

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 706 504**

51 Int. Cl.:

A01N 43/40 (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)
C07D 213/73 (2006.01)
C07D 213/79 (2006.01)
C07D 239/42 (2006.01)
C07D 239/47 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **12.03.2014** **PCT/US2014/024388**

87 Fecha y número de publicación internacional: **25.09.2014** **WO14150850**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **12.03.2014** **E 14769101 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.10.2018** **EP 2967069**

54 Título: **4-Amino-6-(4-sustituido-fenil)-picolinatos y 6-amino-2-(4-sustituido-fenil)-pirimidino-4-carboxilatos y su utilización como herbicidas**

30 Prioridad:

15.03.2013 US 201313840233

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

29.03.2019

73 Titular/es:

DOW AGROSCIENCES LLC (100.0%)
9330 Zionsville Road
Indianapolis, Indiana 46268, US

72 Inventor/es:

ECKELBARGER, JOSEPH, D.;
EPP, JEFFREY, B.;
FISCHER, LINDSEY, G.;
GIAMPIETRO, NATALIE, C.;
IRVINE, NICHOLAS, M.;
KISTER, JEREMY;
LO, WILLIAM, C.;
LOWE, CHRISTIAN, T.;
PETKUS, JEFFREY;
ROTH, JOSHUA;
SATCHIVI, NORBERT, M.;
SCHMITZER, PAUL, R.;
SIDDALL, THOMAS, L. y
YERKES, CARLA, N.

74 Agente/Representante:

ELZABURU, S.L.P

ES 2 706 504 T3

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

DESCRIPCIÓN

4-Amino-6-(4-sustituido-fenil)-picolinatos y 6-amino-2-(4-sustituido-fenil)-pirimidino-4-carboxilatos y su utilización como herbicidas

Antecedentes

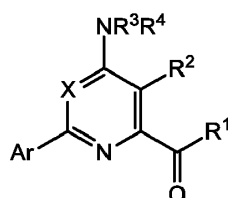
5 La aparición de vegetación no deseable, p. ej., malas hierbas, es un problema constante al que se enfrentan los agricultores en cultivos, pastos y otros entornos. Las malas hierbas compiten con los cultivos y tienen un impacto negativo en el rendimiento de los cultivos. El uso de herbicidas químicos es una herramienta importante para controlar la vegetación no deseable.

10 Se conocen como herbicidas útiles 4-amino-6-sustituido picolinatos y 6-amino-2-pirimidino-4-carboxilatos p. ej., según los documentos WO 2013/003740 A1, WO 2012/103051 A2, WO 2010/125332 A1, WO 2010/092339 A1 y WO 2009/046090 A1.

15 Sigue existiendo la necesidad de nuevos herbicidas químicos que ofrezcan un espectro más amplio de control de malas hierbas, selectividad, daños mínimos en los cultivos, estabilidad en el almacenamiento, facilidad de manejo, mayor actividad contra las malas hierbas y/o medios para abordar la tolerancia a los herbicidas que se desarrolla con respecto a herbicidas actualmente en uso.

Compendio

En la presente memoria se proporcionan compuestos de Fórmula (I):



(I)

en donde

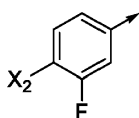
20 X es N o CY, en donde Y es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil(C₁-C₃)tio, o haloalquil(C₁-C₃)tio;

R¹ es OR^{1'}, en donde R^{1'} es H, alquilo C₁-C₈, o arilalquilo C₇-C₁₀;

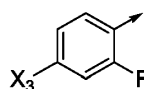
25 R² es F, Cl, Br, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil(C₁-C₄)tio, haloalquil(C₁-C₄)tio, amino, alquil(C₁-C₄)amino, haloalquil(C₂-C₄)amino, formilo, (alquil C₁-C₃)carbonilo, (haloalquil C₁-C₃)carbonilo, ciano, o un grupo de fórmula -CR¹⁷=CR¹⁸-SiR¹⁹R²⁰R²¹, en donde R¹⁷ es hidrógeno, F o Cl; R¹⁸ es hidrógeno, F, Cl, alquilo C₁-C₄, o haloalquilo C₁-C₄; y R¹⁹, R²⁰ y R²¹ son cada uno independientemente alquilo C₁-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₁₀, halocicloalquilo C₃-C₆, fenilo, fenilo sustituido, alcoxi C₁-C₁₀, o OH;

30 R³ y R⁴ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, haloalqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, formilo, (alquil C₁-C₃)carbonilo, (haloalquil C₁-C₃)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquil C₁-C₆)carbamil, (alquil C₁-C₆)sulfonilo, tri(alquil C₁-C₆)sililo, di(alquil C₁-C₆)fosfonilo, o R³ y R⁴ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo saturado de 5- o 6-miembros, o R³ y R⁴ en conjunto representan =CR^{3'}R^{4'}, en donde R^{3'} y R^{4'} son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, o (alquil C₁-C₆)amino, o R^{3'} y R^{4'} junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo saturado de 5- o 6-miembros;

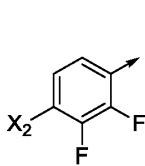
Ar es Ar2, Ar3, Ar4, Ar5 o Ar6:



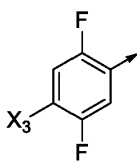
Ar2



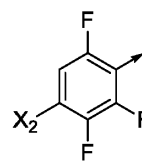
Ar3



Ar4



Ar5



Ar6

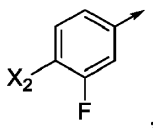
en donde

X_2 es H, F, Br, I, etinilo, haloetinilo, CH_3 , CFH_2 , CF_2H , CF_3 , OCF_2H , OCF_3 , CN, $CONH_2$, CO_2H , o NO_2 ;

X_3 es H, F, Br, I, etinilo, haloetinilo, CH_3 , CFH_2 , CF_2H , CF_3 , OCF_2H , OCF_3 , CN, $CONH_2$, CO_2H , o NO_2 ;

5 en donde

a) cuando Ar es



en ese caso X es N, CH, CF, CCl o CCH_3 ;

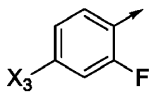
con las condiciones de que:

10

i) R^2 no es Cl, cuando X es N;

ii) X_2 no es Br, I, o CF_3 , cuando R^2 es OCH_3 y X es CF; y

b) cuando Ar es



en ese caso X es N, CH o CF;

15

con las condiciones de que:

i) R^2 no es Cl, cuando X es N;

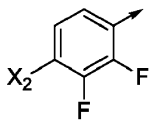
ii) X_3 no es CH_3 , cuando R^2 es OCH_3 y X es N;

iii) X_3 no es H, F o CH_3 , cuando R^2 es Cl y X es CH;

iv) X_3 no es Br o I, cuando R^2 es OCH_3 y X es CF; y

20

b) cuando Ar es



en ese caso X es N, CH o CF;

con las condiciones de que:

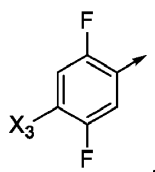
i) R^2 no es Cl, cuando X es N;

25

ii) X_2 no es F, cuando R^2 es Cl y X es CH;

iii) X_2 no es Br, I o CF_3 , cuando R^2 es OCH_3 y X es CF;

d) cuando Ar es



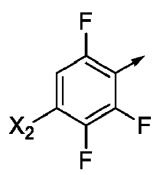
en ese caso X es N, CH o CF;

con la condición de que:

i) X_3 no es CH_3 , cuando R^2 es Cl y X es N;

ii) X_3 no es Br o I, cuando X es CF y R^2 es OCH_3 ; y

e) cuando Ar es



en ese caso X es N, CH o CF;

o un N-óxido o una sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola.

También se proporcionan métodos para controlar la vegetación no deseada que comprenden

(a) poner en contacto con la vegetación no deseable o zona adyacente a la vegetación no deseable, o

(b) poner en contacto previamente con el suelo o el agua, una cantidad eficaz como herbicida de al menos un compuesto de Fórmula (I) o un derivado aceptable desde el punto de vista agrícola (p. ej., sales, solvatos, hidratos, ésteres, amidas, N-óxidos, u otros derivados aceptables desde el punto de vista agrícola) de los mismos.

Descripción detallada

Según se utiliza en la presente memoria, herbicida e ingrediente activo herbicida significa un compuesto que controla la vegetación no deseable cuando se aplica en una cantidad apropiada.

Según se utiliza en la presente memoria, controlar o controlar la vegetación no deseable significa eliminar o prevenir la vegetación, o causar algún otro efecto que modifique adversamente la vegetación, p. ej., desviaciones del crecimiento o desarrollo natural, regulación, desecación, retraso y similares.

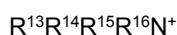
Según se utiliza en la presente memoria, una cantidad eficaz como herbicida o que controla la vegetación es una cantidad de ingrediente activo herbicida cuya aplicación controla la vegetación no deseable relevante.

Según se utiliza en la presente memoria, aplicar un herbicida o una composición herbicida representa la distribución directamente a la vegetación elegida como diana o al lugar de la misma o a la zona donde se desea el control de la vegetación no deseada. Los métodos de aplicación incluyen, pero no se limitan a, poner en contacto con el suelo o el agua antes de la emergencia, o poner en contacto con la vegetación no deseable o la zona adyacente a la vegetación no deseable después de la emergencia.

Según se utiliza en la presente memoria, las plantas y la vegetación incluyen, pero no se limitan a, semillas latentes, semillas germinantes, plántulas emergentes, plantas que emergen de propágulos vegetativos, vegetación inmadura y vegetación establecida.

Según se utiliza en la presente memoria, las sales y ésteres aceptables desde el punto de vista agrícola se refieren a sales y ésteres que muestran actividad herbicida, o que son o se pueden convertir en el herbicida referido en plantas, el agua o el suelo. Los ésteres aceptables desde el punto de vista agrícola ilustrativos son aquellos que están o pueden ser hidrolizados, oxidados, metabolizados o convertidos de otra manera. p. ej., en plantas, el agua o el suelo, en el ácido carboxílico correspondiente que, dependiendo del pH, puede estar en forma disociada o no disociada.

Las sales adecuadas incluyen aquellas derivadas de metales alcalinos o alcalinotérreos y las derivadas de amoníaco y aminas. Los cationes preferidos incluyen cationes de sodio, potasio, magnesio y amonio de fórmula:



en donde R¹³, R¹⁴, R¹⁵ y R¹⁶ cada uno, independientemente representa hidrógeno o alquilo C₁-C₁₂, alqueniilo C₃-C₁₂, o alquinilo C₃-C₁₂, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes tales como hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, alquil(C₁-C₄)tio, o grupos fenilo, siempre que R¹³, R¹⁴, R¹⁵ y R¹⁶ sean estéricamente compatibles. Además, dos cuales quiera R¹³, R¹⁴, R¹⁵ y R¹⁶ pueden representar juntos un radical difuncional alifático que contiene de uno a doce átomos de carbono y hasta dos átomos de oxígeno o azufre. Las sales de los compuestos de Fórmula (I) se pueden preparar por tratamiento de los compuestos de Fórmula (I) con un hidróxido de metal, tal como hidróxido de sodio, con una amina, tal como amoniaco, trimetilamina, dietanolamina, 2-metil-tiopropilamina, bisalilamina, 2-butoxiethylamina, morfolina, ciclododecilamina o bencilamina, o con un hidróxido de tetraalquilamonio, tal como hidróxido de tetrametilamonio o hidróxido de colina. Las sales de amina de los compuestos de Fórmula (I) son formas útiles o derivadas de los compuestos de Fórmula (I) porque son solubles en agua y se prestan a la preparación de composiciones herbicidas de base acuosa deseables.

Otras formas o derivados de compuestos de Fórmula (I) incluyen N-óxidos de compuestos de Fórmula (I). Los N-óxidos de piridina se pueden obtener por oxidación de las piridinas correspondientes. Los métodos de oxidación adecuados se describen, por ejemplo, en Houben-Weyl, *Methoden der organischen Chemie* [Methods in organic chemistry], volúmenes ampliados y posteriores a la 4ª edición, volumen E 7b, pág. 565 f.

Según se utiliza en la presente memoria, "acilo" incluye formilo, (alquil C₁-C₃)carbonilo, y (haloalquil C₁-C₃)carbonilo.

Según se utiliza en la presente memoria, "alquilo" se refiere a radicales hidrocarbonados de cadena lineal o ramificada, saturados. A menos que se especifique lo contrario, se desea grupos alquilo C₁-C₁₀. Los ejemplos incluyen, pero no se limitan a, metilo, etilo, propilo, 1-metil-etilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metil-propilo, 1,1-dimetil-etilo, pentilo, 1-metil-butilo, 2-metil-butilo, 3-metil-butilo, 2,2-dimetil-propilo, 1-etil-propilo, hexilo, 1,1-dimetil-propilo, 1,2-dimetil-propilo, 1-metil-pentilo, 2-metil-pentilo, 3-metil-pentilo, 4-metil-pentilo, 1,1-dimetil-butilo, 1,2-dimetil-butilo, 1,3-dimetil-butilo, 2,2-dimetil-butilo, 2,3-dimetil-butilo, 3,3-dimetil-butilo, 1-etil-butilo, 2-etil-butilo, 1,1,2-trimetil-propilo, 1,2,2-trimetil-propilo, 1-etil-1-metil-propilo, y 1-etil-2-metil-propilo.

Según se utiliza en la presente memoria, "haloalquilo" se refiere a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada, donde en estos grupos los átomos de hidrógeno pueden estar parcial o totalmente sustituidos con uno o más átomos de halógeno. A menos que se especifique lo contrario, se desea los grupos C₁-C₈. Los ejemplos incluyen, pero no se limitan a, clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo, y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo.

Según se utiliza en la presente memoria, "alqueniilo" se refiere a radicales hidrocarbonados de cadena lineal o ramificada, insaturados que contienen uno o más enlaces dobles. A menos que se especifique lo contrario, se desean alqueniilo C₂-C₈. Los grupos alqueniilo pueden contener más de un enlace insaturado. Los ejemplos incluyen, pero no se limitan a, etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo, y 1-etil-2-metil-2-propenilo.

Según se utiliza en la presente memoria, "alquinilo" representa radicales hidrocarbonados de cadena lineal o ramificada que contienen uno o más enlaces triples. A menos que se especifique lo contrario, se desean grupos alquinilo C₂-C₈. Los grupos alquinilo pueden contener más de un enlace insaturado. Los ejemplos incluyen, pero no se limitan a, alquinilo C₂-C₆, tal como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo (o propargilo), 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 3-metil-1-butinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etilo-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 3-metil-1-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 1-metil-2-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo.

Según se utiliza en la presente memoria, "alcoxi" se refiere a un grupo de fórmula R-O-, donde R es alquilo como se define anteriormente. A menos que se especifique lo contrario, se desean grupos alcoxi en donde R es un grupo alquilo C₁-C₈. Los ejemplos incluyen, pero no se limitan a, metoxi, etoxi, propoxi, 1-metil-etoxi, butoxi, 1-metil-propoxi, 2-metil-propoxi, 1,1-dimetil-etoxi, pentoxi, 1-metil-butiloxi, 2-metil-butoxi, 3-metil-butoxi, 2,2-di-metil-propoxi,

1-etil-propoxi, hexoxi, 1,1-dimetil-propoxi, 1,2-dimetil-propoxi, 1-metil-pentoxi, 2-metil-pentoxi, 3-metil-pentoxi, 4-metil-pentoxi, 1,1-dimetil-butoxi, 1,2-dimetil-butoxi, 1,3-dimetil-butoxi, 2,2-dimetil-butoxi, 2,3-dimetil-butoxi, 3,3-dimetil-butoxi, 1-etil-butoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetil-propoxi, 1,2,2-trimetil-propoxi, 1-etil-1-metil-propoxi, y 1-etil-2-metil-propoxi.

5 Según se utiliza en la presente memoria, "haloalcoxi" se refiere a un grupo de la fórmula R-O-, donde R es haloalquilo como se define anteriormente. A menos que se especifique lo contrario, se desean grupos haloalcoxi en donde R es un grupo alquilo C₁-C₈. Los ejemplos incluyen, pero no se limitan a, clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro, 2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi y 1,1,1-trifluoroprop-2-oxi.

15 Según se utiliza en la presente memoria, "alquiltio" se refiere a un grupo de la fórmula R-S-donde R es alquilo como se define anteriormente. A menos que se especifique lo contrario, se desean grupos alquiltio en donde R es un grupo alquilo C₁-C₈. Los ejemplos incluyen, pero no se limitan a, metiltio, etiltio, propiltio, 1-metiletiltio, butiltio, 1-metil-propiltio, 2-metilpropiltio, 1,1-dimeteiltio, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 2,2-dimetilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio, 4-metil-pentiltio, 1,1-dimetil butiltio, 1,2-dimetil-butiltio, 1,3-dimetil-butiltio, 2,2-dimetil butiltio, 2,3-dimetil butiltio, 3,3-dimetil butiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetil propiltio, 1,2,2-trimetil propiltio, 1-etil-1-metil propiltio y 1-etil-2-metilpropiltio.

20 Según se utiliza en la presente memoria, "haloalquiltio" se refiere a un grupo alquiltio como se define anteriormente en donde los átomos de carbono están parcial o totalmente sustituidos con uno o más átomos de halógeno. A menos que se especifique lo contrario, se desean grupos haloalquiltio en donde R es un grupo alquilo C₁-C₈. Los ejemplos incluyen, pero no se limitan a, clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio, pentafluoroetiltio, y 1,1,1-trifluoroprop-2-iltio.

30 Según se utiliza en la presente memoria, "arilo", así como los términos derivados tal como "ariloxi", se refiere a un grupo fenilo, indanilo o naftilo. En algunas realizaciones, se prefiere fenilo. El término "heteroarilo", así como los términos derivados tal como "heteroariloxi", se refiere a un anillo aromático de 5- o 6- miembros que contiene uno o más heteroátomos, p. ej., N, O o S; estos anillos heteroaromáticos se pueden fusionar con otros sistemas aromáticos. Los sustituyentes arilo o heteroarilo pueden estar sin sustituir o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados entre, p. ej., halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, formilo, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, acilo C₁-C₆, (alquil C₁-C₆)tio, (alquil C₁-C₆)sulfonilo, (alquil C₁-C₆)sulfonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, carbamoilo C₁-C₆, hidroxycarbonilo, (alquil C₁-C₆)carbonilo, aminocarbonilo, amino(alquil C₁-C₆)carbonilo, diamino(alquil C₁-C₆)carbonilo, siempre que los sustituyentes sean estéricamente compatibles y se cumplan las reglas de enlace químico y energía de la tensión. En algunas realizaciones, los sustituyentes preferidos incluyen, por ejemplo, halógeno, alquilo C₁-C₂, y haloalquilo C₁-C₂.

Según se utiliza en la presente memoria, "alcoxicarbonilo" se refiere a un grupo de fórmula  en donde R es alquilo.

40 Según se utiliza en la presente memoria, "alquilamino" o "dialquilamino" se refiere a un grupo amino sustituido con uno o dos grupos alquilo, que pueden ser iguales o diferentes.

Según se utiliza en la presente memoria, "alquilcarbamoilo" se refiere a un grupo carbamoilo sustituido en el nitrógeno con un grupo alquilo.

45 Según se utiliza en la presente memoria, "alquilsulfonilo" se refiere a -SO₂R, en donde R es alquilo (p. ej., alquilo C₁-C₁₀).

Según se utiliza en la presente memoria, "carbamoilo" (también denominado carbamoilo o aminocarbonilo) se refiere

a un grupo de fórmula .

Según se utiliza en la presente memoria, "haloalquilamino" se refiere a un grupo alquilamino en donde los átomos de carbono del alquilo están parcial o totalmente sustituidos con uno o más átomos de halógeno.

50 Según se utiliza en la presente memoria, "Me" se refiere a un grupo metilo.

Según se utiliza en la presente memoria, el término "halógeno", incluyendo términos derivados tal como "halo", se

refiere a flúor, cloro, bromo o yodo (o fluoruro, cloruro, bromuro o yoduro).

Según se utiliza en la presente memoria, las plantas y la vegetación incluyen, pero no se limitan a, semillas germinantes, plántulas emergentes, plantas que emergen de propágulos vegetativos, vegetación inmadura y vegetación establecida.

5 Compuestos

En la presente memoria se proporcionan compuestos de Fórmula (I) como se define en la presente memoria (p. ej., en el Compendio anterior) y N-óxidos y sus sales aceptables desde el punto de vista agrícola.

En algunas realizaciones, el compuesto es el ácido carboxílico o un éster o sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola. En algunas realizaciones, el compuesto es el ácido carboxílico o su éster metílico.

10 En algunas realizaciones:

Ar se selecciona del grupo que consiste en Ar₂, Ar₃, Ar₄, Ar₅, y Ar₆;

R¹ es OR^{1'}, en donde R^{1'} es H o alquilo C₁-C₈;

R² es F, Cl, Br, haloalqueno C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil(C₁-C₄)tio, o (haloalquil C₁-C₄)tio;

15 R³ y R⁴ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, haloalqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, formilo, (alquil C₁-C₃)carbonilo, (haloalquil C₁-C₃)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquil C₁-C₆)carbamil, tri(alquil C₁-C₆) sililo, o R³ y R⁴ en conjunto representan =CR^{3'}R^{4'}, en donde R^{3'} y R^{4'} son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, o (alquil C₁-C₆)amino; y

20 X es N o CY, donde Y es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil(C₁-C₃)tio, o haloalquil(C₁-C₃)tio.

En una realización, X es N. En una realización, X es CY.

25 En una realización, Y es hidrógeno. En una realización, Y es halógeno (p. ej., F, Cl, Br, I). En una realización, Y es alquilo C₁-C₃ (p. ej., metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo). En una realización, Y es haloalquilo C₁-C₃ (p. ej., CFH₂, CF₂H, CF₃, CF₂CF₃). En una realización, Y es alcoxi C₁-C₃ (p. ej., OCH₃, OCH₂CH₃). En una realización, Y es haloalcoxi C₁-C₃ (p. ej., OCFH₂, OCF₂H, OCF₃, OCF₂CF₃). En una realización, Y es (alquil C₁-C₃)tio (p. ej., SCH₃, SCH₂CH₃). En una realización, Y es haloalquil(C₁-C₃)tio, (p. ej., SCFH₂, SCF₂H, SCF₃, SCF₂CF₃).

En algunas realizaciones, X es N o CY, en donde Y es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil(C₁-C₃)tio, o haloalquil(C₁-C₃)tio.

30 En algunas realizaciones, X es N o CY, en donde Y es H, halo o alquilo C₁-C₃. En algunas realizaciones, X es N o CY, en donde Y es H o halo. En algunas realizaciones, X es N o CY, en donde Y es H, F, Cl o Br. En algunas realizaciones, X es N o CY, en donde Y es H, F o Cl. En algunas realizaciones, X es N o CY, en donde Y es H o alquilo C₁-C₃. En algunas realizaciones, X es N o CY, en donde Y es H o CH₃. En algunas realizaciones, X es N o CY, en donde Y es H. En algunas realizaciones, X es N o CY, en donde Y es H, F, Cl, Br o CH₃. En algunas realizaciones, X es N o CY, en donde Y es H, F, Cl o CH₃. En algunas realizaciones, X es N o CY, en donde Y es H o F. En algunas realizaciones, X es N o CY, en donde Y es Br. En algunas realizaciones, X es N o CY, en donde Y es H. En algunas realizaciones, Y es H. En algunas realizaciones, Y es F. En algunas realizaciones, Y es Cl. En algunas realizaciones, Y es Br. En algunas realizaciones, Y es CH₃. En algunas realizaciones, Y es H, halo o alquilo C₁-C₃. En algunas realizaciones, Y es H o halo. En algunas realizaciones, Y es H, F, Cl o Br. En algunas realizaciones, Y es H, F o Cl. En algunas realizaciones, Y es H o alquilo C₁-C₃. En algunas realizaciones, Y es H o CH₃. En algunas realizaciones, Y es H, F, Cl, Br o CH₃. En algunas realizaciones, Y es H, F, Cl o CH₃. En algunas realizaciones, Y es H o F. En algunas realizaciones, Y es halo.

En una realización, R¹ es OR^{1'}.

En una realización, R^{1'} es H. En una realización, R^{1'} es alquilo C₁-C₈ (p. ej., metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo). En una realización, R^{1'} es arilalquilo C₇-C₁₀ (p. ej., bencilo).

45 En algunas realizaciones, R¹ es OR^{1'}, en donde R^{1'} es H o alquilo C₁-C₈. En algunas realizaciones, R¹ es OR^{1'}, en donde R^{1'} es H o arilalquilo C₇-C₁₀.

En algunas realizaciones, R¹ es OR^{1'}, en donde R^{1'} es H, metilo, etilo o bencilo. En algunas realizaciones, R¹ es OR^{1'}, en donde R^{1'} es H, metilo o etilo. En algunas realizaciones, R¹ es OR^{1'}, en donde R^{1'} es H o metilo. En algunas realizaciones, R¹ es OR^{1'}, en donde R^{1'} es H o bencilo.

50 En una realización, R² es halógeno (p. ej., F, Cl, Br, I). En una realización, R² es alquilo C₁-C₄ (p. ej., metilo, etilo,

- propilo, butilo). En una realización, R^2 es haloalquilo C_1-C_4 (p. ej., CFH_2 , CF_2H , CF_3 , CF_2CF_3). En una realización, R^2 es alqueno C_2-C_4 (p. ej., vinilo o etenilo, propenilo, butenilo). En una realización, R^2 es haloalqueno C_2-C_4 . En una realización, R^2 es alquino C_2-C_4 . En una realización, R^2 es haloalquino C_2-C_4 . En una realización, R^2 es alcoxi C_1-C_4 (p. ej., OCH_3 , OCH_2CH_3). En una realización, R^2 es haloalcoxi C_1-C_4 (p. ej., $OCFH_2$, OCF_2H , OCF_3 , OCF_2CF_3). En una realización, R^2 es alquil(C_1-C_4)tio (p. ej., SCH_3 , SCH_2CH_3). En una realización, R^2 es haloalquil(C_1-C_4)tio (p. ej., $SCFH_2$, SCF_2H , SCF_3 , SCF_2CF_3). En una realización, R^2 es amino. En una realización, R^2 es alquil C_1-C_4 amino. En una realización, R^2 es haloalquil C_2-C_4 amino. En una realización, R^2 es formilo. En una realización, R^2 es (alquil C_1-C_3)carbonilo. En una realización, R^2 es (haloalquil C_1-C_3)carbonilo. En una realización, R^2 es ciano.
- En una realización, R^2 es $-CR^{17}=CR^{18}-SiR^{19}R^{20}R^{21}$.
- En una realización, R^{17} es hidrógeno. En una realización, R^{17} es F. En una realización, R^{17} es Cl.
- En una realización, R^{18} es hidrógeno. En una realización, R^{18} es F. En una realización, R^{18} es Cl. En una realización, R^{18} es alquil C_1-C_4 . En una realización, R^{18} es haloalquil C_1-C_4 .
- En una realización, R^{19} es alquil C_1-C_{10} . En una realización, R^{19} es cicloalquil C_3-C_6 . En una realización, R^{19} es haloalquil C_1-C_{10} . En una realización, R^{19} es halocicloalquil C_3-C_6 . En una realización, R^{19} es fenilo. En una realización, R^{19} es fenilo sustituido. En una realización, R^{19} es alcoxi C_1-C_{10} . En una realización, R^{19} es OH.
- En una realización, R^{20} es alquil C_1-C_{10} . En una realización, R^{20} es cicloalquil C_3-C_6 . En una realización, R^{20} es haloalquil C_1-C_{10} . En una realización, R^{20} es halocicloalquil C_3-C_6 . En una realización, R^{20} es fenilo. En una realización, R^{20} es fenilo sustituido. En una realización, R^{20} es alcoxi C_1-C_{10} . En una realización, R^{20} es OH.
- En una realización, R^{21} es alquil C_1-C_{10} . En una realización, R^{21} es cicloalquil C_3-C_6 . En una realización, R^{21} es haloalquil C_1-C_{10} . En una realización, R^{21} es halocicloalquil C_3-C_6 . En una realización, R^{21} es fenilo. En una realización, R^{21} es fenilo sustituido. En una realización, R^{21} es alcoxi C_1-C_{10} . En una realización, R^{21} es OH.
- En algunas realizaciones, R^2 es halógeno, alqueno C_2-C_4 , haloalqueno C_2-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, o haloalquil(C_1-C_4)tio. En algunas realizaciones, R^2 es halógeno, alqueno C_2-C_4 , haloalqueno C_2-C_4 o alcoxi C_1-C_4 .
- En algunas realizaciones, R^2 es halógeno, alqueno C_2-C_4 , o alcoxi C_1-C_4 . En algunas realizaciones, R^2 es Cl, vinilo, o OCH_3 . En algunas realizaciones, R^2 es Cl. En algunas realizaciones, R^2 es vinilo. En algunas realizaciones, R^2 es OCH_3 .
- En una realización, R^3 es hidrógeno. En una realización, R^3 es alquil C_1-C_6 . En una realización, R^3 es haloalquil C_1-C_6 . En una realización, R^3 es alqueno C_3-C_6 . En una realización, R^3 es haloalqueno C_3-C_6 . En una realización, R^3 es alquino C_3-C_6 . En una realización, R^3 es hidroxi. En una realización, R^3 es alcoxi C_1-C_6 . En una realización, R^3 es haloalcoxi C_1-C_6 . En una realización, R^3 es formilo. En una realización, R^3 es (alquil C_1-C_3)carbonilo. En una realización, R^3 es (haloalquil C_1-C_3)carbonilo. En una realización, R^3 es (alcoxi C_1-C_6)carbonilo. En una realización, R^3 es (alquil C_1-C_6)carbamil. En una realización, R^3 es alquil C_1-C_6 sulfonilo. En una realización, R^3 es tri(alquil C_1-C_6)sililo. En una realización, R^3 es di(alquil C_1-C_6)fosfonilo.
- En una realización, R^4 es hidrógeno. En una realización, R^4 es alquil C_1-C_6 . En una realización, R^4 es haloalquil C_1-C_6 . En una realización, R^4 es alqueno C_3-C_6 . En una realización, R^4 es haloalqueno C_3-C_6 . En una realización, R^4 es alquino C_3-C_6 . En una realización, R^4 es hidroxi. En una realización, R^4 es alcoxi C_1-C_6 . En una realización, R^4 es haloalcoxi C_1-C_6 . En una realización, R^4 es formilo. En una realización, R^4 es (alquil C_1-C_3)carbonilo. En una realización, R^4 es (haloalquil C_1-C_3)carbonilo. En una realización, R^4 es (alcoxi C_1-C_6)carbonilo. En una realización, R^4 es (alquil C_1-C_6)carbamil. En una realización, R^4 es alquil C_1-C_6 sulfonilo. En una realización, R^4 es tri(alquil C_1-C_6)sililo. En una realización, R^4 es di(alquil C_1-C_6)fosfonilo.
- En una realización, R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo saturado de 5- miembros. En una realización, R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo saturado de 6- miembros.
- En una realización, R^3 y R^4 en conjunto representan $=CR^3R^4$.
- En una realización, R^3 es hidrógeno. En una realización, R^3 es alquil C_1-C_6 . En una realización, R^3 es alqueno C_3-C_6 . En una realización, R^3 es alquino C_3-C_6 . En una realización, R^3 es alcoxi C_1-C_6 . En una realización, R^3 es (alquil C_1-C_6)amino.
- En una realización, R^4 es hidrógeno. En una realización, R^4 es alquil C_1-C_6 . En una realización, R^4 es alqueno C_3-C_6 . En una realización, R^4 es alquino C_3-C_6 . En una realización, R^4 es alcoxi C_1-C_6 . En una realización, R^4 es (alquil C_1-C_6)amino.
- En una realización, R^3 y R^4 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo saturado de 5- miembros. En una realización, R^3 y R^4 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo saturado de 6- miembros.

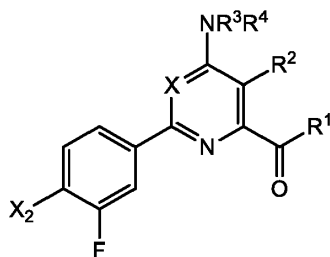
En algunas realizaciones, R^3 y R^4 son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_3-C_6 , haloalqueno C_3-C_6 , alquino C_3-C_6 , formilo, (alquil C_1-C_3)carbonilo, (haloalquil C_1-C_3)carbonilo, (alcoxi C_1-C_6)carbonilo, (alquil C_1-C_6)carbamilo, tri(alquil C_1-C_6)sililo. En algunas realizaciones, R^3 y R^4 en conjunto representan $=CR^3R^4$, en donde R^3 y R^4 son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_3-C_6 , alquino C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , o (alquil C_1-C_6)amino.

En algunas realizaciones, R^3 es H.

En algunas realizaciones, R^4 es H.

En una realización, Ar es Ar2.

En una realización, en la presente memoria se proporciona un compuesto de fórmula (I-2), o un N-óxido o una sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola:

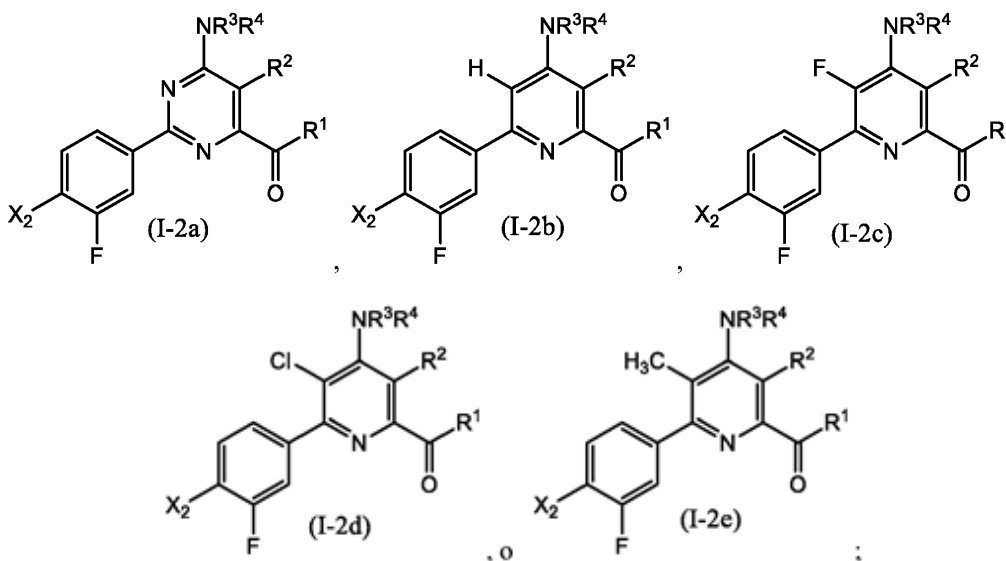


(I-2)

en donde X, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y X_2 se definen en la presente memoria en otra parte.

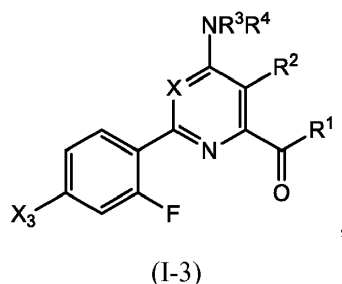
En una realización, en un compuesto de fórmula (I-2), R^1 es OH y R^2 es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-2), R^1 es OH y R^2 es alcoxi C_1-C_4 . En una realización, en un compuesto de fórmula (I-2), R^1 es OH y R^2 es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-2), R^1 es OH y R^2 es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-2), R^1 es -O-(alquilo C_1-C_4) y R^2 es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-2), R^1 es -O-(alquilo C_1-C_4) y R^2 es alcoxi C_1-C_4 . En una realización, en un compuesto de fórmula (I-2), R^1 es -O-(alquilo C_1-C_4) y R^2 es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-2), R^1 es -O-(alquilo C_1-C_4) y R^2 es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-2), R^1 es OCH₃ y R^2 es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-2), R^1 es OCH₃ y R^2 es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-2), R^1 es OCH₃ y R^2 es OCH₃.

En una realización, en la presente memoria se proporciona un compuesto de fórmula (I-2a), (I-2b), (I-2c), (I-2d) o (I-2e), o un N-óxido o una sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola:



en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y X_2 se definen en la presente memoria en otra parte.

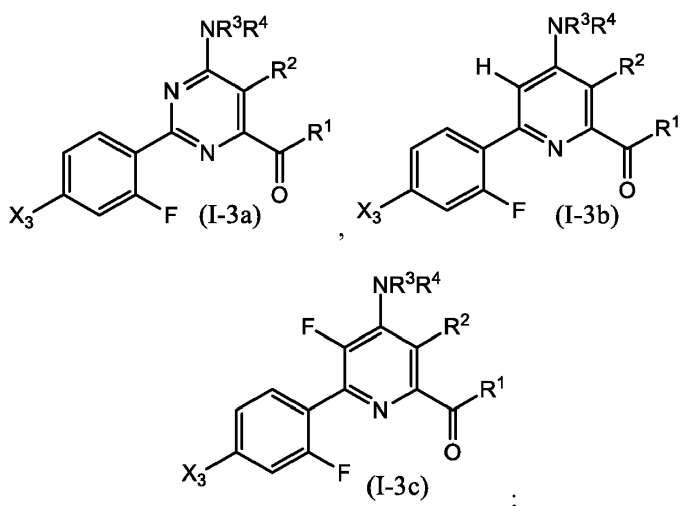
En una realización, en un compuesto de fórmula (I-2a), R^1 es OH y R^2 es F, Cl o Br. En una realización, en un



en donde X, R¹, R², R³, R⁴ y X₃ se definen en la presente memoria en otra parte.

En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3), R¹ es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

En una realización, en este documento se proporciona un compuesto de fórmula (I-3a), (I-3b) o (I-3c), o un N-óxido o una sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola:



en donde R¹, R², R³, R⁴ y X₃ se definen en la presente memoria en otra parte.

En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3a), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3a), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3a), R¹ es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3a), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3a), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3a), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3a), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3a), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

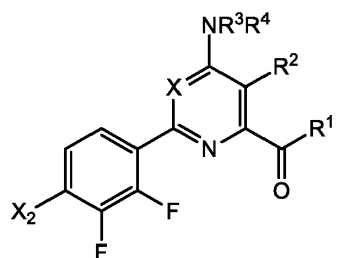
En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3b), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3c), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3c), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3c), R¹ es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3c), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3c), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es halógeno. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3c), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3c), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3c), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3c), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3c), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3c), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-3c), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

En una realización, Ar es Ar⁴.

En una realización, en la presente memoria se proporciona un compuesto de fórmula (I-4), o un N-óxido o una sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola:

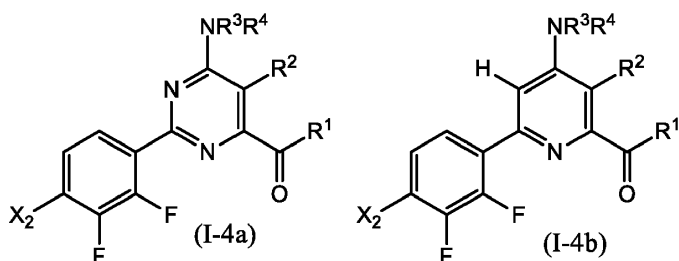


(I-4)

en donde X, R¹, R², R³, R⁴ y X₂ se definen en la presente memoria en otra parte.

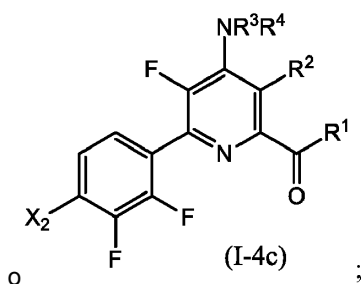
En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4), R¹ es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

En una realización, en la presente memoria se proporciona un compuesto de fórmula (I-4a), (I-4b), o (I-4c), o un N-óxido o una sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola:



(I-4a)

(I-4b)



en donde R¹, R², R³, R⁴ y X₂ se definen en la presente memoria en otra parte.

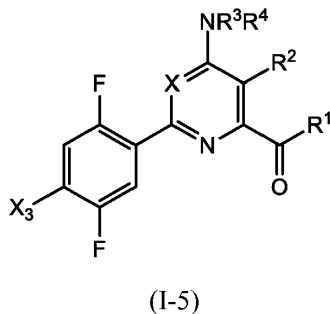
En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4a), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4a), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4a), R¹ es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4a), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4a), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4a), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4a), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4a), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4b), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4b), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4b), R¹ es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4b), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4b), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4b), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4b), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4b), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4b), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4b), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4b), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4b), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4c), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4c), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4c), R¹ es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4c), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4c), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4c), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4c), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4c), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4c), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4c), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4c), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-4c), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

En una realización, Ar es Ar⁵.

En una realización, en la presente memoria se proporciona un compuesto de fórmula (I-5), o un N-óxido o una sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola:

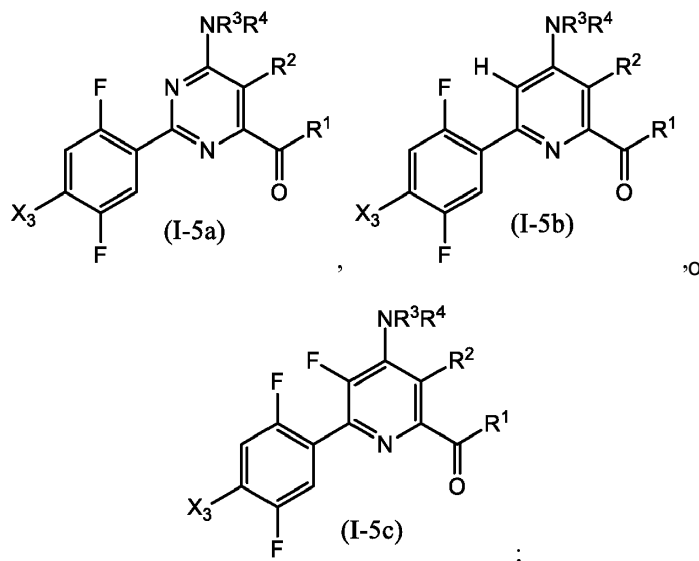


en donde X, R¹, R², R³, R⁴ y X₃ se definen en la presente memoria en otra parte.

En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5), R¹

es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

En una realización, en la presente memoria se proporciona un compuesto de fórmula (I-5a), (I-5b) o (I-5c), o un N-óxido o una sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola:



en donde R¹, R², R³, R⁴ y X₃ se definen en la presente memoria en otra parte.

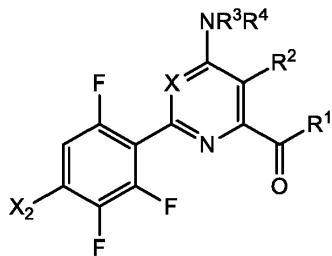
En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5a), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5a), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5a), R¹ es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5a), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5a), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5a), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5a), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5a), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5b), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5b), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5b), R¹ es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5b), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5b), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5b), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5b), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5b), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5b), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5b), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5b), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5b), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5c), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5c), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5c), R¹ es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5c), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5c), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5c), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5c), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5c), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5c), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5c), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5c), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-5c), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

En una realización, Ar es Ar6.

En una realización, en la presente memoria se proporciona un compuesto de fórmula (I-6), o un N-óxido o una sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola:

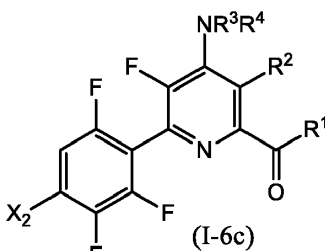
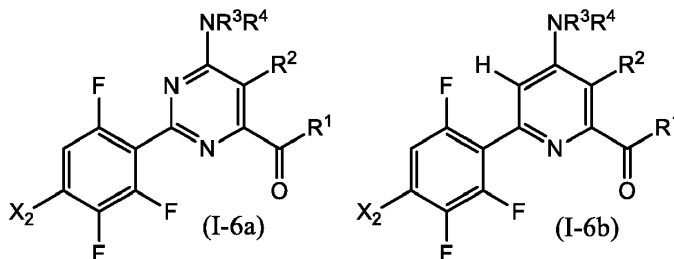


(I-6)

en donde X, R¹, R², R³, R⁴ y X₂ se definen en la presente memoria en otra parte.

En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6), R¹ es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

En una realización, en la presente memoria se proporciona un compuesto de fórmula (I-6a), (I-6b), o (I-6c), o un N-óxido o una sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola:



en donde R¹, R², R³, R⁴ y X₂ se definen en la presente memoria en otra parte.

En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6a), R¹ es OH y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6a), R¹ es OH y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6a), R¹ es OH y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6a), R¹ es OH y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6a), R¹ es -O-(alquilo C₁-C₄) y R² es OCH₃. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6a), R¹ es OCH₃ y R² es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6a), R¹ es OCH₃ y R² es alcoxi C₁-C₄. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6a), R¹ es OCH₃ y R² es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6a), R¹ es OCH₃ y R² es OCH₃.

En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6b), R^1 es OH y R^2 es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6b), R^1 es OH y R^2 es alcoxi C_1-C_4 . En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6b), R^1 es OH y R^2 es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6b), R^1 es OH y R^2 es OCH_3 . En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6b), R^1 es -O-(alquilo C_1-C_4) y R^2 es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6b), R^1 es -O-(alquilo C_1-C_4) y R^2 es alcoxi C_1-C_4 . En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6b), R^1 es -O-(alquilo C_1-C_4) y R^2 es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6b), R^1 es -O-(alquilo C_1-C_4) y R^2 es OCH_3 . En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6b), R^1 es OCH_3 y R^2 es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6b), R^1 es OCH_3 y R^2 es alcoxi C_1-C_4 . En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6b), R^1 es OCH_3 y R^2 es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6b), R^1 es OCH_3 y R^2 es OCH_3 .

En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6c), R^1 es OH y R^2 es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6c), R^1 es OH y R^2 es alcoxi C_1-C_4 . En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6c), R^1 es OH y R^2 es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6c), R^1 es OH y R^2 es OCH_3 . En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6c), R^1 es -O-(alquilo C_1-C_4) y R^2 es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6c), R^1 es -O-(alquilo C_1-C_4) y R^2 es alcoxi C_1-C_4 . En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6c), R^1 es -O-(alquilo C_1-C_4) y R^2 es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6c), R^1 es -O-(alquilo C_1-C_4) y R^2 es OCH_3 . En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6c), R^1 es OCH_3 y R^2 es F, Cl o Br. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6c), R^1 es OCH_3 y R^2 es alcoxi C_1-C_4 . En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6c), R^1 es OCH_3 y R^2 es Cl. En una realización, en un compuesto de fórmula (I-6c), R^1 es OCH_3 y R^2 es OCH_3 .

En una realización, X_2 es H. En una realización, X_2 es F. En una realización, X_2 es Br. En una realización, X_2 es I. En una realización, X_2 es etinilo. En una realización, X_2 es CH_3 . En una realización, X_2 es CFH_2 . En una realización, X_2 es CF_2H . En una realización, X_2 es CF_3 . En una realización, X_2 es OCF_2H . En una realización, X_2 es OCF_3 . En una realización, X_2 es CN. En una realización, X_2 es $CONH_2$. En una realización, X_2 es CO_2H . En una realización, X_2 es NO_2 .

En algunas realizaciones, X_2 es H, Br, I, etinilo, CH_3 , CF_2H , CF_3 , OCF_2H , o CN.

En algunas realizaciones, X_2 es H, F, Br, I, etinilo, CH_3 , CF_3 , OCF_2H , o CN.

En algunas realizaciones, X_2 es F. En algunas realizaciones, X_2 es Br o I.

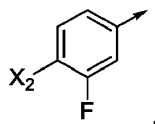
En una realización, X_3 es H. En una realización, X_3 es F. En una realización, X_3 es Br. En una realización, X_3 es I. En una realización, X_3 es etinilo. En una realización, X_3 es CH_3 . En una realización, X_3 es CFH_2 . En una realización, X_3 es CF_2H . En una realización, X_3 es CF_3 . En una realización, X_3 es OCF_2H . En una realización, X_3 es OCF_3 . En una realización, X_3 es CN. En una realización, X_3 es $CONH_2$. En una realización, X_3 es CO_2H . En una realización, X_3 es NO_2 .

En algunas realizaciones, X_3 es H, Br, I, etinilo, OCF_2H , CN o NO_2 .

En algunas realizaciones, X_3 es H, F, Br, I, CH_3 , CF_2H , CF_3 , OCF_2H , o CN.

En algunas realizaciones, X_3 es F o Cl. En algunas realizaciones, X_3 es Br o I.

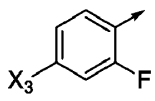
En una realización, cuando Ar es



en ese caso X es N, CH, CF, CCl o CCH_3 , con la condición de que:

- i) R^2 no es Cl, cuando X es N; y
- ii) X_2 no es Br, I o CF_3 , cuando R^2 es OCH_3 y X es CF.

En una realización, cuando Ar es

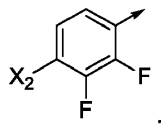


en ese caso X es N, CH o CF, con la condición de que:

- i) R^2 no es Cl, cuando X es N;

- ii) X_3 no es CH_3 , cuando R^2 es OCH_3 y X es N ;
- iii) X_3 no es H , F o CH_3 , cuando R^2 es Cl y X es CH ; y
- iv) X_3 no es Br o I , cuando R^2 es OCH_3 y X es CF .

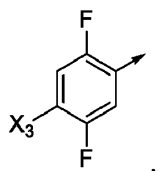
En una realización, cuando Ar es



en ese caso X es N , CH o CF , con la condición de que:

- i) R^2 no es Cl , cuando X es N ;
- ii) X_2 no es F , cuando R^2 es Cl y X es CH ; y
- iii) X_2 no es Br , I o CF_3 , cuando R^2 es OCH_3 y X es CF .

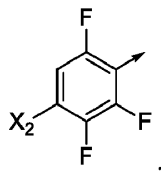
En una realización, cuando Ar es



en ese caso X es N , CH o CF , con la condición de que:

- i) X_3 no es CH_3 , cuando R^2 es Cl y X es N ; y
- ii) X_3 no es Br o I , cuando X es CF y R^2 es OCH_3 .

En una realización, cuando Ar es



en ese caso X es N , CH o CF .

Cualquiera de las combinaciones de Ar , X , Y , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , $\text{R}^{1'}$, $\text{R}^{1''}$, $\text{R}^{2'}$, R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^{20} , R^{21} , $\text{R}^{3'}$, $\text{R}^{4'}$, Ar_1 , Ar_2 , Ar_3 , Ar_4 , Ar_5 , Ar_6 , X_1 , X_2 y/o X_3 , y/o otros sustituyentes descritos en la presente memoria, están incluidos en esta descripción y se proporcionan específicamente en la presente memoria.

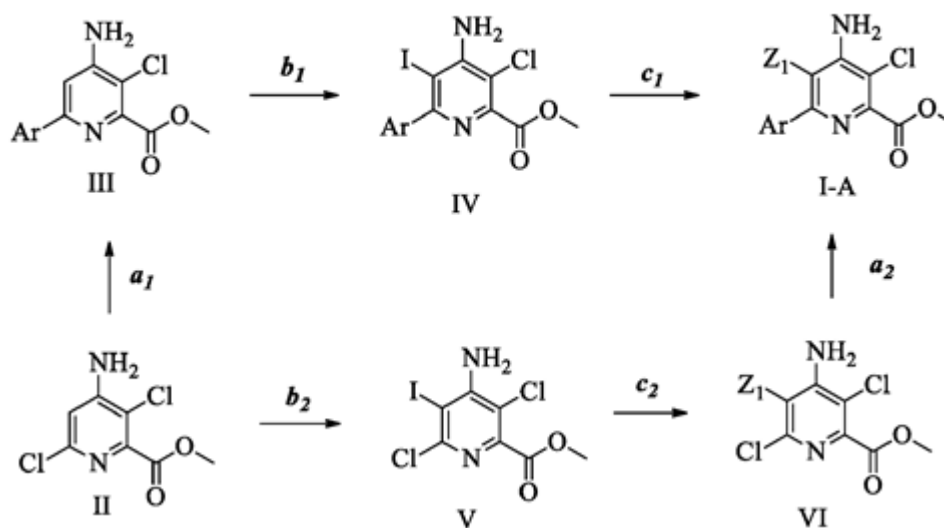
Métodos para preparar los compuestos

Los procedimientos ilustrativos para sintetizar los compuestos de Fórmula (I) se proporcionan a continuación.

Los ácidos 3,5-disustituídos-4-amino-6-(fenil opcionalmente sustituidos) picolínicos de Fórmula (I) se pueden preparar de varias maneras. Como se representa en el Esquema I, los 4-amino-6-cloropicolinatos de Fórmula (II) se pueden convertir en los picolinatos 4-amino-6-sustituídos de Fórmula (III), en donde Ar es como se define en la presente memoria, a través del acoplamiento de Suzuki con un ácido o éster borónico, en presencia de una base, tal como fluoruro de potasio, y un catalizador, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II), en una mezcla de disolventes próticos, polares, tal como acetonitrilo-agua, a una temperatura, tal como 110°C , p. ej., en un reactor de microondas (reacción a_1). Los picolinatos 4-amino-6-sustituídos de Fórmula (III) se pueden transformar en los picolinatos 5-yodo-4-amino-6-sustituídos de Fórmula (IV) a través de una reacción con reactivos de yodación, tal como ácido peryódico y yodo, en un disolvente prótico, polar, tal como alcohol metílico (reacción b_1). El acoplamiento de Stille de los picolinatos 5-yodo-4-amino-6-sustituídos de fórmula (IV) con un estano, tal como tetrametilestano, en presencia de un catalizador, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II), en un disolvente no reactivo, tal como 1,2-dicloroetano, a una temperatura, tal como 120 - 130°C , p. ej., en un reactor de microondas, proporciona 5-(sustituído)-4-amino-6-sustituído-picolinatos de Fórmula (I-A), en donde Z_1 es alquilo, alqueno, alquino, haloalqueno y alquiltio (reacción c_1).

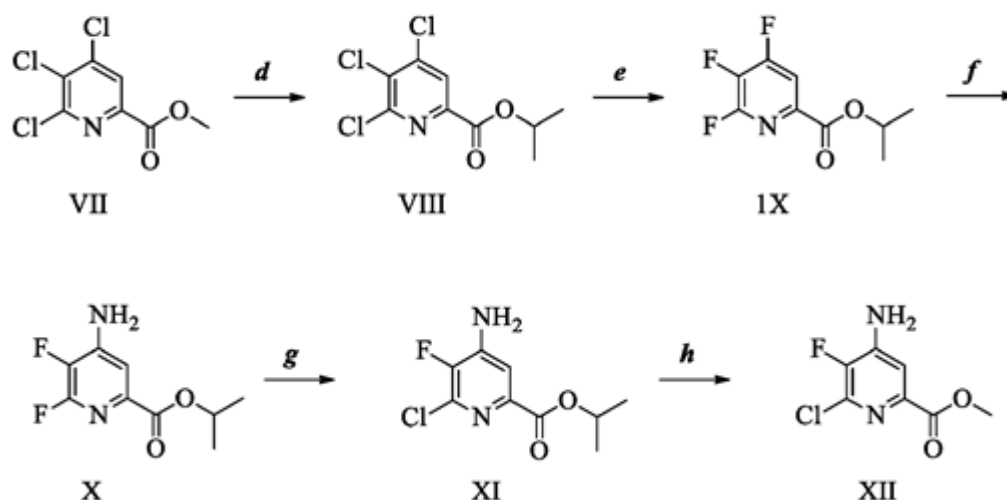
Alternativamente, los 4-amino-6-cloropicolinatos de Fórmula (II) pueden transformarse en los 5-yodo-4-amino-6-cloropicolinatos de Fórmula (V) mediante una reacción con reactivos de yodación, tal como ácido peryódico y yodo, en un disolvente prótico, polar, tal como alcohol metílico (reacción b_2). El acoplamiento de Stille de los 5-yodo-4-amino-6-cloropicolinatos de Fórmula (V) con un estano, tal como tetrametilestaño, en presencia de un catalizador, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II), en un disolvente no reactivo, como el 1,2-dicloroetano, a una temperatura, tal como 120-130°C, p. ej., en un reactor de microondas, proporciona 5-(sustituido)-4-amino-6-cloropicolinatos de fórmula (VI), en donde Z_1 es alquilo, alquénilo, alquinilo, haloalquénilo y alquiltio (reacción c_2). Los 5-sustituidos-4-amino-6-cloropicolinatos de Fórmula (VI) se pueden convertir en los 5-sustituido-4-amino-6-sustituido-picolinatos de Fórmula (IA), en donde Ar es como se define en la presente memoria, a través del acoplamiento de Suzuki con un ácido o éster borónico, en presencia de una base, tal como fluoruro de potasio, y un catalizador, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II), en una mezcla de disolventes próticos, polares, tal como acetonitrilo-agua, a una temperatura, tal como 110°C, p. ej., en un reactor de microondas (reacción a_2).

Esquema I



Como se representa en el Esquema II, el 4,5,6-tricloropicolinato de Fórmula (VII) se puede convertir en el correspondiente éster isopropílico de Fórmula (VIII), a través de una reacción con alcohol isopropílico y ácido sulfúrico concentrado, p. ej., a temperatura de reflujo en condiciones de Dean-Stark (reacción d). El éster isopropílico de Fórmula (VIII) se puede hacer reaccionar con una fuente de iones fluoruro, tal como fluoruro de cesio, en un disolvente aprótico, polar tal como dimetilsulfóxido (DMSO), a una temperatura, tal como 80°C, en condiciones de Dean-Stark, para producir el 4,5,6-trifluoropicolinato de isopropilo de Fórmula (IX) (reacción e). El 4,5,6-trifluoropicolinato de isopropilo de Fórmula (IX) se puede aminorar con una fuente de nitrógeno, tal como amoníaco, en un disolvente aprótico polar, tal como DMSO, para producir un 4-amino-5,6-difluoropicolinato de Fórmula (X) (reacción f). El sustituyente flúor en la posición 6 del 4-amino-5,6-difluoropicolinato de fórmula (X) se puede intercambiar por un sustituyente cloro mediante tratamiento con una fuente de cloruro, tal como cloruro de hidrógeno, p. ej., en dioxano, en un reactor Parr, a una temperatura, tal como 100°C, para producir un 4-amino-5-fluoro-6-cloro-picolinato de Fórmula (XI) (reacción g). El 4-amino-5-fluoro-6-cloropicolinato de Fórmula (XI) se puede transesterificar al correspondiente éster metílico de Fórmula (XII) mediante reacción con isopropóxido de titanio (IV) en alcohol metílico a temperatura de reflujo (reacción h).

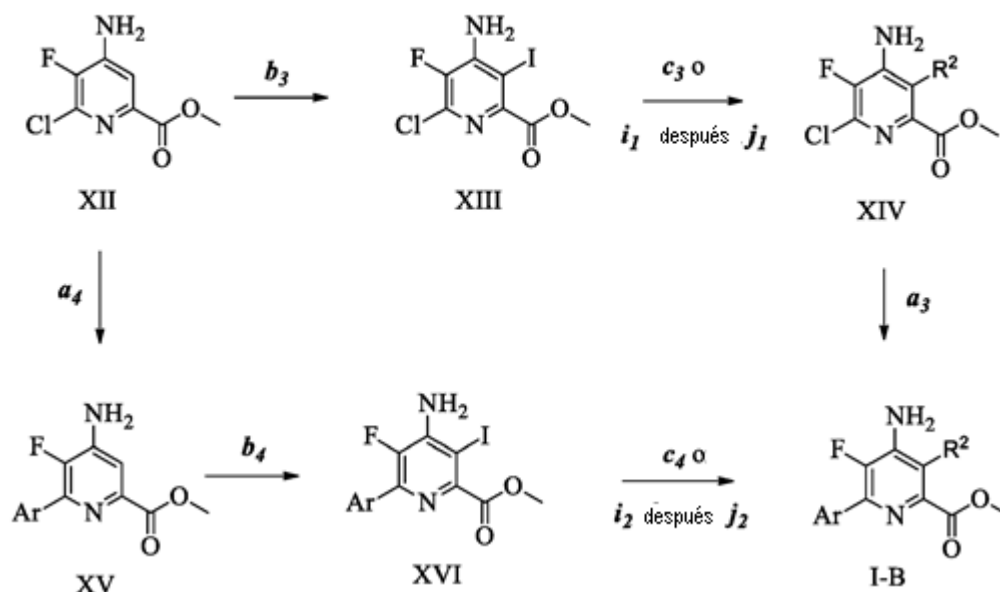
Esquema II



Como se representa en el Esquema III, el 4-amino-5-fluoro-6-cloropicolinato de Fórmula (XII) se puede transformar en el 3-yodo-4-amino-5-fluoro-6-cloropicolinato de Fórmula (XIII) mediante reacción con reactivos de yodación, tal como ácido peryódico y yodo, en un disolvente prótico, polar, tal como alcohol metílico (reacción *b*₃). El acoplamiento de Stille de los 3-yodo-4-amino-5-fluoro-6-cloropicolinatos de fórmula (XIII) con un estannano, tal como tributil(vinil)estannano, en presencia de un catalizador, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II), en un disolvente no reactivo, tal como el 1,2-dicloroetano, a una temperatura, tal como 120-130°C, p. ej., en un reactor de microondas, proporciona 3-(sustituido)-4-amino-5-fluoro-6-cloropicolinatos de fórmula (XIV), en donde R² es alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquenilo y alquiltio (reacción *c*₃). Alternativamente, los 3-yodo-4-amino-5-fluoro-6-cloropicolinatos de fórmula (XIII) se pueden tratar con carbonato de cesio y una cantidad catalítica de yoduro de cobre(I) y 1,10-fenantrolina en presencia de un disolvente prótico, polar, tal como alcohol metílico, a una temperatura, tal como 65°C, para proporcionar ácidos 3-(sustituido)-4-amino-5-fluoro-6-cloropicolínicos de fórmula (XIV), en donde R² es alcoxi o haloalcoxi (reacción *i*₁), que se pueden esterificar a los ésteres metílicos, p. ej., mediante tratamiento con cloruro de hidrógeno (gas) y alcohol metílico a 50°C (reacción *j*₁). Los 3-(sustituido)-4-amino-5-fluoro-6-cloropicolinatos de fórmula (XIV) se pueden convertir en los 4-amino-6-sustituidos-picolinatos de fórmula (I-B), en donde Ar es como se define en la presente memoria, a través del acoplamiento de Suzuki con un ácido o éster borónico, en presencia de una base, tal como fluoruro de potasio, y un catalizador, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II), en una mezcla de disolventes próticos, polares tal como acetonitrilo-agua, a una temperatura, tal como 110°C, p. ej., en un reactor de microondas (reacción *a*₃).

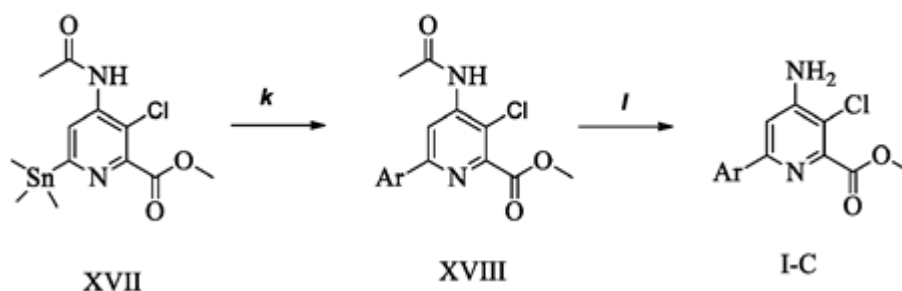
Alternativamente, los 4-amino-5-fluoro-6-cloropicolinatos de Fórmula (XII) se pueden convertir en los 4-amino-5-fluoro-6-sustituidos-picolinatos de Fórmula (XV), en donde Ar es como se define en la presente memoria, a través del acoplamiento de Suzuki con un ácido o éster borónico, en presencia de una base, tal como fluoruro de potasio, y un catalizador, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II), en una mezcla de disolventes próticos, polares, tal como acetonitrilo-agua, a una temperatura, tal como 110°C, p. ej., en un reactor de microondas (reacción *a*₄). Los 4-amino-5-fluoro-6-sustituido-picolinatos de Fórmula (XV) se pueden transformar en los 3-yodo-4-amino-5-fluoro-6-sustituido-picolinatos de Fórmula (XVI) a través de reacción con reactivos de yodación, tales como ácido peryódico y yodo, en un disolvente prótico, polar, tal como alcohol metílico (reacción *b*₄). El acoplamiento de Stille de los 3-yodo-4-amino-5-fluoro-6-sustituido-picolinatos de Fórmula (XVI) con un estannano, tal como tributil(vinil)estannano, en presencia de un catalizador, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II), en un disolvente no reactivo, tal como 1,2-dicloroetano, a una temperatura, tal como 120-130°C, p. ej., en un reactor de microondas, proporciona 3-(sustituido)-4-amino-5-fluoro-6-sustituido-picolinatos de Fórmula (I-B), en donde R² es alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquenilo y alquiltio (reacción *c*₄). Alternativamente, los 3-yodo-4-amino-5-fluoro-6-sustituido-picolinatos de Fórmula (XVI) se pueden tratar con carbonato de cesio y una cantidad catalítica de yoduro de cobre(I) y 1,10-fenantrolina en el presencia de un disolvente prótico, polar, tal como alcohol metílico, a una temperatura, tal como 65°C, para proporcionar ácidos 3-(sustituido)-4-amino-5-fluoro-6-sustituido-picolínicos de Fórmula (I-B), en donde R² es alcoxi o haloalcoxi (reacción *i*₂), que pueden ser esterificados a los ésteres metílicos, p. ej., mediante tratamiento con cloruro de hidrógeno (gas) y alcohol metílico, a una temperatura, tal como 50°C (reacción *j*₂).

Esquema III



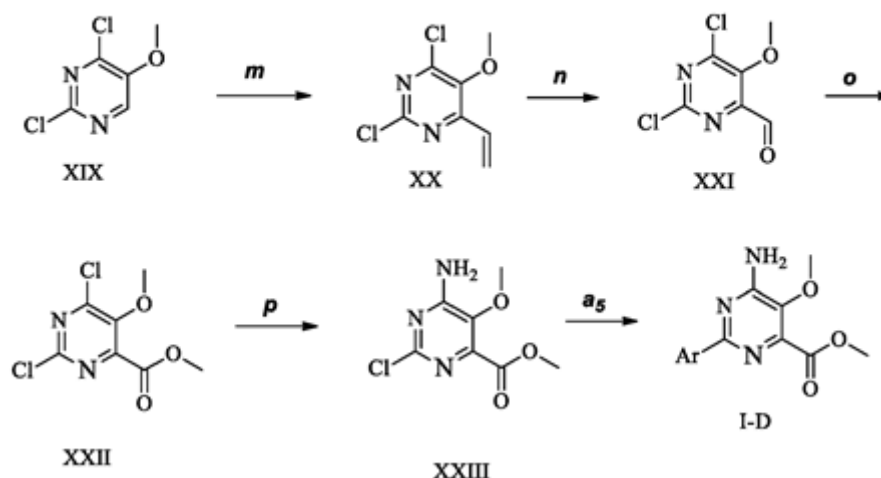
Como se representa en el Esquema IV, los 4-acetamido-6-(trimetilestannil)picolinatos de Fórmula (XVII) se pueden convertir en los 4-acetamido-6-sustituido-picolinatos de Fórmula (XVIII), en donde Ar es como se define en la presente memoria, a través del acoplamiento de Stille con bromuro de arilo o yoduro de arilo, en presencia de un catalizador, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II), en un disolvente, tal como 1,2-dicloroetano, p. ej., a temperatura de reflujo (reacción *k*). Los 4-amino-6-sustituido-picolinatos de Fórmula (IC), en donde Ar es como se define en la presente memoria, se pueden sintetizar a partir de 4-acetamido-6-sustituido-picolinatos de Fórmula (XVIII) a través de métodos de desprotección convencionales, tal como el gas de ácido clorhídrico en metanol (reacción *l*).

Esquema IV



Como se representa en el Esquema V, la 2,4-dicloro-5-metoxipirimidina (XIX) se puede transformar en 2,4-dicloro-5-metoxi-6-vinilpirimidina (XX) a través de una reacción con bromuro de vinil magnesio, en un disolvente aprótico polar, tal como tetrahydrofurano (reacción *m*). La 2,4-dicloro-5-metoxi-6-vinilpirimidina (XX) puede transformarse en 2,6-dicloro-5-metoxipirimidino-4-carboxaldehído (XXI) mediante tratamiento con ozono, p. ej., en una mezcla de disolvente de diclorometano: metanol (reacción *n*). El 2,6-dicloro-5-metoxipirimidino-4-carboxaldehído (XXI) puede transformarse en 2,6-dicloro-5-metoxipirimidina-4-carboxilato de metilo (XXII) mediante tratamiento con bromo, p. ej., en una mezcla de disolvente de metanol: agua (reacción *o*). El 2,6-dicloro-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (XXII) se puede transformar en 6-amino-2-cloro-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (XXIII) mediante tratamiento con amoníaco (p. ej., 2 equivalentes) en un disolvente, tal como DMSO (reacción *p*). Finalmente, se pueden preparar 6-amino-2-sustituido-5-metoxipirimidino-4-carboxilatos de Fórmula (ID), en donde Ar es como se define en la presente memoria, mediante el acoplamiento de Suzuki con un ácido o éster borónico, con 6-amino-2-cloro-5-metoxipirimidino-4-carboxilato (XXIII), en presencia de una base, tal como fluoruro de potasio, y un catalizador, tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio (II), en una mezcla de disolventes próticos, polares, tal como acetonitrilo-agua, a una temperatura, tal como 110°C, p. ej., en un reactor de microondas (reacción *a5*).

Esquema V



Los compuestos de Fórmulas I-A, I-B, I-C y I-D obtenidos por cualquiera de estos procedimientos, se pueden recuperar por medios convencionales y purificarse por procedimientos convencionales, tales como recrystalización o cromatografía. Los compuestos de Fórmula (I) se pueden preparar a partir de compuestos de Fórmulas I-A, I-B, I-C y I-D utilizando métodos convencionales bien conocidos en la técnica.

Composiciones y métodos

En algunas realizaciones, los compuestos proporcionados en la presente memoria se emplean en mezclas que contienen una cantidad eficaz como herbicida del compuesto junto con al menos un coadyuvante o portador aceptable desde el punto de vista agrícola. Los coadyuvantes o portadores ilustrativos incluyen aquellos que no son fitotóxicos o significativamente fitotóxicos para cultivos valiosos, p. ej., a las concentraciones empleadas en la aplicación de las composiciones para el control selectivo de malas hierbas en presencia de cultivos, y/o no reaccionan o reaccionan significativamente químicamente con los compuestos proporcionados en la presente memoria u otros ingredientes de la composición. Tales mezclas se pueden diseñar para aplicarse directamente a las malas hierbas o su lugar o pueden ser productos concentrados o formulaciones que se diluyen con portadores y coadyuvantes adicionales antes de la aplicación. Pueden ser sólidos, tales como, por ejemplo, espolvoreables, gránulos, gránulos dispersables en agua, o polvos mojables o líquidos, tales como productos concentrados o emulsionables, soluciones, emulsiones o suspensiones. También se pueden proporcionar como premezcla o mezclarse en un tanque.

Los coadyuvantes y portadores agrícolas adecuados que son útiles para preparar las mezclas herbicidas de la descripción son bien conocidos por los expertos en la técnica. Algunos de estos coadyuvantes incluyen, pero no se limitan a, producto concentrado de aceite de cultivo (aceite mineral (85%) + emulsionantes (15%)); producto etoxilado de nonilfenol; sal de amonio cuaternario de bencilcocoalquildimetilo; combinación de hidrocarburos de petróleo, ésteres alquílicos, ácido orgánico y tensioactivo aniónico; alquil(C₉-C₁₁)poliglicósido; producto etoxilado de alcohol fosfatado; producto etoxilado de alcohol primario natural (C₁₂-C₁₆); copolímero de bloques EO-PO de di-sec-butilfenol; polisiloxano con protección terminal de metilo; producto etoxilado de nonilfenol + urea - nitrato de amonio; aceite de semilla metilado emulsionado; producto etoxilado (8EO) de alcohol tridecílico (sintético); producto etoxilado (15 OE) de amina de sebo; dioleato-99 PEG (400).

Los portadores líquidos que se pueden emplear incluyen agua y disolventes orgánicos. Los disolventes orgánicos utilizados típicamente incluyen, pero no se limitan a, fracciones de petróleo o hidrocarburos tales como aceite mineral, disolventes aromáticos, aceites parafínicos y similares; aceites vegetales tales como aceite de soja, aceite de colza, aceite de oliva, aceite de ricino, aceite de semilla de girasol, aceite de coco, aceite de maíz, aceite de semilla de algodón, aceite de linaza, aceite de palma, aceite de cacahuete, aceite de cártamo, aceite de sésamo, aceite de tung y similares; ésteres de los aceites vegetales anteriores; ésteres de monoalcoholes o polihialcoholes dihidroxilados, trihidroxilados, u otros polialcoholes inferiores (que contienen 4-6 hidroxilos), tales como estearato de 2-etilhexilo, *n*-oleato de butilo, miristato de isopropilo, dioleato de propilenglicol, succinato de di-octilo, adipato de di-butilo, ftalato de di-octilo y similares; ésteres de ácidos mono-, di- y policarboxílicos y similares. Los disolventes orgánicos específicos incluyen tolueno, xileno, nafta de petróleo, aceite de cultivo, acetona, metil etil cetona, ciclohexanona, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etilo, acetato de amilo, acetato de butilo, monometil éter propilenglicol y monometil éter dietilenglicol, alcohol metílico, alcohol etílico, alcohol isopropílico, alcohol amílico, etilenglicol, propilenglicol, glicerina, *N*-metil-2-pirrolidinona, *N,N*-dimetilalquilamidas, dimetilsulfóxido, fertilizantes líquidos y similares. En algunas realizaciones, el agua es el portador para la dilución de los productos concentrados.

Los portadores sólidos adecuados incluyen talco, arcilla pirofilita, sílice, arcilla atapulgita, arcilla caolín, kieselguhr, tiza, tierra de diatomeas, cal, carbonato de calcio, arcilla bentonita, tierra de Fuller, cascotes de semilla de algodón, harina de trigo, harina de soja, piedra pómez, harina de madera, harina de cáscara de nuez, lignina, y similares.

En algunas realizaciones, se utilizan uno o más agentes tensioactivos en las composiciones de la presente descripción. Tales agentes tensioactivos se emplean, en algunas realizaciones, tanto en composiciones sólidas como líquidas, p. ej., aquellas diseñadas para ser diluidas con portador antes de la aplicación. Los agentes tensioactivos pueden ser de carácter aniónico, catiónico o no iónico y se pueden emplear como agentes emulsionantes, agentes humectantes, agentes de suspensión o para otros fines. Se describen tensioactivos utilizados convencionalmente en la técnica de formulación y que también pueden utilizarse en las presentes formulaciones, entre otros, en *McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual*, MC Publishing Corp., Ridgewood, New Jersey, 1998, y en *Encyclopedia of surfactants*, vol. I-III, Chemical Publishing Co., Nueva York, 1980-81. Los agentes tensioactivos típicos incluyen sales de alquil sulfatos, tales como laurilsulfato de dietanolamónio; sales de alquilarsulfonato, tales como dodecilsulfonato de calcio; productos de adición de óxido de alquifenol-alquilenos, tales como producto etoxilado de nonilfenol-C₁₈; productos de adición de óxido de alquilenol-alcohol, tales como producto etoxilado de alcohol tridecílico-C₁₆; jabones, tales como estearato de sodio; sales alquilnaftalensulfonato, tales como dibutilnaftalensulfonato de sodio; ésteres dialquílicos de sales sulfosuccinato, tales como di(2-etilhexil)sulfosuccinato de sodio; ésteres de sorbitol, tales como oleato de sorbitol; aminos cuaternarios, tales como cloruro de lauril trimetilamónio; ésteres de polietilenglicol de ácidos grasos, tales como estearato de polietilenglicol; copolímeros de bloque de óxido de etileno y óxido de propileno; sales de ésteres de mono- y dialquifosfato; aceites vegetales o de semillas, tales como aceite de soja, aceite de colza/canola, aceite de oliva, aceite de ricino, aceite de girasol, aceite de coco, aceite de maíz, aceite de semilla de lino, aceite de palma, aceite de cacahuete, aceite de cártamo, aceite de sésamo, aceite de tung y similares; y ésteres de los aceites vegetales anteriores, p. ej., ésteres metílicos.

A menudo, algunos de estos materiales, tales como los aceites vegetales o de semillas y sus ésteres, se pueden utilizar indistintamente como coadyuvante agrícola, como portador líquido o como agente tensioactivo.

Otros coadyuvantes utilizados comúnmente en composiciones agrícolas incluyen agentes compatibilizantes, agentes antiespumantes, agentes secuestrantes, agentes neutralizantes y tampones, inhibidores de la corrosión, colorantes, odorantes, agentes de propagación, auxiliares de la penetración, agentes adherentes, 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 de las plantas, fungicidas, insecticidas y similares, y se pueden formular con fertilizantes líquidos o portadores de fertilizantes sólidos en forma de partículas tales como nitrato de amonio, urea y similares.

La concentración de los ingredientes activos en las composiciones herbicidas de esta descripción es generalmente de aproximadamente 0,001 a aproximadamente 98 por ciento en peso. Con frecuencia se emplean concentraciones de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 90 por ciento en peso. En composiciones diseñadas para ser empleadas como productos concentrados, el ingrediente activo está generalmente presente en una concentración de aproximadamente 5 a aproximadamente 98 por ciento en peso, preferiblemente de aproximadamente 10 a aproximadamente 90 por ciento en peso. Tales composiciones se diluyen típicamente con un portador inerte, tal como agua, antes de la aplicación. Las composiciones diluidas usualmente aplicadas a las malas hierbas o al lugar de las malas hierbas generalmente contienen de aproximadamente 0,0001 a aproximadamente 1 por ciento en peso de ingrediente activo y preferiblemente contienen de aproximadamente 0,001 a aproximadamente 0,05 por ciento en peso.

Las presentes composiciones se pueden aplicar a las malas hierbas o su lugar mediante el uso de espolvoreadores, pulverizadores y aplicadores de gránulos terrestres o aéreos convencionales, por adición al agua riego o a inundación, y por otros medios convencionales conocidos por los expertos en la técnica.

En algunas realizaciones, los compuestos y composiciones descritos en la presente memoria se aplican como una aplicación de post-emergencia, aplicación de preemergencia, aplicación en agua a arrozales inundados o masas de agua (p. ej., estanques, lagos y arroyos), o aplicación con efecto de quemado.

En algunas realizaciones, los compuestos y composiciones proporcionados en la presente memoria se utilizan para controlar malas hierbas en cultivos, incluyendo, pero no limitados a, cítricos, manzanos, caucho, aceite, palma, silvicultura, arroz de siembra directa, de siembra en agua y transplantado, trigo, cebada, avena, centeno, sorgo, maíz/maíz dulce, pastos, praderas, pastizales, tierras de barbecho, césped, huertos de árboles y vides, cultivos acuáticos o en hileras, así como en entornos sin cultivos, p. ej., manejo de la vegetación industrial (IVM, en sus siglas en inglés) o servidumbre de paso. En algunas realizaciones, los compuestos y composiciones se utilizan para controlar plantas leñosas, malas hierbas de hoja ancha y cespitosa, o juncias.

En algunas realizaciones, los compuestos y composiciones proporcionados en la presente memoria se utilizan para controlar la vegetación no deseable en el arroz. En ciertas realizaciones, la vegetación no deseable es *Brachiaria platyphylla* (Groseb.) Nash (pasto bandera, BRAPP), *Digitaria sanguinalis* (L.) Scop. (pata de gallina, DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (L.) P. Beauv. (cerreig, ECHCG), *Echinochloa colonum* (L.) LINK (arrocillo silvestre, ECHCO),

Echinochloa oryzoides (Ard.) Fritsch (pasto de agua temprano, ECHOR), *Echinochloa oryzicola* (Vasinger) Vasinger (pasto de agua tardío, ECHPH), *Ischaemum rugosum* Salisb. (paja rugosa, ISCRU), *Leptochloa chinensis* (L.) Nees (cola china, LEFCH), *Leptochloa fascicularis* (Lam.) Gris (cola americana, LEFFA), *Leptochloa Panicoides* (Presl.) Hitchc. (cola amazónica, LEFPA), *Panicum dichotomiflorum* (L.) Michx. (falso maíz, PANDI), *Paspalum dilatatum* Poir. (heno leñoso, PASDI), *Cyperus difformis* L. (juncia de agua, CYPDI), *Cyperus esculentus* L. (chufa, CYPES), *Cyperus iria* L. (juncia de los arrozales, CYPIR), *Cyperus rotundus* L. (juncia real, CYPRO), *Eleocharis* sp. (ELOSS), *Fimbristylis miliacea* (L.) Vahl (fimbristylis menor, FIMMI), *Schoenoplectus juncooides* Roxb. (espadaña japonesa, SCPJU), *Schoenoplectus maritimus* L. (cirpo marino, SCPMA), *Schoenoplectus mucronatus* L. (junco de laguna, SCPMU), *Aeschynomene* sp., (jointvetch, AESSS), *Alternanthera philoxeroides* (Mart.) Griseb. (lagunilla, ALRPH), *Alisma plantago-aquatica* L. (plantago de agua común, ALSPA), *Amaranto* sp., (verdolagas y amarantos, AMASS), *Ammannia coccinea* Rottb. (amania, AMMCO), *Eclipta Alba* (L.) Hassk. (falsa margarita americana, ECLAL), *Heteranthera limosa* (SW.) Willd./Vahl (cucharilla, HETLI), *Heteranthera reniformis* R. & P. (buche de gallina, HETRE), *Ipomoea hederacea* (L.) Jacq. (dondiego de día trepador, IPOHE), *Lindernia dubia* (L.) Pennell (falsa pimpinela, LIDDU), *Monochoria korsakowii* Regel & Maack (monochoria, MOOKA), *Monochoria vaginalis* (Burm. F.) C. Presl ex Kuhth. (monochoria, MOOVA), *Murdannia nudiflora* (L.) Brenan (cangrejillo, MUDNU), *Polygonum pennsylvanicum* L. (poligono de Pennsylvania, POLPY), *Polygonum persicaria* L. (poligono peiguera, POLPE), *Polygonum hydropiperoides* Michx. (poligono tenue, POLHP), *Rotala indica* (Willd.) Koehne (rotala enana, ROTIN), *Sagittaria* sp., (punta de flecha, SAGSS), *Sesbania exaltata* (Raf.) Cory/Rydb. Ex Hill (cáñamo colorado, SEBEX), o *Sphenoclea zeylanica* Gaertn. (correhuela de los caminos, SPDZE).

En algunas realizaciones, los compuestos y composiciones proporcionados en la presente memoria se utilizan para controlar la vegetación no deseable en cereales. En ciertas realizaciones, la vegetación no deseable es *Alopecurus myosuroides* Huds. (cola de zorra, ALOMY), *Apera spica-venti* (L.) Beauv. (pasto de invierno, APESV), *Avena fatua* L. (avena loca, AVEFA), *Bromus tectorum* L. (arabueyes BROTE), *Lolium multiflorum* Justicia. (vallico italiano, LOLMU), *Phalaris minor* Retz. (alfarín, PHAMI), *Poa annua* L. (pastito de invierno, POAAN), *Setaria pumila* (Poir.) Roemer & J.A. Schultes (almorejo, SETLU), *Setaria viridis* (L.) Beauv. (almorejo verde, SETVI), *Cirsium arvense* (L.) Scop. (cardo cundidor, CIRAR), *Galium aparine* L. (amor de hortelano, GALAP), *Kochia scoparia* (L.) Schrad. (Kochia, KCHSC), *Lamium purpureum* L. (ortiga muerta, LAMPU), *Matricaria recutita* L. (manzanilla silvestre, PARTIDO), *Matricaria matricarioides* (Less.) Porter (manzanilla suave, MATMT), *Papaver rhoeas* L. (amapola común, PAPRH), *Polygonum convolvulus* L. (enredadera del trigo, POLCO), *Salsola tragus* L. (barrilla, SASKR), *Stellaria media* (L.) Vill. (pamplina común, STEME), *Veronica Persica* Poir. (verónica, VERPE), *Viola arvensis* Murr. (pensamiento silvestre, VIOAR), o *Viola tricolor* L. (violeta silvestre, VIOTR).

En algunas realizaciones, los compuestos y composiciones proporcionados en la presente memoria se utilizan para controlar la vegetación no deseable en el prado y el pasto. En ciertas realizaciones, la vegetación no deseable es *Ambrosia Artemisiifolia* L. (ambrosia común, AMBEL), *Casia obtusifolia* (casia falcada, CASOB), *Centaurea maculosa* auct. no lam. (centaurea moteada, CENMA), *Cirsium arvense* (L.) Scop. (cardo cundidor, CIRAR), *Convolvulus arvensis* L. (correhuela, CONAR), *Euphorbia esula* L. (lechetezna frondosa, EPHEs), *Lactuca serriola* L./Torn. (lechuga silvestre, LACSE), *Plantago lanceolata* L. (llantén menor, PLALA), *Rumex obtusifolius* L. (acedera, RUMOB), *Sida spinosa* L. (sida espinosa, SIDSP), *Sinapis arvensis* L. (mostaza silvestre, SINAR), *Sonchus arvensis* L. (cerraja, SONAR), *Solidago* sp. (vara de oro, SOOSS), *Taraxacum officinale* G.H. Weber ex Wiggers (diente de león, TAROF), *Trifolium repens* L. (trébol blanco, TRFRE), o *Urtica dioica* L. (ortiga común, URTDI).

En algunas realizaciones, los compuestos y composiciones proporcionados en la presente memoria se utilizan para controlar la vegetación no deseable encontrada en cultivos en hileras. En ciertas realizaciones, la vegetación no deseable es *Alopecurus myosuroides* Huds. (cola de zorra, ALOMY), *Avena fatua* L. (avena loca, AVEFA), *Brachiaria platyphylla* (Groseb.) Nash (pasto bandera, BRAPP), *Digitaria sanguinalis* (L.) Scop. (pata de gallina, DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (L.) P. Beauv. (cerreig, ECHCG), *Echinochloa colonum* (L.) Enlace (arrocillo silvestre, ECHCO), *Lolium multiflorum* Lam. (vallico italiano, LOLMU), *Panicum dichotomiflorum* Michx. (falso maíz, PANDI), *Panicum miliaceum* L. (mijo común, PANMI), *Setaria faberi* Herrm. (almorejo gigante, SETFA), *Setaria viridis* (L.) Beauv. (almorejo verde, SETVI), *Sorgo halepense* (L.) Pers. (cañota, SORHA), *Sorgo bicolor* (L.) Moench ssp. *Arundinaceum* (sorgo, SORVU), *Cyperus esculentus* L. (chufa, CYPES), *Cyperus rotundus* L. (juncia real, CYPRO), *Abutilon theophrasti* Medik (verbascos, ABUTH), *Amaranto* especies (verdolagas y amarantos, AMASS), *Ambrosia Artemisiifolia* L. (ambrosia común, AMBEL), *Ambrosia psilostachya* D.C. (ambrosia occidental, AMBPS), *Ambrosia trifida* L. (ambrosia gigante, AMBTR), *Asclepias syriaca* L. (algodoncillo común, ASCSY), *Chenopodium album* L. (cenizo, CHEAL), *Cirsium arvense* (L.) Scop. (cardo cundidor, CIRAR), *Commelina benghalensis* L. (comelina, COMBE), *Datura Estramonio* L. (estramonio, DATST), *Daucus carota* L. (zanahoria silvestre, DAUCA), *Euphorbia heterophylla* L. (flor de Pascua silvestre, EPHHL), *Erigeron bonariensis* L. (rama negra, ERIBO), *Erigeron canadensis* L. (erigeron canadiense, ERICA), *Helianthus annuus* L. (girasol común, HELAN), *Jacquemontia tamnifolia* (L.) Griseb. (dondiego de flores pequeñas, IAQTA), *Ipomoea hederacea* (L.) Jacq. (dondiego de día trepador, IPOHE), *Ipomoea lacunosa* L. (dondiego de día blanco, IPOLA), *Lactuca serriola* L./Torn. (lechuga silvestre, LACSE), *Portulaca oleracea* L. (verdolaga, POROL), *Sida spinosa* L. (sida espinosa, SIDSP), *Sinapis arvensis* L. (mostaza silvestre, SINAR), *Solanum ptychanthum* Dunal (belladona oriental, SOLPT), o *Xanthium strumarium* L. (cadillo común, XANST).

En algunas realizaciones, las tasas de aplicación de aproximadamente 1 a aproximadamente 4,000 gramos/hectárea (g/ha) se emplean en operaciones de post-emergencia. En algunas realizaciones, se emplean tasas de

aproximadamente 1 a aproximadamente 4.000 g/ha en operaciones de preemergencia.

En algunas realaciones reales, los compuestos y métodos proporcionados en la presente memoria se utilizan junto con uno o más herbicidas diferentes para controlar una variedad más amplia de vegetación no deseable. Cuando se utilizan junto con otros herbicidas, los compuestos actualmente reivindicados pueden formularse con el otro herbicida o herbicidas, mezclarse en el tanque con el otro herbicida o herbicidas o aplicarse secuencialmente con el otro herbicida o herbicidas. Algunos de los herbicidas que se pueden emplear junto con los compuestos de la presente descripción incluyen: 4-CPA, 4-CPB, 4-CPP, 2,4-D, sal de colina 2,4-D, ésteres y aminas de 2,4-D, 2,4-DB, 3,4-DA, 3,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 3,4-DP, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, acetoclor, acifluorfen, aclonifen, acroleína, alaclor, allidoclor, aloxidim, alcohol alílico, alorac, ametrídiona, ametrin, amibuzin, amicarbazona, amidosulfuron, aminociclopiraclor, aminopirialid, amiprofos-metilo, amitrol, sulfamato de amonio, anilofos, anisuron, asulam, atraton, atrazina, azafenidina, azimsulfuron, aziprotina, barban, BCPC, beflubutamid, benazolin, bencarbazona, benfluralin, benfuresato, bensulfuron-metilo, bensulida, bentiocarb, bentazon-sodio, benzadox, benzfendizona, benzipram, benzobiclon, benzofenap, benzo-fluor, benzoilprop, benztiázuron, biciclopirona, bifeno, bilanafos, bispiribac-sodio, bórax, bromacilo, bromobonilo, bromobutida, bromofenoxima, bromoxinil, brompirazon, butaclor, butafenacilo, butamifos, butenaclor, butidazol, butiuron, butralin, butoxidim, buturon, butilato, ácido cacodílico, cafenstrole, clorato cálcico, calcio cianamida, cambendiclor, carbasulam, carbetamida, carboxazola, clorprocab, carfentrazona-etilo, CDEA, CEPC, clometoxifen, cloramben, cloranocril, clorazifop, clorazina, clorbromuron, clorbufam, cloreturon, clorfenac, clorfenprop, clorflurazol, clorflurenol, cloridazon, clorimuron, clornitrofen, cloropon, clorotoluron, cloro-xuron, cloroxinil, clorprofam, clorsulfuron, clortal, clortiamid, cinidon-etilo, cinmetilin, cinosulfuron, cisanilida, cletodim, cliodinato, clodinafop-propargilo, clofop, clomazona, clomeprop, cloprop, cloproxi-dim, clopiralid, cloransulam-metilo, CMA, sulfato de cobre, CPMF, CPPC, credazina, cresol, cumiluron, cianatrin, cianazina, cicloato, ciclosulfamuron, cicloxi-dim, cicluron, cihalofop-butilo, ciperquat, ciprazina, ciprazol, cipromid, daimuron, dalapon, dazomet, delaclor, desmedifam, desmetrin, di-alato, dicamba, diclobenil, dicloralurea, diclormato, diclorprop, diclorprop-P, diclofop, diclosulam, dietamquat, dietatil, difenopenteno, difenoxuron, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, dimefurón, dimepiperato, dimetaclor, dimetametrin, dimetenamida, dimetenamida-P, dimexano, dimidazon, dinitramina, dinofenato, dinoprop, dinosam, dinoseb, dinoterb, difenamid, dipropetrin, diquat, disul, ditiopir, diuron, DMPA, DNOC, DSMA, EBEP, eglina-zina, endotal, epronaz, EPTC, erbon, esprocarb, etalfuralin, etbenzamida, etamsulfuron, etidmuron, etiolato, etobenzamid, etobenzamid, etofumesato, etoxifeno, etoxisulfuron, etinofen, etipromid, etobenzanid, EXD, fenasulam, fenoprop, fenoxaprop, fenoxaprop-P-etilo, feno-zaprop-P-etilo + isoxadifen-etilo, fenoxasulfona, fenteracol, fentiaprop, fentrazamida, fenuron, sufato ferrico, flamprop, framprop-M, flazasulfuron, florasulam, fluazifop, fluazifop-P-butilo, fluazolato, flucarbazona, flucetosulfuron, fluclo-ralin, flufenacet, flufenican, flufenpir-etilo, flumetsulam, flumezin, flumiclorac-pentilo, flumioxazin, flumipropin, fluometuron, fluorodifen, fluoroglicofen, fluoromidina, fluoronitrofen, fluotiuron, flupoxam, flupropacil, flupropanato, flupirsulfuron, fluridona, flurocloridona, fluroxipir, flurtamone, fluti-acet, fomesafen, foramsulfuron, fosamina, furiloxifen, glufosinato, glufosinato-amonio, glifosato, halosafen, halosulfuron-metilo, halo-xidina, halo-xifop-metilo, halo-xifop-P-metilo, halo-xifen-metilo, hexachloroacetona, hexafluorato, hexazinona, imazametabenz, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquin, imazetapir, imazosulfuron, indanofan, indaziflam, yodobonilo, iodometano, iodosulfuron, iofensulfuron, ioxinil, ipazina, ipfencarbazona, iprimidam, isocarbamid, isocil, isometiozin, isonoruron, isopolinato, isopropalin, isopro-turon, isouron, isoxaben, isoxaclortol, isoxaflutol, isoxapirifop, karbutilato, ketospiradox, lactofen, lenacilo, linuron, ésteres y aminas de MAA, MAMA, MCPA, MCPA-tioetil, MCPB, mecoprop, mecoprop-P, medinoterb, mefenacet, mefluidia, mesoprazina, mesosulfuron, mesotriona, metam, metamifop, metamitron, metazaclo-r, metazosulfuron, metflurazon, metabenztiázuron, metapropalin, metazol, metiobencarb, metiozolin, metiuron, metometon, metoprotina, bromuro de metilo, isotiocianato de metilo, metildimron, metobenzuron, metobromuron, metola-clor, metosulam, metoxuron, metribuzina, metsulfuron, molinato, monalida, monisouron, ácido monocloroacético, monolinuron, monuron, morfamquat, MSMA, napro-anilida, napropamida, napropamida-M, naptalam, neburon, nicosulfuron, nipraclofen, nitratin, nitrofen, nitrofluorfen, norflurazon, noruron, OCH, orben-carb, orto-diclorobenceno, ortosulfamuron, orizalina, oxadiargilo, oxadiazon, oxapirazon, oxasulfuron, oxaziclomefona, oxifluorfen, paraflufen-etilo, parafluron, paraquat, pebulato, ácido pelargonico, pendimetalin, penoxsulam, pentaclofenol, pentanoclor, pentoxazona, perfluoridona, petoxamida, fenisofam, fenmedifam, fenmedifm-etilo, fenobenzuron, acetato fenilmercurio, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperofos, arsenito potásico, azida de potasio, cianato potásico, pretilaclor, primisulfuron-metilo, prociazina, prodiamina, proflua-zol, profluralin, profoxidim, proglina-zina, prohexadona-calcio, prometon, prometrin propa-clor, propanil, propaquiza-fop, propazina, profam, propiso-clor, propoxicarbazona, propirisulfuron, propizamida, prosulfalin, prosulfocar-b, prosulfuron, proxan, prina-clor, pidanon, piraclo-nil, piraf-lufen, pirasulfoto-l, pirazogil, pirazolino, pirazosulfuron-etilo, pirazoxifen, piribenzoxim, piributicarb, piclor, piridafol, piridato, piriftalida, piriminobac, pirimisulfan, piritiobac-metilo, piroxasulfona, quinclo-rac, quinmerac, quinclomacina, quinonamida, quizalo-fop, quizalo-fop-P-etilo, rodetanil, rimsulfuron, saflufenacil, S-metola-clor, sebutilazina, secbumeton, setoxidim, siduron, simazina, simeton, simetrin, SMA, arsenito de sodio, azida de sodio, clorato de sodio, sulcotriona, sulfato, sulfentrazona, sulfometuron, sulfosato, sulfosulfuron, ácido sulfúrico, sulglicapin, swep, TCA, tebutam, tebutiuron, tefuri-triona, tembotriona, tepraloxidim, terbacil, terbu-carb, terbu-clor, terbumeton, terbutilazina, terbutrina, tetrafluron, tenil-clor, tiazafluron, tiazopir, tiadizimina, tiadiazuron, tiencarbazona-metilo, tifensulfuron, tiobencarb, tiocarbazil, tioclorin, topramezona, tralkoxidim, triafmona, tri-alato, triasulfuron, triaziflam, tribenuron, tricamba, ésteres y aminas de tri-cloropir, trifidano, trietazina, trifloxisulfuron, trifluralin, triflusulfuron, trifop, trifopsima, trihidroxitriazina, trimeturon, tripripindan, tritac, tritosulfuron, vernolato y xila-clor.

Los compuestos y composiciones de la presente descripción se pueden emplear generalmente en combinación con agentes protectores de herbicidas conocidos, tales como benoxacor, bentiocarb, brassinolida, cloquintocet (p. ej., mexilo), ciometrinil, daimuron, diclormid, diclonon, dimepiperato, disulfoton, fenclorazol-etilo, fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, proteínas harpin, isoxadifen-etilo, mefenpir-dietilo, MG 191, MON 4660, anhídrido naptalico (NA), oxabetrinil, R29148 y amidas de ácido *n*-fenilsulfonilbenzoico, para mejorar su selectividad.

Los compuestos, composiciones y métodos descritos en la presente memoria se utilizarán para controlar la vegetación no deseable en cultivos tolerantes al glifosato, tolerantes al glufosinato, tolerantes a dicamba, tolerantes fenoxi auxina, tolerantes piridiloxi auxina, tolerantes ariloxifenoxipropionato, tolerantes a inhibidores de acetil CoA carboxilasa (ACCase), tolerantes a la imidazolinona, tolerantes a inhibidores de acetolactato sintasa (ALS), tolerantes a inhibidores 4-hidroxifenil-piruvato dioxigenasa (HPPD), tolerantes a inhibidores protoporfirínogeno oxidasa (PPO), tolerantes a triazina, y tolerantes bromoxinil (tales como, pero no limitados a, soja, algodón, canola/colza oleaginosa, arroz, cereales, maíz, césped, etc), por ejemplo, junto con glifosato, glufosinato, dicamba, fenoxi auxinas, piridiloxi auxinas, ariloxifenoxipropionatos, inhibidores de ACCase, imidazolinonas, inhibidores de ALS, inhibidores de HPPD, inhibidores de PPO, triazinas y bromoxinil. Las composiciones y los métodos se pueden utilizar para controlar la vegetación no deseable en cultivos que poseen rasgos múltiples o acumulados que confieren tolerancia a múltiples compuestos químicos y/o inhibidores de múltiples modos de acción.

Los compuestos y composiciones proporcionados en la presente memoria también se pueden emplear para controlar malas hierbas resistentes o tolerantes a herbicidas. Las malas hierbas resistentes o tolerantes ilustrativas incluyen, pero no se limitan a, biotipos resistentes o tolerantes a inhibidores de acetolactato sintasa (ALS), inhibidores del fotosistema II, inhibidores de acetil CoA carboxilasa (ACCase), auxinas sintéticas, inhibidores del fotosistema I, inhibidores de 5-enolpiruvilshikato-3-fosfato (EPSP) sintasa, inhibidores del ensamblaje de microtúbulos, inhibidores de la síntesis de lípidos, inhibidores de protoporfirínógeno oxidasa (PPO), inhibidores de la biosíntesis de carotenoides, inhibidores de los ácidos grasos de cadena muy larga (VLCFA), inhibidores de fitoeno desaturasa (PDS), inhibidores de glutamina sintetasa, inhibidores de 4-hidroxifenil-piruvato-dioxigenasa (HPPD), inhibidores de la mitosis, inhibidores de la biosíntesis de la celulosa, herbicidas con múltiples modos de acción tales como quinclorac y herbicidas no clasificados tales como los ácidos arilaminopropiónicos, difenzoquat, endotal y organoarsenicos. Las malas hierbas resistentes o tolerantes ilustrativas incluyen, pero no se limitan a, biotipos con resistencia o tolerancia a múltiples herbicidas, múltiples clases de compuestos químicos y múltiples modos de acción de herbicidas.

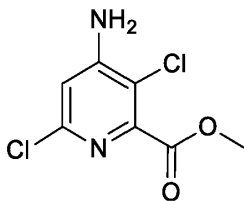
Las realizaciones descritas y los siguientes ejemplos son para fines ilustrativos.

Ejemplos

Síntesis de precursores

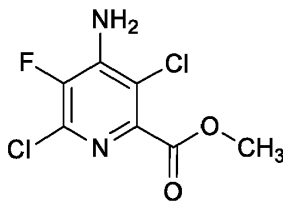
Consideraciones generales: los espectros de flúor se adquirieron a 376 MHz en un espectrómetro Bruker DRX400. Los espectros fueron referenciados a triclorofluorometano (CFCl₃) como un patrón externo y se realizaron típicamente con desacoplamiento de protones.

Ejemplo 1: Preparación de 4-amino-3,6-dicloropicolinato de metilo (Compuesto principal A)



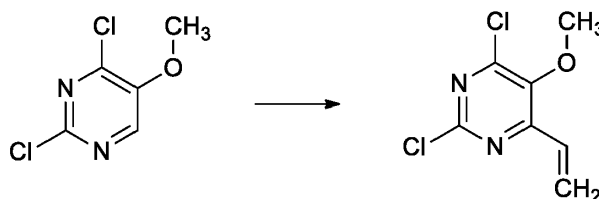
Preparado como se describe en Fields et al., documento WO 2001051468 A1.

Ejemplo 2: Preparación de 4-amino-3,6-dicloro-5-fluoropicolinato de metilo (Compuesto principal B)



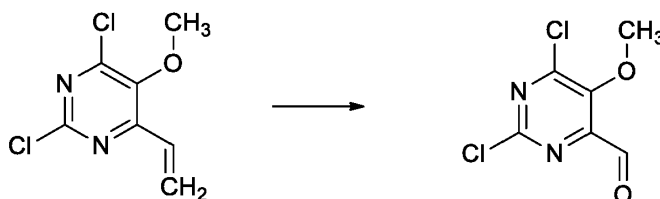
Preparado como se describe en Fields et al., *Tetrahedron Letters* 2010, 51, 79-81.

Ejemplo 3: Preparación de 2,6 dicloro-5-metoxi-4-vinil pirimidina



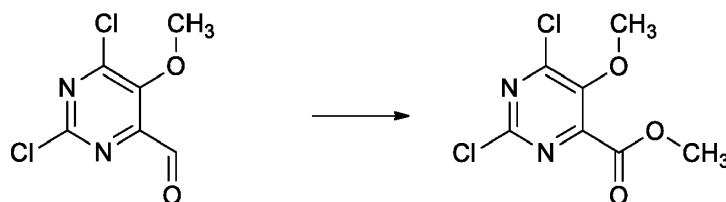
A una solución de 2,6-dicloro-5-metoxi-pirimidina disponible en el mercado (100 gramos (g), 0,55 moles (mol) en tetrahidrofurano seco se añadió gota a gota bromuro de vinil magnesio 1 molar (M) en disolvente de tetrahidrofurano (124 g, 0,94 moles) durante una hora (h) a temperatura ambiente. La mezcla se agitó a continuación durante 4 h a temperatura ambiente. El exceso de reactivo de Grignard se sofocó mediante la adición de acetona (200 mililitros (mL)) mientras que la temperatura de la mezcla se mantuvo a una temperatura por debajo de 20°C. Después de eso, se añadió 2,3-dicloro-5,6-diciano-p-benzoquinona (DDQ; 151 g, 0,67 moles) de una vez y se agitó durante la noche. Precipitó un sólido de color amarillo. El sólido se filtró y se lavó con acetato de etilo (500 mL). El producto filtrado se concentró a presión reducida y el compuesto bruto resultante se diluyó con acetato de etilo (2 litros (L)). El semisólido oscuro no disuelto resultante se separó por filtración utilizando acetato de etilo. Se concentró adicionalmente a presión reducida para proporcionar un compuesto bruto, que se purificó por cromatografía en columna. El compuesto se hizo eluir con una mezcla de acetato de etilo en hexanos del 5% al 10% para proporcionar el compuesto del título (70 g, 60%):*mp* 60-61°C; RMN ¹H (CDCl₃) δ 3,99 (s, 3H), 5,85 (d, 1H), 6,75 (d, 1H), 6,95 (dd, 1H).

Ejemplo 4: Preparación de 2,6-dicloro-5-metoxi-pirimidino-4-carbaldehído



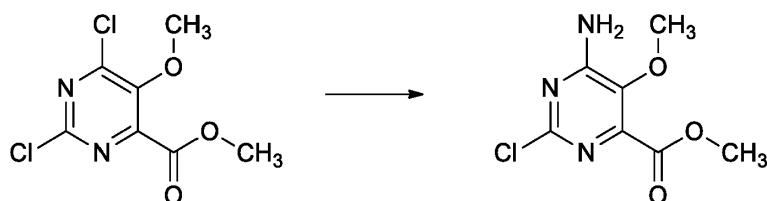
Una solución de 2,6-dicloro-5-metoxi-4-vinil pirimidina (50 g, 0,24 moles) en diclorometano:metanol (4:1,2 L) se enfrió a -78°C. Se burbujeó gas ozono durante 5 h. La reacción se sofocó con sulfuro de dimetilo (50 mL). La mezcla se calentó lentamente a temperatura ambiente y se concentró a presión reducida a 40°C para proporcionar el compuesto del título (50,5 g, 100%).

Ejemplo 5: Preparación de 2,6-dicloro-5-metoxi-pirimidino-4-carboxilato de metilo



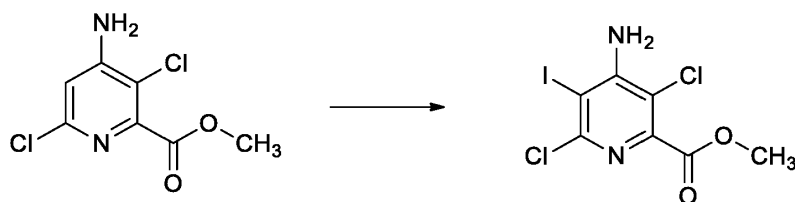
Se preparó una solución de 2,6-dicloro-5-metoxi-pirimidino-4-carbaldehído (50 g, 0,24 moles) en metanol (1 L) y agua (60 mL). A la solución se le añadió bicarbonato de sodio (400 g). Se añadió gota a gota una solución 2 M de bromo (192 g, 1,2 moles) en metanol/agua (600 mL, 9:1 v/v) a la solución de pirimidina durante 45 minutos (min) a 0°C mientras se agitaba la mezcla. La agitación se continuó a la misma temperatura durante 1 h. Más tarde, la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 h. Mientras se agitaba, la mezcla de reacción se vertió posteriormente en una mezcla de hielo triturado (2 L), bisulfito de sodio (50 g) y cloruro de sodio (NaCl; 200 g). El producto se extrajo con acetato de etilo (1 L x 2) y la capa orgánica combinada se secó sobre sulfato de sodio (Na₂SO₄) y se filtró. La evaporación del disolvente a presión reducida produjo un material espeso, que se solidificó tras un reposo prolongado para proporcionar el compuesto del título (50,8 g, 87%): ESIMS *m/z* 238 ([M + H]⁺).

Ejemplo 6: Preparación de 6-amino-2-cloro-5-metoxi-pirimidino-4-carboxilato de metilo (Compuesto principal C)



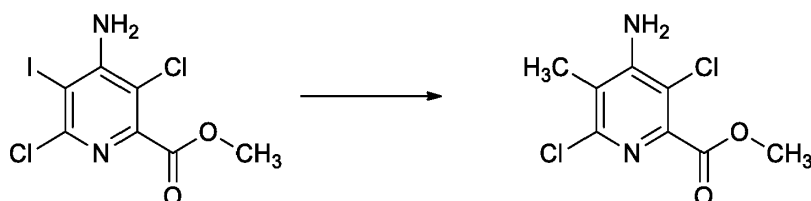
Se preparó una solución de 2,6-dicloro-5-metoxi-pirimidino-4-carboxilato de metilo (25 g, 0,1 moles) y dimetilsulfóxido (DMSO). A esta solución se le añadió, una solución de amoníaco (2 equivalentes (equiv.)) a 0-5°C en DMSO. Esta mezcla se agitó a la misma temperatura de 0-5°C durante 10 a 15 min. Más tarde, la mezcla se diluyó con acetato de etilo y el sólido resultante se retiró por filtración. El filtrado de acetato de etilo se lavó con una solución de salmuera y se secó sobre Na₂SO₄. Tras la concentración, se obtuvo el producto bruto. El producto bruto se agitó en una cantidad mínima de acetato de etilo y se filtró para obtener el compuesto puro. Se obtuvo compuesto puro adicional a partir del filtrado que, después de la concentración, se purificó por cromatografía instantánea. Esto proporcionó del título (11 g, 50%): pf 158°C; RMN H¹ (DMSO-*d*₆) δ 3,71 (s, 3H), 3,86 (s, 3H), 7,65 (s ancho, 1H), 8,01 (s ancho, 1H).

Ejemplo 7: Preparación de 4-amino-3,6-dicloro-5-yodopicolinato de metilo



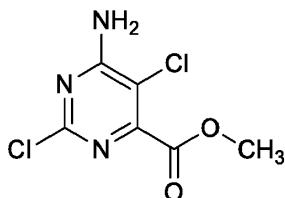
Se disolvió 4-amino-3,6-dicloropicolinato de metilo (10,0 g, 45,2 mmoles), ácido peryódico (3,93 g, 17,2 milimoles (mmoles)) y yodo (11,44 g, 45,1 mmoles) en metanol (30 mL) y se agitó a reflujo a 60°C durante 27 h. La mezcla de reacción se concentró, se diluyó con éter dietílico y se lavó dos veces con bisulfito sódico acuoso saturado. Las capas acuosas se extrajeron una vez con éter dietílico y las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na₂SO₄ anhidro. El producto se concentró y se purificó por cromatografía instantánea (gel de sílice; acetato de etilo/hexanos 0-50%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color amarillo pálido (12,44 g, 79%): pf 130,0-131,5°C; RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 5,56 (s, 2H), 3,97 (s, 3H); RMN C¹³ (101 MHz, CDCl₃) δ 163,80, 153,00, 152,75, 145,63, 112,12, 83,91, 53,21; EIMS *m/z* 346.

Ejemplo 8: Preparación de 4-amino-3,6-dicloro-5-metilpicolinato de metilo (Compuesto principal D)



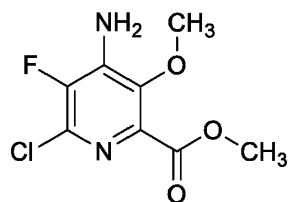
Una mezcla de 4-amino-3,6-dicloro-5-yodopicolinato de metilo (8,1 g, 23,4 mmoles), tetrametilestannano (8,35 g, 46,7 mmoles) y cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (2,5 g, 3,5 mmoles) en 1,2-dicloroetano (40 mL) se irradió en un microondas Biotage™ Initiator a 120°C durante 30 min, con control de la temperatura con un sensor de infrarrojo externo (IR) desde el lateral. La mezcla de reacción se cargó directamente en un cartucho de gel de sílice y se purificó por cromatografía instantánea (gel de sílice; acetato de etilo/hexanos 0-50%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color naranja (4,53 g, 83%): pf 133-136°C; RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 4,92 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 2,29 (s, 3H); RMN C¹³ (101 MHz, CDCl₃) δ 164,34, 150,24, 148,69, 143,94, 117,01, 114,60, 53,02, 14,40; ESIMS *m/z* 236 ([M + H]⁺), 234 ([M-H]⁻).

Ejemplo 9: Preparación de 6-amino-2,5-dicloropirimidino-4-carboxilato de metilo (Compuesto principal E)



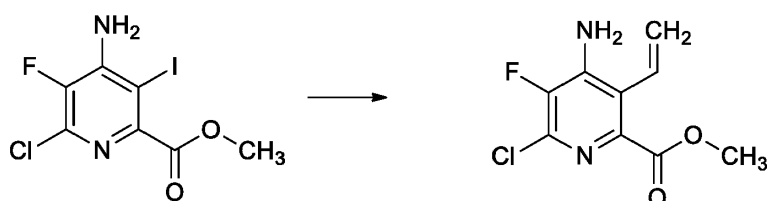
Preparado como se describen Epp et al., en el documento WO 2007082076 A1.

Ejemplo 10: Preparación de 4-amino-6-cloro-5-fluoro-3-metoxipicolinato de metilo (Compuesto principal F)



Preparado como se describe en Epp et al., documento WO 2013003740 A1.

Ejemplo 11: Preparación de 4-amino-6-cloro-5-fluoro-3-vinilpicolinato de metilo (Compuesto principal G)



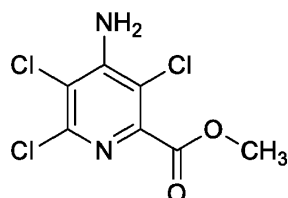
5

10

15

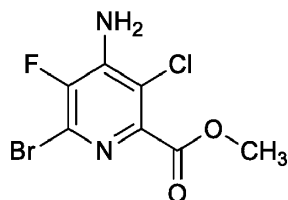
Se suspendieron 4-amino-6-cloro-5-fluoro-3-yodopicolinato de metilo (7,05 g, 21,33 mmoles, preparado como se describe en Epp et al., documento WO 2013003740 A1) y vinil tri-*n*-butilestaño (7,52 mL, 25,6 mmoles) en dicloroetano (71,1 mL) y la mezcla se desgasificó con argón durante 10 min. Después se añadió cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (1,497 g, 2,133 mmoles) y la mezcla de reacción se agitó a 70°C durante la noche (solución de color naranja claro). La reacción se controló por cromatografía de gases-espectrometría de masas (GC-MS). Después de 20 h, la mezcla de reacción se concentró, se adsorbió en Celite® y se purificó por cromatografía en columna (gel de sílice (SiO₂); gradiente de hexanos/acetato de etilo) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color marrón claro (3,23 g, 65,7%): pf 99-100°C; RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ 6,87 (dd, *J* = 18,1, 11,6 Hz, 1H), 5,72 (dd, *J* = 11,5, 1,3 Hz, 1H), 5,52 (dd, *J* = 18,2, 1,3 Hz, 1H), 4,79 (s, 2H), 3,91 (s, 3H); RMN ¹⁹F (376 MHz, CDCl₃) δ -138,79 (s); EIMS *m/z* 230.

Ejemplo 12: Preparación de 4-amino-3,5,6-tricloropicolinato de metilo (Compuesto principal H)



Preparado como describen Finkelstein et al., en el documento WO 2006062979 A1.

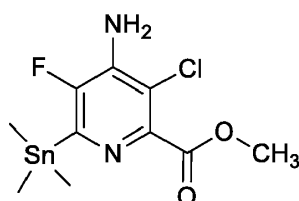
Ejemplo 13: Preparación de 4-amino-6-bromo-3-cloro-5-fluoropicolinato de metilo (Compuesto principal I)



20

Preparado como describen Arndt et al., en el documento US 20120190857 A1.

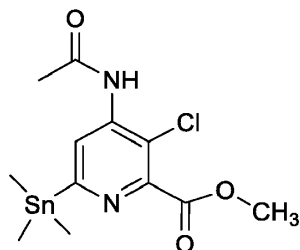
Ejemplo 14: Preparación de 4-amino-3-cloro-5-fluoro-6-(trimetilestannil)picolinato de metilo (Compuesto principal J)



Se combinaron 4-amino-6-bromo-3-cloro-5-fluoropicolinato de metilo (500 miligramos (mg), 1,8 mmoles), 1,1,1,2,2,2-

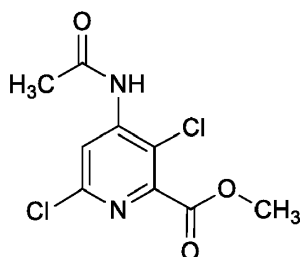
hexametildistannano (580 mg, 1,8 mmoles) y cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (120 mg, 0,18 mmoles) en dioxano seco (6 mL), se rociaron con una corriente de nitrógeno durante 10 min y a continuación se calentaron a 80°C durante 2 h. La mezcla enfriada se agitó con acetato de etilo (25 mL) y NaCl saturado (25 mL) durante 15 min. La fase orgánica se separó, se filtró a través de tierra de diatomeas, se secó (Na₂SO₄) y se evaporó. El residuo se recogió en acetato de etilo (4 mL), se agitó y se trató en porciones con hexanos (15 mL). La solución blanca lechosa se decantó de cualquier sólido producido, se filtró a través de lana de vidrio y se evaporó para dar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanquecino (660 mg, 100%): RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 4,63 (d, *J* = 29,1 Hz, 2H), 3,97 (s, 3H), 0,39 (s, 9H); RMN F¹⁹ (376 MHz, CDCl₃) δ -130,28; EIMS *m/z* 366.

Ejemplo 15: Preparación de 4-acetamido-3-cloro-6-(trimetilestannil)-picolinato de metilo (Compuesto principal K)



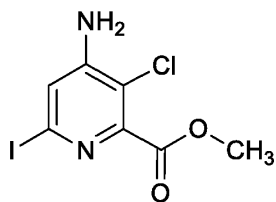
Preparado como describen Balko et al., en el documento WO 2003011853 A1.

Ejemplo 16: Preparación de 4-acetamido-3,6-dicloropicolinato de metilo (Compuesto principal L)



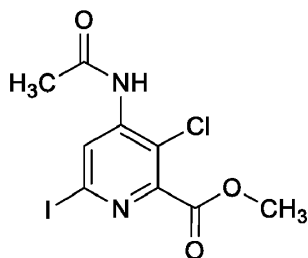
Preparado como describen Fields et al., en el documento WO 2001051468 A1.

Ejemplo 17: Preparación de 4-amino-3-cloro-6-yodopicolinato de metilo (Compuesto principal M)



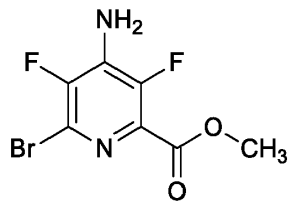
Preparado como describen Balko et al., en el documento WO 2007082098 A2.

Ejemplo 18: Preparación de 4-acetamido-3-cloro-6-yodopicolinato de metilo (Compuesto principal N)



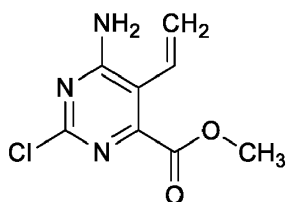
Preparado como describen Balko et al., en el documento WO 2007082098 A2.

Ejemplo 19: Preparación de 4-amino-6-bromo-3,5-difluoropicolinato de metilo (Compuesto principal O)



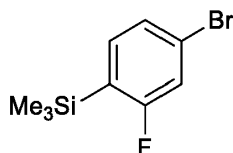
Preparado como describen Fields et al., en el documento WO 2001051468 A1.

Ejemplo 20: Preparación de 6-amino-2-cloro-5-vinilpirimidino-4-carboxilato de metilo (Compuesto principal P)



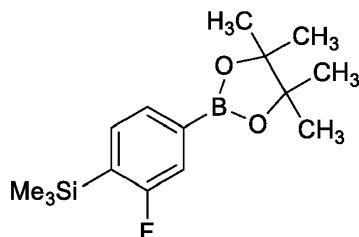
Preparado como describen Epp et al., en el documento US 20090088322.

Ejemplo 22: Preparación de 4-bromo-2-fluorofenil)trimetilsilano



Se añadió una solución de 2,5 M de *n*-butilio en hexanos (*n*-BuLi; 900 microlitros (μL), 2,2 mmoles, 1,1 equiv.) a una solución agitada de 1,4-dibromo-2-fluorobenceno (500 mg, 2,0 mmoles, 1,0 equiv.) en éter de dietilo (10 mL) a -78°C. La solución de color amarillo pálido resultante se agitó a -78°C durante 2 h. Se añadió clorotrimetilsilano (300 μL, 2,4 mmoles, 1,2 equiv.) y la solución de color amarillo pálido resultante se dejó calentar lentamente a 23°C, dejando que el baño de hielo seco/acetona se fundiera, y se agitó durante 72 h. La mezcla de reacción se diluyó con agua (50 mL) y se extrajo con diclorometano (3 x 50 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron (sulfato de magnesio (MgSO₄)), se filtraron por gravedad y se concentraron por evaporación rotatoria para proporcionar el compuesto del título en forma de un aceite de color amarillo pálido (350 mg, 71%): IR (película delgada) 3068 (w), 2955 (m), 2927 (m), 2855 (w), 1598 (w), 1567 (w) cm⁻¹; RMN H¹ (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 7,38 – 7,49 (m, 3H), 0,30 (s, 9H).

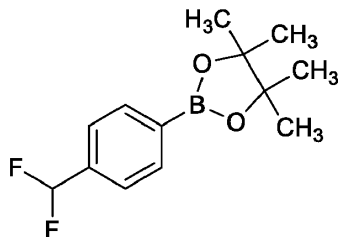
Ejemplo 23: Preparación de (2-fluoro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil)trimetilsilano



Se añadió una solución de 2,5 M de *n*-BuLi (8,5 mL, 21 mmoles, 1,1 equiv.) a una solución agitada de (4-bromo-2-fluorofenil)trimetilsilano (4,8 g, 19 mmoles, 1,0 equiv.) en tetrahydrofurano (80 mL) a -78°C. La solución de color naranja resultante se agitó a -78°C durante 15 min. Se añadió 2-isopropoxi-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (4,4 mL, 21 mmoles, 1,1 equiv.), y la solución turbia de color naranja se dejó calentar lentamente a 23°C, permitiendo que el baño de hielo seco/acetona se derritiera y se agitó durante 20 h. La mezcla de reacción se diluyó con agua (200 mL), se ajustó a aproximadamente pH 4 utilizando ácido clorhídrico 1 M (HCl) y se extrajo con diclorometano (3 x 100 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron (MgSO₄), se filtraron por gravedad y se concentraron por evaporación rotatoria para proporcionar el compuesto del título como un semisólido de color amarillo pálido (6,0 g, 99%): RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 7,55 (dt, *J* = 7,5, 1 Hz, 1H), 7,38 – 7,42 (m, 2H), 1,34 (s, 12H), 0,29 (d, *J* = 1 Hz, 9H).

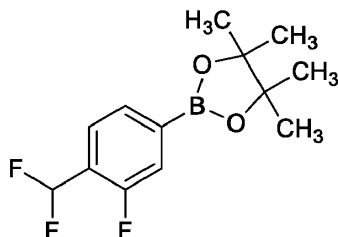
Los siguientes compuestos se elaboraron de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 23:

2-(4-(Difluorometil)fenil)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



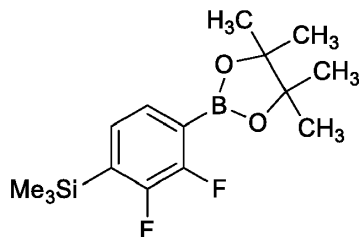
RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 7,89 (br d, $J = 8$ Hz, 2H), 7,50 (br d, $J = 8$ Hz, 2H), 6,65 (t, $J = 56$ Hz, 1H), 1,35 (s, 12H).

2-(4-(Difluorometil)-3-fluorofenil)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



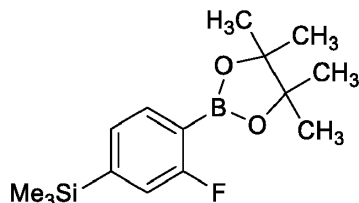
RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 7,51 – 7,68 (m, 3H), 6,90 (t, $J = 55$ Hz, 1H), 1,35 (s, 12H).

Ejemplo 24: Preparación de (2,3-difluoro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil)trimetilsilano



Se añadió una solución de 2,5 M de *n*-BuLi (9,5 mL, 24 mmoles, 1,1 equiv.) a una solución agitada de (2,3-difluorofenil)trimetilsilano (4,0 g, 21 mmoles, 1,0 equiv.) en tetrahidrofurano (86 mL) a -78°C . La solución de color amarillo pálido resultante se agitó a -78°C durante 1 h. Se añadió 2-isopropoxi-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (4,8 mL, 24 mmoles, 1,1 equiv.), y la solución de color amarillo pálido se dejó calentar lentamente a 23°C , permitiendo que el baño de hielo seco/acetona se derritiera y se agitó durante 20 h. La mezcla de reacción se diluyó con agua (200 mL), se ajustó a aproximadamente pH 4 utilizando HCl 1 M y se extrajo con diclorometano (3 x 100 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron (MgSO_4), se filtraron por gravedad y se concentraron mediante evaporación rotatoria para proporcionar el compuesto del título en forma de un polvo de color blanco (6,4 g, 96%): RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 7,42 (ddd, $J = 7,5, 4,5, 0,5$ Hz, 1H), 7,09 (ddd, $J = 7,5, 4, 1$ Hz, 1H), 1,34 (s, 12H), 0,29 (d, $J = 1$ Hz, 9H).

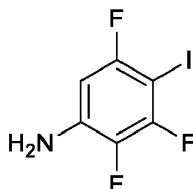
Ejemplo 25: Preparación de (3-fluoro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil)trimetilsilano



Se añadió una solución de 2,5 M de *n*-BuLi (3,5 mL, 8,5 mmoles, 1,1 equiv.) a una solución agitada de 1,4-dibromo-2-fluorobenceno (2,0 g, 7,9 mmoles, 1,0 equiv.) en tetrahidrofurano (THF; 26 mL) a -78°C . La solución de color amarillo brillante resultante se agitó a -78°C durante 15 min. Se añadió 2-isopropoxi-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (1,8 mL, 8,7 mmoles, 1,1 equiv.) y la solución de color amarillo pálido resultante se agitó a -78°C durante 30 min. Se añadió una solución de 2,5 M de *n*-BuLi (3,5 mL, 8,5 mmoles, 1,1 equiv.) y la solución de color amarillo/marrón resultante se agitó a -78°C durante 15 min. Se añadió clorotrimetilsilano (2,2 mL, 17 mmoles, 2,2 equiv.) y la solución de color amarillo pálido resultante se dejó calentar lentamente a 23°C , permitiendo que el baño de hielo seco/acetona se fundiera y se agitó durante 18 h. La mezcla de reacción se diluyó con agua (150 mL) y se

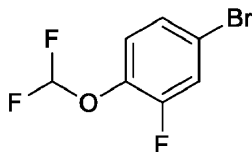
extrajo con diclorometano (2 x 100 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron (MgSO_4), se filtraron por gravedad y se concentraron mediante evaporación rotatoria para proporcionar el compuesto del título en forma de un polvo de color amarillo pálido (2,3 g, 99%): IR (película delgada) 3058 (w), 2981 (s), 2932 (m), 1615 (m) cm^{-1} ; RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 7,72 (dd, $J = 7.5$, 6 Hz, 1H), 7,26 (m, 1H), 7,16 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 1,34 (s, 12H), 0,23 (s, 9H).

5 Ejemplo 26: Preparación de 2,3,5-trifluoro-4-yodoanilina



Se añadió a una solución agitada de 2,3,5-trifluoroanilina (2,0 g, 13,605 mmoles, 1,0 equiv.) en THF seco (40 mL) a -78°C, *sec*-butilitio (10,88 mL, 13,6 mmoles, 1,0 equiv.) durante 30 min. La agitación se continuó a -78°C durante 2 h. Se añadió gota a gota una solución de yodo (4,14 g, 16,32 mmoles, 1,2 equiv.) y la mezcla de reacción se calentó lentamente a 20°C durante 1 h. La reacción se detuvo con un 10% de solución tiosulfato de sodio acuoso (ac) ($\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$) y se extrajo con *tert*-butil metil éter (MTBE; 3 x 50 mL). Los extractos orgánicos combinados se lavaron con solución saturada de salmuera, se secaron sobre Na_2SO_4 anhidro, se filtraron y se evaporaron hasta sequedad a presión reducida. El producto bruto se purificó en columna sobre sílice utilizando acetato de etilo al 0-10% (EtOAc) con hexanos como eluyente para proporcionar 2,3,5-trifluoro-4-yodoanilina (1,3 g, 35%) en forma de un sólido de color rosa: RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 6,43-6,39 (m, 1H), 3,99 (s ancho, 2H); ESIMS m/z 274 ($[\text{M} + \text{H}]^+$).

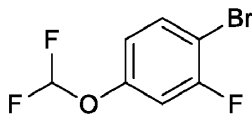
15 Ejemplo 27: Preparación de 4-bromo-1-(difluorometoxi)-2-fluorobenceno



Se agregaron a un matraz de 100 mL cargado con *N,N*-dimetilformamida (DMF; 23 mL), 2-cloro-2,2-difluoroacetato de sodio (4,79 g, 31,4 mmoles), carbonato de potasio (2,60 g, 18,85 mmoles), 4-bromo-2-fluorofenol (3 g, 15,71 mmoles). Se añadió agua (5,75 mL) y la mezcla de reacción se calentó a 100°C durante 3 h. Una vez enfriado a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se diluyó con éter dietílico (Et_2O ; 100 mL) y una solución 2 normal (N) de hidróxido de sodio (NaOH) (100 mL). La capa orgánica se retiró y se secó sobre Na_2SO_4 anhidro. Tras la filtración, la solución orgánica se concentró en un evaporador rotatorio con el baño de agua a 4°C para producir el compuesto del título en forma de un aceite transparente (1 g, 13%): RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 7,35 (dd, $J = 9,7$, 2,3 Hz, 1H), 7,27 (ddd, $J = 8,7$, 2,3, 1,5 Hz, 1H), 7,19-7,04 (m, 1H), 6,53 (t, $J = 73,0$ Hz, 1H); ESIMS m/z 242 ($[\text{M} + \text{H}]^+$).

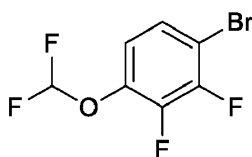
Los siguientes compuestos se elaboraron de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 27.

1-Bromo-4-(difluorometoxi)-2-fluorobenceno



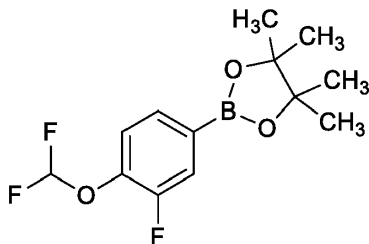
30 RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 7,53 (dd, $J = 8,8$, 7,7 Hz, 1H), 6,95 (dd, $J = 9,1$, 2,7 Hz, 1H), 6,90-6,79 (m, 1H), 6,50 (t, $J = 72,8$ Hz, 1H); IR (película delgada) 781,76, 811,23, 856,78, 945,20, 1043,80, 977,35, 1141,65, 1113,50, 1174,18, 1260,90, 1285,55, 1382,78, 1423,39, 1487,03, 1593,17, 2827,91, 2927,91, 2992,21, 3112,78 cm^{-1} ; ESIMS m/z 242 ($[\text{M} + \text{H}]^+$).

1-Bromo-4-(difluorometoxi)-2,3-difluorobenceno



35 RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 7,31 (ddd, $J = 9,2$, 6,9, 2,5 Hz, 1H), 7,02-6,93 (m, 1H), 6,56 (t, $J = 72,4$ Hz, 1H); IR (película delgada) 776,30, 811,66, 884,39, 986,70, 1100,95, 1144,65, 1211,05, 1241,96, 1266,36, 1297,59, 1383,98, 1494,35, 1474,47, 1600,40, 1679,63, 3038,31, 3103,90 cm^{-1} ; ESIMS m/z 260 ($[\text{M} + \text{H}]^+$).

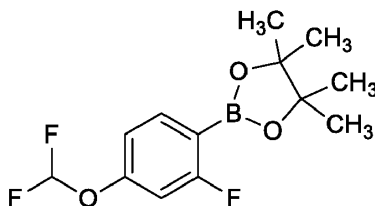
Ejemplo 28: Preparación de 2-(4-(difluorometoxi)-3-fluorofenil)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



Se añadió 4,4,4',4', 5,5,5',5'-octametil-2,2'-bi(1,3,2-dioxaborolano) (1,264 g, 4,98 mmoles), PdCl₂(dppf) (0,304 g, 0,415 mmoles), acetato de potasio (1,222 g, 12,45 mmoles) y 4-bromo-1-(difluorometoxi)-2-fluorobenceno (1 g, 4,15 mmoles) a DMSO (10 mL). La reacción se calentó a una temperatura externa de 80°C durante 18 h. Tras enfriar, la mezcla de reacción se vertió en agua helada (50 mL). La mezcla de agua helada se transfirió a un embudo de decantación y se completaron dos extracciones con EtOAc (50 mL). Las capas orgánicas se combinaron, se secaron sobre Na₂SO₄, y se filtraron. La solución se concentró en Celite® (5 g) utilizando EtOAc como disolvente. El Celite® impregnado se purificó mediante cromatografía en gel de sílice utilizando EtOAc:hexanos al 0-30% para proporcionar el compuesto del título en forma de un aceite de color amarillo (773 mg, 64%): RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 7,61-7,53 (m, 2H), 7,25-7,16 (m, 1H), 6,58 (t, *J* = 73,5 Hz, 1H), 1,34 (s, 12H); ESIMS *m/z* 289 ([M + H]⁺).

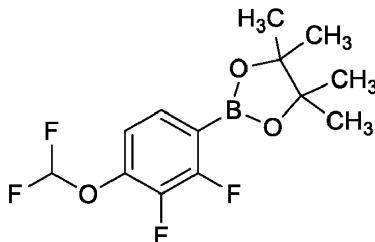
Los siguientes compuestos se elaboraron de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 28:

2-(4-(Difluorometoxi)-2-fluorofenil)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



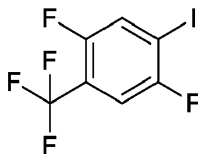
RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 7,74 (dd, *J* = 8,3, 6,8 Hz, 1H), 6,89 (dd, *J* = 8,3, 2,2 Hz, 1H), 6,81 (dd, *J* = 9,9, 2,2 Hz, 1H), 6,54 (t, *J* = 73,2 Hz, 1H), 1,26 (s, 12H); IR (película delgada) 848,53, 961,04, 1066,43, 1125,19, 1172,02, 1238,3, 1212,77, 1330,51, 1281,58, 1357,05, 1372,85, 1380,73, 1425,32, 1469,05, 1579,31, 1621,00, 2933,42, 2982,31 cm⁻¹; ESIMS *m/z* 289 ([M + H]⁺).

2-(4-(Difluorometoxi)-2,3-difluorofenil)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 7,46 (ddd, *J* = 8,3, 5,8, 2,3 Hz, 1H), 7,05-6,95 (m, 1H), 6,59 (t, *J* = 72,8 Hz, 1H), 1,35 (s, 12H); IR (película delgada) 673,35, 851,08, 916,78, 965,07, 1123,87, 1142,58, 1210,42, 1331,14, 1280,13, 1362,56, 1392,44, 1467,32, 1507,77, 1589,62, 1629,61, 2935,00, 2982,70 cm⁻¹; ESIMS *m/z* 307 ([M + H]⁺).

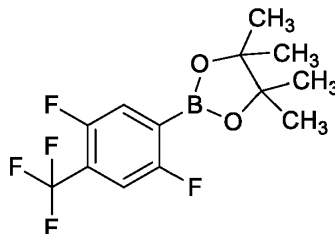
Ejemplo 29: Preparación de 1,4-difluoro-2-yodo-5-(trifluorometil) benceno



Se agitó *N*-(2,5-difluoro-4-(trifluorometil)fenil)acetamida (950 mg, 4,0 mmol; Preparado de acuerdo con Y. Tanabe et al, *J. Org. Chem.* **1988**, 53, 4585-4587) en metanol (25 mL), se trató con cloruro de acetilo (3 mL) y se calentó a reflujo durante 2 h. Los compuestos volátiles se eliminaron por evaporación y el residuo sólido se disolvió en 6 N HCl (50 mL), se enfrió a 5°C y se trató en porciones con una solución de nitrato de sodio (410 mg, 6,0 mmoles) en agua (5 mL). Después de 30 min, esta mezcla se vertió en una solución de yoduro de sodio (2,4 g, 16 mmoles) en agua

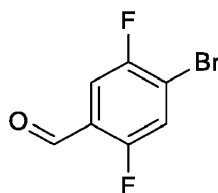
(50 mL) y se agitó rápidamente con diclorometano (50 mL). Después de 30 min, se añadió bisulfito de sodio sólido para destruir el color del yodo, y la fase orgánica separada se lavó con NaCl saturado, se secó (Na₂SO₄), y se evaporó. El material fue purificado por cromatografía instantánea (SiO₂; eluyendo con hexanos) para proporcionar el compuesto del título como un líquido transparente volátil (250 mg, 20%): RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 7,64 (ddd, *J* = 8,8, 4,8, 0,4 Hz, 1H), 7,28 (dd, *J* = 11,1, 4,7 Hz, 1H); RMN F¹⁹ (376 MHz, CDCl₃) δ -61,92, -97,64, -97,68, -118,59, -118,63, -118,64, -118,67; EIMS *m/z* 308.

Ejemplo 30: Preparación de 2-(2,5-difluoro-4-(trifluorometil)fenil)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



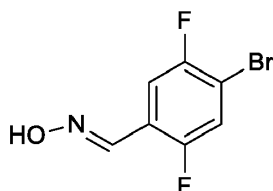
Se disolvió 1,4-difluoro-2-yodo-5-(trifluorometil)benceno (500 mg, 1,6 mmoles) en THF seco (7 mL), se enfrió a 0°C y se trató en porciones con complejo de cloruro de isopropilmagnesio-cloruro de litio (1,3 M; 1,4 mL, 1,8 mmoles) y se agitó durante 40 min a 5°C. Se añadió 2-isopropoxi-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (360 µL, 330 mg, 1,8 mmoles) y se continuó la agitación durante 1 h. Después de tratar con cloruro de amonio saturado (NH₄Cl), la mezcla se agitó con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con NaCl saturado, se secó (Na₂SO₄), y se evaporó para dar el compuesto del título en forma de un aceite de color marrón claro (500 mg, 100%). El material fue utilizado sin purificación adicional: RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 7,54 (dd, *J* = 9,9, 4,3 Hz, 1H), 7,27 (dd, *J* = 8,0, 5,2 Hz, 2H), 1,37 (s, 12H); RMN F¹⁹ (376 MHz, CDCl₃) δ -62,10, -62,13, -106,85, -106,90, -121,81, -121,87, -121,90.

Ejemplo 31: Preparación de 4-bromo-2,5-difluorobenzaldehído



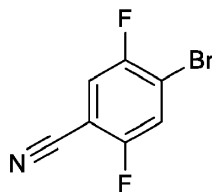
Se agregó gota a gota a una solución de 2,5-dibromo-1,4-difluorobenceno (10,0 g, 36,77 mmoles) en éter dietílico (150 mL) a -78°C, *n*-butil litio (2,5 M en hexanos, 14,86 mL, 37,15 mmoles) en nitrógeno. La mezcla de reacción se agitó a -78°C durante 30 min. Se añadió gota a gota DMF seca (3,13 mL, 40,46 mmoles) en éter dietílico (10 mL) y la reacción se calentó lentamente a temperatura ambiente durante 2 h. La reacción se sofocó con una solución acuosa saturada de NH₄Cl (25 mL) y se extrajo con éter dietílico. La fase orgánica se lavó con solución saturada de salmuera, se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró a presión reducida (Nota: el producto es altamente volátil). El producto bruto se purificó por cromatografía instantánea (SiO₂; eluyendo con acetato de etilo en hexanos al 2-20%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color amarillo pálido (7,0 g, 86%): RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 7,50 (dd, *J* = 5,08, 8,92 Hz, 1H), 7,62 (dd, *J* = 5,80, 7,68 Hz, 1H), 10,30 (d, *J* = 2,76 Hz, 1H).

Ejemplo 32: Preparación de oxima de (*E*)-4-bromo-2,5-difluorobenzaldehído



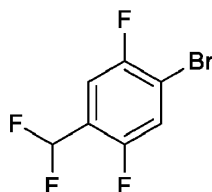
Se agitó una solución de 4-bromo-2,5-difluorobenzaldehído (7,0 g, 31,67 mmoles), hidrocloreto de hidroxilamina (2,42 g, 34,84 mmoles) en piridina (35 mL) y etanol (35 mL) a temperatura ambiente durante 30 min. La mezcla de reacción se diluyó con una solución saturada de NH₄Cl y se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con solución saturada de salmuera, se secó (Na₂SO₄), se filtró, y se concentró a presión reducida. El producto bruto se purificó por cromatografía instantánea (SiO₂; eluyendo con acetato de etilo en hexanos al 5-100%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color amarillo (4,0 g, 53%): ESIMS *m/z* 238 ([*M* + 2H]⁺).

Ejemplo 33: Preparación de 4-bromo-2,5-difluorobenzonitrilo



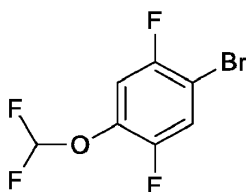
Se agitó una solución de cloruro de cianuro (3,12 g, 16,94 mmoles) y DMF seca (8,5 mL) durante 30 min o hasta la formación de un sólido de color blanco. La desaparición del cloruro cianúrico se confirmó mediante cromatografía en capa fina (TLC). Se añadió gota a gota (*E*)-4-bromo-2,5-difluorobenzaldehído oxima (4,0 g, 16,94 mmoles) en DMF (26 mL) a la suspensión y se agitó durante 1 h. La mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con hexanos. El extracto orgánico se lavó con agua, se lavó con solución saturada de salmuera, se secó (Na₂SO₄), se filtró y se evaporó hasta sequedad a presión reducida. El producto bruto se purificó por cromatografía instantánea (SiO₂; eluyendo con acetato de etilo en hexanos al 2-20%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (2,5 g, 68%): RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ 7,40 (dd, *J* = 5,36, 7,10 Hz, 1H), 7,52 (dd, *J* = 5,40, 7,66 Hz, 1H); EIMS *m/z* 218.

Ejemplo 34: Preparación de 1-bromo-4-(difluorometil)-2,5-difluorobenceno



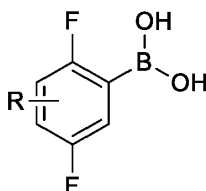
Se añadió trifluoruro de (dietilamino)azufre (DAST; 24,06 g, 0,15 moles) gota a gota a una solución de 4-bromo-2,5-difluorobenzaldehído (11,0 g, 49,77 mmoles) en diclorometano (55 mL) a 0°C. Una vez completada la adición, se retiró el baño de enfriamiento y se continuó la agitación durante 2 h a temperatura ambiente (rt). La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano, se lavó con agua, se lavó con solución salina saturada y se secó (Na₂SO₄), y se evaporó a presión reducida. El producto bruto se purificó por cromatografía instantánea (SiO₂; eluyendo con acetato de etilo en hexanos al 0-10%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un líquido de color marrón pálido (8,39 g, 69%): RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ 6,58 (t, *J* = 72,32 Hz, 1H), 7,12 (t, *J* = 7,92 Hz, 1H), 7,44 (dd, *J* = 6,32, 9,18 Hz, 1H); EIMS *m/z* 244.

Ejemplo 35: Preparación de 1-bromo-4-(difluorometoxi)-2,5-difluorobenceno



En un tubo sellado, se trató una solución de 4-bromo-2,5-difluorofenol (5,0 g, 23,9 mmoles) e hidróxido de potasio (26,8 g, 479 mmoles) en una mezcla 1:1 de acetonitrilo y agua (110 mL) a -78°C con dietilfosfonato de bromo-difluorometilo (12,8 g, 47,9 mmoles) en una porción. El tubo sellado se agitó a temperatura ambiente durante la noche. La mezcla de reacción se diluyó con éter dietílico y la fase orgánica se separó. La fase acuosa se extrajo con éter dietílico dos veces. Los extractos orgánicos combinados se lavaron con una solución saturada de salmuera, se secaron (Na₂SO₄), se filtraron y se evaporaron hasta sequedad a presión reducida. El producto bruto se purificó por cromatografía instantánea (SiO₂; eluyendo con acetato de etilo en hexanos al 0-10%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un líquido transparente (4,2 g, 67,8%): RMN ¹H (300 MHz, CDCl₃) δ 6,56 (t, *J* = 72,36 Hz, 1H), 7,11 (t, *J* = 7,32 Hz, 1H), 7,40-7,45 (m, 1H); EIMS *m/z* 259.

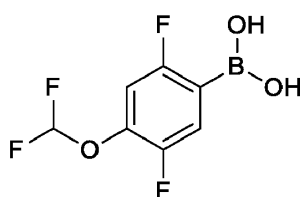
Ejemplo 36: Procedimiento general para la síntesis de ácidos borónicos.



Se burbujeó argón a través de una solución del sustrato de bromofenilo (1,0 equiv.), acetato de potasio (3,0 equiv.), y *bis*-(pinacolato)-diboro (1,1 equiv.) en DMSO (volumen suficiente para proporcionar 0,1-0,2 M en el sustrato) durante 15 min en un tubo sellado. Se añadió Pd(dppf)Cl₂ (0,1 equiv.) y se volvió a tapar el tubo sellado. La mezcla de reacción se calentó a 80°C durante 18 h. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua y se extrajo con metil-*t*-butil éter. El extracto orgánico se lavó con agua, se lavó con solución saturada de salmuera, se secó (Na₂SO₄), se filtró y se evaporó hasta sequedad a presión reducida. El boronato bruto (1,0 equiv.) se disolvió en éter dietílico (10 vol) y se añadió dietanolamina (1,1 equiv.). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 30-45 min. Un sólido de color blanco precipitó después de 45 min. Se detuvo la agitación y se decantó el disolvente. Se añadió éter de nueva aportación a los sólidos seguido de un exceso de HCl 1,5 N. La solución bifásica resultante se agitó durante 30 min. La fase orgánica se lavó con solución saturada de salmuera, se secó (Na₂SO₄), se filtró y se evaporó hasta sequedad a presión reducida. Los ácidos borónicos así obtenidos se utilizaron en la siguiente etapa sin purificación.

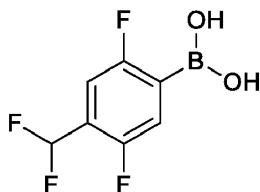
Los siguientes compuestos se elaboraron de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 36:

Ácido (4-(difluorometoxi)-2,5-difluorofenil)borónico



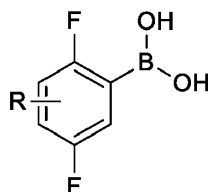
RMN H¹ (300 MHz, CDCl₃) δ 6,59 (t, *J* = 72,78 Hz, 1H), 6,97 (dd, *J* = 2,70, 9,14 Hz, 1H), 7,52 (dd, *J* = 5,19, 10,29 Hz, 1H).

Ácido (4-(difluorometil)-2,5-difluorofenil)borónico



RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 6,87 (dt, *J* = 8,48, 54,64 Hz, 1H), 7,25-7,32 (m, 1H), 7,49 (dd, *J* = 4,08, 9,48 Hz, 1H), 7,59-7,60 (m, 1H).

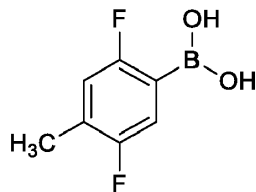
Ejemplo 37: Procedimiento general para la síntesis de ácidos borónicos (Método A)



Se agregó a una solución del sustrato de bromofenilo apropiado (1,0 equiv.) en THF seco (10 vol) a -78°C, gota a gota *n*-BuLi (2,5 M en hexanos; 1,2 equiv.). Una vez completada la adición, se continuó la agitación durante 30 min. Se añadió borato de trimetilo (1,5 equiv.) en una porción y se continuó la agitación durante 1 h a -78°C. La mezcla de reacción se calentó lentamente a temperatura ambiente, se detuvo con HCl 1,5 N y se extrajo con acetato de etilo. El extracto orgánico se lavó con agua, se lavó con solución saturada de salmuera, se secó (Na₂SO₄), se filtró y se evaporó hasta sequedad a presión reducida. Los ácidos borónicos obtenidos de este modo se utilizaron en la siguiente etapa sin purificación.

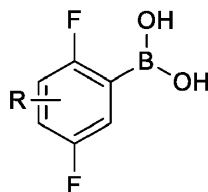
El siguiente compuesto se preparó de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 37:

Ácido (2,5-Difluoro-4-metilfenil)borónico



RMN ^1H (300 MHz, CDCl_3) δ 2,30 (s, 3H), 5,03 (s ancho, 2H), 6,89 (dd, J = 5,67, 10,25 Hz, 1H), 7,42 (dd, J = 5,40, 9,19 Hz, 1H).

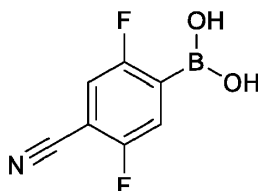
5 Ejemplo 38: Procedimiento general para la síntesis de ácidos borónicos (Método B)



10 Se añadió gota a gota a una solución del sustrato de bromofenilo apropiado (1,0 equiv.) en THF seco (10 vol) a -40°C una solución compleja de cloruro de litio y cloruro de isopropilmagnesio (solución 1,3 M en THF; 1,05 equiv.). Una vez completada la adición, la mezcla de reacción se agitó a -40°C durante 45 min y a continuación se calentó lentamente a 0°C . Se añadió gota a gota éster de pinacol de ácido isopropoxiborónico (1,07 equiv.) y se continuó la agitación a 0°C durante 2 h. La mezcla de reacción se calentó a temperatura ambiente, se sofocó con una solución acuosa saturada de NH_4Cl , y se extrajo con acetato de etilo. El extracto orgánico se lavó con solución saturada de salmuera, se secó (Na_2SO_4), se filtró, y se evaporó a presión reducida. Los ácidos borónicos obtenidos de este modo se utilizaron en la siguiente etapa sin purificación.

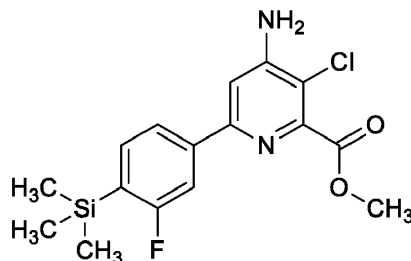
15 El siguiente compuesto se preparó de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 38:

Ácido (4-ciano-2,5-difluorofenil)borónico



RMN ^1H (300 MHz, CDCl_3) δ 5,15 (s ancho, 2H), 7,29-7,36 (m, 1H), 7,69 (dd, J = 4,80, 8,28 Hz, 1H).

Ejemplo 39: Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(3-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo



20 En un recipiente de microondas de 20 mL, equipado con una barra de agitación, Compuesto principal A (500 mg, 2,262 mmoles), se cargaron (2-fluoro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil)trimetilsilano (997 mg, 3,39 mmoles), dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (203 mg, 3,39 mmoles) y fluoruro de cesio (741 mg, 4,88 mmoles). El recipiente se colocó en atmósfera de nitrógeno (N_2) y se añadieron acetonitrilo (4,0 mL) y H_2O (1,0 mL). El recipiente se colocó en un reactor de microondas Biotage Initiator™ durante 30 min a 120°C , con control de la temperatura con un sensor de IR externo desde el lado del recipiente. La reacción se vertió en solución de salmuera y se extrajo con acetato de etilo (3 x 75 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO_4 anhidro, se filtraron y se concentraron. El residuo resultante se purificó por cromatografía instantánea (gel de sílice; EtOAc en hexanos al 0-30%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color amarillo (0,328 g, 41%):

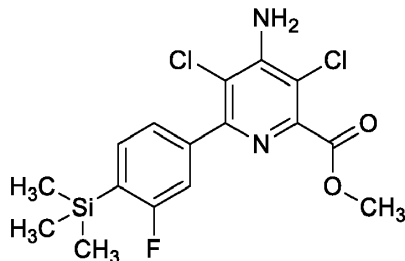
25 RMN ^1H (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 7,68 (dd, J = 7,5, 1,4 Hz, 1H), 7,61-7,47 (m, 2H), 7,30 (s, 1H), 6,78 (s, 2H), 3,88 (s,

30

3H), 0,30 (d, $J = 0,8$ Hz, 9H); RMN F^{19} (376 MHz, DMSO- d_6) δ -101,12; ESIMS m/z 353 ($[M + H]^+$).

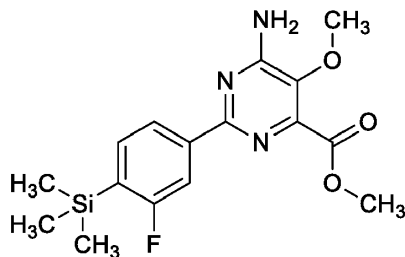
Los siguientes compuestos se prepararon de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 39:

4-Amino-3,5-dicloro-6-(3-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo



- 5 El compuesto del título se preparó como se describe en el Ejemplo 39 con el Compuesto principal H (500 mg, 1,96 mmoles) y se aisló en forma de un sólido de color blanco (0,381 g, 50%): RMN H^1 (400 MHz, DMSO- d_6) δ 7,52 (dd, $J = 7,6, 5,9$ Hz, 1H), 7,41 (dd, $J = 7,5, 1,3$ Hz, 1H), 7,30 (dd, $J = 9,6, 1,4$ Hz, 1H), 7,11 (s, 2H), 3,87 (s, 3H), 0,33 (d, $J = 0,9$ Hz, 9H); RMN F^{19} (376 MHz, DMSO- d_6) δ -101,38; ESIMS m/z 387 ($[M + H]^+$).

6-Amino-2-(3-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo

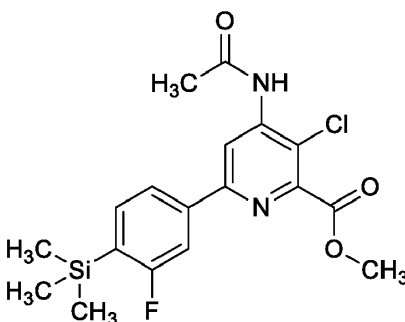


10

El compuesto del título se preparó como se describe en el Ejemplo 39 con el Compuesto principal C (0,510 g, 2,34 mmoles) y se aisló en forma de un sólido de color amarillo (0,307 g, 38%): RMN H^1 (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,08-7,99 (m, 1H), 7,82 (dd, $J = 10,3, 1,4$ Hz, 1H), 7,60-7,27 (m, 3H), 3,91 (s, 3H), 3,74 (s, 3H), 0,32 (d, $J = 0,9$ Hz, 9H); RMN F^{19} (376 MHz, DMSO- d_6) δ -101,73; ESIMS m/z 350 ($[M + H]^+$).

15

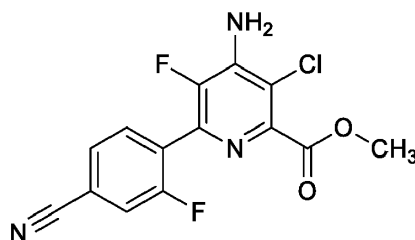
4-Acetamido-3-cloro-6-(3-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo



20

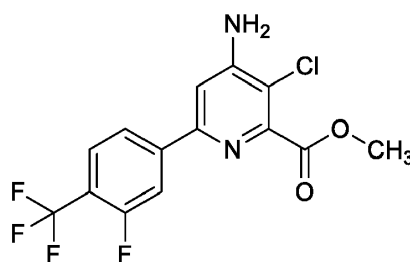
El compuesto del título se preparó como se describe en el Ejemplo 39 con el Compuesto principal L (0,500 g, 1,90 mmoles) en dioxano (7,0 mL) y H_2O (2,0 mL) y se aisló en forma de un sólido de color amarillo (0,433 g, 58%): RMN H^1 (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,99 (s, 1H), 8,71 (s, 1H), 7,75 (dd, $J = 7,6, 1,5$ Hz, 1H), 7,63 (dd, $J = 10,1, 1,5$ Hz, 1H), 7,56 (dd, $J = 7,7, 5,9$ Hz, 1H), 3,94 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 0,30 (d, $J = 0,8$ Hz, 9H); RMN F^{19} (376 MHz, DMSO- d_6) δ -100,78; ESIMS m/z 396 ($[M + H]^+$).

4-Amino-3-cloro-6-(4-ciano-2-fluorofenil)-5-fluoropicolinato de metilo (Compuesto 44)



El compuesto del título se preparó como se describe en el Ejemplo 39 con el Compuesto principal B (400 mg, 1,673 mmoles) y ácido (4-ciano-2-fluorofenil)borónico (400 mg, 2,425 mmoles) en dioxano (4,5 mL) y H₂O (1,2 mL) y se aisló en forma de un sólido de color blanquecino (0,451 g, 83%).

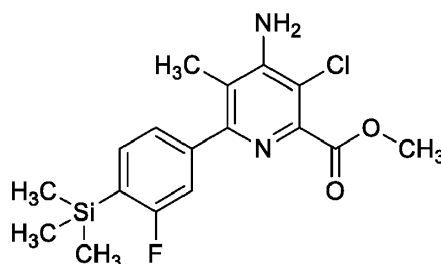
Ejemplo 40. Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(3-fluoro-4-(trifluorometil)fenil)picolinato de metilo (Compuesto 29)



Un vial de 25 mL con 4-amino-3,6-dicloropicolinato de metilo (630 mg, 2,85 mmoles), 2-(3-fluoro-4-(trifluorometil)fenil)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (1,06 g, 3,65 mmoles, 1,3 equiv.), cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (209 mg, 0,30 mmoles, 0,1 equiv.) y fluoruro de potasio (510 mg, 8,8 mmoles, 3 equiv.) en acetonitrilo/agua (8 mL, 3:1) en un reactor de microondas Biotage™ Initiator durante 20 min a 115°C, con control de la temperatura con un sensor de IR externo desde el lado del recipiente. La mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo y se lavó con agua. La capa acuosa se extrajo con acetato de etilo y las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na₂SO₄ anhidro, se filtraron y se concentraron. El compuesto bruto se cargó en un cartucho Celite® y se secó en un horno de vacío. La purificación por cromatografía instantánea de fase inversa (0-60, 60, 60-100% de acetonitrilo/agua) proporcionó el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (0,57 g, 57%).

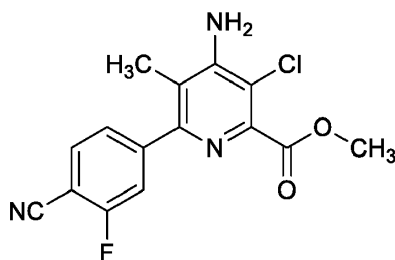
Los siguientes compuestos se prepararon de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 40:

4-Amino-3-cloro-6-(3-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-metilpicolinato de metilo



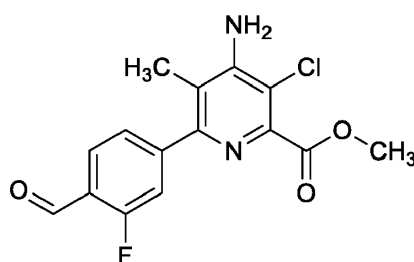
El compuesto del título se preparó como en el Ejemplo 40 con el Compuesto principal D y se aisló en forma de un sólido de color amarillo (346 mg, 27%); pf 167°C (desc.); RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ 7,43 (dd, *J* = 7,4, 5,8 Hz, 1H), 7,20 (dd, *J* = 7,4, 0,9 Hz, 1H), 7,10 (dd, *J* = 9,2, 1,3 Hz, 1H), 4,83 (s, 2H), 3,95 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 0,33 (d, *J* = 0,8 Hz, 9H); RMN ¹⁹F (376 MHz, CDCl₃) δ -100,73; ESIMS *m/z* 367 ([*M* + *H*]⁺).

4-Amino-3-cloro-6-(4-ciano-3-fluorofenil)-5-metilpicolinato de metilo (Compuesto 155)



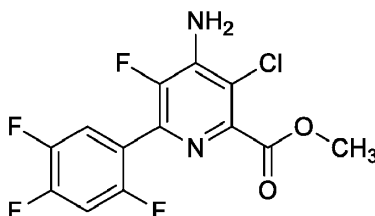
El compuesto del título se preparó como en el Ejemplo 40 con el Compuesto principal D y se aisló en forma de un sólido escamoso de color blanco (200 mg, 49%).

5 4-Amino-3-cloro-6-(3-fluoro-4-formilfenil)-5-metilpicolinato de metilo



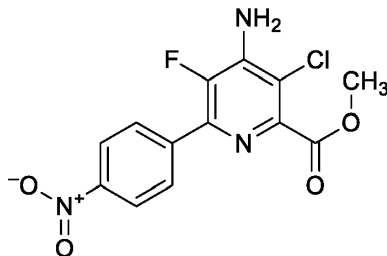
El compuesto del título se preparó como en el Ejemplo 40 con el Compuesto principal D y se aisló en forma de un sólido de color naranja (747 mg, 65%); pf 114-120°C; RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 10,40 (s, 1H), 7,92 (t, J = 7,5 Hz, 1H), 7,38-7,29 (m, 2H), 4,97 (s, 2H), 3,97 (s, 3H), 2,18 (s, 3H); RMN ^{19}F (376 MHz, CDCl_3) δ -121,53; ESIMS m/z 323 ($[\text{M} + \text{H}]^+$).

10 4-Amino-3-cloro-5-fluoro-6-(2,4,5-trifluorofenil)picolinato de metilo (Compuesto 200)



El compuesto del título se preparó como en el Ejemplo 40 con el Compuesto principal B y se aisló en forma de un polvo de color blanco (370 mg, 73%).

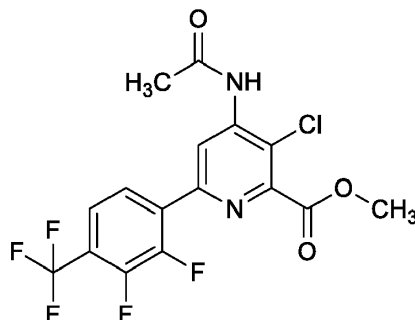
15 Ejemplo 41: Preparación de 4-amino-3-cloro-5-fluoro-6-(4-nitrofenil)picolinato de metilo (Compuesto 95)



A una suspensión del Compuesto principal B (250 mg, 1,05 mmoles), ácido (4-nitrofenil)borónico (192 mg, 1,15 mmoles), fluoruro de cesio (CsF ; 315 mg, 2,09 mmoles) y sal de sodio de hidrato de tris(3-sulfonatofenil)fosfina (TPPTS, 60 mg, 0,11 mmoles) en una mezcla de agua/acetonitrilo (2,8/0,7 mL) se le añadió acetato de paladio (12 mg, 0,05 mmoles). En un microondas de sobremesa Biotage™, la mezcla se calentó a 150°C durante 5 min. La mezcla de reacción se filtró a continuación a través de Celite®, se diluyó con EtOAc, se lavó con agua y salmuera. Las sustancias orgánicas se secaron a continuación (Na_2SO_4), se filtraron, se concentraron a vacío y a continuación se purificaron por cromatografía en gel de sílice eluyendo con EtOAc en hexanos al 0-100% para proporcionar un sólido de color amarillo (150 mg, 44%).

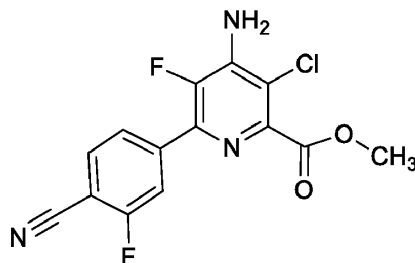
25 El siguiente compuesto se preparó de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 41:

4-Acetamido-3-cloro-6-(2,3-difluoro-4-(trifluorometil)fenil)picolinato de metilo



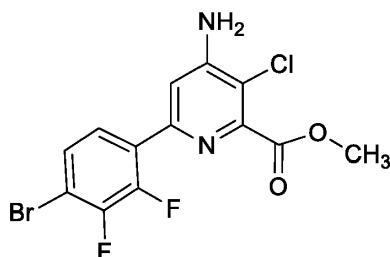
RMN ^1H (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 10,03 (s, 1H), 8,79 (d, $J = 1,0$ Hz, 1H), 7,93-7,84 (m, 1H), 7,75 (dd, $J = 8,3, 6,3$ Hz, 1H), 3,96 (s, 3H), 2,26 (s, 3H); ESIMS m/z 409 ($[\text{M} + \text{H}]^+$).

5 Ejemplo 42: Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(4-ciano-3-fluorofenil)-5-fluoropicolinato de metilo (Compuesto 135)



10 Se combinaron el Compuesto principal B (0,300 g, 1,255 mmoles), ácido 4-ciano-3-fluorofenilborónico (0,248 g, 1,506 mmoles), cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (0,088 g, 0,126 mmoles) y fluoruro de cesio (0,381 g, 2,51 mmoles) en 1,2-dimetoxietano (2 mL) y agua (2 mL) y se calentaron en un reactor de microondas a 110°C durante 20 min. La mezcla de reacción enfriada se repartió entre acetato de etilo y agua. La fase orgánica se secó y se concentró. El producto se purificó por cromatografía instantánea (SiO_2 ; eluyendo con acetato de etilo en hexanos al 5-60%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (0,189 g, 46,5%).

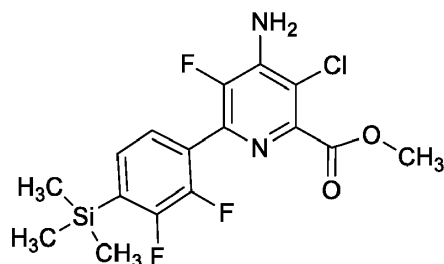
Ejemplo 44: Preparación de 4-amino-6-(4-bromo-2,3-difluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo (Compuesto 114)



15 Etapa 1: Se combinaron el Compuesto principal N (0,600 g, 1,692 mmoles), ácido 4-bromo-2,3-difluorofenilborónico (0,481 g, 2,031 mmoles), fluoruro de cesio (0,617 g, 4,06 mmoles) y cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (0,119 g, 0,169 mmoles) en 1,2-dimetoxietano (4 mL) y agua (4 mL) y se calentaron en un reactor de microondas durante 20 min a 110°C. La mezcla de reacción enfriada se repartió entre acetato de etilo y agua. La fase orgánica se separó y se concentró sobre gel de sílice. El producto se hizo eluir con un gradiente de acetato de etilo/hexanos para proporcionar 4-acetamido-6-(4-bromo-2,3-difluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo (0,515 g, 72,5%) en forma de un sólido de color blanco.

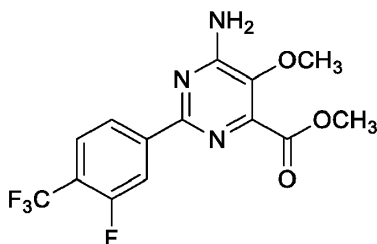
25 Etapa 2: Se suspendió 4-acetamido-6-(4-bromo-2,3-difluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo (0,515 g, 1,227 mmoles) en metanol (20 mL) y se añadió gota a gota cloruro de acetilo (1,559 mL, 21,93 mmoles). La mezcla de reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente y se concentró a vacío. El residuo se repartió entre acetato de etilo y solución acuosa al 5% de bicarbonato de sodio. La fase orgánica se concentró en gel de sílice y se purificó por cromatografía instantánea (SiO_2 ; eluyendo con acetato de etilo en hexanos al 5-60%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (0,231 g, 55,8%).

Ejemplo 45: Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(2,3-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-fluoropicolinato de metilo



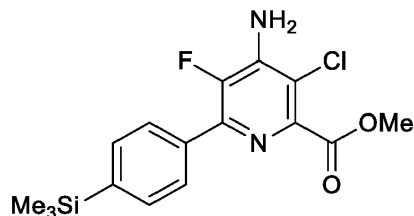
Se combinaron, el Compuesto principal B (2,0 g, 8,37 mmoles), (2,3-difluoro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil)trimetilsilano (3,40 g, 10,88 mmoles), carbonato de sodio (0,887 g, 8,37 mmoles) y cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (0,587 g, 0,837 mmoles) en acetonitrilo (25 mL) y agua (8 mL). La mezcla de reacción se calentó a continuación a reflujo durante 4 h. La mezcla de reacción enfriada se repartió entre acetato de etilo y agua. La fase orgánica se lavó dos veces más con agua y a continuación se concentró en gel de sílice. Esta mezcla se purificó por cromatografía en gel de sílice y el producto se hizo eluir con un sistema de disolvente de acetato de etilo en hexanos al 7-60%. Este procedimiento proporcionó del título en forma de un sólido de color blanco (2,7 g, 83%): pf 160-162°C; RMN ^1H (300 MHz, CDCl_3) δ 7,37-7,28 (m, 1H), 7,21 (ddd, $J = 7,7, 4,4, 1,3$ Hz, 1H), 4,96 (s ancho, 2H), 3,97 (s, 3H), 0,35 (s, 9H).

Ejemplo 46: Preparación de 6-amino-2-(3-fluoro-4-(trifluorometil)fenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (Compuesto 26)



A un vial de microondas se le añadieron el Compuesto principal C (184 mg, 0,846 mmoles), 2-(3-fluoro-4-(trifluorometil)fenil)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (270 mg, 0,930 mmoles), fluoruro de potasio (128 mg, 2,198 mmoles) y cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (59,3 mg, 0,085 mmoles). Posteriormente, se añadieron acetonitrilo (2,789 mL) y agua (2,79 mL). El vial de reacción se tapó y se colocó en un reactor de microondas Biotage™ Initiator durante 20 min a 115°C, con control de la temperatura con un sensor de IR externo desde el lado del recipiente. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, se diluyó con EtOAc y se lavó con H_2O . Las sustancias orgánicas se secaron sobre Na_2SO_4 , se filtraron y se concentraron a vacío. El producto bruto se purificó por medio de cromatografía instantánea (sílice; hexanos/EtOAc). Esto proporcionó el compuesto del título (172 mg, 58,9%) en forma de un sólido de color blanco.

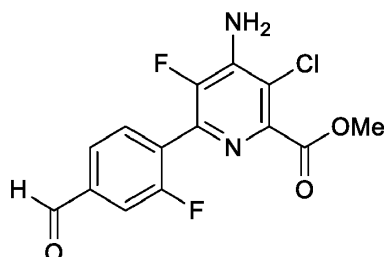
Ejemplo 47: Preparación de 4-amino-3-cloro-5-fluoro-6-(4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo



Se combinaron el Compuesto principal B (600 mg, 2,5 mmoles, 1,0 equiv.) y ácido (4-(trimetilsilil)fenil)borónico (540 mg, 2,8 mmoles, 1,1 equiv.) en un vial de 20 mL seguido de fluoruro de cesio (420 mg, 2,8 mmoles, 1,1 equiv.), acetato de paladio (28 mg, 0,13 mmoles, 0,05 equiv.), y 3,3',3''-fosfinetriiltribenzenesulfonato de sodio (140 mg, 0,25 mmoles, 0,10 equiv.). Se añadió una mezcla 3:1 de agua:acetonitrilo (7,2 mL) y la mezcla de color marrón resultante se tapó y se colocó en un reactor de microondas Biotage™ Initiator durante 5 min a 150°C, con control de la temperatura con un sensor de IR externo desde el lado del recipiente. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua (150 mL) y se extrajo con diclorometano (5 x 60 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron (MgSO_4), se filtraron por gravedad y se concentraron por evaporación rotatoria. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (acetato de etilo en hexanos al 33%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un polvo de color amarillo pálido (700 mg, 79%): pf 148-150°C; RMN ^1H (300 MHz, CDCl_3) δ 7,86 (m, 2H), 7,62 (m, 2H), 4,88 (s ancho, 2H), 3,98 (s, 3H), 0,29 (s, 9H); ESIMS m/z 353 ($[\text{M} + \text{H}]^+$).

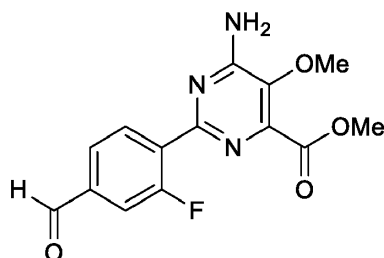
Los siguientes compuestos se elaboraron de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 47:

4-Amino-3-cloro-5-fluoro-6-(2-fluoro-4-formilfenil)picolinato de metilo



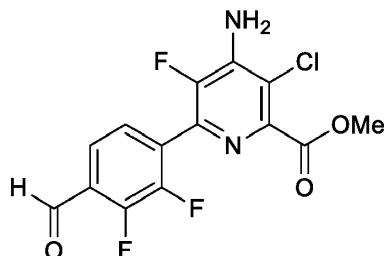
5 pf 151-154°C; RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 10,06 (d, $J = 2$ Hz, 1H), 7,79-7,84 (m, 2H), 7,67 (dd, $J = 10, 1$ Hz, 1H), 5,00 (s ancho, 2H), 3,99 (s, 3H); ESIMS m/z 327 ($[\text{M} + \text{H}]^+$).

6-Amino-2-(2-fluoro-4-formilfenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo



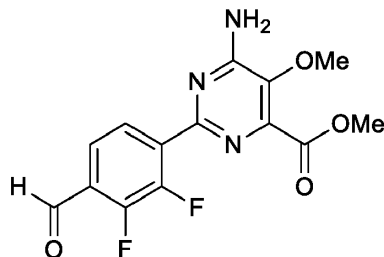
pf 176-178°C; RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 10,03 (d, $J = 2$ Hz, 1H), 8,10 (t, $J = 8$ Hz, 1H), 7,73 (dd, $J = 8, 1,5$ Hz, 1H), 7,65 (dd, $J = 8, 1,5$ Hz, 1H), 5,45 (s ancho, 2H), 4,00 (s, 3H), 3,96 (s, 3H); ESIMS m/z 306 ($[\text{M} + \text{H}]^+$).

10 4-Amino-3-cloro-6-(2,3-difluoro-4-formilfenil)-5-fluoropicolinato de metilo



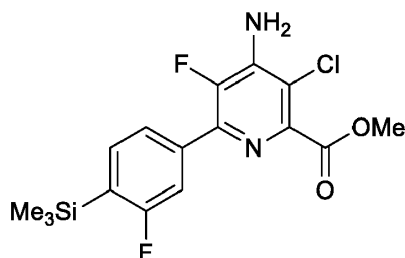
RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 10,40 (d, $J = 1$ Hz, 1H), 7,74 (m, 1H), 7,52 (m, 1H), 5,01 (s ancho, 2H), 3,97 (s, 3H).

6-Amino-2-(2,3-difluoro-4-formilfenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo



15 pf 184-186°C; RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 10,38 (d, $J = 0,5$ Hz, 1H), 7,84 (m, 1H), 7,67 (ddd, $J = 8, 6, 2$ Hz, 1H), 5,47 (s ancho, 2H), 4,01 (s, 3H), 3,96 (s, 3H); ESIMS m/z 324 ($[\text{M} + \text{H}]^+$).

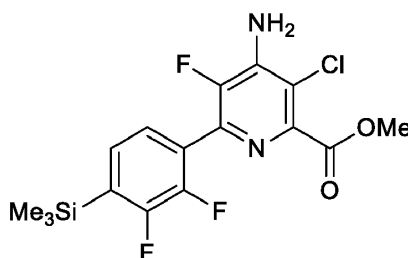
Ejemplo 48: Preparación de 4-amino-3-cloro-5-fluoro-6-(3-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo



Se añadieron secuencialmente dicloro[bis(trifenilfosfino)]-paladio(II) (150 mg, 0,21 mmoles, 0,10 equiv.) y carbonato de sodio (270 mg, 2,5 mmoles, 1,2 equiv.) a una mezcla bruta agitada de (2-fluoro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil)trimetilsilano (990 mg, 2,5 mmoles, 1,2 equiv.) y Compuesto principal B (500 mg, 2,1 mmoles, 1,0 equiv.) en una mezcla 1:1 de agua:acetonitrilo (7,0 mL) a 23°C. La mezcla de color naranja oscuro resultante se calentó a 85°C y se agitó durante 4 h. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua (150 mL) y se extrajo con diclorometano (3 x 80 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron (MgSO₄), se filtraron por gravedad y se concentraron por evaporación rotatoria. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (acetato de etilo en hexanos al 25%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un polvo de color amarillo pálido (500 mg, 65%); pf 125-127°C; IR (película delgada) 3481 (m), 3350 (s), 2952 (w), 1728 (m), 1610 (m) cm⁻¹; RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ 7,71 (dt, *J* = 6,5, 1 Hz, 1H), 7,59 (dt, *J* = 10,1 Hz, 1H), 7,50 (dd, *J* = 8, 6,5 Hz, 1H), 4,91 (s ancho, 2H), 3,99 (s, 3H), 0,33 (d, 9H); ESIMS *m/z* 371 ([M + H]⁺).

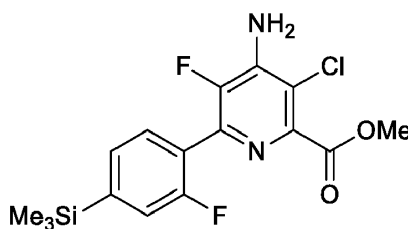
Los siguientes compuestos se elaboraron de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 48:

4-Amino-3-cloro-6-(2,3-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-fluoropicolinato de metilo



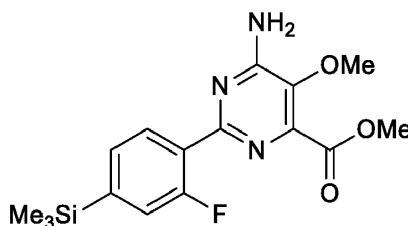
RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ 7,33 (ddd, *J* = 8, 4,5, 1 Hz, 1H), 7,21 (ddd, *J* = 8, 5, 1,5 Hz, 1H), 4,94 (s ancho, 2H), 3,96 (s, 3H), 0,33 (d, *J* = 1 Hz, 9H); ESIMS *m/z* 389 ([M + H]⁺).

4-Amino-3-cloro-5-fluoro-6-(2-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo



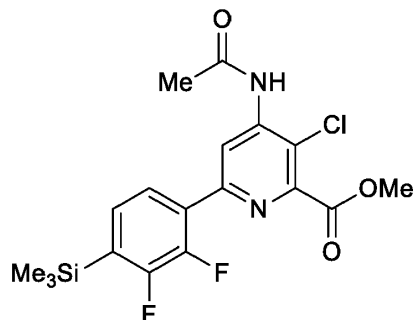
pf 175-177°C; RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ 7,58 (t, *J* = 8 Hz, 1H), 7,39 (dd, *J* = 8, 1 Hz, 1H), 7,27 (m, 1H), 4,91 (s ancho, 2H), 3,96 (s, 3H), 0,26 (s, 9H); ESIMS *m/z* 371 ([M + H]⁺).

6-Amino-2-(2-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo



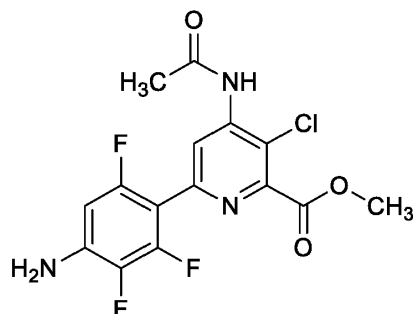
pf 140-142°C; RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ 7,85 (t, *J* = 8 Hz, 1H), 7,32 (dd, *J* = 8, 1 Hz, 1H), 7,26 (m, 1H), 5,38 (s ancho, 2H), 3,99 (s, 3H), 3,94 (s, 3H), 0,26 (s, 9H); ESIMS *m/z* 348 ([M-H]⁻).

4-Acetamido-3-cloro-6-(2,3-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo



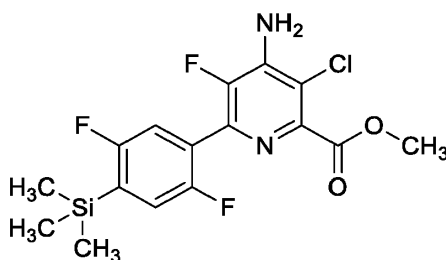
RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 9,04 (d, $J = 1$ Hz, 1H), 7,99 (s ancho, 1H), 7,65 (m, 1H), 7,18 (m, 1H), 4,00 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 0,33 (d, $J = 1$ Hz, 9H); ESIMS m/z 413 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

5 Ejemplo 49: Preparación de 4-acetamido-6-(4-amino-2,3,6-trifluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo



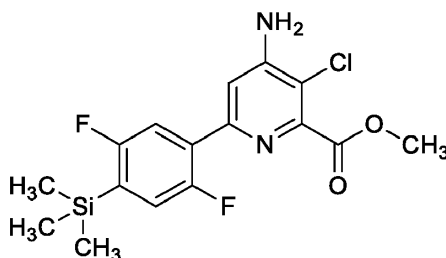
Se irradió una suspensión de 4-acetamido-3-cloro-6-(trimetilestannil)picolinato de metilo (Compuesto principal K; 0,502 g, 1,409 mmoles, 1,0 equiv.), 2,3,5-trifluoro-4-yodoanilina (0,5 g, 1,831 mmoles, 1,3 equiv.), cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (0,098 g, 0,1401 mmoles, 0,1 equiv.) y CuI (26 mg, 0,1401 mmoles, 0,1 equiv.) en DMF seca (3 mL) con microondas a 120°C durante 1 h. La mezcla de reacción se enfrió a 20°C y se agitó con una solución acuosa de fluoruro de potasio (KF) (20 mL) durante 15 min y a continuación se extrajo con acetato de etilo (3 x 100 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na_2SO_4 anhidro, se filtraron y se evaporaron hasta sequedad a presión reducida. El producto bruto se purificó en gel de sílice (malla 60-120) utilizando un gradiente de EtOAc en hexanos al 0-30%, produciendo el compuesto del título en forma de un sólido de color marrón (280 mg, 44,8%): RMN ^1H (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 9,96 (s, 1H), 8,32 (s, 1H), 6,51-6,46 (m, 1H), 6,22 (s ancho, 2H), 3,92 (s, 3H), 2,23 (s, 3H); ESIMS m/z 376 ($[\text{M} + 3\text{H}]^+$).

Ejemplo 50: Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(2,5-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-fluoropicolinato de metilo



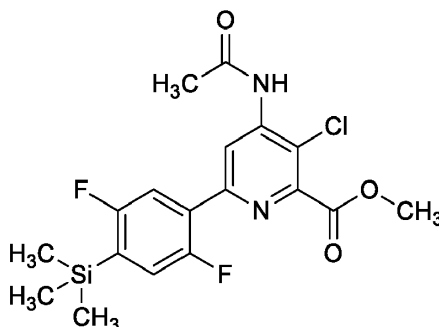
En un recipiente de microondas, se agitó una suspensión de (2,5-difluoro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil)trimetilsilano (véase, p. ej., el documento WO 2013003740 A1; 0,6 g, 1,922 mmoles), 4-amino-3,6-dicloro-5-fluoropicolinato de metilo (Compuesto principal B; 0,383 g, 1,601 mmoles), cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (0,112 g, 0,160 mmoles) y carbonato de sodio (0,204 g, 1,922 mmoles) en una mezcla 3:1 de acetonitrilo (4,00 mL) y agua (1,334 mL) con irradiación de microondas (120°C, 20 min). La mezcla de reacción se vertió en una solución de salmuera semi-saturada y se extrajo con EtOAc (3x). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na_2SO_4 , se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó mediante HPLC preparativa de fase inversa (gradiente de agua/acetonitrilo) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (0,271 g, 43,5%): RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 7,23 (dd, $J = 7,8, 5,1$ Hz, 1H), 7,13 (dd, $J = 9,3, 4,0$ Hz, 1H), 4,95 (s, 2H), 3,98 (s, 3H), 0,33 (d, $J = 0,8$ Hz, 9H); RMN ^{19}F (376 MHz, CDCl_3) δ -106,81, -106,87, -121,20, -121,25, -121,29, -121,35, -137,32, -137,41; ESIMS m/z 389 ($[\text{M} + \text{H}]^+$).

Ejemplo 51: Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(2,5-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo



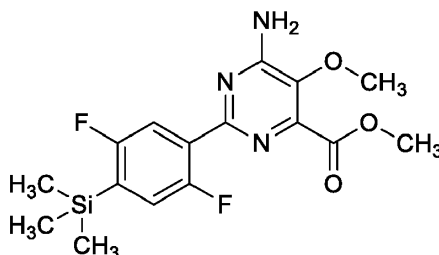
En un recipiente de microondas, se agitó una suspensión de (2,5-difluoro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil)trimetilsilano (véase, p. ej., el documento WO 2013003740 A1) (0,6 g, 1,922 mmoles), 4-amino-3,6-dicloropicolinato de metilo (Compuesto principal A) (0,354 g, 1,601 mmoles), cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (0,112 g, 0,160 mmoles) y carbonato de sodio (0,204 g, 1,922 mmoles) en una mezcla 3:1 de acetonitrilo (4,00 mL) y agua (1,334 mL) con irradiación de microondas (120°C, 20 min). La mezcla de reacción se vertió en una solución de salmuera semi-saturada y se extrajo con EtOAc (3x). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó mediante HPLC preparativa de fase inversa (gradiente de agua/acetonitrilo) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (0,234 g, 0,631 mmoles, 39,4%): RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ 7,66 (dd, *J* = 8,7, 5,8 Hz, 1H), 7,25 (d, *J* = 1,2 Hz, 1H), 7,09 (dd, *J* = 10,8, 4,1 Hz, 1H), 4,84 (s, 2H), 4,00 (s, 3H), 0,32 (d, *J* = 0,7 Hz, 9H); RMN ¹⁹F (376 MHz, CDCl₃) δ -106,56, -106,61, -124,00, -124,06; ESIMS *m/z* 371 ([M + H]⁺).

Ejemplo 52: Preparación de 4-acetamido-3-cloro-6-(2,5-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo



En un recipiente de microondas, se agitó una suspensión de (2,5-difluoro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil)trimetilsilano (véase, p. ej., el documento WO 2013003740 A1; 1 g, 2,56 mmoles), 4-acetamido-3,6-dicloropicolinato de metilo (Compuesto principal L; 0,562 g, 2,135 mmoles), cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (0,150 g, 0,214 mmoles) y carbonato de sodio (0,272 g, 2,56 mmoles) en una mezcla 3:1 de acetonitrilo (5,34 mL) y agua (1,779 mL) bajo irradiación de microondas (120°C, 20 min). La mezcla de reacción se vertió en una solución de salmuera semi-saturada y se extrajo con EtOAc (3x). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó mediante HPLC preparativa de fase inversa (gradiente de agua/acetonitrilo) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (0,481 g, 54,6%): pf 135-137°C; RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ 9,07 (d, *J* = 0,8 Hz, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,62 (dd, *J* = 8,5, 5,7 Hz, 1H), 7,13 (dd, *J* = 10,5, 4,1 Hz, 1H), 4,02 (s, 3H), 2,33 (s, 3H), 0,33 (d, *J* = 0,8 Hz, 9H); RMN ¹⁹F (376 MHz, CDCl₃) δ -106,66, -106,72, -123,42, -123,48; ESIMS *m/z* 411 ([M-H]⁻).

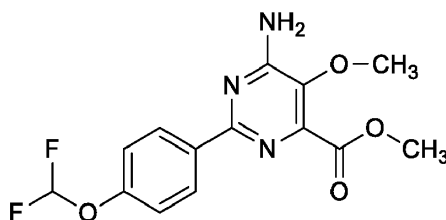
Ejemplo 53: Preparación de 6-amino-2-(2,5-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo



En un recipiente de microondas, se agitó una suspensión de (2,5-difluoro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil)trimetilsilano (p. ej., documento WO 2013003740 A1; 1,925 g, 5,05 mmoles), 6-amino-2-cloro-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (Compuesto principal C; 1 g, 4,60 mmoles), cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (0,323 g, 0,460 mmol) y carbonato de sodio (0,584 g, 5,51 mmoles) en una mezcla 3:1

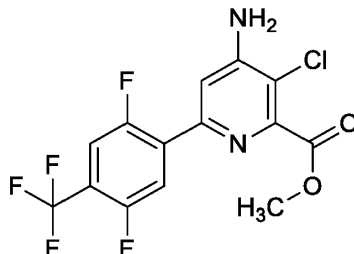
de acetonitrilo (8,62 mL) y agua (2,87 mL) bajo irradiación de microondas (120°C, 20 min). La mezcla de reacción se vertió en una solución de salmuera semi-saturada y se extrajo con EtOAc (3x). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó mediante HPLC preparativa de fase inversa (gradiente de agua/acetonitrilo) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (0,994 g, 58,9%); pf 130-131°C; RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 7,53 (dd, *J* = 8,4, 5,6 Hz, 1H), 7,10 (dd, *J* = 10,2, 4,1 Hz, 1H), 5,44 (s, 2H), 4,00 (s, 3H), 3,94 (s, 3H), 0,32 (d, *J* = 0,9 Hz, 9H); RMN F¹⁹ (376 MHz, CDCl₃) δ -107,45, -107,51, -122,32, -122,37; ESIMS *m/z* 367 ([M]⁺).

Ejemplo 56: Preparación de 6-amino-2-(4-(difluorometoxi)fenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (Compuesto 106)



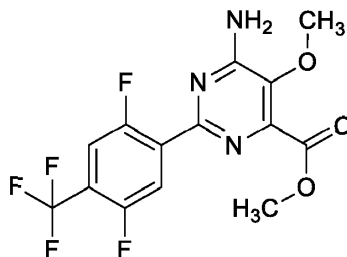
Se agregaron a un vial de 5 mL apto para microondas, fluoruro de potasio (0,151 g, 2,59 mmoles), acetato de paladio (II) (0,012 g, 0,052 mmoles), 2-(4-(difluorometoxi)fenil)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (0,28 g, 1,037 mmoles), 6-amino-2-cloro-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (0,226 g, 1,037 mmoles) y 3,3',3''-fosfinetriiltribenzenosulfonato (0,052 g, 0,104 mmoles). Se añadió una mezcla de agua (1 mL) y acetonitrilo (2 mL), y la reacción se tapó y se colocó en un reactor de microondas Biotage™ Initiator durante 6 min a 160°C, con control de la temperatura con un sensor de IR externo desde el lado del recipiente. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se diluyó con EtOAc (50 mL) y agua (50 mL). Se realizó una extracción adicional con CH₂Cl₂ (50 mL) se combinó con el EtOAc y se secó sobre Na₂SO₄ (50 g) después del CH₂Cl₂ la capa se filtró a través de un tapón de algodón. Los extractos orgánicos combinados se concentraron en un evaporador rotatorio y el residuo se purificó utilizando un sistema de purificación Teledyne ISCO con un sistema de gradiente de eluyente de CH₂Cl₂ y EtOAc para producir el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (134,4 mg, 39,8%).

Ejemplo 59: Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(2,5-difluoro-4-(trifluorometil)fenil)picolinato de metilo (Compuesto 70)



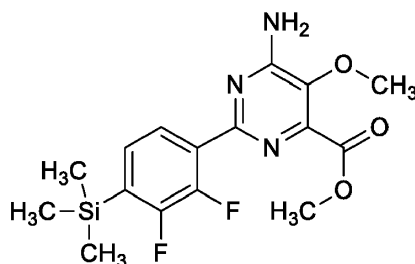
Se combinaron 1,4-difluoro-2-yodo-5-(trifluorometil)benceno (250 mg, 0,81 mmoles), Compuesto principal K (318 mg, 0,81 mmoles), yoduro de cobre(I) (0,08 mmoles) y cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (57 mg, 0,08 mmoles) en DMF seca (5 mL), se desairearon con una corriente de nitrógeno durante 10 min y se calentaron a 75°C. Después de 2 h, la mezcla se enfrió y se repartió entre acetato de etilo y agua. La fase orgánica se lavó con NaCl saturado, se secó (Na₂SO₄), y se evaporó. El producto bruto se purificó mediante cromatografía instantánea (SiO₂; eluyendo con acetato de etilo en hexanos al 0-30%) para proporcionar 100 mg del compuesto intermedio de acetamida. Este material se recogió en metanol (20 mL), se trató con cloruro de acetilo (3 mL) y se agitó durante 3 días a 20°C. Después de la eliminación de los compuestos volátiles a vacío, la mezcla se agitó con NaHCO₃ saturado y acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con NaCl saturado, se secó (Na₂SO₄), y se evaporó para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (77 mg, 24%).

Ejemplo 60: Preparación de 6-amino-2-(2,5-difluoro-4-(trifluorometil)fenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (Compuesto 148)



Se combinaron 2-(2,5-difluoro-4-(trifluorometil)fenil)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (400 mg, 1,2 mmoles), Compuesto principal C (250 mg, 1,2 mmoles), fluoruro de cesio (360 mg, 2,3 mmoles) y cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (82 mg, 0,12 mmoles) en 1:1 volumen por volumen (v/v) de acetonitrilo-agua (4 mL) y se calentaron a 115°C durante 30 min en un reactor de microondas. La mezcla se repartió entre agua y acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con NaCl saturado, se secó (Na₂SO₄), y se evaporó. El material fue purificado mediante cromatografía instantánea (SiO₂; eluyendo con acetato de etilo en hexanos al 0-30%) para proporcionar un aceite de color marrón que se trituró con hexanos-diclorometano para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (40 mg, 8,8%).

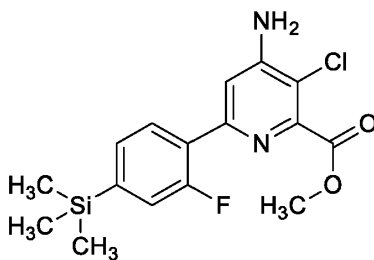
Ejemplo 61: Preparación de 6-amino-2-(2,3-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo



Se combinaron (2,3-difluoro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil)trimetilsilano (1,3 g, 4,2 mmoles) (p. ej., documento WO 2013003740 A1), Compuesto principal C (750 mg, 3,5 mmoles) y cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (240 mg, 0,34 mmoles) en acetonitrilo-agua 1:1 v/v (10 mL) y se calentaron a 115°C durante 30 min por medio de microondas. La mezcla enfriada se repartió entre NaCl saturado y acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con NaCl saturado, se secó (Na₂SO₄), y se evaporó. El material fue purificado mediante cromatografía instantánea (SiO₂; eluyendo con acetato de etilo en hexanos al 0-20%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (330 mg, 26%); pf 157-159°C; RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 7,60 (ddd, *J* = 7,5, 6,0, 1,2 Hz, 1H), 7,14 (ddd, *J* = 7,7, 4,5, 1,5 Hz, 1H), 5,48 (s, 2H), 4,00 (s, 3H), 3,95 (s, 3H), 0,34 (d, *J* = 0,7 Hz, 9H); RMN F¹⁹ (376 MHz, CDCl₃) δ -127,10 a -127,25 (m), -142,40 (dd, *J* = 22,6, 3,6 Hz); ESIMS *m/z* 368 ([M + H]⁺).

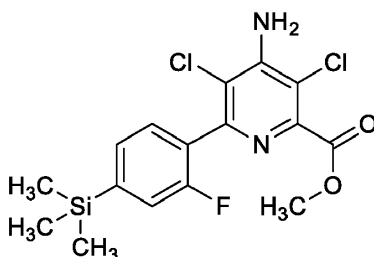
Los siguientes compuestos se elaboraron de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 61 a partir de 2-fluoro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)fenil)trimetilsilano disponible comercialmente (preparado de acuerdo con el documento WO 2013003740 A1):

4-Amino-3-cloro-6-(2-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo (preparado utilizando la Compuesto principal A)



pf 154-156°C; RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 7,97 (m, 1H), 7,30 (m, 3H), 4,84 (s, 2H), 4,01 (s, 3H), 0,293 (s, 9H); ESIMS *m/z* 353 ([M + H]⁺).

4-Amino-3,5-dicloro-6-(2-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo (preparado utilizando la Compuesto principal H)



pf 184-185°C; RMN H¹ (400 MHz, CDCl₃) δ 7,35 (m, 3H), 5,33 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 0,290 (s, 9H); ESIMS *m/z* 387 ([M + H]⁺).

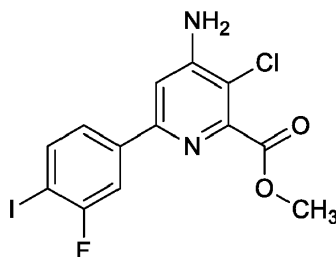
Ejemplo 62: Procedimiento general para el acoplamiento de Suzuki (Método A)

Se burbujeó argón a través de una solución de Compuesto principal A, Compuesto principal B o Compuesto principal C (1,0 equiv.), ácido borónico (1,0 equiv.), Na_2CO_3 (2,0 equiv.) y $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (0,1 equiv.) en 1:1 tolueno:etanol (20 vol) durante 15 min en un tubo sellado. La mezcla de reacción se calentó a continuación en el tubo sellado a 110°C durante 18 h. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. (Nota: la capa acuosa contenía productos de ácido carboxílico que se aislaron como se describe a continuación). Los extractos orgánicos se lavaron con agua, se lavaron con solución salina saturada, se secaron (Na_2SO_4), se filtró y se evaporó hasta sequedad a presión reducida. El producto bruto se purificó mediante TLC preparativa para obtener los ésteres puros. La capa acuosa se aciduló a pH 2 utilizando HCl 1,5 N y se extrajo con acetato de etilo. El extracto orgánico se lavó con solución saturada de salmuera, se secó (Na_2SO_4), se filtró y se evaporó hasta sequedad a presión reducida. El producto bruto se purificó mediante TLC preparativa para obtener los derivados de ácido carboxílico puros.

Ejemplo 63: Procedimiento general para el acoplamiento de Suzuki (Método B)

Se burbujeó argón a través de una solución de Compuesto principal A, Compuesto principal B o Compuesto principal C (0,8 equiv.), ácido borónico (1,0 equiv.), NaHCO_3 (Solución 2M, 1,0 equiv.) y $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (0,1 equiv.) en dioxano seco (20 vol) durante 15 min en un tubo sellado. El tubo sellado se calentó a 80°C durante 18 h. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. El extracto orgánico se lavó con agua, se lavó con solución saturada de salmuera, se secó (Na_2SO_4), se filtró y se evaporó hasta sequedad a presión reducida. El producto bruto se purificó mediante cromatografía instantánea (SiO_2 ; eluyendo con acetato de etilo en hexanos al 5-40%) para proporcionar el compuesto puro.

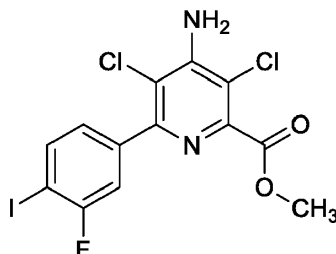
Ejemplo 64: Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(3-fluoro-4-yodofenil)picolinato de metilo (Compuesto 66)



A un matraz de fondo redondo de 250 mL, equipado con una barra de agitación, 4-amino-3-cloro-6-(3-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo (0,328 g, 0,930 mmoles), y diclorometano (5,0 mL). A esta solución se le añadió monoclورو de yodo (0,141 mL, 2,79 mmoles). La mezcla de reacción se dejó agitando a temperatura ambiente durante 18 h. Se añadió otra porción de monoclورو de yodo (0,141 mL, 2,79 mmoles) y la reacción se dejó agitando a temperatura ambiente durante 4,5 h adicionales. La mezcla de reacción se vertió en Na_2SO_3 1 M, y las capas se repartieron. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo adicional (2 x 100 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO_4 anhidro, se filtraron y se concentraron para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color marrón (0,375 g, 99%):

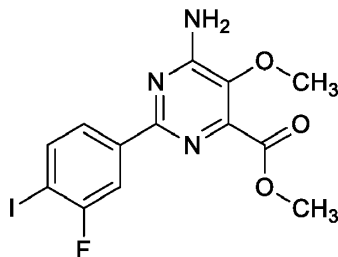
Los siguientes compuestos se elaboraron de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 64:

4-Amino-3,5-dicloro-6-(3-fluoro-4-yodofenil)picolinato de metilo (Compuesto 13)



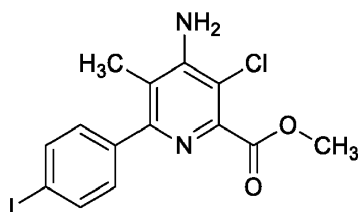
El compuesto del título se preparó como se describe en el Ejemplo 64 con 4-amino-3,5-dicloro-6-(3-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo (0,381 g, 0,984 mmoles) y se aisló en forma de un sólido de color amarillo (0,360 g, 83%).

6-Amino-2-(3-fluoro-4-yodofenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (Compuesto 27)



El compuesto del título se preparó como se describe en el Ejemplo 64 con 6-amino-2-(3-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (0,307 g, 0,879 mmoles) y se aisló en forma de un sólido de color amarillo (0,368 g).

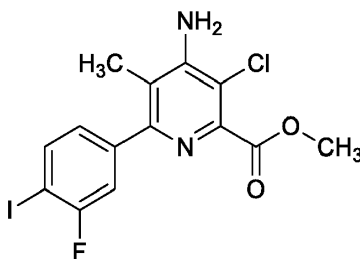
Ejemplo 65: Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(4-yodofenil)-5-metilpicolinato de metilo (Compuesto 136) (no de acuerdo con la presente invención)



Se añadió a 4-amino-3-cloro-5-metil-6-(4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo (0,95 g, 2,72 mmoles) en diclorometano (9 mL) monoclورو de yodo gota a gota (920 mg, 5,67 mmoles) en diclorometano (4,5 mL). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante 4 h, a continuación se sofocó con tiosulfato de sodio acuoso saturado, se diluyó con agua y se extrajo con diclorometano (3x). Las capas orgánicas se secaron sobre Na₂SO₄ anhidro, se filtraron y se concentraron. La purificación mediante cromatografía instantánea (acetato de etilo/hexanos al 0-30%) proporcionó el compuesto del título en forma de un sólido de color rojo anaranjado (618 mg, 56%).

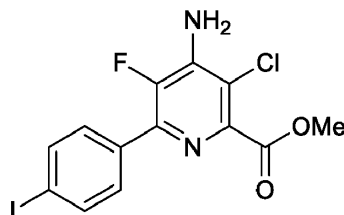
El siguiente compuesto se preparó de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 65:

4-Amino-3-cloro-6-(3-fluoro-4-yodofenil)-5-metilpicolinato de metilo (Compuesto 79)



El compuesto del título se preparó como en el Ejemplo 65 y se aisló en forma de un sólido de color blanquecino (54 mg, 59%).

Ejemplo 66: Preparación de 4-amino-6-(4-yodofenil)-3-cloro-5-fluoropicolinato de metilo (Compuesto 118) (no de acuerdo con la presente invención)

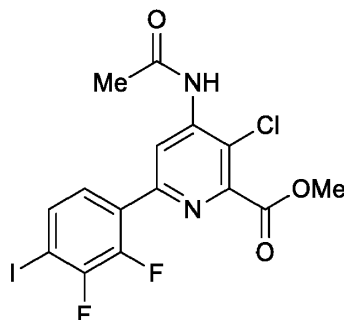


Se añadió monoclورو de yodo (280 mg, 1,7 mmoles, 2,0 equiv.) a una solución agitada de 4-amino-3-cloro-5-fluoro-6-(4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo (300 mg, 0,85 mmoles, 1,0 equiv.) en 1,2-dicloroetano (5,7 mL) a 23°C. La solución de color marrón resultante se agitó a 23°C durante 17 h. La mezcla de reacción se diluyó con una solución saturada de tiosulfato de sodio (100 mL) y se extrajo con diclorometano (4 x 40 mL). Las capas orgánicas

combinadas se secaron (MgSO_4), se filtraron por gravedad y se concentraron por evaporación rotatoria. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (acetato de etilo en hexanos al 33%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un polvo de color morado pálido (250 mg, 71%).

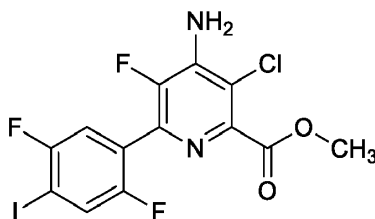
Los siguientes compuestos se elaboraron de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 66:

5 4-Acetamido-3-cloro-6-(2,3-difluoro-4-yodofenil)picolinato de metilo



RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 9,06 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 7,98 (s ancho, 1H), 7,60 (ddd, $J = 9, 5, 2$ Hz, 1H), 7,53 (ddd, $J = 9, 7, 2$ Hz, 1H), 4,03 (s, 3H), 2,34 (s, 3H); ESIMS m/z 467 ($[\text{M} + \text{H}]^+$).

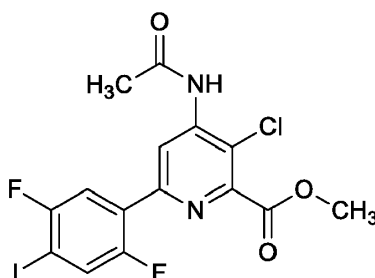
Ejemplo 67: Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(2,5-difluoro-4-yodofenil)-5-fluoropicolinato de metilo (Compuesto 55)



A una solución de 4-amino-3-cloro-6-(2,5-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-fluoropicolinato de metilo (0,280 g, 0,720 mmoles) en CH_2Cl_2 (2,88 mL) a 20°C , se le añadió monoclورو de yodo (0,144 mL, 2,880 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a 20°C durante la noche. La mezcla se vertió a continuación en una solución acuosa al 10% de Na_2SO_3 , se extrajo con EtOAc (3x), se secó sobre Na_2SO_4 , se filtró y se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía instantánea en columna (SiO_2 ; gradiente de hexanos/EtOAc) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (0,237 g, 74,4%).

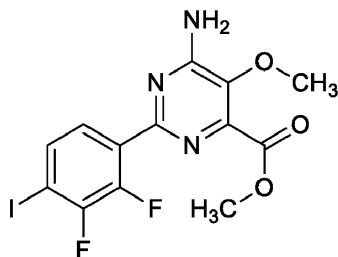
El siguiente compuesto se preparó de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 67:

4-Acetamido-3-cloro-6-(2,5-difluoro-4-yodofenil)picolinato de metilo



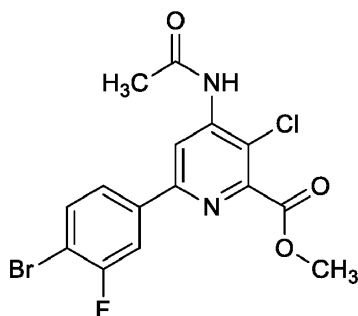
RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 9,10 (d, $J = 0,7$ Hz, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,76 (dd, $J = 8,4, 6,4$ Hz, 1H), 7,57 (dd, $J = 9,8, 5,0$ Hz, 1H), 4,03 (s, 3H), 2,33 (s, 3H); RMN ^{19}F (376 MHz, CDCl_3) δ -99,95, -100,00, -119,90, -119,95; ESIMS m/z 465 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Ejemplo 68: Preparación de 6-amino-2-(2,3-difluoro-4-yodofenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (Compuesto 24)



Se agitó 6-amino-2-(2,3-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (330 mg, 0,90 mmoles) en 1,2-dicloroetano (5 mL), se trató con monodocloruro de yodo (1,0 g, 6,9 mmoles) y se calentó a 70°C durante 21 h. Después de enfriar, la mezcla se diluyó con acetato de etilo, se lavó con bisulfito de sodio al 15%, se lavó con NaCl saturado y se secó (Na₂SO₄), y se evaporó. El material se purificó mediante RP-HPLC utilizando acetonitrilo al 70% para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (250 mg, 66%).

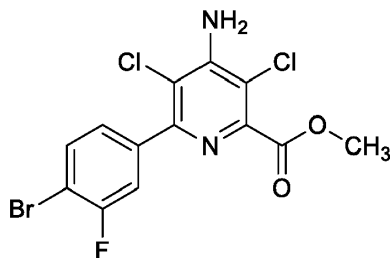
Ejemplo 69: Preparación de 4-acetamido-6-(4-bromo-3-fluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo



Aun matraz de fondo redondo de 100 mL, equipado con una barra de agitación, se le añadieron 4-acetamido-3-cloro-6-(3-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo (433 mg, 1,11 mmoles), diclorometano (10 mL) y bromo (0,225 mL, 4,39 mmoles). La mezcla de reacción se dejó agitando a temperatura ambiente durante 18 h. La mezcla de reacción se vertió a continuación en Na₂SO₃ 1 N y se extrajo con acetato de etilo (3 x 50 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO₄ anhidro, se filtraron y se concentraron. El residuo resultante se purificó mediante cromatografía instantánea (EtOAc en hexanos al 0-50%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color tostado claro (0,440 g, 100%): RMN H¹ (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 10,02 (s, 1H), 8,71 (s, 1H), 7,98-7,81 (m, 2H), 7,74 (dd, *J* = 8,4, 2,1 Hz, 1H), 3,94 (s, 3H), 2,23 (s, 3H); RMN F¹⁹ (376 MHz, DMSO-*d*₆) δ -107,44; ESIMS *m/z* 402 ([M + H]⁺).

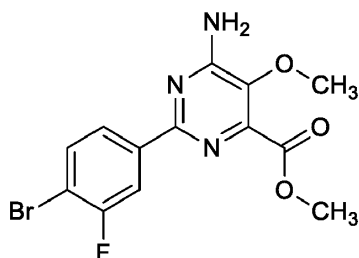
Los siguientes compuestos se elaboraron de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 69:

4-Amino-6-(4-bromo-3-fluorofenil)-3,5-dicloropicolinato de metilo (Compuesto 73)



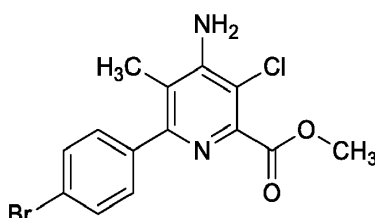
El compuesto del título se preparó como se describe en el Ejemplo 69 con 4-amino-3,5-dicloro-6-(3-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo (0,290 g, 0,749 mmoles) y se aisló en forma de un sólido de color blanco (0,250 g, 85%).

6-Amino-2-(4-bromo-3-fluorofenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (Compuesto 171)



El compuesto del título se preparó como se describe en el Ejemplo 69 con 6-amino-2-(3-fluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (0,250 g, 0,715 mmoles) y se aisló en forma de un sólido de color blanco (0,200 g, 78%).

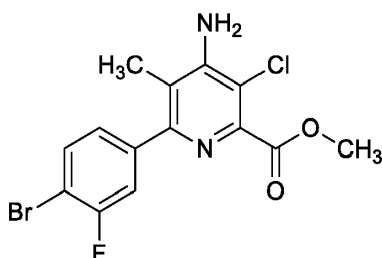
Ejemplo 70: Preparación de 4-amino-6-(4-bromofenil)-3-cloro-5-metilpicolinato de metilo (Compuesto 81) (no de acuerdo con la presente invención)



Se añadió a 4-amino-3-cloro-5-metil-6-(4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo (150 mg, 0,43 mmoles) y carbonato de potasio (215 mg, 1,56 mmoles) en 1,2-dicloroetano (DCE, 2,9 mL) se le añadió bromo (0,03 mL, 0,58 mmoles) y se agitó a temperatura ambiente durante 18 h. El DCE se concentró a vacío y el material bruto se repartió entre acetato de etilo y carbonato de potasio acuoso. La capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (3x), se lavó con agua, se secó sobre MgSO₄ anhidro, se filtró y se absorbió sobre gel de sílice. La purificación mediante cromatografía instantánea (acetato de etilo/hexanos al 0-40%) proporcionó del título en forma de un polvo de color naranja pálido (68 mg, 45%).

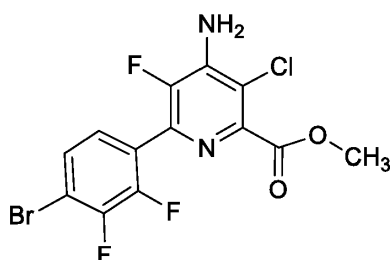
El siguiente compuesto se preparó de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 70:

4-Amino-6-(4-bromo-3-fluorofenil)-3-cloro-5-metilpicolinato de metilo (Compuesto 112)



El compuesto del título se preparó como en el Ejemplo 70 y se aisló en forma de un sólido de color blanquecino (96 mg, 52%).

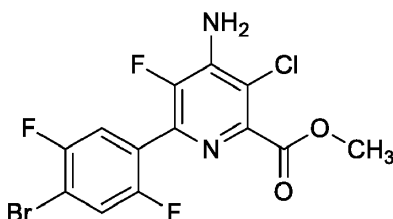
Ejemplo 71: Preparación de 4-amino-6-(4-bromo-2,3-difluorofenil)-3-cloro-5-fluoropicolinato de metilo (Compuesto 109)



Se disolvió 4-amino-3-cloro-6-(2,3-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-fluoropicolinato de metilo (2,5 g, 6,43 mmoles) en acetonitrilo (32 mL) y se añadió bromo (3,31 mL, 64,3 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a temperatura

ambiente durante 4 h, momento en el que la cromatografía líquida-espectrometría de masas (LC-MS) indicó que la reacción estaba casi completa. La mezcla de reacción se repartió entre diclorometano y agua y se añadió tiosulfato de sodio (10,17 g, 64,3 mmoles). La fase acuosa se extrajo con diclorometano y los extractos orgánicos se combinaron y se concentraron a vacío. El producto se purificó mediante cromatografía instantánea (SiO_2 ; eluyendo con acetato de etilo en hexanos al 5-40%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color amarillo claro (1,62 g, 63,7%).

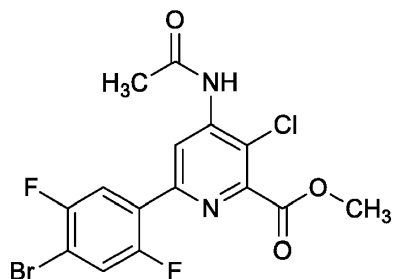
Ejemplo 73: Preparación de 4-amino-6-(4-bromo-2,5-difluorofenil)-3-cloro-5-fluoropicolinato de metilo (Compuesto 51)



A una solución de 4-amino-3-cloro-6-(2,5-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-fluoropicolinato de metilo (0,240 g, 0,617 mmoles) en CH_2Cl_2 (2,469 mL) a 20°C se le añadió bromo (0,127 mL, 2,469 mmoles). Después de 24 h, la mezcla de reacción se vertió en una solución acuosa saturada de $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$ y se extrajo con EtOAc (3x). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na_2SO_4 , se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía instantánea en columna (SiO_2 ; gradiente de hexanos/EtOAc) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (0,187 g, 77%).

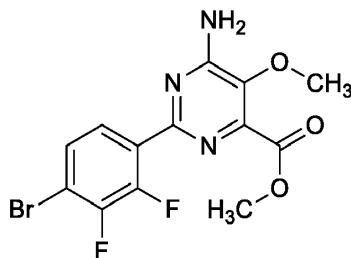
El siguiente compuesto se preparó de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 73:

4-Acetamido-6-(4-bromo-2,5-difluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo



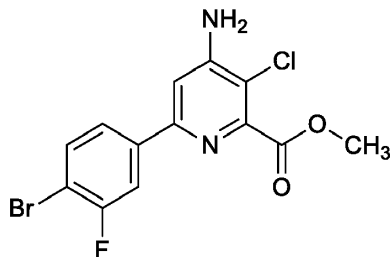
pf 177-179°C; RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) δ 9,10 (d, $J = 0,7$ Hz, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,85 (dd, $J = 9,1, 6,6$ Hz, 1H), 7,40 (dd, $J = 9,9, 5,5$ Hz, 1H), 4,03 (s, 3H), 2,33 (s, 3H); RMN ^{19}F (376 MHz, CDCl_3) δ -112,76, -112,80, -119,21, -119,26; ESIMS m/z 418 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Ejemplo 74: Preparación de 6-amino-2-(4-bromo-2,3-difluorofenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (Compuesto 122)



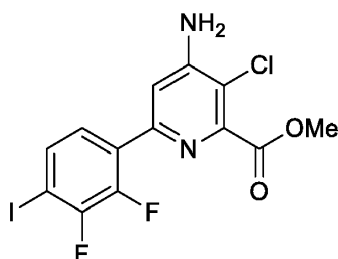
Se agitó 6-amino-2-(2,3-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (350 mg, 0,95 mmoles) en 1,2-dicloroetano (4 mL), se trató con bromo (1,0 g, 6,3 mmoles), y se calentó a 60°C durante 6 h. Después de enfriar, la mezcla se agitó con una solución de bisulfito de sodio al 15% hasta que dio negativo en un papel de almidón y yodo. La mezcla se diluyó con acetato de etilo, se lavó con NaCl saturado, se secó (Na_2SO_4), y se evaporó. La purificación mediante cromatografía instantánea (SiO_2 ; eluyendo con acetato de etilo en hexanos al 0-30%) proporcionó el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (75 mg, 23%).

Ejemplo 75: Preparación de 4-amino-6-(4-bromo-3-fluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo (Compuesto 115)



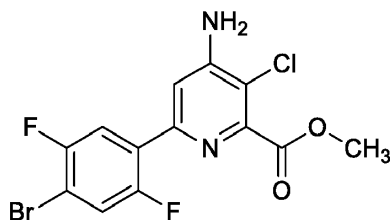
A un matraz de fondo redondo de 100 mL, equipado con una barra de agitación, se le añadieron 4-acetamido-6-(4-bromo-3-fluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo (0,411 g, 1,023 mmoles), metanol (5,12 mL) y cloruro de acetilo (1,45 mL, 20,5 mmoles). La mezcla de reacción se dejó agitando a temperatura ambiente durante 18 h. El disolvente se eliminó con un evaporador rotatorio. El sólido resultante se disolvió en NaHCO_3 1 N y se extrajo con acetato de etilo (3 x 75 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO_4 anhidro, se filtraron y se concentraron para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (0,324 g, 88%).

Ejemplo 76: Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(2,3-difluoro-4-yodofenil)picolinato de metilo (Compuesto 129)



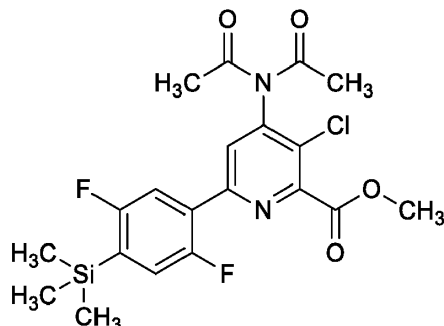
Se añadió lentamente cloruro de acetilo (1,3 mL, 18 mmoles, 10 equiv.) a metanol (12 mL) y se agitó a 23°C durante 30 min. Se añadió 4-acetamido-3-cloro-6-(2,3-difluoro-4-yodofenil)picolinato de metilo (830 mg, 1,8 mmoles, 1,0 equiv.) y la mezcla de color blanco heterogénea se agitó a 23°C durante 18 h. La mezcla de reacción se concentró por evaporación rotatoria. El residuo se diluyó con bicarbonato de sodio saturado (200 mL) y se extrajo con diclorometano (3 x 75 mL). La capa orgánica se secó (MgSO_4), se filtró por gravedad y se concentró mediante evaporación rotatoria para proporcionar el compuesto del título en forma de un polvo de color blanco (720 mg, 95%).

Ejemplo 77: Preparación de 4-amino-6-(4-bromo-2,5-difluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo (Compuesto 127)



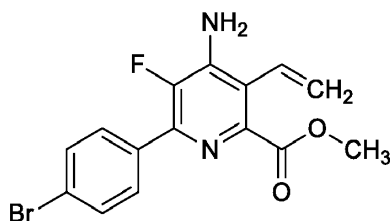
Se añadió lentamente cloruro de acetilo (1,017 mL, 14,30 mmoles) a una solución de 4-acetamido-6-(4-bromo-2,5-difluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo (0,300 g, 0,715 mmoles) en una mezcla de metanol (3,57 mL) y THF (3,57 mL). La mezcla de reacción se agitó a 20°C durante 2 h. La mezcla se vertió a continuación en una solución acuosa saturada de NaHCO_3 y se extrajo con EtOAc (3x). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na_2SO_4 , se filtraron, se concentraron y se secaron a vacío para proporcionar 4-amino-6-(4-bromo-2,5-difluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo (0,257 g, 95%) en forma de un sólido de color blanco.

Ejemplo 78: Preparación de 4-(*N*-acetilacetamido)-3-cloro-6-(2,5-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo



A una solución de 4-amino-3-cloro-6-(2,5-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo (0,280 g, 0,755 mmoles) en dicloroetano (3,02 mL), se le añadieron *N,N*-diisopropiletilamina (0,396 mL, 2,265 mmoles) y cloruro de acetilo (0,107 mL, 1,510 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a 20°C durante 4 h y a continuación a 60°C durante 2 h. La mezcla se vertió en una solución acuosa saturada de NH₄Cl y se extrajo con EtOAc (3x). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía instantánea en columna (SiO₂; gradiente de hexanos/EtOAc) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color amarillo claro (104 mg, 30,3%); pf 121-123°C; RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) δ 7,88 (d, *J* = 0,7 Hz, 1H), 7,79 (dd, *J* = 8,5, 5,8 Hz, 1H), 7,15 (dd, *J* = 10,9, 4,1 Hz, 1H), 4,05 (s, 3H), 2,35 (s, 6H), 0,35 (d, *J* = 0,8 Hz, 9H); ESIMS *m/z* 455 ([*M* + *H*]⁺).

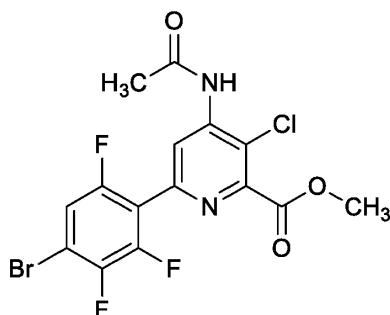
Ejemplo 79: Preparación de 4-amino-6-(4-bromofenil)-5-fluoro-3-vinilpicolinato de metilo (Compuesto 57) (no de acuerdo con la presente invención)



A una suspensión a 0°C de tetrafluoroborato de nitrosilo (0,122 g, 1,044 mmoles) en CH₂Cl₂ (2 mL) se le añadió una solución de 4-amino-6-(4-aminofenil)-5-fluoro-3-vinilpicolinato de metilo (0,3 g, 1,044 mmoles) en una mezcla 1:1 de CH₂Cl₂ y CH₃CN (10 mL). La mezcla de reacción se agitó a 0°C durante 30 min, a continuación se añadió gota a gota a una suspensión de bromuro de potasio (0,497 g, 4,18 mmoles), 18-corona-6 (0,028 g, 0,104 mmoles), bromuro de cobre(II) (0,023 g, 0,104 mmoles), bromuro de cobre(I) (0,015 g, 0,104 mmoles) y 1,10-fenantrolina (0,019 g, 0,104 mmoles). La mezcla se agitó a 20°C durante 1 h. Se añadió bromuro de cobre(I) adicional (0,749 g, 5 equiv.) y la mezcla de reacción se agitó a 20°C durante 1 h adicional. La mezcla de reacción se diluyó con Et₂O y se filtró sobre una almohadilla corta de Celite®. El sobrenadante se concentró y se purificó mediante cromatografía instantánea en columna (SiO₂; gradiente de hexanos/EtOAc) seguido de HPLC preparativa de fase inversa (gradiente de agua/acetonitrilo) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color marrón claro (130 mg, 35,5%).

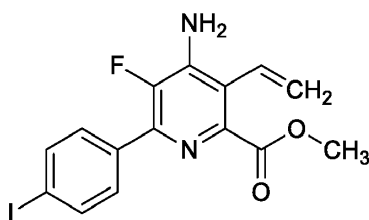
El siguiente compuesto se preparó de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 79:

4-Acetamido-6-(4-bromo-2,3,6-trifluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo



RMN ¹H (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 10,08 (s, 1H), 8,48 (s, 1H), 7,87-7,84 (m, 1H), 3,93 (s, 3H), 2,25 (s, 3H); ESIMS *m/z* 437 ([*M* + 2*H*]⁺).

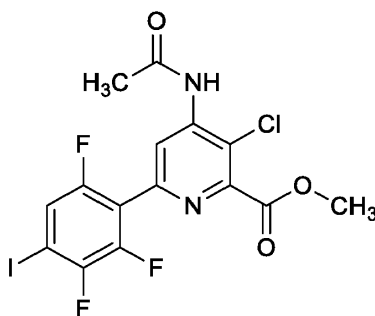
Ejemplo 81: Preparación de 4-amino-5-fluoro-6-(4-yodofenil)-3-vinilpicolinato de metilo (Compuesto 139) (no de acuerdo con la presente invención)



A una suspensión a 0°C de tetrafluoroborato de nitrosilo (0,041 g, 0,348 mmoles) en CH₂Cl₂ (1 mL) se le añadió una solución de 4-amino-6-(4-aminofenil)-5-fluoro-3-vinilpicolinato de metilo (0,1 g, 0,348 mmoles) en una mezcla 1:1 de CH₂Cl₂ y CH₃CN (4 mL). La mezcla de reacción se agitó a 0°C durante 30 min, a continuación se añadió una solución de yoduro de sodio (0,261 g, 1,740 mmoles) disuelto en un mínimo de agua y la mezcla de reacción se agitó a 20°C durante 30 min. La mezcla se vertió a continuación en una solución acuosa al 10% de sulfito de sodio y se extrajo con EtOAc (3x). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía instantánea en columna (SiO₂; gradiente de hexanos/EtOAc) seguido de HPLC preparativa de fase inversa (gradiente de agua/acetonitrilo) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (32 mg, 23,09%).

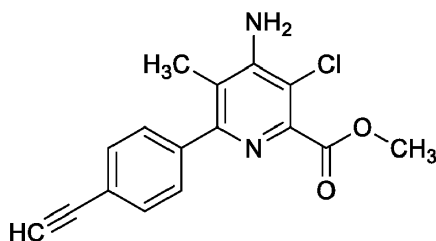
El siguiente compuesto se preparó de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 81:

4-Acetamido-3-cloro-6-(2,3,6-trifluoro-4-yodofenil)picolinato de metilo



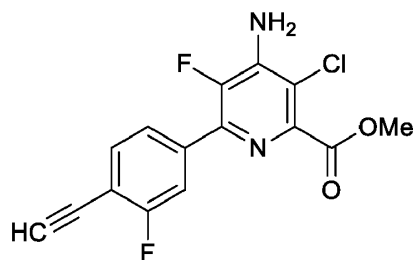
RMN ¹H (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 10,07 (s, 1H), 8,46 (s, 1H), 7,89-7,85 (m, 1H), 3,93 (s, 3H), 2,25 (s, 3H); ESIMS *m/z* 487 ([M + 3H]⁺).

Ejemplo 83: Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(4-etinilfenil)-5-metilpicolinato de metilo (Compuesto 40)



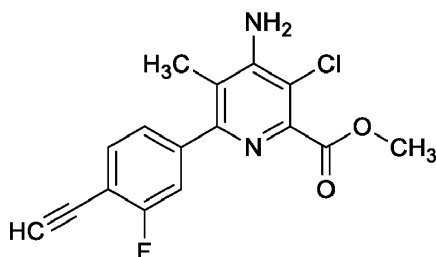
A 4-amino-3-cloro-5-metil-6-(4-((trimetilsilil)etnil)fenil)-picolinato de metilo (50 mg, 0,13 mmoles) en metanol (0,7 mL), se le añadió carbonato de potasio (24 mg, 0,17 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 40 min, a continuación se diluyó con agua y se extrajo con diclorometano (4x). Las capas orgánicas se secaron sobre MgSO₄ anhidro, se filtraron y se concentraron para proporcionar el compuesto del título en forma de un aceite de color marrón (34 mg, 84%).

Ejemplo 86: Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(4-etinil-3-fluorofenil)-5-fluoropicolinato de metilo (Compuesto 133)



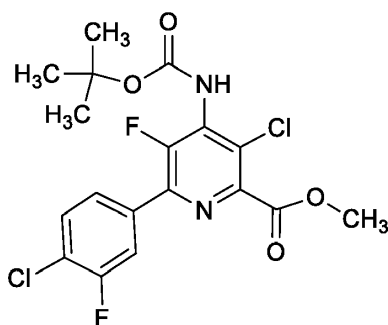
Se añadió 1-diazo-2-oxopropilfosfonato de dimetilo (290 mg, 1,5 mmoles, 1,2 equiv.) a una mezcla agitada de 4-amino-3-cloro-5-fluoro-6-(3-fluoro-4-formilfenil)picolinato de metilo (410 mg, 1,3 mmoles, 1,0 equiv.) y carbonato de potasio sólido (350 mg, 2,5 mmoles, 2,0 equiv.) en metanol (12 mL) a 23°C. La mezcla de color amarillo pálido resultante se agitó a 23°C durante 2 h. La mezcla de reacción se diluyó con agua (150 mL) y se extrajo con diclorometano (4 x 60 mL). Las capas orgánicas se secaron (MgSO₄), se filtraron por gravedad y se concentraron por evaporación rotatoria. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (acetato de etilo en hexanos al 33%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un polvo de color blanco (150 mg, 38%).

Ejemplo 87. Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(4-etinil-3-fluorofenil)-5-metilpicolinato de metilo (Compuesto 151)



A una solución de 4-amino-3-cloro-6-(3-fluoro-4-formilfenil)-5-metilpicolinato de metilo (358 mg, 1,1 mmoles) y carbonato de potasio (537 mg, 3,9 mmoles) en metanol (11 mL) a temperatura ambiente se le añadió (1-diazo-2-oxopropilo)fosfonato de dimetilo (reactivo de Bestmann-Ohira, reactivo bruto; 1 mL) y la mezcla se agitó durante 3 h. La reacción se detuvo con bicarbonato de sodio acuoso saturado y se extrajo con acetato de etilo (3x). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na₂SO₄ anhidro, se filtraron, y se absorbieron sobre gel de sílice. La purificación mediante cromatografía instantánea (acetato de etilo/hexanos al 0-50%) proporcionó el compuesto del título en forma de un sólido de color amarillo (245 mg, 69%).

Ejemplo 89: Preparación de 4-((*tert*-butoxicarbonil)amino)-3-cloro-6-(4-cloro-3-fluorofenil)-5-fluoropicolinato de metilo

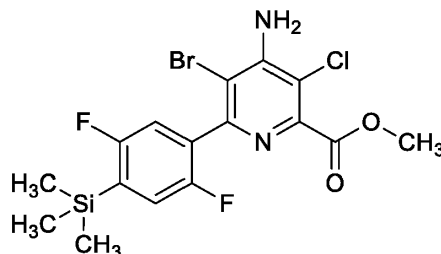


Etapa 1: Se combinó 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-3-fluorofenil)-5-fluoropicolinato de metilo (1,43 g, 4,29 mmoles) con dicarbonato de di-*tert*-butilo (2,99 mL, 12,88 mmoles) y *N,N*-dimetilpiridin-4-amina (0,079 g, 0,644 mmoles) en diclorometano (30 mL). La mezcla de reacción se agitó durante la noche a rt. La mezcla de reacción se concentró en una corriente de nitrógeno y se aplicó directamente a una columna de gel de sílice. El compuesto se hizo eluir con un sistema disolvente en gradiente de acetato de etilo/hexanos al 2-20% para proporcionar 4-(bis(*tert*-butoxicarbonil)amino)-3-cloro-6-(4-cloro-3-fluorofenil)-5-fluoropicolinato de metilo (2,1 g, 92%) en forma de un sólido de color blanco.

Etapa 2: Se disolvió 4-(bis(*tert*-butoxicarbonil)amino)-3-cloro-6-(4-cloro-3-fluorofenil)-5-fluoropicolinato de metilo (2,1 g, 3,94 mmoles) en dicloroetano (20 mL) y se añadió ácido trifluoroacético (0,598 mL, 7,76 mmoles) a rt. La mezcla de reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente y a continuación se concentró a vacío. El producto se purificó mediante cromatografía instantánea (SiO₂; eluyendo con acetato de etilo en diclorometano al 2-20%) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (1,64 g, 98%): RMN ¹H (300 MHz, CDCl₃)

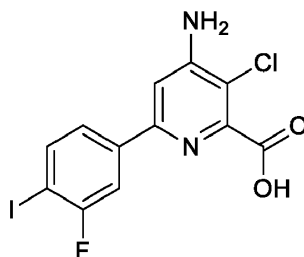
δ 7,80 (dd, $J = 22,0, 8,5$ Hz, 2H), 7,50 (dd, $J = 8,3, 7,6$ Hz, 1H), 6,51 (s, 1H), 4,02 (s, 3H), 1,56 (s, 9H); ESIMS m/z 431 ($[M-H]^-$).

Ejemplo 91: Preparación de 4-amino-5-bromo-3-cloro-6-(2,5-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo



A una solución de 4-amino-3-cloro-6-(2,5-difluoro-4-(trimetilsilil)fenil)picolinato de metilo (0,210 g, 0,566 mmoles) en CH_2Cl_2 (2,265 mL) a 20°C, se le añadió bromo (0,117 mL, 2,265 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a 20°C durante la noche. La mezcla se vertió a continuación en una solución acuosa saturada de $Na_2S_2O_3$ y se extrajo con EtOAc (3x). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na_2SO_4 , se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía instantánea en columna (SiO_2 ; gradiente de hexanos/EtOAc) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (0,125 g, 49,1%): pf 165-166°C; RMN H^1 (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7,10 (dd, $J = 8,9, 4,0$ Hz, 1H), 7,03 (dd, $J = 7,6, 5,1$ Hz, 1H), 5,43 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 0,33 (d, $J = 0,7$ Hz, 9H); ESIMS m/z 450 ($[M + H]^+$).

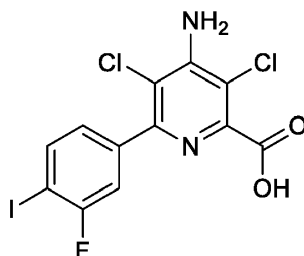
Ejemplo 92: Preparación de ácido 4-amino-3-cloro-6-(3-fluoro-4-yodofenil)picolínico (Compuesto 77)



A un matraz de fondo redondo de 100 mL, equipado con una barra de agitación, se le añadieron 4-amino-3-cloro-6-(3-fluoro-4-yodofenil)picolinato de metilo (0,284 g, 0,699 mmoles), hidróxido de sodio 1,0 N (2,79 mL, 2,79 mmoles) y metanol (5,0 mL). La mezcla de reacción se dejó agitando durante 18 h a rt. A continuación se eliminó el disolvente con un evaporador rotatorio. El sólido resultante se diluyó con H_2O , que se ajustó a pH 3,0 con HCl 1 N y se extrajo con acetato de etilo (3 x 50 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre $MgSO_4$ anhidro, se filtraron y se concentraron para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color blanco (0,056 g, 21%).

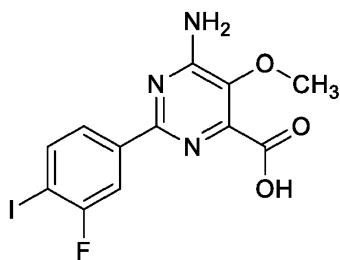
Los siguientes compuestos se elaboraron de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 92:

Ácido 4-amino-3,5 dicloro-6-(3-fluoro-4-yodofenil)picolínico (compuesto 145)



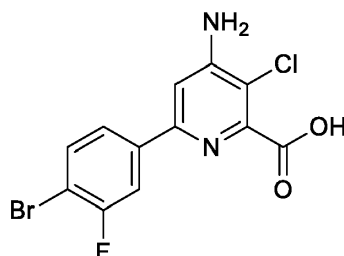
El compuesto del título se preparó como se describe en el Ejemplo 92 con 4-amino-3,5-dicloro-6-(3-fluoro-4-yodofenil)picolinato de metilo (0,197 g, 0,447 mmoles) y se aisló en forma de un sólido de color blanco (0,133 g, 70%).

Ácido 6-Amino-2-(3-fluoro-4-yodofenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxílico (Compuesto 37)



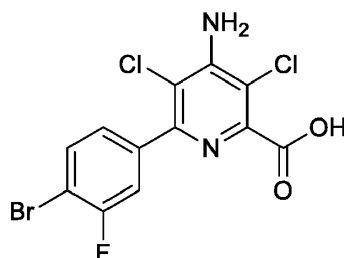
El compuesto del título se preparó como se describe en el Ejemplo 92 con 6-amino-2-(3-fluoro-4-yodofenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (0,309 g, 0,766 mmoles) y se aisló en forma de un sólido de color blanco (0,065 g, 22%).

Ácido 4-amino-6-(4-bromo-3-fluorofenil)-3-cloropicolínico (compuesto 110)



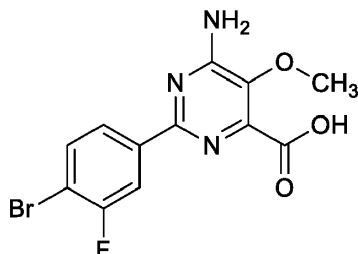
El compuesto del título se preparó como se describe en el Ejemplo 92 con 4-amino-6-(4-bromo-3-fluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo (291 mg, 0,809 mmoles) y se aisló en forma de un sólido de color blanquecino (0,247 g, 88%).

Ácido 4-amino-6-(4-bromo-3-fluorofenil)-3,5-dicloropicolínico (Compuesto 43)



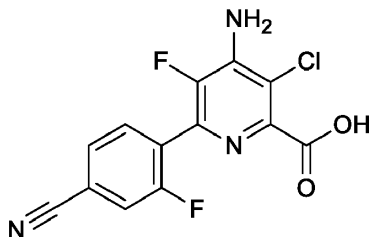
El compuesto del título se preparó como se describe en el Ejemplo 92 con 4-amino-6-(4-bromo-3-fluorofenil)-3-dicloropicolinato de metilo (225 mg, 0,571 mmoles) y se aisló en forma de un sólido de color blanco (0,219 g, 100%).

Ácido 6-amino-2-(4-bromo-3-fluorofenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxílico (Compuesto 113)



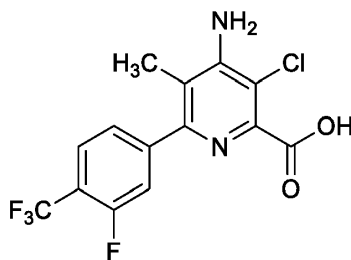
El compuesto del título se preparó como se describe en el Ejemplo 92 con 6-amino-2-(4-bromo-3-fluorofenil)-5-metoxipirimidino-4-carboxilato de metilo (166 mg, 0,466 mmoles) y se aisló en forma de un sólido de color blanco (0,056 g, 35%).

Ejemplo 93: Preparación de ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-ciano-2-fluorofenil)-5-fluoropicolínico (Compuesto 65)



En un matraz de fondo redondo de 50 mL, equipado con una barra de agitación, se disolvieron 4-amino-3-cloro-6-(4-ciano-2-fluorofenil)-5-fluoropicolinato de metilo (351 mg, 1,084 mmoles) e hidrato de hidróxido de litio (100 mg, 2,383 mmoles) en tetrahidrofurano (2,0 mL), metanol (2,0 mL) y H₂O (1,0 mL). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 h. A continuación se eliminó el disolvente por medio de un evaporador rotatorio. El sólido resultante se trató con H₂O, que a continuación se ajustó a pH 3,0 con HCl 1 N y se extrajo con acetato de etilo (3 x 50 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO₄ anhidro, se filtraron y se concentraron. El residuo resultante se purificó mediante cromatografía de fase inversa (150 g C₁₈, 0-100% de acetonitrilo en H₂O), según fuera necesario, para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color marrón (0,058 g, 20%).

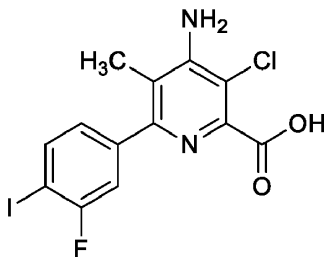
Ejemplo 94. Preparación de ácido 4-amino-3-cloro-6-(3-fluoro-4-(trifluorometil)fenil)-5-metilpicolínico (Compuesto 161)



A 4-amino-3-cloro-6-(3-fluoro-4-(trifluorometil)fenil)-5-metilpicolinato de metilo (0,35 g, 0,96 mmoles) en metanol (6,4 mL), se le añadió NaOH 1 N (1,93 mL, 3,9 mmoles) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 18 h. La solución se aciduló con HCl 2 N y el precipitado se filtró a vacío para proporcionar el compuesto del título en forma de un polvo de color blanco (199 mg, 59%).

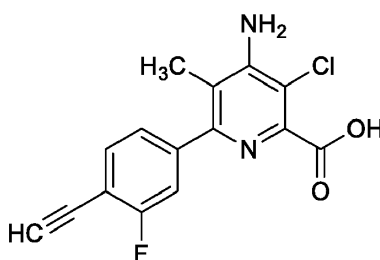
Los siguientes compuestos se elaboraron de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo 94:

Ácido 4-Amino-3-cloro-6-(3-fluoro-4-yodofenil)-5-metilpicolínico (Compuesto 87)



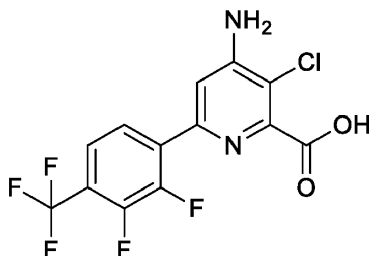
El compuesto del título se preparó como en el Ejemplo 94 y se aisló en forma de un polvo de color blanco (120,5 mg, 88%).

Ácido 4-amino-3 cloro-6-(4-etinil-3-fluorofenil)-5-metilpicolínico (compuesto 6)



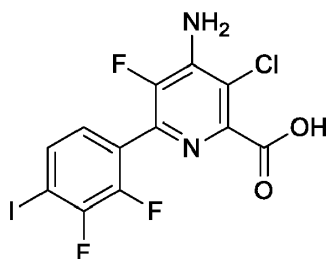
El compuesto del título se preparó como en el Ejemplo 94 y se aisló en forma de un polvo de color amarillo (147 mg, 82%).

Ejemplo 96: Preparación de ácido 4-amino-3-cloro-6-(2,3-difluoro-4-(trifluorometil)fenil)picolínico (Compuesto 172)



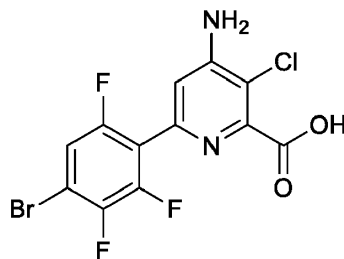
A una mezcla de 4-acetamido-3-cloro-6-(2,3-difluoro-4-(trifluorometil)fenil)picolinato de metilo (115 mg, 0,28 mmoles) en metanol (1 mL), se le añadió solución acuosa de hidróxido de sodio 2 Normal (N) (NaOH; 1,4 mL, 2,81 mmoles). La solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 15 h. Después, la solución se concentró y se aciduló con una solución acuosa de 2N HCl. El producto deseado precipitó de la solución. Esta mezcla se extrajo (3x) con diclorometano, los extractos orgánicos se combinaron, se secaron (Na₂SO₄), se filtraron y se concentraron a vacío para proporcionar un sólido de color blanco (94 mg, 90%).

Ejemplo 98: Preparación de ácido 4-amino-3-cloro-6-(2,3-difluoro-4-yodofenil)-5-fluoropicolínico (Compuesto 141)



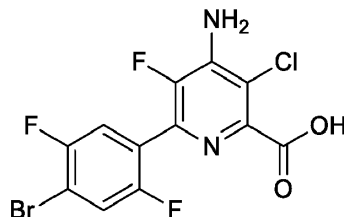
Se añadió una solución 2 M de hidróxido de sodio acuoso (270 µL, 0,54 mmoles, 2,0 equiv.) a una suspensión agitada de 4-amino-3-cloro-6-(2,3-difluoro-4-yodofenil)-5-fluoropicolinato de metilo (120 mg, 0,27 mmoles, 1,0 equiv.) en metanol (2,7 mL) a 23°C. La mezcla de color blanco heterogénea se agitó a 23°C durante 18 h. La mezcla de reacción se ajustó a aproximadamente pH 4 mediante la adición gota a gota de HCl concentrado y se concentró mediante evaporación rotatoria. El residuo se disolvió en diclorometano (250 mL), se hizo pasar a través de un separador de fase de membrana hidrófoba, se secó (MgSO₄), se filtró por gravedad y se concentró mediante evaporación rotatoria para proporcionar el compuesto del título en forma de un polvo de color blanco (110 mg, 92%).

Ejemplo 99: Preparación de ácido 4-amino-6-(4-bromo-2,3,6-trifluorofenil)-3-cloropicolínico (Compuesto 162)



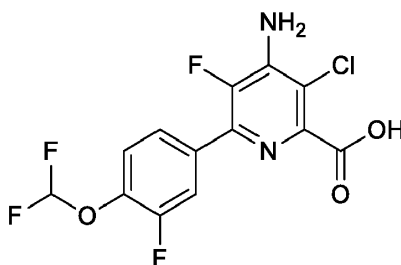
Se agitó una solución de 4-acetamido-6-(4-bromo-2,3,6-trifluorofenil)-3-cloropicolinato de metilo (50 mg, 0,122 mmoles, 1,0 equiv.) e hidróxido de sodio (14 mg, 0,366 mmoles, 3,0 equiv.) en THF:MeOH:H₂O (1:1:0,5; 2,5 mL) a 20°C durante 2 h. La mezcla de reacción se aciduló a pH 4-5 utilizando HCl 1,5 N y se extrajo con EtOAc (2x). El extracto orgánico combinado se secó sobre Na₂SO₄ anhidro y se evaporó hasta sequedad a presión reducida para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color marrón (30 mg, 65%).

Ejemplo 100: Preparación de ácido 4-amino-6-(4-bromo-2,5-difluorofenil)-3-cloro-5-fluoropicolínico (Compuesto 42)



A una solución de 4-amino-6-(4-bromo-2,5-difluorofenil)-3-cloro-5-fluoropicolinato de metilo (0,160 g, 0,404 mmoles) en una mezcla 1:1 de MeOH (0,674 mL) y acetona (0,674 mL), se le añadió una solución acuosa 2 N de hidróxido de sodio (0,607 mL, 1,213 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a 20°C durante la noche. La mezcla de reacción se concentró, se vertió en una solución acuosa 2 N de HCl y se extrajo con EtOAc (3x). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron, se concentraron y se secaron a vacío para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color marrón claro (126 mg, 82%).

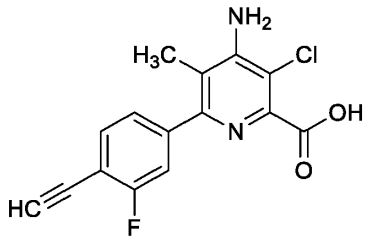
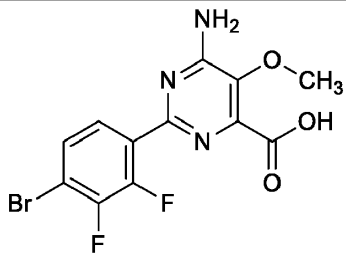
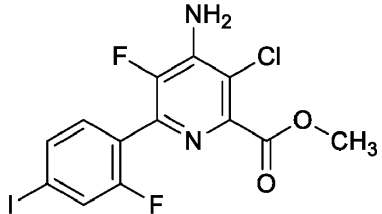
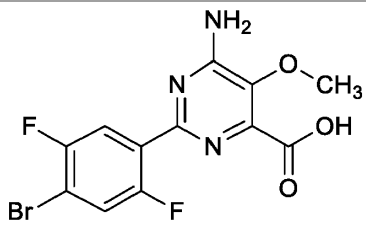
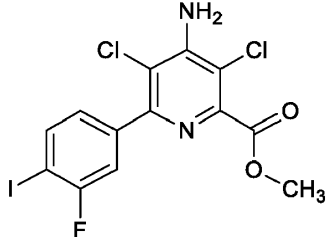
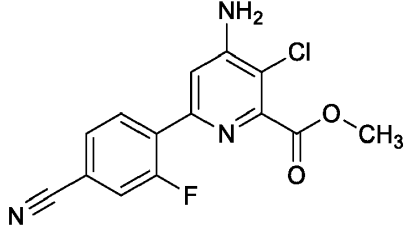
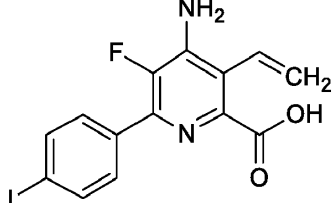
Ejemplo 101: Preparación de ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-(difluorometoxi)-3-fluorofenil)-5-fluoropicolínico (Compuesto 92)

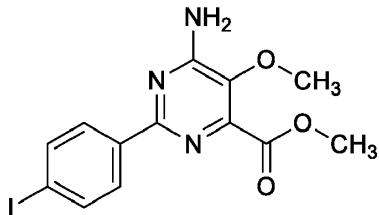
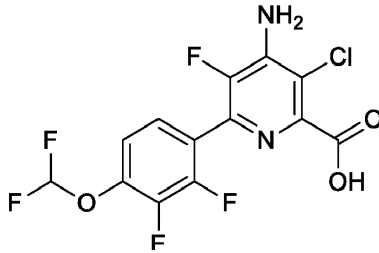
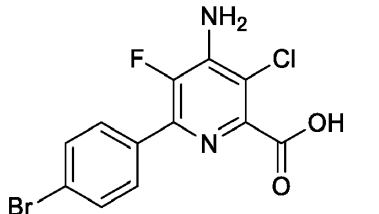
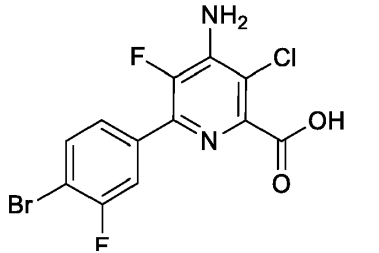
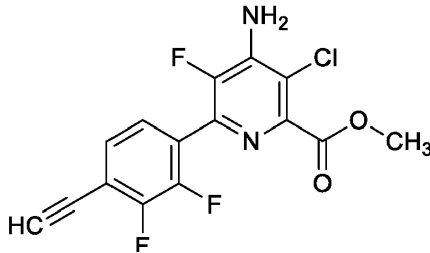
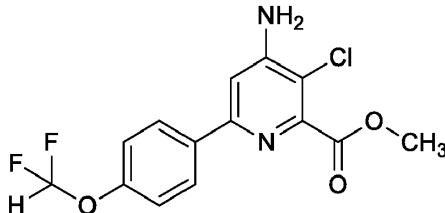
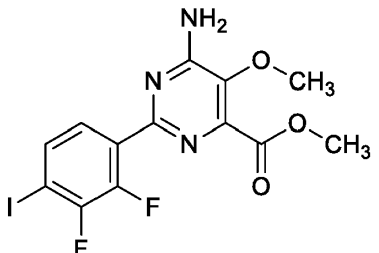


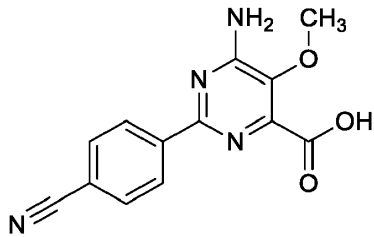
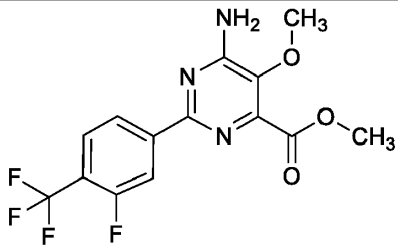
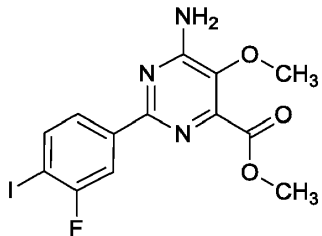
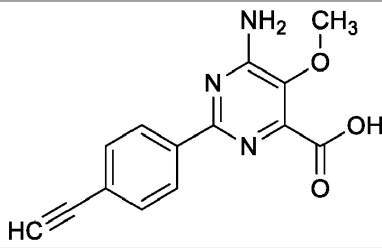
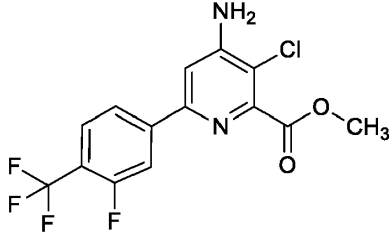
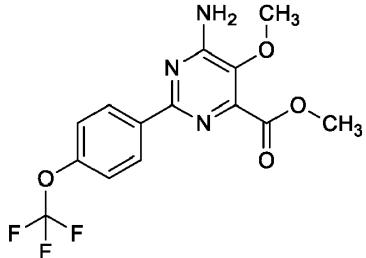
A un matraz cargado con MeOH (2 mL), se le añadieron 4-amino-3-cloro-6-(4-(difluorometoxi)-3-fluorofenil)-5-fluoropicolinato de metilo (190 mg, 0,52 mmoles) y una solución de hidróxido de sodio 2 M (1 mL, 1 mmoles). Después de 12 h de agitación mecánica, la mezcla de reacción se concentró utilizando un evaporador rotatorio con una temperatura de baño de agua de 40°C. Se añadió agua al aceite resultante y la solución se aciduló lentamente mediante la adición de HCl concentrado hasta que se formó un precipitado de color tostado. La filtración con papel de filtro y un embudo Büchner proporcionó el compuesto del título en forma de un sólido de color tostado (108 mg, 59%).

Tabla 1. Número compuesto, estructura, preparación y apariencia.

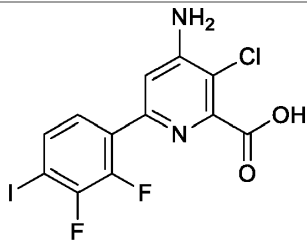
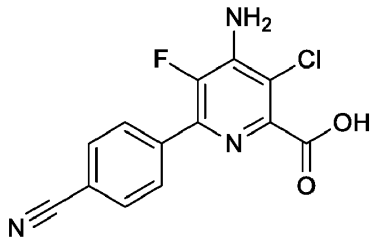
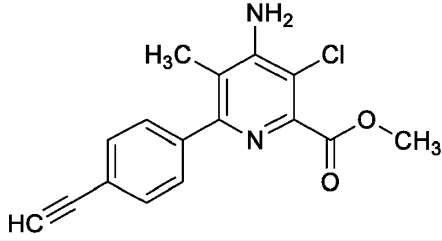
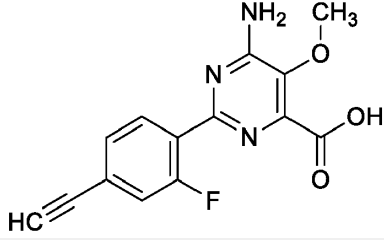
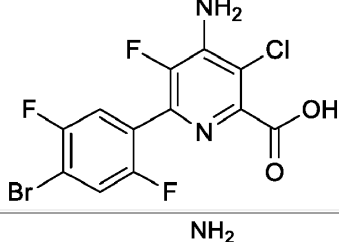
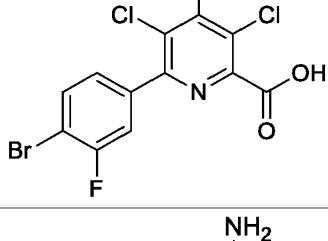
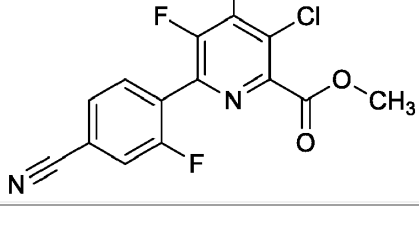
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
2		Sólido de color blanco	73
3		Sólido de color blanco	100

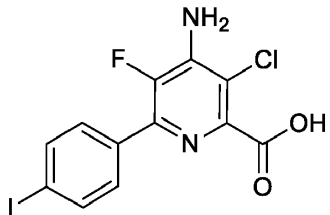
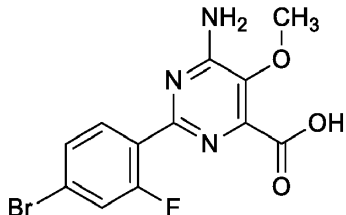
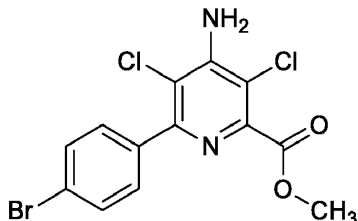
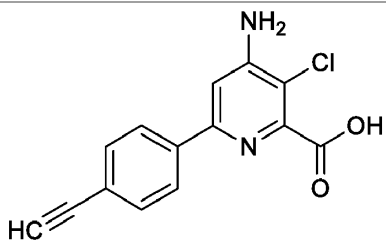
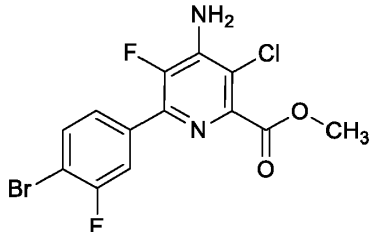
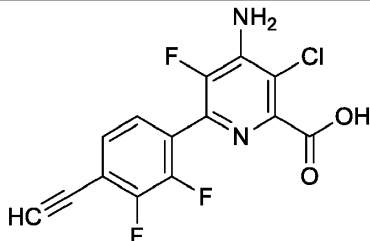
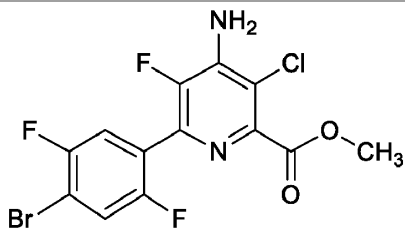
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
6		Polvo de color amarillo	94
8		Sólido de color blanco	98
9		Polvo de color blanquecino	66
11		Sólido de color blanco	100
13		Sólido de color amarillo	64
16		Sólido de color blanquecino	42
17		Sólido de color amarillo	100

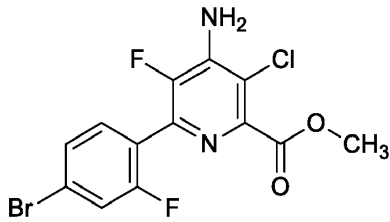
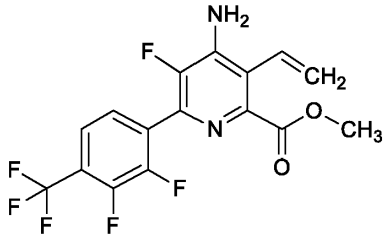
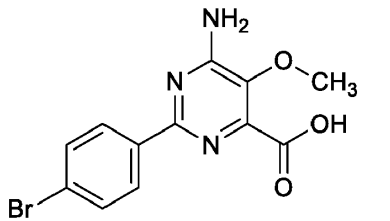
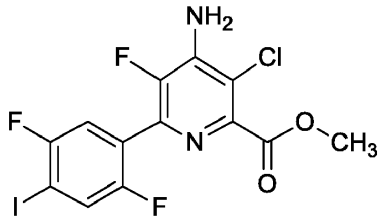
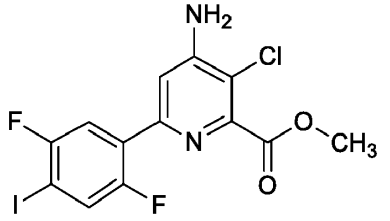
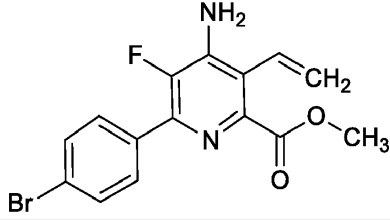
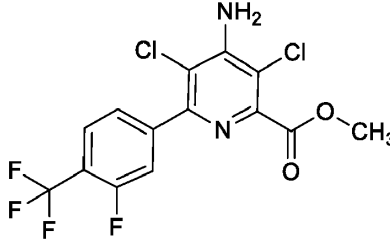
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
18		Aceite de color amarillo claro	66
19		Sólido de color blanco	101
20		Sólido de color blanco teñido de naranja	97
21		Polvo de color blanquecino	97
22		Polvo de color blanco	86
23		Sólido de color amarillo	42
24		Sólido de color blanco	68

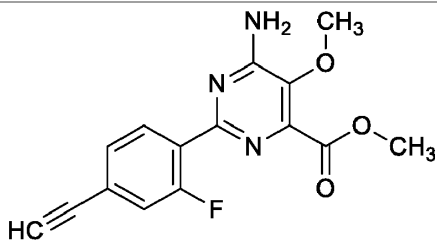
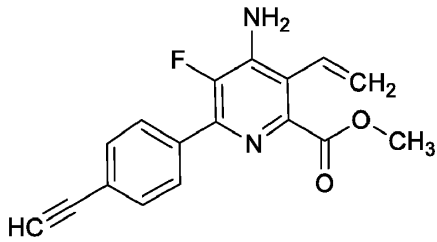
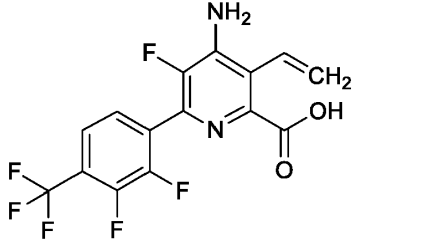
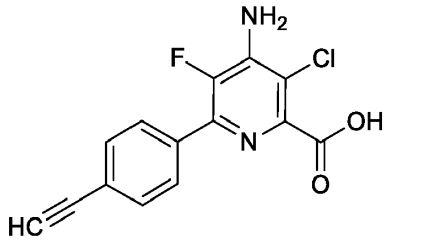
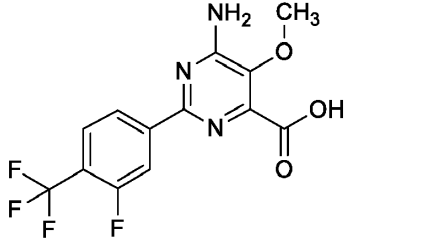
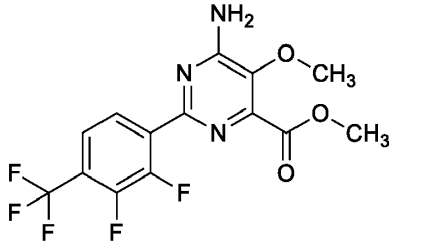
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
25		Sólido de color amarillo	98
26		Sólido de color blanco	46
27		Sólido de color amarillo	64
28		Sólido de color blanco	98
29		Sólido de color blanco	46
30		Sólido de color amarillo	42

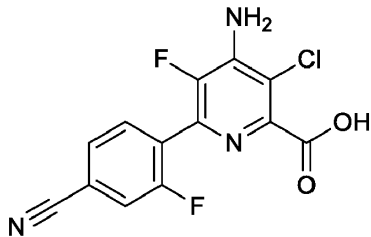
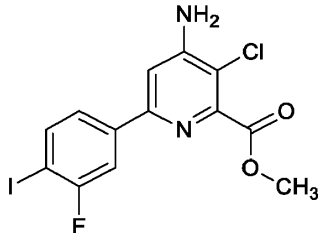
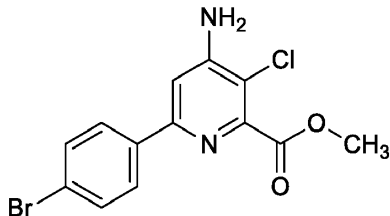
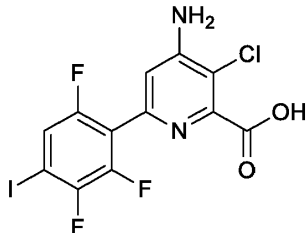
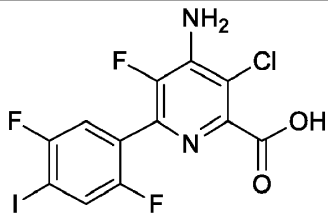
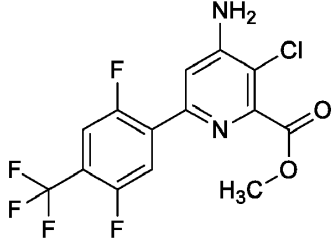
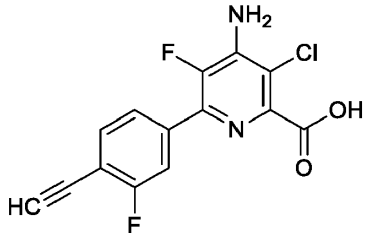
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
31		Sólido de color tostado	95
32		Sólido de color amarillo claro	92
33		Sólido de color blanco	98
34		Sólido de color amarillo	86
35		Polvo de color blanquecino	72
36		Sólido de color blanquecino	101
37		Sólido de color blanco	92

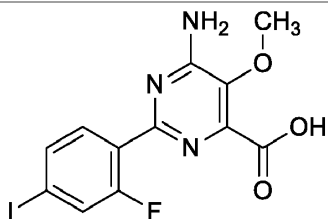
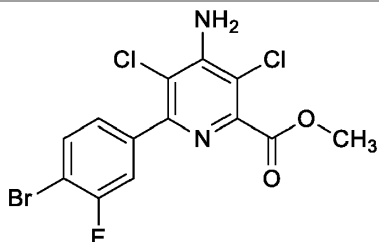
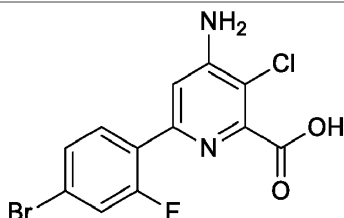
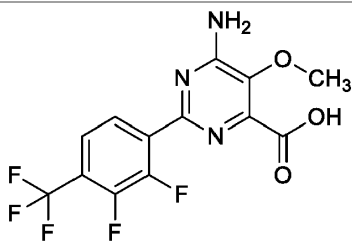
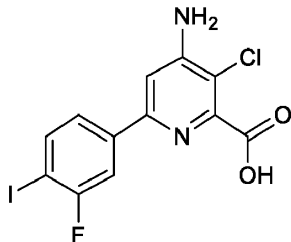
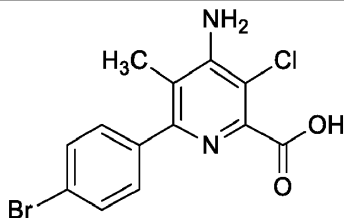
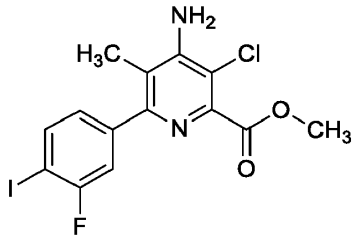
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
38		Polvo de color blanco	97
39		Sólido de color blanco	98
40		Aceite de color marrón	83
41		Polvo de color tostado	98
42		Sólido de color marrón claro	100
43		Sólido de color blanco	92
44		Sólido de color blanquecino	39

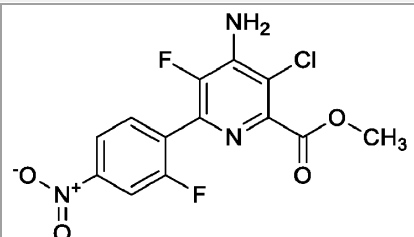
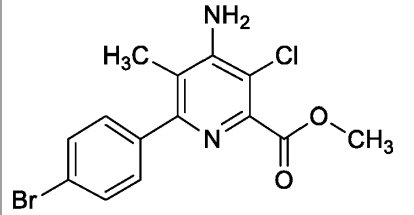
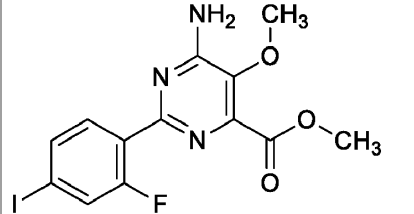
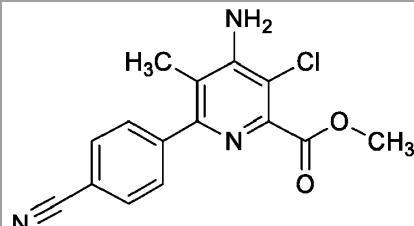
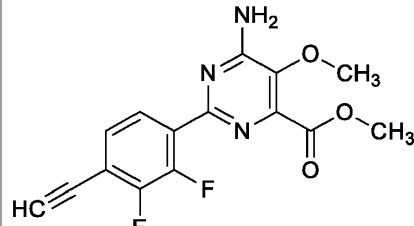
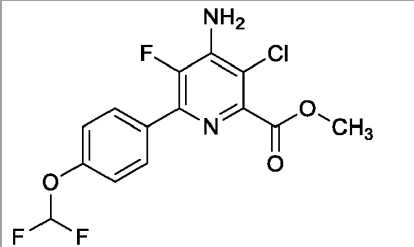
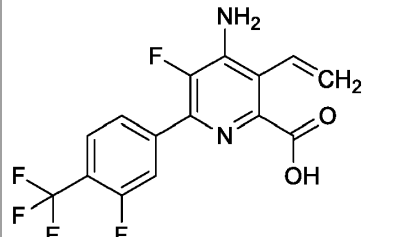
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
45		Polvo de color rosa pálido	97
46		Polvo de color blanquecino	98
47		Sólido de color blanco	74
48		Sólido de color blanco	98
49		Polvo de color blanquecino	72
50		Polvo de color blanquecino	98
51		Sólido de color blanco	73

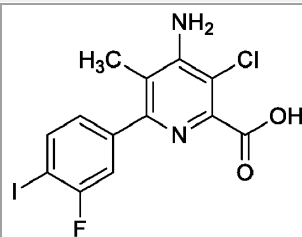
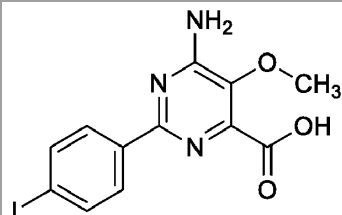
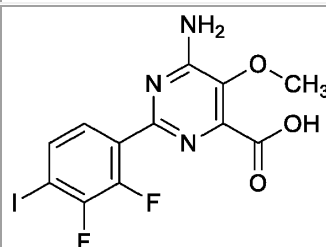
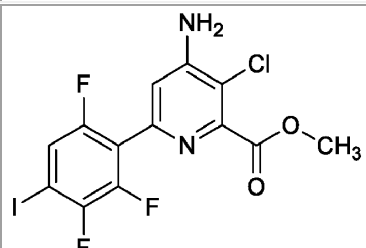
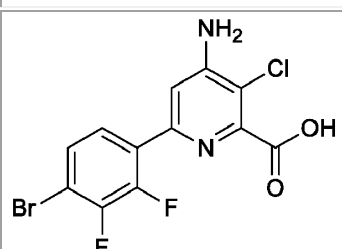
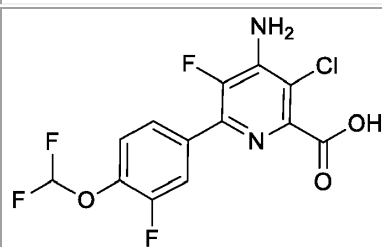
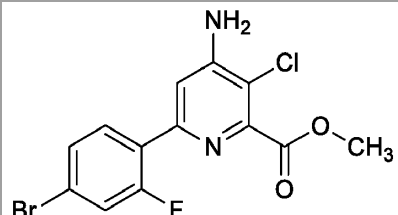
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
52		Polvo de color blanco	72
53		Sólido de color marrón	54
54		Sólido de color blanco	97
55		Sólido de color blanco	67
56		Sólido de color naranja	77
57		Sólido de color marrón claro	79
58		Sólido de color blanquecino	46

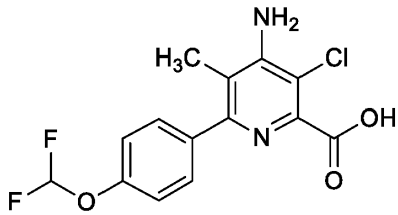
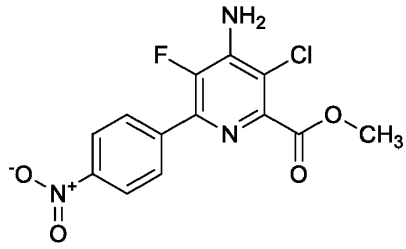
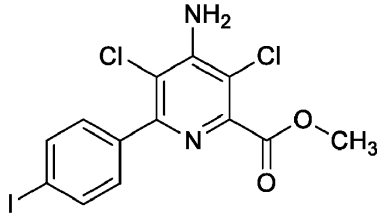
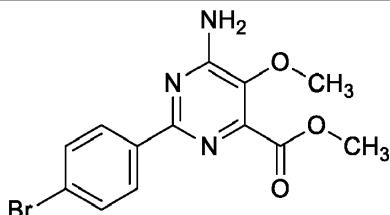
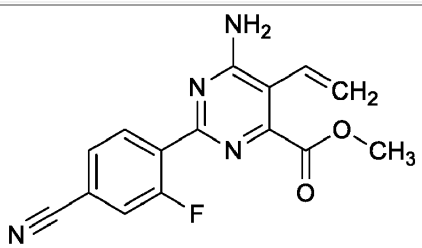
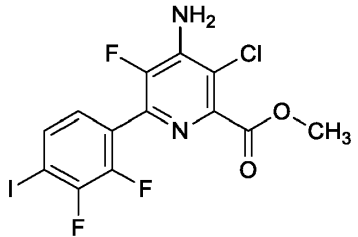
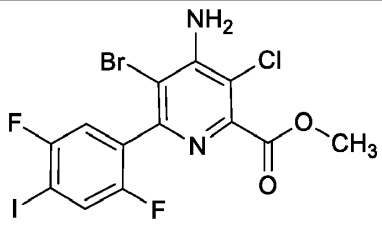
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
59		Polvo de color blanco	86
60		Sólido de color blanco	88
61		Aceite Gomoso de color marrón	100
62		Polvo de color tostado	97
63		Sólido de color blanco	96
64		Sólido de color blanco	41

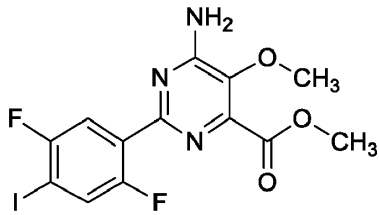
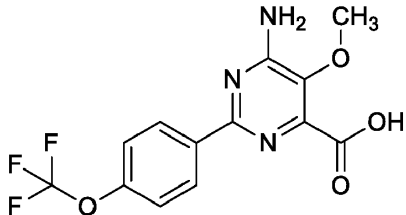
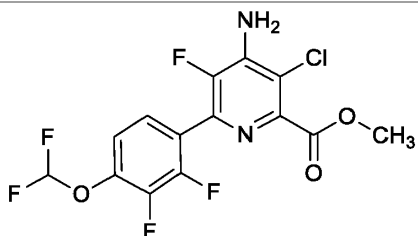
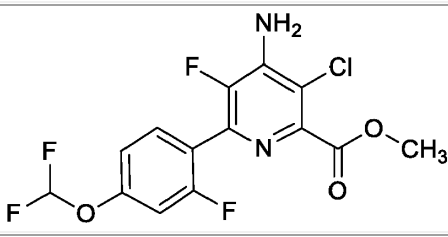
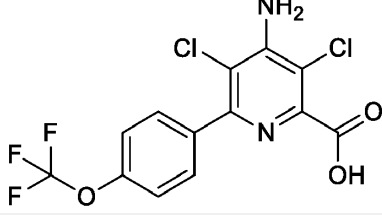
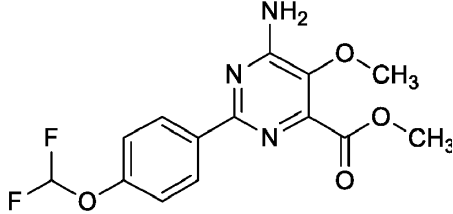
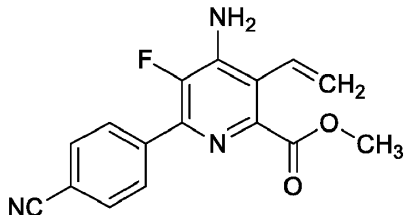
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
65		Sólido de color marrón	93
66		Sólido de color marrón	64
67		Aceite Viscoso de color marrón oscuro	76
68		Sólido de color blanquecino	100
69		Sólido de color blanco	100
70		Sólido de color blanco	59
71		Polvo de color blanquecino	98

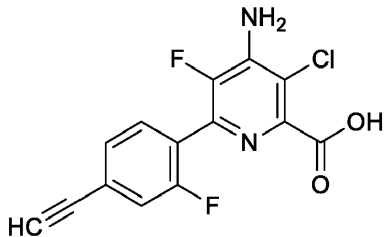
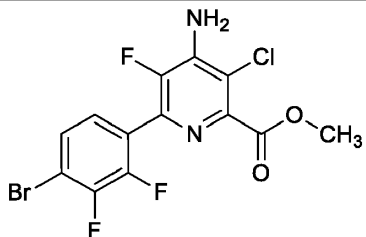
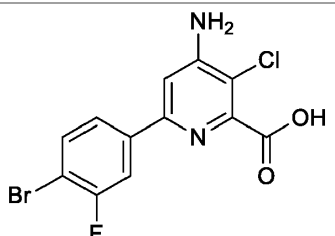
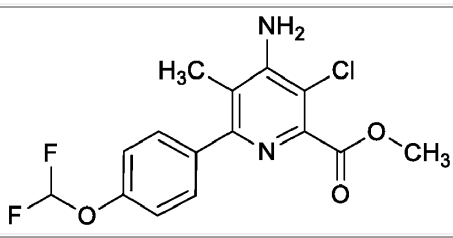
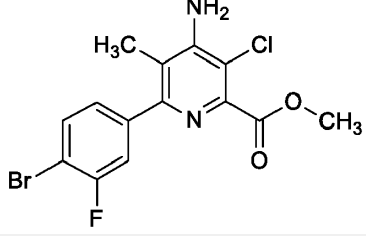
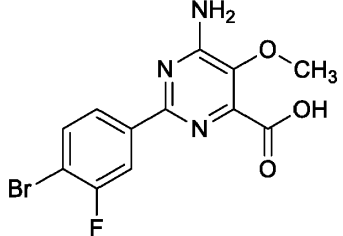
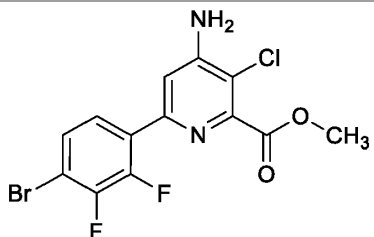
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
72		Polvo de color amarillo	98
73		Sólido de color blanco	69
74		Sólido de color blanco	98
76		Sólido de color blanco	95
77		Sólido de color blanco	92
78		Sólido de color blanco	94
79		Sólido de color blanquecino	65

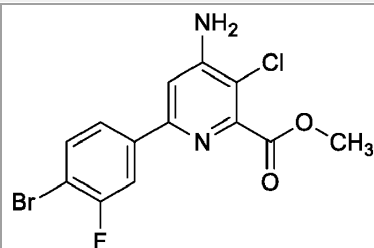
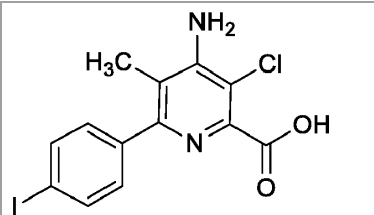
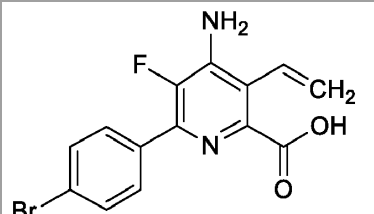
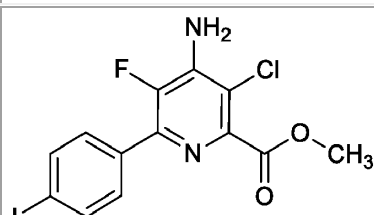
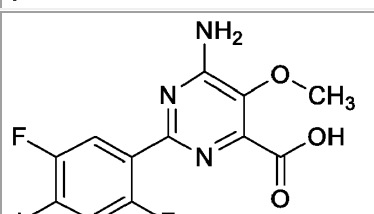
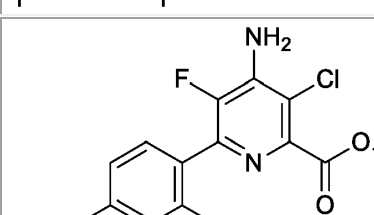
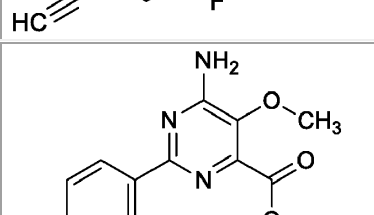
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
80		Sólido de color amarillo	41
81		Polvo de color naranja pálido	70
82		Polvo de color amarillo	66
83		Sólido de color naranja	40
84		Polvo de color blanco	86
85		Sólido de color blanco	42
86		Sólido de color blanco	98

Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
87		Polvo de color blanco	94
88		Sólido de color blanco	97
89		Sólido de color blanco	98
90		Sólido de color blanco	77
91		Sólido de color blanco	97
92		Sólido de color tostado	101
93		Sólido de color blanco	74

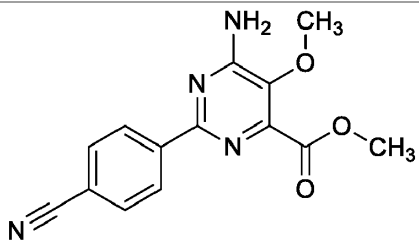
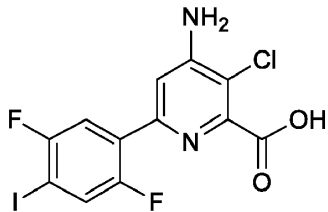
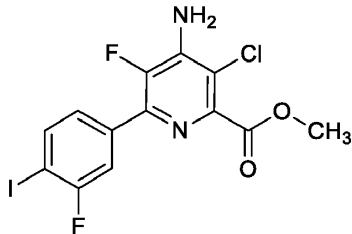
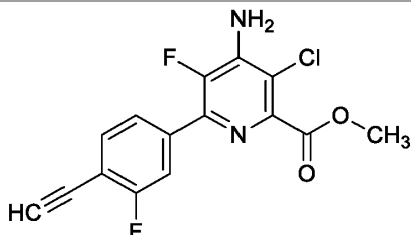
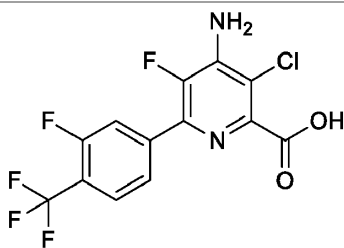
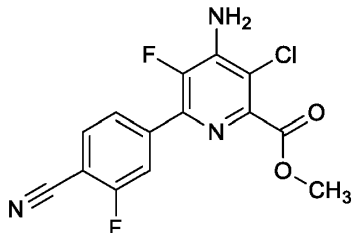
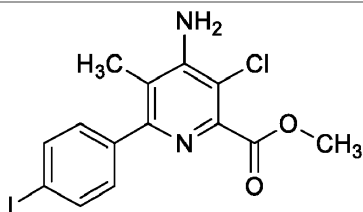
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
94		Sólido de color amarillo	94
95		Sólido de color amarillo	41
96		Sólido de color gris	68
97		Sólido de color blanquecino	72
98		Sólido de color amarillo	39
99		Polvo de color blanco	66
100		Sólido de color marrón claro	67

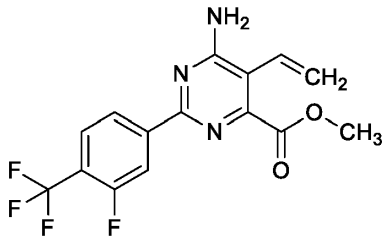
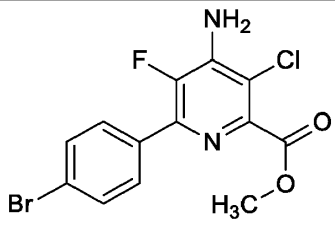
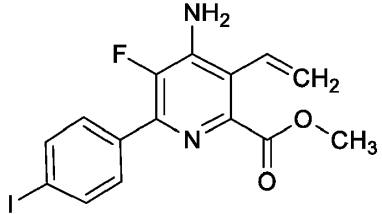
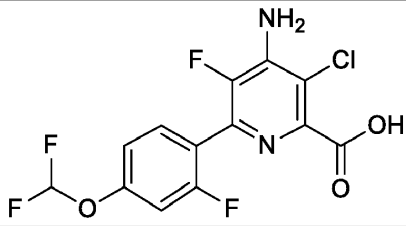
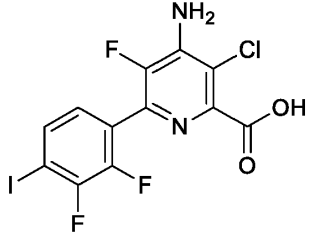
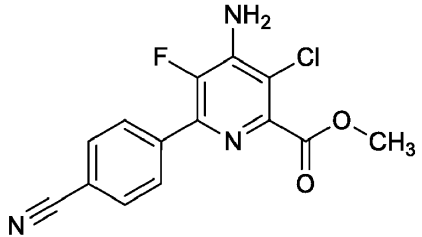
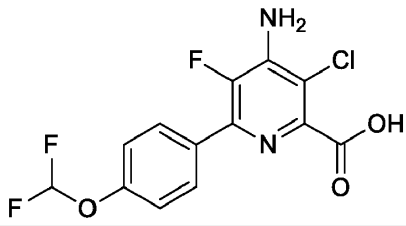
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
101		Sólido de color blanco	67
102		Sólido de color amarillo	98
103		Sólido de color tostado	56
104		Sólido de color amarillo	56
105		Sólido de color blanco	98
106		Sólido de color blanco	56
107		Sólido de color tostado	57

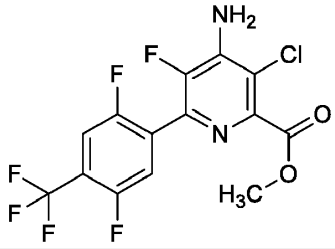
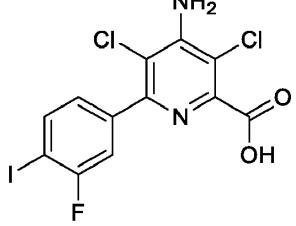
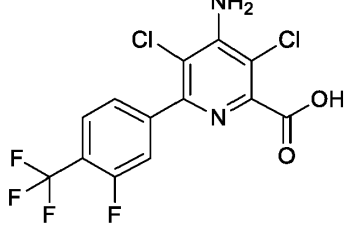
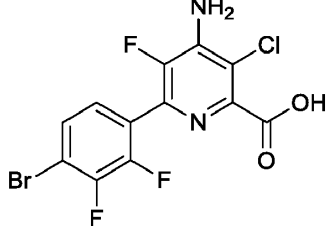
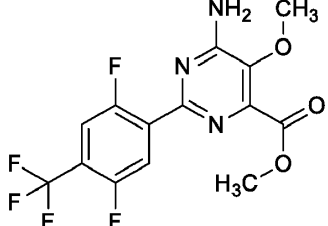
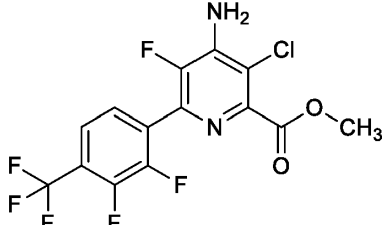
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
108		Polvo de color naranja pálido	98
109		Sólido de color amarillo claro	71
110		Sólido de color blanquecino	92
111		Sólido de color amarillo céreo	40
112		Sólido de color blanquecino	70
113		Sólido de color blanco	92
114		Sólido de color blanco	44

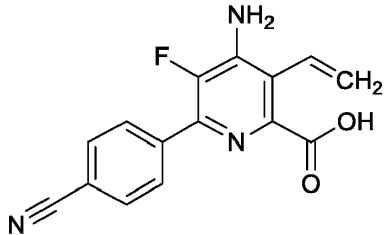
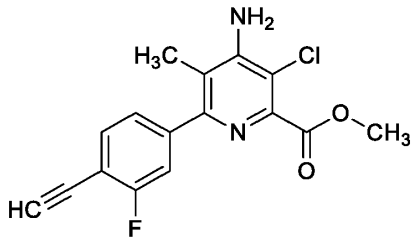
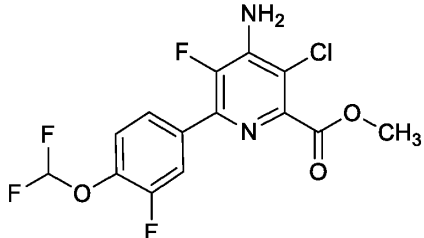
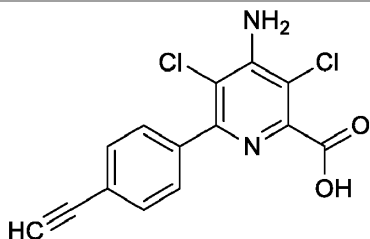
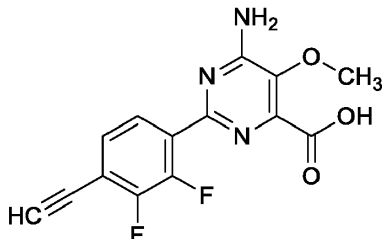
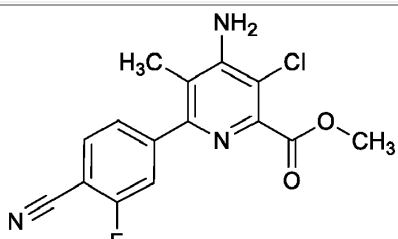
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
115		Sólido de color blanco	75
116		Polvo de color naranja	94
117		Sólido de color marrón claro	100
118		Polvo de color morado	66
119		Sólido de color amarillo	100
121		Polvo de color blanco	86
122		Sólido de color blanco	74

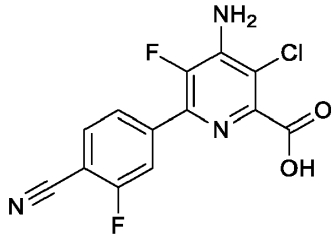
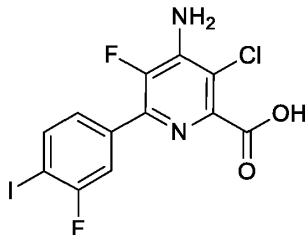
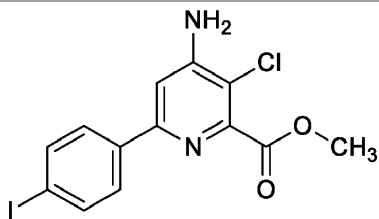
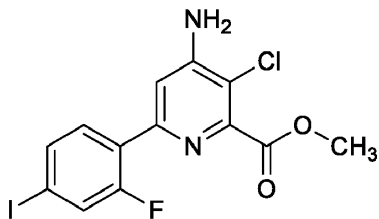
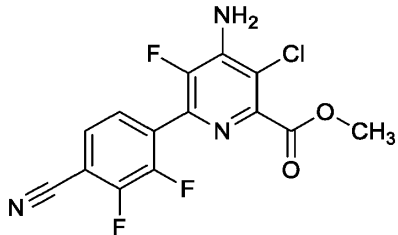
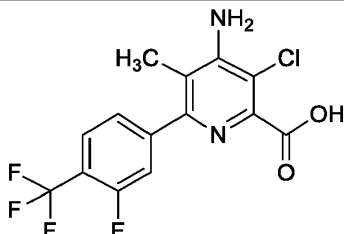
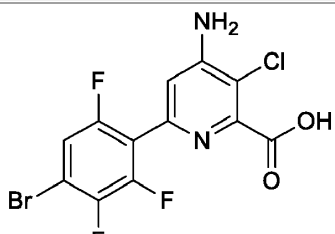
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
123		Sólido de color blanquecino	93
124		Sólido de color amarillo	98
125		Sólido de color blanco	98
126		Sólido de color amarillo	86
127		Sólido de color blanco	77
128		Sólido de color blanco	96
129		Polvo de color blanco	76

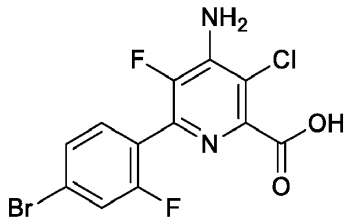
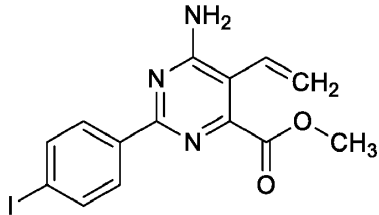
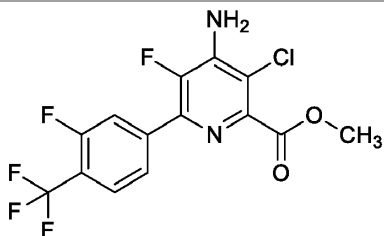
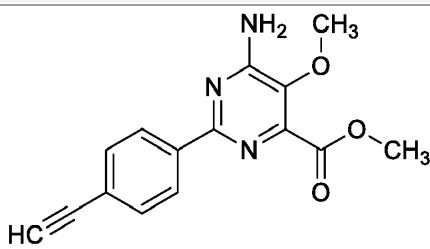
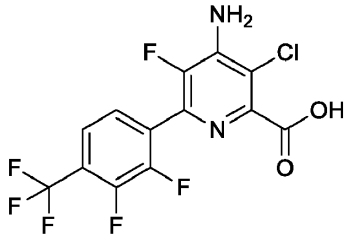
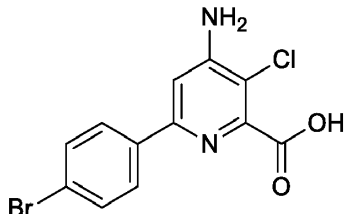
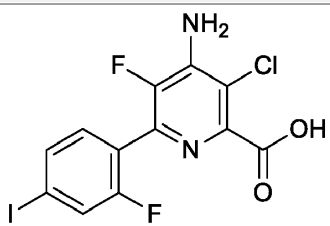
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
130		Sólido de color blanco	42
131		Sólido de color marrón claro	100
132		Polvo de color tostado	66
133		Polvo de color blanco	86
134		Sólido de color blanco	95
135		Sólido de color blanco	42
136		Sólido de color rojo-naranja	65

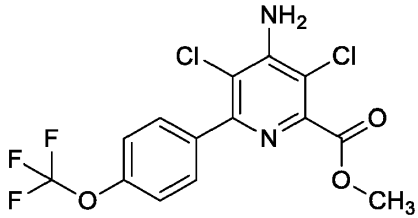
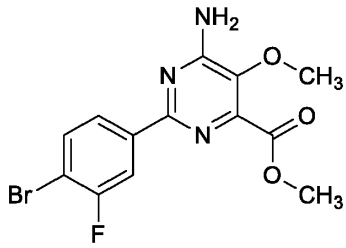
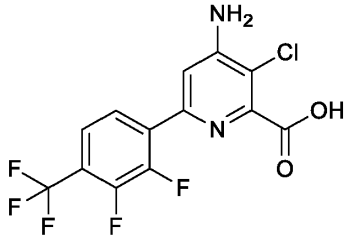
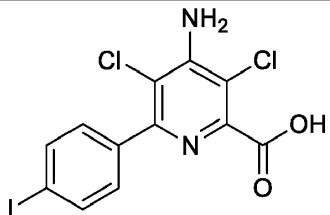
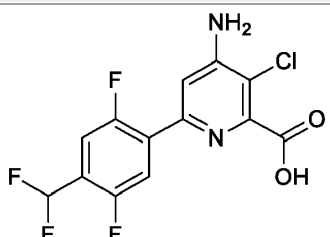
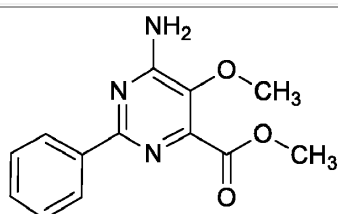
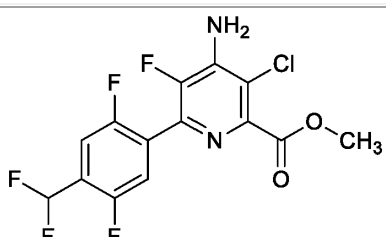
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
137		Sólido de color tostado claro	39
138		Polvo de color tostado	72
139		Sólido de color blanco	81
140		Sólido de color blanquecino	101
141		Polvo de color blanco	98
142		Sólido	42
143		Sólido de color blanco	98

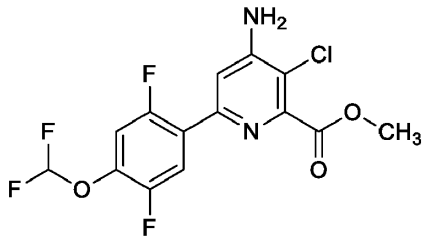
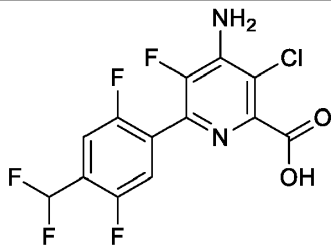
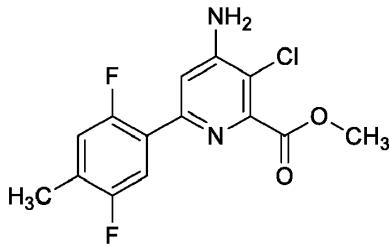
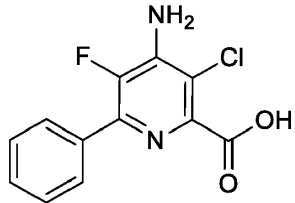
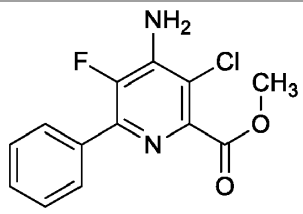
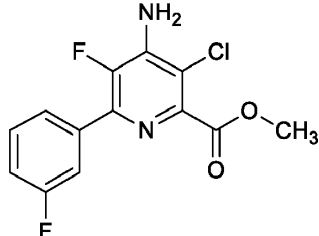
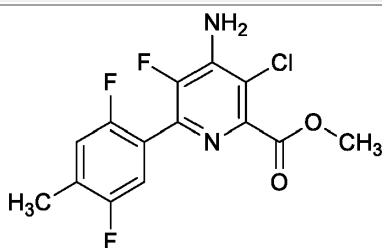
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
144		Sólido de color blanco	60
145		Sólido de color blanco	92
146		Sólido de color blanco	96
147		Sólido de color tostado	98
148		Sólido de color blanco	60
149		Sólido de color blanco	41

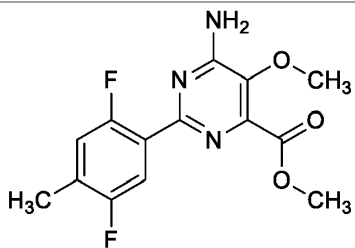
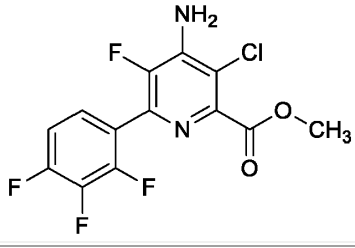
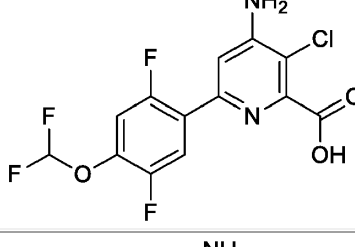
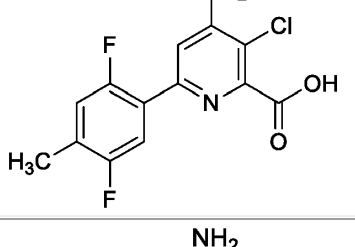
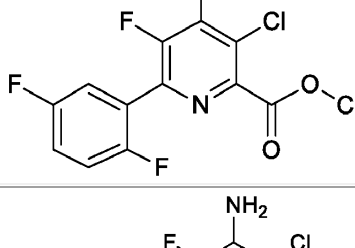
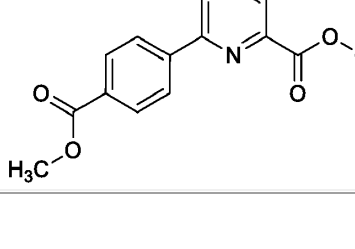
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
150		Sólido de color tostado	101
151		Sólido de color amarillo	87
152		Sólido de color blanco	56
153		Sólido de color amarillo	98
154		Polvo de color tostado	98
155		Sólido escamoso de color blanco	40

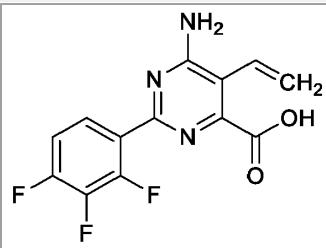
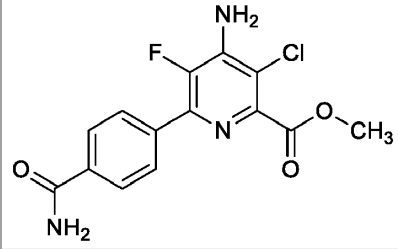
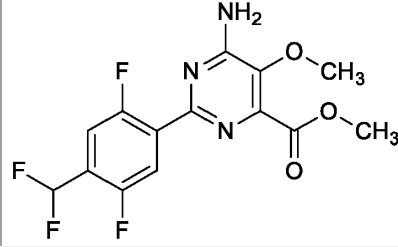
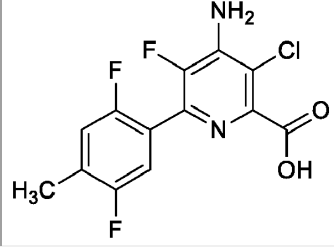
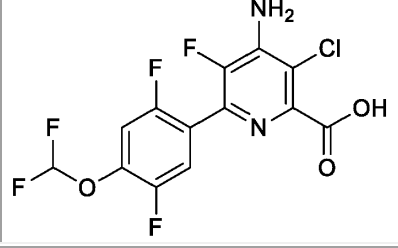
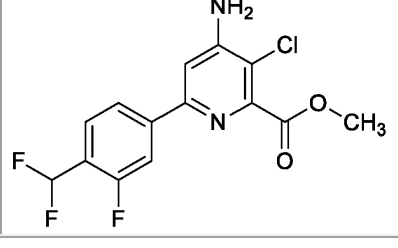
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
156		Sólido de color blanco	98
157		Polvo de color tostado	97
158		Semisólido de color marrón oscuro	76
159		Sólido de color blanco	68
160		Sólido de color blanco	41
161		Polvo de color blanco	94
162		Sólido de color marrón	99

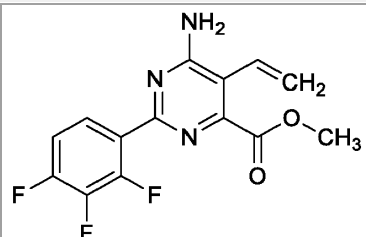
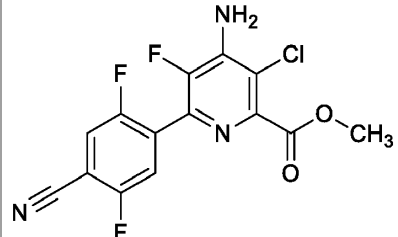
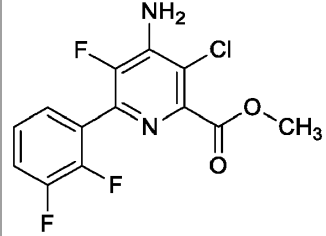
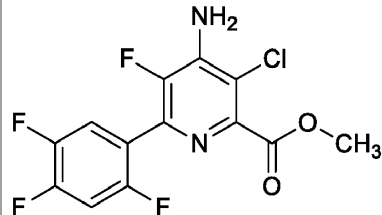
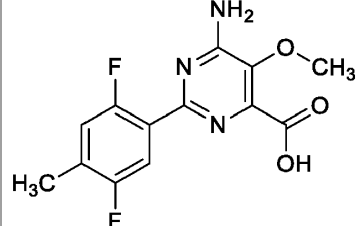
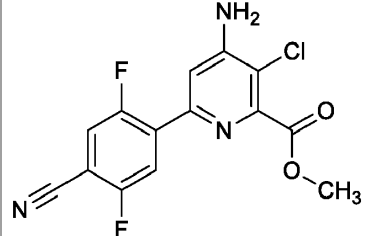
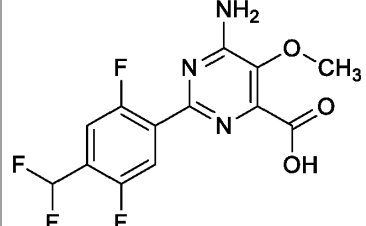
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
163		Polvo de color blanquecino	98
164		Sólido de color amarillo claro	80
165		Sólido de color blanco	41
166		Sólido de color amarillo	86
167		Sólido de color blanco	95
168		Sólido de color marrón	97
169		Polvo de color blanquecino	98

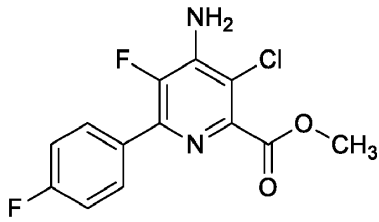
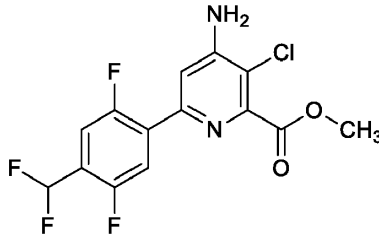
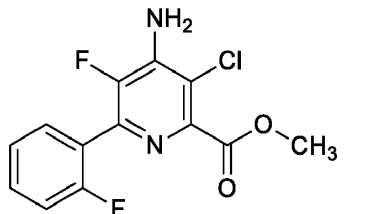
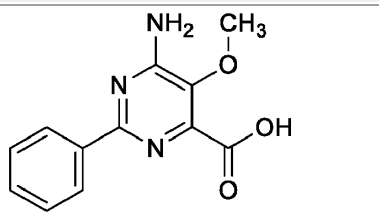
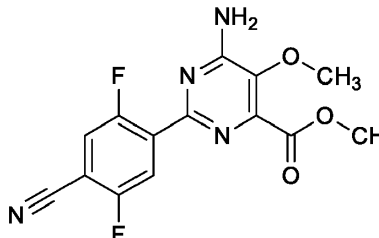
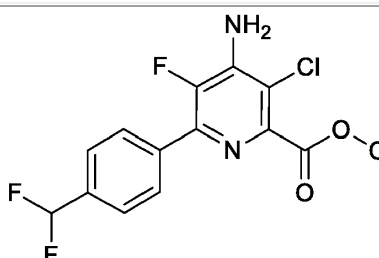
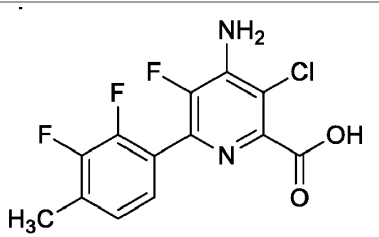
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
170		Sólido de color blanco	42
171		Sólido de color blanco	69
172		Sólido de color blanco	96
173		Sólido de color amarillo	98
174		Sólido de color blanquecino	62
175		Sólido de color tostado	57
176		Sólido de color blanco	63

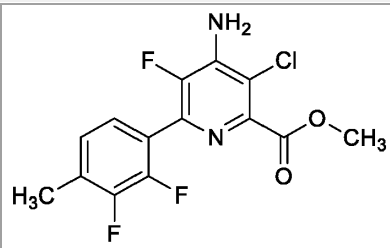
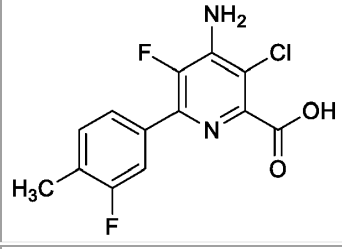
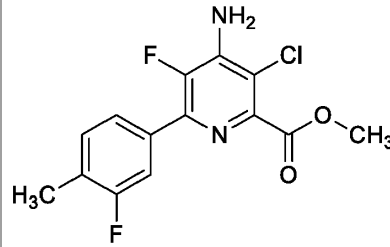
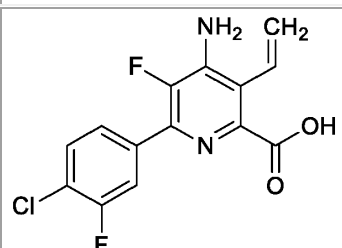
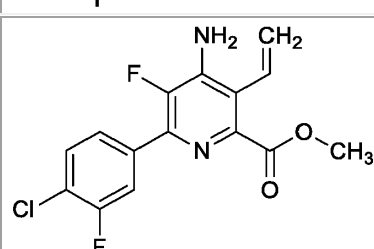
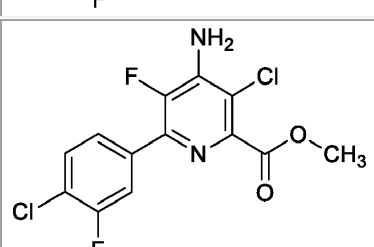
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
177		Sólido de color blanco	63
178		Sólido de color blanquecino	62
179		Sólido de color blanco	63
180		Sólido de color blanco	101
181		Sólido de color blanquecino	57
183		Aceite de color amarillo pálido	46
184		Sólido de color blanco	63

Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
185		Sólido de color blanco	63
186		Sólido de color blanco	41
187		Sólido de color blanco	98
188		Sólido de color blanco	62
189		Sólido de color blanco	46
190		Sólido de color blanco	43

Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
191		Sólido de color amarillo	92
192		Sólido de color blanco	43
193		Sólido de color blanco	63
194		Sólido de color blanco	62
195		Sólido de color blanco	98
196		Polvo de color blanco	47

Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
197		Sólido de color amarillo	39
198		Sólido de color blanco	63
199		Sólido de color tostado	57
200		Polvo de color blanco	40
201		Sólido de color blanco	62
202		Sólido de color blanco	63
203		Sólido de color blanco	62

Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
204		Sólido de color blanco	41
205		Sólido de color blanco	62
206		Sólido de color tostado	57
207		Sólido de color tostado	101
208		Sólido de color blanco	63
209		Polvo de color blanco	47
210			95

Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
211		Sólido de color blanco	41
212			95
213		Sólido de color blanco	41
214		Sólido de color blanco	98
215		Sólido de color blanco	90
216		Sólido de color blanco	42

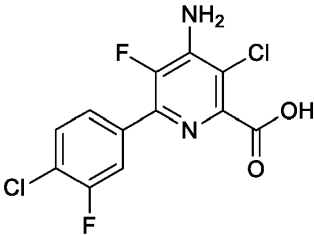
Núm. compuesto	Estructura	Apariencia	Preparado como en el Ejemplo:
217		Sólido de color blanquecino	97

Tabla 2. Datos analíticos para compuestos de la Tabla 1

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
1	133,4-134,8		ESIMS <i>m/z</i> 322 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,81 (m, 4H), 5,42 (s, 2H), 4,02 (s, 3H)	
2	186-187		ESIMS <i>m/z</i> 373 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,78 (dd, <i>J</i> = 9,0, 6,5 Hz, 1H), 7,37 (dd, <i>J</i> = 9,6, 5,6 Hz, 1H), 5,43 (s, 2H), 4,01 (s, 3H), 3,95 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -113,66, -113,70, -117,53, -117,58
3	172-174		ESIMS <i>m/z</i> 364 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,89-7,84 (m, 2H), 7,26 (d, <i>J</i> = 1,2 Hz, 1H), 6,85 (s, 2H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -108,94, -108,99, -114,18, -114,22
4			ESIMS <i>m/z</i> 375 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,85 (m, 2H), 7,69 (m, 2H), 7,24 (s, 1H), 6,73 (s ancho, 2H)	
5	164-168			RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,65 (s, 1H), 8,12-7,89 (m, 2H), 7,80 (dd, <i>J</i> = 8,0, 1,6 Hz, 1H), 7,32 (d, <i>J</i> = 4,8 Hz, 2H), 6,66 (dd, <i>J</i> = 17,7, 11,4 Hz, 1H), 5,75-5,41 (m, 2H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -111,46
6	175,0-176,5		ESIMS <i>m/z</i> 303 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,38 (s, 1H), 7,62 (t, <i>J</i> = 7,7 Hz, 1H), 7,40 (dd, <i>J</i> = 10,4, 1,5 Hz, 1H), 7,31 (dd, <i>J</i> = 7,9, 1,6 Hz, 1H), 6,51 (s, 2H), 4,59	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -111,32

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				(s, 1H), 2,09 (s, 3H)	
7	127-130	IR (película delgada) 3478 (s), 3374 (s), 3239 (s), 2955 (w), 1731 (m), 1624 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 305 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (300 MHz, CDCl ₃) δ 7,91 (m, 2H), 7,58 (m, 2H), 4,90 (s ancho, 2H), 3,99 (s, 3H), 3,16 (s, 1H)	
8	126-128 (desc.)		ESIMS <i>m/z</i> 360 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,64 (s, 1H), 7,74-7,56 (m, 2H), 7,45 (s, 2H), 3,76 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -131,53, -131,58, -136,08, -136,14
9	136-138	IR (película delgada) 3489 (s), 3381 (s), 3233 (m), 3199 (m), 3083 (w), 3000 (w), 2954 (m), 2853 (w), 1737 (s), 1622 (s) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 425 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,88 (dd, <i>J</i> = 8, 1,5 Hz, 1H), 7,55 (dd, <i>J</i> = 10, 1,5 Hz, 1H), 7,33 (dd, <i>J</i> = 8,5, 8 Hz, 1H), 4,94 (s ancho, 2H), 3,96 (s, 3H)	
10	170,4-172,1		ESIMS <i>m/z</i> 315 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,97 (d, 2H), 7,30 (m, 5H), 6,72 (s, 2H)	
11	132-133		ESIMS <i>m/z</i> 359 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,86-7,73 (m, 2H), 7,43 (s, 2H), 3,75 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -114,36, -114,40, -116,52, -116,57
12	77-78		ESIMS <i>m/z</i> 359 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,86 (dd, <i>J</i> = 9,0, 6,9 Hz, 2H), 7,69 (t, <i>J</i> = 7,8 Hz, 1H), 6,90 (dd, <i>J</i> = 18,1, 11,6 Hz, 1H), 5,74 (dd, <i>J</i> = 11,6, 1,3 Hz, 1H), 5,60 (dd, <i>J</i> = 18,1, 1,3 Hz, 1H), 4,78 (s, 2H), 3,94 (s, 3H)	
13			ESIMS <i>m/z</i> 442 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,95 (dd, <i>J</i> = 8,1, 6,7 Hz, 1H), 7,47 (dd, <i>J</i> = 9,1, 1,9 Hz, 1H), 7,22 (dd, <i>J</i> = 8,1, 1,9 Hz, 1H), 7,14 (s, 2H), 3,87 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -95,18
14	178,0-179,7		ESIMS <i>m/z</i> 308 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,95 (d, 2H), 7,80 (d,	

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				2H), 7,09 (s, 2H)	
15	102,4- 103,6		ESIMS m/z 363 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,72 (d, 2H), 7,24 (d, 2H), 5,42 (s, 2H), 4,02 (s, 3H)	
16			ESIMS m/z 306 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,01 (m, 2H), 7,79 (dd, <i>J</i> = 8,1, 1,5 Hz, 1H), 7,30 (d, <i>J</i> = 1,5 Hz, 1H), 6,96 (s, 2H), 3,89 (s, 3H)	
17			ESIMS m/z 385 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,12 (s, 1H), 7,87 (d, <i>J</i> = 8,4 Hz, 2H), 7,66 (d, <i>J</i> = 7,6 Hz, 2H), 6,75 (dd, <i>J</i> = 17,8, 11,5 Hz, 1H), 6,41 (s, 2H), 5,55 (dd, <i>J</i> = 14,2, 1,1 Hz, 1H), 5,52 (dd, <i>J</i> = 7,8, 1,1 Hz, 1H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -145,75
18			ESIMS m/z 387 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 8,04 (m, 2H), 7,77 (m, 2H), 5,36 (s ancho, 2H), 4,01 (s, 3H), 3,91 (s, 3H)	
19	113-115	IR (película delgada) 1025,80, 1047,25, 1126,02, 1225,15, 1266,03, 1299,98, 1386,12, 1481,90, 1515,13, 1585,75, 1633,93, 1721,56, 2536,01, 3199,39, 3331,39, 3471,03 cm ⁻¹	ESIMS m/z 369 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,70 (s, 1H), 7,47 (ddd, <i>J</i> = 9,2, 7,2, 2,0 Hz, 1H) 7,40 (d, <i>J</i> = 3,0 Hz, 1H), 7,37 (t, <i>J</i> = 72,3 Hz, 1H), 7,07 (s, 2H)	
20	149-152		ESIMS m/z 347 ([M + H] ⁺)	RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,85-7,77 (m, 2H), 7,75-7,68 (m, 2H), 6,94 (s, 2H)	
21	117-120	IR (película delgada) 3468 (s), 3334 (s), 3198 (s), 1717 (w), 1629 (m), 1573 (w) cm ⁻¹	ESIMS m/z 365 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,88 (dd, <i>J</i> = 9, 8 Hz, 1H), 7,82 (dd, <i>J</i> = 9, 1,5 Hz, 1H), 7,70 (d, <i>J</i> = 9 Hz, 1H),	

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				6,73 (s ancho, 2H)	
22	190-192	IR (película delgada) 3512 (m), 3411 (s), 3248 (s), 2954 (w), 1730 (m), 1616 (m) cm ⁻¹	ESIMS m/z 341 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,33-7,35 (m, 2H), 4,98 (s ancho, 2H), 3,98 (s, 3H), 3,43 (s, 1H)	
23	166,4-169,0		ESIMS m/z 329 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,95 (d, 2H), 7,31 (m, 3H), 6,85 (s, 2H), 3,92 (s, 3H)	
24	169-170		ESIMS m/z 422 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,58-7,43 (m, 2H), 5,53 (s, 2H), 4,00 (s, 3H), 3,95 (s, 3H)	
25	185,2-186,1		ESIMS m/z 271 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,6 (s, 1H), 8,40 (d, 2H), 7,96 (d, 2H), 7,46 (s, 2H), 3,79 (s, 3H)	
26		IR (película delgada) 3401, 1739, 1638 cm ⁻¹	ESIMS m/z 346 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,19 (t, <i>J</i> = 16,1 Hz, 1H), 8,11 (d, <i>J</i> = 12,3 Hz, 1H), 7,92 (t, <i>J</i> = 7,9 Hz, 1H), 7,74-7,46 (m, 2H), 3,92 (s, 3H), 3,76 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -59,9, -115,7, -116,0
27			ESIMS m/z 403 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,00-7,87 (m, 2H), 7,82 (dd, <i>J</i> = 8,3, 1,8 Hz, 1H), 7,49 (s, 2H), 3,90 (s, 3H), 3,74 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -95,51
28	170,7-171,3		ESIMS m/z 270 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,6 (s, 1H), 8,25 (d, 2H), 7,59 (d, 2H), 7,36 (s, 2H), 4,35 (s, 1H), 3,77 (s, 3H)	
29	145-146		ESIMS m/z 349 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,79 (dd, <i>J</i> = 15,8, 9,9 Hz, 2H), 7,66 (t, <i>J</i> = 7,7 Hz, 1H), 7,12 (s, 1H), 4,90 (s, 2H),	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -61,3, -113,9

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				4,02 (s, 3H)	
30	122,0- 123,6		ESIMS m/z 343 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 8,33 (d, 2H), 7,27 (d, 2H), 5,84 (s, 2H), 4,03 (s, 3H), 3,95 (s, 3H)	
31	180-181			RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,71 (s, 1H), 8,40-8,33 (m, 2H), 8,13 (d, <i>J</i> = 8,3, 2H), 7,07 (s, 2H)	
32	168-171		ESIMS m/z 328 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,68 (s, 1H), 8,28 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 8,20 (d, <i>J</i> = 12,2 Hz, 1H), 7,94 (t, <i>J</i> = 7,9 Hz, 1H), 7,35 (d, <i>J</i> = 27,9 Hz, 2H), 6,68 (dd, <i>J</i> = 17,7, 11,5 Hz, 1H), 5,75-5,46 (m, 2H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -59,97 (d, <i>J</i> = 12,2 Hz), -115,77 (q, <i>J</i> = 12,2 Hz)
33	146,3- 147,6		ESIMS m/z 349 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,7 (s, 1H), 7,68 (d, 2H), 7,32 (d, 2H), 6,96 (s, 2H)	
34	164,2- 166,8		ESIMS m/z 321 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (300 MHz, CDCl ₃) δ 6,30 (m, 5H), 5,35 (s, 2H), 3,98 (s, 3H)	
35	163-165	IR (película delgada) 3416 (s), 3355 (w), 3300 (m), 3162 (s), 2957 (w), 1730 (s), 1637 (s) cm ⁻¹	ESIMS m/z 358 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,84 (t, <i>J</i> = 9 Hz, 1H), 7,31-7,37 (m, 2H), 5,41 (s ancho, 2H), 3,99 (s, 3H), 3,93 (s, 3H)	
36			ESIMS m/z 282 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,93-7,84 (m, 2H), 7,64-7,54 (m, 2H), 6,75 (dd, <i>J</i> = 17,8, 11,5 Hz, 1H), 6,36 (s, 2H), 5,57 (dd, <i>J</i> = 17,8, 1,4 Hz, 1H), 5,50 (dd, <i>J</i> = 11,5, 1,4 Hz, 1H), 4,31 (s, 1H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -141,43

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
37			ESIMS <i>m/z</i> 390 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,57 (s, 1H), 8,02-7,92 (m, 2H), 7,85 (dd, <i>J</i> = 8,2, 1,8 Hz, 1H), 7,41 (s, 2H), 3,75 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -95,59.
38	288-293 (desc.)	IR (película delgada) 3473 (s), 1588 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 411 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,74 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,02 (d, <i>J</i> = 1,5 Hz, 1H), 6,30 (s ancho, 2H)	
39			ESIMS <i>m/z</i> 292 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,08-7,92 (m, 4H), 7,03 (s, 2H)	
40			ESIMS <i>m/z</i> 301 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,55 (d, <i>J</i> = 8,4 Hz, 2H), 7,42 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 2H), 4,83 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 3,12 (s, 1H), 2,16 (s, 3H)	RMN C ¹³ (101 MHz, CDCl ₃) δ 165,71, 155,51, 149,15, 145,10, 140,11, 132,02, 129,34, 122,02, 116,77, 113,59, 83,42, 77,90, 52,87, 14,65
41	155-165 (desc.)	IR (película delgada) 3297 (s), 3218 (s), 2938 (w), 1618 (s), 1576 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 288 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,80 (t, <i>J</i> = 8 Hz, 1H), 7,35-7,40 (m, 2H), 6,66 (s ancho, 2H), 4,41 (s, 1H), 3,76 (s, 3H)	
42	156-157		ESIMS <i>m/z</i> 382 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,63 (s, 1H), 7,92 (dd, <i>J</i> = 9,0, 5,7 Hz, 1H), 7,61 (dd, <i>J</i> = 8,4, 6,3 Hz, 1H), 7,06 (s, 2H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -113,46, -113,50, -117,37, -117,41, -117,45, -117,49, -138,28, -138,36
43			ESIMS <i>m/z</i> 381 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,72 (s, 1H), 7,82 (dd, <i>J</i> = 8,3, 7,3 Hz, 1H), 7,60 (dd, <i>J</i> = 9,8, 2,0 Hz, 1H), 7,40 (dd, <i>J</i> = 8,3, 2,0 Hz, 1H), 7,06 (s, 2H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -108,25
44			ESIMS <i>m/z</i> 324 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,05 (dd, <i>J</i> = 10,0, 1,5 Hz, 1H), 7,85 (dd, <i>J</i> = 8,0, 1,5 Hz, 1H),	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -112,13 (d, <i>J</i> = 28,4 Hz), -137,43 (d, <i>J</i> = 28,4 Hz)

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				7,73-7,81 (m, 1H), 7,18 (s, 2H), 3,87 (s, 3H)	
45	148-150		ESIMS <i>m/z</i> 393 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,87 (m, 2H), 7,62 (m, 2H), 6,91 (s ancho, 2H)	
46	133-135	IR (película delgada) 3490 (s), 3350 (s), 1753 (w), 1634 (m), 1607 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 344 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,60 (s ancho, 1H), 7,81 (t, <i>J</i> = 9 Hz, 1H), 7,63 (dd = 11, 2 Hz, 1H), 7,52 (dd, <i>J</i> = 9, 2 Hz, 1H), 7,38 (s ancho, 2H), 3,76 (s, 3H)	
47	159,6- 161,1		ESIMS <i>m/z</i> 377 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,58 (m, 4H), 5,36 (s, 2H), 3,99 (s, 3H)	
48	204,2- 205,9		ESIMS <i>m/z</i> 273 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,5 (s, 1H), 7,94 (d, 2H), 7,60 (d, 2H), 7,30 (s, 1H), 6,69 (s, 2H)	
49	114-116	IR (película delgada) 3492 (s), 3378 (s), 3235 (w), 2955 (w), 2927 (w), 1736 (s), 1621 (s) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 379 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (300 MHz, CDCl ₃) δ 7,76 (m, 1H), 7,60-7,68 (m, 2H), 4,94 (s ancho, 2H), 3,99 (s, 3H)	
50	174-176	IR (película delgada) 3305 (s), 1720 (w), 1634 (m), 1586 (w) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 327 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,53 (dd, <i>J</i> = 8, 7 Hz, 1H), 7,41 (m, 1H), 6,93 (s ancho, 2H), 4,81 (s, 1H)	
51	153-154		ESIMS <i>m/z</i> 394 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,42-7,38 (m, 2H), 4,98 (s, 2H), 3,99 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -112,74, -112,78, -116,99, -117,03, -117,09, -117,13, -137,28, -137,38
52	146-148	IR (película neta) 3519 (m), 3473 (m), 3420 (s), 3379 (s), 3196 (w), 3075 (w), 2955 (w), 2852 (w), 1736 (s), 1616 (s) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 379 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,50 (dd, <i>J</i> = 8, 7 Hz, 1H), 7,42 (dd, <i>J</i> = 8, 2 Hz, 1H), 7,36 (dd, <i>J</i> = 10, 2 Hz, 1H), 4,93 (s ancho, 2H),	

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				3,96 (s, 3H)	
53	118-120		ESIMS <i>m/z</i> 377 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,53-7,45 (m, 2H), 6,91 (dd, <i>J</i> = 18,1, 11,6 Hz, 1H), 5,76 (dd, <i>J</i> = 11,6, 1,3 Hz, 1H), 5,61 (dd, <i>J</i> = 18,1, 1,3 Hz, 1H), 4,81 (s, 2H), 3,92 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -61,16, -61,20, -135,77, -135,83, -135,86, -135,92, -138,61, -138,65, -138,67, -138,68, -138,70, -138,72, -138,74, -138,77, -140,73, -140,82.
54			ESIMS <i>m/z</i> 326,07 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,15 (m, 2H), 7,67 (m, 2H), 7,45 (s ancho, 2H), 3,75 (s, 3H)	
55	142-144		ESIMS <i>m/z</i> 443 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,56 (dd, <i>J</i> = 8,5, 4,9 Hz, 1H), 7,32 (dd, <i>J</i> = 7,6, 5,8 Hz, 1H), 4,97 (s, 2H), 3,98 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -99,87, -99,91, -117,70, -117,74, -117,80, -117,84, -137,25, -137,35.
56	142-144		ESIMS <i>m/z</i> 425 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,80 (dd, <i>J</i> = 8,5, 6,5 Hz, 1H), 7,53 (dd, <i>J</i> = 10,0, 5,0 Hz, 1H), 7,25 (d, <i>J</i> = 1,2 Hz, 1H), 4,86 (s, 2H), 4,01 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -100,00, -100,05, -120,62, -120,66.
57	93-94		ESIMS <i>m/z</i> 352 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,86-7,79 (m, 2H), 7,62-7,56 (m, 2H), 6,89 (dd, <i>J</i> = 18,1, 11,5 Hz, 1H), 5,71 (dd, <i>J</i> = 11,6, 1,4 Hz, 1H), 5,58 (dd, <i>J</i> = 18,1, 1,4 Hz, 1H), 4,71 (s, 2H), 3,93 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -144,04
58		IR (película delgada) 3367, 1735, 1608 cm ⁻¹ .	ESIMS <i>m/z</i> 381 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,91 (t, <i>J</i> = 7,8 Hz, 1H), 7,74 (d, <i>J</i> = 11,6 Hz, 1H), 7,62 (d, <i>J</i> = 8,1 Hz, 1H), 7,20 (d, <i>J</i> = 21,4 Hz, 2H), 3,87 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -59,9, -115,6, -116,3
59	203-205	IR (película delgada) 3425 (m), 3297 (m), 3245 (s), 3158 (m), 3008 (w), 2956	ESIMS <i>m/z</i> 302 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,91 (t, <i>J</i> = 8 Hz, 1H), 7,32	

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
		(w), 1729 (m), 1637 (m) cm ⁻¹		(dd, $J = 8, 1,5$ Hz, 1H), 7,26 (dd, $J = 12, 1,5$ Hz, 1H), 5,40 (s ancho, 2H), 3,99 (s, 3H), 3,93 (s, 3H), 3,15 (s, 1H)	
60			ESIMS m/z 297 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,93 (ddd, $J = 8,2, 1,6, 0,7$ Hz, 2H), 7,65-7,54 (m, 2H), 6,90 (ddd, $J = 18,1, 11,6, 0,5$ Hz, 1H), 5,71 (dd, $J = 11,5, 1,4$ Hz, 1H), 5,58 (dd, $J = 18,1, 1,4$ Hz, 1H), 4,71 (s, 2H), 3,93 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -143,86
61			ESIMS m/z 361 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,55-7,45 (m, 2H), 7,25 (dd, $J = 18,3, 11,6$ Hz, 1H), 5,85 (dd, $J = 11,7, 1,2$ Hz, 1H), 5,64 (dd, $J = 18,4, 1,2$ Hz, 1H), 5,11 (s, 2H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -61,22,-61,25,-135,48,-135,54,-135,57,-135,62,-137,62,-137,66,-137,68,-137,69,-137,71,-137,73,-137,75,-137,78,-137,78,-137,95
62	142-147 (desc.)	IR (película delgada) 3317 (s), 3199 (s), 2955 (w), 2924 (w), 2870 (w), 2256 (w), 1721 (m), 1634 (m) cm ⁻¹	ESIMS m/z 291 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 7,86 (m, 2H), 7,61 (m, 2H), 6,93 (s ancho, 2H), 4,33 (s, 1H)	
63		IR (película delgada) 2979, 1715 cm ⁻¹	ESIMS m/z 332 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,22 (t, $J = 10,7$ Hz, 1H), 8,17 (d, $J = 12,3$ Hz, 1H), 7,90 (dd, $J = 21,3, 13,4$ Hz, 1H), 7,56 (d, $J = 44,0$ Hz, 3H), 3,77 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- d_6) δ -59,9, -115,3, -116,7
64	140-141		ESIMS m/z 364 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 7,87 (t, $J = 7,5$ Hz, 1H), 7,72-7,66 (m, 1H), 7,58 (s, 2H), 3,90 (s, 3H), 3,78 (s, 3H)	
65			ESIMS m/z 310 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 13,71 (s, 1H), 8,05 (dd, $J = 9,9, 1,4$ Hz, 1H), 7,86 (dd, $J = 8,0, 1,5$ Hz, 1H), 7,75-	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- d_6) δ -112,04 (d, $J = 29,9$ Hz), -138,35 (d, $J = 29,6$ Hz)

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				7,81 (m, 1H), 7,09 (s, 2H)	
66	141-143		ESIMS <i>m/z</i> 407 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,95 (dd, 1H), 7,77 (dd, 1H), 7,52 (dd, 1H), 7,32 (s, 1H), 6,81 (s, 2H), 3,89 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -95,03
67			ESIMS <i>m/z</i> 341 ([M-H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,77 (m, 2H), 7,55 (m, 2H), 7,1 (s, 1H), 4,84 (s ancho, 2H), 4,00 (s, 3H)	
68	170,1- 172,6		ESIMS <i>m/z</i> 431 ([M + 3H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 6,85-6,77 (m, 3H), 7,79 (m, 1H)	
69	159-161		ESIMS <i>m/z</i> 429 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 11,14 (s, 1H), 7,63 (dd, <i>J</i> = 8,6, 4,9 Hz, 1H), 7,27 (dd, <i>J</i> = 7,5, 5,7 Hz, 1H), 5,21 (s, 2H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -99,15, -99,20, -117,70, -117,74, -117,79, -117,83, -134,64, -134,71
70	114-116		ESIMS <i>m/z</i> 367 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,97 (dd, <i>J</i> = 10,6, 6,3 Hz, 1H), 7,39 (dd, <i>J</i> = 10,5, 5,6 Hz, 1H), 7,30 (d, <i>J</i> = 1,2 Hz, 1H), 4,91 (s, 2H), 4,02 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -61,69, -61,73, -119,19, -119,22, -119,24, -119,27, -120,01, -120,06
71	157-160 (desc.)	IR (película delgada) 3400 (s), 3300 (s), 3200 (m), 1711 (w), 1630 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 309 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,68-7,78 (m, 3H), 6,76 (s ancho, 2H), 4,66 (s, 1H)	
72	95-98	IR (película delgada) 3327 (s), 2941 (w), 1718 (w), 1629 (m), 1603 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 390 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,67 (s ancho, 1H), 7,73 (dd, <i>J</i> = 11, 1,5 Hz, 1H), 7,68 (dd, <i>J</i> = 8,5, 1,5 Hz, 1H), 7,63 (t, <i>J</i> = 8,5 Hz, 1H), 7,33 (s ancho, 2H), 3,76 (s, 3H)	
73			ESIMS <i>m/z</i> 395 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,82 (dd, <i>J</i> = 8,3, 7,3 Hz,	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 108,20

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				1H), 7,60 (dd, <i>J</i> = 9,8, 2,0 Hz, 1H), 7,40 (dd, <i>J</i> = 8,3, 2,0 Hz, 1H), 7,16 (s, 2H), 3,87 (s, 3H)	
74	186,0-187,3		ESIMS <i>m/z</i> 345 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,6 (s, 1H), 7,87 (m, 1H), 7,72 (m, 1H), 7,57 (m, 1H), 7,23 (s, 1H), 6,18 (s, 2H)	
76	169-170		ESIMS <i>m/z</i> 350 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,63 (s, 1H), 7,89 (t, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,69 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 7,48 (s, 2H), 3,79 (s, 3H)	
77			ESIMS <i>m/z</i> 393 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,57 (s, 1H), 7,95 (dd, <i>J</i> = 8,2, 6,8 Hz, 1H), 7,74 (dd, <i>J</i> = 9,8, 2,0 Hz, 1H), 7,53 (dd, <i>J</i> = 8,3, 2,0 Hz, 1H), 7,28 (s, 1H), 6,71 (s, 2H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -95,12
78	185,5-187,0		ESIMS <i>m/z</i> 342 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,64 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 2H), 7,40 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 2H), 6,47 (s, 2H), 2,07 (s, 3H)	RMN C ¹³ (101 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 166,57, 153,45, 150,28, 138,92, 131,35, 130,86, 121,35, 115,84, 109,91, 99,49, 14,91
79	121-124		ESIMS <i>m/z</i> 421 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,80 (dd, <i>J</i> = 8,1, 6,5 Hz, 1H), 7,19 (dd, <i>J</i> = 8,6, 1,9 Hz, 1H), 7,00 (dd, <i>J</i> = 8,1, 1,9 Hz, 1H), 4,86 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 2,17 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -93,62
80	170-171		ESIMS <i>m/z</i> 344 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,30 (dd, <i>J</i> = 9,8, 2,1 Hz, 1H), 8,22 (dd, <i>J</i> = 8,5, 2,2 Hz, 1H), 7,87 (m, 1H), 7,22 (s, 2H), 3,88 (s, 3H)	
81	128-130		ESIMS <i>m/z</i>	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,56 (d, <i>J</i>	RMN C ¹³ (101 MHz, CDCl ₃) δ 165,68, 155,19, 149,18,

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
			354 ([M-H] ⁻)	= 8,5 Hz, 2H), 7,33 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 2H), 4,84 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 2,15 (s, 3H)	145,09, 138,57, 131,42, 131,00, 122,60, 116,69, 113,59, 52,88, 14,65
82	159-162	IR (película delgada) 3493 (s), 3352 (s), 2943 (w), 2853 (w), 1725 (m), 1602 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 404 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,68 (t, <i>J</i> = 8 Hz, 1H), 7,50-7,58 (m, 2H), 5,40 (s ancho, 2H), 4,00 (s, 3H), 3,94 (s, 3H)	
83	145-148, 220		ESIMS <i>m/z</i> 302 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,73 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 2H), 7,58 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 2H), 4,90 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 2,16 (s, 3H)	RMN C ¹³ (101 MHz, CDCl ₃) δ 165,50, 154,25, 149,37, 145,36, 144,19, 132,09, 130,18, 118,67, 116,71, 114,01, 112,06, 52,95, 14,58
84	214-217	IR (película delgada) 3453 (m), 3302 (m), 3242 (s), 3170 (m), 2963 (w), 2852 (w), 2112 (w), 1732 (m), 1631 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 320 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,69 (ddd, <i>J</i> = 9, 7, 2 Hz, 1H), 7,27 (m, 1H), 5,42 (s ancho, 2H), 4,00 (s, 3H), 3,95 (s, 3H), 3,42 (s, 1H)	
85	126-125		ESIMS <i>m/z</i> 347 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,88 (dd, <i>J</i> = 8,8, 1,3, 2H), 7,34 (t, <i>J</i> = 73,8, 1H), 7,31 (d, <i>J</i> = 8,9, 2H), 7,01 (s ancho, 2H), 3,88 (s, 1H)	
86	120-122		ESIMS <i>m/z</i> 345 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,22 (s, 1H), 8,02-7,94 (m, 3H), 6,78 (dd, <i>J</i> = 17,7, 11,6 Hz, 1H), 6,56 (s, 2H), 5,65-5,52 (m, 2H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -61,37, -61,41, -114,17, -114,20, -114,24, -114,27, -143,61
87	171-172		ESIMS <i>m/z</i> 407 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,36 (s, 1H), 7,91 (dd, <i>J</i> = 8,0, 6,8 Hz, 1H), 7,35 (dd, <i>J</i> = 9,1, 1,9 Hz, 1H), 7,10 (dd, <i>J</i> = 8,1, 1,9 Hz, 1H), 6,49 (s, 2H), 2,09 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -95,45
88			ESIMS <i>m/z</i> 372 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,00 (m, 2H), 7,84 (m, 2H), 7,35 (s ancho,	

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				2H), 3,11 (s, 3H)	
89	119-121			RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,63 (s, 1H), 7,72 (ddd, <i>J</i> = 8,3, 5,7, 1,8 Hz, 1H), 7,51 (ddd, <i>J</i> = 8,6, 7,0, 1,8 Hz, 1H), 7,43 (s, 2H), 3,76 (s, 3H)	
90	176,2-178,7		ESIMS <i>m/z</i> 445 ([M + 2H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 3,86 (s, 3H), 6,98-6,94 (m, 3H), 7,89-7,85 (m, 1H)	
91	173-175		ESIMS <i>m/z</i> 363 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,76-7,56 (m, 2H), 7,22 (d, <i>J</i> = 1,7, 1H), 6,84 (s, 2H)	
92	147-149	IR (película delgada) 778,80, 822,34, 879,66, 973,14, 1006,40, 1026,12, 1056,64, 1120,85, 1214,80, 1276,30, 1389,19, 1409,98, 1459,47, 1496,89, 1519,03, 1592,79, 1627,42, 1720,12, 1769,38, 2535,30, 3199,10, 3386,23, 3501,86 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 351 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,63 (s, 1H), 7,83 (dd, <i>J</i> = 11,8, 2,1 Hz, 1H), 7,75 (t, <i>J</i> = 72,0 Hz, 1H), 7,52 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,50-7,14 (m, 1H), 6,99 (s, 2H)	
93	98,9-101,6		ESIMS <i>m/z</i> 359 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,93 (m, 1H), 7,34 (m, 2H), 7,22 (s, 1H), 4,85 (s, 2H), 4,00 (s, 3H)	
94	158,5-159,5		ESIMS <i>m/z</i> 329 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,51 (d, <i>J</i> = 8,6 Hz, 2H), 7,33-7,14 (m, 3H), 6,61 (s, 2H), 2,09 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -82,20
95			ESIMS <i>m/z</i> 326 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (300 MHz, CDCl ₃) δ 8,32 (d, <i>J</i> = 9,0, 2H), 8,13 (dd, <i>J</i> = 9,0, 1,4, 2H), 5,02 (s, 2H), 4,01 (s, 3H)	
96	187,2-		ESIMS <i>m/z</i>	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,80 (d,	

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
	189,9		423 ([M + H] ⁺)	2H), 7,42 (d, 2H), 5,35 (s, 2H), 3,98 (s, 3H)	
97			ESIMS <i>m/z</i> 340 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 8,19 (m, 2H), 7,55 (m, 2H), 5,35 (s ancho, 2H), 4,01 (s, 3H), 3,92 (s, 3H)	
98			ESIMS <i>m/z</i> 299 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,13-7,90 (m, 2H), 7,80 (dd, <i>J</i> = 8,0, 1,6 Hz, 1H), 7,46 (s, 2H), 6,66 (dd, <i>J</i> = 17,6, 11,5 Hz, 1H), 5,63-5,43 (m, 2H), 3,82 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -111,51
99	168-170	IR (película delgada) 3502 (m), 3378 (s), 2953 (w), 1739 (m), 1726 (m), 1617 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 443 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,62 (ddd, <i>J</i> = 9, 6, 2 Hz, 1H), 7,16 (ddd, <i>J</i> = 9, 6, 5, 2 Hz, 1H), 4,97 (s ancho, 2H), 3,96 (s, 3H)	
100	145-147		ESIMS <i>m/z</i> 502 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,54 (dd, <i>J</i> = 8,2, 4,9 Hz, 1H), 7,12 (dd, <i>J</i> = 7,4, 5,8 Hz, 1H), 5,44 (s, 2H), 3,97 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -99,80, -99,84, -116,84, -116,89
101	193-194		ESIMS <i>m/z</i> 422 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,69 (dd, <i>J</i> = 8,3, 6,3 Hz, 1H), 7,54 (dd, <i>J</i> = 9,5, 5,0 Hz, 1H), 5,43 (s, 2H), 4,00 (s, 3H), 3,94 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -100,82, -100,86, -118,25, -118,29
102	171,0-172,1		ESIMS <i>m/z</i> 330 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,35 (d, 2H), 7,47 (d, 2H), 7,39 (s, 2H), 3,78 (s, 3H)	
103		IR (película delgada) 708,67, 786,89, 824,69, 939,95, 1032,81, 1120,09, 1153,46, 1204,33, 1225,97, 1263,98, 1424,87, 1375,02, 1445,12, 1481,84,	ESIMS <i>m/z</i> 383 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,37 (ddd, <i>J</i> = 8,7, 7,0, 2,3 Hz, 1H), 7,19-7,11 (m, 1H), 6,61 (t, <i>J</i> = 72,5 Hz, 1H), 4,99	

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
		1518,14, 1615,72, 1739,13, 2959,84, 3195,90, 3378,30, 3486,20 cm ⁻¹		(s, 2H), 3,98 (s, 3H)	
104	127-129	IR (película delgada) 758,08, 793,58, 824,98, 856,60, 919,36, 972,37, 1014,89, 1053,05, 1122,86, 1162,89, 1203,20, 1241,89, 1276,59, 1369,66, 1439,27, 1480,39, 1512,36, 1611,65, 1732,10, 2957,77, 3021,70, 3389,26, 3506,76 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 366 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,61 (t, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 7,04 (ddd, <i>J</i> = 8,6, 2,3, 0,8 Hz, 1H), 6,96 (dd, <i>J</i> = 10,5, 2,3 Hz, 1H), 6,55 (t, <i>J</i> = 73,0 Hz, 1H), 4,96 (s, 2H), 3,97 (s, 3H)	RMN C ¹³ (101 MHz, CDCl ₃) δ 164,70, 161,50, 158,98, 152,94, 152,84, 147,17, 144,60, 143,59, 143,54, 140,22, 140,08, 137,91, 137,78, 132,54, 132,53, 132,49, 119,75, 119,71, 119,60, 119,56, 118,02, 115,77, 115,75, 115,42, 115,40, 115,37, 112,81, 107,69, 107,43, 53,07
105	141,9- 143,1		ESIMS <i>m/z</i> 367 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,7 (s, 1H), 7,75 (d, 2H), 7,49 (d, 2H), 7,01 (s, 2H)	
106	183-184	IR (película delgada) 861,93, 886,37, 962,21, 984,56, 1035,97, 1010,25, 1113,86, 1143,26, 1173,58, 1222,01, 1251,67, 1294,93, 1438,95, 1397,88, 1514,76, 1486,42, 1595,67, 1568,01, 1608,88, 1645,71, 1735,15, 2693,18, 2860,72, 2960,57, 3179,92, 3320,20, 3406,42 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 326 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 8,35-8,29 (m, 2H), 7,19-7,10 (m, 2H), 6,56 (t, <i>J</i> = 72 Hz, 1H), 5,33 (s, 3H), 4,02 (s, 3H), 3,92 (s, 3H)	
107			ESIMS <i>m/z</i> 298 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 8,08 (dd, <i>J</i> = 8,6, 1,5 Hz, 2H), 7,78-7,71 (m, 2H), 6,89 (dd, <i>J</i> = 18,1, 11,6 Hz, 1H), 5,73 (dd, <i>J</i> = 11,6, 1,4 Hz, 1H), 5,59 (dd, <i>J</i> = 18,1, 1,4 Hz, 1H), 4,78 (s, 2H), 3,93 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -143,64
108	165-175 (desc.)	IR (película delgada) 3468 (s), 1621 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 309 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,55 (t, <i>J</i> = 8 Hz, 1H), 7,50 (dd, <i>J</i> = 11, 1,5 Hz, 1H), 7,46 (dd, <i>J</i> = 8, 1,5 Hz, 1H), 6,47 (s ancho,	

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				2H), 4,45 (s, 1H)	
109	184-186		ESIMS <i>m/z</i> 393 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (300 MHz, CDCl ₃) δ 7,48-7,40 (m, 1H), 7,33-7,26 (m, 1H), 4,99 (s ancho, 2H), 3,98 (s, 3H)	
110			ESIMS <i>m/z</i> 345 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,33 (s, 1H), 7,70-7,52 (m, 2H), 7,45 (dd, <i>J</i> = 8,4, 2,0 Hz, 1H), 7,06 (s, 1H), 6,52 (s, 2H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -107,95.
111			ESIMS <i>m/z</i> 341 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,46 (d, <i>J</i> = 8,7 Hz, 2H), 7,18 (d, <i>J</i> = 8,7 Hz, 2H), 6,53 (t, <i>J</i> = 73,8 Hz, 1H), 4,84 (s, 2H), 3,95 (s, 3H), 2,16 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -80,81
112	134-137		ESIMS <i>m/z</i> 375 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,61 (dd, <i>J</i> = 8,2, 7,1 Hz, 1H), 7,27-7,25 (m, 1H), 7,13 (ddd, <i>J</i> = 8,2, 1,9, 0,6 Hz, 1H), 4,86 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 2,17 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -107,04
113			ESIMS <i>m/z</i> 344 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,63 (s, 1H), 8,07 (dd, <i>J</i> = 10,3, 1,9 Hz, 1H), 8,01 (dd, <i>J</i> = 8,5, 2,0 Hz, 1H), 7,81 (dd, <i>J</i> = 8,4, 7,2 Hz, 1H), 7,40 (s, 2H), 3,76 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -108,44
114	178-180		ESIMS <i>m/z</i> 379 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,78-7,58 (m, 2H), 7,26 (d, <i>J</i> = 1,6, 1H), 6,95 (s, 2H), 3,89 (s, 3H)	
115			ESIMS <i>m/z</i> 359 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,91-7,80 (m, 2H), 7,75-7,67 (m, 1H), 7,35 (s, 1H), 6,86 (s,	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -107,88

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				2H), 3,93 (s, 3H)	
116	179,5- 181,0		ESIMS <i>m/z</i> 389 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,81 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 2H), 7,25 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 2H), 6,46 (s, 2H), 2,07 (s, 3H)	RMN C ¹³ (101 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 166,56, 153,62, 150,28, 139,23, 136,72, 131,38, 115,78, 109,86, 94,48, 48,57, 14,90
117	149-151		ESIMS <i>m/z</i> 336 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,13 (s, 1H), 7,82 (dd, <i>J</i> = 8,5, 0,9 Hz, 2H), 7,74-7,66 (m, 2H), 6,75 (dd, <i>J</i> = 17,8, 11,5 Hz, 1H), 6,42 (s, 2H), 5,56 (dd, <i>J</i> = 12,8, 1,3 Hz, 1H), 5,52 (dd, <i>J</i> = 6,5, 1,3 Hz, 1H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -145,77
118	133-135		ESIMS <i>m/z</i> 407 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (300 MHz, CDCl ₃) δ 7,81 (m, 2H), 7,67 (m, 2H), 4,91 (s ancho, 2H), 3,99 (s, 3H)	
119	131-132		ESIMS <i>m/z</i> 408 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,83 (dd, <i>J</i> = 9,6, 5,1 Hz, 1H), 7,66 (dd, <i>J</i> = 8,5, 6,3 Hz, 1H), 7,42 (s, 2H), 3,75 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -101,95, -102,00, -117,68, -117,72
121	186-188	IR (película delgada) 3500 (w), 3472 (m), 3370 (s), 3229 (m), 2955 (w), 2921 (w), 2850 (w), 1728 (m), 1622 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 323 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,58 (t, <i>J</i> = 8 Hz, 1H), 7,39 (dd, <i>J</i> = 8, 1,5 Hz, 1H), 7,28 (m, 1H), 4,94 (s ancho, 2H), 3,97 (s, 3H), 3,17 (s, 1H)	
122	171-172		ESIMS <i>m/z</i> 374 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,65 (ddd, <i>J</i> = 9,0, 7,1, 2,1 Hz, 1H), 7,40-7,31 (m, 1H), 5,45 (s, 2H), 4,01 (s, 3H), 3,95 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -129,82 (s), -129,88 (s), -135,73 (s), -135,79 (s)
123	187-190		ESIMS <i>m/z</i> 368 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,01-8,09 (m, 2H), 7,82-7,90 (m, 2H), 7,16 (s, 1H), 6,65 (dd, <i>J</i> = 17,7, 11,5 Hz,	

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				1H), 5,61 (dd, J = 17,7, 1,3 Hz, 1H), 5,49 (dd, J = 11,4, 1,3 Hz, 1H)	
124	208,4- 210,2		ESIMS m/z 393 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 13,7 (s, 1H), 7,78 (m, 3H), 7,23 (s, 1H), 6,83 (s, 2H)	
125	164,9- 166,1		ESIMS m/z 363 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 13,69 (s, 1H), 7,67 (d, 2H) 7,55 (d, 2H), 6,99 (s, 2H)	
126	158,9- 161,2		ESIMS m/z 287 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,93 (d, 2H), 7,60 (d, 2H), 7,16 (s, 1H), 4,89 (s, 2H), 4,05 (s, 3H)	
127	174-176		ESIMS m/z 376 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,89 (dd, J = 9,2, 6,7 Hz, 1H), 7,36 (dd, J = 10,2, 5,5 Hz, 1H), 7,25 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 4,86 (s, 2H), 4,01 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -112,80, -112,84, -119,98, -120,02
128		IR (película delgada) 3334, 1722 cm ⁻¹	ESIMS m/z 336 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,25 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 8,17 (d, J = 11,9 Hz, 2H), 7,95 (t, J = 7,9 Hz, 2H), 7,66 (s, 1H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO) δ -60,0, -114,7, -116,5
129	172-174	IR (película delgada) 3481 (m), 3338 (s), 3185 (w), 3096 (w), 2963 (w), 1727 (m), 1608 (m) cm ⁻¹	ESIMS m/z 425 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,55-7,62 (m, 2H), 7,21 (d, J = 2 Hz, 1H), 4,86 (s ancho, 2H), 3,99 (s, 3H)	
130	185,1- 186,9		ESIMS m/z 285 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 8,45 (d, 2H), 7,75 (s, 2H), 5,84 (s, 2H), 4,03 (s, 3H), 3,96 (s, 3H)	
131	173-175		ESIMS m/z 411 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 7,90 (dd, J = 10,2, 5,1 Hz, 1H), 7,73 (dd, J = 8,6, 6,6 Hz, 1H),	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- d_6) δ -96,56, -96,61, -115,34, -115,38

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				7,26 (s, 1H), 6,83 (s, 2H)	
132	138-140	IR (película delgada) 3437 (w), 3352 (s), 3197 (w), 2949 (w), 1737 (m), 1614 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 425 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,88 (dd, <i>J</i> = 9, 7 Hz, 1H), 7,73 (ddd, <i>J</i> = 9, 2, 1 Hz, 1H), 7,55 (dt, <i>J</i> = 8,5, 2 Hz, 1H), 4,94 (s ancho, 2H), 4,00 (s, 3H)	
133	141-143	IR (película delgada) 3385 (s), 3242 (m), 2955 (w), 2918 (w), 2856 (w), 1734 (m), 1622 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 323 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,75 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 2H), 7,57 (t, <i>J</i> = 7 Hz, 1H), 4,93 (s ancho, 2H), 3,98 (s, 3H), 3,37 (s, 1H)	
134	124-126		ESIMS <i>m/z</i> 353 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,92 (d, <i>J</i> = 12,8 Hz, 3H), 7,01 (s, 2H)	
135			ESIMS <i>m/z</i> 324 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,98-7,83 (m, 1H), 7,72 (dd, <i>J</i> = 8,4, 6,6, 1H), 5,01 (s, 1H), 4,01 (s, 2H)	
136	115-118		ESIMS <i>m/z</i> 403 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,77 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 2H), 7,20 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 2H), 4,83 (s, 2H), 3,95 (s, 3H), 2,15 (s, 3H)	RMN C ¹³ (101 MHz, CDCl ₃) δ 165,69, 155,29, 149,17, 145,12, 139,19, 137,39, 131,16, 116,65, 113,57, 94,30, 52,86, 14,64
137			ESIMS <i>m/z</i> 342 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,26 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 8,17 (d, <i>J</i> = 12,2 Hz, 1H), 7,94 (t, <i>J</i> = 7,9 Hz, 1H), 7,35 (s, 2H), 6,67 (dd, <i>J</i> = 17,7, 11,5 Hz, 1H), 5,52 (m, 2H), 3,85 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -59,99 (d, <i>J</i> = 12,2 Hz), -115,72 (d, <i>J</i> = 12,2 Hz)
138			ESIMS <i>m/z</i> 361 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,81 (m, 2H), 7,60 (m, 2H), 7,40 (d, <i>J</i> = 2 Hz, 2H), 4,91 (s ancho, 2H), 3,99 (s, 3H)	

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
139	95-96		ESIMS <i>m/z</i> 399 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,84-7,75 (m, 2H), 7,73-7,66 (m, 2H), 6,89 (dd, <i>J</i> = 18,1, 11,6 Hz, 1H), 5,71 (dd, <i>J</i> = 11,6, 1,4 Hz, 1H), 5,58 (dd, <i>J</i> = 18,1, 1,4 Hz, 1H), 4,71 (s, 2H), 3,92 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -143,98
140	149-151	IR (película delgada) 698,09, 825,26, 869,29, 998,15, 1025,59, 1050,34, 1098,57, 1129,54, 1167,58, 1246,97, 1386,17, 1435,44, 1481,70, 1515,78, 1590,42, 1628,74, 1720,93, 2535,45, 3198,03, 3327,36, 3469,29 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 351 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 18,40 (s, 1H), 12,39 (t, <i>J</i> = 8,4 Hz, 1H), 12,16 (t, <i>J</i> = 72,0 Hz, 1H), 12,05 (dd, <i>J</i> = 11,1, 2,4 Hz, 1H), 11,94 (dd, <i>J</i> = 8,5, 2,4 Hz, 1H), 11,75 (s, 2H)	
141	155-157	IR (película delgada) 3325 (s), 3193 (s), 1625 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 429 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,81 (br t, <i>J</i> = 7 Hz, 1H), 7,20 (br t, <i>J</i> = 7 Hz, 1H), 6,64 (s ancho, 2H)	
142	164-167		ESIMS <i>m/z</i> 306 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,06-7,94 (m, 4H), 7,12 (s ancho, 2H), 3,89 (s, 3H)	
143	137-139		ESIMS <i>m/z</i> 333 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,90 (dd, <i>J</i> = 8,8, 1,3, 2H), 7,34 (t, <i>J</i> = 73,8, 1H), 7,30 (d, <i>J</i> = 8,8, 2H), 6,90 (s, 2H)	
144	124-126		ESIMS <i>m/z</i> 385 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,50 (dd, <i>J</i> = 9,8, 5,3 Hz, 1H), 7,42 (dd, <i>J</i> = 8,9, 5,6 Hz, 1H), 5,03 (s, 2H), 3,99 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -61,82, -61,85, -116,72, -116,76, -116,81, -116,86, -119,30, -119,33, -119,35, -119,38, -137,15, -137,24
145			ESIMS <i>m/z</i> 427 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,75 (s, 1H), 7,95 (dd, <i>J</i> = 8,1, 6,7 Hz, 1H), 7,48 (dd, <i>J</i> = 9,1, 1,9 Hz, 1H), 7,25	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -95,25

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				(dd, $J = 8,1, 1,9$ Hz, 1H), 7,04 (s, 2H)	
146		IR (película delgada) 3359, 1719, 1619 cm ⁻¹	ESIMS m/z 369 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 7,90 (t, $J = 7,9$ Hz, 2H), 7,75 (d, $J = 11,8$ Hz, 2H), 7,64 (d, $J = 8,1$ Hz, 2H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- d_6) δ -59,9, -115,3, -116,6
147	168-170		ESIMS m/z 381 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 7,74-7,65 (m, 1H), 7,43-7,32 (m, 1H), 7,00 (s ancho, 2H)	
148	96-98		ESIMS m/z 364 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,84 (dd, $J = 10,6, 5,9$ Hz, 1H), 7,39 (dd, $J = 9,8, 5,6$ Hz, 1H), 5,46 (s, 2H), 4,01 (s, 3H), 3,96 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -61,73, -61,76, -117,59, -117,64, -120,18, -120,21, -120,23, -120,26
149	131-132		ESIMS m/z 385 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 7,77 (t, $J = 7,2, 1$ Hz, 1H), 7,63 (t, $J = 7,0, 1$ Hz, 1H), 7,25 (s, 2H), 3,88 (s, 3H)	
150			ESIMS m/z 284 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 11,46 (s, 1H), 8,05-7,98 (m, 2H), 7,84-7,75 (m, 2H), 7,26 (ddd, $J = 18,4, 11,7, 1,4$ Hz, 1H), 5,85 (dd, $J = 11,7, 1,4$ Hz, 1H), 5,63 (dd, $J = 18,4, 1,4$ Hz, 1H), 5,06 (s, 2H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -140,74
151	130-132		ESIMS m/z 319 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,53 (dd, $J = 7,9, 7,3$ Hz, 1H), 7,22 (ddd, $J = 7,3, 6,7, 1,5$ Hz, 2H), 4,87 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 3,35 (s, 1H), 2,17 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -110,01
152	112-114	IR (película delgada) 751,85, 792,16, 879,37, 933,73, 1013,05, 1094,15, 1058,41, 1117,03, 1200,23, 1247,75, 1267,53, 1375,51,	ESIMS m/z 366 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,86-7,68 (m, 2H), 7,36-7,29 (m, 1H), 6,60 (t, $J = 73,3$ Hz, 1H), 4,95	

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
		1432,34, 1476,69, 1516,02, 1611,65, 1725,02, 2961,33, 3378,00, 3505,09 cm ⁻¹		(s, 2H), 4,00 (s, 3H)	
153	160,9- 162,6		ESIMS <i>m/z</i> 307 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,72 (s, 1H), 7,61 (m, 5H), 7,04 (s, 2H)	
154	142-144	IR (película delgada) 3486 (m), 3378 (s), 3225 (s), 2940 (w), 1768 (w), 1719 (w), 1625 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 306 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,72 (m, 1H), 7,46 (m, 1H), 7,11 (s ancho, 2H), 4,80 (s, 1H), 3,79 (m, 3H)	
155	177-180		ESIMS <i>m/z</i> 318 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,78-7,61 (m, 1H), 7,42-7,29 (m, 2H), 4,92 (s, 2H), 3,97 (s, 3H), 2,17 (s, 3H)	RMN C ¹³ (101 MHz, CDCl ₃) δ 165,33, 164,23, 161,59, 152,85, 149,49, 145,46, 133,27, 125,88, 117,79, 117,58, 116,64, 114,32, 113,80, 53,01, 14,55; RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ - 105,97
156			ESIMS <i>m/z</i> 310 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,07 (dd, <i>J</i> = 8,1, 7,0, 1H), 7,96-7,85 (m, 2H), 7,08 (s, 2H)	
157	140-150 (desc.)	IR (película delgada) 3462 (s), 3194 (s), 1610 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 411 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,99 (dd, <i>J</i> = 8, 7 Hz, 1H), 7,68 (dd, <i>J</i> = 10, 1 Hz, 1H), 7,53 (dt, <i>J</i> = 9, 1,5 Hz, 1H), 6,39 (s ancho, 2H)	
158			ESIMS <i>m/z</i> 387 ([M-H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,75 (m, 2H), 7,63 (m, 2H), 7,08 (s, 1H), 4,87 (s ancho, 2H), 4,00 (s, 3H)	
159	139,8- 141,2		ESIMS <i>m/z</i> 407 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,60 (m, 3H), 7,39 (s, 1H), 5,53 (s, 2H), 4,04 (s, 3H)	
160	163-164		ESIMS <i>m/z</i> 342 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,90 (m, 1H), 7,59 (t, <i>j</i> = 6,8 Hz, 1H), 7,25	

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				(s, 2H), 3,87 (s, 3H)	
161	170,0- 171,5		ESIMS <i>m/z</i> 349 ([METRO] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,73 (t, <i>J</i> = 7,7 Hz, 1H), 7,32 (t, <i>J</i> = 8,9 Hz, 2H), 5,15 (s, 2H), 2,23 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (400 MHz, CDCl ₃) δ -61,4,-113,3
162			ESIMS <i>m/z</i> 383 ([M + 2H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 6,90-6,70 (s ancho, 3H), 7,88 (d, <i>J</i> = 8,96 Hz, 1H)	
163	162-164	IR (película delgada) 3467 (s), 1609 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 365 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,75 (dd, <i>J</i> = 10, 2 Hz, 1H), 7,60 (dd, <i>J</i> = 8, 2Hz, 1H), 7,52 (t, <i>J</i> = 8 Hz, 1H), 6,55 (s ancho, 2H)	
164	142-144		ESIMS <i>m/z</i> 382 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 3,83 (s, 3H), 5,38-5,58 (m, 2H), 6,65 (dd, <i>J</i> = 17,6, 11,5 Hz, 1H), 6,98-7,65 (m, 2H), 7,86 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 2H), 8,03 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 2H)	
165	133-135		ESIMS <i>m/z</i> 368 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,92 (m, 3H), 7,17 (s, 2H), 3,90 (s, 3H)	
166	148,2- 150,9		ESIMS <i>m/z</i> 284 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,29 (d, 2H), 7,56 (d, 2H), 5,37 (s, 2H), 4,02 (s, 3H), 3,93 (s, 3H) 3,18 (s, 1H)	
167	69-70		ESIMS <i>m/z</i> 369 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,75 (s, 1H), 7,77 (m, 1H), 7,64 (m, 1H), 7,16 (s, 2H)	
168			ESIMS <i>m/z</i> 329 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,84 (m, 2H), 7,68 (m, 2H), 7,25 (s, 1H), 6,72 (s ancho, 2H)	

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
169	152-155	IR (película delgada) 3470 (s), 1716 (w), 1629 (m), 1606 (m) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 411 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,84 (dd, <i>J</i> = 10, 1,5 Hz, 1H), 7,76 (dd, <i>J</i> = 8, 1,5 Hz, 1H), 7,33 (t, <i>J</i> = 8 Hz, 1H), 6,61 (s ancho, 2H)	
170	178,9-180,2		ESIMS <i>m/z</i> 381 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,75 (d, 2H), 7,32 (d, 2H), 5,40 (s, 2H), 4,02 (s, 3H)	
171			ESIMS <i>m/z</i> 356 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,11-7,90 (m, 2H), 7,82 (dd, <i>J</i> = 8,3, 7,2 Hz, 1H), 7,67-7,39 (m, 2H), 3,91 (s, 3H), 3,75 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -108,34
172	161		ESIMS <i>m/z</i> 353 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,69 (s, 1H), 7,91 (t, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,71 (t, <i>J</i> = 7,2 Hz, 1H), 7,30 (d, <i>J</i> = 1,7 Hz, 1H), 6,93 (s, 2H)	
173	188,7-190,3		ESIMS <i>m/z</i> 409 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,79 (s, 1H), 7,87 (d, 2H), 7,42 (d, 2H), 7,01 (s, 2H)	
174	171,8-173,9		ESIMS <i>m/z</i> 337 [(M + 3H) ⁺]	1H-RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 6,91 (s ancho, 2H), 7,26 (t, <i>J</i> = 53,88 Hz, 1H), 7,45-7,47 (m, 1H), 7,68 (dd, <i>J</i> = 5,60, 10,64 Hz, 1H), 7,87 (dd, <i>J</i> = 5,88, 10,74 Hz, 1H), 13,68 (s ancho, 1H)	
175	123-124		ESIMS <i>m/z</i> 260 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 8,34-8,24 (m, 2H), 7,49-7,38 (m, 3H), 5,33 (s, 2H), 4,02 (s, 3H), 3,92 (s, 3H)	
176	135,2-136,9		ESIMS <i>m/z</i> 367 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,41 (m, 2H), 6,91 (t, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,00	

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				(s, 3H)	
177	107,5- 110,3		ESIMS <i>m/z</i> 365 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,95 (m, 1H), 7,26 (s, 1H), 7,08 (m, 1H), 6,61 (t, 1H), 4,91 (s, 2H), 4,02 (s, 3H)	
178	86,1- 88,4		ESIMS <i>m/z</i> 354 ([M + 2H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 6,99 (s ancho, 2H), 7,28 (t, <i>J</i> = 54,00 Hz, 1H), 7,60-7,70 (m, 2H)	
179	137,2- 138,8		ESIMS <i>m/z</i> 313 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,73 (m, 1H), 7,76 (s, 1H), 6,95 (m, 1H), 4,85 (s, 2H), 4,01 (s, 3H), 2,30 (s, 3H)	
180			ESIMS <i>m/z</i> 267 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,82 (m, 2H), 7,55-7,44 (m, 3H), 6,88 (s, 2H)	
181	105-108		ESIMS <i>m/z</i> 281 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,82 (m, 2H), 7,55-7,44 (m, 3H), 6,88 (s, 2H), 3,98 (s, 3H)	
183			ESIMS <i>m/z</i> 299 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,68 (dq, <i>J</i> = 7,9, 1,3 Hz, 1H), 7,58 (m, 2H), 7,33 (m, 1H), 7,06 (s, 2H), 3,89 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -112,86, -140,06
184	116,5- 118,8		ESIMS <i>m/z</i> 331 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,26 (m, 1H), 6,99 (m, 1H), 4,95 (s, 2H), 3,99 (s, 3H), 2,32 (s, 3H)	
185	163,4- 164,8		ESIMS <i>m/z</i> 310 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,62 (m, 1H), 6,97 (m, 1H), 5,45 (s, 2H), 4,01 (s, 3H), 3,95 (s, 3H), 2,30 (s, 3H)	
186	147-148			RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,46 (m, 2H), 7,17 (s,	

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				2H), 3,87 (s, 3H)	
187	167,4- 170,2		ESIMS <i>m/z</i> 351 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CD ₃ OD) δ 4,89 (s, 2H), 7,02 (t, <i>J</i> = 72,80 Hz, 1H), 7,33 (dd, <i>J</i> = 6,40, 10,80 Hz, 1H), 7,80 (dd, <i>J</i> = 7,20, 11,00 Hz, 1H)	
188	172,9- 175,0		ESIMS <i>m/z</i> 301 ([M + 2H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 2,28 (s, 3H), 6,80 (s ancho, 2H), 7,25 (s, 1H), 7,31 (dd, <i>J</i> = 6,32, 11,58 Hz 1H), 7,65 (dd, <i>J</i> = 6,60, 10,36 Hz, 1H), 13,54 (s ancho, 1H)	
189		IR (película delgada) 3376, 1737, 1615 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 317 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,50-7,32 (m, 3H), 7,13 (s, 2H), 3,87 (d, <i>J</i> = 2,3 Hz, 3H)	
190	163-165		ESIMS <i>m/z</i> 339 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,13-8,04 (m, 2H), 8,02-7,92 (m, 2H), 7,08 (s, 2H), 3,89 (s, 6H)	
191	154-157		ESIMS <i>m/z</i> 296 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,86-7,70 (m, 1H), 7,41 (tdd, <i>J</i> = 9,5, 7,3, 2,1 Hz, 3H), 6,66 (dd, <i>J</i> = 17,6, 11,5 Hz, 1H), 5,63-5,38 (m, 2H), 3,82 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -132,72 (dd, <i>J</i> = 21,4, 8,8 Hz), -135,29 (dd, <i>J</i> = 21,0, 8,7 Hz), -161,04 (t, <i>J</i> = 21,3 Hz)
192	192-195		ESIMS <i>m/z</i> 324 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,08 (s ancho, 1H), 7,99 (m, 2H), 7,87 (m, 2H), 7,47 (s ancho, 1H), 7,03 (s ancho, 2H), 3,89 (s, 3H)	
193	127.9- 129.2		ESIMS <i>m/z</i> 346 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,77 (m, 1H), 7,39 (m, 1H), 6,89 (t, 1H), 5,49 (s, 2H), 4,02 (s, 3H), 3,97 (s, 3H)	

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
194	167,4- 170,2		ESIMS <i>m/z</i> 317 [(M + H) ⁺]	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 2,30 (s, 3H), 6,41 (s ancho, 2H), 7,28-7,45 (m, 2H)	
195	162,0- 165,0		ESIMS <i>m/z</i> 369 [(M + H) ⁺]	1H-RMN (400 MHz, CD ₃ OD) δ 4,90 (s, 2H), 7,01 (t, <i>J</i> = 72,72 Hz, 1H), 7,29 (dd, <i>J</i> = 6,52, 9,76 Hz, 1H), 7,55 (dd, <i>J</i> = 6,36, 10,52 Hz, 1H)	
196	127-129	IR (película delgada) 3480 (s), 3345 (s), 3186 (w), 2961 (w), 1717 (s), 1614 (s) cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 331 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (300 MHz, CDCl ₃) δ 7,75-7,81 (m, 2H), 7,67 (t, <i>J</i> = 8 Hz, 1H), 7,14 (s, 1H), 6,94 (t, <i>J</i> = 55 Hz, 1H), 4,90 (s ancho, 2H), 4,04 (s, 3H)	
197	156-158		ESIMS <i>m/z</i> 309 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,86-7,70 (m, 1H), 7,41 (tdd, <i>J</i> = 9,5, 7,3, 2,1 Hz, 3H), 6,66 (dd, <i>J</i> = 17,6, 11,5 Hz, 1H), 5,63-5,38 (m, 2H), 3,82 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -132,72 (dd, <i>J</i> = 21,4, 8,8 Hz), -135,29 (dd, <i>J</i> = 21,0, 8,7 Hz), -161,04 (t, <i>J</i> = 21,3 Hz)
198			ESIMS <i>m/z</i> 342 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,54 (m, 1H), 7,44 (m, 1H), 5,06 (s, 2H), 4,00 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -111,33, -111,38, -115,73, -115,77, -115,83, -115,89, -136,82, -136,92
199	145-147		ESIMS <i>m/z</i> 317 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,36 (tt, <i>J</i> = 5,8, 1,7 Hz, 1H), 7,29-7,15 (m, 2H), 4,97 (s, 2H), 3,98 (s, 3H)	
200	143,5- 144,5	IR (película delgada) 3498, 3374, 1731, 1621, 1520, 1232 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 335 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,57-7,39 (m, 1H), 7,09-6,96 (m, 1H), 4,96 (s, 2H), 4,00 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (400 MHz, CDCl ₃) δ -114,6, -131,0, -137,5, -142,0
201	135,9- 137,7		ESIMS <i>m/z</i> 297 ([M + H] ⁺)	1H-RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 2,28 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 7,24 (dd, <i>J</i> = 6,24, 10,98 Hz,	

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				1H), 7,36 (dd, J = 6,32, 10,20 Hz, 1H), 13,5 (s, 1H)	
202	209,7-211,9		ESIMS m/z 324 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 8,03 (m, 1H), 7,42 (m, 1H), 7,32 (s, 1H), 4,96 (s, 2H), 4,03 (s, 3H)	RMN F ¹⁹ (376 MHz, CDCl ₃) δ -111,15, -119,08
203	143,7-145,5		ESIMS m/z 332 ([M + H] ⁺)	1H-RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 3,76 (s, 3H), 7,24 (t, J = 54,00 Hz, 1H), 7,43 (s ancho, 2H), 7,59 (dd, J = 5,60, 10,00 Hz, 1H), 7,78 (dd, J = 5,60, 10,40 Hz, 1H)	
204	131			RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 7,87 (m, 2H), 7,35 (m, 2H), 7,01 (s, 2H), 3,89 (s, 3H)	
205	141,8-145		ESIMS m/z 349 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,91 (m, 1H), 7,38 (m, 1H), 7,35 (s, 1H), 6,90 (t, 1H), 4,90 (s, 2H), 4,03 (s, 3H)	
206	159-161		ESIMS m/z 299 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 7,55 (m, 2H), 7,39-7,30 (m, 2H), 7,05 (s, 2H), 3,86 (s, 3H)	
207	130-132		ESIMS m/z 246 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 8,29-8,21 (m, 2H), 7,48 (m, 3H), 5,66 (s, 2H), 4,06 (s, 3H)	
208	165,0-166,5		ESIMS m/z 321 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,88 (m, 1H), 7,42 (m, 1H), 5,51 (s, 2H), 4,03 (s, 3H), 3,98 (s, 3H)	
209	113-115	IR (película delgada) 3496 (s), 3377 (s), 2954 (w), 1726 (s), 1611 (s) cm ⁻¹	ESIMS m/z 331 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (300 MHz, CDCl ₃) δ 8,01 (br d, J = 8 Hz, 2H), 7,61 (br d, J = 8 Hz, 2H), 6,70 (t, J = 56 Hz, 1H), 4,93 (s ancho,	

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				2H), 3,99 (s, 3H)	
210	159 descomp		ESIMS <i>m/z</i> 317 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,26 (m, 2H), 7,02 (s, 2H), 2,35 (d, <i>J</i> = 1,7 Hz, 3H)	
211	167-168		ESIMS <i>m/z</i> 329 ([M-H] ⁻)	RMN H ¹ (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,23 (m, 2H), 7,08 (s, 2H), 3,85 (s, 3H), 2,33 (d, <i>J</i> = 2,1 Hz, 3H)	
212	145-146		ESIMS <i>m/z</i> 299 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,59 (s, 1H), 7,60 (m, 2H), 7,42 (m, 1H), 6,94 (s, 2H), 2,30 (s, 3H)	
213	127		ESIMS <i>m/z</i> 313 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,57 (dd, <i>J</i> = 14,6, 9,7 Hz, 2H), 7,42 (t, <i>J</i> = 8,1 Hz, 1H), 7,02 (s, 2H), 3,89 (s, 3H), 2,30 (s, 3H)	
214	151-154		ESIMS <i>m/z</i> 311 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,87 (dd, <i>J</i> = 11,2, 1,6 Hz, 1H), 7,80-7,68 (m, 2H), 6,76 (dd, <i>J</i> = 17,6, 11,7 Hz, 1H), 6,50 (s ancho, 2H), 5,57 (dd, <i>J</i> = 7,3, 0,9 Hz, 1H), 5,53 (s, 1H)	
215	97-101		ESIMS <i>m/z</i> 325 ([M + H] ⁺)	RMN H ¹ (300 MHz, CDCl ₃) δ 7,83-7,77 (m, 1H), 7,76-7,69 (m, 1H), 7,48 (dd, <i>J</i> = 8,4, 7,6 Hz, 1H), 6,89 (dd, <i>J</i> = 18,0, 11,7 Hz, 1H), 5,73 (dd, <i>J</i> = 11,5, 1,4 Hz, 1H), 5,59 (dd, <i>J</i> = 18,1, 1,4 Hz, 1H), 4,78 (s ancho, 2H), 3,93 (s, 3H)	
216	111-114				
217	159-161			RMN H ¹ (400 MHz, CDCl ₃) δ 7,80 (d, <i>J</i>	

Núm. Comp.	pf (°C)	IR (cm ⁻¹)	Masa ^a	RMN H ^{1b}	RMN F ¹⁹ o C ¹³
				= 10,4 Hz, 1H), 7,72 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,48 (m, 1H), 4,93 (s, 2H), 4,00 (s, 3H)	
^a Los datos de espectrometría de masas son espectrometría de masas de ionización por electropulverización (ESIMS), a menos que se indique lo contrario.					
^b Todos los datos medidos de RMN H ¹ en CDCl ₃ a 400 MHz a menos que se indique lo contrario.					

Ejemplos de actividades herbicidas

Las evaluaciones herbicidas se realizaron visualmente en una escala de 0 a 100, donde 0 representa ninguna actividad y 100 representa la muerte completa de la planta. Los datos se muestran como se indica en la Tabla A.

5

Tabla A: Tabla de conversión del porcentaje de control

Clasificación	% De control
A	95-100
B	85-94
C	75-84
D	60-74
E	45-59
F	30-44
G	0-29

Ejemplo A. Evaluación de la actividad herbicida de post-emergencia

10 Ensayo I de post-emergencia: Se obtuvieron semillas de especies de ensayo de proveedores comerciales y se plantaron en una maceta redonda de 13 centímetros (cm) de diámetro que contenía una mezcla de medios sin suelo (Metro-Mix 360®, Sun Gro Horticulture). Los tratamientos de post-emergencia se plantaron 8-12 días (d) antes de la aplicación y se cultivaron en un invernadero equipado con fuentes de luz complementarias para proporcionar un fotoperíodo de 16 horas (h) a 24-29°C. Todas las macetas fueron irrigadas en superficie.

15 Una cantidad ponderada, determinada por la tasa más alta que se iba a someter a ensayo, de cada compuesto se disolvió en 1,3 mL de acetona-dimetilsulfóxido (DMSO; 97:3, volumen por volumen (v/v)) y se diluyó con 4,1 mL de agua-isopropanol-producto concentrado de aceite de cultivo (78:20:2, v/v/v) que contenía Triton X-155 al 0,02% para obtener soluciones de partida concentradas. Se obtuvieron por dilución en serie de la solución de alta tasa en una solución que contenía un volumen apropiado de mezcla 97:3 v/v de acetona y DMSO y un volumen apropiado de una mezcla acuosa de agua, alcohol isopropílico, producto concentrado de aceite de cultivo (78:20:2, v/v/v) que contenía Triton X-155 al 0,02%.

20 Los compuestos formulados se aplicaron utilizando un pulverizador de aire comprimido DeVilbiss® a 0,13-0,27 atmosferas (2-4 libras por pulgada cuadrada (psi)). Después del tratamiento, las macetas se devolvieron al invernadero durante la duración del experimento. Todas las macetas fueron sub-irrigadas a demanda para

proporcionar condiciones óptimas de crecimiento. Todas las macetas se fertilizaron una vez por semana mediante sub-irrigación con fertilizante Peters Peat-Lite Special® (20-10-20).

Las clasificaciones de fitotoxicidad se obtuvieron 10 días después de las aplicaciones de post-emergencia del tratamiento. Todas las evaluaciones se realizaron visualmente en una escala de 0 a 100, donde 0 representa ninguna actividad y 100 representa la muerte completa de la planta y se presenta como se indica en la Tabla A.

5

Algunos de los compuestos de ensayo, las tasas de aplicación empleadas, las especies de plantas sometidas a ensayo y los resultados se proporcionan en la Tabla 3.

Tabla 3. Actividad herbicida de ensayo I de post-emergencia en malas hierbas de hoja ancha y cespitosa clave, así como también en especies de cultivos

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (kg ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación					
		AMARE	AVEFA	ECHCG	HELAN	IPOHE	SETFA
138	4	A	C	A	A	A	A
20	4	n/t	C	A	A	B	A
135	4,04	A	D	A	A	B	C
156	4,04	A	C	A	A	A	B
16	3,84	A	G	E	A	A	D
114	3,92	A	G	A	A	B	C
85	3,76	A	F	A	A	F	B
142	3,84	A	E	A	A	A	D
118	2,32	A	A	A	A	A	A
45	3,96	A	A	A	A	B	A
143	4	A	n/t	A	A	E	A
39	2	A	C	B	A	D	n/t
209	4	A	B	A	A	B	A
199	4	A	n/t	D	A	C	B
206	4,04	A	n/t	G	A	C	G
196	3,84	A	D	A	A	B	A
181	1,76	A	G	G	A	C	G
109	4	n/t	C	A	A	B	A
147	3,96	A	C	A	A	A	A
215	3,96	n/t	F	B	A	A	G
214	4,04	n/t	D	A	A	A	B

AMARE: verdolaga (*Amaranthus retroflexus*)

AVEFA: avena loca (*Avena fatua*)

ECHCG: cerreig (*Echinochloa crus-galli*)

HELAN: girasol (*Helianthus annuus*)

IPOHE: dondiego de día trepador (*Ipomoea hederecea*)

SETFA: almorojo gigante (*Setaria faberi*)

kg ia/ha: kilogramos de ingrediente activo por hectárea

n/t: no sometido a ensayo

Ejemplo B. Evaluación de la actividad herbicida de preemergencia

Ensayo I de preemergencia: Se plantaron semillas de especies de ensayo en macetas de plástico redondas (12,7 cm de diámetro) que contenían suelo franco arenoso. Después de la plantación, todas las macetas fueron sub-irrigadas 16 h antes de la aplicación del compuesto.

- 5 Los compuestos se disolvieron en una mezcla 97:3 v/v de acetona y DMSO y se diluyeron a la concentración apropiada en una solución de aplicación final que contenía agua, acetona, isopropanol, DMSO y Agri-dex (producto concentrado de aceite de cultivo) a una razón 59:23:15:1,0:1,5 de v/v y 0,02% p/v (peso/volumen) de Triton X-155 para obtener la solución de rociado que contiene la tasa de aplicación más alta. Las tasas de aplicación adicionales se obtuvieron por dilución en serie de la solución de tasa alta con la solución de aplicación anterior.
- 10 El compuesto formulado (2,7 mL) se pipeteó uniformemente sobre la superficie del suelo, seguido de la incorporación con agua (15 mL). Después del tratamiento, las macetas se devolvieron al invernadero durante la duración del experimento. El invernadero se programó para un fotoperíodo de aproximadamente 15 h que se mantuvo a aproximadamente 23-29°C durante el día y 22-28°C durante la noche. Los nutrientes y el agua se agregaron de manera regular a través de irrigación de la superficie y se proporcionó iluminación adicional con lámparas de 1000 vatios halógenas suspendidas, según sea necesario.
- 15

Las valoraciones del efecto herbicida se obtuvieron 14 días después del tratamiento. Todas las evaluaciones se realizaron en relación con los controles apropiados en una escala de 0 a 100, donde 0 representa ningún efecto herbicida y 100 representa la muerte de una planta o la falta de emergencia del suelo y se presenta como se indica en la Tabla A. Algunos de los compuestos sometidos a ensayo, tasas de aplicación empleadas, especies de plantas sometidas a ensayo, y los resultados se proporcionan en la Tabla 4.

20

Tabla 4. Actividad herbicida de ensayo I preemergencia en malas hierbas de hoja ancha y cespitosas clave, así como también en especies de cultivos

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (kg ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación					
		AMARE	AVEFA	ECHCG	HELAN	IPOHE	SETFA
138	4	A	A	A	A	A	A
20	4	n/t	A	A	A	A	A
135	4,04	A	F	F	A	A	F
156	4,04	A	C	A	A	A	A
16	3,84	A	F	F	A	A	G
114	3,92	A	A	C	A	A	B
85	3,76	A	C	A	A	F	n/t
142	3,84	A	A	F	A	A	n/t
118	2,32	A	A	A	A	A	n/t
45	3,96	A	A	A	A	A	A
143	4	B	D	B	A	B	A
39	2	A	B	A	A	A	n/t
209	4	A	A	A	A	A	A
199	4	n/t	n/t	G	D	C	E
206	4,04	n/t	n/t	G	A	A	C
196	3,84	A	n/t	B	A	A	A

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (kg ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación					
		AMARE	AVEFA	ECHCG	HELAN	IPOHE	SETFA
181	1,76	A	G	n/t	B	B	C
109	4	n/t	B	A	C	A	A
147	3,96	n/t	A	A	A	A	A
215	3,96	A	B	A	A	A	B
214	4,04	n/t	B	A	A	A	A
AMARE: verdolaga (<i>Amaranthus retroflexus</i>) AVEFA: avena loca (<i>Avena fatua</i>) ECHCG: cerreig (<i>Echinochloa crus-galli</i>) HELAN: girasol (<i>Helianthus annuus</i>) IPOHE: dondiego de día trepador (<i>Ipomoea hederecea</i>) SETFA: almuerzo gigante (<i>Setaria faberi</i>) kg ia/ha: kilogramos de ingrediente activo por hectárea n/t: no sometido a ensayo							

Ejemplo C. Evaluación de la actividad herbicida de post-emergencia

Ensayo II de post-emergencia: Se plantaron semillas o núculas de las especies de plantas de ensayo deseadas en mezcla de plantación Sun Gro Metro-Mix® 360, que generalmente tiene un pH de 6,0 a 6,8 y un contenido de materia orgánica de aproximadamente 30 por ciento, en macetas de plástico con un área de superficie de 64 centímetros cuadrados. Cuando fue necesario para asegurar una buena germinación y plantas sanas, se aplicó un tratamiento con fungicidas y/u otro tratamiento químico o físico. Las plantas se cultivaron durante 7-21 d en un invernadero con un fotoperíodo de aproximadamente 15 h que se mantuvo a aproximadamente 23-29°C durante el día y 22-28°C durante la noche. Los nutrientes y el agua se agregaron de manera regular y se proporcionó iluminación adicional con lámparas de 1000 vatios halógenas suspendidas, según sea necesario. Las plantas se emplearon para el ensayo cuando alcanzaron la primera o la segunda etapa verdadera de la hoja.

Se colocó una cantidad ponderada, determinada mediante la tasa más alta que se iba a someter a ensayo, de cada compuesto de ensayo se situó en un vial de vidrio de 25 mL y se disolvió en 4 mL de una mezcla 97:3 v/v de acetona y DMSO para obtener soluciones de partida concentradas. Si el compuesto de ensayo no se disolvía fácilmente, la mezcla se calentó y/o se sometió a sonicación. Las soluciones de partida concentradas obtenidas se diluyeron con 20 mL de una mezcla acuosa que contenía acetona, agua, alcohol isopropílico, DMSO, producto concentrado de aceite de cultivo Atplus 411F y tensioactivo Triton® X-155 a una razón 48,5:39:10:1,5:1,0:0,02 v/v para obtener soluciones de pulverización que contienen las tasas de aplicación más altas. Se obtuvieron tasas de aplicación adicionales por dilución en serie de 12 mL de la solución de alta tasa en una solución que contenía 2 mL de mezcla 97:3 v/v de acetona y DMSO y 10 mL de una mezcla acuosa que contenía acetona, agua, alcohol isopropílico, DMSO, producto concentrado de aceite de cultivo Atplus 411F y tensioactivo Triton X-155 a una razón 48,5:39:10:1,5:1,0:0,02 v/v para obtener tasas de 1/2X, 1/4X, 1/8X y 1/16X de la alta tasa. Los requisitos de los compuestos se basan en un volumen de aplicación de 12 mL a una tasa de 187 litros por hectárea (L/ha). Los compuestos formulados se aplicaron al material vegetal con un pulverizador de riel Mandel suspendido equipado con boquillas 8002E calibradas para suministrar 187 L/ha en una zona de aplicación de 0,503 metros cuadrados a una altura de pulverización de 43 cm (18 pulgadas) por encima de la altura del dosel vegetal promedio. Las plantas de control se pulverizaron de la misma manera con el blanco de disolvente.

Las plantas tratadas y las plantas de control se colocaron en un invernadero como se describió anteriormente y se regaron mediante sub-irrigación para evitar el lavado de los compuestos de ensayo. Después de 14 d, la condición de las plantas de ensayo en comparación con la de las plantas no tratadas se determinó visualmente y se calificó en una escala de 0 a 100 por ciento, donde 0 corresponde a ninguna lesión y 100 corresponde a la destrucción completa y se presenta como se indica en la Tabla A. Algunos de los compuestos sometidos a ensayo, las tasas de aplicación empleadas, las especies de plantas sometidas a ensayo y los resultados se proporcionan en la Tabla 5.

Tabla 5. Actividad herbicida de ensayo II de post-emergencia en malas hierbas de hoja ancha clave y especies cultivos

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación						
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN	VIOTR
20	70	A	A	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A	A
216	70	A	A	C	A	A	A	B
	140	A	A	B	A	A	A	A
217	70	A	A	B	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A	A
135	70	A	A	D	A	A	A	D
	140	A	A	D	A	A	A	D
156	70	D	A	C	A	B	A	D
	140	C	A	B	A	B	A	D
16	70	B	n/t	G	A	A	A	F
	140	A	A	G	A	A	A	F
95	70	D	A	G	A	A	A	G
	140	C	A	F	A	A	A	G
31	70	G	A	F	D	G	A	G
	140	G	A	E	B	G	A	G
149	70	A	A	B	A	A	A	B
	140	A	A	A	A	A	A	B
114	70	A	A	B	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A	A
85	70	A	A	E	B	A	B	G
	140	A	A	D	A	A	A	G
142	70	A	A	G	A	A	A	C
	140	A	A	G	A	A	A	B
118	70	A	A	A	A	A	A	B
	140	A	A	A	A	A	A	A
45	70	A	A	A	A	A	A	B
	140	A	A	A	A	A	A	A
91	70	B	A	C	B	A	B	A
	140	A	A	B	B	A	B	A
143	70	B	D	D	B	A	D	F
	140	B	B	B	B	A	B	F
190	70	G	G	G	D	G	G	G

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación						
		ABUTH	AMARE	BRNN	CHEAL	EPHHL	HELAN	VIOTR
	140	G	F	G	F	G	G	G
39	70	F	G	G	B	B	A	F
	140	D	G	F	A	A	A	F
165	70	B	B	C	A	A	A	E
	140	A	B	B	A	A	A	A
160	70	F	B	G	D	E	B	G
	140	E	A	G	C	D	A	G
204	70	A	A	B	A	A	A	C
	140	A	A	A	A	A	A	A
186	70	A	A	B	A	A	B	B
	140	A	A	A	A	A	A	A
209	70	A	A	B	A	A	A	G
	140	A	A	B	A	A	A	G
134	70	B	B	A	A	A	A	A
	140	B	A	A	A	A	A	A
80	70	G	D	G	A	C	D	G
	140	G	B	G	A	C	C	G
199	70	A	A	B	B	D	C	G
	140	A	A	A	A	B	A	F
206	70	A	A	C	B	A	D	E
	140	A	A	B	B	A	B	D
180	70	B	E	B	A	D	B	G
	140	A	C	A	A	C	B	G
213	66	A	A	B	A	A	A	G
	132	A	A	B	A	A	A	G
196	70	A	A	F	A	A	A	G
	140	A	A	F	A	A	A	G
181	70	A	B	B	A	B	A	G
	140	A	A	A	A	A	A	G
212	70	A	A	A	A	A	A	G
	140	A	A	A	A	A	A	G
211	70	A	A	D	A	A	A	G
	140	A	A	B	A	A	A	G
109	70	A	A	A	A	A	G	A
	140	A	A	A	A	A	A	A

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación						
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN	VIOTR
147	70	A	A	A	A	A	A	A
	140	G	A	A	A	A	A	A
210	70	B	A	C	A	A	A	G
	140	A	A	C	A	A	A	G
167	70	B	A	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A	B
215	70	A	A	A	A	A	A	G
	140	A	A	A	A	A	A	n/t
214	70	A	A	A	A	A	A	C
	140	A	A	A	A	A	A	C
175	70	E	E	G	G	B	E	G
	140	E	A	G	F	B	D	G
7	70	A	A	B	A	B	B	G
	140	A	A	B	A	A	A	G
62	70	C	A	A	B	A	B	G
	140	C	n/t	A	B	A	A	G
64	70	A	E	C	A	A	A	D
	140	A	C	B	A	A	A	D
76	70	A	A	B	B	A	B	E
	140	A	A	A	A	n/t	A	D
172	70	A	A	C	B	A	A	E
	140	A	A	C	B	A	A	D
106	70	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G
49	70	A	A	A	A	n/t	A	A
	140	A	A	A	A	n/t	A	A
21	70	A	A	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A	A
132	70	A	A	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A	A
157	70	B	A	A	A	A	A	A
	140	B	A	A	A	A	A	A
152	70	B	B	B	B	A	C	G
	140	B	B	B	B	A	B	G
103	70	E	G	G	G	G	C	G

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación						
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN	VIOTR
	140	E	G	F	B	G	C	G
99	70	A	A	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A	A
67	70	A	A	G	A	A	B	G
	140	A	A	D	A	A	A	G
158	70	A	A	D	A	A	C	G
	140	A	A	C	A	A	C	G
141	70	B	A	A	B	A	A	A
	140	B	A	A	B	A	A	A
104	70	E	G	G	G	C	C	G
	140	E	G	G	G	B	C	G
133	70	B	C	C	A	B	A	G
	140	A	C	A	A	A	A	F
71	70	G	D	E	B	A	D	G
	140	E	C	E	B	A	C	G
121	70	B	G	B	C	E	B	G
	140	B	G	A	A	A	A	G
168	70	A	A	A	A	A	A	G
	140	A	A	A	A	A	A	F
4	70	A	B	A	A	A	C	G
	140	A	B	A	A	A	B	G
97	70	B	A	B	B	A	C	D
	140	A	A	A	A	A	A	A
18	70	C	G	C	B	A	A	G
	140	C	G	A	A	A	A	E
54	70	B	A	A	A	A	B	F
	140	B	A	A	A	A	A	E
88	70	C	B	A	n/t	A	B	E
	140	A	B	A	A	A	B	D
59	70	G	G	F	G	G	D	G
	140	G	G	E	D	G	D	G
41	70	G	G	G	G	G	D	G
	140	G	G	E	D	G	C	G
108	70	E	C	B	D	B	B	G
	140	C	A	B	C	A	A	E

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación						
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN	VIOTR
122	70	A	A	A	A	A	B	A
	140	A	A	A	A	A	A	B
24	70	A	C	A	A	A	B	E
	140	A	B	A	A	A	A	A
52	70	A	A	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A	A
9	70	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G
163	70	B	A	A	A	A	A	A
	140	B	A	A	A	A	A	A
169	70	B	A	A	A	A	A	A
	140	B	A	A	A	A	A	A
22	70	G	G	G	E	G	E	G
	140	G	G	D	C	A	C	G
50	70	D	G	G	G	E	E	G
	140	D	G	G	G	A	D	G
82	70	A	A	B	B	A	A	D
	140	A	A	B	A	A	A	C
72	70	B	A	B	A	A	A	D
	140	B	A	B	A	A	A	D
35	70	A	C	A	A	A	A	B
	140	A	A	A	A	A	A	A
46	70	A	B	A	A	A	B	E
	140	A	A	A	A	A	A	A
89	70	B	B	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A	A
84	70	G	G	G	G	G	n/t	G
	140	G	G	G	G	G	D	G
154	70	G	G	G	G	A	C	G
	140	E	G	D	E	A	C	G
129	70	A	A	B	A	A	C	A
	140	A	A	A	A	A	B	A
38	70	A	B	A	B	A	C	A
	140	A	A	A	A	A	B	A
183	70	C	A	D	A	A	B	G

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación						
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN	VIOTR
	140	A	A	B	A	A	B	G
92	70	G	E	F	B	A	D	G
	140	G	D	E	B	A	C	G
140	70	G	G	G	G	B	D	G
	140	G	G	G	G	B	C	G
19	70	G	G	G	G	G	C	G
	140	G	G	D	G	F	C	G
8	70	A	A	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A	A
26	70	B	D	F	G	A	B	G
	140	B	C	F	G	A	B	G
29	70	B	D	E	A	A	B	G
	140	B	D	D	A	A	B	G
63	70	D	D	C	B	A	B	C
	140	B	C	B	A	A	B	A
128	70	G	E	F	E	E	E	G
	140	F	E	E	E	E	E	G
58	70	B	B	D	A	G	A	G
	140	A	A	C	A	G	A	G
146	70	C	C	B	B	G	A	G
	140	B	B	B	B	G	A	G
47	70	A	A	A	A	B	A	G
	140	A	A	A	A	A	A	G
125	70	A	A	A	A	F	A	G
	140	A	A	A	A	E	A	G
189	70	C	A	E	B	G	B	n/t
	140	C	A	D	B	G	B	G
200	70	A	A	A	A	A	B	C
	140	A	A	A	A	A	A	A
12	70	C	G	G	G	E	G	G
	140	B	E	G	G	A	G	G
126	70	A	A	C	A	A	B	G
	140	A	A	B	A	A	A	F
48	140	A	A	B	B	A	A	G
23	70	A	A	G	B	A	G	G

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación						
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN	VIOTR
	140	A	A	G	A	A	B	G
10	140	A	A	D	C	A	B	G
34	70	A	A	B	A	C	A	G
	140	A	A	A	A	B	A	G
153	140	A	A	A	A	G	A	G
15	140	B	G	G	F	G	A	G
33	140	D	G	F	G	G	A	G
170	140	G	G	G	D	G	B	G
105	140	G	G	G	G	G	A	G
1	140	D	D	G	B	G	A	G
14	140	G	G	G	A	G	A	G
51	70	A	A	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A	A
42	70	B	A	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A	A
55	70	A	A	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A	A
69	70	B	A	A	A	A	A	A
	140	B	A	A	A	A	A	A
86	70	A	n/t	C	A	A	A	A
	140	A	n/t	A	A	A	A	A
100	70	B	B	D	A	E	B	G
	140	B	A	D	A	E	B	G
166	140	G	A	G	D	A	B	G
30	140	E	G	G	G	A	G	G
102	140	G	G	G	G	A	D	G
25	140	G	G	G	G	G	G	G
127	70	A	A	B	A	A	B	A
	140	A	A	A	A	A	A	A
56	70	A	A	B	A	A	C	A
	140	A	A	B	A	A	B	A
3	70	A	A	B	A	A	B	A
	140	A	A	A	A	A	B	A
131	70	A	A	A	A	A	B	A
	140	A	A	A	A	A	A	A

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación						
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN	VIOTR
159	70	A	A	B	A	A	C	G
	140	A	A	B	A	A	A	E
124	70	B	A	A	A	A	B	A
	140	B	A	A	A	A	B	A
96	70	A	B	C	A	C	A	G
	140	A	A	B	A	E	A	G
173	70	D	B	B	B	G	A	G
	140	B	A	B	B	E	A	G
28	140	G	A	G	A	A	B	G
130	140	G	G	G	G	A	B	G
161	70	C	E	A	A	G	A	G
	140	B	A	A	A	G	A	G
53	70	G	G	G	G	A	G	G
	140	G	G	G	G	A	G	G
93	70	A	A	G	B	A	B	F
	140	A	A	D	A	A	B	n/t
74	70	A	A	B	A	A	A	A
	140	A	A	B	A	A	A	A
61	70	B	A	G	C	A	A	G
	140	A	A	G	B	A	A	G
81	140	A	A	D	A	C	A	G
136	70	A	B	B	A	G	A	G
	140	A	B	B	A	G	A	G
78	70	A	B	B	B	G	A	G
	140	A	A	A	B	G	A	G
116	70	A	C	B	B	G	A	G
	140	A	B	A	B	G	A	G
2	70	A	B	A	A	A	A	F
	140	A	B	A	A	A	A	A
101	70	B	B	A	B	A	B	G
	140	B	B	A	B	A	B	G
11	70	A	A	A	A	A	A	G
	140	A	A	A	A	A	A	E
119	70	C	B	A	A	A	B	G
	140	B	A	A	A	A	B	G

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación						
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN	VIOTR
107	70	C	G	G	A	A	C	G
	140	C	G	G	A	A	B	G
40	66	C	G	E	E	G	B	G
	132	A	E	E	D	G	A	G
150	70	E	A	E	B	A	A	G
	140	D	A	D	B	A	A	G
60	70	G	G	G	G	G	E	G
	140	G	G	G	G	G	C	G
36	70	G	A	G	B	A	B	G
	140	G	A	G	B	A	B	G
57	70	B	B	D	B	B	B	G
	140	B	A	C	B	B	B	G
17	70	A	A	A	B	A	B	G
	140	A	A	A	A	A	A	G
117	70	A	A	C	A	A	B	G
	140	A	A	C	A	A	B	G
83	70	G	G	G	G	G	B	G
	140	F	G	G	G	G	B	G
111	70	F	G	G	F	G	C	G
	140	D	G	G	D	G	B	G
94	70	G	G	G	B	G	B	G
	140	G	E	G	B	G	B	G
192	70	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G
112	70	A	A	B	B	G	A	G
	140	A	A	B	B	G	A	G
79	66	B	D	B	A	G	A	G
	132	A	C	B	A	G	A	G
155	70	G	G	E	B	G	B	G
	140	G	G	D	A	G	B	G
66	70	B	A	E	B	A	B	G
	140	B	A	E	B	A	B	G
13	70	B	B	B	A	G	A	G
	140	A	A	B	A	F	A	G
27	70	D	D	D	B	A	B	A

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación						
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN	VIOTR
	140	C	C	D	B	A	B	A
77	70	B	A	C	A	A	B	G
	140	A	A	B	A	A	B	G
145	70	E	C	A	A	D	A	G
	140	D	A	A	A	D	A	G
37	70	E	B	A	A	A	B	A
	140	D	B	A	A	A	B	A
73	70	B	A	A	B	E	A	E
	140	B	A	A	B	D	A	E
171	70	C	B	B	B	A	B	A
	140	B	A	B	B	A	B	A
43	70	B	A	A	C	D	A	A
	140	B	A	A	C	D	A	A
113	70	B	A	A	A	A	A	A
	140	B	A	A	A	A	A	A
115	70	B	A	D	A	A	B	A
	140	B	A	C	A	A	A	A
110	70	A	A	A	A	A	A	E
	140	A	A	A	A	A	A	E
197	70	A	A	A	A	A	B	D
	140	A	A	B	A	A	B	C
191	70	D	A	A	A	A	A	E
	140	A	A	A	A	A	A	E
137	70	C	G	G	G	G	E	G
	140	B	G	G	E	D	D	G
98	70	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G
32	70	D	C	G	A	A	B	G
	140	D	A	E	A	A	B	G
5	70	G	G	G	G	G	B	G
	140	G	G	G	G	G	B	G
151	70	A	n/t	C	A	G	B	G
	140	A	n/t	B	A	G	B	G
87	70	B	n/t	A	B	G	B	D
	140	B	n/t	A	B	G	B	B

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación						
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN	VIOTR
123	70	G	A	G	G	A	C	G
	140	G	A	D	G	A	C	E
70	70	A	A	C	A	A	B	D
	140	A	A	B	A	A	A	C
44	70	F	C	G	C	B	B	G
	140	D	A	G	B	A	A	G
65	70	G	A	G	D	A	B	G
	140	G	A	F	C	A	A	F
144	70	B	A	B	B	C	B	C
	140	A	A	A	A	B	A	B
148	70	C	G	E	B	B	E	E
	140	C	G	D	A	C	D	D
90	70	B	A	A	A	A	F	A
	140	B	A	A	A	A	C	A
162	70	B	A	A	A	A	B	A
	140	B	A	A	A	A	B	A
68	70	B	A	A	A	A	D	A
	140	B	A	A	A	A	G	A
202	70	A	A	C	A	A	A	D
	140	A	A	B	A	A	A	D
198	70	D	D	C	B	E	A	F
	140	C	A	C	A	D	A	D
208	70	G	G	G	G	F	G	G
	140	G	G	G	G	E	E	G
205	70	A	A	D	A	A	B	E
	140	A	A	B	A	A	A	D
176	70	A	A	A	B	A	A	F
	140	A	A	A	B	A	A	E
193	70	D	C	D	B	B	D	G
	140	C	A	D	A	A	C	F
177	70	B	C	F	C	A	F	G
	140	B	B	C	B	A	G	G
179	70	A	A	F	A	A	B	G
	140	A	A	E	A	A	B	G
184	70	A	B	B	B	B	A	G

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación						
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN	VIOTR
	140	A	A	A	A	A	A	G
185	70	F	G	F	D	C	C	G
	140	E	G	E	A	B	B	G
174	70	C	A	A	A	A	A	E
	140	C	A	A	A	A	A	D
178	70	C	A	A	A	B	A	F
	140	C	A	A	A	A	A	E
203	70	F	E	F	B	A	D	G
	140	F	A	E	A	A	C	F
187	70	E	A	C	C	A	E	G
	140	D	A	C	A	A	D	G
195	70	G	G	E	E	F	D	G
	140	G	E	D	C	F	B	G
188	70	C	A	D	A	A	C	G
	140	A	A	D	B	A	C	G
194	70	D	A	D	C	B	B	G
	140	C	A	C	B	B	A	G
201	70	F	F	A	B	E	D	G
	140	D	D	A	C	B	C	G

ABUTH: verbasco (*Abutilon theophrasti*)
 AMARE: verdolaga (*Amaranthus retroflexus*)
 BRSNN: colza, canola (*Brassica napus*)
 CHEAL: cenizo (*Album de chenopodium*)
 EPHHL: flor de pascua silvestre (*Euphorbia heterophylla*)
 HELAN: girasol (*Helianthus annuus*)
 VIOTR: pensamiento silvestre (*Viola tricolor*)
 g ia/ha: gramos de ingrediente activo por hectárea
 n/t: no sometido a ensayo

Tabla 6. Actividad herbicida de ensayo II de post-emergencia en malas hierbas cespitosas y juncia clave, así como en cultivos de pasto

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
20	70	A	A	A	A	A	D	C	A
	140	A	A	A	A	A	D	C	A
216	70	B	F	A	F	B	G	G	B
	140	A	C	A	E	B	G	F	B

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
217	70	B	B	A	A	B	D	C	B
	140	B	B	A	A	B	C	C	A
135	70	B	D	A	D	C	G	F	C
	140	A	C	A	C	B	G	F	C
156	70	D	D	C	B	D	G	E	C
	140	B	C	B	A	D	G	D	C
16	70	A	D	C	E	D	G	F	B
	140	A	C	A	D	D	G	E	B
95	70	E	G	B	G	D	G	G	G
	140	C	G	A	G	D	G	G	G
31	70	G	D	C	G	G	G	G	G
	140	G	D	B	G	G	G	G	G
149	70	A	F	A	F	A	G	F	C
	140	A	F	A	F	A	G	E	B
114	70	A	D	A	D	A	G	F	B
	140	A	D	A	C	A	G	E	B
85	70	B	F	A	E	C	G	F	C
	140	B	F	A	C	B	G	F	C
142	70	C	D	C	G	E	G	G	E
	140	B	D	B	G	E	G	F	D
118	70	A	C	A	E	A	F	C	D
	140	A	B	A	D	A	E	C	B
45	70	B	B	A	B	D	E	D	B
	140	A	B	A	B	A	D	C	A
91	70	A	B	A	C	C	G	E	B
	140	A	B	A	B	C	G	E	B
143	70	B	C	A	C	B	G	E	B
	140	B	C	A	C	B	F	D	B
190	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
39	70	D	F	B	G	F	G	F	D
	140	C	E	B	F	D	G	E	D
165	70	A	D	B	D	D	G	E	C

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
	140	A	D	A	B	D	G	E	A
160	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
204	70	B	D	A	G	C	G	E	C
	140	B	D	A	E	B	G	D	C
186	70	B	E	B	G	D	G	D	C
	140	B	D	A	D	C	F	D	B
209	70	B	E	A	E	A	G	G	C
	140	B	D	A	C	A	G	G	B
134	70	A	C	A	A	B	E	D	E
	140	A	B	A	A	B	E	C	D
80	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
199	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
206	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
180	70	F	G	G	G	G	G	G	G
	140	E	G	G	G	F	G	G	G
213	66	G	G	B	G	C	G	G	D
	132	E	G	B	G	A	G	G	C
196	70	B	E	A	G	C	G	G	G
	140	B	E	A	G	C	G	G	C
181	70	A	G	G	G	G	G	G	G
	140	A	G	G	G	F	G	G	F
212	70	G	G	C	E	D	D	D	C
	140	F	F	B	C	C	D	D	B
211	70	E	G	E	E	G	G	G	F
	140	D	G	B	D	F	G	G	E
109	70	A	B	A	A	B	E	E	B
	140	A	A	A	A	A	E	D	B
147	70	A	B	A	G	A	D	D	A
	140	A	A	A	A	A	C	D	A

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
210	70	G	G	D	C	G	G	G	G
	140	G	G	C	B	G	F	G	E
167	70	B	C	A	B	B	G	D	C
	140	A	C	A	A	B	G	D	B
215	70	A	G	G	G	E	G	G	F
	140	A	G	A	G	D	G	G	E
214	70	A	G	A	G	C	G	G	B
	140	A	G	A	F	B	E	G	B
175	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
7	70	C	C	C	D	B	G	F	A
	140	B	B	A	A	B	G	E	A
62	70	A	B	A	A	C	G	E	C
	140	A	B	A	A	C	G	E	B
64	70	E	D	E	F	F	G	F	A
	140	D	B	B	D	E	G	E	A
76	70	G	C	B	E	E	G	E	G
	140	F	B	A	D	E	F	E	A
172	70	A	C	A	A	C	G	E	A
	140	A	C	A	A	C	G	D	A
106	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
49	70	A	D	B	D	A	G	E	A
	140	B	C	A	A	A	G	D	A
21	70	A	C	A	A	A	G	D	A
	140	A	C	A	A	A	G	D	A
132	70	E	B	B	G	B	G	G	A
	140	B	B	C	D	A	G	F	A
157	70	E	C	A	A	B	G	E	A
	140	E	B	A	A	A	G	E	A
152	70	D	E	n/t	G	E	G	G	A
	140	A	C	B	E	E	G	G	A
103	70	G	G	G	G	G	G	G	G

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
	140	E	G	G	G	G	G	G	G
99	70	n/t	C	A	A	A	G	E	A
	140	A	B	A	A	A	G	D	A
67	70	A	D	B	G	B	G	G	G
	140	A	C	A	G	B	G	G	E
158	70	E	D	D	G	B	G	G	G
	140	E	D	C	G	B	G	E	G
141	70	G	C	B	C	B	G	D	A
	140	A	C	A	A	B	G	D	A
104	70	G	G	G	G	G	G	G	E
	140	E	G	G	G	E	G	G	A
133	70	F	G	G	E	D	G	F	A
	140	E	D	D	C	C	G	F	A
71	70	G	D	B	D	F	G	F	A
	140	G	E	B	D	E	G	E	A
121	70	E	G	G	G	E	G	G	A
	140	E	G	G	G	D	G	G	A
168	70	A	C	A	A	A	G	D	A
	140	A	C	A	A	A	G	D	A
4	70	E	D	C	D	C	G	C	G
	140	A	C	B	D	C	G	C	G
97	70	A	E	G	G	G	G	F	A
	140	A	E	D	F	F	G	D	A
18	70	A	G	G	G	F	G	F	A
	140	A	F	E	G	G	G	F	A
54	70	E	G	A	C	D	G	E	A
	140	A	D	A	C	C	G	E	A
88	70	B	G	C	D	C	G	D	E
	140	A	G	C	B	B	G	D	E
59	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
41	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
108	70	E	D	E	E	G	G	F	G
	140	F	D	C	F	F	G	F	E
122	70	A	E	B	n/t	A	G	E	A
	140	A	E	A	A	B	G	E	A
24	70	A	E	A	D	B	G	G	A
	140	A	D	A	B	B	G	F	A
52	70	A	B	D	n/t	A	G	F	A
	140	A	B	C	B	A	G	F	A
9	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
163	70	A	C	B	B	B	G	D	E
	140	A	B	B	A	B	G	D	D
169	70	A	C	C	A	A	F	F	A
	140	A	B	C	A	A	F	E	A
22	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	E	G	G	G	G	E
50	70	G	G	E	F	G	G	G	A
	140	G	E	C	E	G	G	G	A
82	70	A	G	E	G	G	G	F	A
	140	A	G	B	G	E	G	F	A
72	70	G	E	A	E	B	G	D	D
	140	A	D	A	C	A	G	D	D
35	70	A	E	F	G	E	G	F	A
	140	A	B	B	E	D	G	E	A
46	70	A	E	B	C	E	G	E	E
	140	A	D	B	B	D	G	D	E
89	70	E	E	B	B	B	G	G	E
	140	A	D	B	B	A	D	E	A
84	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
154	70	G	G	E	G	G	G	G	G
	140	G	G	E	G	G	G	G	G
129	70	A	D	C	n/t	A	G	E	D

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
	140	n/t	D	C	n/t	A	G	E	C
38	70	A	C	A	A	B	G	D	B
	140	A	C	A	A	B	G	D	A
183	70	G	G	n/t	G	F	G	G	G
	140	G	G	n/t	G	E	G	G	G
92	70	G	D	n/t	n/t	F	G	F	D
	140	G	D	n/t	n/t	E	G	E	D
140	70	G	G	n/t	n/t	G	G	G	G
	140	G	G	n/t	n/t	G	G	G	G
19	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
8	70	A	C	B	C	A	F	D	D
	140	A	B	B	A	A	E	C	B
26	70	n/t	G	G	G	G	G	E	G
	140	n/t	G	G	G	G	G	E	E
29	70	F	F	G	G	E	G	G	G
	140	E	D	G	G	E	G	G	G
63	70	n/t	D	C	n/t	G	G	D	D
	140	n/t	D	A	A	F	G	D	D
128	70	G	F	E	C	G	G	G	G
	140	G	F	E	C	G	G	G	G
58	70	A	D	G	n/t	E	G	E	D
	140	A	C	C	n/t	E	G	D	D
146	70	A	D	C	n/t	F	G	D	D
	140	A	D	B	n/t	F	G	C	D
47	70	B	C	B	B	B	G	E	B
	140	A	C	B	A	B	G	E	B
125	70	A	D	n/t	B	D	G	D	D
	140	A	D	n/t	A	B	G	D	D
189	70	G	G	n/t	G	G	G	G	G
	140	G	G	n/t	G	G	G	G	G
200	70	G	C	C	E	G	G	F	E
	140	E	C	C	C	G	G	F	D

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
12	70	F	G	G	G	G	G	G	G
	140	E	G	G	G	G	G	G	G
126	70	D	C	A	G	C	G	G	G
	140	F	B	A	C	B	G	G	D
48	140	G	D	C	G	G	G	F	G
23	70	E	C	B	G	B	G	G	G
	140	C	C	A	E	A	G	G	G
10	140	G	C	B	A	C	G	D	D
34	70	D	G	G	C	F	G	D	D
	140	D	E	G	B	E	G	D	D
153	140	E	E	G	C	G	G	D	D
15	140	G	G	G	G	G	G	G	G
33	140	G	G	G	G	G	G	G	G
170	140	G	G	G	G	G	G	G	G
105	140	G	G	G	G	G	G	G	G
1	140	F	G	G	G	G	G	G	G
14	140	G	G	G	G	G	G	G	G
51	70	A	A	A	A	A	G	D	B
	140	A	n/t	A	A	A	G	B	B
42	70	A	C	A	A	A	F	D	C
	140	A	B	A	A	A	F	C	D
55	70	A	B	A	A	B	G	n/t	D
	140	A	B	A	A	A	G	A	B
69	70	E	A	A	A	A	G	D	C
	140	A	A	A	A	A	G	B	C
86	70	A	G	C	G	C	F	G	D
	140	A	G	B	G	n/t	E	G	D
100	70	G	E	G	G	G	G	F	G
	140	G	D	G	G	G	G	D	E
166	140	E	G	G	G	G	G	G	E
30	140	G	G	G	G	G	G	G	G
102	140	G	G	G	G	G	G	G	G
25	140	G	G	G	G	G	G	G	G

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
127	70	A	B	A	A	A	G	D	B
	140	A	A	A	A	A	G	C	B
56	70	A	C	A	A	C	G	D	B
	140	A	B	A	A	B	G	D	B
3	70	A	C	B	A	B	F	D	B
	140	A	B	B	A	B	E	D	B
131	70	B	C	A	A	D	G	D	B
	140	B	C	A	A	C	F	C	B
159	70	A	B	B	C	A	G	D	D
	140	A	B	A	A	A	G	D	C
124	70	A	C	B	D	A	F	E	C
	140	A	B	B	A	A	F	D	C
96	70	A	D	G	D	B	G	D	C
	140	A	C	D	C	B	G	C	C
173	70	A	D	C	C	C	G	D	D
	140	A	C	C	B	B	G	D	C
28	140	G	D	G	E	G	G	G	D
130	140	G	G	G	G	G	G	G	G
161	70	A	F	E	B	G	G	D	D
	140	n/t	E	D	B	G	G	D	D
53	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
93	70	A	C	B	C	B	G	E	D
	140	A	A	B	C	A	G	E	C
74	70	A	B	B	C	B	G	E	C
	140	A	B	B	B	B	F	D	C
61	70	E	G	E	G	E	G	F	D
	140	E	G	D	G	D	G	F	D
81	140	G	E	G	D	C	G	E	C
136	70	A	D	G	F	D	G	E	D
	140	A	D	G	E	D	G	E	C
78	70	G	G	G	E	G	G	E	G
	140	A	G	G	D	G	G	E	F

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
116	70	G	E	E	E	F	G	E	E
	140	G	D	D	D	E	G	E	D
2	70	D	n/t	D	E	F	G	E	C
	140	D	D	D	D	D	G	E	C
101	70	E	E	G	G	F	G	F	D
	140	E	D	B	D	E	G	F	D
11	70	E	D	B	D	D	G	E	D
	140	E	D	B	D	C	G	D	D
119	70	E	E	B	D	D	G	E	D
	140	E	D	B	D	D	G	D	D
107	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	D	G	G	G	G	G	G	G
40	66	G	G	G	G	G	G	G	G
	132	G	G	G	G	G	G	G	G
150	70	G	G	G	G	E	G	F	E
	140	E	G	G	D	E	G	E	D
60	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
36	70	G	G	D	G	D	G	E	F
	140	A	G	C	G	D	G	E	E
57	70	A	G	G	G	C	G	G	G
	140	A	G	G	G	A	G	G	G
17	70	A	G	C	G	B	D	F	D
	140	A	G	B	E	A	B	E	C
117	70	A	G	C	G	B	E	G	E
	140	A	G	C	E	B	E	G	D
83	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
111	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
94	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
192	70	G	G	G	G	G	G	G	G

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
112	70	A	D	D	B	B	G	E	D
	140	A	D	D	A	B	G	D	D
79	66	A	D	D	C	D	G	G	D
	132	A	D	D	C	C	G	F	D
155	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
66	70	E	D	G	G	C	G	G	G
	140	A	D	D	G	B	G	G	G
13	70	C	D	D	E	B	G	E	D
	140	C	C	C	C	B	G	D	D
27	70	G	G	G	G	G	G	E	G
	140	A	G	G	G	F	G	E	G
77	70	G	C	D	G	E	G	E	G
	140	E	B	D	G	E	G	E	G
145	70	E	B	C	C	B	G	D	C
	140	E	B	C	C	B	G	D	C
37	70	G	E	C	G	C	G	E	G
	140	G	D	C	D	B	G	D	E
73	70	A	G	G	D	B	G	D	D
	140	A	E	D	D	B	G	D	D
171	70	E	G	F	G	G	G	F	D
	140	E	D	D	G	E	G	F	C
43	70	A	C	C	D	A	G	D	C
	140	A	C	D	D	A	F	D	C
113	70	A	C	B	C	B	F	D	B
	140	A	C	B	C	B	D	C	B
115	70	A	B	B	G	B	G	G	G
	140	A	B	B	G	A	G	G	G
110	70	E	C	D	D	B	G	E	E
	140	E	C	C	D	B	G	E	D
197	70	D	E	G	G	D	G	G	D
	140	D	D	C	G	D	G	G	D

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
191	70	G	D	B	C	E	G	G	E
	140	D	C	C	C	E	G	F	D
137	70	E	G	G	G	G	G	G	G
	140	E	G	G	G	G	G	G	G
98	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
32	70	G	G	C	G	D	G	G	E
	140	E	G	C	G	D	G	G	D
5	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
151	70	G	G	G	G	D	G	G	D
	140	C	G	E	D	D	G	G	C
87	70	G	D	C	D	D	G	D	D
	140	E	D	C	C	D	G	D	D
123	70	G	G	C	G	F	G	G	E
	140	E	G	B	G	F	G	G	D
70	70	A	B	B	F	B	G	C	A
	140	A	A	A	D	A	G	B	A
44	70	F	G	G	G	G	G	F	G
	140	E	G	G	G	G	G	F	G
65	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
144	70	B	D	E	D	C	G	D	D
	140	A	C	C	C	B	G	C	C
148	70	D	G	G	G	G	G	F	G
	140	C	G	G	G	G	F	D	F
90	70	A	B	B	B	A	F	F	D
	140	A	C	B	B	A	G	E	D
162	70	A	C	B	B	B	E	E	D
	140	E	C	C	C	A	E	E	C
68	70	A	C	B	B	A	E	F	G
	140	A	C	C	C	A	E	E	C
202	70	B	F	D	D	D	G	D	F

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
	140	B	D	A	D	B	G	C	E
198	70	D	G	G	G	G	G	F	G
	140	D	G	G	G	G	G	E	G
208	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
205	70	B	F	B	E	D	G	G	F
	140	A	E	B	C	C	G	F	D
176	70	B	E	B	B	D	G	F	G
	140	A	D	B	B	B	G	E	B
193	70	F	G	G	G	G	G	G	G
	140	E	G	G	E	E	G	F	G
177	70	E	G	G	F	G	G	F	G
	140	E	G	D	E	E	G	F	G
179	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	F	G	E	G	G	G
184	70	G	G	E	G	G	G	G	G
	140	G	G	D	G	F	G	G	G
185	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
174	70	D	G	D	G	G	G	G	G
	140	B	E	B	E	G	G	G	G
178	70	B	G	D	B	E	G	F	G
	140	B	E	B	B	D	G	E	F
203	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	C	G	G	C	G	G	G	G
187	70	G	G	D	D	G	G	G	G
	140	F	G	D	C	G	G	E	G
195	70	G	G	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G	G	G
188	70	G	G	C	G	E	G	G	G
	140	G	G	D	F	G	G	G	G
194	70	G	G	G	E	G	G	G	G
	140	G	G	G	D	G	G	G	G

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 14 días después de la aplicación							
		CYPES	DIGSA	ECHCG	SETFA	SORVU	ORYSA	TRZSS	ZEAMX
201	70	G	G	D	G	G	G	G	G
	140	G	G	E	F	E	G	G	G
ECHCG: cerreig (<i>Echinochloa crus-galli</i>) CYPES: chufa (<i>Cyperus esculentus</i>) DIGSA: pata de gallina (<i>Digitaria sanguinalis</i>) ORYSA: arroz (<i>Oryza sativa</i>) SETFA: almorejo gigante (<i>Setaria faberi</i>) SORVU: sorgo (<i>Sorgo vulgare</i>) TRZAS: trigo, primavera (<i>Triticum aestivum</i>) ZEAMX: maíz, maíz (<i>Zea mays</i>) g ia/ha: gramos de ingrediente activo por hectárea n/t: no sometido a ensayo									

Ejemplo D. Evaluación de la actividad herbicida de post-emergencia en trigo y cebada

Ensayo III de post-emergencia. Las semillas de las especies de plantas de ensayo deseadas se plantaron en la mezcla de plantación Sun Gro MetroMix® 306, que típicamente tiene un pH de 6,0 a 6,8 y un contenido de materia orgánica de aproximadamente 30 por ciento, en macetas de plástico con un área de superficie de 103,2 centímetros cuadrados (cm²). Cuando fue necesario para asegurar una buena germinación y plantas sanas, se aplicó un tratamiento con fungicidas y/u otro tratamiento químico o físico. Las plantas se cultivaron durante 7-36 d en un invernadero con un fotoperíodo de aproximadamente 14 h que se mantuvo a aproximadamente 18°C durante el día y 17°C durante la noche. Los nutrientes y el agua se agregaron de manera regular y se proporcionó iluminación adicional con lámparas de de 1000 vatios halógenas suspendidas, según sea necesario. Las plantas se emplearon para el ensayo cuando alcanzaron la fase de segunda o tercera hojas verdaderas.

Se colocó una cantidad ponderada, determinada por la tasa más alta que se iba a someter a ensayo, de cada compuesto de ensayo en un vial de vidrio de 25 mL y se disolvió en 4 mL de una mezcla 97:3 v/v de acetona y DMSO para obtener soluciones de partida concentradas. Si el compuesto de ensayo no se disolvía fácilmente, la mezcla se calentó y/o se sometió a sonicación. Las soluciones de partida concentradas obtenidas se diluyeron con 20 mL de una mezcla acuosa que contenía acetona, agua, alcohol isopropílico, DMSO, producto concentrado de aceite de cultivo Agri-Dex y tensioactivo X-77 a una razón 48:39:10:1,5:1,5:0,02 v/v para obtener soluciones de pulverización que contienen las tasas de aplicación más altas. Se obtuvieron tasas de aplicación adicionales por dilución en serie de 12 mL de la solución de alta tasa en una solución que contenía 2 mL de mezcla 97:3 v/v de acetona y DMSO y 10 mL de una mezcla acuosa que contenía acetona, agua, alcohol isopropílico, DMSO, producto concentrado de aceite de cultivo Agri-Dex y tensioactivo X-77 a una razón 48:39:10:1,5:1,5:0,02 v/v para obtener tasas de 1/2X, 1/4X, 1/8X y 1/16X de la alta tasa. Los requisitos de los compuestos se basan en un volumen de aplicación de 12 mL a una tasa de 187 litros por hectárea (L/ha). Los compuestos formulados se aplicaron al material vegetal con un pulverizador de riel Mandel suspendido equipado con boquillas 8002E calibradas para suministrar 187 L/ha en un área de aplicación de 0,503 metros cuadrados a una altura de pulverización de 43 cm (18 pulgadas) por encima de la altura del dosel vegetal promedio. Las plantas de control se pulverizaron de la misma manera con el blanco de disolvente.

Las plantas tratadas y las plantas de control se colocaron en un invernadero como se describió anteriormente y se regaron mediante sub-irrigación para evitar el lavado de los compuestos de ensayo. Después de 21 d, el estado de las plantas de ensayo en comparación con el de las plantas no tratadas se determinó visualmente y se calificó en una escala de 0 a 100 por ciento, donde 0 corresponde a ninguna lesión y 100 corresponde a la destrucción completa y se presenta como se indica en la Tabla A.

Aplicando el análisis probit bien aceptado según lo descrito por J. Berkson en *Journal of the American Statistical Society*, 48, 565 (1953) y por D. Finney en "*Probit Analysis*" Cambridge University Press (1952), se puede utilizar el daño por herbicida de un compuesto específico a diferentes tasas para calcular los valores RC₂₀, RC₅₀, RC₈₀ y RC₉₀, que se definen como factores de reducción del crecimiento que corresponden a la dosis eficaz de herbicida requerida para proporcionar una reducción del crecimiento de las plantas (RC) del 20%, 50%, 80% y 90%, respectivamente. Se aplicó el análisis Probit a los datos recopilados a partir de tasas de dosis múltiples de compuestos individuales utilizando los procedimientos explicados en los siguientes ejemplos. Los datos de algunas de las tasas de dosis y el análisis de todas las tasas de dosis se recogen en las siguientes tablas.

Algunos de los compuestos sometidos a ensayo, las tasas de aplicación empleadas, las especies de plantas sometidas a ensayo y los resultados se proporcionan en las Tablas 7 a 11.

Tabla 7: Actividad de compuestos herbicidas en trigo y cebada

Núm. Comp	Tasa de aplicación (g/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación													
		ALOMY	APESV	BROTE	KCHSC	LAMSS	LOLS	MATSS	PAPRH	PHAMI	SETVI	STEME	VERPE	HORSS	TRZSS
138	35	C	B	C	A	A	D	D	A	E	B	F	D	B	B
	70	B	B	B	A	A	C	B	A	C	B	F	B	B	B
	140	A	A	B	A	A	B	B	A	B	A	E	B	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	11	2	12	1	1	20	16	1	31	8	125	15	--	--
	RC ₈₀	30	12	42	4	1	66	51	1	78	32	>140	49	--	--
20	35	C	B	C	A	A	E	A	A	B	A	C	D	B	B
	70	C	B	B	A	A	D	A	A	B	A	A	D	A	B
	140	C	B	B	A	A	D	A	A	B	A	A	C	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	21	2	3	2	1	25	1	1	5	4	8	33	--	--
	RC ₈₀	72	12	87	5	1	>140	1	1	25	10	25	>140	--	--
216	35	E	B	F	A	A	G	C	A	G	D	F	E	B	C
	70	D	B	E	A	A	F	C	A	F	C	F	D	B	B
	140	C	A	E	A	A	E	B	A	C	B	C	C	B	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	54	6	136	1	1	137	10	1	>140	20	52	32	--	--
	RC ₈₀	>140	20	>140	2	1	>140	62	1	>140	64	>140	>140	--	--
217	35	C	B	C	B	A	E	B	A	B	C	D	D	C	C
	70	B	B	B	A	A	D	B	A	B	C	C	D	C	C
	140	B	A	B	A	A	D	B	A	B	C	C	D	C	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	7	2

ES 2 706 504 T3

Núm Com p	Tas a de apli- ca- ción (g ia/h a)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación													
		ALO MY	APES V	BRO TE	KCHS C	LAMS S	LOLS S	MAT SS	PAPR H	PHA MI	SET VI	STE ME	VERP E	HOR SS	TRZS S
	RC ₅ ₀	12	6	15	2	1	32	34	1	11	46	28	19	--	--
	RC ₈ ₀	31	15	33	6	2	>140	>140	1	30	>140	88	73	--	--
114	35	G	G	G	D	B	G	G	A	G	G	G	F	G	F
	70	G	G	G	D	B	G	G	A	G	G	G	F	F	E
	140	G	G	G	C	A	G	G	A	G	G	G	F	F	E
	RC ₂ ₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	42	16
	RC ₅ ₀	>140	>140	>140	3	1	>140	>140	1	>140	>140	>140	>140	--	--
	RC ₈ ₀	>140	>140	>140	>140	4	>140	>140	4	>140	>140	>140	>140	--	--
85	35	G	G	G	G	B	G	G	B	G	G	G	F	G	D
	70	G	G	G	G	B	G	G	A	G	G	G	E	F	D
	140	G	G	G	G	B	G	G	A	G	G	G	D	D	D
	RC ₂ ₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	33	1
	RC ₅ ₀	>140	>140	>140	>140	0,014	>140	88	1	>140	>140	57	90	--	--
	RC ₈ ₀	>140	>140	>140	>140	6	>140	>140	3	>140	>140	123	>140	--	--
142	35	G	G	G	E	B	G	G	B	G	G	G	C	G	G
	70	G	G	G	D	B	G	G	A	G	G	G	B	G	G
	140	G	G	G	D	B	G	F	A	G	G	G	B	G	E
	RC ₂ ₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	57	>140
	RC ₅ ₀	>140	>140	>140	17	0,15	>140	>140	1	>140	>140	>140	5	--	--
	RC ₈ ₀	>140	>140	>140	>140	5	>140	>140	4	>140	>140	>140	40	--	--
118	35	D	D	D	B	A	F	D	A	G	G	F	B	B	C
	70	C	C	B	B	A	D	C	A	D	F	F	B	B	B
	140	B	B	B	A	A	C	B	A	C	D	F	A	B	B
	RC ₂ ₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	1	0,29

ES 2 706 504 T3

Núm Com p	Tas a de apli- ca- ción (g ia/h a)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación													
		ALO MY	APES V	BRO TE	KCHS C	LAMS S	LOLS S	MAT SS	PAPR H	PHA MI	SET VI	STE ME	VERP E	HOR SS	TRZS S
	RC ₅ ₀	25	22	31	3	1	49	14	1	68	91	1	5	--	--
	RC ₈ ₀	60	60	64	17	1	121	60	1	126	184	1	17	--	--
45	35	C	B	B	B	B	D	B	A	C	D	F	C	B	B
	70	B	B	B	A	A	C	A	A	B	B	F	B	B	B
	140	A	A	A	A	A	B	A	A	A	A	F	B	A	B
	RC ₂ ₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅ ₀	9	8	13	2	1	20	2	1	15	18	75	7	--	--
	RC ₈ ₀	27	25	36	9	6	69	29	1	32	52	>140	30	--	--
91	35	E	E	E	C	A	G	D	A	F	D	G	F	C	C
	70	E	E	E	B	A	G	C	A	F	C	F	F	C	B
	140	E	D	F	B	A	G	B	A	F	C	E	E	B	B
	RC ₂ ₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅ ₀	98	67	29	2	1	>140	11	1	>140	6	>140	123	--	--
	RC ₈ ₀	>140	>140	>140	47	3	>140	75	1	>140	105	>140	>140	--	--
143	35	G	D	G	F	B	G	G	B	G	E	G	F	D	D
	70	D	D	E	F	B	F	D	B	F	E	G	E	C	C
	140	D	C	E	E	B	E	D	B	D	D	G	E	B	C
	RC ₂ ₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	2	0,09
	RC ₅ ₀	71	31	95	>140	1	116	67	1	112	52	>140	97	--	--
	RC ₈ ₀	>140	129	>140	>140	1	>140	>140	8	>140	>140	>140	>140	--	-
39	35	G	F	G	C	A	F	A	A	G	F	G	B	F	C
	70	E	E	G	B	A	E	A	A	F	E	F	B	E	C
	140	E	D	G	B	A	D	A	A	E	D	E	A	D	B
	RC ₂ ₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	18	1

ES 2 706 504 T3

Núm Com p	Tas a de apli- ca- ción (g ia/h a)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación													
		ALO MY	APES V	BRO TE	KCHS C	LAMS S	LOLS S	MAT SS	PAPR H	PHA MI	SET VI	STE ME	VERP E	HOR SS	TRZS S
	RC ₅ ₀	111	70	>140	3	1	82	1	1	118	68	111	1	--	--
	RC ₈ ₀	>140	>140	>140	40	1	>140	1	1	>140	>140	>140	12	--	--
204	35	G	G	G	B	B	G	G	B	G	G	C	D	F	D
	70	E	F	G	A	A	G	G	B	E	F	C	D	D	C
	140	E	D	F	A	A	G	G	A	D	F	B	D	D	B
	RC ₂ ₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	16	7
	RC ₅ ₀	105	106	>140	2	1	>140	>140	3	100	>140	7	20	--	--
	RC ₈ ₀	>140	>140	>140	9	8	>140	>140	19	>140	>140	61	>140	--	--
186	35	G	G	G	D	C	G	G	D	G	G	F	F	G	G
	70	G	G	G	D	B	G	G	D	G	G	F	E	G	G
	140	G	G	G	D	B	G	G	C	G	G	F	D	G	G
	RC ₂ ₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	115	>140
	RC ₅ ₀	>140	>140	>140	1	1	>140	>140	1	>140	>140	>140	82	--	--
	RC ₈ ₀	>140	>140	>140	>140	25	>140	>140	>140	>140	>140	>140	>140	--	--
209	35	G	G	G	D	B	G	G	A	G	F	G	D	E	F
	70	G	G	F	B	B	F	G	A	G	E	F	C	D	D
	RC ₂ ₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	16	25
	RC ₅ ₀	>140	>140	88	12	7	93	>140	2	>140	65	>140	20	--	--
	RC ₈ ₀	>140	>140	>140	42	29	>140	>140	5	>140	>140	>140	86	--	--
109	35	D	B	C	B	A	E	F	A	A	C	D	B	C	D
	70	C	B	B	B	A	E	E	A	A	C	D	A	B	C
	RC ₂ ₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	2	4
	RC ₅ ₀	22	1	14	3	1	34	72	1	6	15	11	2	--	--

Núm. Comp	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación													
		ALOMY	APESV	BROTE	KCHSC	LAMSS	LOLS	MATSS	PAPRH	PHAMI	SETVI	STEME	VERPE	HORSS	TRZSS
	RC ₈₀	88	6	41	19	1	>140	>140	1	14	42	>140	13	--	--
147	35	D	B	C	B	B	F	A	A	A	D	F	E	B	C
	70	B	B	B	A	B	E	A	A	A	B	D	C	B	B
	140	B	B	B	B	B	D	A	A	A	B	D	D	B	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	0,07	0,07
	RC ₅₀	20	5	6	4	1	71	6	1	4	16	61	43	--	--
	RC ₈₀	47	16	28	19	8	>140	14	1	14	49	>140	>140	--	--
167	35	F	C	F	D	A	G	C	A	C	F	F	A	E	E
	70	D	B	C	C	A	G	B	A	B	C	F	A	C	D
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	13	14
	RC ₅₀	57	20	43	23	1	>140	24	1	22	40	>140	1	--	--
	RC ₈₀	119	46	81	52	1	>140	48	1	44	90	>140	2	--	--
214	35	F	G	G	C	C	F	C	A	G	G	G	F	G	F
	70	E	F	G	B	C	E	B	A	G	F	F	D	F	E
	140	F	E	G	A	B	B	B	A	G	E	C	C	D	D
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	--	24	8
	RC ₅₀	95	110	>140	7	12	59	4	4	>140	>140	71	62	--	--
	RC ₈₀	>140	>140	>140	52	33	>140	41	9	>140	>140	>140	>140	--	--

Tabla 8: Actividad de compuestos herbicidas en trigo y cebada

Núm. Comp	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación										
		CIRAR	GALAP	KCHSC	LAMSS	MATSS	PAPRH	SASKR	VERPE	VIOS	HORS	TRZSS
135	35	B	D	C	C	F	B	D	D	D	G	F
	70	B	A	C	B	F	B	D	C	D	F	F

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	Tasa de aplicación (g/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación										
		CIRAR	GALAP	KCHSC	LAMSS	MATSS	PAPRH	SASKR	VERPE	VIOS S	HORS S	TRZSS
	140	B	A	C	B	E	A	C	B	C	D	E
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	-	--	37	16
	RC ₅₀	1	12	3	1	125	1	3	24	23	-	-
	RC ₈₀	13	38	130	19	>140	1	>140	78	>140	>140	>140
3	35	D	A	A	A	A	A	C	E	A	B	B
	70	C	A	A	A	A	A	B	D	A	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	18	5	2	1	4	1	2	34	4	--	--
	RC ₈₀	53	7	8	1	11	1	28	126	7	--	--
124	35	D	B	B	A	C	A	D	C	D	B	B
	70	C	A	B	A	B	A	B	B	A	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	24	6	3	1	9	1	12	20	24	--	--
	RC ₈₀	91	21	29	1	32	1	53	39	49	--	--
79	35	A	A	D	D	C	A	C	C	G	B	C
	70	A	A	C	D	B	A	B	B	G	B	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	1	2
	RC ₅₀	1	4	24	27	13	1	11	2	>140	--	--
	RC ₈₀	5	6	70	72	46	1	43	37	>140	--	--
27	35	C	B	C	B	F	A	D	C	C	F	D
	70	C	B	C	B	F	A	D	B	A	E	C
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	11	11
	RC ₅₀	18	5	18	1	109	1	22	5	8	--	--
	RC ₈₀	70	25	61	14	>140	1	116	42	27	--	--
145	35	A	E	D	A	A	A	D	B	G	B	B
	70	B	C	D	A	A	A	C	B	G	A	B
	140	A	A	C	A	A	A	B	A	F	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	2	18	37	4	3	1	9	1	>140	--	--
	RC ₈₀	7	54	112	13	10	1	79	10	>140	--	--
37	35	E	B	E	B	D	A	E	D	C	D	C
	70	C	A	D	A	D	A	D	C	B	C	B

Núm. Comp.	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación										
		CIRAR	GALAP	KCHSC	LAMSS	MATSS	PAPRH	SASKR	VERPE	VIOS	HORSS	TRZSS
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	5	3
	RC ₅₀	23	14	34	1	21	1	33	15	12	--	--
	RC ₈₀	103	31	119	11	77	1	104	66	35	--	--
171	35	D	B	B	B	F	A	D	B	A	E	C
	70	D	A	A	A	F	A	C	B	A	D	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	20	11
	RC ₅₀	17	9	9	2	>140	1	21	4	5	--	--
	RC ₈₀	80	23	23	11	>140	1	67	27	10	--	--
43	35	B	A	D	B	B	A	C	F	E	A	B
	70	B	A	B	B	A	A	C	C	D	A	A
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	0,18	2	11	1	3	1	3	33	37	--	--
	RC ₈₀	13	6	41	10	7	1	61	>140	>140	--	--
113	35	C	A	A	A	B	A	C	B	A	B	B
	70	B	A	A	A	A	A	B	B	A	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	7	5	3	1	4	1	5	3	4	--	--
	RC ₈₀	33	12	10	4	15	1	36	18	11	--	--
110	35	C	A	A	A	D	A	C	G	F	B	B
	70	C	A	A	A	B	A	B	G	D	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	19	1	1	1	10	1	1	>140	51	--	--
	RC ₈₀	52	1	1	1	37	1	30	>140	144	--	--

Tabla 9: Actividad de compuestos herbicidas en trigo y cebada

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación					
		APESV	KCHSC	LOLSS	SETVI	HORSS	TRZSS
76	35	C	G	F	E	D	C
	70	B	E	E	D	D	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	6	4
	RC ₅₀	27	74	53	42	--	--
	RC ₈₀	52	132	133	87	--	--

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación					
		APESV	KCHSC	LOLSS	SETVI	HORSS	TRZSS
172	35	F	D	G	D	D	C
	70	D	D	G	C	D	C
	RC ₂₀	--	--	--	--	3	1
	RC ₅₀	53	38	>140	25	--	--
	RC ₈₀	124	73	>140	56	--	--
168	35	C	A	G	E	B	B
	70	B	A	E	D	A	A
	RC ₂₀	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	21	5	108	28	--	--
	RC ₈₀	57	15	>140	70	--	--
35	35	G	C	G	G	D	C
	70	F	B	F	F	D	C
	RC ₂₀	--	--	--	--	8	2
	RC ₅₀	113	8	126	79	--	--
	RC ₈₀	>140	37	>140	>140	--	--
46	35	G	C	G	G	D	C
	70	G	B	F	F	D	C
	140	E	B	E	F	B	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	8	1
	RC ₅₀	>140	10	118	>140	--	--
	RC ₈₀	>140	45	>140	>140	--	--
154	35	G	G	G	F	G	G
	70	G	G	G	D	G	F
	140	G	G	G	C	E	E
	RC ₂₀	--	--	--	--	81	49
	RC ₅₀	>140	57	>140	56	--	--
	RC ₈₀	>140	93	>140	109	--	--
146	35	A	G	G	E	C	C
	70	A	G	G	C	B	B
	140	A	G	G	A	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	23	>140	>140	41	--	--
	RC ₈₀	34	>140	>140	76	--	--

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación					
		APESV	KCHSC	LOLSS	SETVI	HORSS	TRZSS
47	35	A	B	G	G	A	B
	70	A	C	E	C	A	A
	140	A	A	D	B	A	A
	RC ₂₀	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	10	20	80	51	--	--
	RC ₈₀	14	45	>140	104	--	--
125	35	C	D	G	B	B	C
	70	B	B	G	B	A	C
	140	A	A	E	B	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	10	8	>140	2	--	--
	RC ₈₀	41	34	>140	16	--	--
51	35	B	B	C	C	B	B
	70	A	A	C	B	A	A
	RC ₂₀	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	3	4	3	24	--	--
	RC ₈₀	11	14	61	49	--	--
42	35	B	B	F	B	B	B
	70	B	D	E	B	B	B
	140	A	A	C	A	A	A
	RC ₂₀	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	7	1	76	1	--	--
	RC ₈₀	22	1	>140	19	--	--
55	35	C	B	D	C	B	B
	70	A	B	C	B	A	A
	RC ₂₀	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	4	4	21	29	--	--
	RC ₈₀	18	21	50	46	--	--
159	35	B	B	E	E	B	B
	70	A	A	D	D	A	A
	RC ₂₀	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	11	4	36	43	--	--
	RC ₈₀	25	19	89	113	--	--

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación					
		APESV	KCHSC	LOLSS	SETVI	HORSS	TRZSS
96	35	F	G	E	G	B	B
	70	F	D	D	D	A	B
	140	E	D	D	C	A	A
	RC ₂₀	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	125	79	48	72	--	--
	RC ₈₀	>140	>140	>140	128	--	--
173	35	D	F	F	F	B	C
	70	C	E	E	E	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	27	60	119	54	--	--
	RC ₈₀	59	131	>140	104	--	--
28	35	G	G	G	G	G	F
	70	G	F	G	G	F	D
	RC ₂₀	--	--	--	--	43	17
	RC ₈₀	>140	88	>140	>140	--	--
	RC ₈₀	>140	>140	>140	>140	--	--
161	35	D	G	G	F	B	C
	70	C	G	G	D	B	C
	RC ₂₀	--	--	--	--	1	1
	RC ₈₀	30	>140	38	53	--	--
	RC ₈₀	57	>140	82	128	--	--
74	35	B	B	F	C	B	C
	70	B	A	E	B	B	C
	RC ₂₀	--	--	--	--	1	1
	RC ₈₀	10	3	>140	3	--	--
	RC ₈₀	25	11	>140	49	--	--
150	35	G	D	G	G	F	D
	70	G	D	G	F	E	D
	RC ₂₀	--	--	--	--	8	1
	RC ₅₀	>140	7	>140	79	--	--
	RC ₈₀	>140	>140	>140	>140	--	--
36	35	G	G	G	G	F	C
	70	G	G	G	F	D	C

ES 2 706 504 T3

Núm. compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación					
		APESV	KCHSC	LOLSS	SETVI	HORSS	TRZSS
	RC ₂₀	--	--	--	--	16	1
	RC ₅₀	>140	>140	>140	126	--	--
	RC ₈₀	>140	>140	>140	>140	--	--
117	35	E	D	E	G	G	G
	70	D	C	D	D	G	F
	RC ₂₀	--	--	--	--	73	32
	RC ₅₀	41	20	41	59	--	--
	RC ₈₀	>140	67	>140	99	--	--

Tabla 10: Actividad de compuestos herbicidas en trigo y cebada

Núm. Compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción visual de crecimiento (%) 21 días después de la aplicación						
		KCHSC	MATSS	SASKR	VERPE	VIOSS	HORSS	TRZSS
49	35	B	D	C	E	A	C	C
	70	B	C	B	D	A	B	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	4	15	1	37	5	--	--
	RC ₈₀	18	93	30	>140	8	--	--
21	35	A	B	C	F	A	B	C
	70	A	B	B	G	A	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	1	5	1	130	4	--	--
	RC ₈₀	1	31	25	>140	6	--	--
132	35	B	G	C	G	A	D	D
	70	B	F	C	C	A	C	D
	140	A	F	C	B	A	A	C
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	9	10
	RC ₅₀	4	>140	1	58	9	--	--
	RC ₈₀	20	>140	66	99	17	--	--
157	35	B	D	C	F	A	B	C
	70	B	C	B	D	A	A	C
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	6	21	11	50	1	--	--
	RC ₈₀	18	64	34	>140	4	--	--

ES 2 706 504 T3

Núm. Compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción visual de crecimiento (%) 21 días después de la aplicación						
		KCHSC	MATSS	SASKR	VERPE	VIOSS	HORSS	TRZSS
99	35	C	F	C	A	A	B	B
	70	B	E	C	A	A	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	9	63	10	8	9	--	--
	RC ₈₀	27	>140	48	17	19	--	--
141	35	C	C	C	C	A	B	C
	70	B	A	B	B	A	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	7	15	4	14	7	--	--
	RC ₈₀	28	33	40	43	11	--	--
108	35	G	F	G	D	F	F	C
	70	G	D	F	C	F	E	C
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	16	6
	RC ₅₀	>140	58	136	22	85	--	--
	RC ₈₀	>140	>140	>140	67	>140	--	--
122	35	B	G	A	A	A	D	C
	70	A	F	A	A	A	B	B
	RC ₂₀	--	-	--	--	--	3	1
	RC ₅₀	5	>140	<17,5	1	10	-	-
	RC ₈₀	14	>140	<17,5	2	21	-	-
52	35	C	G	D	C	A	B	B
	70	B	D	C	A	A	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	5	62	4	20	12	--	--
	RC ₈₀	38	91	84	37	19	--	--
163	35	C	C	C	C	C	B	C
	70	B	A	B	A	A	A	C
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	8	5	3	13	14	--	--
	RC ₈₀	36	24	27	30	29	--	--
169	37,1	D	C	D	B	C	A	C
	74,3	B	A	C	A	A	A	B
	149	B	A	B	A	A	A	B

ES 2 706 504 T3

Núm. Compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción visual de crecimiento (%) 21 días después de la aplicación						
		KCHSC	MATSS	SASKR	VERPE	VIOSS	HORSS	TRZSS
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	8	15	5	19	21	--	--
	RC ₈₀	72	35	83	37	36	--	--
72	35	D	G	F	B	F	E	C
	70	D	F	D	A	E	D	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	5	1
	RC ₅₀	27	126	48	1	67	--	--
	RC ₈₀	105	>140	106	8	>140	--	--
89	35	B	C	B	A	A	D	C
	70	B	B	B	A	A	D	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	3	1
	RC ₈₀	12	14	9	3	11	--	--
	RC ₈₀	25	36	21	6	19	--	--
129	35	B	G	C	F	C	B	C
	70	A	F	B	E	A	B	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	7	89	6	92	17	--	--
	RC ₈₀	21	131	41	>140	34	--	--
38	35	B	D	D	F	A	B	B
	70	B	B	D	D	A	B	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	1	21	17	42	13	--	--
	RC ₈₀	24	56	68	112	26	--	--
8	35	A	D	B	A	B	D	C
	70	A	C	B	A	B	C	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	3	26	1	1	13	--	--
	RC ₈₀	6	73	16	1	28	--	--
69	35	B	C	B	B	B	B	B
	70	B	B	B	A	A	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	1	1
	RC ₅₀	5	5	7	1	3	--	--
	RC ₈₀	19	29	29	4	8	--	--

Núm. Compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción visual de crecimiento (%) 21 días después de la aplicación						
		KCHSC	MATSS	SASKR	VERPE	VIOSS	HORSS	TRZSS
86	35	C	D	D	B	D	F	D
	70	C	D	C	B	D	F	D
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	14	1
	RC ₅₀	12	22	18	15	21	--	--
	RC ₈₀	55	85	66	34	77	--	--

Tabla 11: Actividad de compuestos herbicidas en trigo y cebada

Núm. Compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación					
		KCHSC	MATSS	SASKR	VIOSS	HORSS	TRZSS
149	35	F	E	D	F	D	E
	70	D	D	D	D	C	C
	RC ₂₀	18	9	6	11	21	20
	RC ₅₀	56	38	24	44	--	--
	RC ₈₀	>140	>140	100	>140	--	--
165	35	B	G	C	F	C	D
	70	B	E	B	D	B	C
	RC ₂₀	--	--	--	--	9	8
	RC ₅₀	9	81	4	55	--	--
	RC ₈₀	30	>140	46	>140	--	--

ALOMY: cola de zorra (*Alopecurus myosuroides*)APESV: pasto de invierno (*Apera spica-venti*)BROTE: arabueyes (*Bromus tectorum*)HORSS: cebada, incluidos primavera e invierno (*Hordeum vulgare*)TRZSS: trigo, incluidos primavera e invierno (*Triticum aestivum*)LOLSS: vallico incluyendo, vallico italiano (*Lolium multiflorum*), vallico rígido (*Lolium rigidum*), vallico anual (*Lolium multiflorum subsp. Gaudini*)PHAMI: alfarín (*Phalaris minor*)SETVI: cola de zorra verde (*Setaria viridis*)KCHSC: kochia (*Kochia scoparia*)LAMSS: incluyendo ortiga muerta (*Lamium purpureum*) y zapatitos de la virgen (*Lamium amplexicaule*)GALAP: amor de hortelano (*Galium aparine*)VERPE: verónica (*veronica persica*)PAPRH: amapola común (*Papaver rhoeas*)SASKR: barrilla (*Salsola ibérica*)CIRAR: cardo cundidor (*Cirsium arvense*)VIOSS: pensamiento silvestre (*Viola tricolor*), violeta silvestre (*Viola arvensis*)MATSS: manzanilla dulce (*Matricaria chamomilla*), manzanilla suave (*Matricaria matricarioides*)STEME: pamplina común (*Stellaria media*).

g ia/ha: gramos de ingrediente activo por hectárea

Núm. Compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación					
		KCHSC	MATSS	SASKR	VIOS	HORSS	TRZSS
nt: no sometido a ensayo							
RC ₂₀ : Reducción del crecimiento del 20% del crecimiento de las plantas.							
RC ₅₀ : Reducción del crecimiento del 50% del crecimiento de las plantas.							
RC ₈₀ : Reducción del crecimiento del 80% del crecimiento de las plantas.							
RC ₉₀ : Reducción del crecimiento del 90% del crecimiento de las plantas.							

Ejemplo E. Evaluación de la actividad herbicida de preemergencia

Ensayo III de Preemergencia. Las semillas de las especies de ensayo se plantaron en macetas cuadradas de plástico (10 cm de ancho) que contenían suelo franco arenoso. Después de la plantación, todas las macetas fueron sub-irrigadas 16 h antes de la aplicación del compuesto.

Se colocó una cantidad ponderada, determinada por la tasa más alta que se iba a someter a ensayo, de cada compuesto de ensayo en un vial de vidrio de 25 mL y se disolvió en 4 mL de una mezcla 97:3 v/v de acetona y DMSO para obtener soluciones de partida concentradas. Si el compuesto de ensayo no se disolvió fácilmente, la mezcla se calentó y/o se sometió a sonicación. Las soluciones de partida concentradas obtenidas se diluyeron con 20 mL de una mezcla acuosa que contenía agua y 0,02% p/v (peso/volumen) de Triton X-155 para obtener soluciones de pulverización que contenían las tasas de aplicación más altas. Se obtuvieron tasas de aplicación adicionales por dilución en serie de 12 mL de la solución de alta velocidad en una solución que contenía 2 mL de una mezcla 97:3 v/v de acetona y DMSO y 10 mL de una mezcla acuosa que contiene agua y 0,02% p/v (peso/volumen) de Triton X-155 para obtener tasas de 1/2X, 1/4X, 1/8X y 1/16X de la tasa alta. Los requisitos de los compuestos se basan en un volumen de aplicación de 12 mL a una tasa de 187 litros por hectárea (L/ha). Los compuestos formulados se aplicaron a la superficie del suelo con un pulverizador de riel Mandel suspendido equipado con boquillas 8002E calibradas para suministrar 187 L/ha en un área de aplicación de 0,503 metros cuadrados. Las macetas de control se pulverizaron de la misma manera con el blanco de disolvente.

Las macetas tratadas y las macetas de control se colocaron en un invernadero tal como se describió anteriormente y se regaron con irrigación superficial. Después de 21 d, se determinó visualmente el estado de las macetas de ensayo en comparación con el de las macetas no tratadas y se calificó en una escala de 0 a 100 por ciento, donde 0 corresponde a ningún efecto herbicida y 100 corresponde a la muerte de la planta o falta de emergencia de la planta en el suelo y se presenta como se indica en la tabla A.

Aplicando el análisis probit bien aceptado según lo descrito por J. Berkson en *Journal of the American Statistical Society*, 48, 565 (1953) y por D. Finney en *"Probit Analysis"* Cambridge University Press (1952), se puede utilizar la lesión por herbicida de un compuesto específico a diferentes tasas para calcular los valores de RC₂₀, RC₅₀, RC₈₀ y RC₉₀, que se definen como factores de reducción del crecimiento que se corresponden con la dosis eficaz de herbicida requerida para proporcionar una reducción del crecimiento de las plantas (RC) de 20 por ciento, 50 por ciento, 80 por ciento y 90 por ciento, respectivamente. El análisis Probit se aplicó a los datos recopilados a partir de tasas de dosis múltiples de compuestos individuales utilizando los procedimientos explicados en los siguientes ejemplos. Los datos de algunas de las tasas de dosis y el análisis de todas las tasas de dosis se recogen en las siguientes tablas.

Algunos de los compuestos sometidos a ensayo, las tasas de aplicación empleadas, las especies de plantas sometidas a ensayo y los resultados se proporcionan en la Tabla 12.

Tabla 12: Actividad de preemergencia de compuestos herbicidas en trigo y cebada

Núm. Compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación					
		APESV	LAMSS	LOLSS	SETVI	HORSS	TRZSS
20	35	A	A	G	F	F	E
	70	A	A	E	B	E	E
	RC ₂₀	--	--	--	--	17	10
	RC ₅₀	6	6	>70	32	--	--
	RC ₈₀	16	9	>70	71	--	--

Núm. Compuesto	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación					
		APESV	LAMSS	LOLSS	SETVI	HORSS	TRZSS
147	35	C	A	G	E	G	F
	70	B	A	G	C	G	F
	RC ₂₀	--	--	--	--	70	23
	RC ₅₀	19	1	52	17	--	--
	RC ₈₀	33	5	>70	>70	--	--
214	35	C	A	G	G	G	G
	70	A	A	E	G	G	F
	RC ₂₀	--	--	--	--	93	28
	RC ₅₀	13	1	>70	>70	--	--
	RC ₈₀	28	2	>70	>70	--	--
49	35	F	A	G	F	G	G
	70	E	A	G	F	G	G
	RC ₂₀	--	--	--	--	>70	>70
	RC ₅₀	>70	1	>70	>70	--	--
	RC ₈₀	>70	3	>70	>70	--	--
42	35	B	A	G	E	F	E
	70	A	A	G	D	E	E
	RC ₂₀	--	--	--	--	11	5
	RC ₅₀	12	1	>70	36	--	--
	RC ₈₀	27	1	>70	>70	--	--

APESV: pasto de invierno (*Apera spica-venti*)

LAMPU: ortiga muerta (*Lamium purpureum*)

LOLSS: vallico incluyendo, vallico italiano (*Lolium multiflorum*), pasto rígido (*Lolium rigidum*), vallico anual (*Lolium multiflorum subsp. Gaudini*)

SETVI: cola de zorra verde (*Setaria viridis*)

HORSS: cebada, incluidos primavera e invierno (*Hordeum vulgare*)

TRZSS: trigo, incluidos primavera e invierno (*Triticum aestivum*)

g ia/ha: gramos de ingrediente activo por hectárea

nt: no sometido a ensayo

RC₂₀: Reducción del crecimiento del 20% del crecimiento de las plantas.

RC₅₀: Reducción del crecimiento del 50% del crecimiento de las plantas.

RC₈₀: Reducción del crecimiento del 80% del crecimiento de las plantas.

RC₉₀: Reducción del crecimiento del 90% del crecimiento de las plantas.

Ejemplo F. Evaluación de la actividad herbicida de post-emergencia en arroz de siembra directa

Se plantaron semillas o núculas de las especies de plantas de ensayo deseadas en una matriz de suelo preparada mezclando un suelo franco (43 por ciento de limo, 19 por ciento de arcilla y 38 por ciento de arena, con un pH de aproximadamente 8,1 y un contenido de materia orgánica de aproximadamente 1,5 por ciento) y arena de río a una razón de 80 a 20. La matriz del suelo estaba contenida en macetas de plástico con un área de superficie de 139,7

cm². Cuando fue necesario para asegurar una buena germinación y plantas sanas, se aplicó un tratamiento con fungicidas y/u otro tratamiento químico o físico. Las plantas se cultivaron durante 10-17 d en un invernadero con un fotoperíodo de aproximadamente 14 h que se mantuvo a aproximadamente 29°C durante el día y 26°C durante la noche. Los nutrientes y el agua se agregaron de manera regular y se proporcionó iluminación adicional con lámparas de 1000 vatios halógenas suspendidas, según sea necesario. Las plantas se emplearon para el ensayo cuando alcanzaron fase de segunda o tercera hoja verdadera.

Se colocó una cantidad ponderada, determinada por la tasa más alta que se iba a someter a ensayo, de cada compuesto de ensayo en viales de vidrio de 25 mL y se disolvió en un volumen de 97:3 v/v de acetona-DMSO para obtener soluciones de partida 12X. Si el compuesto de ensayo no se disolvía fácilmente, la mezcla se calentó y/o se sometió a sonicación. Las soluciones de partida concentradas se agregaron a las soluciones de pulverización de manera que las concentraciones finales de acetona y DMSO fueran 16,2% y 0,5%, respectivamente. Las soluciones de pulverización se diluyeron a las concentraciones finales apropiadas con la adición de 10 mL de una mezcla acuosa de producto concentrado de aceite de cultivo Agri-dex al 1,5% (v/v). Las soluciones de pulverización finales contenían producto concentrado de aceite de cultivo Agri-dex al 1,25% (v/v). Los requisitos de los compuestos se basan en un volumen de aplicación de 12 mL a una tasa de 187 l/ha. Los compuestos formulados se aplicaron al material vegetal con un pulverizador de riel Mandel suspendido equipado con boquillas 8002E calibradas para suministrar 187 L/ha sobre un área de aplicación de 0,503 metros cuadrados (m²) a una altura de pulverización de 43 cm (18 pulgadas) por encima de la altura del dosel vegetal promedio. Las plantas de control se pulverizaron de la misma manera con el blanco de disolvente.

Las plantas tratadas y las plantas de control se colocaron en un invernadero como se describió anteriormente y se regaron mediante subirrigación para evitar el lavado de los compuestos de ensayo. Después de 20-22 d, se determinó visualmente el estado de las plantas de ensayo, en comparación con el de las plantas no tratadas, y se calificó en una escala de 0 a 100 por ciento, donde 0 corresponde a ninguna lesión y 100 corresponde a la destrucción completa y se presenta como se indica en la tabla A.

Aplicando el análisis probit bien aceptado según lo descrito por J. Berkson en *Journal of the American Statistical Society*, 48, 565 (1953) y por D. Finney en "*Probit Analysis*" Cambridge University Press (1952), se puede utilizar la lesión por herbicida de un compuesto específico a diferentes tasas para calcular los valores de RC₂₀, RC₅₀, RC₈₀ y RC₉₀, que se definen como factores de reducción del crecimiento que corresponden a la dosis eficaz de herbicida requerida para proporcionar una reducción del crecimiento de las plantas (RC) de 20 por ciento, 50 por ciento, 80 por ciento y 90 por ciento, respectivamente. El análisis Probit se aplicó a los datos recopilados a partir de tasas de dosis múltiples de compuestos individuales utilizando los procedimientos explicados en los siguientes ejemplos. Los datos de algunas de las tasas de dosis y el análisis de todas las tasas de dosis se recogen en las siguientes tablas.

Algunas de las tasas y proporciones de aplicación empleadas, las especies de plantas sometidas a ensayo y los resultados se proporcionan en la Tabla 13.

Tabla 13: Actividad de compuestos herbicidas en arroz de siembra directa

Núm. Comp.	Tasa de aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación						
		BRAPP	CYPSS	ECHSS	LEFSS	SCPJU	SEBEX	ORYSS
216	35	B	B	B	B	A	A	G
	70	B	B	A	A	A	A	G
	RC ₂₀	--	--	-	-	--	--	>70
	RC ₅₀	8	10	4	8	1	1	--
	RC ₈₀	27	70	15	23	1	1	--
217	35	A	A	A	A	A	A	E
	70	A	A	A	A	A	A	C
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	10
	RC ₅₀	3	5	1	1	1	1	--
	RC ₈₀	5	11	1	3	1	1	--
135	35	B	C	C	G	B	A	G

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	Tasa aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación						
		BRAPP	CYPSS	ECHSS	LEFSS	SCPJU	SEBEX	ORYSS
	70	B	B	C	D	A	A	G
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	>70
	RC ₅₀	4	5	17	57	2	1	--
	RC ₈₀	11	49	70	114	5	1	--
165	35	B	C	B	G	n/t	A	G
	70	A	C	A	A	n/t	A	F
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	44
	RC ₅₀	12	19	10	24	--	1	--
	RC ₈₀	27	67	24	56	--	1	--
134	35	A	A	A	A	n/t	A	D
	70	A	A	A	A	A	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	5
	RC ₅₀	3	6	1	6	1	1	--
	RC ₈₀	12	13	1	15	1	1	--
122	35	C	A	C	G	A	A	G
	70	B	A	B	G	A	A	G
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	70
	RC ₅₀	5	1	6	>70	1	1	--
	RC ₈₀	42	1	47	>70	1	1	--
8	35	A	A	A	G	A	A	C
	70	A	A	A	F	A	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	2
	RC ₅₀	4	1	2	>70	1	3	--
	RC ₈₀	9	1	6	>70	1	5	--
58	35	G	A	G	G	A	A	G
	70	G	A	G	E	A	A	G
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	>70
	RC ₅₀	>70	4	>70	>70	5	2	--
	RC ₈₀	>70	8	>70	>70	8	4	--
146	35	D	A	B	G	A	A	F
	70	A	A	B	C	A	A	D
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	18
	RC ₅₀	8	1	17	44	1	3	--

ES 2 706 504 T3

Núm. Comp.	Tasa aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación						
		BRAPP	CYPSS	ECHSS	LEFSS	SCPJU	SEBEX	ORYSS
	RC ₈₀	29	1	32	87	1	4	--
47	35	F	A	F	C	A	A	G
	70	F	A	G	G	A	A	G
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	>70
	RC ₈₀	>70	1	>70	>70	1	1	-
	RC ₈₀	>70	3	>70	>70	1	1	--
125	35	E	A	E	E	A	A	G
	70	D	A	D	D	A	A	G
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	0
	RC ₅₀	46	4	40	43	1	1	--
	RC ₈₀	>70	10	>70	>70	1	1	--
159	35	A	A	A	A	A	A	E
	70	A	A	A	A	A	A	D
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	12
	RC ₅₀	3	2	2	12	1	1	--
	RC ₈₀	8	5	4	19	1	1	--
124	35	A	A	A	A	A	A	D
	70	A	A	A	A	A	A	B
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	1
	RC ₅₀	4	1	2	7	1	1	--
	RC ₈₀	8	1	6	16	1	1	--
96	35	D	A	E	B	A	A	G
	70	B	A	B	C	A	A	G
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	130
	RC ₅₀	19	3	29	27	1	1	--
	RC ₈₀	58	6	84	58	1	1	--
173	35	C	A	C	E	A	A	E
	70	A	A	A	A	A	A	D
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	16
	RC ₅₀	8	2	12	24	1	1	--
	RC ₈₀	26	4	33	47	1	1	--
93	35	A	A	A	A	A	A	E
	70	A	A	A	A	A	A	D

Núm. Comp.	Tasa aplicación (g ia/ha)	Reducción de crecimiento visual (%) 21 días después de la aplicación						
		BRAPP	CYPSS	ECHSS	LEFSS	SCPJU	SEBEX	ORYSS
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	13
	RC ₅₀	1	1	1	6	1	1	--
	RC ₈₀	1	2	1	11	1	1	--
74	35	A	A	A	A	A	A	D
	70	A	A	A	A	A	A	D
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	4
	RC ₅₀	1	5	1	6	1	1	--
	RC ₈₀	5	10	1	13	1	1	--
11	35	D	A	B	G	A	A	F
	70	B	A	A	G	A	A	E
	RC ₂₀	--	--	--	--	--	--	25
	RC ₅₀	13	1	11	175	1	3	--
	RC ₈₀	44	1	25	463	1	7	--

BRAPP: pasto bandera (*Brachiaria platyphylla*)

CYPSS: juncia, incluyendo la juncia de agua (*Cyperus difformis*), chufa (*Cyperus esculentus*), juncia de los arrozales (*Cyperus iria*)

ECHSS: incluyendo cerreig, (*Echinochloa crus-galli*), arrozillo silvestre, (*Echinochloa colonum*)

LEFSS: Leptochloa, incluida la cola china (*Leptochloa chinensis*), cola verde (*Leptochloa dubia*)

SCPJU: espadaña japonesa, *Schoenoplectus juncooides*

SEBEX: cáñamo (*Sesbania exaltata*)

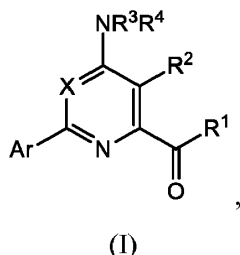
ORYSS: *Oryza sativa*

nt: no sometido a ensayo

g ia/ha: gramos de ingrediente activo por hectárea

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



en donde

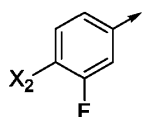
5 X es N o CY; en donde Y es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil(C₁-C₃)tio, o haloalquil(C₁-C₃)tio;

R¹ es OR^{1'}, en donde R^{1'} es H, alquilo C₁-C₈, o arilalquilo C₇-C₁₀;

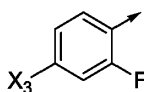
10 R² es F, Cl, Br, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil(C₁-C₄)tio, haloalquil(C₁-C₄)tio, amino, alquil(C₁-C₄)amino, haloalquil(C₂-C₄)amino, formilo, (alquil C₁-C₃)carbonilo, (haloalquil C₁-C₃)carbonilo, ciano o un grupo de fórmula-CR¹⁷=CR¹⁸-SiR¹⁹R²⁰R²¹, en donde R¹⁷ es hidrógeno, F, o Cl; R¹⁸ es hidrógeno, F, Cl, alquilo C₁-C₄, o haloalquilo C₁-C₄; y R¹⁹, R²⁰ y R²¹ son cada uno independientemente alquilo C₁-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₁₀, halocicloalquilo C₃-C₆, fenilo, fenilo sustituido, alcoxi C₁-C₁₀, u OH;

15 R³ y R⁴ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, haloalquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, formilo, (alquil C₁-C₃)carbonilo, (haloalquil C₁-C₃)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquil C₁-C₆)carbamillo, (alquil C₁-C₆)sulfonilo, tri(alquil C₁-C₆)sililo, di(alquil C₁-C₆)fosfonilo, o R³ y R⁴ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo saturado de 5 o 6 miembros, o R³ y R⁴ en conjunto representan =CR^{3'}R^{4'}, donde R^{3'} y R^{4'} son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, o (alquil C₁-C₆)amino, o R^{3'} y R^{4'} junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo saturado de 5- o 6- miembros;

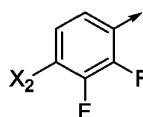
Ar es Ar₂, Ar₃, Ar₄, Ar₅ o Ar₆:



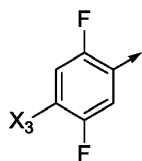
Ar₂



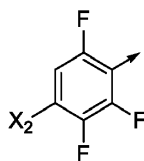
Ar₃



Ar₄



Ar₅



Ar₆

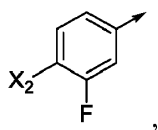
en donde

25 X₂ es H, F, Br, I, etinilo, haloetinilo, CH₃, CFH₂, CF₂H, CF₃, OCF₂H, OCF₃, CN, CONH₂, CO₂H, o NO₂;

X₃ es H, F, Br, I, etinilo, haloetinilo, CH₃, CFH₂, CF₂H, CF₃, OCF₂H, OCF₃, CN, CONH₂, CO₂H, o NO₂;

en donde

a) cuando Ar es



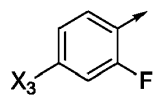
en ese caso X es N, CH, CF, CCl o CCH₃;

con las condiciones de que:

i) R² no es Cl, cuando X es N;

ii) X₂ no es Br, I o CF₃, cuando R² es OCH₃ y X es CF; y

b) cuando Ar es



en ese caso X es N, CH o CF;

con las condiciones de que:

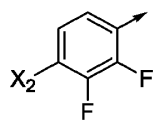
i) R² no es Cl, cuando X es N;

ii) X₃ no es CH₃, cuando R² es OCH₃ y X es N;

iii) X₃ no es H, F o CH₃, cuando R² es Cl y X es CH;

iv) X₃ no es Br o I, cuando R² es OCH₃ y X es CF; y

c) cuando Ar es



en ese caso X es N, CH o CF;

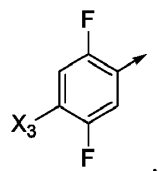
con las condiciones de que:

i) R² no es Cl, cuando X es N;

ii) X₂ no es F, cuando R² es Cl y X es CH;

iii) X₂ no es Br, I o CF₃, cuando R² es OCH₃ y X es CF;

d) cuando Ar es



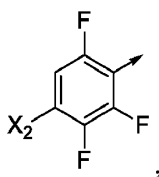
en ese caso X es N, CH o CF;

con la condición de que

i) X₃ no es CH₃, cuando R² es Cl y X es N;

ii) X₃ no es Br o I, cuando X es CF y R² es OCH₃; y

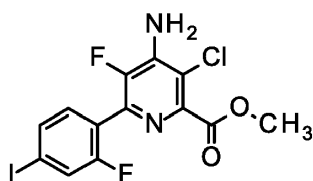
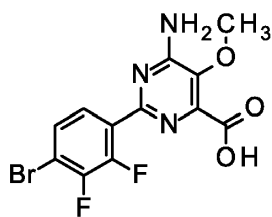
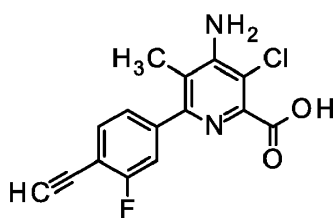
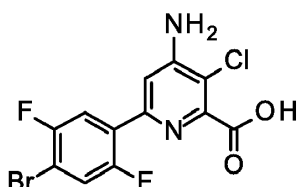
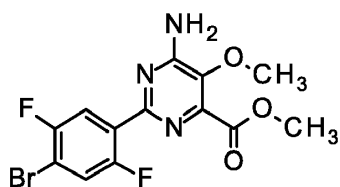
e) cuando Ar es

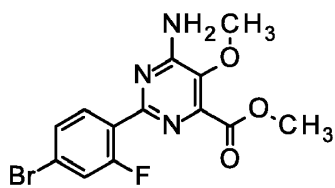
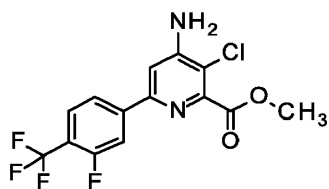
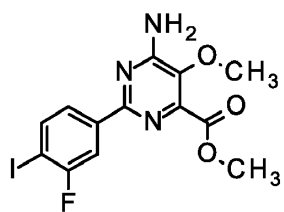
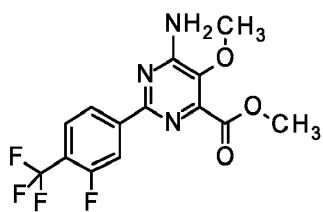
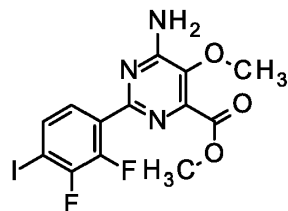
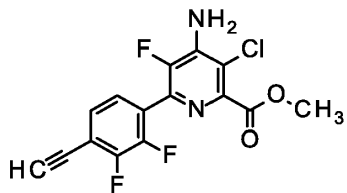
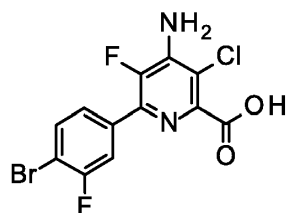
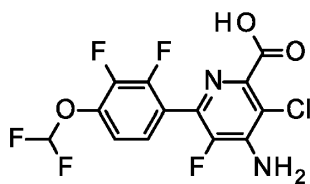
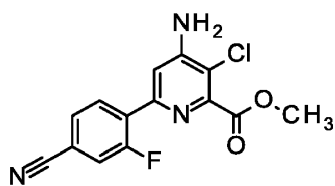
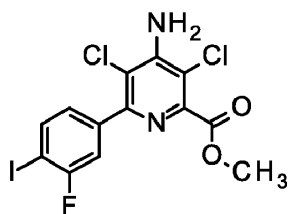
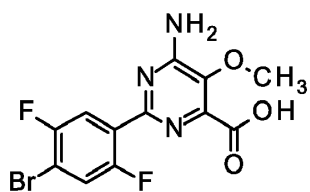


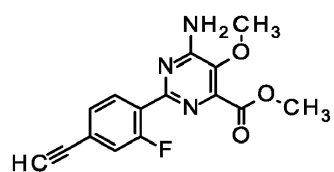
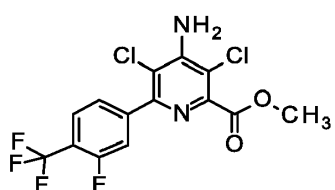
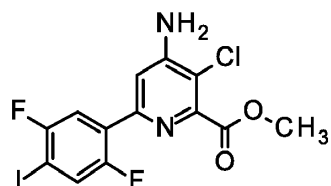
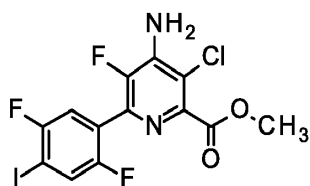
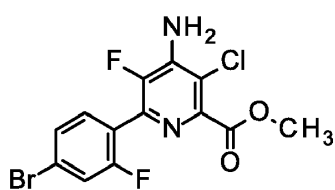
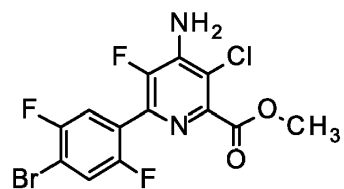
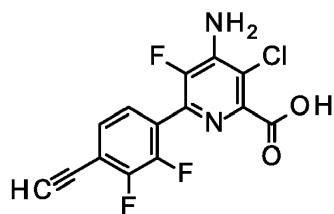
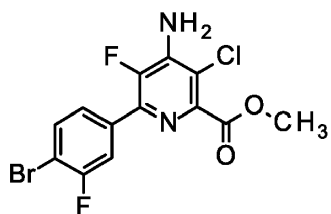
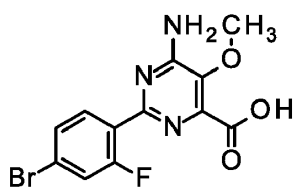
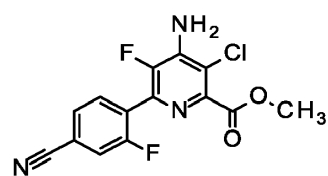
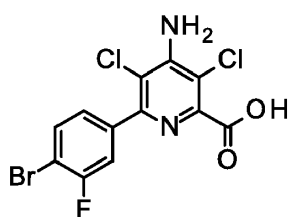
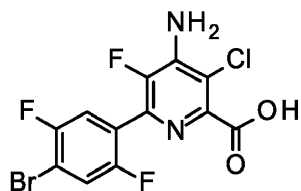
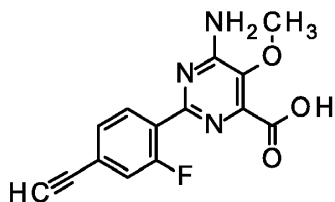
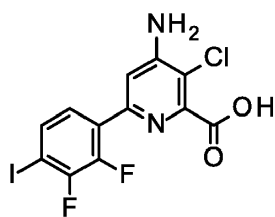
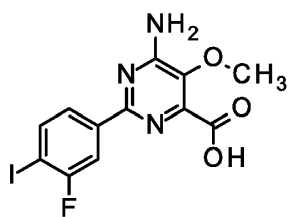
en ese caso X es N, CH o CF;

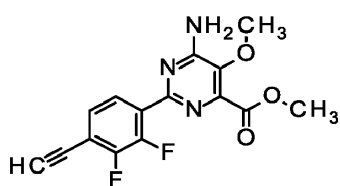
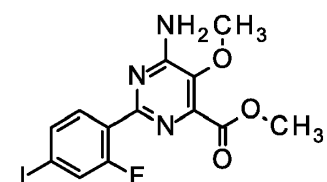
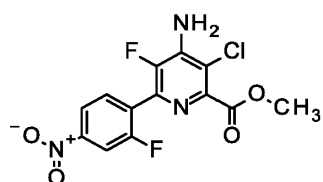
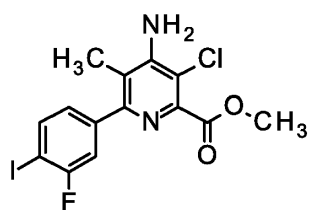
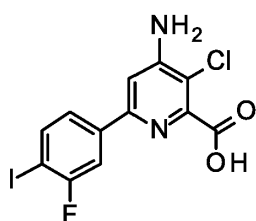
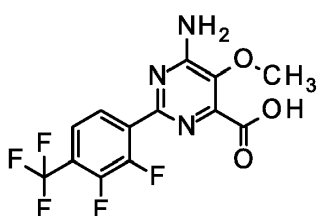
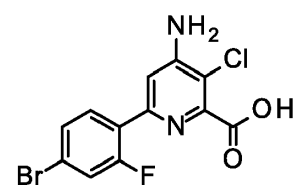
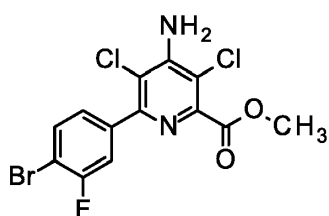
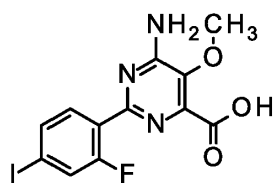
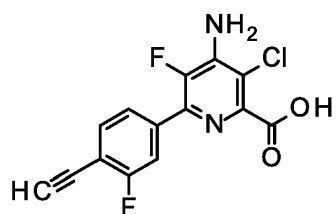
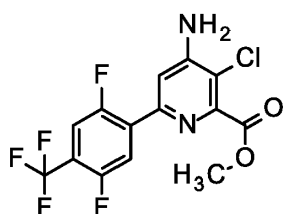
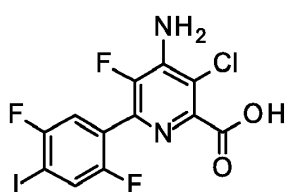
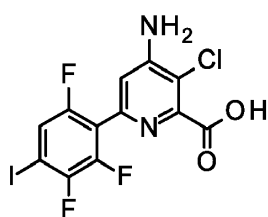
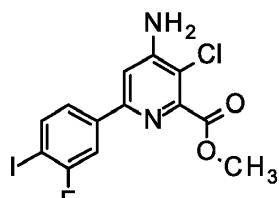
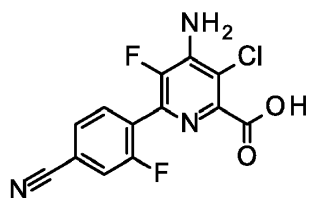
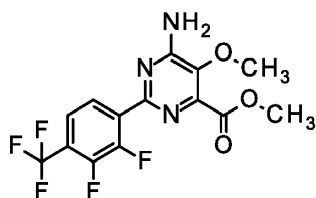
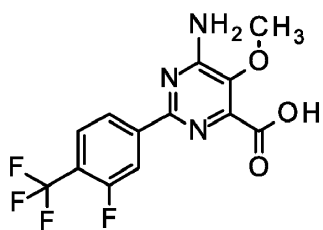
o un N-óxido o una sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola.

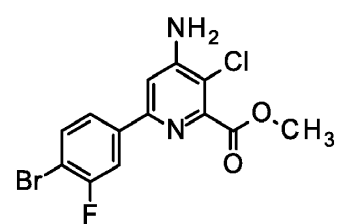
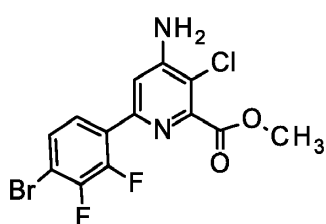
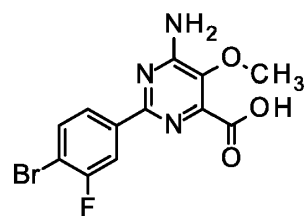
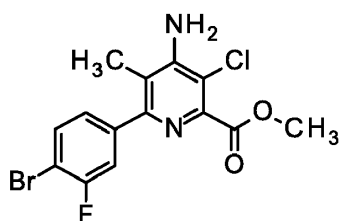
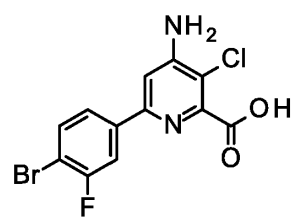
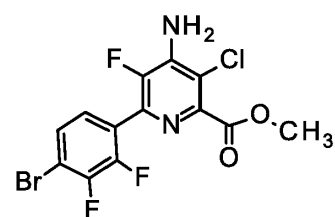
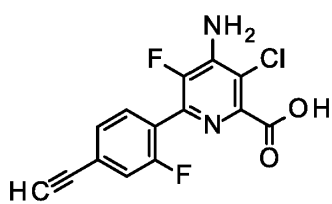
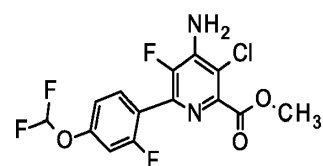
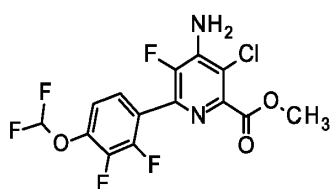
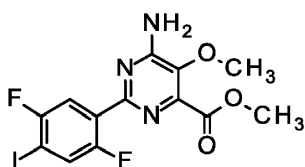
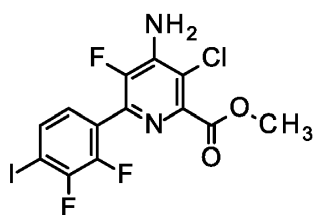
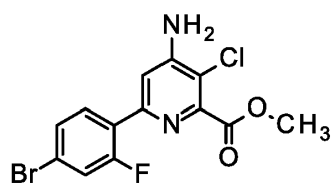
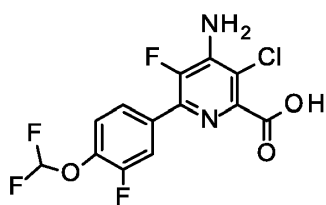
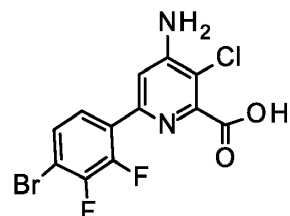
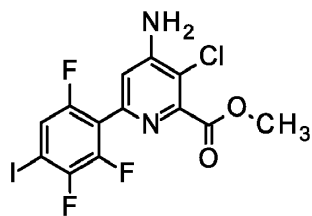
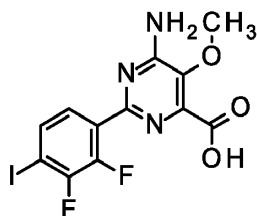
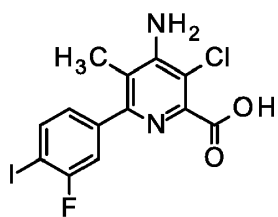
2. El compuesto de la reivindicación 1, en donde Ar es Ar2 y X₂ es preferiblemente H, Br, I, etinilo, CH₃, CF₂H, CF₃, OCF₂H, o CN.
3. El compuesto de la reivindicación 1, en donde Ar es Ar3 y X₃ es preferiblemente H, Br, I, etinilo, OCF₂H, CN o NO₂.
4. El compuesto de la reivindicación 1, en donde Ar es Ar4 y X₂ es preferiblemente H, F, Br, I, etinilo, CH₃, CF₃, OCF₂H, o CN.
5. El compuesto de la reivindicación 1, en donde Ar es Ar5 y X₃ es preferiblemente H, F, Br, I, CH₃, CF₂H, CF₃, OCF₂H, o CN.
6. El compuesto de la reivindicación 1, en donde Ar es Ar6 y X₂ es preferiblemente Br o I.
7. El compuesto de la reivindicación 1, en donde R¹ es OR^{1'}.
8. El compuesto de la reivindicación 1, en donde X es N.
9. El compuesto de la reivindicación 1, en donde X es CY.
10. El compuesto de la reivindicación 1, en donde R² es F, Cl, Br, haloalquenilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil(C₁-C₄)tio, o (haloalquil C₁-C₄)tio.
11. El compuesto de la reivindicación 1, en donde R³ y R⁴ son hidrogeno.
12. El compuesto de la reivindicación 1 o un N-óxido o una sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola, en donde el compuesto es:

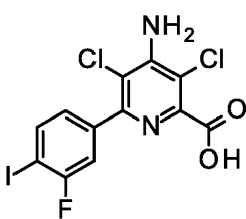
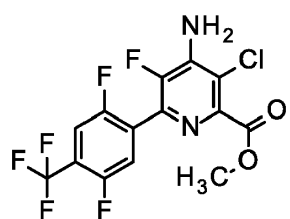
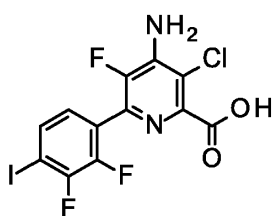
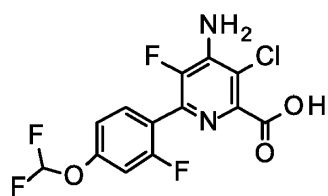
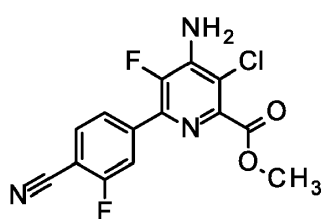
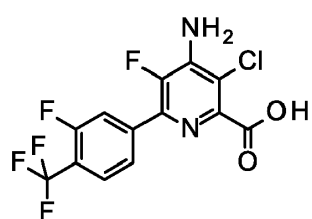
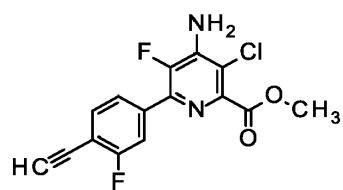
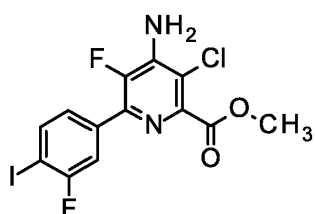
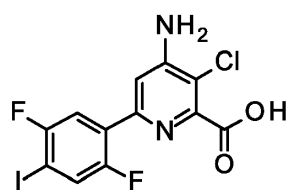
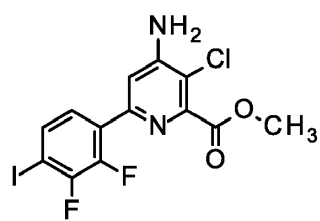
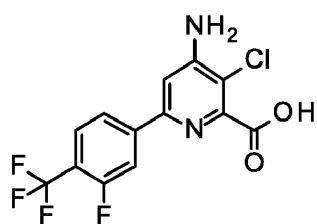
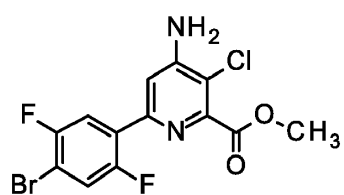
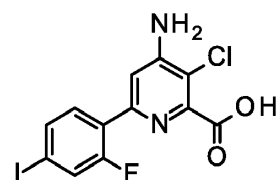
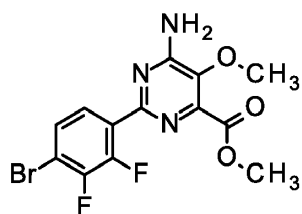
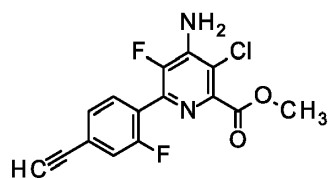
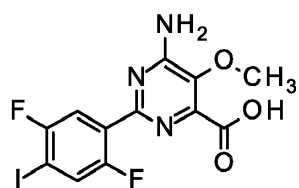


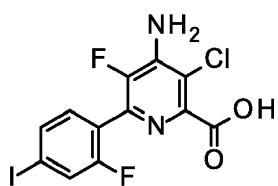
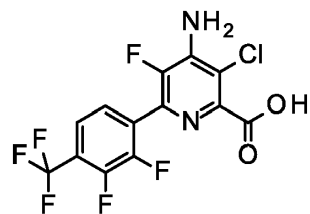
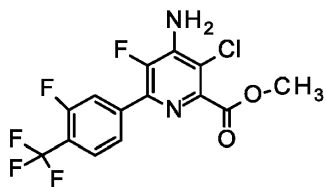
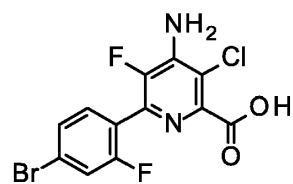
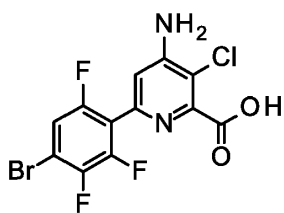
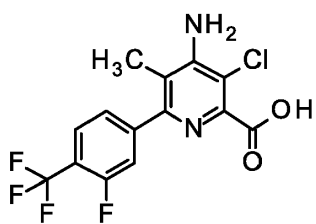
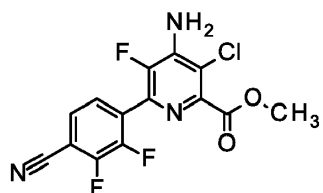
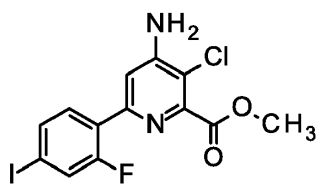
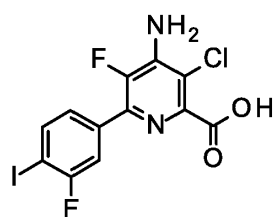
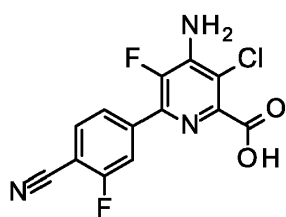
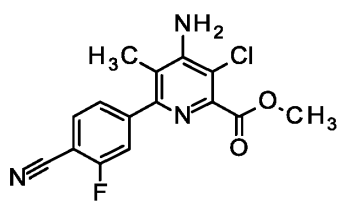
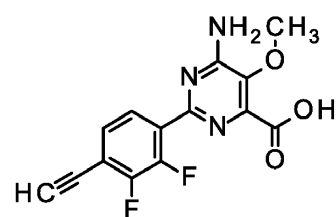
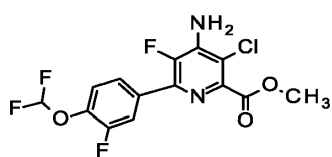
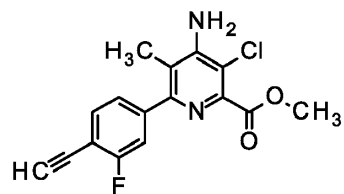
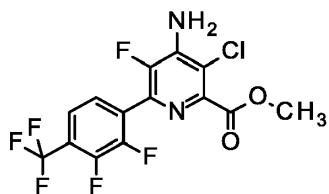
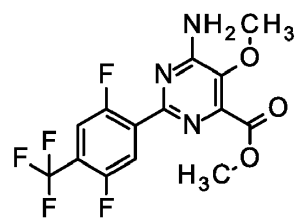
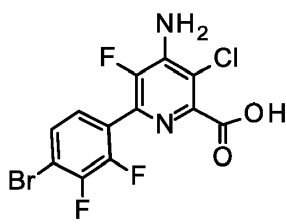
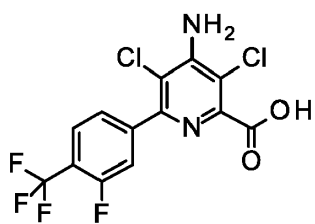


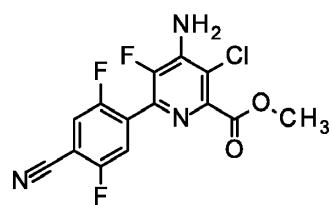
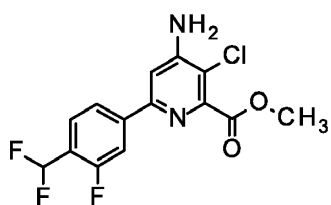
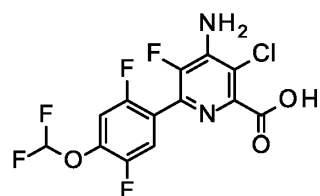
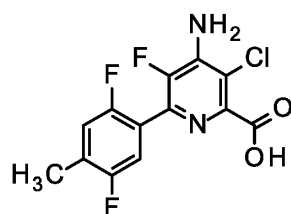
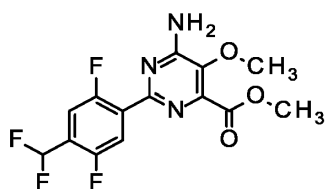
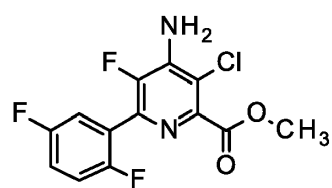
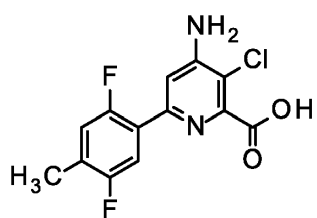
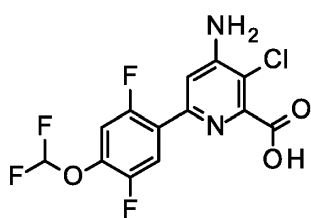
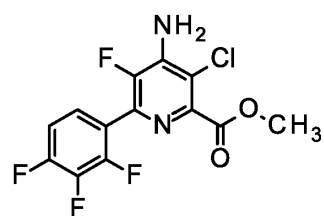
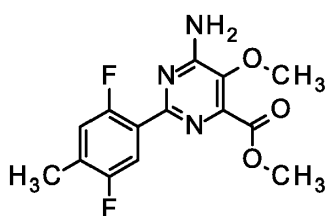
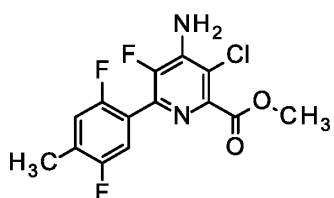
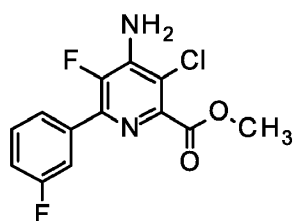
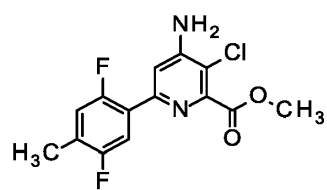
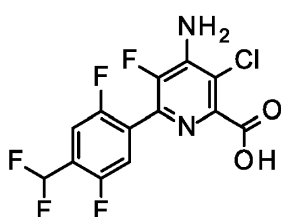
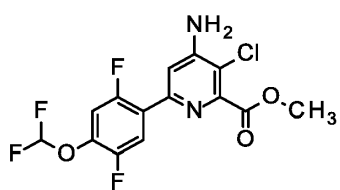
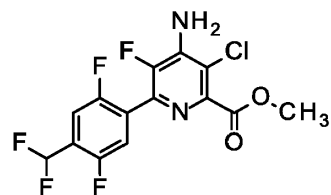
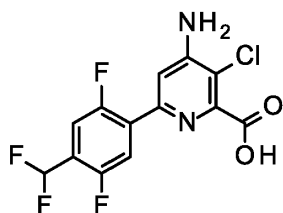
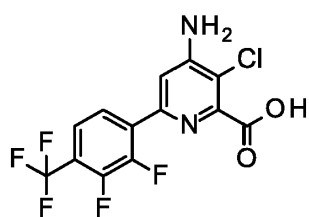
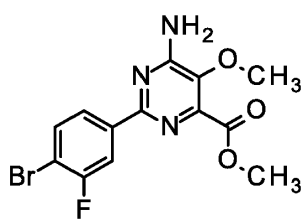


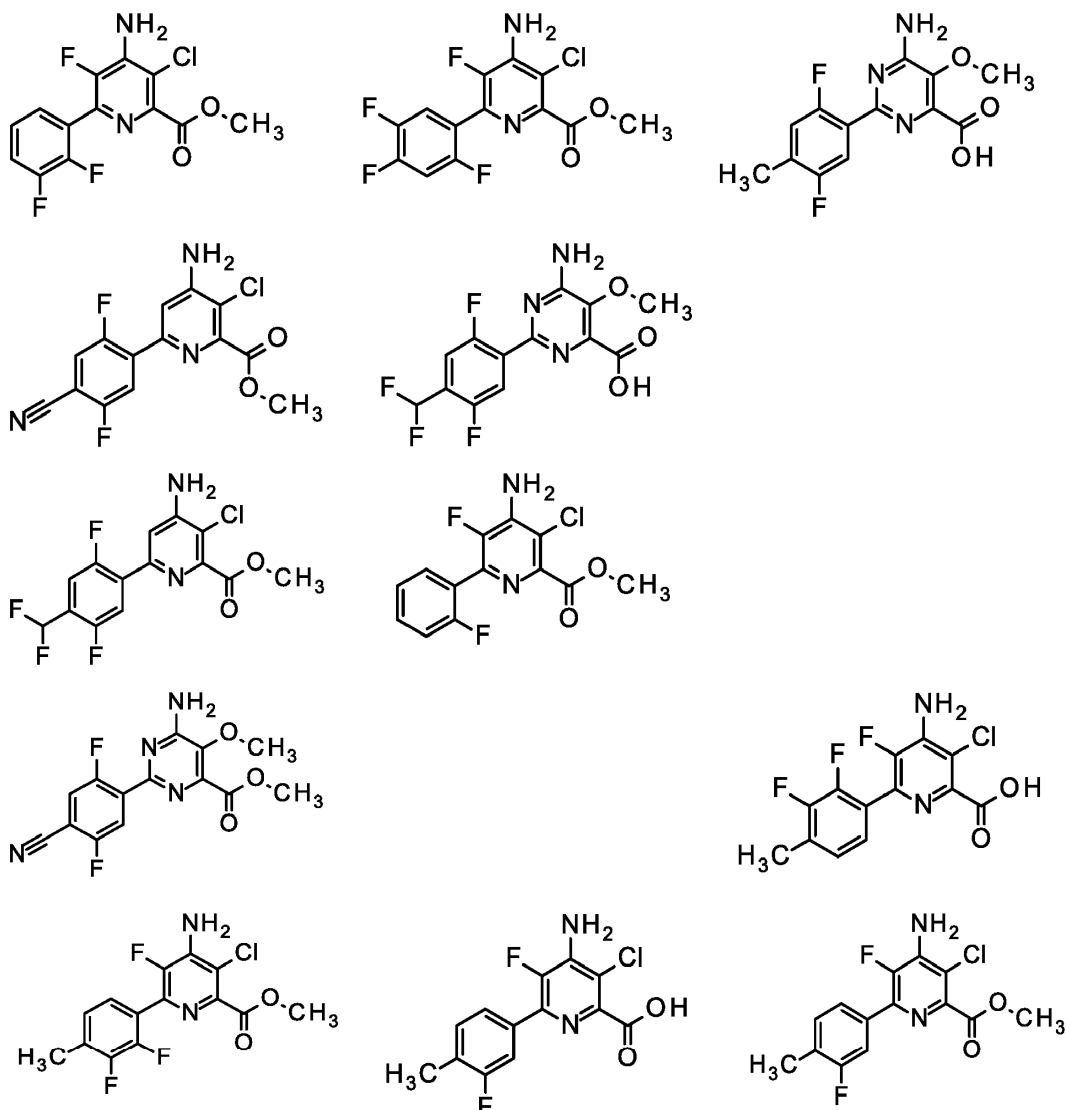












5

13. Una composición herbicida que comprende el compuesto de la reivindicación 1 o un N-óxido o una sal del mismo aceptable desde el punto de vista agrícola, y un coadyuvante o portador aceptable desde el punto de vista agrícola, que comprende preferiblemente adicionalmente al menos al menos un compuesto herbicida adicional y/o un agente protector.

10

14. Un método para controlar la vegetación no deseable, que comprende aplicar el compuesto de la reivindicación 1, o la composición de la reivindicación 13.