



MD 4259 C1 2014.07.31

## REPUBLICA MOLDOVA



(19) Agenția de Stat  
pentru Proprietatea Intelectuală

(11) **4259** (13) **C1**  
(51) Int.Cl: *C07D 231/20* (2006.01)  
*C07C 69/96* (2006.01)  
*A01N 43/56* (2006.01)  
*A01N 47/06* (2006.01)  
*A01P 13/00* (2006.01)

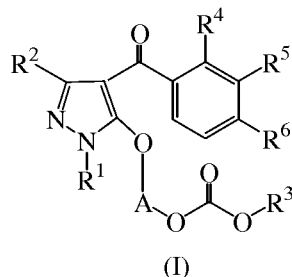
**(12) BREVET DE INVENȚIE**

<p>(21) Nr. depozit: a 2009 0049 (22) Data depozit: 2007.11.09</p> <p>(31) Nr.: 2006-319579 (32) Data: 2006.11.28 (33) Țara: JP</p> <p>(41) Data publicării cererii: 2010.10.31</p>	<p>(45) Data publicării hotărârii de acordare a brevetului: 2013.11.30, BOPI nr. 11/2013</p> <p>(85) <b>2009.05.05</b></p> <p>(86) PCT/JP2007/072239, 2007.11.09</p> <p>(87) WO 2008/065907 A1, 2008.06.05</p>
<p>(71) Solicitant: ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD, JP</p> <p>(72) Inventatori: KOMYOJI Terumasa, JP; TSUKAMOTO Masamitsu, JP; KIKUGAWA Hiroshi, JP; HATA Hiroshi, JP</p> <p>(73) Titular: ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD, JP</p> <p>(74) Mandatar autorizat : SOKOLOVA Sofia</p>	

**(54) Compuși benzoilpirazolici, procedeu de preparare a lor și erbicide care le conțin****(57) Rezumat:**

Invenția se referă la un erbicid nou, care manifestă un spectru larg de activitate și poate fi utilizat la tratarea suprafețelor agricole și neagricole, prin diverse metode, inclusiv tratamentul solului și tratamentul foliar.

Se revendică un compus benzoilpirazolic cu formula (I) sau o sare a lui:



unde: R<sup>1</sup> este alchil, R<sup>2</sup> – un atom de hidrogen sau alchil, R<sup>3</sup> – alchil, R<sup>4</sup> – alchil sau halogen, R<sup>5</sup> – alchil substituit cu un Y<sup>1</sup>, haloalcoxi, alcoxi substituit cu un Y<sup>2</sup> sau alcoxycarbonil, R<sup>6</sup> – alchilsulfonil, A – grupa -CH(CH<sub>3</sub>)-, Y<sup>1</sup> – alcoxi sau haloalcoxi și Y<sup>2</sup> – alcoxi; un procedeu de preparare; un erbicid care îl conține în calitate de ingredient activ și o metodă de combatere a plantelor nedorite sau de inhibare a creșterii lor, care presupune aplicarea unei cantități efective de erbicid pe plantele nedorite sau la locul creșterii lor.  
Revendicări: 10

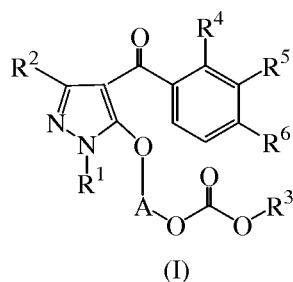
MD 4259 C1 2014.07.31

## (54) Benzoylpyrazole compounds, process for their production and herbicides containing them

### (57) Abstract:

The invention relates to a novel herbicide, showing excellent herbicidal effects, which has a wide application range including agricultural and non-agricultural fields and various application methods including soil and foliage treatment.

A benzoylpyrazole compound is claimed represented by the formula (I) or its salt:



wherein:  $R^1$  is alkyl,  $R^2$  is a hydrogen atom or alkyl,  $R^3$  is alkyl,  $R^4$  is alkyl or halogen,  $R^5$  is alkyl substituted by one  $Y^1$ , haloalkoxy, alkoxy substituted by one  $Y^2$ , or alkoxycarbonyl,  $R^6$  is alkyl sulfonyl, A is  $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$  group,  $Y^1$  is alkoxy or haloalkoxy, and  $Y^2$  is alkoxy; a process for its production; a herbicide containing it as an active ingredient; and a method for controlling undesired plants or inhibiting their growth, which comprises applying a herbicidally effective amount thereof to the undesired plants or to a place where they grow.

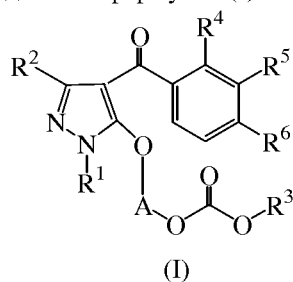
Claims: 10

## (54) Бензилпиразоловые соединения, способ их получения и гербициды их содержащие

### (57) Реферат:

Изобретение относится к новому гербициду, который проявляет широкий спектр активности и может быть использован для обработки сельскохозяйственных и несельскохозяйственных площадей, различными способами, включая обработку почвы и листьев.

Заявляется бензилпиразоловое соединение формулой (I) или его соль:



где:  $R^1$  алкил,  $R^2$  атом водорода или алкил,  $R^3$  алкил,  $R^4$  алкил или галоген,  $R^5$  алкил замещенный на  $Y^1$ , галоалкокси, алкокси замещенный на  $Y^2$ , или алкоксикарбонил,  $R^6$  алкилсульфонил, A группа  $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ ,  $Y^1$  алкокси или галоалкокси и  $Y^2$  алкокси; способ получения; гербицид содержащий его в качестве активного ингредиента и способ борьбы с нежелательными растениями или ингибирования их роста, который предусматривает нанесение эффективного количества гербицида на нежелательные растения или на место их произрастания.

П. формулы: 10

**Descriere:**

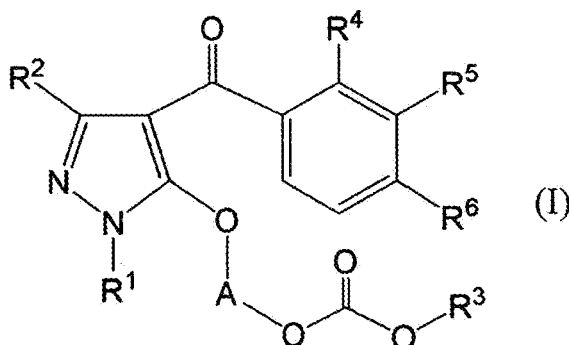
Invenția se referă la un erbicid nou, care manifestă un spectru larg de activitate și poate fi utilizat la tratarea suprafețelor agricole și neagricole, prin diverse metode, inclusiv tratamentul solului și tratamentul foliar.

5 Documentele [1] și [2] dezvăluie compuși de benzoilpirazol. Totuși, compușii de benzoilpirazol prezentați prin formula de mai jos (I) nu sunt dezvăluiți în mod special în aceste documente.

10 Anterior, pentru reducerea volumului de muncă în activitatea de combatere a buruienilor și pentru sporirea productivității plantelor agricole și horticole se dorea obținerea unor erbicide cu acțiune excelentă împotriva buruienilor și inofensive pentru plantele de cultură. În scopul obținerii unor erbicide noi pe viitor se dorește elaborarea unor compuși capabili de a manifesta acțiuni erbicide scontate, asigurându-se totodată ca dozele lor să fie mici. Suplimentar se dorește elaborarea unor compuși care nu vor rămâne în sol mai mult timp decât e necesar pentru manifestarea efectelor reziduale practice, precum și a unor compuși maximal inofensivi pentru animale. Totuși, depistarea compușilor noi care să corespundă acestor scopuri depinde de metoda încercărilor și greșelilor.

Autorii prezentei invenții au efectuat studii intensive referitor la compușii de benzoilpirazol în scopul obținerii celor mai excelente erbicide pentru rezolvarea problemei propuse și ca urmare au realizat prezenta invenție.

20 În special, prezenta invenție se referă la un compus de benzoilpirazol reprezentat prin formula (I) sau o sare a sa:



25 in care R<sup>1</sup> este alchil, R<sup>2</sup> - un atom de hidrogen sau alchil, R<sup>3</sup> - alchil, R<sup>4</sup> - alchil sau halogen, R<sup>5</sup> - alchil substituit cu un Y<sup>1</sup>, haloalcoxi, alcoxi substituit cu un Y<sup>2</sup>, sau alcoxycarbonil, R<sup>6</sup> - alchilsulfonil, A - grupa -CH(CH<sub>3</sub>)-, Y<sup>1</sup> - alcoxi sau haloalcoxi și Y<sup>2</sup> - alcoxi; la un procedeu de preparare a lui; un erbicid care îl conține în calitate de ingredient activ și o metodă de combatere a plantelor nedorite sau de inhibare a creșterii lor, care presupune aplicarea unei cantități efective de erbicid plantelor nedorite sau la locul creșterii lor.

30 Compușii reprezentați prin formula (I) dau dovadă de o îmbunătățire remarcabilă în ce privește activitățile erbicide împotriva buruienilor în comparație cu compușii convenționali de tip similar și de o inofensivitate înaltă pentru plantele de cultură.

35 În formula (I), alchil sau catena alchil poate fi liniară sau ramificată, iar exemplele specifice ale acestor radicali cuprind alchil C<sub>1-9</sub>, cum ar fi metil, etil, n-propil, izo-propil, n-butil, izo-butil, sec-butil, terț-butil, n-pentil, izo-pentil, neopentil, terț-pentil, n-hexil, izo-hexil, n-heptil, n-octil și n-nonil.

În formula (I), halogenul sau halogen în calitate de substituent poate fi un atom de fluor, clor, brom sau iod. Numărul de halogeni în calitate de substituenți poate fi unul sau mai mulți, iar în cazul în care sunt mai mulți, aceștia pot fi aceiași sau diferiți. Suplimentar, pozițiile de substituție a acestor halogeni pot fi oricare.

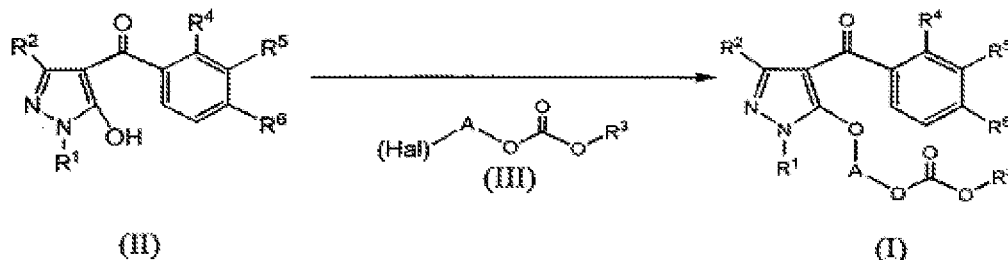
40 În formula (I), catena alchilenă poate fi o alchilenă C<sub>1-9</sub>, cum ar fi metilen, etilenă, trimetilen, tetrametilen, pentametilen, hexametilen, heptametilen, octametilen sau nonametilen.

45 Sarea compusului de benzoilpirazol reprezentată prin formula (I) cuprinde toate tipurile de săruri cu condiția că ele sunt acceptabile agricol. Exemple ale acestora cuprind săruri de metale alcaline, cum ar fi sarea de sodiu și sarea de potasiu; săruri de metale alcalino-pământoase, cum ar fi sarea de magneziu și sarea de calciu; săruri de amine, cum ar fi sarea de dimetilamină și sarea de trietilamină; săruri de acizi anorganici, cum ar fi clorhidrat, perclorat, sulfat și nitrat, și săruri de acizi organici, cum ar fi acetat și metansulfonat.

În compușii de benzoilpirazol reprezentați prin formula (I), pot fi prezenți și izomeri optici, iar prezenta invenție cuprinde toți acești izomeri. În prezenta invenție compusul este descris ca un amestec de izomeri, dacă nu se indică altfel.

5 Compusul de benzoilpirazol reprezentat prin formula (I) sau sarea sa (denumiți în continuare compus conform prezentei invenții) pot fi preparați prin următoarea reacție (A) în conformitate cu un procedeu uzual de preparare a sării.

(A)



in care  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  și A sunt așa cum sunt definiți mai sus, iar Hal este halogen.

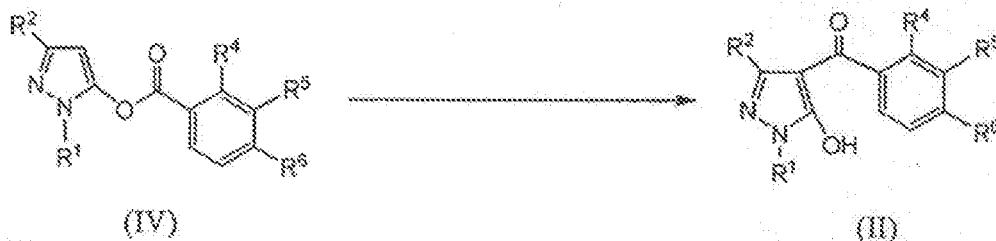
10 Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui solvent, după caz, care poate fi orice solvent inert pentru reacție. Acesta poate fi, de exemplu, o cetonă, cum ar fi acetona, etil metil cetona sau dietil cetona; o hidrocarbură halogenată, cum ar fi clorura de metilen, cloroform, diclorețan sau triclorețan; o hidrocarbură aromatică, cum ar fi benzen, toluen, xilen sau nitrobenzen; un ester, cum ar fi acetat de metil, acetat de etil sau acetat de propil; un solvent aprotic polar, cum ar fi acetonitril, N,N-dimetilformamidă (DMF), dimetilsulfoxid (DMSO), dimetilacetamidă (DMA), triamida acidului hexametil fosforic (HMPA) sau sulfolan; sau un  
15 eter, cum ar fi dietil eter, dioxan, tetrahidrofuran (THF) sau dimetoxietan. În calitate de solvent, unul sau mai mulți dintre ei pot fi selectați corespunzător.

20 Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unei baze, după caz, care poate fi o bază anorganică sau o bază organică. Bază organică poate fi, de exemplu, o amină terțiară, cum ar fi trietilamina sau diizopropiletilamina; piridina, 4-(dimetilamino)piridina, sau 2,6-lutidina. Bază anorganică poate fi, de exemplu, un carbonat de metal alcalin, cum ar fi carbonat de sodiu sau carbonat de potasiu; un hidrogenocarbonat de metal alcalin, cum ar fi hidrogenocarbonat de sodiu sau hidrogenocarbonat de potasiu; un carbonat de metal alcalino-pământos, cum ar fi carbonat de calciu sau carbonat de bariu; un hidroxid de metal alcalin, cum ar fi hidroxid de sodiu sau  
25 hidroxid de potasiu; sau o cianură de metal alcalin, cum ar fi cianura de sodiu sau cianura de potasiu. În ce privește aceste baze una sau mai multe dintre ele pot fi corespunzător selectate și amestecate pentru utilizare, în cantități de la 0,01 până la 100 părți echivalente, cu compusul cu formula (II).

30 Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui catalizator, cum ar fi, de exemplu, bromura de n-butil amoniu, clorura de n-butil amoniu, bromura de tetra-n-butilfosfoniu, iodura de sodiu sau iodura de potasiu.

Reacția de mai sus poate fi realizată la o temperatură de reacție de obicei de la 0 până la 150°C cu durata de reacție de obicei de la 1 minut până la 48 ore.

35 Compusul reprezentat prin formula (II) poate fi preparat în conformitate cu următoarea reacție (B):



in care  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  și  $R^6$  sunt așa cum sunt definiți mai sus.

In special, compusul reprezentat prin formula (II) poate fi preparat prin supunerea compusului reprezentat prin formula (IV) reacției de rearanjare.

40 Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui solvent, după caz, care poate fi orice solvent inert pentru reacție. Acesta poate fi, de exemplu, o hidrocarbură halogenată, cum ar fi clorura de metilen, cloroform, diclorețan sau triclorețan; o hidrocarbură aromatică, cum ar fi

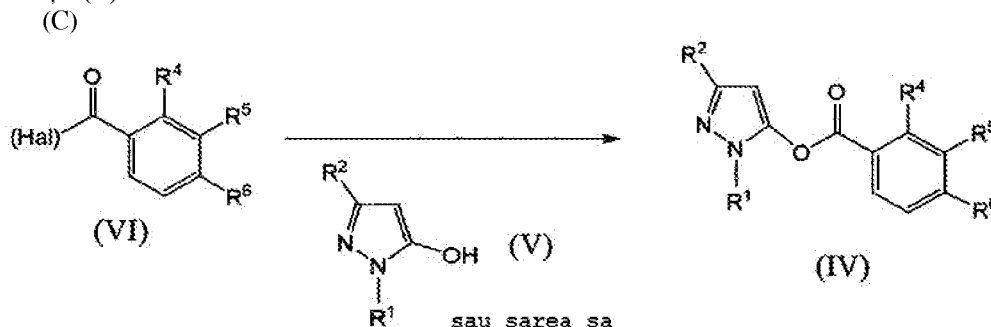
benzen, toluen, xilen sau nitrobenzen; un ester, cum ar fi acetat de metil, acetat de etil sau acetat de propil; un solvent aprotic polar, cum ar fi acetonitril, DMF, DMSO, DMA, HMPA sau sulfolan; sau un eter, cum ar fi dietil eter, dioxan, THF sau dimetoxietan. In calitate de solvent, unul sau mai mulți dintre ei pot fi selectați corespunzător.

5 Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unei baze, după caz, care poate fi o bază organică sau o bază anorganică, precum și acele aduse drept exemplu în reacția (A) de mai sus. În ce privește aceste baze, una sau mai multe dintre ele pot fi corespunzător selectate și amestecate pentru utilizare în cantități de la 0,01 până la 100 părți echivalente cu compusul cu formula (IV).

10 Suplimentar, în reacția de mai sus un catalizator poate fi adăugat, după caz. Acetoncianhidrina poate fi folosită în calitate de așa catalizator de la 0,01 până la 10 părți echivalente cu compusul cu formula (IV).

Reacția de mai sus poate fi realizată la o temperatură de reacție de obicei de la 0 până la 150°C cu durata de reacție de obicei de la 1 minut până la 48 ore.

15 Compusul reprezentat prin formula (IV) poate fi preparat în conformitate cu următoarea reacție (C):



in care  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  și Hal sunt așa cum sunt definiți mai sus.

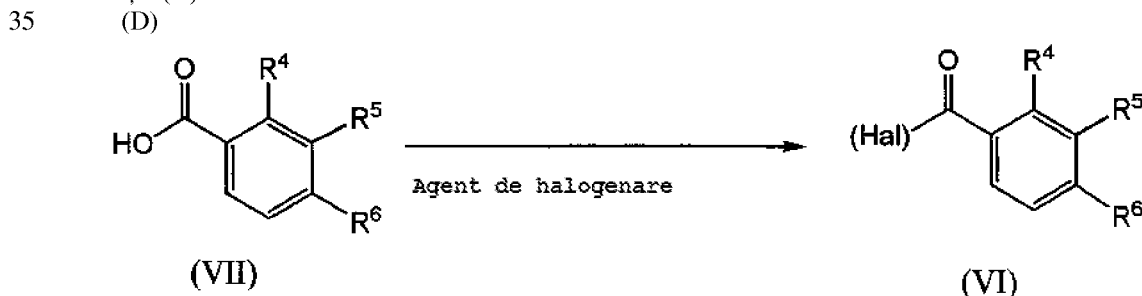
20 În special, compusul reprezentat prin formula (IV) poate fi preparat prin reacția unui compus reprezentat prin formula (V) sau a sării sale, cum ar fi clorhidrat, sulfat sau nitrat, cu un compus reprezentat prin formula (VI).

Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui solvent, după caz, care poate fi orice solvent inert pentru reacție, precum și acei aduși drept exemplu în reacția (B) de mai sus. Unul sau mai mulți dintre ei pot fi selectați corespunzător.

25 Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unei baze, după caz, care poate fi o bază organică sau o bază anorganică, precum și acele aduse drept exemplu în reacția (A) de mai sus. În ce privește aceste baze, una sau mai multe dintre ele pot fi corespunzător selectate și amestecate pentru utilizare în cantități de la 1 până la 100 părți echivalente cu compusul cu formula (VI).

30 Temperatura de realizare a reacției de mai sus este de obicei de la 0 până la 150°C, iar durata de reacție este de obicei de la 1 minut până la 48 ore.

Compusul reprezentat prin formula (VI) poate fi preparat în conformitate cu următoarea reacție (D):



in care  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  și Hal sunt așa cum sunt definiți mai sus.

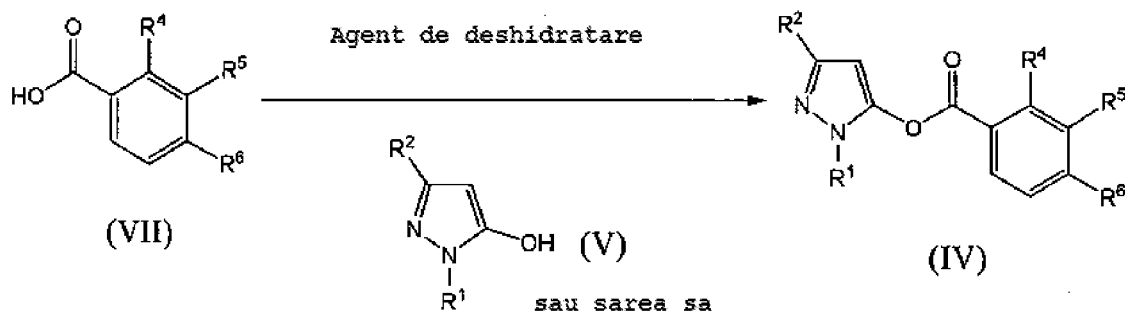
40 În reacția de mai sus un agent de halogenare, cum ar fi clorura de tionil sau clorura de oxalil, este supus reacției în cantitate de la 1 până la 100 părți echivalente cu compusul reprezentat prin formula (VII).

Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui solvent, după caz, care poate fi orice solvent inert pentru reacție, precum și acei aduși drept exemplu în reacția (B) de mai sus. Unul sau mai mulți dintre ei pot fi selectați corespunzător.

Pentru reacția de mai sus poate fi folosit un catalizator, după caz, de exemplu, DMF.

Temperatura de realizare a reacției de mai sus este de obicei de la 0 până la 150°C, iar durata de reacție este de obicei de la 1 minut până la 48 ore.

Compusul reprezentat prin formula (IV) poate fi preparat în conformitate cu următoarea reacție (E), diferită de metodele menționate mai sus:



in care  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  și  $R^6$  sunt așa cum sunt definiți mai sus.

În special, compusul reprezentat prin formula (IV) poate fi preparat prin reacția compusului reprezentat prin formula (V) sau a sării sale, cum ar fi hidroxlorură, sulfat sau nitrat cu un compus reprezentat prin formula (VII) prin intermediul unui agent de deshidratare.

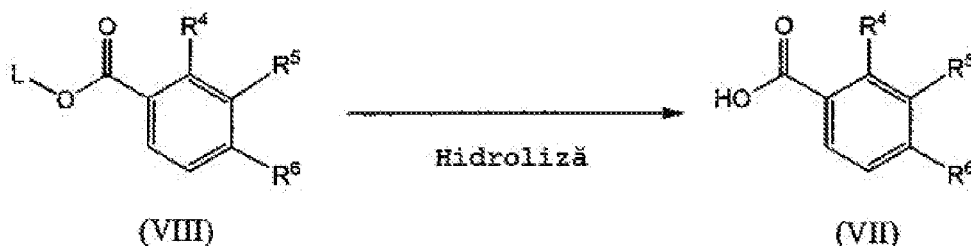
Agent de deshidratare folosit în reacția de mai sus poate fi, de exemplu, DCC (diclohexilcarbodiimidă) sau 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)-carbodiimidă clorhidrat.

Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui solvent, după caz, care poate fi orice solvent inert pentru reacție, precum și acei aduși drept exemplu în reacția (B) de mai sus. Unul sau mai mulți dintre ei pot fi selectați corespunzător.

Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unei baze, după caz, care poate fi, de exemplu, o amină terțiară, cum ar fi trietilamina sau diizopropiletilamina; piridina, 4-(dimetilamino)piridina sau 2,6-lutidina. În calitate de bază, una sau mai multe dintre ele pot fi corespunzător selectate și amestecate pentru utilizare în cantități de la 1 până la 100 părți echivalente cu compusul reprezentat prin formula (VII).

Reacția de mai sus poate fi realizată la o temperatură de reacție de obicei de la 0 până la 150°C cu durata de reacție de obicei de la 1 minut până la 48 ore.

Compusul reprezentat prin formula (VII) poate fi preparat în conformitate cu următoarea reacție (F):



in care  $R^4$ ,  $R^5$  și  $R^6$  sunt așa cum sunt definiți mai sus, iar L este o grupă protectoare, cum ar fi alchil.

Compusul reprezentat prin formula (VII) poate fi preparat prin supunerea compusului reprezentat prin formula (VIII) hidrolizei în prezența apei.

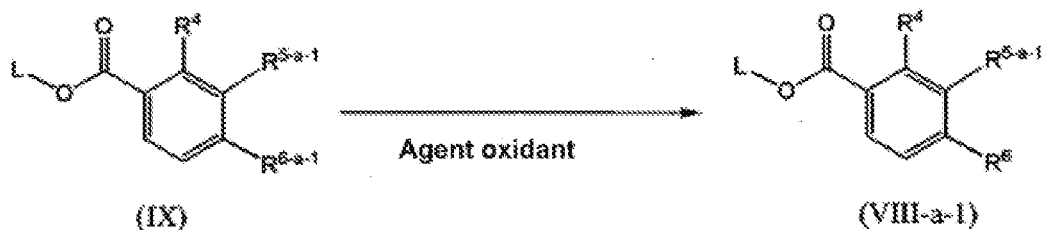
Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui solvent, după caz, care poate fi orice solvent inert pentru reacție, de exemplu, o hidrocarbură aromatică, cum ar fi benzen, toluen sau xilen; un solvent aprotic polar, cum ar fi acetonitril, DMF, DMSO, DMA, HMPA sau sulfolan; un eter, cum ar fi dietil eter, dioxan, THF sau dimetoxietan; un alcool, cum ar fi metanol sau etanol; sau apă. În calitate de solvent, unul sau mai mulți dintre ei pot fi selectați corespunzător.

Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unei baze sau unui acid, după caz. Bază poate fi o bază organică sau o bază anorganică, precum și acele aduse drept exemplu în reacția (A) de mai sus. Acid poate fi, de exemplu, acid clorhidric, acid sulfuric sau acid percloric. În calitate de bază sau acid unul sau mai mulți dintre ei pot fi corespunzător selectați și amestecați pentru utilizare în cantități de la 1 până la 100 părți echivalente cu compusul cu formula (VIII).

Reacția de mai sus poate fi realizată la o temperatură de reacție de obicei de la 0 până la 150°C cu durata de reacție de obicei de la 1 minut până la 48 ore.

Printre compușii reprezentați prin formula (VIII), un compus în care  $R^5$  este  $R^{5-a-1}$  poate fi preparat în conformitate cu următoarea reacție (G):

5



în care  $R^{5-a-1}$  este alcoxi substituit cu un  $Y^2$ , sau haloalcoxi,  $R^{6-a-1}$  este alchilțio, iar L,  $R^4$ ,  $R^6$  și  $Y^2$  sunt așa cum sunt definiți mai sus.

10 În special, compusul reprezentat prin formula (VIII-a-1) poate fi preparat prin reacția unui compus reprezentat prin formula (IX) cu un agent oxidant în prezența unui solvent.

Agent oxidant folosit în reacția de mai sus poate fi, de exemplu, perhidrol, acid peracetic sau acid metaclorperbenzoic.

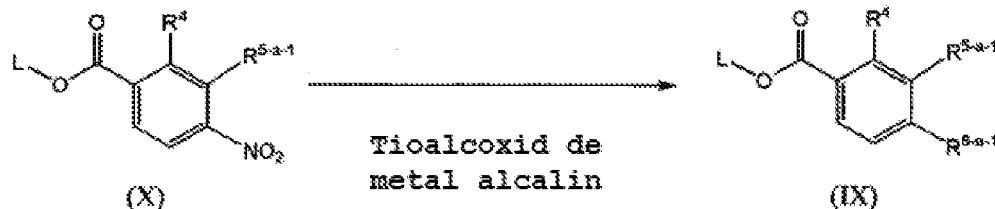
15 În reacția de mai sus poate fi folosit orice solvent care este inert pentru reacție și acesta poate fi, de exemplu, o hidrocarbură halogenată, cum ar fi clorura de metilen, cloroform, dicloretan sau tricloretan; o cetonă, cum ar fi acetona sau metil etil cetona; un eter, cum ar fi dietil eter, dioxan, THF sau dimetoxietan; sau un acid acetic. În calitate de solvent, unul sau mai mulți dintre ei pot fi selectați corespunzător.

Reacția de mai sus poate fi realizată la o temperatură de reacție de obicei de la 0 până la 150°C cu durata de reacție de obicei de la 1 minut până la 48 ore.

20 Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui catalizator, după caz, care poate fi, de exemplu, wolfram de sodiu sau hidratul său.

Compusul reprezentat prin formula (IX) poate fi preparat în conformitate cu următoarea reacție (H):

(H)



25

în care L,  $R^4$ ,  $R^{5-a-1}$  și  $R^{6-a-1}$  sunt așa cum sunt definiți mai sus.

În special compusul reprezentat prin formula (IX) poate fi preparat prin reacția unui compus reprezentat prin formula (X) cu un tioalcoxid de metal alcalin.

30 Tioalcoxid de metal alcalin folosit pentru reacția de mai sus poate fi, de exemplu, tiometoxid de sodiu sau tioetoxid de sodiu.

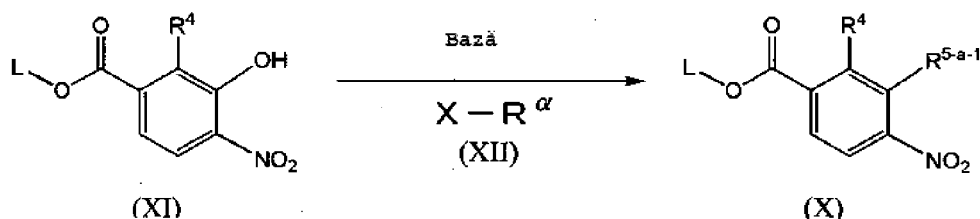
Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui solvent, după caz, care poate fi orice solvent inert pentru reacție și acesta poate fi, de exemplu, un solvent aprotic polar, cum ar fi acetonitril, DMF, DMSO, DMA, HMPA, sulfolan sau dimetoxietan. În calitate de solvent, unul sau mai mulți dintre ei pot fi selectați corespunzător.

35

Reacția de mai sus poate fi realizată la o temperatură de reacție de obicei de la 0 până la 150°C cu durata de reacție de obicei de la 1 minut până la 48 ore.

Compusul reprezentat prin formula (X) poate fi preparat în conformitate cu următoarea reacție (I):

(I)



40

în care  $R^\alpha$  este alchil substituit cu un  $Y^2$  sau haloalchil, X este o grupă nucleofugă, cum ar fi grupa halogen sau grupa sulfoximetan, iar L,  $R^4$ ,  $R^{5-a-1}$  și  $Y^2$  sunt așa cum sunt definiți mai sus.

5 În special, compusul reprezentat prin formula (X) poate fi preparat prin reacția unui compus reprezentat prin formula (XI) cu un compus reprezentat prin formula (XII) în prezența unei baze.

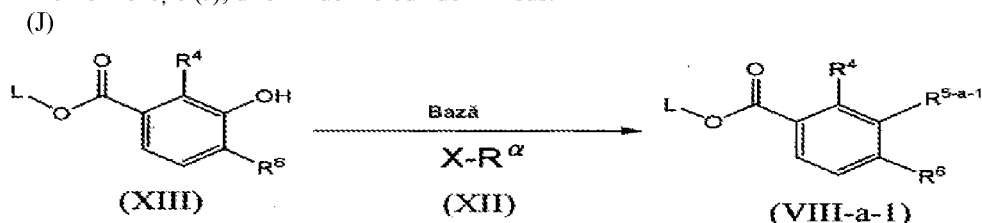
Baza folosită în reacția de mai sus poate fi o bază anorganică sau o bază organică. Bază organică poate fi, de exemplu, trietilamina, diizopropiletilamina, piridina, 4-(dimetilamino)piridina sau 2,6-lutidina. Bază anorganică poate fi, de exemplu, un carbonat de metal alcalin, cum ar fi carbonat de sodiu sau carbonat de potasiu; un hidroxid de metal alcalin, cum ar fi hidroxid de sodiu sau hidroxid de potasiu; sau o hidrură de metal alcalin, cum ar fi hidrura de sodiu sau hidrura de potasiu. În calitate de bază una sau mai multe dintre ele pot fi corespunzător selectate și amestecate pentru utilizare, în cantități de la 0,5 până la 100 părți echivalente cu compusul cu formula (XI).

15 Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui solvent, după caz, care poate fi orice solvent inert pentru reacție, precum și acei aduși drept exemplu în reacția (B) de mai sus. Unul sau mai mulți dintre ei pot fi selectați corespunzător.

Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui catalizator, cum ar fi iodura de potasiu sau iodura de tetra-n-butilamoniu.

20 Reacția de mai sus poate fi realizată la o temperatură de reacție de obicei de la 0 până la 150°C cu durata de reacție de obicei de la 1 minut până la 48 ore.

Compusul reprezentat prin formula (VIII-a-1) poate fi preparat în conformitate cu următoarea reacție (J), diferită de metoda de mai sus:

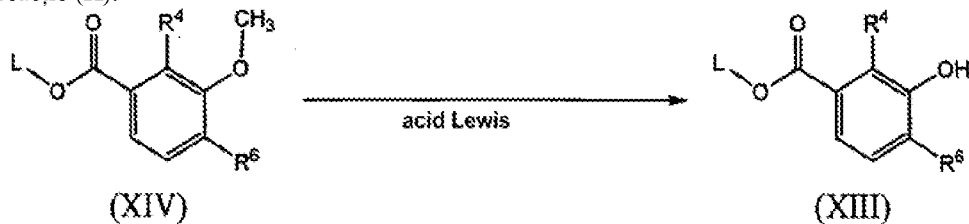


25 în care L,  $R^4$ ,  $R^{5-a-1}$ ,  $R^6$ ,  $R^\alpha$  și X sunt așa cum sunt definiți mai sus.

În special, compusul reprezentat prin formula (VIII-a-1) poate fi preparat prin reacția unui compus reprezentat prin formula (XIII) cu un compus reprezentat prin formula (XII) în prezența unei baze.

30 Reacția de mai sus poate fi realizată în același mod ca și reacția (I).

Compusul reprezentat prin formula (XIII) poate fi preparat în conformitate cu următoarea reacție (K):



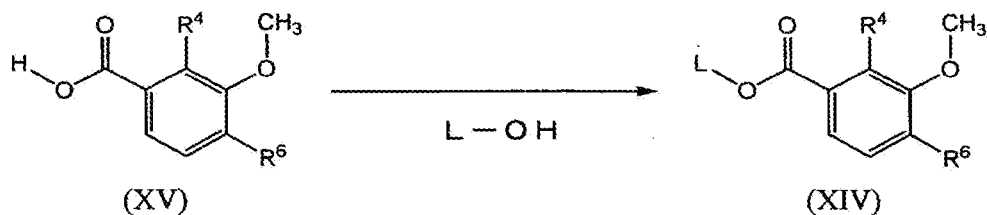
în care  $R^4$ ,  $R^6$  și L sunt așa cum sunt definiți mai sus.

35 În special, compusul reprezentat prin formula (XIII) poate fi preparat prin reacția unui compus reprezentat prin formula (XIV) cu un acid Lewis, cum ar fi tribromura de bor, clorura de aluminiu sau bromura feroasă.

40 Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui solvent, după caz, care poate fi orice solvent inert pentru reacție, de exemplu, o hidrocarbură halogenată, cum ar fi clorura de metilen, cloroform, dicloretan sau tricloretan; o hidrocarbură aromatică cum ar fi benzen, toluen sau xilen; sau un ester, cum ar fi acetat de metil, acetat de etil sau acetat de propil. În calitate de solvent, unul sau mai mulți dintre ei pot fi selectați corespunzător.

Reacția de mai sus poate fi realizată la o temperatură de reacție de obicei de la 0 până la 150°C cu durata de reacție de obicei de la 1 minut până la 48 ore.

45 Compusul reprezentat prin formula (XIV) poate fi preparat în conformitate cu următoarea reacție (L):



in care  $\text{R}^4$ ,  $\text{R}^6$  și  $\text{L}$  sunt așa cum sunt definiți mai sus.

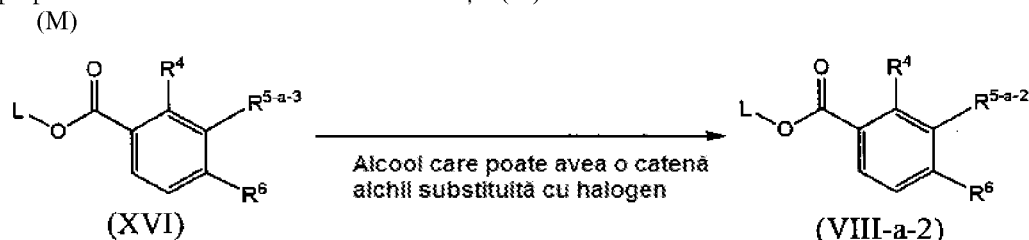
În special, compusul reprezentat prin formula (XIV) poate fi preparat prin reacția de introducere a unei grupe protectoare  $\text{L}$  într-un compus reprezentat prin formula (XV).

5 Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui solvent, după caz, care poate fi orice solvent inert pentru reacție, și acesta poate fi, de exemplu, o hidrocarbură aromatică, cum ar fi benzen, toluen sau xilen; un ester, cum ar fi acetat de metil, acetat de etil sau acetat de propil; o hidrocarbură halogenată, cum ar fi clorura de metilen, cloroform, dicloretan sau tricloretan; sau un solvent aprotic polar, cum ar fi acetonitril, DMF, DMSO, DMA, HMPA sau sulfolan. In calitate de solvent, unul sau mai mulți dintre ei pot fi selectați corespunzător.

Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui acid, după caz. În reacția de mai sus poate fi folosit, de exemplu, acid clorhidric sau acid sulfuric.

Reacția de mai sus poate fi realizată la o temperatură de reacție de obicei de la 0 până la 150°C cu durata de reacție de obicei de la 1 minut până la 48 ore.

15 Printre compușii reprezentați prin formula (VIII), un compus în care  $\text{R}^5$  este  $\text{R}^{5-a-2}$  poate fi preparat în conformitate cu următoarea reacție (M):



in care  $\text{R}^{5-a-2}$  este alchil substituit cu un  $\text{Y}^1$ ,  $\text{R}^{5-a-3}$  este bromalchil, iar  $\text{L}$ ,  $\text{R}^4$ ,  $\text{R}^6$  și  $\text{Y}^1$  sunt așa cum sunt definiți mai sus.

20 Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unui solvent, după caz, care poate fi orice solvent inert pentru reacție, de exemplu, un alcool, cum ar fi metanol sau etanol; un ester, cum ar fi acetat de metil, acetat de etil sau acetat de propil; un eter, cum ar fi eter dietilic, dioxan, THF sau dimetoxietan; sau un solvent aprotic polar, cum ar fi acetonitril, DMF, DMSO, DMA, HMPA sau sulfolan. In calitate de solvent, unul sau mai mulți dintre ei pot fi selectați corespunzător.

Reacția de mai sus poate fi realizată în prezența unei baze, după caz. Bază poate fi, de exemplu, o hidrură de metal alcalin, cum ar fi hidrura de sodiu sau hidrura de potasiu.

30 Reacția de mai sus poate fi realizată la o temperatură de reacție de obicei de la 0 până la 150°C cu durata de reacție de obicei de la 1 minut până la 48 ore.

Compușii conform prezentei invenții manifestă efecte erbicide excelente când sunt utilizați în calitate de ingredient activ al erbicidelor. Domeniul de aplicare se extinde la suprafețele agricole, cum ar fi lanurile de orez, suprafețele cu plante de cultură, livezile și plantațiile de duzi, precum și la suprafețele neagricole, cum ar fi pădurile, drumurile agricole, terenurile pentru jocuri și terenurile industriale. Metoda de aplicare poate fi corespunzător selectată din aplicare în sol, aplicare foliară, aplicare în apă etc.

40 Compușii conform prezentei invenții sunt capabili să combată o varietate mare de buruieni nedorite, de exemplu plante din familia graminee, cum ar fi *Echinochloa crus-galli* L., *Echinochloa oryzicola* Vasing., *Digitaria sanguinalis* L., *Digitaria ischaemum* Muhl., *Digitaria adscendens* Henr., *Digitaria microbachne* Henr., *Digitaria horizontalis* Willd., *Setaria viridis* L., *Setaria faberi* Herrm., *Setaria lutescens* Hubb., *Eleusine indica* L., *Avena fatua* L., *Sorghum halepense* L., *Agropyron repens* L., *Brachiaria plantaginea*, *Panicum maximum* Jacq., *Panicum purpurascens*, *Leptochloa chinensis*, *Leptochloa panicea*, *Poa annua* L., *Alopecurus myosuroides* Huds., *Agropyron tsukushiense* (Honda) Ohwi, *Brachiaria platyphilla* Nash, *Cenchrus echinatus* L., *Lolium multiflorum* Lam. și *Cynodon dactylon* Pers.; ciperacee, cum ar fi *Cyperus iria* L. sau *Cyperus rotundus* L., *Cyperus esculentus* L., *Scirpus juncooides*, *Cyperus serotinus*, *Cyperus difformis*, *Eleocharis acicularis* și *Eleocharis kuroguwai*; alismatacee, cum ar fi *Sagittaria pygmaea*, *Sagittaria trifolia* și *Alisma canaliculatum*;

pontederiacee, *Monochoria vaginalis* și *Monochoria korsakowii*; scrofulariacee, cum ar fi *Lindernia pyxidaria* și *Dopatrium junceum*; lythraceae, cum ar fi *Rotala india* și *Ammannia multiflora*; elatinacee, cum ar fi *Elatine triandra* SCHK.; malvacee, cum ar fi *Abutilon theophrasti* MEDIC., *Sida spinosa* L.; compositae, cum ar fi *Xanthium strumarium* L., *Ambrosia elatior* L., *Breea setosa* (BIEB.) KITAM., *Galinsoga ciliata* Blake, *Matricaria chamomilla* L.; solanacee, cum ar fi *Solanum nigrum* L. și *Datura stramonium*; amarantacee, cum ar fi *Amaranthus viridis* L. și *Amaranthus retroflexus* L.; polygonacee, cum ar fi *Polygonum lapathifolium* L., *Polygonum persicaria* L., *Polygonum convolvulus* L. și *Polygonum aviculare* L.; crucifere, cum ar fi *Cardamine flexuosa* WITH., *Capsella bursa-pastoris* Medik. și *Brassica juncea* Czern.; convolvulacee, cum ar fi *Ipomoea purpurea* L., *Calystegia arvensis* L. și *Ipomoea hederacea* Jacq.; chenopodiacee, cum ar fi *Chenopodium album* L. și *Kochia scoparia* Schrad.; portulacacee, cum ar fi *Portulaca oleracea* L.; leguminoase, cum ar fi *Cassia obtusifolia* L.; cariofilacee, cum ar fi *Stellaria media* L.; labiate, cum ar fi *Lamium amplexicaule* L.; rubiacee, cum ar fi *Galium spurium* L.; euforbiacee, cum ar fi *Acalypha australis* L.; și commelinaceae, cum ar fi *Cotnmelina communis* L.

De aceea ei pot fi efectiv folosiți pentru combaterea selectivă a buruienilor dăunătoare sau pentru combaterea neselectivă a buruienilor dăunătoare în cultivarea culturilor folositoare, cum ar fi porumbul (*Zea mays* L.), soia (*Glycine max* Merr.), bumbacul (*Gossypium* spp.), graul (*Triticum* spp.), orezul (*Oryza sativa* L.), orzul (*Hordeum vulgare* L.), secara (*Secale cereale* L.), ovăzul (*Avena sativa* L.), sorgul (*Sorghum bicolor* Moench), rapița (*Brassica napus* L.), floarea-soarelui (*Helianthus annuus* L.), sfecla de zahăr (*Beta vulgaris* L.), trestia de zahăr (*Saccharum officinarum* L.), iarba de gazon japoneză (*Zoysia japonica* stend), arahidele (*Arachis hypogaea* L.), inul (*Linum usitatissimum* L.), tutunul (*Nicotiana tabacum* L.) și cafeaua (*Coffea* spp.). În special compuşii conform prezentei invenții sunt folosiți efectiv pentru combaterea selectivă a buruienilor dăunătoare la cultivarea porumbului, soi, bumbacului, grâului, orezului, rapiței, florii-soarelui, sfeclei de zahăr, trestiei de zahăr, ierbii de gazon japoneze, arahidelor, inului, tutunului, cafelei ș.a.m.d., iar printre acestea, în special a porumbului, grâului, orezului, cornului, ierbii de gazon japoneze ș.a.m.d. La cultivarea acestor plante de cultură, de exemplu, la cultivarea porumbului, printre buruienile dăunătoare menționate, gramineele și malvaceele sunt buruieni dăunătoare tipice, iar *Setaria viridis* L., *Panicum maximum* Jacq. și *Abutilon theophrasti* MEDIC. ce se referă la acestea, pot fi, de exemplu, menționate ca buruieni bine combătute. Fiind inofensivi pentru plantele de cultură, compuşii conform prezentei invenții pot fi folosiți îndeosebi efectiv atât pentru combaterea buruienilor dăunătoare menționate mai sus, cât și pentru combaterea buruienilor dăunătoare greu de combătut, cum ar fi *Setaria viridis* L., *Panicum maximum* Jacq. și *Abutilon theophrasti* MEDIC.

Compusul conform prezentei invenții poate fi amestecat cu diverși aditivi agricoli și aplicat sub diverse forme, cum ar fi pulberile, granulele, granulele dispersabile în apă, prafurile umectabile, comprimatele, pilulele, capsulele (inclusiv preparatele acoperite cu peliculă solubilă în apă), suspensiile pe bază de apă, suspensiile pe bază de ulei, microemulsiile, suspensoemulsiile, prafurile solubile în apă, concentratele emulsionabile, concentratele solubile sau pastele. Acesta poate fi preparat sub orice formă folosită uzual în acest domeniu, cu condiția că prin aceasta este rezolvată problema propusă de prezenta invenție.

Aditivii folosiți la preparare cuprind, de exemplu, un agent solid, cum ar fi pământ de diatomee, var stins, carbonat de calciu, talc, dioxid de siliciu amorf, caolin, bentonit, amestec de caolin și sericit, argilă, carbonat de sodiu, bicarbonat de sodiu, mirabilit, zeolit sau amidon; un solvent, cum ar fi apa, toluen, xilen, solvent nafta, dioxan, acetonă, izoforon, metilzobutil cetonă, clorbenzen, ciclohexan, dimetilsulfoxid, N,N-dimetilformamidă, dimetilacetamidă, N-metil-2-pirolidon sau un alcool; un agent activ de suprafață anionic, cum ar fi o sare de acid gras, un benzoat, un alchilsulfosuccinat, un dialchilsulfosuccinat, un policarboxilat, o sare a esterului acidului alchilsulfuric, un alchil sulfat, un alchilaril sulfat, un alchil diglicol eter sulfat, o sare a esterului compus al acidului sulfuric, un alchil sulfonat, un alchilaril sulfonat, un aril sulfonat, un sulfonat de lignină, un alchildifenil eter disulfonat, un polistiren sulfonat, o sare a esterului acidului alchilfosforic, un alchilaril fosfat, un stîrilaril fosfat, o sare a esterului de polioxietilen alchil eter al acidului sulfuric, o sare a esterului de polioxietilen alchilaril eter sulfat, o sare a esterului de polioxietilen alchilaril eter al acidului sulfuric, un polioxietilen alchil eter fosfat, o sare a esterului de polioxietilen alchilaril al acidului fosforic, o sare a esterului de polioxietilen aril eter al acidului fosforic, un naftalinsulfonat condensat cu formaldehidă sau un alchilnaftalinsulfonat condensat cu formaldehidă; un agent activ de suprafață nonionic, cum ar fi un ester de sorbitan al acidului gras, un ester de glicerină al

acidului gras, o poligliceridă a acidului gras, un alcool poliglicol eter al acidului gras, un glicol acetilenic, un alcool acetilenic, un polimer bloc de oxialchilenă, un polioxiptilen alchil eter, un polioxiptilen alchilaril eter, un polioxiptilen stirlaril eter, un polioxiptilen glicol alchil eter, un polietilen glicol, un ester de polioxiptilen al acidului gras, un ester de polioxiptilen sorbitan al acidului gras, un ester de polioxiptilen glicerină al acidului gras, un ulei de ricin polioxiptilen hidrogenat sau un ester polioxiptilen al acidului gras; un ulei vegetal sau mineral, cum ar fi uleiul de măsline, uleiul de capoc, uleiul de ricin, uleiul de palmier, uleiul de camelia, uleiul de cocos, uleiul de susan, uleiul de porumb, uleiul de orez, uleiul de arahide, uleiul din semințe de bumbac, uleiul de soia, uleiul de rapiță, uleiul de in, uleiul de tung sau parafinele lichide.

5 Acești aditivi pot fi selectați corespunzător pentru folosire singuri sau în combinație ca amestec din doi sau mai mulți din ei, cu condiția că este rezolvată problema propusă de prezenta invenție. Suplimentar, alți aditivi decât cei menționați mai sus pot fi selectați corespunzător pentru folosire din randul celor cunoscuți în acest domeniu. De exemplu, pot fi folosiți diverși aditivi uzuali, cum ar fi o umplutură, un îngroșător, un agent împotriva sedimentării, un aditiv

10 anticongelant, un stabilizator al dispersiei, un safener, un agent împotriva mucegaiului, un agent antispumant, un agent de dezintegrare și un liant. Raportul de amestecare după greutate a compusului conform prezentei invenții față de acești diverși aditivi poate fi de la 0,1:99,9 până la 95:5, de preferință de la 0,2:99,8 până la 85:15.

Doza de erbicid ce conține compusul conform prezentei invenții nu poate fi definită în general, deoarece aceasta variază în dependență de condițiile meteorologice, starea solului, modul de preparare, tipul buruienilor ce urmează a fi combătute, anotimpul de aplicare etc. Totuși, compusul se aplică conform prezentei invenții în cantitate de la 0,1 până la 5000 g, de preferință de la 0,5 până la 1000 g, mai de preferință de la 1 până la 500 g, per hectar. Prezenta invenție se referă la o metodă de combatere a buruienilor nedorite prin aplicarea acestui

20 erbicid.

Suplimentar, erbicidul ce conține compusul conform prezentei invenții poate fi amestecat sau folosit în combinație cu alte chimicale agricole, îngrășăminte sau agenți de reducere a fitotoxicității, prin aceasta obținându-se uneori efecte sau activități sinergice. Aceste alte chimicale agricole cuprind, de exemplu, un erbicid, un fungicid, un antibiotic, un fitohormon și un insecticid. În special, cu ajutorul unei compoziții erbicide mixte ce conține un compus conform prezentei invenții în combinație cu unul sau mai mulți compuși activi de alte erbicide, varietatea buruienilor combătute, timpul de aplicare a compoziției, activitățile erbicide etc. pot fi îmbunătățite în direcțiile dorite. Compusul conform prezentei invenții și compusul activ al

30 altui erbicid pot fi preparați separat, astfel încât să poată fi amestecate pentru utilizare în timpul aplicării sau pot fi preparate împreună. Prezenta invenție se referă la o asemenea compoziție erbicidă mixtă.

Raportul de amestecare a compusului conform prezentei invenții și a compușilor activi de alte erbicide nu poate fi în general definit, deoarece acesta variază în dependență de condițiile meteorologice, starea solului, modurile de preparare, timpul aplicării, metoda de aplicare etc., însă alte erbicide sunt amestecate în cantități de la 0,001 până la 10000 părți de masă, de preferință de la 0,01 până la 1000 părți de masă per un tip de compus activ, bazate pe 1 parte de masă a compusului conform prezentei invenții. Suplimentar, doza de aplicare este luată astfel, încât cantitatea totală a compusului activ să fie de la 0,1 până la 10000 g, de preferință de la 0,2 până la 5000 g, mai de preferință de la 10 până la 3000 g, per hectar. Prezenta invenție se referă la o metodă de combatere a buruienilor nedorite prin aplicarea acestei compoziții

40 erbicide mixte.

Alt compus erbicid activ include, de exemplu, următorii compuși (denumiri comune, inclusiv unele solicitate pentru aprobare de ISO). În cazul în care acești compuși au săruri, esteri alchil etc., acești derivați, desigur, tot sunt incluși chiar și în cazul când aceștia nu se menționează în mod special.

50

(1) Acei care se consideră că manifestă efecte erbicide prin tulburarea activităților hormonale ale plantelor, cum ar fi grupa fenoxi, așa ca 2,4-D, 2,4-D-butotil, 2,4-D-butil, 2,4-D-dimetilamoniu, 2,4-D-diolamină, 2,4-D-etil, 2,4-D-2-etilhexil, 2,4-D-izobutil, 2,4-D-izoctil, 2,4-D-izopropil, 2,4-D-izopropilamoniu, 2,4-D-sodiu, 2,4-D-izopropanolamoniu, 2,4-D-trolamină, 2,4-DB, 2,4-DB-butil, 2,4-DB-dimetilamoniu, 2,4-DB-izoctil, 2,4-DB-potasiu, 2,4-DB-sodiu, diclorprop, diclorprop-butotil, diclorprop-dimetilamoniu, diclorprop-izoctil, diclorprop-potasiu, diclorprop-P, diclorprop-P-dimetilamoniu, diclorprop-P-potasiu, diclorprop-P-sodiu, MCPA, MCPA-butotil, MCPA-dimetilamoniu, MCPA-2-etilhexil, MCPA-potasiu, MCPA-sodiu, MCPA-tioetil, MCPB, MCPB-etil, MCPB-sodiu, mecoprop, mecoprop-butotil, mecoprop-sodiu, mecoprop-P, mecoprop-P-butotil, mecoprop-P-dimetilamoniu,

60

mecoprop-P-2-etilhexil, mecoprop-P-potasiu, naproanilidă sau clomeprop; grupa de acizi carboxilici aromatici așa ca 2,3,6-TBA, dicamba, dicamba-butotil, dicamba-diglicolamină, dicamba-dimetilamoniu, dicamba-diolamină, dicamba-izopropilamoniu, dicamba-potasiu, dicamba-sodiu, diclobenil, picloram, picloram-dimetilamoniu, picloram-izocetil, picloram-potasiu, picloram-triizopropanolamoniu, picloram-triizopropilamoniu, picloram-trolamină, triclopir, triclopir-butotil, triclopir-trietilamoniu, clopiralid, clopiralid-olamină, clopiralid-potasiu, clopiralid-triizopropanolamoniu sau aminopiralid; și altele așa ca naptalam, naptalam-sodiu, benazolin, benazolin-etil, quinclorac, quinmerac, diflufenzopir, diflufenzopir-sodiu, fluroxipir, fluroxipir-2-butoxi-1-metiletil, fluroxipir-meptil, clorflurenol sau clorflurenol-metil.

(2) Acei care se consideră că manifestă efecte erbicide prin inhibarea fotosintezei plantelor, cum ar fi grupa ureelor așa ca clorotoluron, diuron, fluometuron, linuron, izoproturon, metobenzuron, tebutiuron, dimefuron, izouron, carbutilat, metabenziazuron, metoxuron, monolinuron, neburon, siduron, terbumeton sau trietazină; grupa triazinelor așa ca simazina, atrazina, atraton, simetrin, prometrin, dimetametrin, hexazinona, metribuzin, terbutilazina, cianazina, ametrin, cibutrin, triaziflam, terbutrin, propazina, metamitron sau prometon; grupa uracililor așa ca bromacil, bromacil-litiu, lenacil sau terbacil; grupa anilidelor așa ca propanil sau cipromid; grupa carbamaților așa ca swep, desmedifam sau fenmedifam; grupa hidroxibenzonitrililor așa ca bromoxinil, bromoxinil-octanoat, bromoxinil-heptanoat, ioxinil, ioxinil-octanoat, ioxinil-potasiu sau ioxinil-sodiu; și altele așa ca piridat, bentazon, bentazon-sodiu, amicarbazon, metazol sau pentanoclor.

(3) Grupa cuaternară a sărurilor de amoniu, cum ar fi paraquat sau diquat, ce se consideră că se transformă singuri în radicali liberi pentru a forma oxigen activ în organismul plantelor și dau dovadă de eficiență erbicidă rapidă.

(4) Acei care se consideră că manifestă efecte erbicide prin inhibarea biosintezei clorofilei plantelor și acumularea anormală a substanței fotosensibilizante de peroxid în organismul plantelor, cum ar fi grupa difenileterilor așa ca nitrofen, clometoxifen, bifenox, acifluorfen, acifluorfen-sodiu, fomesafen, fomesafen-sodiu, oxifluorfen, lactofen, acilonifen, etoxifen-etil (HC-252), fluoroglicofen-etil sau fluoroglicofen; grupa imidelor ciclice așa ca clorftalim, flumioxazina, flumiclorac, flumiclorac-pentil, cinidon-etil sau flutiacet-metil; și altele, cum ar fi oxadiargil, oxadiazon, sulfentrazon, carfentrazon-etil, tidiazimin, pentoxazon, azafenidin, izopropazol, piraflufen-etil, benzfendizon, butafenacil, flupoxam, fluazolat, profluazol, piraclonil, flufenpir-etil sau bencarbazon.

(5) Acei care se consideră că manifestă proprietăți erbicide caracterizate prin activități de înălbire prin inhibarea cromogenezei plantelor, cum ar fi carotenoizii, grupa piridazinonilor așa ca norflurazon, cloridazon sau metflurazon; grupa pirazolilor așa ca pirazolinat, pirazoxifen, benzofenap, topramezon (BAS-670H) sau pirasulfotol; și altele așa ca amitrol, fluridon, flurtamon, diflufenican, metoxifenon, clomazon, sulcotrion, mesotrion, tembotrion, tefuriltrion (AVH-301), izoxaflutol, difenzoquat, difenzoquat-metilsulfat, izoxaclortol, benzobiclon, picolinafen sau beflubutamid.

(6) Acei care manifestă efecte erbicide puternice în special asupra plantelor ierboase, cum ar fi grupa de acizi ariloxifenoxipropionici așa ca diclofop-metil, diclofop, pirifenop-sodiu, fluazifop-butil, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-P-butil, haloxifop-metil, haloxifop, haloxifop-etotil, haloxifop-P, haloxifop-P-metil, quizalofop-etil, quizalofop-P, quizalofop-P-etil, quizalofop-P-tefuril, cihalofop-butil, fenoxaprop-etil, fenoxaprop-P, fenoxaprop-P-etil, metamifop-propil, metamifop, clodinafop-propargil, clodinafop sau propaquizafop; grupa ciclohexandionelor așa ca aloxidim-sodiu, aloxidim, cletodim, setoxidim, tralkoxidim, butoxidim, tepraloxidim, profoxidim sau cicloxidim; sau altele așa ca flamprop-M-metil, flamprop-M sau flamprop-M-izopropil.

(7) Acei care se consideră că manifestă efecte erbicide prin inhibarea biosintezei aminoacizilor plantelor, cum ar fi grupa sulfonilureelor așa ca clorimuron-etil, clorimuron, sulfometuron-metil, sulfometuron, primisulfuron-metil, primisulfuron, bensulfuron-metil, bensulfuron, clorsulfuron, metsulfuron-metil, metsulfuron, cinosulfuron, pirazosulfuron-etil, pirazosulfuron, azimsulfuron, flazasulfuron, rimsulfuron, nicosulfuron, imazosulfuron, ciclosulfamuron, prosulfuron, flupirsulfuron-metil-sodiu, flupirsulfuron, triflusulfuron-metil, triflusulfuron, halosulfuron-metil, halosulfuron, tifensulfuron-metil, tifensulfuron, etoxisulfuron, oxasulfuron, etametsulfuron, etametsulfuron-metil, iodisulfuron, iodisulfuron-metil-sodiu, sulfosulfuron, triasulfuron, tribenuron-metil, tribenuron, tritosulfuron, foramsulfuron, trifloxisulfuron, trifloxisulfuron-sodiu, mesosulfuron-metil, mesosulfuron, ortosulfamuron, flucetosulfuron, amidosulfuron, TH-547, un compus dezvăluit în WO2005092104; grupa triazolpirimidinasulfonamidelor așa ca flumetsulam, metosulam,

diclosulam, cloransulam-metil, florasulam sau penoxsulam; grupa imidazolinonelor așa ca imazapir, imazapir-izopropilamoniu, imazetapir, imazetapir-amoni, imazaquin, imazaquin-amoni, imazamox, imazamox-amoni, imazametabenz, imazametabenz-metil sau imazapic; grupa de acizi pirimidinilsalicilici așa ca piritiobac-sodiu, bispiribac-sodiu, piriminobac-metil, piribenzoxim, pirifalid, pirimisulfan (KUH-021); grupa sulfonilaminocarboniltriazolinonelor așa ca flucarbazon, flucarbazon-sodiu, propoxicarbazon-sodiu sau propoxicarbazon; și altele așa ca glifosat, glifosat-sodiu, glifosat-potasiu, glifosat-amoni, glifosat-diamoni, glifosat-trimesiu, glifosat-sesquisodiu, glufosinat, glufosinat-amoni, bilanafos, bilanafos-sodiu sau cinmetilin.

(8) Acei care se consideră că manifestă efecte erbicide prin inhibarea mitozei celulelor plantelor, cum ar fi grupa dinitroanilinelor așa ca trifluralin, orizalin, nitratin, pendimetalin, etalfluralin, benfluralin, prodiamin, butralin sau dinitramina; grupa amidelor așa ca bensulid, napronamida, propizamida sau pronamida; grupa fosforului organic așa ca amiprofos-metil, butamifos, anilofos sau piperofos; grupa fenilcarbamaților așa ca profam, clorprofam, barban sau carbetamida; grupa cumilaminelor așa ca daimuron, cumiluron bromobutid sau metildimron; și altele așa ca asulam, asulam-sodiu, ditiopir, tiazopir, clortal-dimetil, clortal sau difenamidă.

(9) Acei care se consideră că manifestă efecte erbicide prin inhibarea biosintezei proteice sau biosintezei lipidice a plantelor, cum ar fi grupa cloracetamidelor așa ca alaclor, metazaclor, butaclor, pretilaclor, metolaclor, S-metolaclor, tenilclor, petoxamid, acetoclor, propaclor, dimetenamida, dimetenamida-P, propisoclor sau dimetaclor; grupa tiocarbamaților așa ca molinat, dimepiperat, piributicarb, EPTC, butilat, vernolat, pebulat, cicloat, prosulfocarb, esprocarb, tiobencarb, diallat, tri-allat sau orbencarb; și altele așa ca etobenzanid, mefenacet, flufenacet, tridifan, cafenstrol, fentrazamidă, oxaziclomefon, indanofan, benfuresat, piroxasulfon (KIH-485), dalapon, dalapon-sodiu, TCA-sodiu sau acid tricloracetic.

(10) MSMA, DSMA, CMA, endotal, endotal-dipotasiu, endotal-sodiu, endotal-mono(N,N-dimetilalchilamoni), etofumesat, clorat de sodiu, acid pelargonic, acid nonanoic, fosamina, fosamina-amoni, pinoxaden, HOK-201, aclolein, sulfamat de amoni, borax, acid cloracetic, cloracet de sodiu, cianamida, acid metilarsenic, acid cacodilic, dimetilarsinat de sodiu, dinoterb, dinoterb-amoni, dinoterb-diolamina, dinoterb-acetat, DNOC, sulfat de fier, flupropanat, flupropanat-sodiu, izoxaben, mefluidida, mefluidida-diolamina, metam, metam-amoni, metam-potasiu, metam-sodiu, izotiocianat de metil, pentaclorfenol, pentaclorfenoxid de sodiu, laurat de pentaclorfenol, quinoclamină, acid sulfuric, sulfat de uree etc.

(11) Acei care se consideră că manifestă efecte erbicide fiind parazitari pentru plante, cum ar fi *Xanthomonas campestris*, *Epicoccossirus nematosorus*, *Epicoccossirus nematosperus*, *Exserohilum monoseras* sau *Drechsrela monoceras*.

Mai jos sunt prezentate variantele preferate de realizare a prezentei invenții, însă prezenta invenție nici într-un mod nu se limitează la ele.

(1) Un compus de benzoilpirazol cu formula (I) sau o sare a sa, în care  $R^1$  este alchil,  $R^2$  - un atom de hidrogen sau alchil,  $R^3$  - alchil,  $R^4$  - alchil,  $R^5$  - alchil substituit cu un  $Y^1$ , alcoxi substituit cu un  $Y^2$ , sau alcoxycarbonil,  $R^6$  - alchilsulfonil, A este grupa  $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ ,  $Y^1$  - alcoxi sau haloalcoxi, iar  $Y^2$  - alcoxi;

(2) Compusul de benzoilpirazol sau o sare a sa conform variantei (1) de mai sus, în care  $R^2$  este un atom de hidrogen, iar  $R^5$  este alcoxi substituit cu un alcoxi.

(3) Compusul de benzoilpirazol sau o sare a sa conform variantei (1) de mai sus, în care  $R^1$  este metil,  $R^2$  - un atom de hidrogen,  $R^3$  - metil,  $R^4$  - metil,  $R^5$  - 2-metoxietoxi,  $R^6$  - metilsulfonil.

(4) Compusul de benzoilpirazol sau o sare a sa conform variantei (1) de mai sus, în care  $R^1$  este metil,  $R^2$  - un atom de hidrogen,  $R^3$  - etil,  $R^4$  - metil,  $R^5$  - 2-metoxietoxi,  $R^6$  - metilsulfonil.

(5) Compusul de benzoilpirazol sau o sare a sa conform variantei (1) de mai sus, în care  $R^1$  este metil,  $R^2$  - un atom de hidrogen,  $R^3$  - izopropil,  $R^4$  - metil,  $R^5$  - 2-metoxietoxi,  $R^6$  - metilsulfonil.

(6) Compusul de benzoilpirazol sau o sare a sa conform variantei (1) de mai sus, în care  $R^1$  este metil,  $R^2$  - un atom de hidrogen,  $R^3$  - etil,  $R^4$  - metil,  $R^5$  - metoximetil,  $R^6$  - metilsulfonil.

(7) O compoziție erbicidă ce conține un compus de benzoilpirazol cu formula (I) sau o sare a sa și un adjuvant agricol.

(8) O metodă de combatere a plantelor nedorite sau inhibarea creșterii lor, care presupune aplicarea unei cantități efective din punct de vedere erbicid de compus cu formula (I) sau a sării sale asupra plantelor nedorite sau la locul creșterii lor.

(9) Metodă conform variantei (8) de mai sus, prin care plantele nedorite sunt combătute sau creșterea lor este inhibată într-un lan de porumb.

(10) Metodă conform variantei (9) de mai sus, în care porumbul este modificat.

5 (11) Metodă conform variantei (8) de mai sus, prin care plantele nedorite sunt combătute sau creșterea lor este inhibată într-un lan de grâu, orz sau secară.

(12) Metodă conform variantei (8) de mai sus, prin care plantele nedorite sunt combătute sau creșterea lor este inhibată într-un lan de orez.

(13) Metodă conform variantei (8) de mai sus, prin care plantele nedorite sunt combătute sau creșterea lor este inhibată pe o suprafață neagricolă.

10 (14) Utilizarea compusului de benzoilpirazol cu formula (I) de mai sus sau a sării sale în calitate de ingredient activ pentru un erbicid selectiv într-un lan de porumb.

În continuare prezenta invenție va fi descrisă în detalii suplimentare cu referințe la Exemple. Totuși, se subînțelege că prezenta invenție nici într-un mod nu se limitează la aceste Exemple specifice.

15 Un Exemplu de Preparare a compusului conform prezentei invenții este descris mai jos.

#### EXEMPLU DE PREPARARE

Prepararea 1-(4-(3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoil)-1-metil-1H-pirazol-5-iloxi)etil carbonatului de etil (compusul No. 2, după cum este descris în continuare)

20 (1) Metil 3-hidroxi-2-metil-4-nitrobenzoat (1,55 g) și 2-cloretil metil eter (1,8 g) au fost dizolvați în DMF anhidru (20 mL), s-a adăugat carbonat de potasiu (1,25 g) și iodură de potasiu (300 mg), după ce a urmat agitarea la temperatura de 90°C timp de 20 ore. La amestecul de reacție a fost adăugat acetat de etil (200 mL), după ce a urmat spălarea dublă cu soluție saturată de sare. Stratul organic a fost uscat pe sulfat de sodiu anhidru și concentrat sub presiune redusă pentru a obține metil 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-nitrobenzoat (2,1 g) sub formă de un solid galben pal.

<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz CDCl<sub>3</sub> δppm): 2,54 (3H, s), 3,39(3H, s), 3,70(2H, m), 3,91(3H, m), 4,11(2H, m), 7,59(1H, d, J=8,0 Hz), 7,64 (1H, d, J=8,0 Hz).

30 (2) Metil 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-nitrobenzoat (31 g) a fost dizolvat în DMF anhidru (300 mL), s-a adăugat tiometoxid de sodiu (puritate: 95%, 8,92 g) la temperatura camerei, după care s-a agitat timp de 45 minute. La amestecul de reacție s-a adăugat acetat de etil (400 mL), a fost spălat o singură dată cu 1 N acid clorhidric (150 mL) și spălat de două ori cu soluție saturată de sare. Stratul organic a fost uscat pe sulfat de sodiu anhidru, iar solventul a fost distilat sub presiune redusă pentru a obține metil 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metiltio)benzoat (30 g) sub formă de solid.

35 <sup>1</sup>H-RMN (400 MHz CDCl<sub>3</sub> δppm): 2,24 (3H, s), 2,53 (3H, s), 3,48 (3H, s), 3,78 (2H, m), 3,86 (3H, s), 4,01 (2H, m), 6,96 (1H, d, J=8,4 Hz), 7,68 (1H, d, J=8,4 Hz).

40 (3) Metil 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metiltio)benzoat (30 g) a fost dizolvat în acid acetic (300 mL), s-a adăugat wolfram de sodiu dihidrat (0,08 echivalente, 2,9 g). La acestea s-a adăugat perhidrol (30%, 38 mL) picătură cu picătură la temperatura camerei timp de 10 minute. Amestecul de reacție a fost agitat la temperatura camerei timp de trei ore, apoi s-a adăugat acetat de etil (300 mL) și hexan (300 mL), după ce a urmat spălarea de trei ori cu soluție saturată de sare. Stratul organic a fost spălat cu soluție apoasă de bicarbonat de sodiu saturată și uscat pe sulfat de sodiu anhidru. Solventul a fost distilat sub presiune redusă pentru a obține metil 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoat (26 g).

45 <sup>1</sup>H-RMN (400 MHz CDCl<sub>3</sub> δppm): 2,54 (3H, s), 3,26 (3H, s), 3,46(3H, s), 3,79 (2H, m), 3,91(3H, s), 4,19 (2H, m), 7,71 (1H, d, J=8,4 Hz), 7,84 (1H, d, J=8,4 Hz).

50 (4) Metil 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoat (26 g) a fost dizolvat în metanol (200 mL), s-a adăugat soluție apoasă de NaOH de 20% (50 mL) la temperatura camerei. După agitare timp de o oră metanolul a fost distilat sub presiune redusă. La reziduu s-a adăugat 2N acid clorhidric (100 mL), după ce a urmat extracția cu acetat de etil (500 mL). Stratul organic a fost spălat cu soluție saturată de sare și uscat pe sulfat de sodiu anhidru, iar solventul a fost distilat sub presiune redusă. La reziduu s-a adăugat un solvent mixt (acetat de etil:hexane=1:1, 50 mL), amestecul a fost lăsat să stea la temperatura de 5°C timp de 12 ore. Cristalele obținute au fost colectate prin filtrare pentru a obține 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoic acid (19,5 g).

55 <sup>1</sup>H-RMN (400 MHz CDCl<sub>3</sub> δppm): 2,63 (3H, s), 3,31 (3H, s), 3,49 (3H, s), 3,83 (2H, m), 4,23(2H, m), 7,91(2H, s).

60 (5) 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoic acid (10 g) a fost dizolvat în cloroform (200 mL), s-a adăugat clorură de oxalil (6.0 mL) și DMF (cantitate catalitică) la temperatura camerei. După agitare timp de o oră, cloroformul și clorura de oxalil nereacționată

au fost distilate sub presiune redusă. La reziduu s-a adăugat 1-metil-1H-pirazol-5-ol (3,8 g), 4-dimetilaminopiridină (8,5 g), tetrahidrofuran (200 mL) și trietilamină (7,3 mL), după ce s-a refluxat la încălzire timp de o oră. La amestecul de reacție răcit s-a adăugat acetat de etil (50 mL), s-a spălat consecutiv cu o soluție saturată de sare și 0,30N acid clorhidric (200 mL) și uscat pe sulfat de sodiu anhidru. Solventul a fost distilat sub presiune redusă, iar reziduu a fost spălat cu hexan pentru a obține 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoic acid 1-metil-1H-pirazol-5-il ester (7,8 g).

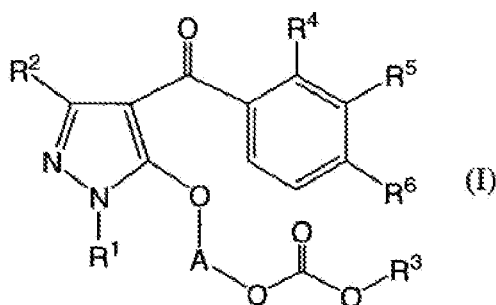
<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz CDCl<sub>3</sub> δppm): 2,66 (3H, s), 3,32 (3H, s), 3,49 (3H, s), 3,81 (3H, s), 3,83 (2H, m), 4,25 (2H, m), 6,28 (1H, d, J=2,0 Hz), 7,49 (1H, d, J=2,0 Hz), 7,99 (2H, s).

(6) 3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoic acid 1-metil-1H-pirazol-5-il ester (7,8 g) a fost dizolvat în acetonitril (100 mL), s-a adăugat trietilamină (7,9 mL) și acetoncianhidrină (0,87 mL) la temperatura camerei. După agitare timp de 6 ore, solventul a fost distilat sub presiune redusă. La reziduu s-a adăugat acetat de etil (100 mL), a urmat spălarea consecutivă cu 1N acid clorhidric (50 mL), apă și soluție saturată de sare și uscarea pe sulfat de sodiu anhidru. Solventul a fost distilat sub presiune redusă, iar reziduu a fost spălat cu hexan pentru a obține 4-(3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoil)-1-metil-1H-pirazol-5-ol (4,2 g).

<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz CDCl<sub>3</sub> δppm): 2,41 (3H, s), 3,31(3H, s), 3,48 (3H, s), 3,73 (3H, s), 3,82 (2H, m), 4,26(2H, m), 7,34(1H, s), 7,36 (1H, d, J=8,4 Hz), 7,94 (1H, d, J=8,4 Hz).

(7) 4-(3-(2-metoxietoxi)-2-metil-4-(metilsulfonil)benzoil)-1-metil-1H-pirazol-5-ol (4,2 g) a fost dizolvat în acetonă (50 mL), s-a adăugat carbonat de potasiu (5,5 g) și 1-cloretil carbonat de etil (9,1 g), a urmat refluxarea la încălzire timp de 4 ore. Apoi s-a adăugat iodură de sodiu (10 g) și s-a refluxat suplimentar timp de o oră. După ce s-a răcit, amestecul de reacție a fost dizolvat în acetat de etil (100 mL) și s-a adăugat apă. Sistemul de solvenți mixt a fost extras de trei ori cu acetat de etil, iar stratul organic a fost spălat cu soluție saturată de sare, apoi uscat pe sulfat de sodiu anhidru. Solventul a fost distilat sub presiune redusă, iar reziduu a fost purificat prin cromatografie pe coloană cu silicagel (solvent de dezvoltare: acetat de etil:hexan=1:1), solventul a fost distilat pentru a obține un solid. La solidul obținut a fost adăugat un solvent mixt (hexan:acetat de etil=7:3, 50 mL), amestecul a fost lăsat la temperatura de 5°C timp de 12 ore. Cristalele obținute au fost colectate prin filtrare pentru a obține produsul dorit (2,0 g) cu punctul de topire de 120°C.

În continuare exemple tipice ale compușilor reprezentați prin formula (I) de mai sus sunt prezentate în tabelul 1, iar datele lor de spectru <sup>1</sup>H-RMN sunt prezentate în tabelul 2. Acești compuși pot fi preparați în conformitate cu Exemplul de Preparare de mai sus sau prin diverse procedee de preparare a compușilor conform prezentei invenții. În tabelele 1 și 2, No. reprezintă numărul compusului. Suplimentar, în tabelul 1, Me reprezintă grupa metil, Et - grupa etil, n-Pr - grupa propil normal, i-Pr - grupa izpropil, n-Bu - grupa butil normal și t-Bu - grupa butil terțiar. Suplimentar, partea stângă a -A- este legată de partea pirazol, iar partea dreaptă a -A- este legată de partea carbonat.



Tabelul 1

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	-A-
1	Me	H	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
2	Me	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
3	Et	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
4	Me	H	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
5	Me	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-C(Me) <sub>2</sub> -
6	Me	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
7	Me	H	Et	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
8	Me	H	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
9	n-Bu	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
10	t-Bu	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
11	Me	Me	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
12	Me	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-C(Me)(Et)-
13	Me	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Et)-
14	Me	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(i-Pr)-
15	Me	H	Et	Me	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
16	Et	H	Et	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
17	Me	H	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
18	i-Pr	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
19	Me	H	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
20	Me	H	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
21	Me	H	Et	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
22	Me	H	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-C(Me) <sub>2</sub> -
23	Et	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-C(Me) <sub>2</sub> -
24	Me	H	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-C(Me) <sub>2</sub> -

Tabelul 1 (continuare)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	-A-
25	i-Pr	Me	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-C(Me) <sub>2</sub> -
26	Me	H	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-C(Me) <sub>2</sub> -
27	Me	H	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-C(Me) <sub>2</sub> -
28	Me	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-C(Me) <sub>2</sub> -
29	Et	H	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
30	t-Bu	H	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
31	Me	Me	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
32	Me	H	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
33	Me	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
34	Et	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
35	Me	H	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
36	Me	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-C(Me) <sub>2</sub> -
37	Me	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
38	Me	H	Et	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
39	Me	H	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
40	n-Bu	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
41	t-Bu	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
42	Me	Me	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
43	Me	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-C(Me)(Et)-
44	Me	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Et)-
45	Me	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(i-Pr)-
46	Me	H	Et	Me	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
47	Et	H	Et	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
48	Me	H	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
49	i-Pr	Me	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
50	Me	H	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
51	Me	H	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
52	Me	H	Et	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
53	Me	H	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-C(Me) <sub>2</sub> -
54	Et	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-C(Me) <sub>2</sub> -
55	Me	H	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-C(Me) <sub>2</sub> -
56	Me	H	Me	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
57	Me	H	Et	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
58	Et	H	Et	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
59	Me	H	i-Pr	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
60	Me	H	Et	Br	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-C(Me) <sub>2</sub> -
61	Me	H	Et	Br	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
62	Me	H	Et	Br	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
63	n-Bu	H	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-

Tabelul 1 (continuare)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	-A-
64	t-Bu	H	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Et	-CH(Me)-
65	Me	Me	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
66	Me	Et	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
67	Me	Et	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
68	Me	Et	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
69	Me	Et	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
70	Me	Et	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
71	Et	Et	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
72	Et	Et	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
73	Et	Et	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
74	Et	Et	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
75	Et	Et	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
76	i-Pr	Et	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
77	i-Pr	Et	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
78	i-Pr	Et	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
79	i-Pr	Et	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
80	i-Pr	Et	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
81	n-Pr	Et	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
82	n-Pr	Et	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
83	n-Pr	Et	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
84	n-Pr	Et	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
85	n-Pr	Et	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
86	n-Bu	Et	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
87	n-Bu	Et	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
88	n-Bu	Et	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
89	n-Bu	Et	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
90	n-Bu	Et	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
91	t-Bu	Et	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
92	t-Bu	Et	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
93	t-Bu	Et	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
94	t-Bu	Et	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
95	t-Bu	Et	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
96	Me	Et	Me	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
97	Me	Et	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
98	Me	Et	i-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
99	Me	Et	n-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
100	Me	Et	n-Bu	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
101	Et	Et	Me	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
102	Et	Et	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
103	Et	Et	i-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-

Tabelul 1 (continuare)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	-A-
104	Et	Et	n-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
105	Et	Et	n-Bu	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
106	i-Pr	Et	Me	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
107	i-Pr	Et	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
108	i-Pr	Et	i-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
109	i-Pr	Et	n-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
110	i-Pr	Et	n-Bu	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
111	n-Pr	Et	Me	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
112	n-Pr	Et	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
113	n-Pr	Et	i-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
114	n-Pr	Et	n-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
115	n-Pr	Et	n-Bu	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
116	n-Bu	Et	Me	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
117	n-Bu	Et	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
118	n-Bu	Et	i-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
119	n-Bu	Et	n-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
120	n-Bu	Et	n-Bu	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
121	t-Bu	Et	Me	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
122	t-Bu	Et	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
123	t-Bu	Et	i-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
124	t-Bu	Et	n-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
125	t-Bu	Et	n-Bu	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
126	Me	Et	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
127	Me	Et	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
128	Me	Et	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
129	Me	Et	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
130	Me	Et	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
131	Et	Et	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
132	Et	Et	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
133	Et	Et	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
134	Et	Et	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
135	Et	Et	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
136	i-Pr	Et	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
137	i-Pr	Et	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
138	i-Pr	Et	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
139	i-Pr	Et	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
140	i-Pr	Et	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
141	n-Pr	Et	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
142	n-Pr	Et	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-

Tabelul I (continuare)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	-A-
143	n-Pr	Et	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
144	n-Pr	Et	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
145	n-Pr	Et	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
146	n-Bu	Et	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
147	n-Bu	Et	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
148	n-Bu	Et	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
149	n-Bu	Et	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
150	n-Bu	Et	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
151	t-Bu	Et	Me	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
152	t-Bu	Et	Et	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
153	t-Bu	Et	i-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
154	t-Bu	Et	n-Pr	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
155	t-Bu	Et	n-Bu	Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
156	Me	Et	Me	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
157	Me	Et	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
158	Me	Et	i-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
159	Me	Et	n-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
160	Me	Et	n-Bu	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
161	Et	Et	Me	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
162	Et	Et	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
163	Et	Et	i-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
164	Et	Et	n-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
165	Et	Et	n-Bu	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
166	i-Pr	Et	Me	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
167	i-Pr	Et	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
168	i-Pr	Et	i-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
169	i-Pr	Et	n-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
170	i-Pr	Et	n-Bu	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
171	n-Pr	Et	Me	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
172	n-Pr	Et	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
173	n-Pr	Et	i-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
174	n-Pr	Et	n-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
175	n-Pr	Et	n-Bu	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
176	n-Bu	Et	Me	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
177	n-Bu	Et	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
178	n-Bu	Et	i-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
179	n-Bu	Et	n-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
180	n-Bu	Et	n-Bu	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -

Tabelul 1 (continuare)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	-A-
181	t-Bu	Et	Me	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
182	t-Bu	Et	Et	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
183	t-Bu	Et	i-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
184	t-Bu	Et	n-Pr	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
185	t-Bu	Et	n-Bu	Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
186	Me	Et	Me	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
187	Me	Et	Et	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
188	Me	Et	i-Pr	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
189	Me	Et	n-Pr	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
190	Me	Et	n-Bu	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
191	Et	Et	Me	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
192	Et	Et	Et	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
193	Et	Et	i-Pr	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
194	Et	Et	n-Pr	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
195	Et	Et	n-Bu	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
196	i-Pr	Et	Me	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
197	i-Pr	Et	Et	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
198	i-Pr	Et	i-Pr	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
199	i-Pr	Et	n-Pr	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
200	i-Pr	Et	n-Bu	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
201	n-Pr	Et	Me	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
202	n-Pr	Et	Et	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
203	n-Pr	Et	i-Pr	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
204	n-Pr	Et	n-Pr	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
205	n-Pr	Et	n-Bu	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
206	n-Bu	Et	Me	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
207	n-Bu	Et	Et	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
208	n-Bu	Et	i-Pr	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
209	n-Bu	Et	n-Pr	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
210	n-Bu	Et	n-Bu	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
211	t-Bu	Et	Me	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
212	t-Bu	Et	Et	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
213	t-Bu	Et	i-Pr	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
214	t-Bu	Et	n-Pr	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
215	t-Bu	Et	n-Bu	Me	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -
216	Me	Et	Me	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH (Me) -

Tabelul 1 (continuare)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	-A-
217	Me	Et	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
218	Me	Et	i-Pr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
219	Me	Et	n-Pr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
220	Me	Et	n-Bu	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
221	Et	Et	Me	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
222	Et	Et	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
223	Et	Et	i-Pr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
224	Et	Et	n-Pr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
225	Et	Et	n-Bu	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
226	i-Pr	Et	Me	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
227	i-Pr	Et	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
228	i-Pr	Et	i-Pr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
229	i-Pr	Et	n-Pr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
230	i-Pr	Et	n-Bu	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
231	n-Pr	Et	Me	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
232	n-Pr	Et	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
233	n-Pr	Et	i-Pr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
234	n-Pr	Et	n-Pr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
235	n-Pr	Et	n-Bu	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
236	n-Bu	Et	Me	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
237	n-Bu	Et	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
238	n-Bu	Et	i-Pr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
239	n-Bu	Et	n-Pr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
240	n-Bu	Et	n-Bu	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
241	t-Bu	Et	Me	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
242	t-Bu	Et	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
243	t-Bu	Et	i-Pr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
244	t-Bu	Et	n-Pr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
245	t-Bu	Et	n-Bu	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
246	Me	Et	Me	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
247	Me	Et	Et	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
248	Me	Et	i-Pr	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
249	Me	Et	n-Pr	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
250	Me	Et	n-Bu	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
251	Et	Et	Me	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-

Tabelul 1 (continuare)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	-A-
252	Et	Et	Et	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
253	Et	Et	i-Pr	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
254	Et	Et	n-Pr	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
255	Et	Et	n-Bu	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
256	i-Pr	Et	Me	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
257	i-Pr	Et	Et	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
258	i-Pr	Et	i-Pr	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
259	i-Pr	Et	n-Pr	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
260	i-Pr	Et	n-Bu	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
261	n-Pr	Et	Me	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
262	n-Pr	Et	Et	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
263	n-Pr	Et	i-Pr	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
264	n-Pr	Et	n-Pr	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
265	n-Pr	Et	n-Bu	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
266	n-Bu	Et	Me	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
267	n-Bu	Et	Et	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
268	n-Bu	Et	i-Pr	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
269	n-Bu	Et	n-Pr	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
270	n-Bu	Et	n-Bu	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
271	t-Bu	Et	Me	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
272	t-Bu	Et	Et	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
273	t-Bu	Et	i-Pr	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
274	t-Bu	Et	n-Pr	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
275	t-Bu	Et	n-Bu	Me	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
276	Me	Et	Me	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
277	Me	Et	Et	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
278	Me	Et	i-Pr	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
279	Me	Et	n-Pr	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
280	Me	Et	n-Bu	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
281	Et	Et	Me	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
282	Et	Et	Et	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
283	Et	Et	i-Pr	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
284	Et	Et	n-Pr	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
285	Et	Et	n-Bu	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
286	i-Pr	Et	Me	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
287	i-Pr	Et	Et	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-

Tabelul 1 (continuare)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	-A-
288	i-Pr	Et	i-Pr	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
289	i-Pr	Et	n-Pr	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
290	i-Pr	Et	n-Bu	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
291	n-Pr	Et	Me	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
292	n-Pr	Et	Et	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
293	n-Pr	Et	i-Pr	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
294	n-Pr	Et	n-Pr	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
295	n-Pr	Et	n-Bu	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
296	n-Bu	Et	Me	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
297	n-Bu	Et	Et	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
298	n-Bu	Et	i-Pr	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
299	n-Bu	Et	n-Pr	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
300	n-Bu	Et	n-Bu	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
301	t-Bu	Et	Me	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
302	t-Bu	Et	Et	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
303	t-Bu	Et	i-Pr	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
304	t-Bu	Et	n-Pr	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
305	t-Bu	Et	n-Bu	Cl	C(O)OMe	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
306	Me	H	Et	Me	CH <sub>2</sub> OCH(Me) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
307	Et	H	Et	Me	CH <sub>2</sub> OCH(Me) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
308	n-Pr	H	Et	Me	CH <sub>2</sub> OCH(Me) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
309	i-Pr	H	Et	Me	CH <sub>2</sub> OCH(Me) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
310	Me	H	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OCH(Me) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
311	Et	H	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OCH(Me) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
312	n-Pr	H	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OCH(Me) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-
313	i-Pr	H	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OCH(Me) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)-

No.	<sup>1</sup> H-NMR δppm (solvent: CDCl <sub>3</sub> , measuring instrument: JEOL-GSX (400MHz))
1	1.78 (3H, d, J=5.6Hz), 2.36 (3H, s), 3.10 (3H, s), 3.48 (3H, s), 3.71 (3H, s), 3.74 (3H, s), 3.82 (2H, m), 4.26 (2H, m), 6.73 (1H, m), 7.27 (1H, d, J=8.4Hz), 7.30 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=8.4Hz).
2	1.26 (3H, t, J=7.1Hz), 1.78 (3H, d, J=5.0Hz), 2.36 (3H, s), 3.31 (3H, s), 3.47 (3H, s), 3.71 (3H, s), 3.81 (2H, m), 4.14 (2H, q, J=7.1Hz), 4.25 (2H, m), 6.72 (1H, q, J=5.0Hz), 7.27 (1H, d, J=8.0Hz), 7.30 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=8.0Hz).
3	1.19 (3H, t, J=7.0Hz), 1.36 (3H, t, J=7.2Hz), 1.72 (3H, d, J=5.2Hz), 2.31 (3H, s), 3.25 (3H, s), 3.41 (3H, s), 3.75 (2H, m), 4.00 (2H, m), 4.06 (2H, q, J=7.2Hz), 6.73 (1H, q, J=5.2Hz), 7.20 (1H, s), 7.21 (1H, d, J=8.2Hz), 7.83 (1H, d, J=8.2Hz).
4	1.22 (3H, d, J=6.0Hz), 1.26 (3H, d, J=6.4Hz), 1.77 (3H, d, J=5.3Hz), 2.36 (3H, s), 3.31 (3H, s), 3.48 (3H, s), 3.71 (3H, s), 3.82 (2H, m), 4.25 (2H, m), 4.79 (1H, m), 6.71 (1H, q, J=5.3Hz), 7.27 (1H, d, J=8.4Hz), 7.30 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=8.4Hz).
7	1.23 (3H, t, J=7.0Hz), 1.76 (3H, d, J=5.2Hz), 2.41 (3H, s), 3.20 (3H, s), 3.48 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.94 (2H, s), 6.72 (1H, q, J=5.2Hz), 7.23 (1H, s), 7.42 (1H, d, J=7.6Hz), 8.03 (1H, d, J=7.6Hz).
11	1.25 (3H, t, J=6.8Hz), 1.45 (3H, d, J=5.6Hz), 1.97 (3H, s), 2.35 (3H, s), 3.30 (3H, s), 3.48 (3H, s), 3.65 (3H, s), 3.82 (2H, t, J=4.4Hz), 4.13 (2H, q, J=6.8Hz), 4.25 (2H, t, J=4.4Hz), 6.23 (1H, q, J=5.6Hz), 7.23 (1H, d, J=8.4Hz), 7.91 (1H, d, J=8.4Hz).
15	1.19 (3H, t, J=6.8Hz), 1.71 (3H, d, J=5.6Hz), 2.38 (3H, s), 3.12 (3H, s), 3.64 (3H, s), 3.96 (2H, q, J=8.0Hz), 4.06 (2H, q, J=6.8Hz), 5.17 (2H, s), 6.68 (1H, q, J=5.6Hz), 7.21 (1H, s), 7.42 (1H, d, J=8.0Hz), 8.00 (1H, d, J=8.0Hz).
18	1.24 (3H, t, J=7.0Hz), 1.42 (6H, m), 1.77 (3H, d, J=5.6Hz), 2.35 (3H, s), 3.30 (3H, s), 3.46 (3H, s), 3.80 (2H, m), 4.10 (2H, q, J=7.0Hz), 4.23 (2H, m), 4.66 (1H, m), 6.76 (1H, q, J=5.6Hz), 7.25 (1H, s), 7.28 (1H, d, J=8.0Hz), 7.87 (1H, d, J=8.0Hz).
19	0.86 (3H, t, J=7.2Hz), 1.58 (2H, m), 1.71 (3H, d, J=5.2Hz), 2.30 (3H, s), 3.25 (3H, s), 3.42 (3H, s), 3.65 (3H, s), 3.76 (2H, m), 3.97 (2H, t, J=6.8Hz), 4.19 (2H, m), 6.67 (1H, q, J=5.2Hz), 7.20 (1H, s), 7.22 (1H, d, J=7.6Hz), 7.84 (1H, d, J=7.6Hz).

Tabelul 2 (continuare)

20	0.89 (3H, t, J=7.2Hz), 1.32 (2H, m), 1.57 (2H, m), 1.75 (3H, d, J=5.2Hz), 2.34 (3H, s), 3.29 (3H, s), 3.45 (3H, s), 3.68 (3H, s), 3.79 (2H, m), 4.05 (2H, t, J=6.4Hz), 4.23 (2H, m), 6.70 (1H, q, J=5.2Hz), 7.25 (1H, J=8.0Hz), 7.27 (1H, s), 7.87 (1H, d, J=8.0Hz).
21	1.24 (3H, t, J=7.6Hz), 1.76 (3H, d, J=5.2Hz), 2.32 (3H, s), 3.12 (3H, s), 3.69 (3H, s), 3.98 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.6Hz), 6.72 (1H, m), 7.27 (1H, s), 7.52 (1H, d, J=8.0Hz), 7.94 (1H, d, J=8.0Hz).

In continuare vor fi descrise Exemplele Test.

#### 5 EXEMPLUL TEST 1

Intr-un ghiveci de 1/170000 ha, cu sol de pe un teren muntos, au fost semădate semințe de diverse plante. Cand plantele respective au ajuns la stadiile predeterminate de *Echinochloa crus-galli* L.: 1,0 până la 3,3 frunze, (2) *Digitaria sanguinalis* L.: 1,2 până la 3,0 frunze, (3) *Setaria viridis* L.: 1,5 până la 3,3 frunze, (4) *Amaranthus retroflexus* L.: 0,1 până la 2,0 frunze, (5) *Sida spinosa* L.: stadiul de cotiledon până la 2,0 frunze, (6) *Abutilon theophrasti* MEDIC.: 0,1 până la 2,0 frunze, (7) *Oryza sativa* L. : 1,3 până la 3,0 frunze, (8) *Zea mays* L.: 2,5 până la 3,4 frunze și (9) *Glycine max* Merr.: stadiul frunzei primare până la 0,3 frunze), prafurile umectabile sau concentratele emulsionabile ale compuşilor conform prezentei invenții, preparate după o metodă convențională de preparare, au fost luate în cantități prescrise și diluate cu apă în cantitate corespunzătoare cu 500 litri per 1 hectar (cu conținut de 0,1 % vol. de umplutură agricolă ("KUSARINOH", fabricată de NIHON NOHYAKU CO., LTD.)). Soluțiile de pulverizare preparate astfel au fost aplicate pentru tratament foliar cu un pulverizator mic.

15 In a 21-a zi după aplicare starea creșterii fiecărei plante s-a observat vizual, iar efectul erbicid a fost evaluat prin rata de inhibare a creșterii (%) de la 0% (echivalent cu suprafața netratată) până la  
20 100% (distrugere completă). Rezultatele sunt prezentate în tabelul 3.

Compus №.	Cantitate de ingredient activ (g/ha)	Rata de inhibare a creșterii (%)									Data observării
		<i>Echinochloa crus-galli</i> L.	<i>Digitaria sanguinalis</i> L.	<i>Setaria viridis</i> L.	<i>Amaranthus retroflexus</i> L.	<i>Sida spinosa</i> L.	<i>Abutilon theophrasti</i> MEDIC.	<i>Oryza sativa</i> L.	<i>Zea mays</i> L.	<i>Glycine max</i> Merr.	
1	7	100	90	100	100	60	100	80	0	95	21
2	7	100	95	95	100	40	95	80	0	80	21
	63	100	100	100	100	85	100	70	0	98	21
3	7	95	95	100	90	10	90	80	0	70	21
4	7	100	90	100	90	40	98	30	0	90	21
7	7	95	90	90	85	80	98	70	0	95	21
11	7	90	90	90	80	10	60	80	0	70	21
15	7	70	95	75	90	0	98	40	10	75	21
18	7	95	95	90	95	30	95	70	0	80	21
19	7	95	90	100	95	30	95	80	0	80	21
20	7	100	100	100	100	40	100	50	0	80	21
21	7	90	90	80	90	-	85	80	0	95	21

**EXEMPLUL TEST 2**

5        Într-un ghiveci de 1/170000 ha, umplut cu sol de pe un teren muntos, au fost semănate semințe de diverse plante (*Echinochloa crus-galli* L., *Digitaria sanguinalis* L., *Setaria viridis* L., *Amaranthus retroflexus* L., *Sida spinosa* L., *Abutilon theophrasti* MEDIC., *Oryza sativa* L., *Zea mays* L., *Glycine max* Merr.). La o zi după semănare prafurile umectabile sau concentratele emulsionabile ale compușilor conform prezentei invenții,

10        preparate în conformitate cu o metodă convențională de preparare, au fost luate în cantități prescrise și diluate cu apă în cantitate corespunzătoare cu 500 litri per 1 hectar, după ce a urmat aplicarea în sol cu un pulverizator mic.

15        Din ziua a 19-a până în a 22-a zi după aplicare starea creșterii plantelor respective s-a observat vizual, iar efectul erbicid a fost evaluat prin rata de inhibare a creșterii (%) de la 0% (echivalent cu suprafața netratată) până la 100% (distrugere completă). Rezultatele sunt prezentate în tabelul 4.

Compus No	Cantitate de ingredient activ (g/ha)	Rata de inhibare a creșterii (%)									Data observării
		<i>Echinochloa crus-galli</i> L.	<i>Digitaria sanguinalis</i> L.	<i>Setaria viridis</i> L.	<i>Amaranthus retroflexus</i> L.	<i>Sida spinosa</i> L.	<i>Abutilon theophrasti</i> MEDIC.	<i>Oryza sativa</i> L.	<i>Zea mays</i> L.	<i>Glycine max</i> Merr.	
1	250	100	100	90	100	90	100	100	0	0	19
2	250	100	100	100	100	70	60	98	0	0	21
3	250	100	100	100	100	50	80	100	0	20	19
4	250	100	100	95	95	90	70	90	0	0	20
7	250	100	90	40	80	80	70	90	0	0	21
11	250	100	100	100	100	40	70	100	0	20	19
15	250	100	100	100	100	70	100	100	0	0	19
18	250	100	100	100	100	70	100	100	0	-	22
19	250	100	100	100	100	60	98	100	0	40	19
20	250	100	100	100	100	70	100	100	0	30	19
21	250	100	100	100	100	60	90	100	0	50	19

**EXEMPLUL TEST 3**

- 5 Intr-un ghiveci de 1/1000000 ha, cu sol de pe un teren muntos, au fost semănate semințe de diverse plante. Când plantele respective au ajuns la stadiile predeterminate de (1) *Abutilon theophrasti* MEDIC.: 3,3 până la 4,3 frunze, (2) *Panicum maximum* Jacq.: 3,5 până la 4,3 frunze, (3) *Setaria viridis* L.: 4,0 până la 4,5 frunze și (4) *Zea mays* L.: 4,0 până la 4,3 frunze, un praf umectabil de compus No. 2 conform prezentei invenții, un concentrat emulsionabil de următorul Compus de Referință 1 și un praf umectabil de următorul Compus de Referință 2, preparate în conformitate cu o metodă convențională de preparare, au fost luate în cantități prescrise și diluate cu apă în cantitate corespunzătoare cu 300 litri per 1 hectar (cu conținut de 0,5 % vol. de umplutură agricolă (concentratul MSO a fost fabricat de Cognis Corporation). Soluțiile de pulverizare preparate astfel au fost aplicate pentru tratament foliar cu un pulverizator mic.

15 Din ziua a 17-a până în a 22-a zi după aplicare starea creșterii plantelor respective s-a observat vizual, iar efectul erbicid a fost evaluat prin rata de inhibare a creșterii (%) de la 0% (echivalent cu suprafața netratată) până la 100% (distrugere completă). Rezultatele sunt prezentate în tabelele 5-8.

# MD 4259 C1 2014.07.31

29

Tabelul 5

Compusul №.	Cantitatea de ingredient activ (g/ha)	Rata de inhibare a creșterii (%) (ziua 22 după aplicare)
		<i>Abutilon theophrasti</i> MEDIC.
2	15	94
Compusul de referință 1	15	20
Compusul de referință 2	15	40

Tabelul 6

5

Compusul №.	Cantitatea de ingredient activ (g/ha)	Rata de inhibare a creșterii (%) (ziua 18 după aplicare)
		<i>Panicum maximum</i> Jacq.
2	3,5	90
Compusul de referință 1	3,5	0
Compusul de referință 2	3,5	0

Tabelul 7

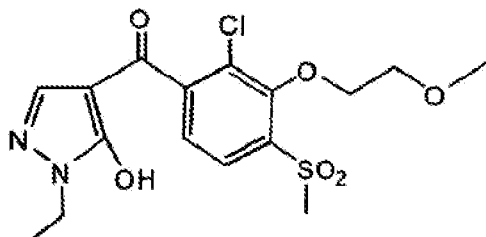
Compusul №.	Cantitatea de ingredient activ (g/ha)	Rata de inhibare a creșterii (%) (ziua 17 după aplicare)
		<i>Setaria viridis</i> L.
2	3,5	93
	7	98
Compusul de referință 1	3,5	35
	7	55
Compusul de referință 2	3,5	30
	7	45

10

Tabelul 8

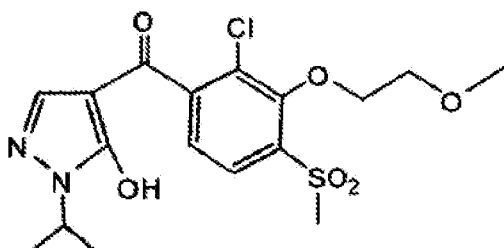
Compusul №.	Cantitatea de ingredient activ (g/ha)	Rata de inhibare a creșterii (%) (ziua 21 după aplicare)
		<i>Zea mays</i> L.
2	120	4
Compusul de referință 2	120	28

Compusul de referință 1:



(Compusul №. 1 dezvăluit pe pagina 18 din EP0352543A1)

5 Compusul de referință 2:



(Compusul №. 20 dezvăluit pe pagina 21 din EP0352543A1)

#### 10 EXEMPLUL TEST 4

Intr-un ghiveci de 1/1000000 ha, cu sol de pe un lan de orez, au fost semănate semințe de *Echinochloa oryzicola* vasing. și *Scirpus juncooides* și acoperite puțin cu sol. Apoi ghiveciul a fost lăsat în seră, în stare de irigare cu apă la adâncimea de la 0,5 până la 1 cm, iar în ziua următoare sau peste două zile, au fost plantați tuberculi de *Sagittaria pygmaea*. Adâncimea apei de irigare a fost menținută la nivelul de la 3 până la 4 cm, iar când *Echinochloa oryzicola* vasing. și *Scirpus juncooides* au ajuns la stadiul de 0,5 frunze, iar *Sagittaria pygmaea* a ajuns la stadiul de frunză primară, o soluție diluată cu apă de praf umectabil sau de concentrat emulsionabil de compus conform prezentei invenții, preparată în conformitate cu o metodă convențională de preparare, a fost aplicată uniform picătură cu picătură astfel, încât cantitatea ingredientelor active să fie o cantitate prescrisă. Suplimentar, un ghiveci de 1/1000000 ha a fost umplut cu sol de pe un lan de orez, a urmat tasarea solului la adâncimea apei de irigare de la 3 până la 4 cm. În ziua următoare, orezul (*Oryza sativa* L.) (var.: Nihonbare) în stadiul de două frunze a fost transplântat la adâncimea de transplântare de 3 cm. În ziua a 4-a după transplântare, compusul conform prezentei invenții a fost aplicat în modul descris mai sus.

25 În ziua a 14-a după aplicare s-a observat vizual starea creșterii *Echinochloa oryzicola* vasing., *Scirpus juncooides* și *Sagittaria pygmaea*, iar în a 21-a zi după aplicare starea creșterii *Oryza sativa* L. s-a observat vizual. Efectul erbicid a fost evaluat prin rata de inhibare a creșterii (%) de la 0% (echivalent cu suprafața netratată) până la 100% (distrugere completă). Rezultatele sunt prezentate în tabelul 9.

Tabelul 9

Compus №.	Cantitate de ingredient activ (g/ha)	Rata de inhibare a creșterii (%)			
		<i>Echinochloa oryzicola</i> vasing.	<i>Scirpus juncooides</i>	<i>Sagittaria pygmaea</i>	<i>Oryza sativa</i> L.
1	63	100	70	98	30
2	63	100	60	95	50
3	63	100	95	90	40
4	63	100	95	90	50
7	63	100	70	60	70
11	63	98	100	60	60
15	63	100	60	-	10
18	63	100	90	90	0
19	63	100	95	95	20
20	63	100	80	-	50
21	63	100	70	70	10

În continuare vor fi descrise Exemple de Preparare conform prezentei invenții.

5

**EXEMPLUL DE PREPARARE 1**

(1) Compusul conform prezentei invenții

75 părți de masă

(2) Geropon T-77 (denumire comercială, fabricat de Rhone- Poulenc)

14,5 părți de masă

(3) NaCl

10 părți de masă

(4) Dextrină

0,5 părți de masă

Componentele de mai sus sunt puse în mixer granulator de înaltă viteză, amestecate cu 20% din greutate de apă, granulate și uscate pentru a obține granule dispersabile în apă.

10

**EXEMPLUL DE PREPARARE 2**

(1) Caolin

78 părți de masă

(2) Laveline FAN (denumire comercială, fabricat de DAI-ICHI KOGYO SEIYAKU CO., LTD.)

2 părți de masă

(3) Sorpol 5039 (denumire comercială, fabricat de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.)

5 părți de masă

(4) Carplex (denumire comercială, fabricat de DSL. Japan Co., Ltd.)

15 părți de masă

# MD 4259 C1 2014.07.31

32

Amestecul de componente (1) - (4) și compusul conform prezentei invenții sunt amestecate în raport de greutate de 9:1 pentru a obține un praf umectabil.

## EXEMPLUL DE PREPARARE 3

- |   |                  |
|---|------------------|
| (1) Hi-Filler No. 10 (denumire comercială, fabricat de Matsumura Sangyo Co., Ltd.)  | 33 părți de masă |
| (2) Sorpol 5050 (denumire comercială, fabricat de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) | 3 părți de masă  |
| (3) Sorpol 5073 (denumire comercială, fabricat de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) | 4 părți de masă  |
| (4) Compusul conform prezentei invenții   | 60 părți de masă |
- 5      Compușii de mai sus (1) - (4) sunt amestecați pentru a obține un praf umectabil.

## EXEMPLUL DE PREPARARE 4

- |   |                    |
|---|--------------------|
| (1) Compusul conform prezentei invenții   | 4 părți de masă    |
| (2) Bentonit  | 30 părți de masă   |
| (3) Carbonat de calciu  | 61,5 părți de masă |
| (4) Toxanon GR-31A (denumire comercială, fabricat de Sanyo Chemical Industries Co., Ltd.) | 3 părți de masă    |
| (5) Ligninsulfonat de calciu  | 1,5 părți de masă  |
- 10      Componentul pulverizat (1) și componentele (2), (3) sunt amestecate în prealabil, apoi componentele (4) și (5) și apa sunt amestecate cu ele. Amestecul este extrudat, granulat, după care uscat și cernut pentru a obține granule.

## EXEMPLUL DE PREPARARE 5

- |   |                  |
|---|------------------|
| (1) Compusul conform prezentei invenții   | 30 părți de masă |
| (2) Zieclite (denumire comercială, fabricat de Zieclite Co., Ltd.)                  | 60 părți de masă |
| (3) New Kalgen WG-I (denumire comercială, fabricat de TAKEMOTO OIL & FAT CO., LTD.) | 5 părți de masă  |
| (4) New Kalgen FS-7 (denumire comercială, fabricat de TAKEMOTO OIL & FAT CO., LTD.) | 5 părți de masă  |
- 15      Componentele (1), (2) și (3) sunt amestecate și trecute printr-o moară pentru măcinare fină, apoi componentul (4) se adaugă la acestea. Amestecul este malaxat, extrudat și granulat, apoi uscat și cernut pentru a obține granule dispersabile în apă.

## EXEMPLUL DE PREPARARE 6

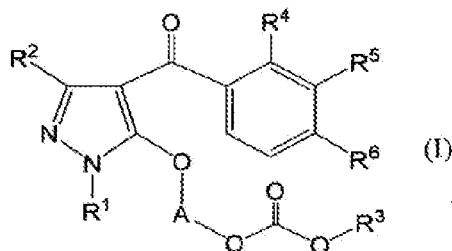
- |   |                  |
|---|------------------|
| (1) Compusul conform prezentei invenții   | 28 părți de masă |
| (2) Soprophor FL (denumire comercială, fabricat de Rhone-Poulenc)                       | 2 părți de masă  |
| (3) Sorpol 335 (denumire comercială, fabricat de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.)      | 1 parte de masă  |
| (4) IP solvent 1620 (denumire comercială, fabricat de Idemitsu Petrochemical Co., Ltd.) | 32 părți de masă |
| (5) Etilen glicol   | 6 părți de masă  |
| (6) Apă   | 31 părți de masă |
- 20      Componentele (1) - (6) de mai sus sunt amestecate și pulverizate cu ajutorul unei malaxor umed (Dyno-mill) pentru a obține un concentrat de suspensie pe bază de apă.

**(56) Referințe bibliografice citate în descriere:**

1. EP 0352543 A1 (1990.01.31)
2. EP 0282944 A2 (1988.09.21)

**(57) Revendicări:**

1. Un compus de benzoilpirazol reprezentat prin formula (I) sau o sare a sa:



în care  $R^1$  este alchil,  $R^2$  – un atom de hidrogen sau alchil,  $R^3$  – alchil,  $R^4$  – alchil sau halogen,  $R^5$  – alchil substituit cu un  $Y^1$ , haloalcoxi, alcoxi substituit cu un  $Y^2$  sau alcoxycarbonil,  $R^6$  – alchilsulfonil, A – grupa  $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ ,  $Y^1$  – alcoxi sau haloalcoxi și  $Y^2$  – alcoxi.

2. Compusul de benzoilpirazol sau o sare a sa conform Revendicării 1, în care  $R^1$  este alchil,  $R^2$  – un atom de hidrogen sau alchil,  $R^3$  – alchil,  $R^4$  – alchil,  $R^5$  – alchil substituit cu un  $Y^1$ , alcoxi substituit cu un  $Y^2$  sau alcoxycarbonil,  $R^6$  – alchilsulfonil,  $Y^1$  – alcoxi sau haloalcoxi și  $Y^2$  – alcoxi.

3. Compusul de benzoilpirazol sau o sare a sa conform Revendicării 2, în care  $R^2$  este un atom de hidrogen, iar  $R^5$  – alcoxi substituit cu un alcoxi.

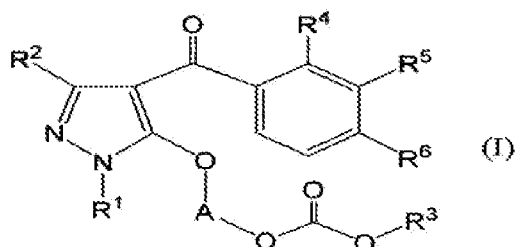
4. Compusul de benzoilpirazol sau o sare a sa conform Revendicării 2, în care  $R^1$  este metil,  $R^2$  – un atom de hidrogen,  $R^3$  – metil,  $R^4$  – metil,  $R^5$  – 2-metoxietoxi și  $R^6$  – metilsulfonil.

5. Compusul de benzoilpirazol sau o sare a sa conform Revendicării 2, în care  $R^1$  este metil,  $R^2$  – un atom de hidrogen,  $R^3$  – etil,  $R^4$  – metil,  $R^5$  – 2-metoxietoxi și  $R^6$  – metilsulfonil.

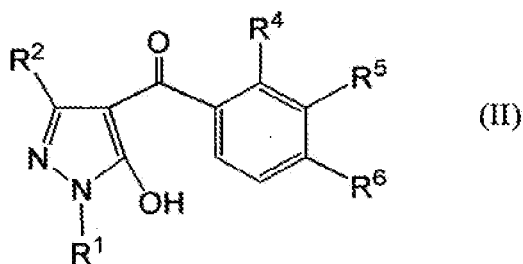
6. Compusul de benzoilpirazol sau o sare a sa conform Revendicării 2, în care  $R^1$  este metil,  $R^2$  – un atom de hidrogen,  $R^3$  – izopropil,  $R^4$  – metil,  $R^5$  – 2-metoxietoxi și  $R^6$  – metilsulfonil.

7. Compusul de benzoilpirazol sau o sare a sa conform Revendicării 2, în care  $R^1$  este metil,  $R^2$  – un atom de hidrogen,  $R^3$  – etil,  $R^4$  – metil,  $R^5$  – metoximetil și  $R^6$  – metilsulfonil.

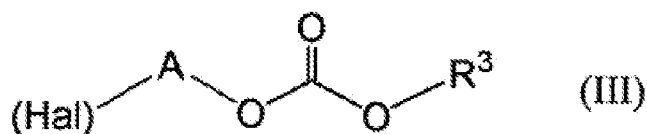
8. Procedeu de preparare a compusului de benzoilpirazol cu formula (I) sau a sării sale:



în care  $R^1$  este alchil,  $R^2$  – un atom de hidrogen sau alchil,  $R^3$  – alchil,  $R^4$  – alchil sau halogen,  $R^5$  – alchil substituit cu un  $Y^1$ , haloalcoxi, alcoxi substituit cu un  $Y^2$  sau alcoxycarbonil,  $R^6$  – alchilsulfonil, A – grupa  $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ ,  $Y^1$  – alcoxi sau haloalcoxi, iar  $Y^2$  – alcoxi, care presupune reacția unui compus reprezentat prin formula (II):



in care  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  și  $R^6$  au semnificația definită mai sus, cu un compus reprezentat prin formula (III):



in care Hal este halogen, iar  $R^3$  și A au semnificația definită mai sus.

9. Erbicid ce conține compusul de benzoilpirazol sau o sare a sa conform Revendicării 1 în calitate de ingredient activ.

10. Metodă de combatere a plantelor nedorite sau de inhibare a creșterii lor, care presupune aplicarea unei cantități efective din punct de vedere erbicid de compus de benzoilpirazol sau o sare a sa, conform Revendicării 1, pe plantele nedorite sau la locul creșterii lor.

Șef secție:

IUSTIN Viorel

Examinator:

JOVMIR Tudor

Redactor:

LOZOVANU Maria

**RAPORT DE DOCUMENTARE SUPLIMENTAR la « International Search Report »**

I. Datele de identificare a cererii		
(21) Nr. depozit: a 2009 0049 (32) Data de prioritate recunoscută: <b>2006.11.28</b>		
(22) Data depozit: 2007.11.09 Raport de documentare internațională: +		
(54) <b>Titlul: Compuși benzoilpirazolici, procedeu de preparare a lor și erbicide care le conțin</b>		
(71) Solicitant: <b>ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD, JP</b>		
(51) (Int.Cl): <b>Int.Cl: C07D 231/20</b> (2006.01) <b>A01N 47/06</b> (2006.01) <b>C07C 69/96</b> (2006.01) <b>A01P 13/00</b> (2006.01) <b>A01N 43/56</b> (2006.01)		
II. Condiții de unitate a invenției: <b>+ satisfice</b> <input type="checkbox"/> nu satisfice		
Note:		
III.Revendicări: claritatea, susținerea de descriere		
Note: <b>+ satisfice</b> <input type="checkbox"/> nu satisfice		
IV. Colecții și Baze de date de brevete cercetate (denumirea, termeni caracteristici, ecuații de căutare reprezentative). <b>Dacă nu este specificat cuvintele-cheie și indicii de clasificare se referă respectiv la Title/Abstracts și la IPC</b>		
<b>MD - Intern « Documentare Invenții »</b> (inclusiv cereri nepublicate; trunchiere automată stanga/dreapta): <b>Full-text</b> : benzoilpirazol ; aroilpirazol ; benzoil pirazol ;		
<b>"Worldwide" (Espacenet)</b> : benzoylpyrazole* ; „benzoyl pyrazole*” ; aroylpyrazole* ; (benzoylpyrazole* OR pyrazole*) AND IPC=C07C69 ; C07D321/20 AND C07C69/96 ; benzoylpyrazole* AND publ.date=1960:2006 ; full text/(EP or WO): (benzoylpyrazole* OR pyrazole*) AND alkoxyalkoxycarbonyl ; full text/(EP or WO): alkoxyalkoxycarbonyl AND herbicide* ; full text/(EP or WO): alkoxyalkoxycarbonyl AND IPC= C07D231 ; alkoxycarbonylalkoxy ;		
<b>EA, RU (Eapatis)</b> : (бензоилпиразол*\AB) ; («бензоил пиразол»\AB) ;		
V. Baze de date și colecții de literatură nonbrevet cercetate		
VI. Documente considerate a fi relevante		
Categoria*	Date de identificare ale documentelor citate si, unde este cazul, indicarea pasajelor pertinente	Numărul revendicării vizate
A	US 4986845 (1991-01-22) v. column 3, row 7; claims 2: column 91, row 6-8	1-10
A, C	US 5175299 (1992-12-29) v. column 9, row 10-11; column 36, row 31, Q14	1-10
A	US 6165944 200-12-26 v. column 42-44, compounds Ia29 - Ia32; column 128-130, compounds Ia301- Ia304	1-10

<b>* categoriile speciale ale documentelor citate:</b>	
<b>A</b> – document care definește stadiul anterior general	<b>T</b> – document publicat după data depozitului sau a priorității invocate, care nu aparține stadiului pertinent al tehnicii, dar care este citat pentru a pune în evidență principiul sau teoria pe care se bazează invenția
<b>X</b> – document de relevanță deosebită: invenția revendicată nu poate fi considerată nouă sau implicând activitate inventivă când documentul este luat în considerație de unul singur	<b>E</b> – document anterior dar publicat la data depozit național reglementar sau după aceasta dată
<b>Y</b> – document de relevanță deosebită: invenția revendicată nu poate fi considerată ca implicând activitate inventivă când documentul este asociat cu unul sau mai multe documente de aceeași categorie	<b>D</b> – document menționat în descrierea cererii de brevet
<b>O</b> - document referitor la o divulgare orală, un act de folosire, la o expoziție sau la orice alte mijloace de divulgare	<b>C</b> – document considerat ca cea mai apropiată soluție
	<b>&amp;</b> – document, care face parte din aceeași familie de brevete
<b>P</b> - document publicat înainte de data de depozit, dar după data priorității invocate	<b>L</b> – document citat cu alte scopuri
Data finalizării documentării 2013.06.10	
Examinator <b>JOVMIR Tudor</b>	