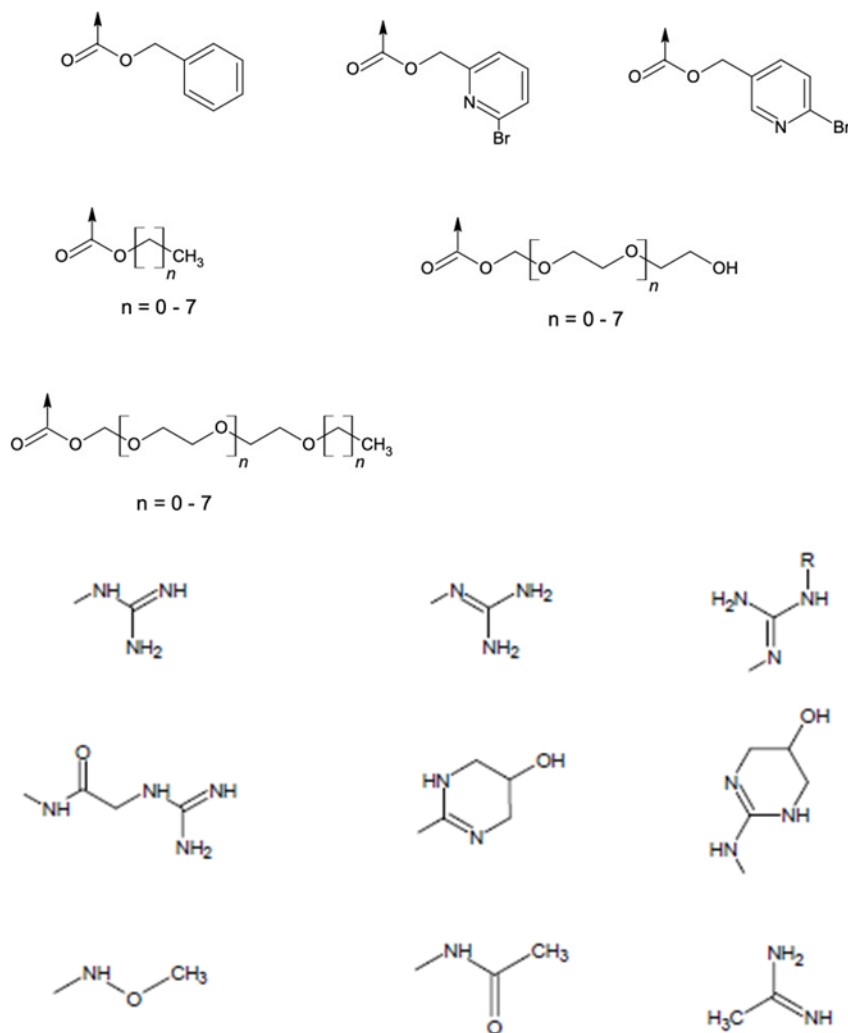
T es un grupo metileno sustituido o no sustituido con uno o dos haluros, -SO₂CF₃, -O-SO₂CF₃, -NR₃⁺, -SO₂R, -CX₃, -CX₂R-COX, -CHO, -COR, -CO₂R, -CONH₂, -CONHR, -CONR₂, -F, -N=O, -N=N⁺, -N=NR, -CR=NR, -N=CR₂, y en donde X se selecciona de -F, -Cl, -Br, y -I;

y

Z es -COOH, -COO-, -OH, -O-R, -COOR con residuos alcohol saturados o no saturados con cadena lineal, ramificada, cíclica, aromática o heteroaromática; -O-(CH₂CH₂O)_nR (n>1); -O-(CHMeCH₂O)_nR (n>1); grupo fosfato sustituido o no sustituido, grupo sulfonilo, grupo carbamoilo, amina primaria, amina secundaria, amina terciaria, carboxamida, -NR-O-R, -O-NR₂, hidracina, -NH-COR, y resto metanimidamida o una de sus sales; en donde R se selecciona de H, alquilo sustituido o no sustituido y grupo arilo sustituido o no sustituido; y

b. un segundo herbicida, para controlar efectivamente el crecimiento vegetal indeseado.

Según algunas realizaciones del método anterior, Z podría seleccionarse, sin limitación, del grupo que incluye:



Según algunas realizaciones del método anterior, el segundo herbicida puede ser, entre otros, un herbicida inhibidor de la síntesis de aminoácidos, tal como un herbicida de sulfonilurea, un herbicida de imidazolinona, un herbicida de sulfonamida y un derivado de aminoácido.

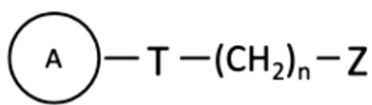
Según algunas realizaciones del método anterior, el segundo herbicida se puede seleccionar de una lista no limitante que incluye imazamox, imazapic, imazetapir, imazaquina, imazapir, imazametabenzo, Clorimurón, Primisulfurón, Tifensulfurón, Triasulfurón, Nicosulfurón, Metsulfurón, Tribenurón, Rimsulfurón, Triflusulfurón, Glifosato, atrazina, terbutilazina, (S)-metolacoloro, metolacoloro, terbutrina, simazina, dimetenamida, (S)-dimetenamida, flufenacet, acetocoloro, alacoloro, isoxaflutol, isoxaclortol, mesotriona, sulcotriona, metosulam, flumetsulam, pendimetalina, bromoxinil, bentazona, carfentrazona-etilo, clomazona, nicosulfurón, rimsulfurón, halosulfurón-metilo, metribuzina, flumiclorac-pentilo,

prosulfurón, primisulfurón-metilo, dicamba, flutiacet-metilo, piridato, 2,4-D, clopiralida, diflufenzopir, fluroxipir, MCPA, MCPB, mecoprop (MCP), metobenzurón, tifensulfurón-metilo, aclonifen, EPTC, glifosato, glufosinato, sulfosato, cianazina, propaquizafop, metamitrón, pyramin, fenmedifam, desmedifam, etofumesato, triasulfurón, cloridazón, lenacil, trialato, fluazifop, setoxidima, quizalofop, clopiralida, cletodima, oxasulfurón, acifluorfen, benazolin-etilo, sulfentrazona, clorimurón-etilo, cloransulam-metilo, fomesafen, imazamox, imazaquina, imazetapir, imazapir, lactofen, fenoxaprop(P-etilo), tidiazurón, tribufos, trifluralina, dimetacoloro, napropamida, quinmerac, metazacoloro, carbetamida, dimefurón, propizamida, etametsulfurón-metilo, tebutam, fluometurón, prometrina, norflurazón, piritiobac-sodio, MSMA, DSMA, diurón, flurocloridona, ditiopir, tiazopir, oxifluorfen, etalfluralina, clodinafop, amidosulfurón, diclofop-metilo, diflufenicán, etoxisulfurón, fentrazamida, flazasulfurón, florasulam, fluazolato, flucarbazona, flupirsulfurón-metil sodio, flurtamona, yodosulfurón, isoproturón, clortolurón, clorsulfurón, metsulfurón-metilo, sulfosulfurón, tribenuron-metilo, 2,4-DB, 2,4-DP, bifenox, flamprop-M, imazametabenzo-metilo, ioxinil, tralkoxidim, fluoroglucofen-etilo, metabenzthiazurón, isoxaben, prosulfocarb, difenzoquat-metilsulfato, pretilaclor, cinosulfurón, fenclorim, bensulfurón-metilo, imazosulfurón, pirazosulfurón-etilo, azimsulfurón, esprocarb, mefenacet, molinato, propanil, pirazolato, cihalofop-butilo, bispiribac-sodio, piriminobac-metilo, cafenstrolo, oxadiargilo, oxadiazón, bromobutida, MY-100, dymron, NB 061, MK243, HW-52, AC 014, ametrina, hexazinona, asulam, azafenidina, tebutiurón y etametsulfurón-metilo.

Según algunas realizaciones, los métodos anteriores comprenden además aplicar al lugar de crecimiento indeseado un tercer herbicida o un regulador del crecimiento vegetal.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona una composición para controlar el crecimiento vegetal indeseado que comprende una mezcla de:

- a. un primer herbicida que tiene la estructura



o una de sus sales, en donde

A es un armazón de ciclopentadieno, benceno e indeno que comprende de 1 a 4 heteroátomos; en donde cada uno de los heteroátomos se selecciona independientemente del grupo que consiste en N, S, Se, y O; y en donde uno o más de los átomos de carbono del anillo está opcionalmente unido químicamente a al menos uno de los grupos que consisten en: $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NR}^+$, $-\text{SO}_2$, $-\text{CX}_3$, $-\text{CX}_2\text{R}$, $-\text{COX}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COR}$, $-\text{CO}_2\text{R}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}$, $-\text{CONR}_2$, $-\text{N}=\text{O}$, $-\text{N}=\text{N}^+$, $-\text{N}=\text{NR}$, $-\text{CR}=\text{NR}$, $-\text{N}=\text{CR}_2$, $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, y $-\text{I}$, y en donde X se selecciona de $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, y $-\text{I}$;

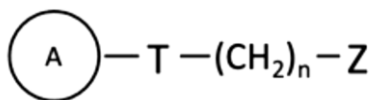
n es 0 a 5;

T es un grupo metileno sustituido o no sustituido con uno o dos haluros, $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NR}_3^+$, $-\text{SO}_2\text{R}$, $-\text{CX}_3$, $-\text{CX}_2\text{R}-\text{COX}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COR}$, $-\text{CO}_2\text{R}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}$, $-\text{CONR}_2$, $-\text{F}$, $-\text{N}=\text{O}$, $-\text{N}=\text{N}^+$, $-\text{N}=\text{NR}$, $-\text{CR}=\text{NR}$, $-\text{N}=\text{CR}_2$, y en donde X se selecciona de $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, y $-\text{I}$; y

Z es $-\text{COOH}$, $-\text{COO}-$, $-\text{OH}$, $-\text{O}-\text{R}$, $-\text{COOR}$ con residuos alcohol saturados o no saturados con cadena lineal, ramificada, cíclica, aromática o heteroaromática; $-\text{O}-(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{R}$ ($n>1$); $-\text{O}-(\text{CHMeCH}_2\text{O})_n\text{R}$ ($n>1$); grupo fosfato sustituido o no sustituido, grupo sulfonilo, grupo carbamoilo, amina primaria, amina secundaria, amina terciaria, carboxamida, $-\text{NR}-\text{O}-\text{R}$, $-\text{O}-\text{NR}_2$, hidracina, $-\text{NH}-\text{COR}$, y resto metanimidamida o una de sus sales; en donde R se selecciona de H, alquilo sustituido o no sustituido y grupo arilo sustituido o no sustituido;

- b. al menos un herbicida o un regulador del crecimiento vegetal; y,
- c. al menos un portador aceptable.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona un método para inhibir selectivamente el crecimiento de vegetación indeseada que comprende aplicar al lugar del crecimiento vegetal indeseado una cantidad herbicidamente efectiva de un compuesto que tiene la estructura



o una de sus sales, en donde:

A es un armazón de ciclopentadieno, benceno e indeno que comprende de 1 a 4 heteroátomos; en donde cada uno de los heteroátomos se selecciona independientemente del grupo que consiste en N, S, Se, y O; y en donde uno o más de los átomos de carbono del anillo está opcionalmente unido químicamente a al menos uno de los grupos que consisten en: $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NR}^+$, $-\text{SO}_2$, $-\text{CX}_3$, $-\text{CX}_2\text{R}$, $-\text{COX}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COR}$, $-\text{CO}_2\text{R}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}$, $-\text{CONR}_2$, $-\text{N}=\text{O}$, $-\text{N}=\text{N}^+$, $-\text{N}=\text{NR}$, $-\text{CR}=\text{NR}$, $-\text{N}=\text{CR}_2$, $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, y $-\text{I}$, y en donde X se selecciona de $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, y $-\text{I}$;

n es 0 a 5;

T es un grupo metileno sustituido o no sustituido con uno o dos haluros, $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{O}-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NR}_3^+$, $-\text{SO}_2\text{R}$, $-\text{CX}_3$, $-\text{CX}_2\text{R}-\text{COX}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COR}$, $-\text{CO}_2\text{R}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}$, $-\text{CONR}_2$, $-\text{F}$, $-\text{N}=\text{O}$, $-\text{N}=\text{N}^+$, $-\text{N}=\text{NR}$, $-\text{CR}=\text{NR}$, $-\text{N}=\text{CR}_2$, y en donde X se selecciona de $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, y $-\text{I}$;

Z es $-\text{COOH}$, $-\text{COO}-$, $-\text{OH}$, $-\text{O}-\text{R}$, $-\text{COOR}$ con residuos alcohol saturados o no saturados con cadena lineal, ramificada, cíclica, aromática o heteroaromática; $-\text{O}-(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{R}$ ($n>1$); $-\text{O}-(\text{CHMeCH}_2\text{O})_n\text{R}$ ($n>1$); grupo fosfato sustituido o no sustituido, grupo sulfonilo, grupo carbamoilo, amina primaria, amina secundaria, amina terciaria, carboxamida, $-\text{NR}-\text{O}-\text{R}$, $-\text{O}-\text{NR}_2$, hidracina, $-\text{NH}-\text{COR}$, y resto metanimidamida o una de sus sales; en donde R se selecciona de H, alquilo sustituido o no sustituido y grupo arilo sustituido o no sustituido.

Tal como se utiliza en el presente documento, el término “crecimiento vegetal indeseado” es intercambiable con términos tales como “pantas no deseadas”, “vegetación no deseada” y “crecimiento de malezas” y similares, y se refiere al crecimiento de malezas a expensa de los cultivos. La inhibición del crecimiento puede ser una inhibición total del crecimiento, una inhibición parcial del crecimiento, ejerciendo un efecto negativo sobre la tasa de crecimiento de la maleza en comparación con la tasa de crecimiento del cultivo. El efecto sobre el

rendimiento de las malezas se puede lograr antes de su emergencia, lo que resulta en una falta y/o menor cantidad de malezas en el área tratada, o después de la emergencia, lo que resulta en una detención del crecimiento, daño irreversible a las malezas y muerte de la planta. En el contexto de la invención, el término “planta” se refiere, sin limitación, a la planta entera o sus partes, incluidas raíces, hojas, frutos, flores, tejidos, semillas o cualquier otra parte de la planta.

Tal como se utiliza en el presente documento, el término “inhibir selectivamente” se refiere a inhibir el crecimiento de la maleza, sin ejercer un efecto negativo sobre el cultivo.

Según algunas realizaciones de los métodos y composiciones anteriores, la lista no limitante de cultivos de la invención incluye soja, maíz, cereales, arroz, cebada, sorgo, semillas oleaginosas y avena.

Según algunas realizaciones de los métodos anteriores, el “crecimiento vegetal indeseado” se refiere a malezas resistentes a herbicidas, tales como, entre otros, grupo HPAC 9 (inhibidores de la síntesis de EPSP), 2 (inhibidores de acetolactato sintasa (ALS)), 22 (Fotosistema I, Paraquat), y 4 (reguladores del crecimiento vegetal o auxinas sintéticas).

Según algunas realizaciones de los métodos y composiciones anteriores, la aplicación puede ser, entre otros, una aplicación foliar, una aplicación por empapado o una aplicación al suelo.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona un método para inhibir el crecimiento de malezas, de forma selectiva.

Según algunas realizaciones, la composición se aplica al suelo antes de la emergencia y a las malezas después de la emergencia.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona una composición agrícola que comprende un compuesto o una de sus sales seleccionado entre 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etan-1-amina; ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-hidroxipropanoico; ácido 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acético; 1-(2,5-diclorotiofen-3-il)metanamina; 2-(tiofen-3-il)etan-1-amina; 2-(tiofen-3-il)etan-1-ol; 2-amino-1-(tiofen-3-il)etan-1-ol; 2-(tiofen-3-il)acetamida; 2-(1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina; 2-(1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina; 3-(tiofen-3-

il)propan-1-amina; ácido 2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-carboxílico; 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butanoico; 3-[5-(clorometil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2-acetamido-3,3-difluoropropanoato de etilo; clorhidrato[HCl] de ácido 2-amino-3-(1H-indazol-3-il)propanoico; ácido (2-bromopiridin-4-il)acético; ácido 3-(2-bromopiridin-4-il)-2-hidroxipropanoico; 2-(2-bromopiridin-4-il)etan-1-amina; 4-(2-aminoetil)fenol; bis[(2-bromopiridin-4-il)metil]amina; 2-(piridin-3-il)acetamida; ácido 2-(2,6-dibromopiridin-4-il)acético; 2-bromo-4-(2-bromoetil)piridina; ácido naftaleno-2-carboxílico; ácido 2-bromopiridina-4-carboxílico; ácido (2E)-3-(2,6-dicloropiridin-3-il)prop-2-enoico; 2-amino-N-(2-bromopiridin-4-il)etano-1-sulfonamida; 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butanamida; 2-(tiofen-3-il)etano-1-tiol; (2-aminoetil)[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amina; 2-{[2-(tiofen-3-il)etil]sulfanil}etan-1-amina; 3-(tiofen-3-il)propano-1,2-diol; ácido 3-[(2,5-diclorotiofen-3-il)formamido]-2,2-difluoropropanoico; ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)propanoico; ácido (2E)-3-(5-clorotiofen-2-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(1,3-tiazol-5-il)prop-2-enoico; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetamida; [(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]hidracina; ácido 3-{[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino}-2,2-difluoropropanoico; ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxopropanoico; cloruro de 2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-carbonilo; 2-bromo-N-[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]piridina-4-carboxamida; ácido 2-{[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino}acético; dicloro-1,3-tiazol-4-carboxamida; N-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)acetamida; ácido (3E)-4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxobut-3-enoico; ácido (2E)-3-(3-cloro-1H-1,2,4-triazol-5-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(2,4-dicloro-1,3-tiazol-5-il)prop-2-enoico; ácido 2-(2-clorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacético; ácido 3-{[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino}-2,2-difluoropropanoico; ácido 2-(5-clorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacético; ácido 3-{4-[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]piperazin-1-il}propanoico; tricloro-1,3-tiazol; ácido 3-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propanoico; N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]acetamida; ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-dimetilbutanoico; ácido 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxoacético; ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-4,4-difluorobutanoico; diclorhidrato [HCl] de ácido 2-amino-3-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propanoico; N-propil-3-(4H-1,2,4-triazol-3-il)propanamida; 3-(4H-1,2,4-triazol-3-il)propanoato de propilo; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacetamida; ácido 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)acético; 3-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-N-propilpropanamida; 3-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)propanoato de etilo; ácido (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acético; 2-(3-bromo-1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina; (2,5-

diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de etilo; ácido [2-(2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetamido]acético; ácido 2-oxo-2-(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acético; 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N-etilpropanamida; ácido 3-[(2,5-dibromotiofeno-3-sulfonyl)amino]propanoico; N-(2-aminoetil)-2,5-dibromotiofeno-3-sulfonamida; 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)propanoato de etilo; N-[2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]acetamida; ácido 2,2-difluoro-2-(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acético; oxo(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acetato de metilo; 1-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)metanamina; ácido 2,2-difluoro-2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-1,3-benzodiazol-5-il)acético; (2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de etilo; 2-cloro-2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de metilo; 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butan-1-amina; ácido 2-amino-2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acético; propil[2-(1H-1,2,4-triazol-3-il)etil]amina; 2-(2-bromo-5-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo; 2-bromo-2-(2-bromo-5-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo; 2-(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de sodio; ácido 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; (2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de etilo; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de bencilo; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N-metoxietan-1-amina; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N,N,N-trimetiletan-1-amonio; 2-(5-bromo-2-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo; clorhidrato de ácido 2-amino-4,5,6,7-tetrahidro-1,3-benzotiazol-4-carboxílico; 5-(2,5-diclorotiofen-3-il)imidazolidina-2,4-diona; 2-cloro-4-fenil-1,3-tiazol; ácido 2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; ácido 2,2-difluoro-2-[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]acético; 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-N,N,N-trimetiletan-1-amonio; 2-cloro-4-(fenoximetil)-1,3-tiazol; ácido 2-cloro[1,3]tiazol[5,4-b]piridina-6-carboxílico; 4-bencilo-2-cloro-1,3-tiazol; 3-([2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]amino)metilfenol; ácido 2,2-difluoro-2-(1H-1,2,3,4-tetrazol-5-il)acético; dibencilo[(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)metil]amina; ácido dicloro-1,3-tiazol-4-sulfinico; 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etan-1-amina; ácido 2,5-diclorotiofeno-3-carboxílico; ácido (tiofen-3-il)acético; bencilo[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amina; ácido (tiofen-3-il)propanodioico; N-[2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]-2-(3-hidroxifenil)acetamida; 4-[difluoro(fenil)metil]-1,3-tiazol-2-amina; 4-[difluoro(fenil)metil]-1H-imidazolo; 2-cloro-4-[difluoro(fenil)metil]-1,3-tiazol; ácido 2,2-difluoro[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-5-il]acético; 2,2-difluoro-2-[5-(trifluorometil)tiofen-2-il]acetato de etilo; 2-cloro-4-(2-hidraziniletal)-1,3-tiazol; difluoro(tiofen-3-il)acetato de etilo; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetohidrazida; [2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]hidracina; difluoro[5-

(trifluorometil)tiofen-3-il]acetato de etilo; N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-2-fenilacetamida; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de bencilo; ácido 2,2-difluoro-2-[5-(trifluorometil)-1,3-tiazol-2-il]acético; [2-(5-clorotiofen-3-il)etil]hidracina; ácido [(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)metil]fosfónico; 1-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-3-fenilpropan-2-ona; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-N'-metilacetohidrazida; ácido 2-[2-(5-cloro-3-fluoropiridin-2-il)-1,3-tiazol-4-il]acético; ácido 2,2-difluoro-2-[5-metil-2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]acético; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroetan-1-ol; N'-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-N-(3-hidroxipropil)guanidina; 2-carbamimidamido-N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]acetamida; N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-N'-(2-hidroxipropil)guanidina; ácido difluoro[2-(trifluorometil)tiofen-3-il]acético; 2-(2-amino-5-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo; ácido 2-(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; 2-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-1,4,5,6-tetrahidropirimidin-5-ol; 2-(2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amino}-4,5-dihidro-1H-imidazol-1-il)etan-1-ol; 2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil](4,5-dihidro-1H-imidazol-2-il)amino}etan-1-ol; ácido 2-[2-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,3-tiazol-4-il]-2,2-difluoroacético; (2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de (4-bromofenil)metilo; ácido 2,2-difluoro-2-{2-[3-fluoro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]-1,3-tiazol-4-il}acético; ácido [(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)metil]fosfónico; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(4-metilfenil)-2-oxoetilo; ácido 4-amino-5-(2-clorotiofen-3-il)pentanoico; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-oxo-2-(piridin-2-il)etilo; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-oxo-2-feniletilo; 2-(2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amino}-4,5-dihidro-1H-imidazol-1-il)etan-1-ol; 3-acetil-1-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]piperidin-4-ona; ácido [2,5-bis(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il](difluoro)acético; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de 2-[2-(bencilooxi)etoxi]etilo; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(2-metoxietoxi)etilo; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de (2-bromofenil)metilo; ácido 2-(1,2,3-tiadiazol-4-il)acético; ácido [2-(2,4-dimetilbenzene-1-sulfonyl)-1,3-tiazol-4-il](difluoro)acético; ácido 5H,6H-tieno[3,2-d][1,2,3]tiadiazolo-5-carboxílico; ácido (2-cloro-5-fluoro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acético; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetato de {2-[(6-amino-9H-purin-9-il)metoxi]etoxi}metilo; ácido (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(ciano)acético; ácido (2-cloro-5-fluoro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acético; ácido (6-cianopiridin-2-il)(difluoro)acético; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacetato de (6-bromopiridin-2-il)metilo; (2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de (6-bromopiridin-2-il)metilo; ácido difluoro[4-

(trifluorometil)tiofen-3-il]acético; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de (4-bromofenil)metilo; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(2-metoxietoxi)etilo; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de (2-bromofenil)metilo; ácido 2-(3-cloro-1,2-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de 2,5,8,11,14-pentaoxahexadecan-16-ilo; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo; ácido 2-(2-cloro-1,3-benzotiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; ácido 2-[5-cloro-2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]-2,2-difluoroacético; ácido 2-[2-cloro-5-(2-feniletinil)-1,3-tiazol-4-il]-2,2-difluoroacético; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetato de 2-(4-metilfenil)-2-oxoetilo; ácido 2-(2-cianotiofen-3-il)acético; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de octilo; ácido 3-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-3-oxopropanoico; (2-clorotiofen-3-il)acetato de 2-(6-bromopiridin-2-il)-2-oxoetilo; ácido 4-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)but-3-inoico; 2-bromopiridina-4-carboxamida; ácido (2E)-3-(6-cloropiridin-2-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(2-cloropiridin-3-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(2-bromopiridin-3-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(2-bromopiridin-4-il)prop-2-enoico; 2-bromo-N-(2-bromopiridin-4-il)piridina-4-carboxamida; (2E)-3-(2-bromopiridin-4-il)-N-(4-hidroxifenil)prop-2-enamida; ácido 3-(2-bromopiridin-4-il)-2-oxopropanoico; 2-(2,6-dibromopiridin-4-il)etan-1-amina; 4-(2-aminoetil)-6-bromopiridina-2-carbonitrilo; ácido 2,2-difluoro-2-(piridin-4-il)acético; ácido 2-[4-(piridin-4-iloxi)fenil]acético; 3-amino-3-(2-bromopiridin-4-il)propanamida; ácido 2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroacético; ácido 3-[(2-bromopiridin-4-il)formamido]-2,2-difluoropropanoico; ácido 2,2-difluoro-2-(pirimidin-2-il)acético; ácido 2-(6-bromopiridin-3-il)-2,2-difluoroacético; 2-(6-bromopirimidin-4-il)etan-1-amina; clorhidrato de ácido 2-[2-amino-3-(4-hidroxifenil)propanamido]-3-fenilpropanoico; ácido 2-(2-fenoxipiridin-4-il)etan-1-amina; (2-bromopiridin-4-il)(oxo)acético; ácido 1-cloroisoquinolina-7-carboxílico; ácido 2-(2,6-dicloropiridin-4-il)-2,2-difluoroacético; 2-(2-bromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacetato de metilo; ácido (2,6-dibromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacético; 2-(2,6-dibromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacetamida; 6-bromopiridina-2-carboximidamida clorhidrato; 2-(6-bromopiridin-2-il)acetato de etilo; N-[(6-bromopiridin-2-il)metil]guanidina; clorhidrato de N-(6-bromopiridin-2-il)guanidina; ácido (2E)-3-(6-bromopiridin-3-il)-2,3-difluoroprop-2-enoico; 2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroacetato de etilo; 2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroetan-1-ol; [2-(6-bromopiridin-2-il)etil]trimetilazanio; 2-bromo-6-fenoxipiridina; (6-bromopiridin-2-il)(difluoro)acetato de

bencilo; 2-amino-3-(6-bromopiridin-2-il)propan-1-ol; clorhidrato de 2-(6-bromopiridin-2-il)etanimidamida; 3-(2-bromopiridin-4-il)propan-1-amina; 2-bromo-6-[difluoro(fenil)metil]piridina; ácido 2,2-difluoro-2-[6-(trifluorometil)piridin-2-il]acético; ácido 2,2-difluoro-2-[4-(trifluorometil)pirimidin-2-il]acético; ácido 2-(6-cloropirazin-2-il)-2,2-difluoroacético; ácido 2,2-difluoro-2-[6-(trifluorometil)pirazin-2-il]acético; ácido 2-[6-(4-cloro-2-fluorofenil)piridin-2-il]-2,2-difluoroacético; 2-(6-bromopiridin-2-il)etan-1-amina; ácido 2-[6-(2,5-diclorotiofen-3-il)piridin-2-il]-2,2-difluoroacético; ácido 2,2-difluoro-2-{6-[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]piridin-2-il}acético; ácido 2,2-difluoro-2-{6-[2-fluoro-4-(trifluorometil)fenil]piridin-2-il}acético; ácido difluoro(3,5,6-trifluoropiridin-2-il)acético; ácido 2-fluoro-2-(3,5,6-trifluoropiridin-2-il)acético; ácido 2-[6-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)piridin-2-il]-2,2-difluoroacético; ácido (6-bromo-5-fluoropiridin-2-il)(difluoro)acético; ácido difluoro(6-fluoropiridin-2-il)acético; ácido difluoro[6-(metilideneamino)piridin-2-il]acético; ácido (6-cloropiridin-2-il)(difluoro)acético; ácido (6-bromo-5-fluoropiridin-2-il)(difluoro)acético; (2-bromo-6-cianopiridin-3-il)acetato de octilo; (6-bromo-2-cianopiridin-3-il)acetato de octilo; y al menos un portador aceptable.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona un método para controlar el crecimiento vegetal no deseado que comprende aplicar al lugar del crecimiento no deseado un compuesto o una de sus sales seleccionado entre: 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etan-1-amina; ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-hidroxipropanoico; ácido 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acético; 1-(2,5-diclorotiofen-3-il)metanamina; 2-(tiofen-3-il)etan-1-amina; 2-(tiofen-3-il)etan-1-ol; 2-amino-1-(tiofen-3-il)etan-1-ol; 2-(tiofen-3-il)acetamida; 2-(1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina; 2-(1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina; 3-(tiofen-3-il)propan-1-amina; ácido 2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-carboxílico; ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butanoico; 3-[5-(clorometil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2-acetamido-3,3-difluoropropanoato de etilo; clorhidrato[HCl] de ácido 2-amino-3-(1H-indazol-3-il)propanoico; ácido (2-bromopiridin-4-il)acético; ácido 3-(2-bromopiridin-4-il)-2-hidroxipropanoico; 2-(2-bromopiridin-4-il)etan-1-amina; 4-(2-aminoetil)fenol; bis[(2-bromopiridin-4-il)metil]amina; 2-(piridin-3-il)acetamida; ácido 2-(2,6-dibromopiridin-4-il)acético; 2-bromo-4-(2-bromoetil)piridina; ácido naftaleno-2-carboxílico; ácido 2-bromopiridina-4-carboxílico; ácido (2E)-3-(2,6-dicloropiridin-3-il)prop-2-enoico; 2-amino-N-(2-bromopiridin-4-il)etano-1-sulfonamida; 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butanamida; 2-(tiofen-3-il)etano-1-tiol; (2-aminoetil)[(2,5-

diclorotiofen-3-il)metil]amina; 2-{[2-(tiofen-3-il)etil]sulfanil}etan-1-amina; 3-(tiofen-3-il)propano-1,2-diol; ácido 3-[(2,5-diclorotiofen-3-il)formamido]-2,2-difluoropropanoico; ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)propanoico; ácido (2E)-3-(5-clorotiofen-2-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(1,3-tiazol-5-il)prop-2-enoico; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetamida; [(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]hidracina; ácido 3-{[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino}-2,2-difluoropropanoico; ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxopropanoico; cloruro de 2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-carbonilo; 2-bromo-N-[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]piridina-4-carboxamida; ácido 2-{[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino}acético; dicloro-1,3-tiazol-4-carboxamida; N-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)acetamida; ácido (3E)-4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxobut-3-enoico; ácido (2E)-3-(3-cloro-1H-1,2,4-triazol-5-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(2,4-dicloro-1,3-tiazol-5-il)prop-2-enoico; ácido 2-(2-clorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacético; ácido 3-{[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino}-2,2-difluoropropanoico; ácido 2-(5-clorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacético; ácido 3-{4-[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]piperazin-1-il}propanoico; tricloro-1,3-tiazol; ácido 3-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propanoico; N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]acetamida; ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-dimetilbutanoico; ácido 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxoacético; ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-4,4-difluorobutanoico; diclorhidrato [HCl] de ácido 2-amino-3-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propanoico; N-propil-3-(4H-1,2,4-triazol-3-il)propanamida; 3-(4H-1,2,4-triazol-3-il)propanoato de propilo; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacetamida; ácido 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)acético; 3-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-N-propilpropanamida; 3-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)propanoato de etilo; ácido (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acético; 2-(3-bromo-1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de etilo; ácido [2-(2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetamido]acético; ácido 2-oxo-2-(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acético; 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N-etilpropanamida; ácido 3-[(2,5-dibromotiofeno-3-sulfonil)amino]propanoico; N-(2-aminoetil)-2,5-dibromotiofeno-3-sulfonamida; 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)propanoato de etilo; N-[2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]acetamida; ácido 2,2-difluoro-2-(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acético; oxo(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acetato de metilo; 1-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)metanamina; ácido 2,2-difluoro-2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-1,3-benzodiazol-5-il)acético; (2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de etilo; 2-cloro-2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de metilo; 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butan-1-amina; ácido 2-amino-2-(2,5-

diclorotiofen-3-il)acético; propil[2-(1H-1,2,4-triazol-3-il)etil]amina; 2-(2-bromo-5-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo; 2-bromo-2-(2-bromo-5-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo; 2-(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de sodio; ácido 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; (2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de etilo; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de bencilo; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N-metoxietan-1-amina; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N,N,N-trimetiletan-1-amonio; 2-(5-bromo-2-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo; clorhidrato de ácido 2-amino-4,5,6,7-tetrahidro-1,3-benzotiazol-4-carboxílico; 5-(2,5-diclorotiofen-3-il)imidazolidina-2,4-diona; 2-cloro-4-fenil-1,3-tiazol; ácido 2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; ácido 2,2-difluoro-2-[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]acético; 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-N,N,N-trimetiletan-1-amonio; 2-cloro-4-(fenoximetil)-1,3-tiazol; ácido 2-cloro[1,3]tiazol[5,4-b]piridina-6-carboxílico; 4-bencil-2-cloro-1,3-tiazol; 3-([2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]amino}metil)fenol; ácido 2,2-difluoro-2-(1H-1,2,3,4-tetrazol-5-il)acético; dibencil[(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)metil]amina; ácido dicloro-1,3-tiazol-4-sulfínico; 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etan-1-amina; ácido 2,5-diclorotiofeno-3-carboxílico; ácido (tiofen-3-il)acético; bencil[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amina; ácido (tiofen-3-il)propanodioico; N-[2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]-2-(3-hidroxifenil)acetamida; 4-[difluoro(fenil)metil]-1,3-tiazol-2-amina; 4-[difluoro(fenil)metil]-1H-imidazol; 2-cloro-4-[difluoro(fenil)metil]-1,3-tiazol; ácido 2,2-difluoro[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-5-il]acético; 2,2-difluoro-2-[5-(trifluorometil)tiofen-2-il]acetato de etilo; 2-cloro-4-(2-hidraziniletil)-1,3-tiazol; difluoro(tiofen-3-il)acetato de etilo; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetohidrazida; [2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]hidracina; difluoro[5-(trifluorometil)tiofen-3-il]acetato de etilo; N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-2-fenilacetamida; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de bencilo; ácido 2,2-difluoro-2-[5-(trifluorometil)-1,3-tiazol-2-il]acético; [2-(5-clorotiofen-3-il)etil]hidracina; ácido [(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)metil]fosfónico; 1-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-3-fenilpropan-2-ona; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-N'-metilacetohidrazida; ácido 2-[2-(5-cloro-3-fluoropiridin-2-il)-1,3-tiazol-4-il]acético; ácido 2,2-difluoro-2-[5-metil-2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]acético; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroetan-1-ol; N'-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-N-(3-hidroxipropil)guanidina; 2-carbamimidamido-N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]acetamida; N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-N'-(2-hidroxipropil)guanidina; ácido difluoro[2-(trifluorometil)tiofen-3-il]acético; 2-(2-amino-5-

cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo; ácido 2-(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; 2-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-1,4,5,6-tetrahidropirimidin-5-ol; 2-(2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amino}-4,5-dihidro-1H-imidazol-1-il)etan-1-ol; 2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil](4,5-dihidro-1H-imidazol-2-il)amino}etan-1-ol; ácido 2-[2-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,3-tiazol-4-il]-2,2-difluoroacético; (2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de (4-bromofenil)metilo; ácido 2,2-difluoro-2-{2-[3-fluoro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]-1,3-tiazol-4-il}acético; ácido [(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)metil]fosfónico; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(4-metilfenil)-2-oxoetilo; ácido 4-amino-5-(2-clorotiofen-3-il)pentanoico; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-oxo-2-(piridin-2-il)etilo; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-oxo-2-feniletilo; 2-(2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amino}-4,5-dihidro-1H-imidazol-1-il)etan-1-ol; 3-acetil-1-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]piperidin-4-ona; ácido [2,5-bis(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il](difluoro)acético; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de 2-[2-(benciloxi)etoxi]etilo; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(2-metoxietoxi)etilo; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de (2-bromofenil)metilo; ácido 2-(1,2,3-tiadiazol-4-il)acético; ácido [2-(2,4-dimetilbenceno-1-sulfonil)-1,3-tiazol-4-il](difluoro)acético; ácido 5H,6H-tieno[3,2-d][1,2,3]tiadiazol-5-carboxílico; ácido (2-cloro-5-fluoro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acético; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetato de {2-[(6-amino-9H-purin-9-il)metoxi]etoxi}metilo; ácido (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(ciano)acético; ácido (2-cloro-5-fluoro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acético; ácido (6-cianopiridin-2-il)(difluoro)acético; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacetato de (6-bromopiridin-2-il)metilo; (2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de (6-bromopiridin-2-il)metilo; ácido difluoro[4-(trifluorometil)tiofen-3-il]acético; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de (4-bromofenil)metilo; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(2-metoxietoxi)etilo; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de (2-bromofenil)metilo; ácido 2-(3-cloro-1,2-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de 2,5,8,11,14-pentaoxahexadecan-16-ilo; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo; ácido 2-(2-cloro-1,3-benzotiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; ácido 2-[5-cloro-2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]-2,2-difluoroacético; ácido 2-[2-cloro-5-(2-feniletinil)-1,3-tiazol-4-il]-2,2-difluoroacético; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetato de 2-(4-metilfenil)-2-oxoetilo; ácido 2-(2-cianotiofen-3-il)acético; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de octilo; ácido 3-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-3-oxopropanoico; (2-clorotiofen-3-il)acetato de 2-(6-

bromopiridin-2-il)-2-oxoetilo; ácido 4-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)but-3-inoico; 2-bromopiridina-4-carboxamida; ácido (2E)-3-(6-cloropiridin-2-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(2-cloropiridin-3-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(2-bromopiridin-3-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(2-bromopiridin-4-il)prop-2-enoico; 2-bromo-N-(2-bromopiridin-4-il)piridina-4-carboxamida; (2E)-3-(2-bromopiridin-4-il)-N-(4-hidroxifenil)prop-2-enamida; ácido 3-(2-bromopiridin-4-il)-2-oxopropanoico; 2-(2,6-dibromopiridin-4-il)etan-1-amina; 4-(2-aminoetil)-6-bromopiridina-2-carbonitrilo; ácido 2,2-difluoro-2-(piridin-4-il)acético; ácido 2-[4-(piridin-4-iloxi)fenil]acético; 3-amino-3-(2-bromopiridin-4-il)propanamida; ácido 2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroacético; ácido 3-[(2-bromopiridin-4-il)formamido]-2,2-difluoropropanoico; ácido 2,2-difluoro-2-(pirimidin-2-il)acético; ácido 2-(6-bromopiridin-3-il)-2,2-difluoroacético; 2-(6-bromopiridin-4-il)etan-1-amina; clorhidrato de ácido 2-[2-amino-3-(4-hidroxifenil)propanamido]-3-fenilpropanoico; 2-(2-fenoxipiridin-4-il)etan-1-amina; ácido (2-bromopiridin-4-il)(oxo)acético; ácido 1-cloroisoquinolina-7-carboxílico; ácido 2-(2,6-dicloropiridin-4-il)-2,2-difluoroacético; 2-(2-bromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacetato de metilo; ácido (2,6-dibromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacético; 2-(2,6-dibromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacetamida; clorhidrato de 6-bromopiridina-2-carboximidamida; 2-(6-bromopiridin-2-il)acetato de etilo; N-[(6-bromopiridin-2-il)metil]guanidina; clorhidrato de N-(6-bromopiridin-2-il)guanidina; ácido (2E)-3-(6-bromopiridin-3-il)-2,3-difluoroprop-2-enoico; 2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroacetato de etilo; 2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroetan-1-ol; [2-(6-bromopiridin-2-il)etil]trimetilazano; 2-bromo-6-fenoxipiridina; (6-bromopiridin-2-il)(difluoro)acetato de bencilo; 2-amino-3-(6-bromopiridin-2-il)propan-1-ol; clorhidrato de 2-(6-bromopiridin-2-il)etanimidamida; 3-(2-bromopiridin-4-il)propan-1-amina; 2-bromo-6-[difluoro(fenil)metil]piridina; ácido 2,2-difluoro-2-[6-(trifluorometil)piridin-2-il]acético; ácido 2,2-difluoro-2-[4-(trifluorometil)pirimidin-2-il]acético; ácido 2-(6-cloropirazin-2-il)-2,2-difluoroacético; ácido 2,2-difluoro-2-[6-(trifluorometil)pirazin-2-il]acético; ácido 2-[6-(4-cloro-2-fluorofenil)piridin-2-il]-2,2-difluoroacético; 2-(6-bromopiridin-2-il)etan-1-amina; ácido 2-[6-(2,5-diclorotiofen-3-il)piridin-2-il]-2,2-difluoroacético; ácido 2,2-difluoro-2-{6-[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]piridin-2-il}acético; ácido 2,2-difluoro-2-{6-[2-fluoro-4-(trifluorometil)fenil]piridin-2-il}acético; ácido difluoro(3,5,6-trifluoropiridin-2-il)acético; ácido 2-fluoro-2-(3,5,6-trifluoropiridin-2-il)acético; ácido 2-[6-

(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)piridin-2-il]-2,2-difluoroacético; ácido (6-bromo-5-fluoropiridin-2-il)(difluoro)acético; ácido difluoro(6-fluoropiridin-2-il)acético; ácido difluoro[6-(metilidaneamino)piridin-2-il]acético; ácido (6-cloropiridin-2-il)(difluoro)acético; ácido (6-bromo-5-fluoropiridin-2-il)(difluoro)acético; (2-bromo-6-cianopiridin-3-il)acetato de octilo; (6-bromo-2-cianopiridin-3-il)acetato de octilo; y al menos un portador aceptable.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona un método para controlar el crecimiento vegetal indeseado que comprende aplicar al lugar del crecimiento indeseado un compuesto de composición agrícola o una de sus sales seleccionado de: 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etan-1-amina; ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-hidroxipropanoico; ácido 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acético; 1-(2,5-diclorotiofen-3-il)metanamina; 2-(tiofen-3-il)etan-1-amina; 2-(tiofen-3-il)etan-1-ol; 2-amino-1-(tiofen-3-il)etan-1-ol; 2-(tiofen-3-il)acetamida; 2-(1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina; 2-(1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina; 3-(tiofen-3-il)propan-1-amina; ácido 2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-carboxílico; ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butanoico; 3-[5-(clorometil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2-acetamido-3,3-difluoropropanoato de etilo; clorhidrato[HCl] de ácido 2-amino-3-(1H-indazol-3-il)propanoico; ácido (2-bromopiridin-4-il)acético; ácido 3-(2-bromopiridin-4-il)-2-hidroxipropanoico; 2-(2-bromopiridin-4-il)etan-1-amina; 4-(2-aminoetil)fenol; bis[(2-bromopiridin-4-il)metil]amina; 2-(piridin-3-il)acetamida; ácido 2-(2,6-dibromopiridin-4-il)acético; 2-bromo-4-(2-bromoetil)piridina; ácido naftaleno-2-carboxílico; ácido 2-bromopiridina-4-carboxílico; ácido (2E)-3-(2,6-dicloropiridin-3-il)prop-2-enoico; 2-amino-N-(2-bromopiridin-4-il)etano-1-sulfonamida; 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butanamida; 2-(tiofen-3-il)etano-1-tiol; (2-aminoetil)[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amina; 2-{[2-(tiofen-3-il)etil]sulfanil}etan-1-amina; 3-(tiofen-3-il)propano-1,2-diol; ácido 3-[(2,5-diclorotiofen-3-il)formamido]-2,2-difluoropropanoico; ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)propanoico; ácido (2E)-3-(5-clorotiofen-2-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(1,3-tiazol-5-il)prop-2-enoico; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetamida; [(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]hidracina; ácido 3-{[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino}-2,2-difluoropropanoico; ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxopropanoico; cloruro de 2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-carbonilo; 2-bromo-N-[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]piridina-4-carboxamida; ácido 2-{[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino}acético; dicloro-1,3-tiazol-4-carboxamida; N-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)acetamida; ácido (3E)-4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxobut-3-enoico; ácido (2E)-3-(3-cloro-1H-1,2,4-triazol-5-

il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(2,4-dicloro-1,3-tiazol-5-il)prop-2-enoico; ácido 2-(2-clorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacético; ácido 3-[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino}-2,2-difluoropropanoico; ácido 2-(5-clorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacético; ácido 3-{4-[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]piperazin-1-il}propanoico; tricloro-1,3-tiazol; ácido 3-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propanoico; N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]acetamida; ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-dimetilbutanoico; ácido 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxoacético; ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-4,4-difluorobutanoico; diclorhidrato[HCl] de ácido 2-amino-3-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propanoico; N-propil-3-(4H-1,2,4-triazol-3-il)propanamida; 3-(4H-1,2,4-triazol-3-il)propanoato de propilo; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacetamida; ácido 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)acético; 3-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-N-propilpropanamida; 3-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)propanoato de etilo; ácido (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acético; 2-(3-bromo-1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de etilo; ácido [2-(2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetamido]acético; ácido 2-oxo-2-(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acético; 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N-etilpropanamida; ácido 3-[(2,5-dibromotiofeno-3-sulfonil)amino]propanoico; N-(2-aminoetil)-2,5-dibromotiofeno-3-sulfonamida; 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)propanoato de etilo; N-[2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]acetamida; ácido 2,2-difluoro-2-(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acético; oxo(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acetato de metilo; 1-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)metanamina; ácido 2,2-difluoro-2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-1,3-benzodiazol-5-il)acético; 1 (2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de etilo; 2-cloro-2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de metilo; 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butan-1-amina; ácido 2-amino-2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acético; propil[2-(1H-1,2,4-triazol-3-il)etil]amina; 2-(2-bromo-5-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo; 2-bromo-2-(2-bromo-5-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo; 2-(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de sodio; ácido 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; (2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de etilo; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de bencilo; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N-metoxietan-1-amina; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N,N,N-trimetiletan-1-amonio; 2-(5-bromo-2-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo; clorhidrato de ácido 2-amino-4,5,6,7-tetrahidro-1,3-benzotiazol-4-carboxílico; 5-(2,5-diclorotiofen-3-il)imidazolidina-2,4-diona; 2-cloro-4-fenil-1,3-tiazol; ácido 2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; ácido 2,2-difluoro-2-[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]acético; 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-

il)-N,N,N-trimetiletan-1-amonio; 2-cloro-4-(fenoximetil)-1,3-tiazol; ácido 2-cloro[1,3]tiazol[5,4-b]piridina-6-carboxílico; 4-bencil-2-cloro-1,3-tiazol; 3-([2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]amino)metil)fenol; ácido 2,2-difluoro-2-(1H-1,2,3,4-tetrazol-5-il)acético; dibencil[(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)metil]amina; ácido dicloro-1,3-tiazol-4-sulfínico; 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etan-1-amina; ácido 2,5-diclorotiofeno-3-carboxílico; ácido (tiofen-3-il)acético; bencil[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amina; ácido (tiofen-3-il)propanodioico; N-[2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]-2-(3-hidroxifenil)acetamida; 4-[difluoro(fenil)metil]-1,3-tiazol-2-amina; 4-[difluoro(fenil)metil]-1H-imidazol; 2-cloro-4-[difluoro(fenil)metil]-1,3-tiazol; ácido 2,2-difluoro[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-5-il]acético; 2,2-difluoro-2-[5-(trifluorometil)tiofen-2-il]acetato de etilo; 2-cloro-4-(2-hidraziniletal)-1,3-tiazol; difluoro(tiofen-3-il)acetato de etilo; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetohidrazida; [2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]hidracina; difluoro[5-(trifluorometil)tiofen-3-il]acetato de etilo; N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-2-fenilacetamida; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de bencilo; ácido 2,2-difluoro-2-[5-(trifluorometil)-1,3-tiazol-2-il]acético; [2-(5-clorotiofen-3-il)etil]hidracina; ácido [(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)metil]fosfónico; 1-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-3-fenilpropan-2-ona; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-N'-metilacetohidrazida; ácido 2-[2-(5-cloro-3-fluoropiridin-2-il)-1,3-tiazol-4-il]acético; ácido 2,2-difluoro-2-[5-metil-2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]acético; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroetan-1-ol; N'-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-N-(3-hidroxipropil)guanidina; 2-carbamimidamido-N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]acetamida; N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-N'-(2-hidroxipropil)guanidina; ácido difluoro[2-(trifluorometil)tiofen-3-il]acético; 2-(2-amino-5-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo; ácido 2-(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; 2-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-1,4,5,6-tetrahidropirimidin-5-ol; 2-(2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amino}-4,5-dihidro-1H-imidazol-1-il)etan-1-ol; 2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil](4,5-dihidro-1H-imidazol-2-il)amino}etan-1-ol; ácido 2-[2-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,3-tiazol-4-il]-2,2-difluoroacético; (2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de (4-bromofenil)metilo; ácido 2,2-difluoro-2-{2-[3-fluoro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]-1,3-tiazol-4-il}acético; ácido [(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)metil]fosfónico; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(4-metilfenil)-2-oxoetilo; ácido 4-amino-5-(2-clorotiofen-3-il)pentanoico; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-oxo-2-(piridin-2-il)etilo; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-oxo-2-feniletalo; 2-(2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-

il)etil]amino}-4,5-dihidro-1H-imidazol-1-il)etan-1-ol; 3-acetil-1-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]piperidin-4-ona; ácido [2,5-bis(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il](difluoro)acético; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de 2-[2-(benciloxi)etoxi]etilo; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(2-metoxietoxi)etilo; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de (2-bromofenil)metilo; ácido 2-(1,2,3-tiadiazol-4-il)acético; ácido [2-(2,4-dimetilbenceno-1-sulfonyl)-1,3-tiazol-4-il](difluoro)acético; ácido 5H,6H-tieno[3,2-d][1,2,3]tiadiazol-5-carboxílico; ácido (2-cloro-5-fluoro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acético; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetato de {2-[(6-amino-9H-purin-9-il)metoxi]etoxi}metilo; ácido (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(ciano)acético; ácido (2-cloro-5-fluoro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acético; ácido (6-cianopiridin-2-il)(difluoro)acético; 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacetato de (6-bromopiridin-2-il)metilo; (2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de (6-bromopiridin-2-il)metilo; ácido difluoro[4-(trifluorometil)tiofen-3-il]acético; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de (4-bromofenil)metilo; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(2-metoxietoxi)etilo; (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de (2-bromofenil)metilo; ácido 2-(3-cloro-1,2-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de 2,5,8,11,14-pentaoxahexadecan-16-ilo; 2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo; ácido 2-(2-cloro-1,3-benzotiazol-4-il)-2,2-difluoroacético; ácido 2-[5-cloro-2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]-2,2-difluoroacético; ácido 2-[2-cloro-5-(2-feniletinil)-1,3-tiazol-4-il]-2,2-difluoroacético; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetato de 2-(4-metilfenil)-2-oxoetilo; ácido 2-(2-cianotiofen-3-il)acético; (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de octilo; ácido 3-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-3-oxopropanoico; (2-clorotiofen-3-il)acetato de 2-(6-bromopiridin-2-il)-2-oxoetilo; ácido 4-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)but-3-inoico; 2-bromopiridina-4-carboxamida; ácido (2E)-3-(6-cloropiridin-2-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(2-cloropiridin-3-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(2-bromopiridin-3-il)prop-2-enoico; ácido (2E)-3-(2-bromopiridin-4-il)prop-2-enoico; 2-bromo-N-(2-bromopiridin-4-il)piridina-4-carboxamida; (2E)-3-(2-bromopiridin-4-il)-N-(4-hidroxifenil)prop-2-enamida; ácido 3-(2-bromopiridin-4-il)-2-oxopropanoico; 2-(2,6-dibromopiridin-4-il)etan-1-amina; 4-(2-aminoetil)-6-bromopiridina-2-carbonitrilo; ácido 2,2-difluoro-2-(piridin-4-il)acético; ácido 2-[4-(piridin-4-iloxi)fenil]acético; 3-amino-3-(2-bromopiridin-4-il)propanamida; ácido 2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroacético; ácido 3-[(2-bromopiridin-4-il)formamido]-2,2-difluoropropanoico; ácido 2,2-difluoro-2-(pirimidin-2-il)acético; ácido 2-(6-bromopiridin-3-

il)-2,2-difluoroacético; 2-(6-bromopirimidin-4-il)etan-1-amina; clorhidrato de ácido 2-[2-amino-3-(4-hidroxifenil)propanamido]-3-fenilpropanoico; 2-(2-fenoxipiridin-4-il)etan-1-amina; ácido (2-bromopiridin-4-il)(oxo)acético; ácido 1-cloroisoquinolina-7-carboxílico; ácido 2-(2,6-dicloropiridin-4-il)-2,2-difluoroacético; 2-(2-bromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacetato de metilo; ácido (2,6-dibromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacético; 2-(2,6-dibromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacetamida; clorhidrato de 6-bromopiridina-2-carboximidamida; 2-(6-bromopiridin-2-il)acetato de etilo; N-[(6-bromopiridin-2-il)metil]guanidina; clorhidrato de N-(6-bromopiridin-2-il)guanidina; ácido (2E)-3-(6-bromopiridin-3-il)-2,3-difluoroprop-2-enoico; 2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroacetato de etilo; 2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroetan-1-ol; [2-(6-bromopiridin-2-il)etil]trimetilazanio; 2-bromo-6-fenoxipiridina; (6-bromopiridin-2-il)(difluoro)acetato de bencilo; 2-amino-3-(6-bromopiridin-2-il)propan-1-ol; clorhidrato de 2-(6-bromopiridin-2-il)etanimidamida; 3-(2-bromopiridin-4-il)propan-1-amina; 2-bromo-6-[difluoro(fenil)metil]piridina; ácido 2,2-difluoro-2-[6-(trifluorometil)piridin-2-il]acético; ácido 2,2-difluoro-2-[4-(trifluorometil)pirimidin-2-il]acético; ácido 2-(6-cloropirazin-2-il)-2,2-difluoroacético; ácido 2,2-difluoro-2-[6-(trifluorometil)pirazin-2-il]acético; ácido 2-[6-(4-cloro-2-fluorofenil)piridin-2-il]-2,2-difluoroacético; 2-(6-bromopiridin-2-il)etan-1-amina; ácido 2-[6-(2,5-diclorotiofen-3-il)piridin-2-il]-2,2-difluoroacético; ácido 2,2-difluoro-2-{6-[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]piridin-2-il}acético; ácido 2,2-difluoro-2-{6-[2-fluoro-4-(trifluorometil)fenil]piridin-2-il}acético; ácido difluoro(3,5,6-trifluoropiridin-2-il)acético; ácido 2-fluoro-2-(3,5,6-trifluoropiridin-2-il)acético; ácido 2-[6-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)piridin-2-il]-2,2-difluoroacético; ácido (6-bromo-5-fluoropiridin-2-il)(difluoro)acético; ácido difluoro(6-fluoropiridin-2-il)acético; ácido difluoro[6-(metilidaneamino)piridin-2-il]acético; ácido (6-cloropiridin-2-il)(difluoro)acético; ácido (6-bromo-5-fluoropiridin-2-il)(difluoro)acético; (2-bromo-6-cianopiridin-3-il)acetato de octilo; (6-bromo-2-cianopiridin-3-il)acetato de octilo; y al menos un portador aceptable.

Según algunas realizaciones de los métodos y composiciones anteriores, la dosis de aplicación para aplicación preemergente es de 200 g/Ha a 600 g/Ha.

Según algunas realizaciones de los métodos y composiciones anteriores, la dosis de aplicación para aplicación preemergente es de 250 g/Ha a 500 g/Ha.

Según algunas realizaciones de los métodos y composiciones anteriores, la dosis de aplicación para aplicación p-emergente es de 150 g/Ha; 175 g/Ha; 200 g/Ha; 225 g/Ha; 250 g/Ha; 275 g/Ha; 300 g/Ha; 325 g/Ha; 350 g/Ha; 375 g/Ha; 400 g/Ha; 425 g/Ha; 450 g/Ha; 475 g/Ha; 500 g/Ha; 525 g/Ha; 550 g/Ha; 575 g/Ha y 600 g/Ha.

Según algunas realizaciones de los métodos y composiciones anteriores, la dosis de aplicación para aplicación posemergente es de 700 g/Ha a 2200 g/Ha.

Según algunas realizaciones de los métodos y composiciones anteriores, la dosis de aplicación para aplicación preemergente es de 1000 g/Ha a 2000 g/Ha.

Según algunas realizaciones de los métodos y composiciones anteriores, la dosis de aplicación para aplicación preemergente es de 700 g/Ha; 750 g/Ha; 800 g/Ha; 850 g/Ha; 900 g/Ha; 950 g/Ha; 1000 g/Ha; 1050 g/Ha; 1100 g/Ha; 1150 g/Ha; 1200 g/Ha; 1250 g/Ha; 1300 g/Ha; 1350 g/Ha; 1400 g/Ha; 1450 g/Ha; 1500 g/Ha; 1550 g/Ha; 1600 g/Ha; 1650 g/Ha; 1700 g/Ha; 1750 g/Ha; 1800 g/Ha; 1850 g/Ha; 1900 g/Ha; 1950 g/Ha; 2000 g/Ha; 2050 g/Ha; 2100 g/Ha; 2150 g/Ha; y 2200 g/Ha.

Según algunas realizaciones de los métodos y composiciones anteriores, la dosis de aplicación es efectiva para bloquear el crecimiento y/o exterminar la mayoría de las malezas de hoja ancha.

Según algunas realizaciones de los métodos y composiciones anteriores, el lugar de vegetación no deseada es un campo de cultivo. Según algunas realizaciones, el cultivo es un cereal. Según algunas realizaciones, la lista no limitativa de cultivos incluye soja, maíz (*Zea*), trigo (*Triticum*), centeno (*Secale*), cebada (*Hordeum*), avena (*Avena*), arroz (*Oryza*), mijo (*Pennisetum*), sorgo (*Sorgo*), y triticale.

En el contexto de las realizaciones de los métodos y composiciones anteriores, el término “maleza” es intercambiable con el término “mala hierba” y se refiere a plantas que crecen cerca de cultivos y ponen en peligro la prosperidad de los cultivos.

Según algunas realizaciones de los métodos y composiciones anteriores, la lista no limitativa de malezas incluye *Amaranthus tuberculatus*, *Amaranthus palmeri*, *Chenopodium album*,

Chenopodium murale, *Malva nicaeensis*, *Abutilon theophrasti*, *Chrysanthemum coronarium*, *Silybum marianum*, *Bidens*, *Verbesina encelioides*, *Lactuca serriola*, *Erigeron canadensis*, *Erigeron bonariensis*, *Ormenis mixta*, *Xanthium strumarium*, *Heterotheca subaxillaris*, *Sonchus oleraceus*, *Sinapis arvensis*, *Datura innoxia*, *Datura ferox*, *Portulaca oleracea*, *Convolvulus althaeoides*, *Ipomoea hederacea*, *Medicago scutellate*, o cualquier otra maleza que pueda ser erradicada por el compuestos, composiciones y usos de las invenciones.

Según algunas realizaciones de los métodos y composiciones anteriores, la lista no limitativa de malezas incluye especies de malezas nocivas, que han sido designadas por una autoridad (nacional o internacional) como dañinas (o perjudiciales) para cultivos, ecosistemas, animales o humanos. Según algunas realizaciones, la invención proporciona una composición agrícola que comprende un compuesto o una de sus sales seleccionado entre los compuestos enumerados en la Tabla 1 y al menos un portador aceptable.

Según algunas realizaciones, la invención proporciona un método para controlar la vegetación no deseada que comprende aplicar en el lugar de dicha vegetación una cantidad herbicidamente efectiva de una composición agrícola que comprende un compuesto o una de sus sales seleccionado entre los compuestos enumerados en la Tabla 1 y al menos un portador aceptable.

Ejemplos

En los siguientes ejemplos, si una abreviatura no ha sido definida en los párrafos anteriores tiene el significado generalmente aceptado. Además, todas las temperaturas están en grados Celsius (a menos que se indique lo contrario). Los compuestos se pueden identificar con un número de identificación (ID) de 3 o 4 dígitos (como 548 o 5601), con o sin prefijo (como FP5666). Se usaron los siguientes métodos para preparar los compuestos que se presentan a continuación como se indica

Ejemplo 1: Derivados de aminoácidos heterocíclicos con actividad herbicida

Tabla 1: lista no exclusiva de derivados de aminoácidos heterocíclicos no codificados que ilustran las reivindicaciones:

ID	Nombre químico
584	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etan-1-amina
585	ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-hidroxipropanoico
586	ácido 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acético
587	1-(2,5-diclorotiofen-3-il)metanamina
588	2-(tiofen-3-il)etan-1-amina
589	2-(tiofen-3-il)etan-1-ol
590	2-amino-1-(tiofen-3-il)etan-1-ol
591	2-(tiofen-3-il)acetamida
592	2-(1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina
592	2-(1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina
593	3-(tiofen-3-il)propan-1-amina
596	ácido 2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-carboxílico
597	ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butanoico
598	3-[5-(clorometil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2-acetamido-3,3-difluoropropanoato de etilo
599	clorhidrato [HCl] de ácido 2-amino-3-(1H-indazol-3-il)propanoico

ID	Nombre químico
678	ácido (2-bromopiridin-4-il)acético
680	ácido 3-(2-bromopiridin-4-il)-2-hidroxipropanoico
681	2-(2-bromopiridin-4-il)etan-1-amina
684	4-(2-aminoetil)fenol
686	bis[(2-bromopiridin-4-il)metil]amina
687	2-(piridin-3-il)acetamida
689	ácido 2-(2,6-dibromopiridin-4-il)acético
690	2-bromo-4-(2-bromoetil)piridina
691	ácido naftaleno-2-carboxílico
692	ácido 2-bromopiridina-4-carboxílico
694	ácido (2E)-3-(2,6-dicloropiridin-3-il)prop-2-enoico
695	2-amino-N-(2-bromopiridin-4-il)etano-1-sulfonamida
5600	4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butanamida
5601	2-(tiofen-3-il)etano-1-tiol
5602	(2-aminoetil)[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amina

ID	Nombre químico
5603	2-{[2-(tiofen-3-il)etil]sulfanil}etan-1-amina
5604	3-(tiofen-3-il)propano-1,2-diol
5605	ácido 3-[(2,5-diclorotiofen-3-il)formamido]-2,2-difluoropropanoico
5606	ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)propanoico
5607	ácido (2E)-3-(5-clorotiofen-2-il)prop-2-enoico
5608	ácido (2E)-3-(1,3-tiazol-5-il)prop-2-enoico
5609	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetamida
5610	[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]hidracina
5611	ácido 3-{[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino}-2,2-difluoropropanoico
5612	ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxopropanoico
5613	cloruro de 2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-carbonilo
5614	2-bromo-N-[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]piridina-4-carboxamida
5615	ácido 2-{[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino}acético
5616	dicloro-1,3-tiazol-4-carboxamida
5618	N-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)acetamida

ID	Nombre químico
5620	ácido (3E)-4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxobut-3-enoico
5621	ácido (2E)-3-(3-cloro-1H-1,2,4-triazol-5-il)prop-2-enoico
5622	ácido (2E)-3-(2,4-dicloro-1,3-tiazol-5-il)prop-2-enoico
5623	ácido 2-(2-clorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacético
5624	ácido 3-{[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino}-2,2-difluoropropanoico
5625	ácido 2-(5-clorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacético
5626	ácido 3-{4-[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]piperazin-1-il}propanoico
5627	tricloro-1,3-tiazol
5628	ácido 3-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propanoico
5629	N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]acetamida
5630	ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-dimetilbutanoico
5631	ácido 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxoacético
5632	ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-4,4-difluorobutanoico
5633	diclorhidrato [HCl] de ácido 2-amino-3-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propanoico
5634	N-propil-3-(4H-1,2,4-triazol-3-il)propanamida

ID	Nombre químico
5635	3-(4H-1,2,4-triazol-3-il)propanoato de propilo
5636	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacetamida
5637	ácido 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)acético
5638	3-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-N-propilpropanamida
5639	3-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)propanoato de etilo
5640	ácido (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acético
5642	2-(3-bromo-1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina
5643	(2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de etilo
5644	ácido [2-(2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetamido]acético
5645	ácido 2-oxo-2-(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acético
5646	3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N-etilpropanamida
5647	ácido 3-[(2,5-dibromotiofeno-3-sulfonil)amino]propanoico
5648	N-(2-aminoetil)-2,5-dibromotiofeno-3-sulfonamida
5649	3-(2,5-diclorotiofen-3-il)propanoato de etilo
5650	N-[2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]acetamida

ID	Nombre químico
5651	ácido 2,2-difluoro-2-(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acético
5652	oxo(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acetato de metilo
5653	1-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)metanamina
5654	ácido 2,2-difluoro-2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-1,3-benzodiazol-5-il)acético
5655	(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de etilo
5656	2-cloro-2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de metilo
5657	4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butan-1-amina
5659	ácido 2-amino-2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acético
5660	propil[2-(1H-1,2,4-triazol-3-il)etil]amina
5661	2-(2-bromo-5-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo
5662	2-bromo-2-(2-bromo-5-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo
5663	2-(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo
5666	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de sodio
5667	ácido 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético,
5668	(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de etilo

ID	Nombre químico
5669	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de bencilo
5670	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N-metoxietan-1-amina
5671	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N,N,N-trimetiletan-1-amonio
5672	2-(5-bromo-2-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo
5673	clorhidrato de ácido 2-amino-4,5,6,7-tetrahidro-1,3-benzotiazol-4- carboxílico
5674	5-(2,5-diclorotiofen-3-il)imidazolidina-2,4-diona
5676	2-cloro-4-fenil-1,3-tiazol
5678	ácido 2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético
5679	ácido 2,2-difluoro-2-[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]acético
5680	2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-N,N,N-trimetiletan-1-amonio
5681	2-cloro-4-(fenoximetil)-1,3-tiazol
5683	ácido 2-cloro[1,3]tiazol[5,4-b]piridina-6-carboxílico
5685	4-bencil-2-cloro-1,3-tiazol
5687	3-({[2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]amino}metil)fenol
5688	ácido 2,2-difluoro-2-(1H-1,2,3,4-tetrazol-5-il)acético

ID	Nombre químico
5689	dibencil[(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)metil]amina
5690	ácido dicloro-1,3-tiazol-4-sulfinico
5691	2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etan-1-amina
5692	ácido 2,5-diclorotiofeno-3-carboxílico
5693	ácido (tiofen-3-il)acético
5694	bencil[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amina
5695	ácido (tiofen-3-il)propanodioico
5696	N-[2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]-2-(3-hidroxifenil)acetamida
5697	4-[difluoro(fenil)metil]-1,3-tiazol-2-amina
5698	4-[difluoro(fenil)metil]-1H-imidazol
5699	2-cloro-4-[difluoro(fenil)metil]-1,3-tiazol
5700	ácido 2,2-difluoro[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-5-il]acético
5701	2,2-difluoro-2-[5-(trifluorometil)tiofen-2-il]acetato de etilo
5702	2-cloro-4-(2-hidraziniletal)-1,3-tiazol
5703	difluoro(tiofen-3-il)acetato de etilo

ID	Nombre químico
5704	2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetohidrazida
5705	[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]hidracina
5707	difluoro[5-(trifluorometil)tiofen-3-il]acetato de etilo
5708	N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-2-fenilacetamida
5709	1 (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de bencilo
5710	ácido 2,2-difluoro-2-[5-(trifluorometil)-1,3-tiazol-2-il]acético
5711	[2-(5-clorotiofen-3-il)etil]hidracina
5713	ácido [(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)metil]fosfónico
5714	1-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-3-fenilpropan-2-ona
5715	2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-N'-metilacetohidrazida
5716	ácido 2-[2-(5-cloro-3-fluoropiridin-2-il)-1,3-tiazol-4-il]acético
5717	ácido 2,2-difluoro-2-[5-metil-2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]acético
5724	2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroetan-1-ol
5725	N'-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-N-(3-hidroxipropil)guanidina
5726	2-carbamimidamido-N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]acetamida

ID	Nombre químico
5727	N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-N'-(2-hidroxiopropil)guanidina
5728	ácido difluoro[2-(trifluorometil)tiofen-3-il]acético
5729	2-(2-amino-5-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo
5730	ácido 2-(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético
5731	2-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-1,4,5,6- tetrahidropirimidin-5-ol
5732	2-(2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amino}-4,5-dihidro-1H-imidazol-1-il)etan-1-ol
5733	2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil](4,5-dihidro-1H-imidazol-2-il)amino}etan-1-ol
5734	ácido 2-[2-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,3-tiazol-4-il]-2,2-difluoroacético
5735	(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de (4-bromofenil)metilo
5736	ácido 2,2-difluoro-2-{2-[3-fluoro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]-1,3-tiazol-4-il}acético
5737	ácido [(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)metil]fosfónico
5738	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(4-metilfenil)-2-oxoetilo
5739	ácido 4-amino-5-(2-clorotiofen-3-il)pentanoico
5740	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-oxo-2-(piridin-2-il)etilo

ID	Nombre químico
5741	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-oxo-2-feniletilo
5742	2-(2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amino}-4,5-dihidro-1H-imidazol-1-il)etan-1-ol
5743	3-acetil-1-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]piperidin-4-ona
5744	ácido [2,5-bis(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il](difluoro)acético
5745	2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de 2-[2-(benciloxi)etoxi]etilo
5746	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(2-metoxietoxi)etilo
5747	(2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de (2-bromofenil)metilo
5748	ácido 2-(1,2,3-tiadiazol-4-il)acético
5749	ácido [2-(2,4-dimetilbenceno-1-sulfonil)-1,3-tiazol-4-il](difluoro)acético
5750	ácido 5H,6H-tieno[3,2-d][1,2,3]tiadiazol-5-carboxílico
5751	ácido (2-cloro-5-fluoro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acético
5752	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetato de {2-[(6-amino-9H-purin-9-il)metoxi]etoxi}metilo
5753	ácido (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(ciano)acético
5754	ácido (2-cloro-5-fluoro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acético

ID	Nombre químico
5755	ácido (6-cianopiridin-2-il)(difluoro)acético
5757	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacetato de (6-bromopiridin-2-il)metilo
5759	(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de (6-bromopiridin-2-il)metilo
5764	ácido difluoro[4-(trifluorometil)tiofen-3-il]acético
5768	(2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de (4-bromofenil)metilo
5771	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(2-metoxietoxi)etilo
5772	(2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato (2-bromofenil)metilo
5773	ácido 2-(3-cloro-1,2-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético
5778	2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de 2,5,8,11,14-pentaoxahexadecan-16-ilo
5784	2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo
5786	ácido 2-(2-cloro-1,3-benzotiazol-4-il)-2,2-difluoroacético
5791	ácido 2-[5-cloro-2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]-2,2-difluoroacético
5792	ácido 2-[2-cloro-5-(2-feniletinil)-1,3-tiazol-4-il]-2,2-difluoroacético
5795	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetato de 2-(4-metilfenil)-2-oxoetilo
5803	ácido 2-(2-cianotiofen-3-il)acético

ID	Nombre químico
5805	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de octilo
5818	ácido 3-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-3-oxopropanoico
5831	(2-clorotiofen-3-il)acetato de 2-(6-bromopiridin-2-il)-2-oxoetilo
5834	ácido 4-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)but-3-inoico
6600	2-bromopiridina-4-carboxamida
6603	ácido (2E)-3-(6-cloropiridin-2-il)prop-2-enoico
6604	ácido (2E)-3-(2-cloropiridin-3-il)prop-2-enoico
6605	ácido (2E)-3-(2-bromopiridin-3-il)prop-2-enoico
6606	ácido (2E)-3-(2-bromopiridin-4-il)prop-2-enoico
6607	2-bromo-N-(2-bromopiridin-4-il)piridina-4-carboxamida
6610	(2E)-3-(2-bromopiridin-4-il)-N-(4-hidroxifenil)prop-2-enamida
6611	ácido 3-(2-bromopiridin-4-il)-2-oxopropanoico
6612	2-(2,6-dibromopiridin-4-il)etan-1-amina
6613	4-(2-aminoetil)-6-bromopiridina-2-carbonitrilo
6614	ácido 2,2-difluoro-2-(piridin-4-il)acético

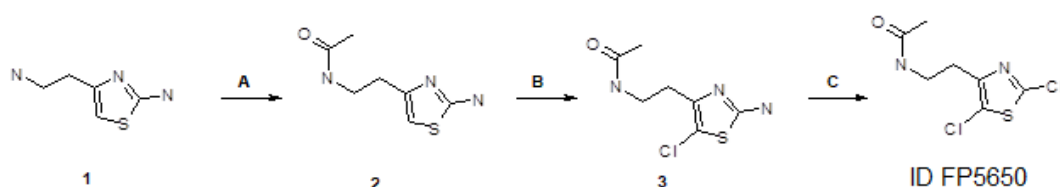
ID	Nombre químico
6615	ácido 2-[4-(piridin-4-iloxi)fenil]acético
6616	3-amino-3-(2-bromopiridin-4-il)propanamida
6617	ácido 2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroacético
6618	ácido 3-[(2-bromopiridin-4-il)formamido]-2,2-difluoropropanoico
6619	ácido 2,2-difluoro-2-(pirimidin-2-il)acético
6620	ácido 2-(6-bromopiridin-3-il)-2,2-difluoroacético
6621	2-(6-bromopirimidin-4-il)etan-1-amina
6622	clorhidrato de ácido 2-[2-amino-3-(4-hidroxifenil)propanamido]-3-fenilpropanoico
6625	2-(2-fenoxipiridin-4-il)etan-1-amina
6626	ácido (2-bromopiridin-4-il)(oxo)acético
6627	ácido 1-cloroisoquinolina-7-carboxílico
6628	ácido 2-(2,6-dicloropiridin-4-il)-2,2-difluoroacético
6629	2-(2-bromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacetato de metilo
6632	ácido (2,6-dibromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacético
6633	2-(2,6-dibromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacetamida

ID	Nombre químico
6634	clorhidrato de 6-bromopiridina-2-carboximidamida
6635	2-(6-bromopiridin-2-il)acetato de etilo
6636	N-[(6-bromopiridin-2-il)metil]guanidina
6637	clorhidrato de N-(6-bromopiridin-2-il)guanidina
6638	ácido (2E)-3-(6-bromopiridin-3-il)-2,3-difluoroprop-2-enoico
6640	2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroacetato de etilo
6643	2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroetan-1-ol
6644	[2-(6-bromopiridin-2-il)etil]trimetilazanio
6645	2-bromo-6-fenoxipiridina
6646	(6-bromopiridin-2-il)(difluoro)acetato de bencilo
6647	2-amino-3-(6-bromopiridin-2-il)propan-1-ol
6648	clorhidrato de 2-(6-bromopiridin-2-il)etanimidamida
6649	3-(2-bromopiridin-4-il)propan-1-amina
6650	2-bromo-6-[difluoro(fenil)metil]piridina
6651	ácido 2,2-difluoro-2-[6-(trifluorometil)piridin-2-il]acético

ID	Nombre químico
6652	ácido 2,2-difluoro-2-[4-(trifluorometil)pirimidin-2-il]acético
6653	ácido 2-(6-cloropirazin-2-il)-2,2-difluoroacético
6654	ácido 2,2-difluoro-2-[6-(trifluorometil)pirazin-2-il]acético
6655	ácido 2-[6-(4-cloro-2-fluorofenil)piridin-2-il]-2,2-difluoroacético
6656	2-(6-bromopiridin-2-il)etan-1-amina
6657	ácido 2-[6-(2,5-diclorotiofen-3-il)piridin-2-il]-2,2-difluoroacético
6658	ácido 2,2-difluoro-2-{6-[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]piridin-2-il} acético
6659	ácido 2,2-difluoro-2-{6-[2-fluoro-4-(trifluorometil)fenil]piridin-2-il} acético
6660	ácido difluoro(3,5,6-trifluoropiridin-2-il)acético
6661	ácido 2-fluoro-2-(3,5,6-trifluoropiridin-2-il)acético
6662	ácido 2-[6-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)piridin-2-il]-2,2-difluoroacético
6663	ácido (6-bromo-5-fluoropiridin-2-il)(difluoro)acético
6664	ácido difluoro(6-fluoropiridin-2-il)acético
6665	ácido difluoro[6-(metilidaneamino)piridin-2-il]acético
6667	ácido (6-cloropiridin-2-il)(difluoro)acético

ID	Nombre químico
6681	ácido (6-bromo-5-fluoropiridin-2-il)(difluoro)acético
6691	(2-bromo-6-cianopiridin-3-il)acetato de octilo
6692	(6-bromo-2-cianopiridin-3-il)acetato de octilo

Ejemplo 2: Síntesis de N-[2-{2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]acetamida



Paso A: Se suspendió dihidrocloruro de 4-(2-aminoetil)tiazol-2-amina (5 g, 23,3 mmol) en DCM y se enfrió hasta 0 °C, seguido de la consiguiente adición gota a gota de TEA (7 g, 70 mmol) y anhídrido acético (2,4 g, 24 mmol). Una vez completada la reacción, la mezcla se evaporó a sequedad y se volvió a evaporar 3 veces con tolueno para dar N-(2-(2-aminotiazol-4-il)etil)acetamida cruda (4,5 g, cruda), la que se usó en el paso siguiente sin purificación.

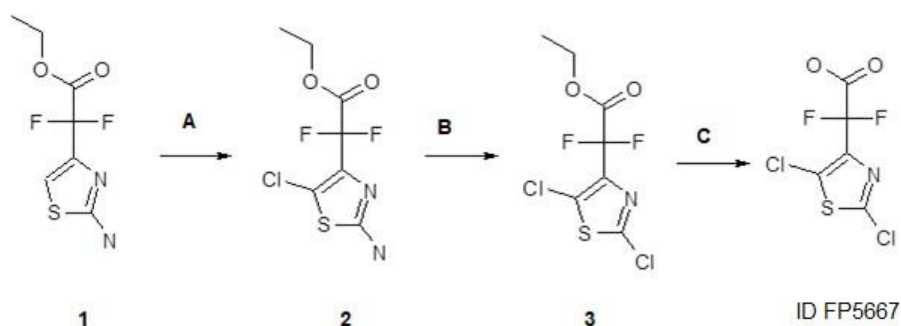
Paso B: Se disolvió N-(2-(2-aminotiazol-4-il)etil)acetamida (4,5 g, 24,2 mmol) en CH₃CN (50 mL), se enfrió hasta 0°C y se añadió NCS (3,33 g, 25 mmol) en una porción. Una vez completada la reacción (concluida por HRMN), el solvente orgánico se evaporó hasta sequedad y la mezcla cruda se repartió entre EtOAc (50 ml) y H₂O (50 ml). La capa orgánica se lavó con H₂O y salmuera, se secó sobre Na₂SO₄ y se evaporó bajo presión reducida para dar N-(2-(2-amino-5-clorotiazol-4-il)etil)acetamida (3,7 g, 17,0 mmol, 70 % de rendimiento) como un aceite amarillo.

Paso C: A la solución preenfriada a 0 °C de N-(2-(2-amino-5-clorotiazol-4-il)etil)acetamida (3,7 g, 17,0 mmol) en CH₃CN (50 mL) se le añadió CuCl₂ anhidro (2,3 g, 17 mmol) en una porción. Después de diez minutos, se añadió nitrito de terc-butilo (1,8 g, 17,5 mmol) gota a gota (la reacción comienza después de la adición de aproximadamente el 10 % del reactivo; el inicio puede identificarse por el comienzo de un desprendimiento vigoroso de gas). Una vez completada la reacción (concluida por HNMR), el volumen de la mezcla de reacción se redujo cuidadosamente hasta la mitad bajo presión reducida; la mezcla cruda resultante se disolvió en EtOAc (100 ml) y se lavó exhaustivamente con HCl acuoso al 5% y salmuera. La capa orgánica se secó sobre Na₂SO₄ y se evaporó a presión reducida para dar el producto crudo, que se purificó por FCC para dar N-(2-(2,5-diclorotiazol-4-il)etil)acetamida (1,22 g, 5,1 mmol, 30 % de rendimiento).

¹H RMN (500 MHz, DMSO-d₆) δ 7,94 (s, 1H); 3,29 (q, J = 6,4 Hz, 2H); 2,76 (t, J = 6,8 Hz, 2H); 1,76 (s, 3H).

LCMS 239 [M+H]⁺. PM 239,12; Punto de fusión 87 °C, Pureza 90%.

Ejemplo 3: Síntesis de ácido 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético (ID FP5667)



Paso A: Se disolvió 2-(2-(2-amino-5-clorotiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo (350 g, 1,58 mol) en CH₃CN (3 L), se enfrió a 0 °C y se añadió NCS (215 g, 1,6 mol) en una porción. Una vez completada la reacción (concluida por HRMN), el solvente orgánico se evaporó hasta sequedad y la mezcla cruda se repartió entre EtOAc (3 L) y H₂O (1 L). La capa orgánica se lavó con H₂O y salmuera, se secó sobre Na₂SO₄ y se evaporó bajo presión reducida para dar

2-(2-amino-5-clorotiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo (283 g, 1,1 mol, 70% de rendimiento) como un sólido amarillo.

Paso B: A la solución preenfriada a 0 °C de 2-(2-amino-5-clorotiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo (283 g, 1,1 mol) en CH₃CN (3 L) se añadió CuCl₂ anhidro (155 g, 1,15 mol) en una porción. Después de diez minutos, se añadió gota a gota nitrito de terc-butilo (121 g, 1,16 mol) (la reacción comienza después de la adición de aproximadamente el 10 % del reactivo; el inicio puede identificarse por el comienzo de un desprendimiento vigoroso de gas). Una vez completada la reacción (concluida por HNMR), el volumen de la mezcla de reacción se redujo cuidadosamente a la mitad bajo presión reducida; la mezcla cruda resultante se disolvió en EtOAc (3 L) y se lavó exhaustivamente con HCl acuoso al 5 % y salmuera. La capa orgánica se secó sobre Na₂SO₄ y se evaporó a presión reducida para dar 2-(2,5-diclorotiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo crudo (210 g, crudo) como un aceite de color marrón oscuro, que se utilizó en el siguiente paso sin purificación.

Paso C: Se disolvió 2-(2,5-diclorotiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo crudo (210 g, crudo) del paso anterior en EtOH (2 L) y se añadió el K₂CO₃ acuoso al 20% (0,5 L) en una porción. Una vez completada la reacción (típicamente 3 h), los solventes se evaporaron hasta sequedad y la mezcla cruda se disolvió en H₂O (0,5 L); la solución clara se lavó con CHCl₃ (3 x 200 mL) y MTBE (100 mL). La capa de agua se acidificó con Na₂SO₄ a pH = 4 y se extrajo con éter dietílico (3 x 150 mL). La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre Na₂SO₄ y se evaporó a presión reducida para dar un producto oleoso. Después de una cromatografía en columna y trituración con pentano, se obtuvo ácido 2-(2,5-diclorotiazol-4-il)-2,2-difluoroacético puro (113 g, 0,46 mol, 27 % de rendimiento en 3 etapas) como un sólido amarillo.

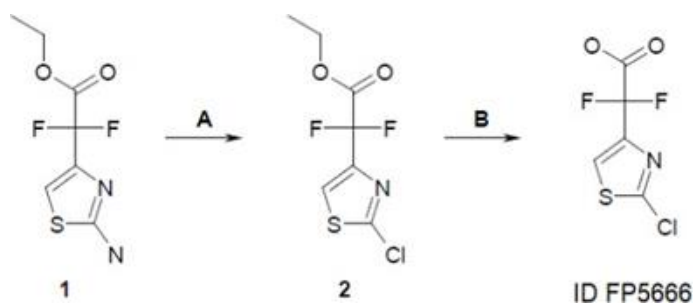
¹H RMN (500 MHz, cdcl₃) δ 10,38 (s, 1H).

¹³C RMN (126 MHz, cdcl₃) δ 165,29 (t, J = 33,4 Hz) ; 149,86 (s); 140,45 (t, J = 29,7 Hz); 129,24 (s) ; 109,64 (t, J = 253,2 Hz).

^{19}F RMN (470 MHz, cdcl_3) δ -102,57 (s).

LCMS 248 $[\text{M}+\text{H}]^+$. Pureza > 95%.

Ejemplo 4: Síntesis de ácido 2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético



Paso A: A la solución preenfriada a 0 °C de 2-(2-aminotiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo (250 g, 1,12 mol) en CH_3CN (3 L) se le añadió CuCl_2 anhidro (155 g, 1,15 mol) en una porción (¡Precaución! ¡Se observa un efecto exotérmico! Calentamiento hasta 10°C). Después de diez minutos, se añadió gota a gota nitrito de terc-butilo (121 g, 1,16 mol) (la reacción comienza después de la adición de aproximadamente el 10 % del reactivo; el inicio puede identificarse por el comienzo de un desprendimiento vigoroso de gas). Una vez completada la reacción (concluida por HNMR), el volumen de la mezcla de reacción se redujo cuidadosamente a la mitad bajo presión reducida; la mezcla cruda resultante se disolvió en EtOAc (3 L) y se lavó exhaustivamente con HCl acuoso al 5 % y salmuera. La capa orgánica se secó sobre Na_2SO_4 y se evaporó a presión reducida para dar 2-(2-clorotiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo crudo (205 g, crudo) que se usó en el paso siguiente sin purificación.

Paso B: El 2-(2-clorotiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo crudo (205 g, crudo) del paso anterior se disolvió en EtOH (1,5 L) y se añadió K_2CO_3 acuoso al 20% (0,5 L) en una porción. Una vez completada la reacción (normalmente 3 h), los solventes se evaporaron hasta sequedad y la mezcla cruda se disolvió en H_2O (500 mL); la solución clara se lavó con CHCl_3 (3 x 200 mL) y MTBE (100 mL). La capa de agua se acidificó con Na_2SO_4 a pH = 4 y se extrajo con éter dietílico (3 x 150 mL). La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se

secó sobre Na₂SO₄ y se evaporó a presión reducida para dar un producto oleoso. Después de una cromatografía en columna y trituración con pentano se obtuvo ácido 2-(2-clorotiazol-4-il)-2,2-difluoroacético puro (108 g, 0,5 mol, 45% de rendimiento en 2 etapas) como un sólido amarillo.

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 11,61 (s, 1H); 7,70 (s, 1H).

¹³C RMN (101 MHz, CDCl₃) δ 165,10 (t, J = 33,6 Hz) ; 154,53 (s); 145,63 (t, J = 30,9 Hz); 122,62 (t, J = 4,7 Hz); 109,40 (t, J = 251,0 Hz).

¹⁹F RMN (376 MHz, CDCl₃) δ-103,92 (s).

LCMS 214 [M+H]⁺. PF 92 °C; Pureza > 95%.

Ejemplo 5: Efecto de los derivados de aminoácidos heterocíclicos sobre la germinación y el desarrollo temprano de las plantas.

Materiales: Se obtuvieron semillas de lechuga Lettuce R. (Super-Jericho, no esterilizadas) de Ben Shahr Moshe Ltd., 99% de pureza. Los compuestos de prueba enumerados en la Tabla 2 a continuación se sintetizaron de *novo* o se compraron a diferentes proveedores.

Bioensayos de papel de filtro con semillas de lechuga: El protocolo que se siguió fue el de Bertin *et al.* 2009 y Movellan *et al.* 2014 con las modificaciones especificadas que se describen a continuación.

Las semillas se colocaron en papel de filtro Whatman no. 1 (Whatman, Middlesex, Reino Unido) en placas de Petri (10 semillas por placa) con 2,0 ml de solución acuosa de un material de prueba a una concentración que varió de 0 (control) a 1 mmol/L y se colocaron en una bandeja inclinada a 45 grados. Las bandejas se mantuvieron en la oscuridad durante 48 horas y luego se transfirieron a la cámara de crecimiento con un ciclo de oscuridad/luz de 6/18 durante 4 días. Cada experimento se realizó al menos con dos repeticiones. Se evaluó visualmente el desarrollo de la radícula y los brotes de las plantas 6 días después del comienzo de la prueba para determinar la Concentración Mínima Efectiva (CME) de un material de prueba. En el contexto de la invención, la CME se define como el nivel de concentración más bajo de un material de prueba que produce una desviación (ausencia de germinación o

malformación de radícula o brotes) con respecto al desarrollo de la planta en el grupo Control. La CME se expresa en una unidad arbitraria como puntuación de actividad, como se presenta en la Tabla 1:

CME	Puntuación de actividad
Superior a 0,1 mM	Débil
0,1 mM	Moderada
0,01 mM	Fuerte
0,001 mM y menos	Muy fuerte

La actividad herbicida de compuestos seleccionados sobre la germinación de las semillas y el desarrollo temprano de las plantas se resume en la Tabla 2:

ID	Nombre químico	CME
584	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etan-1-amina	Fuerte
585	ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-hidroxipropanoico	Fuerte
586	ácido 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acético	Fuerte
587	1-(2,5-diclorotiofen-3-il)metanamina	Fuerte
588	2-(tiofen-3-il)etan-1-amina	Fuerte
589	2-(tiofen-3-il)etan-1-ol	Fuerte
590	2-amino-1-(tiofen-3-il)etan-1-ol	Débil
591	2-(tiofen-3-il)acetamida	Fuerte
592	2-(1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina	Débil
593	3-(tiofen-3-il)propan-1-amina	Débil

ID	Nombre químico	CME
596	ácido 2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-carboxílico	Moderada
597	ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butanoico	Fuerte
598	3-[5-(clorometil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-2- acetamido-3,3-difluoropropanoato de etilo	Fuerte
599	ácido 2-amino-3-(1H-indazol-3-il)propanoico	Fuerte
678	ácido (2-bromopiridin-4-il)acético	Fuerte
680	ácido 3-(2-bromopiridin-4-il)-2-hidroxipropanoico	Débil
681	2-(2-bromopiridin-4-il)etan-1-amina	Débil
684	4-(2-aminoetil)fenol	Débil
686	bis[(2-bromopiridin-4-il)metil]amina	Débil
687	2-(piridin-3-il)acetamida	Débil
689	ácido 2-(2,6-dibromopiridin-4-il)acético	Fuerte
690	2-bromo-4-(2-bromoetil)piridina	Débil
692	ácido 2-bromopiridina-4-carboxílico	Moderada
694	ácido (2E)-3-(2,6-dicloropiridin-3-il)prop-2-enoico	Moderada
695	2-amino-N-(2-bromopiridin-4-il)etano-1-sulfonamida	Débil
699	ácido 1-cloroisoquinolina-6-carboxílico	Débil
5600	4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butanamida	Moderada
5601	2-(tiofen-3-il)etano-1-tiol	Moderada
5602	(2-aminoetil)[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amina	Fuerte
5603	2-{[2-(tiofen-3-il)etil]sulfanil}etan-1-amina	Moderada

ID	Nombre químico	CME
5604	3-(tiofen-3-il)propano-1,2-diol	Fuerte
5605	ácido 3-[(2,5-diclorotiofen-3-il)formamido]-2,2- difluoropropanoico	Moderada
5606	ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)propanoico	Fuerte
5607	ácido (2E)-3-(5-clorotiofen-2-il)prop-2-enoico	Fuerte
5608	ácido (2E)-3-(1,3-tiazol-5-il)prop-2-enoico	Moderada
5609	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetamida	Fuerte
5610	[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]hidracina	Moderada
5611	ácido (2E)-3-(2,5-diclorotiofen-3-il)prop-2-enoico	Moderada
5612	ácido 3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxopropanoico	Fuerte
5613	cloruro de 2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-carbonilo	Moderada
5614	2-bromo-N-[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]piridina-4-carboxamida	Fuerte
5615	ácido 2-[[[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino]acético	Moderada
5616	dicloro-1,3-tiazol-4-carboxamida	Fuerte
5618	N-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)acetamida	Fuerte
5620	ácido (3E)-4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxobut-3-enoico	Moderada
5621	ácido (2E)-3-(3-cloro-1H-1,2,4-triazol-5-il)prop-2-enoico	Moderada
5622	ácido (2E)-3-(2,4-dicloro-1,3-tiazol-5-il)prop-2-enoico	Fuerte
5623	ácido 2-(2-clorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacético	Fuerte
5624	ácido 3-[[[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]amino]-2,2- difluoropropanoico	Moderada
5625	ácido 2-(5-clorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacético	Fuerte
5626	ácido 3-{4-[(2,5-diclorotiofen-3-il)metil]piperazin-1- il}propanoico	Moderada

ID	Nombre químico	CME
5627	tricloro-1,3-tiazol	Débil
5628	ácido 3-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propanoico	Moderada
5629	N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]acetamida	Débil
5630	ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-dimetilbutanoico	Moderada
5631	ácido 2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2-oxoacético	Moderada
5632	ácido 4-(2,5-diclorotiofen-3-il)-4,4-difluorobutanoico	Fuerte
5633	clorhidrato [HCl] de ácido 2-amino-3-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propanoico	Fuerte
5634	N-propil-3-(4H-1,2,4-triazol-3-il)propanamida	Débil
5635	3-(4H-1,2,4-triazol-3-il)propanoato de propilo	Débil
5636	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacetamida	Fuerte
5637	ácido 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)acético	Fuerte
5638	3-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-N-propilpropanamida	Débil
5639	3-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)propanoato de etilo	Moderada
5640	ácido (2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acético	Fuerte
5642	2-(3-bromo-1H-1,2,4-triazol-5-il)etan-1-amina	Débil
5643	(2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de etilo	Fuerte
5644	ácido [2-(2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetamido]acético	Fuerte
5645	ácido 2-oxo-2-(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acético	Fuerte
5646	3-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N-etilpropanamida	Fuerte
5647	ácido 3-[(2,5-dibromotiofeno-3-sulfonil)amino]propanoico	Débil
5648	N-(2-aminoetil)-2,5-dibromotiofeno-3-sulfonamida	Débil

ID	Nombre químico	CME
5649	3-(2,5-diclorotiofen-3-il)propanoato de etilo	Débil
5650	N-[2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]acetamida	Fuerte
5651	ácido 2,2-difluoro-2-(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acético	Moderada
5652	oxo(2,4,5-triclorotiofen-3-il)acetato de metilo	Moderada
5653	1-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)metanamina	Moderada
5654	ácido 2,2-difluoro-2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-1,3-benzodiazol-5-il)acético	Débil
5655	(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de etilo	Fuerte
5656	2-cloro-2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de metilo	Débil
5657	4-(2,5-diclorotiofen-3-il)butan-1-amina	Fuerte
5659	ácido 2-amino-2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acético	Débil
5660	[2-(1H-1,2,4-triazol-3-il)etil]amina de propilo	Débil
5661	2-(2-bromo-5-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo	Fuerte
5662	2-bromo-2-(2-bromo-5-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo	Moderada
5663	2-(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo	Fuerte
5664	2-(2H-1,2,3-triazol-4-il)acetamida	Débil
5665	(2,5-diclorotiofen-3-il)etanimidamida	Débil
5666	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de sodio	Muy Fuerte
5667	ácido 2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético	Muy Fuerte
5668	(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de etilo	Fuerte
5669	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de bencilo	Fuerte
5670	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N-metoxietan-1-amina	Fuerte

ID	Nombre químico	CME
5671	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-N,N,N-trimetiletan-1-amonio	Moderada
5672	2-(5-bromo-2-metil-1,3-tiazol-4-il)acetato de etilo	Moderada
5673	clorhidrato de ácido 2-amino-4,5,6,7-tetrahidro-1,3-benzotiazol-4-carboxílico	Débil
5674	5-(2,5-diclorotiofen-3-il)imidazolidina-2,4-diona	Débil
5676	2-cloro-4-fenil-1,3-tiazol	Débil
5678	ácido 2-(2-amino-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético	Moderada
5679	ácido 2,2-difluoro-2-[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]acético	Muy Fuerte
5680	2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)-N,N,N- trimetiletan-1-amonio	Moderada
5681	2-cloro-4-(fenoximetil)-1,3-tiazol	Débil
5683	ácido 2-cloro[1,3]tiazol[5,4-b]piridina-6-carboxílico	Fuerte
5685	4-bencil-2-cloro-1,3-tiazol	Débil
5687	3-([2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]amino)metilfenol	Moderada
5688	ácido 2,2-difluoro-2-(1H-1,2,3,4-tetrazol-5-il)acético	Débil
5689	dibencil[(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)metil]amina	Moderada
5690	ácido dicloro-1,3-tiazol-4-sulfínico	Moderada
5691	2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etan-1-amina	Fuerte
5692	ácido 2,5-diclorotiofeno-3-carboxílico	Moderada
5693	ácido (tiofen-3-il)acético	Moderada
5694	bencil[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amina	Fuerte
5695	ácido (tiofen-3-il)propanodioico	Moderada

ID	Nombre químico	CME
5696	N-[2-(2,5-dicloro-1,3-tiazol-4-il)etil]-2-(3-hidroxifenil)acetamida	Fuerte
5697	4-[difluoro(fenil)metil]-1,3-tiazol-2-amina	Fuerte
5698	4-[difluoro(fenil)metil]-1H-imidazol	Fuerte
5699	2-cloro-4-[difluoro(fenil)metil]-1,3-tiazol	Fuerte
5700	ácido 2,2-difluoro[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-5-il]acético	Moderada
5701	2,2-difluoro-2-[5-(trifluorometil)tiofen-2-il]acetato de etilo	Débil
5702	2-cloro-4-(2-hidraziniletil)-1,3-tiazol	Fuerte
5703	difluoro(tiofen-3-il)acetato de etilo	Débil
5704	2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetohidrazida	Fuerte
5705	[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]hidracina	Débil
5707	difluoro[5-(trifluorometil)tiofen-3-il]acetato de etilo	Moderada
5708	N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-2-fenilacetamida	Fuerte
5709	(2,5-diclorotiofen-3-il)(difluoro)acetato de bencilo	Muy Fuerte
5710	ácido 2,2-difluoro[5-(trifluorometil)-1,3-tiazol-2-il]acético	Fuerte
5711	[2-(5-clorotiofen-3-il)etil]hidracina	Débil
5713	ácido [(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)metil]fosfónico	Débil
5714	1-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-3-fenilpropan-2-ona	Débil
5715	2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-N'-metilacetohidrazida	Fuerte
5716	ácido 2-[2-(5-cloro-3-fluoropiridin-2-il)-1,3-tiazol-4-il]acético	Fuerte
5717	ácido 2,2-difluoro-2-[5-metil-2-(trifluorometil)-1,3- tiazol-4-il]acético	Fuerte
5724	2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroetan-1-ol	Moderada

ID	Nombre químico	CME
5725	N'-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-N-(3-hidroxipropil)guanidina	Moderada
5726	2-carbamimidamido-N-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]acetamida	Moderada
5727	2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amino}-1,4,5,6-tetrahidropirimidin-5-ol	Moderada
5728	ácido 2,2-difluoro-2-[2-(trifluorometil)tiofen-3-il]acético	Moderada
5729	2-(2-amino-5-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de etilo	Moderada
5730	ácido 2-(2-bromo-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacético	Moderada
5731	2-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]-1,4,5,6- tetrahidropirimidin-5-ol	Moderada
5732	N-{2-[3-(2,5-diclorotiofen-3-il)propoxi]fenil} guanidina	Moderada
5733	2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil](4,5-dihidro- 1H-imidazol-2-il)amino}etan-1-ol	Moderada
5734	ácido 2-[2-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,3-tiazol-4-il]-2,2-difluoroacético	Moderada
5735	(2,5-diclorotiofen-3-il)acetato de (4-bromofenil)metilo	Moderada
5736	ácido 2,2-difluoro-2-{2-[3-fluoro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]-1,3-tiazol-4-il}acético	Moderada
5738	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(4-metilfenil)-2-oxoetilo	Moderada
5739	ácido 4-amino-5-(2-clorotiofen-3-il)pentanoico	Moderada
5740	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-oxo-2-(piridin-2-il)etilo	Moderada
5741	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-oxo-2-feniletilo	Moderada
5742	2-(2-{[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]amino}-4,5-dihidro-1H-imidazol-1-il)etan-1-ol	Moderada
5743	3-acetil-1-[2-(2,5-diclorotiofen-3-il)etil]piperidin-4-ona	Moderada
5744	ácido [2,5-bis(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il](difluoro)acético	Moderada

ID	Nombre químico	CME
5745	2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)-2,2-difluoroacetato de 2-[2-(benciloxi)etoxi]etilo	Fuerte
5746	(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acetato de 2-(2-metoxietoxi)etilo	Fuerte
5747	2-(2,5-diclorotiofen-3-il)-2,2-difluoroacetato de (2-bromofenil)metilo	Fuerte
5748	ácido 2-(1,2,3-tiadiazol-4-il)acético	Fuerte
5749	ácido [2-(2,4-dimetilbenceno-1-sulfonil)-1,3-tiazol-4-il](difluoro)acético	Fuerte
5750	ácido 5H,6H-tieno[3,2-d][1,2,3]tiadiazol-5-carboxílico	Fuerte
5751	ácido (2-cloro-5-fluoro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acético	Fuerte
5752	2-(2-cloro-1,3-tiazol-4-il)acetato de 2-{2-[2-(6-amino-9H-purin-9-il)etoxi]etoxi}etilo	Fuerte
5753	ácido (2-cloro-1,3-tiazol-4-il)(ciano)acético	Fuerte
5754	ácido (2-cloro-5-fluoro-1,3-tiazol-4-il)(difluoro)acético	Fuerte
5755	ácido (6-cianopiridin-2-il)(difluoro)acético	Fuerte
6600	2-bromopiridina-4-carboxamida	Débil
6603	ácido (2E)-3-(6-cloropiridin-2-il)prop-2-enoico	Débil
6604	ácido (2E)-3-(2-cloropiridin-3-il)prop-2-enoico	Fuerte
6605	ácido (2E)-3-(2-bromopiridin-3-il)prop-2-enoico	Fuerte
6606	ácido (2E)-3-(2-bromopiridin-4-il)prop-2-enoico	Débil
6607	2-bromo-N-(2-bromopiridin-4-il)piridina-4-carboxamida	Moderada
6610	(2E)-3-(2-bromopiridin-4-il)-N-(4-hidroxifenil)prop-2-enamida	Débil
6611	ácido 3-(2-bromopiridin-4-il)-2-oxopropanoico	Débil

ID	Nombre químico	CME
6612	2-(2,6-dibromopiridin-4-il)etan-1-amina	Moderada
6613	4-(2-aminoetil)-6-bromopiridina-2-carbonitrilo	Débil
6614	ácido 2,2-difluoro-2-(piridin-4-il)acético	Débil
6615	ácido 2-[4-(piridin-4-iloxi)fenil]acético	Débil
6616	3-amino-3-(2-bromopiridin-4-il)propanamida	Débil
6617	ácido 2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroacético	Fuerte
6618	ácido 3-[(2-bromopiridin-4-il)formamido]-2,2-difluoropropanoico	Moderada
6619	ácido 2,2-difluoro-2-(pirimidin-2-il)acético	Débil
6620	ácido 2-(6-bromopiridin-3-il)-2,2-difluoroacético	Moderada
6621	2-(6-bromopirimidin-4-il)etan-1-amina	Moderada
6622	clorhidrato de ácido 2-[2-amino-3-(4-hidroxifenil)propanamido]-3-fenilpropanoico	Débil
6625	2-(2-fenoxipiridin-4-il)etan-1-amina	Débil
6626	ácido (2-bromopiridin-4-il)(oxo)acético	Moderada
6627	ácido 1-cloroisoquinolina-7-carboxílico	Moderada
6628	ácido 2-(2,6-dicloropiridin-4-il)-2,2-difluoroacético	Débil
6629	2-(2-bromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacetato de metilo	Moderada
6632	ácido (2,6-dibromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacético	Débil
6633	2-(2,6-dibromopiridin-4-il)-2,2-difluoroacetamida	Débil
6634	clorhidrato [HCl] de 6-bromopiridina-2-carboximidamida	Moderada
6635	2-(6-bromopiridin-2-il)acetato de etilo	Fuerte

ID	Nombre químico	CME
6636	N-[(6-bromopiridin-2-il)metil]guanidina	Moderada
6637	clorhidrato de N-(6-bromopiridin-2-il)guanidina	Débil
6638	ácido (2E)-3-(6-bromopiridin-3-il)-2,3-difluoroprop-2-enoico	Débil
6640	2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroacetato de etilo	Fuerte
6643	2-(6-bromopiridin-2-il)-2,2-difluoroetan-1-ol	Moderada
6644	[2-(6-bromopiridin-2-il)etil]trimetilazano	Débil
6645	2-bromo-6-fenoxipiridina	Moderada
6646	(6-bromopiridin-2-il)(difluoro)acetato de bencilo	Muy Fuerte
6647	2-amino-3-(6-bromopiridin-2-il)propan-1-ol	Débil
6648	clorhidrato de 2-(6-bromopiridin-2-il)etanimidamida	Débil
6649	3-(2-bromopiridin-4-il)propan-1-amina	Moderada
6650	2-bromo-6-[difluoro(fenil)metil]piridina	Débil
6651	ácido 2,2-difluoro-2-[6-(trifluorometil)piridin-2-il]acético	Débil
6652	ácido 2,2-difluoro-2-[4-(trifluorometil)pirimidin-2-il]acético	Débil
6653	ácido 2-(6-cloropirazin-2-il)-2,2-difluoroacético	Débil
6654	ácido 2,2-difluoro-2-[6-(trifluorometil)pirazin-2-il]acético	Débil
6655	ácido 2-[6-(4-cloro-2-fluorofenil)piridin-2-il]-2,2-difluoroacético	Débil
6656	2-(6-bromopiridin-2-il)etan-1-amina	Débil
6657	ácido 2-[6-(2,5-diclorotiofen-3-il)piridin-2-il]-2,2- difluoroacético	Débil
6658	ácido 2,2-difluoro-2-{6-[2-(trifluorometil)-1,3-tiazol-4-il]piridin-2-il}acético	Moderada

ID	Nombre químico	CME
6659	ácido 2,2-difluoro-2-{6-[2-fluoro-4-(trifluorometil)fenil]piridin-2-il}acético	Moderada
6660	ácido 2,2-difluoro-2-(3,5,6-trifluoropiridin-2-il)acético	Fuerte
6661	ácido 2-fluoro-2-(3,5,6-trifluoropiridin-2-il)acético	Fuerte
6662	ácido difluoro(3,5,6-trifluoropiridin-2-il)acético	Fuerte
6663	ácido (6-bromo-5-fluoropiridin-2-il)(difluoro)acético	Fuerte
6664	ácido difluoro(6-fluoropiridin-2-il)acético	Fuerte
6665	ácido difluoro[6-(metilidaneamino)piridin-2-il]acético	Fuerte

Ejemplo 6: Actividad herbicida posemergencia de derivados de aminoácidos no codificados (DNAA) seleccionados

Las pruebas se realizaron en plantas de lechuga romana (*Lactuca sativa L.*) en la etapa de 2 a 3 hojas. Las plantas se cultivaron en minimaceteros llenos de tierra, de dimensiones 2 X 2 X 5 cm, una planta por minimacetero. Los compuestos de prueba se disolvieron en una solución acuosa al 0,1 % de adyuvante Silwet hasta concentraciones finales que oscilaban entre 0 (control) y 0,01 %. Los compuestos de prueba se aplicaron al suelo (1 ml por macetero) o foliarmente con aerógrafo (0,1 ml por macetero). Cada concentración se probó en 20 plantas. Dos semanas después del tratamiento, se evaluaron visualmente los efectos herbicidas del material de prueba respectivo (parte aérea y raíces). Luego, la parte aérea de las plantas se cortó cuidadosamente y se pesó (peso húmedo) para evaluar la inhibición del crecimiento causada por el compuesto de prueba. La inhibición del crecimiento (GI, por sus siglas en inglés) se calculó de la siguiente manera:

$$GI = 1 - Mt * 100\% / Mc$$

Donde Mt y Mc son la mediana del peso húmedo de las plantas tratadas y de control, respectivamente. En el contexto de la invención, el efecto herbicida se evaluó por la

inhibición del crecimiento o el daño a la planta causado por el compuesto de prueba (0,01 y 0,05 mg de ingrediente activo/pocillo). El efecto herbicida se evaluó a los 14-21 días después de la aplicación utilizando la siguiente Puntuación de Daño: 0 = menos del 10% de inhibición del crecimiento; 1 = 10%-30% de inhibición del crecimiento, síntomas de daños menores; 2 = 30%-50% de inhibición del crecimiento, síntomas claros de daño; 3 = 50%-70% de inhibición del crecimiento, síntomas de daño significativos; 4 = 70%-90%, síntomas de daño severo; 5 = 90%-100% de inhibición del crecimiento/letalidad total. La actividad herbicida de los DHAA seleccionados se resume en la Tabla 3 (aplicación al suelo) y la Tabla 4 (aplicación foliar).

Tabla 3: Actividad herbicida de DNAA seleccionados (aplicación al suelo):

ID	Actividad herbicida	ID	Actividad herbicida
584	2	5724	4
585	1	5728	5
586	3	5730	5
597	2	5738	5
678	2	5745	5
689	2	5747	3
692	2	5757	5
5600	3	5759	5
5609	3	5764	2
5616	1	5768	3
5623	4	5771	5
5625	4	5772	5
5629	3	5773	3
5636	2	5778	5
5637	4	5781	5
5640	5	5791	5
5644	2	5792	3
5650	3	5805	5
5655	5	5818	2
5657	2	5831	2
5663	2	5834	2

ID	Actividad herbicida	ID	Actividad herbicida
5666	5	6600	2
5667	4	6606	2
5669	3	6612	2
5670	2	6617	4
5672	1	6635	2
5679	4	6640	3
5691	2	6643	4
5707	2	6646	2
5709	2	6651	3
5710	3	6667	4
5717	2		

Tabla 5. Actividad herbicida de DNAA seleccionados (aplicación foliar).

ID	Actividad herbicida	ID	Actividad herbicida
584	3	5746	4
586	2	5757	2
5623	3	5768	4
5625	5	5772	3
5637	2	5778	4
5640	3	5781	4
5663	3	5791	4
5666	5	5803	2
5667	4	5805	5
5679	5	6617	4
5709	3	6640	3
5728	3	6643	2
5730	3	6681	4
5738	3		

Ejemplo 7: Actividad herbicida de DNAA seleccionados sobre el desarrollo de malezas.

El efecto herbicida de los compuestos reivindicados sobre malezas se ejemplifica usando los compuestos 5623, 5625, 5666, 5679, 5738, 5746, 5784, 5791, 6651 y 6617. Las malezas se sembraron en macetas de 7 X 7 X 6 cm, que contenían medio de suelo arenoso (pH 7). En este conjunto de pruebas se usaron las siguientes malezas: *Amaranthus tuberculatus*, *Amaranthus palmeri*, *Chenopodium album*, *Chenopodium murale*, *Malva nicaeensis*, *Abutilon theophrasti*, *Chrysanthemum coronarium*, *Silybum marianum*, *Bidens*, *Verbesina encelioides*, *Lactuca serriola*, *Erigeron canadensis*, *Erigeron bonariensis*, *Ormenis mixta*, *Xanthium strumarium*, *Heterotheca subaxillaris*, *Sonchus oleraceus*, *Sinapis arvensis*, *Datura innoxia*, *Datura ferox*, *Portulaca oleracea*, *Convolvulus althaeoides*, *Ipomoea hederacea*, *Medicago scutellate*.

Los compuestos que se sometieron a prueba se aplicaron al suelo (preemergencia) rociando la superficie del suelo con una solución acuosa de un compuesto de prueba (tasa de 0 a 1 kg i.a./Ha), con un volumen de 200 L/Ha. Después del rociado, las macetas se regaron con 10 ml/macetero y, 21 días después del tratamiento se examinó y evaluó el efecto herbicida utilizando la escala de daño como se usó en el Ejemplo 6. La dosis efectiva que resultó en una Puntuación de Daños ≥ 4 y varió entre 0,05 y 0,25 kg de i.a./Ha. La Figura 1 muestra el efecto herbicida preemergencia del compuesto 5666 sobre *Amaranthus palmeri*, a 21 DPA. Puntuación de Daño 5.

Ejemplo 8: Efecto herbicida posemergente de derivados de aminoácidos no codificados (DNAA) sobre malezas.

El efecto herbicida de los compuestos reivindicados sobre las malezas se ejemplifica usando los compuestos 5623, 5625, 5666, 5679, 5738, 5746, 5784, 5791, 6651 y 6617. Aplicación foliar: Las malezas se cultivaron en macetas de 7 X 7 X 6 cm, que contenían medio de vivero (pH 5-6). Las pruebas que realizamos en *Amaranthus tuberculatus*, *Chenopodium album*, *Chenopodium murale*, *Malva nicaeensis*, *Abutilon theophrasti*, *Chrysanthemum coronarium*, *Silybum marianum*, *Bidens*, *Verbesina encelioides*, *Lactuca serriola*, *Erigeron canadensis*, *Erigeron bonariensis*, *Ormenis mixta*, *Xanthium strumarium*, *Heterotheca subaxillaris*,

Sonchus oleraceus, *Sinapis arvensis*, *Datura innoxia*, *Datura ferox*, *Portulaca oleracea*, *Convolvulus althaeoides*, *Ipomoea hederacea*, *Medicago scutellate*.

Los compuestos sometidos a prueba se aplicaron rociando el follaje cuando las plantas alcanzaron 2-4 hojas verdaderas con un volumen de 200 L/Ha (tasa de 0 a 1 kg de i.a./Ha) o mediante aplicación por empapado. El efecto herbicida se examinó 14 días después del tratamiento y se evaluó utilizando la Puntuación de Daño descrita en el ejemplo 6. En aplicación foliar, la dosis efectiva que generó una Puntuación de Daño ≥ 4 fue de 0,1 a 1 Kg de i.a./Ha (fig. 2 y fig. 3).

En la Figura 2 se demuestra el efecto herbicida posemergencia del compuesto 5679 en *Amaranth tuberculatus*, a 14 DPA, aplicación foliar (Puntuación de Daño 5), y en la Figura 3 se muestra el efecto herbicida de los compuestos 5679, 5666 y 6651 en aplicación por empapado en *Malva nicaeensis*, a 14 DPA (Puntuación de Daño 4).

Ejemplo 9: Selectividad de DNAA por cereales

Se ilustra la selectividad de los compuestos reivindicados por cereales usando los compuestos: 5623, 5625, 5666, 5679, 5738, 5746, 5784, 5791, 6651, 6617, 5629, 5609, 5602, 5657. Las pruebas se realizaron en cultivos de cereales como el trigo, maíz, arroz, cebada, sorgo y avena en comparación con la maleza *Amaranth palmeri* (Figuras 4, 5 y 6). Las plantas de prueba se cultivaron y trataron como se describe en el Ejemplo 7 (aplicación preemergente) o como se describe en el Ejemplo 8 (aplicaciones foliares o empapado posemergencia).

El efecto herbicida se evaluó usando la Puntuación de Daño como se detalla en el Ejemplo 6.

La selectividad en cereales de los compuestos probados se observó hasta las dosis de 5 Kg de i.a./Ha, 0,05% y 0,5 Kg de i.a./Ha en aplicaciones foliares, de empapado y suelo, respectivamente.

En la Figura 4 se muestra la selectividad del compuesto 5666 por cereales en aplicación al suelo en una dosis de 0,25 Kg/Ha, a 21 DPA

En la Figura 5 se demuestra la selectividad del compuesto 5746 y 5666 por maíz en aplicación foliar, 1 Kg/Ha, a 21 DPA.

En la Figura 6 se muestra la selectividad de los compuestos 5657, 5602, 5609, 5629 por cereales (maíz y cebada) en aplicación por empapado (0,05%), a 14 DPA.

Ejemplo 10. Efecto herbicida de DNAA sobre malezas resistentes a otros herbicidas

Se ilustra el efecto herbicida de los compuestos reivindicados sobre malezas resistentes usando el compuesto 5679. Las pruebas se realizaron en malezas resistentes a herbicidas en aplicaciones foliares como se describe en el Ejemplo 8. El efecto herbicida se evaluó como se detalla en el Ejemplo 6. El compuesto 5679 se probó en malezas resistentes a herbicidas del Grupo 2 (inhibidores de ALS); grupo 22 (Fotosistema I, Paraquat) y Grupo 9 (inhibidores de la EPSP Sintasa, Glifosato). El compuesto 5679 en una dosis de 0,5 Kg de i.a./Ha produjo daño (Puntuación de Daño ≥ 4) tanto en malezas sensibles como resistentes.

En la Figura 7 se muestra el efecto herbicida del compuesto 5679 en aplicación foliar sobre *Conyza bonariensis* resistente a Glifosato (Grupo 9) y resistente a Paraquat (Grupo 22), a 14 DPA. En la figura 8 se muestra el efecto herbicida del compuesto 5679 (0,5 Kg de i.a./Ha, aplicación foliar) sobre *Sonchus oleraceus* resistente a sulfonilureas (herbicidas del grupo 2), 14 DPA..

Discusión:

La protección de cultivos con herbicidas es un elemento clave de la sostenibilidad alimentaria mundial. Desafortunadamente, poco después de la introducción de los herbicidas se puede desarrollar resistencia a los mismos. Según los mecanismos de resistencia a herbicidas, todos los procesos se pueden agrupar de la siguiente manera: resistencia de sitio activo, resistencia fuera del sitio activo, resistencia cruzada y resistencia múltiple. La resistencia de sitio activo generalmente se debe a una o varias mutaciones en el gen que codifica la enzima diana del herbicida, lo que, a su vez, disminuye la afinidad por la unión del herbicida a esa enzima. La resistencia fuera del sitio activo es causada por mecanismos que reducen la cantidad de compuesto herbicida activo antes de que pueda atacar a la planta a través de una reducción de la absorción o alteración de la translocación, el incremento en la capacidad de secuestrar

el herbicida o el aumento del metabolismo del herbicida. La resistencia cruzada significa que un único mecanismo de resistencia genera resistencia a varios herbicidas con algún modo de acción. La resistencia múltiple es una situación en la que dos o más mecanismos de resistencia están presentes en la misma planta, a menudo debido a la selección secuencial de herbicidas con diferentes modos de acción. Actualmente, se ha reportado resistencia a herbicidas en una multitud de biotipos de malezas en todo el mundo. Muchos de esos biotipos son resistentes a los inhibidores de la acetolactato sintasa (ALS), inhibidores del PS I y el PS II, los inhibidores de la ACC-asa y los inhibidores de la EPSPS (herbicidas de los Grupos 2, 1, 22, 5 y 9, respectivamente).

A menos que se defina lo contrario, todos los términos técnicos y/o científicos utilizados en el presente documento tienen el mismo significado que entienden comúnmente los expertos en la materia a la que pertenece la invención. A continuación se describen métodos y/o materiales ilustrativos, aunque hay que dejar en claro que en las pruebas o práctica de las realizaciones de la invención se pueden usar métodos y materiales similares o equivalentes a los descritos en este documento. En caso de conflicto, las especificaciones de la patente serán las que prevalecerán, incluidas las definiciones. Además, cabe destacar que los materiales, métodos y ejemplos usados son sólo ilustrativos y no pretenden ser necesariamente limitativos.

Como se usa en el presente documento, los términos “comprende”, “que comprende”, “incluye”, “que incluye”, “incluido”, “tiene”, “que tiene” y sus conjugados significan “incluido pero no limitado a”.

El término “que consiste en” significa “que incluye y se limita a”.

Como se usa en el presente documento, la forma singular “un”, “una” y “el”, “la”, incluyen referencias plurales a menos que el contexto dicte claramente lo contrario. Por ejemplo, el término “un compuesto” o “al menos un compuesto” puede incluir una pluralidad de compuestos, incluidas sus mezclas.

Se entenderá que cuando se hace referencia a un elemento como si estuviera “sobre”, “unido” a, “conectado” a, “acoplado” con, “en contacto” con, etc., otro elemento, este puede estar directamente sobre, unido, conectado, acoplado y/o en contacto con el otro elemento, o pueden haber elementos intermedios presentes. Por el contrario, cuando se dice que un elemento está, por ejemplo, “directamente sobre”, “directamente unido”, “directamente conectado”, “directamente acoplado” o “directamente en contacto” con otro elemento, no hay elementos intermedios presentes. Los expertos en la materia también deben tener en cuenta que cuando se hace referencia a una estructura o característica que está dispuesta “adyacente” a otra característica, la primera puede tener partes que se superponen o subyacen a la característica adyacente.

Aunque en el presente documento los términos primero, segundo, etc., pueden usarse para describir varios elementos, componentes, regiones, capas y/o secciones, se entenderá que estos elementos, componentes, regiones, capas y/o secciones no deben estar limitados por estos términos. Más bien, estos términos solo se usan para distinguir un elemento, componente, región, capa y/o sección, de otro elemento, componente, región, capa y/o sección.

Como apreciarán los expertos en la materia, los compuestos de las diversas fórmulas descritas en el presente documento pueden contener centros quirales, por ejemplo, átomos de carbono asimétricos. Por lo tanto, la presente divulgación se refiere a la síntesis tanto de (i) mezclas racémicas de los compuestos activos, como de (ii) formas enantioméricas de los compuestos activos. La resolución de racematos en formas enantioméricas y la racemización de formas enantioméricas ópticamente activas se puede realizar de acuerdo con procedimientos conocidos en la técnica. En los compuestos descritos en el presente documento también pueden estar presentes isómeros geométricos de dobles enlaces y sus similares, y todos estos isómeros estables están incluidos en la presente descripción a menos que se especifique lo contrario. En los compuestos de la divulgación también se incluyen tautómeros (por ejemplo, tautómeros de triazol y/o imidazol) y rotámeros. Todas las cadenas definidas por las fórmulas presentadas en este documento que incluyen tres o más carbonos pueden ser saturadas o insaturadas a menos que se indique lo contrario.

Se entiende que los sustituyentes y patrones de sustitución en los compuestos usados en el método de la presente invención pueden ser seleccionados por un experto en la materia para proporcionar compuestos que sean químicamente estables y que puedan ser fácilmente sintetizados por técnicas conocidas a partir de materiales de partida fácilmente disponibles. Si un mismo sustituyente está sustituido con más de un grupo, se entiende que estos múltiples grupos pueden estar en el mismo carbono o en diferentes carbonos, siempre y cuando se genere una estructura estable.

Un grupo “opcionalmente sustituido” se refiere a un grupo funcional en el que uno o más enlaces a un átomo de hidrógeno contenido en él se reemplazan por un enlace a átomos que no son de hidrógeno ni de carbono, siempre y cuando se mantengan las valencias normales y la sustitución de como resultado un compuesto estable. Los grupos sustituidos también incluyen grupos en los que uno o más enlaces a uno o más átomos de carbono o hidrógeno se reemplazan por uno o más enlaces a un heteroátomo, incluyendo enlaces dobles o triples. Cuando se describan o reivindiquen múltiples restos sustituyentes, el compuesto sustituido puede estar independientemente sustituido por uno o más de los restos sustituyentes descritos o reivindicados, individualmente o en conjunto. Por independientemente sustituido se entiende que los (dos o más) sustituyentes pueden ser iguales o diferentes. Al elegir los compuestos de la presente invención, un experto en la materia reconocerá que los diversos sustituyentes deben elegirse de conformidad con principios conocidos de conectividad entre estructuras químicas.

Como se usa en el presente documento, “H” se refiere a un átomo de hidrógeno. “C” se refiere a un átomo de carbono. “N” se refiere a un átomo de nitrógeno. “O” se refiere a un átomo de oxígeno. “Halo” se refiere a F, Cl, Br o I. El término “hidroxi”, como se usa en el presente documento, se refiere a un resto -OH. “Br” se refiere a un átomo de bromo. “Cl” se refiere a un átomo de cloro. “I” se refiere a un átomo de yodo. “F” se refiere a un átomo de flúor. Un “grupo acilo” significa un grupo -C(O)-R, en donde R es un sustituyente adecuado, por ejemplo, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo butiroilo, un grupo benzoilo o un grupo alquilbenzoilo. “Alquilo”, como se usa en el presente documento, se refiere a un hidrocarburo de cadena lineal o ramificada que contiene de 1 o 2 a 10 o 20 o más átomos de carbono (por ejemplo, C₂, C₃, C₄, C₅, C₆, C₇, C₈, C₉, C₁₀, C₁₁, C₁₂, C₁₃, C₁₄, C₁₅, etc.).

En algunas realizaciones, el alquilo puede ser un alquilo inferior. “Alquilo inferior” se refiere a un alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 3, o de 1 a 5, o de 1 a 8 átomos de carbono. Los ejemplos representativos de alquilo incluyen, entre otros, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo, isopentilo, neopentilo, n-hexilo, 3-metilhexilo, 2,2-dimetilpentilo, 2,3-dimetilpentilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo y similares. Tal como se usa en el presente documento, la identificación de un rango de número de carbonos, por ejemplo, alquilo C1-C12, pretende incluir cada uno de los restos del componente con número de carbonos dentro de dicho rango, de modo que cada número de carbono intermedio y cualquier otro valor de número de carbonos indicado o intermedio sea abarcado dentro de ese rango establecido, de modo que pueden especificarse independientemente sub-rangos de números de carbono dentro de rangos de números de carbono especificados. Por ejemplo, alquilo C1-C12 pretende incluir metilo, etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo, octilo, nonilo, decilo, undecilo y dodecilo, incluyendo cadenas lineales así como también grupos ramificados, como se indicó anteriormente, y el rango de números de carbonos de alquilo C1-C12 también puede especificarse más restrictivamente como sub-rangos tales como alquilo C1-C4, alquilo C2-C8, alquilo C2-C4, alquilo C3-C5 o cualquier otro sub-rango dentro del rango más amplio de números de carbonos. Además, se contemplan rangos de números de carbonos que excluyen específicamente un número o números de carbonos, así como sub-rangos que excluyen uno o ambos límites del número de carbonos de los rangos especificados. Como entienden generalmente los expertos en la materia, “saturación” se refiere al estado en el que todos los enlaces de valencia disponibles de un átomo (por ejemplo, carbono) están unidos a otros átomos. De manera similar, “insaturación” se refiere al estado en el que no todos los enlaces de valencia disponibles están unidos a otros átomos; en tales compuestos, los enlaces adicionales suelen adoptar la forma de enlaces dobles o triples (normalmente con carbono). Por ejemplo, una cadena de carbono está “saturada” cuando no hay enlaces dobles o triples presentes a lo largo de la cadena o conectados directamente a la cadena (por ejemplo, un carbonilo), y está “insaturada” cuando a lo largo de la cadena o conectado directamente a la cadena está presente al menos un enlace doble o triple (por ejemplo, un carbonilo). Además, los expertos en la materia entenderán que la presencia o ausencia de un sustituyente dependiendo de la saturación de la cadena depende del requisito de valencia de los átomos a los que se une el sustituyente (por ejemplo, carbono).

“Alquenilo”, tal como se usa en el presente documento, se refiere a un hidrocarburo de cadena lineal o ramificada que contiene de 1 o 2 a 10 o 20 o más carbonos, y que contiene al menos un doble enlace carbono-carbono, formado estructuralmente, por ejemplo, por el reemplazo de dos hidrógenos. Ejemplos representativos de “alquenilo” incluyen, entre otros, etenilo, 2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 3-butenilo, 4-pentenilo, 5-hexenilo, 2-heptenilo, 2-metil-1-heptenilo, 3-decenilo y similares. “Alquinilo”, tal como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo de hidrocarburos de cadena lineal o ramificada que contiene de 1 o 2 a 10 o 20 o más átomos de carbono, y que contiene al menos un triple enlace carbono-carbono. Ejemplos representativos de alquinilo incluyen, entre otros, acetilenilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 3-butinilo, 2-pentinilo, 1-butinilo y similares. El término “cicloalquilo”, como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo hidrocarburo cíclico saturado que contiene de 3 a 8 carbonos o más.

Como se entiende en la materia, el término “opcionalmente sustituido” indica que el grupo especificado puede o no estar sustituido por uno o más sustituyentes adecuados. Un “sustituyente” que está “sustituido” es un átomo o grupo que ocupa el lugar de un átomo de hidrógeno en la cadena principal o ciclo de una molécula orgánica. “Heterociclo”, como se usa en el presente documento, se refiere a un sistema de anillos monocíclico, bicíclico o tricíclico. Los sistemas de anillos heterocíclicos monocíclicos están ejemplificados por cualquier anillo de 5 a 9 miembros que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados independientemente del grupo que consiste en: O, N y S. “Arilo”, como se usa en el presente documento, se refiere a un sistema de anillos que tiene uno o más anillos aromáticos. Los ejemplos representativos de arilo incluyen azulenilo, indanilo, indenilo, naftilo, fenilo, tetrahidronaftilo y similares. “Heteroarilo” significa un hidrocarburo aromático cíclico en el que uno o más átomos de carbono han sido reemplazados por heteroátomos (por ejemplo, N, O o S). Si el grupo heteroarilo contiene más de un heteroátomo, los heteroátomos pueden ser iguales o diferentes. “Alcoxi”, como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo, como se define en este documento, unido al resto molecular principal a través de un grupo oxi, como se define en este documento. Una “amina” o “amino” significa el grupo -NH₂. Las “aminas primarias” tienen uno de los tres átomos de hidrógeno reemplazado por un grupo alquilo o aromático. Las “aminas secundarias” tienen dos sustituyentes orgánicos unidos al nitrógeno junto con un hidrógeno. Las “aminas terciarias” tienen tres sustituyentes

orgánicos unidos al nitrógeno. Una “amida”, como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo funcional que tiene un grupo carbonilo ($C=O$) unido a un átomo de nitrógeno (N), o un compuesto orgánico que contiene este grupo, generalmente representado como: donde, R y R' puede ser independientemente cualquier átomo o átomos enlazados covalentemente.

El término “oxo”, como se usa en el presente documento, se refiere a un resto $=O$. El término “oxi”, como se usa en el presente documento, se refiere a un resto $-O-$. “Nitro” se refiere al grupo funcional del compuesto orgánico $-NO_2$. “Carbonilo” es un grupo funcional que tiene un átomo de carbono con doble enlace a un átomo de oxígeno ($-C=O$). “Carboxi”, como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo funcional $-COOH$, también escrito como $-CO_2H$ o $-(C=O)-OH$.

Se entenderá que los compuestos, las composiciones y los métodos proporcionados en el presente documento pueden ser adicionalmente detallados en algunas realizaciones mediante condiciones o limitaciones que excluyen sustituyentes, grupos, restos, estructuras, ingredientes, pasos o condiciones específicas, según corresponda, en relación con varias especificaciones y ejemplificaciones más amplias establecidas en el presente documento.

Los “portadores agrícolamente aceptables” de la invención incluyen, sin limitación, adyuvantes, mezcladores, potenciadores, etc. que son beneficiosos para la aplicación de la fórmula química. Los portadores adecuados no deberían ser fitotóxicos para los cultivos valiosos, particularmente a las concentraciones empleadas en la aplicación de las composiciones para el control selectivo de malezas en presencia de cultivos, y no deberían reaccionar químicamente con los compuestos cuya fórmula química se presenta en este documento ni con otros ingredientes de la composición. Dichas mezclas pueden diseñarse para su aplicación directamente a las malezas o al lugar en que se encuentran, o pueden prepararse en forma de concentrados o formulaciones que normalmente se diluyen con portadores y adyuvantes adicionales antes de la aplicación. Pueden incluir componentes inertes o activos y pueden ser sólidos, como, por ejemplo, polvos, gránulos, granulados dispersables en agua o polvos humectables, o líquidos, como, por ejemplo, concentrados emulsionables, soluciones, emulsiones o suspensiones. Los portadores agrícolas adecuados útiles para preparar las composiciones agrícolas de la presente invención son bien conocidos por los expertos en la materia. Por ejemplo, los portadores líquidos que se pueden emplear

incluyen agua, tolueno, xileno, nafta de petróleo, aceite vegetal, acetona, metiletilcetona, ciclohexanona, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etilo, acetato de amilo, acetato de butilo, éter monometílico de propilenglicol y éter monometílico de dietilenglicol, metanol, etanol, isopropanol, alcohol amílico, etilenglicol, propilenglicol, glicerina y similares. El agua es generalmente el portador de elección para la dilución de concentrados. Los portadores sólidos adecuados incluyen talco, arcilla de pirofilita, sílice, arcilla de atapulgita, tierra de diatomeas, tiza, tierra de diatomeas, cal, carbonato de calcio, arcilla de bentonita, tierra de Fuller, cáscaras de semillas de algodón, harina de trigo, harina de soja, piedra pómez, harina de madera, harina de cáscara de nuez, lignina y similares.

Con frecuencia es deseable incorporar uno o más agentes tensioactivos en las composiciones de la presente invención. Dichos agentes tensioactivos se emplean ventajosamente en composiciones tanto sólidas como líquidas, especialmente aquellas diseñadas para diluirse con el portador antes de la aplicación. Los agentes tensioactivos pueden ser de carácter aniónico, catiónico o no iónico y pueden emplearse como agentes emulsionantes, agentes humectantes, agentes de suspensión o para otros fines. Los agentes tensioactivos típicos incluyen sales de sulfatos de alquilo, tales como laurilsulfato de dietanolamonio; sales de alquilarilsulfonato, tales como dodecibencenosulfonato de calcio; productos de adición de alquilfenol-óxido de alquileo, tales como nonilfenol-etoxilado C18; productos de adición de alcohol-óxido de alquileo, tales como alcohol tridecílico-etorilato C16; jabones, como estearato de sodio; sales de alquilnaftalenosulfonato, tales como dibutilnaftalenosulfonato de sodio; ésteres dialquílicos de sales de sulfosuccinato, tales como di(2-etilhexil) sulfosuccinato de sodio; ésteres de sorbitol, tales como oleato de sorbitol; aminas cuaternarias, tales como cloruro de lauril trimetilamonio; ésteres de polietilenglicol de ácidos grasos, tales como estearato de polietilenglicol; copolímeros en bloque de óxido de etileno y óxido de propileno; y sales de ésteres de fosfato de mono y dialquilo.

Otros adyuvantes comúnmente utilizados en las composiciones agrícolas incluyen agentes antiespumantes, agentes compatibilizantes, agentes secuestrantes, agentes neutralizantes y soluciones amortiguadoras, inhibidores de la corrosión, tintes, odorizantes, ayudantes de penetración, agentes esparcidores, agentes adhesivos, agentes dispersantes, agentes espesantes, depresores del punto de congelación, agentes antimicrobianos, y similares. Las

composiciones también pueden contener otros componentes compatibles, por ejemplo, otros herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, fungicidas, insecticidas y similares, y pueden formularse con fertilizantes líquidos o portadores de fertilizantes particulados tales como nitrato de amonio, urea y similares.

“Sal agrícolamente aceptable” significa una sal que retiene la eficacia biológica de los ácidos y bases libres de un compuesto específico y que no es indeseable desde el punto de vista biológico o de otro tipo. Los ejemplos de sales agrícolas aceptables incluyen sulfatos, piro-sulfatos, bisulfatos, sulfitos, bisulfitos, fosfatos, monohidrogenofosfatos, dihidrogenofosfatos, metafosfatos, pirofosfatos, cloruros, bromuros, yoduros, acetatos, propionatos, decanoatos, caprilatos, acrilatos, formiatos, isobutiratos, caproatos, heptanoatos, propiolatos, oxalatos, malonatos, succinatos, suberatos, sebacatos, fumaratos, maleatos, butino-1,4-dioatos, hexino-1,6-dioatos, benzoatos, clorobenzoatos, metilbenzoatos, dinitrobenzoatos, hidroxibenzoatos, metoxibenzoatos, ftalatos, sulfonatos, xilenosulfonatos, fenilacetatos, fenilpropionatos, fenilbutiratos, citratos, lactatos, γ -hidroxibutiratos, glicolatos, tartratos, metanosulfonatos, propanosulfonatos, naftaleno-1-sulfonatos, naftaleno-2-sulfonatos y mandelatos.

A lo largo de esta solicitud se pueden presentar varias realizaciones de esta invención en un formato de rango. Debe entenderse que la descripción en formato de rango es meramente por conveniencia y brevedad y no debe interpretarse como una limitación inflexible del alcance de la invención. En consecuencia, se debe considerar que al describir un rango se divulga específicamente todos los sub-rangos posibles, así como los valores numéricos individuales dentro de ese rango. Por ejemplo, cuando se describe un rango tal como de 1 a 6 debe considerarse que a la par se están específicamente divulgando sus sub-rangos, tales como de 1 a 3, de 1 a 4, de 1 a 5, de 2 a 4, de 2 a 6, de 3 a 6, etc., así como los números individuales contenidos dentro de ese rango, por ejemplo, 1, 2, 3, 4, 5 y 6. Esto se aplica independientemente de la amplitud del rango.

Cada vez que en el presente documento se indica un rango numérico se supone que éste incluye cualquier número citado (fraccional o entero) dentro del rango indicado. En el presente documento se usan indistintamente las frases “que varía entre” un primer número indicado y un segundo número indicado y “que varía desde” un primer número indicado

“hasta” un segundo número indicado, y con ellas se pretende incluir el primer y el segundo número indicados y todos los números fraccionarios y enteros entre ellos.

Ciertas características de la invención, que se describen, para mayor claridad, en el contexto de realizaciones separadas, también pueden proporcionarse en combinación en una única realización. A la inversa, diversas características de la invención, que se describen por brevedad en el contexto de una sola realización, también pueden proporcionarse por separado o en cualquier subcombinación adecuada, o como sea apropiado en cualquier otra realización descrita de la invención. Ciertas características descritas en el contexto de varias realizaciones no deben considerarse características esenciales de esas realizaciones, a menos que la realización no funcione sin esos elementos.

Tal como se utiliza en el presente documento, el término “método” se refiere a formas, medios, técnicas y procedimientos para realizar una tarea determinada, incluidos, entre otros, aquellas formas, medios y técnicas y procedimientos conocidos o desarrollados fácilmente a partir de formas, medios, técnicas y procedimientos conocidos por quienes llevan a la práctica las técnicas químicas, agrícolas, biológicas y bioquímicas.

Como se usa en el presente documento, el término “regulador del crecimiento vegetal” se refiere, entre otros, a un compuesto, ya sea natural o sintético, que modifica o controla uno o más procesos fisiológicos específicos dentro de una planta.

Tal como se usa en el presente documento, el término “planta” se refiere, entre otros, a plantas enteras, ancestros y progenies de las plantas y partes de plantas, incluidas semillas, brotes, tallos, raíces (incluidos los tubérculos) y células, tejidos y órganos vegetales. La planta puede estar en cualquier forma, incluidos cultivos en suspensión, embriones, regiones meristemáticas, tejido calloso, hojas, gametofitos, esporofitos, polen y microesporas.

Tal como se usa en el presente documento, el término “agente protector de cultivos” se refiere, entre otros, a un agente que es un pesticida (o una mezcla de más de un pesticida) o un regulador del crecimiento vegetal.

Como se usa en el presente documento, el término “pesticida” se refiere, entre otros, a un agente químico o biológico que detiene, inhabilita, extermina o frena las plagas.

Los compuestos de esta invención se utilizarán generalmente como ingrediente activo herbicida en una composición. Como se usa en el presente documento, el término “composición” se refiere, pero no está limitado, a una formulación, con al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, que sirve como portador. Los ingredientes de la formulación o composición se seleccionan para que sean consistentes con las propiedades físicas del ingrediente activo, el modo de aplicación y los factores ambientales, como el tipo de aceite, la humedad y la temperatura. Las composiciones útiles pueden incluir formulaciones tanto líquidas como sólidas. Las formulaciones líquidas pueden incluir soluciones (incluyendo concentrados emulsionables), suspensiones, emulsiones (incluyendo microemulsiones, emulsiones de aceite en agua, concentrados fluidos y/o suspoemulsiones) y similares, que opcionalmente pueden espesarse para formar geles. Los tipos generales de composiciones líquidas acuosas son: concentrado soluble, concentrado en suspensión, suspensión en cápsula, emulsión concentrada, microemulsión, emulsión de aceite en agua, concentrado fluido y suspoemulsión. Los tipos generales de composiciones líquidas no acuosas son concentrado emulsionable, concentrado microemulsionable, concentrado dispersable y dispersión de aceite.

Los tipos generales de formulaciones sólidas son polvo, producto en polvo, gránulos, gránulos, pellets, prills, astillas, tabletas, películas rellenas (incluyendo recubrimientos de semillas) y similares, que pueden ser dispersables en agua (“humectables o mojables”) o solubles en agua. Para el tratamiento de semillas son particularmente útiles las películas y recubrimientos formados a partir de soluciones formadoras de películas o suspensiones fluidas. El ingrediente activo se puede (micro)encapsular y posteriormente constituirse en forma de una suspensión o una formulación sólida; alternativamente, la formulación completa del ingrediente activo se puede encapsular (o “recubrir”). La encapsulación puede controlar o retrasar la liberación del ingrediente activo. Las formulaciones pulverizables normalmente se extienden en un medio adecuado antes de la pulverización. Dichas formulaciones líquidas y sólidas se formulan para diluirse fácilmente en el medio de pulverización, generalmente agua, pero ocasionalmente en otro medio adecuado como un hidrocarburo parafínico o aromático o un aceite vegetal. Los volúmenes de pulverización pueden oscilar entre aproximadamente uno y varios miles de litros por hectárea, pero más

normalmente se encuentran en el rango de aproximadamente diez a varios cientos de litros por hectárea. Las formulaciones pulverizables pueden mezclarse en un tanque con agua u otro medio adecuado para el tratamiento foliar mediante aplicación aérea o al suelo, o para aplicación al medio de crecimiento de la planta. Las formulaciones líquidas y secas pueden dosificarse directamente en los sistemas de riego por goteo o dosificarse en el surco durante la siembra.

Típicamente las formulaciones contendrán cantidades efectivas de ingrediente activo, diluyente y tensioactivo dentro de los siguientes rangos aproximados que suman 100 por ciento en peso.

Los compuestos de la invención tienen actividad herbicida (tanto preemergente como posemergente). Como se usa en el presente documento, el término “controlar el crecimiento vegetal indeseado” se refiere a exterminar o dañar la vegetación o reducir su crecimiento.

Los compuestos y composiciones de la invención se pueden aplicar exitosamente mediante una variedad de métodos que implican poner en contacto una cantidad herbicidamente efectiva de un compuesto de la invención, o una composición que comprende dicho compuesto, y al menos uno de un tensioactivo, un diluyente sólido o un diluyente líquido, con el follaje u otra parte de la vegetación o planta indeseada o el entorno del crecimiento vegetal indeseado, tal como en el suelo o el agua en el que crece la vegetación indeseada o que rodea la semilla u otro propágulo de la planta indeseada.

Una cantidad herbicidamente efectiva de los compuestos de esta invención está determinada por una serie de factores: formulación seleccionada, método de aplicación, cantidad y tipo de crecimiento vegetal indeseado presente, condiciones de crecimiento, etc. En general, la una cantidad herbicidamente efectiva de los compuestos de esta invención es de aproximadamente 0,001 a 20 kg/ha con un rango preferido de aproximadamente 0,004 a 1 kg/ha. Un experto en la materia puede determinar fácilmente la cantidad herbicidamente efectiva necesaria para el nivel deseado de control de malezas.

Los compuestos de la invención se aplican, típicamente, en forma de composición formulada, en un lugar que comprende el crecimiento de vegetación deseada (por ejemplo, cultivos) y

de vegetación indeseada (por ejemplo, malezas), las cuales pueden ser semillas, plántulas y/o plantas más grandes, que están en contacto con un medio de cultivo (por ejemplo, suelo). En este lugar, se puede aplicar una composición que comprende los compuestos de la invención directamente a una planta o cualquier parte vegetal de la misma, particularmente del crecimiento de plantas indeseadas, y/o al medio de crecimiento en contacto con la planta.

Los compuestos de esta invención también se pueden mezclar con uno o más compuestos o agentes biológicamente activos, incluidos herbicidas, protectores de cultivos/antídotos de herbicidas, fungicidas, insecticidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, reguladores del crecimiento de plantas, tales como inhibidores de la muda de insectos, y estimulantes del enraizamiento, quimioesterilizantes, semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes de alimentación, nutrientes para plantas, otros compuestos biológicamente activos o bacterias, virus u hongos para formar un pesticida multicomponente que brinda un espectro más amplio de protección agrícola. Las mezclas de los compuestos de la invención con otros herbicidas pueden ampliar el espectro de actividad contra otras especies de malezas y suprimir la proliferación de cualquier biotipo resistente.

A lo largo de esta solicitud se hace referencia a varias publicaciones, solicitudes de patentes publicadas y patentes publicadas. Las descripciones de estas publicaciones en su totalidad se incorporan aquí por referencia para describir más completamente el estado de la técnica al que pertenece esta invención.

Ciertas características de la invención, que se describen, para mayor claridad, en el contexto de realizaciones separadas, también pueden proporcionarse en combinación en una sola realización. A la inversa, diversas características de la invención, que se describen, por brevedad, en el contexto de una sola realización, también se pueden proporcionar por separado o en cualquier subcombinación adecuada, o como sea apropiado, dentro de cualquier otra realización descrita de la invención. Ciertas características descritas en el contexto de varias realizaciones no deben considerarse características esenciales de esas realizaciones, a menos que la realización no funcione sin esos elementos.