G. HOLLMANN RESTREPO
ABOGADOS LTDA.

272
261

10957

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00008334 00000004 Folios: 2
Fecha (AMD): 2003-03-13 11:12:48
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 538 PETICION
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
E. S. D.

Re: **Expediente No. 00-008334**
Solicitud de patente referente a: "FENIL-SULFONIL-UREAS, PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACIÓN COMO AGENTES HERBECIDAS Y REGULADORES DEL CRECIMIENTO DE LAS PLANTAS
Titular: HOECHST SCHERING AGREVO GmbH.

Yo, GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO, vecino de Bogotá D.C., portador de la tarjeta profesional No. 5903, obrando como apoderado en este negocio, digo a usted lo siguiente:

1. Que la solicitud de patente de la referencia fue publicada en la Gaceta de Propiedad Industrial No. 521 de 30 de octubre de 2002.

2. Que estando dentro del término de seis (6) meses a que hace referencia el artículo 44 de la Decisión 486 solicito que se examine si la invención solicitada es patentable.

3. Acompaño el recibo No. 17,959 de marzo 11 de 2003, por la suma de $335.000.oo, correspondientes a las tasas para la práctica del examen de patentabilidad.

Señor Superintendente,

GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO
C.C. No. 2.878.023 de Bogotá
T.P. No. 5903

mm.

CARRERA 11A No. 94-76 OF. 308 - TELS.: 616 1425 - 616 1948 - 616 1935 - 616 1961 FAX: 616 3976 A. AEREO 3830
CABLES HOLLMANN - BOGOTA

Industria y Comercio

273

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 03008334 00000004 Folios: 2
Fecha (AMD): 2003-03-13 11:12:48
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 538 PETICION
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

CIA

NIT : 800176089-2

262

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 03 - 17,959
FECHA : MARZO 11 DE 2003

***** C O N S I G N A C I O N *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
GUSTAVO HOLLMAN	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	6482712	11/03/2003	9,290,000.00

***** C O N C E P T O *****

ANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	85 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	335,000.00
		TOTAL : $	335,000.00

A: TRESCIENTOS TREINTA Y CINCO MIL PESOS

ONSABLE : _____

O DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador 382 0840
Fax 350 5220
E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

274

263

2005-05-19
375

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020

Bogotá,D.C.

Doctor
Gustavo Hollmann Restrepo
Apoderado

Oficio N° 00012787

REFERENCIA: Radicación N° 00-8334
Trámite 002
Evento 001
Actuación 430
Folios 045

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. DOCUMENTOS ESTUDIADOS:

- Capítulo descriptivo: folios 5 a 84, 256 a 259
-Capítulo reivindicatorio: reivindicaciones 1 a 8 y 12 folios 86 a 102 y reivindicaciones 9 a 11 y 13, 15 y 17 folios 268 a 269. enviadas como respuesta al requerimiento formal , junto con memorial de 17 de mayo de 2000.

El artículo 9 de la Decisión 486 de la Comisión del Acuerdo de Cartagena establece que:

"La primera solicitud de patente de invención o de modelo de utilidad, o de registro de diseño industrial o de marca, válidamente presentada en otro País Miembro o de una autoridad nacional, regional o internacional con la cual el País Miembro estuviera vinculado por algún tratado que establezca el derecho de prioridad análogo al que establece la presente Decisión, conferirá al solicitante o a su causahabiente un derecho de prioridad para solicitar en el País Miembro una patente o un registro respecto de la misma materia. El alcance y los efectos del derecho de prioridad serán los previstos en el Convenio de París para la protección de la Propiedad Industrial..."
"..Para beneficiarse del derecho de prioridad, la solicitud que la invoca deberá presentarse dentro de los siguientes plazos improrrogables contados desde la fecha de presentación de la solicitud cuya prioridad se invoca:

a) doce meses para las patentes de invención y de modelo de utilidad; y
b) seis meses para los registros de diseños industriales y de marcas"

La solicitud fue presentada el 29 de febrero de 2000 en ese momento se reclamó prioridad para las solicitud DE 19905453 de febrero 10 de 1999 de la cual se presentó la copia respectiva, dentro del término legal establecido por lo tanto, la prioridad reivindicada es válida.

2. OBJETO DE LA INVENCIÓN:

La invención se refiere a:
- Compuestos de formula I del tipo de las fenil-sulfonilureas.
-Procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula I
-Compuesto de fórmula II*, X* y VIII
-Procedimiento para eliminar malas hierbas o regular el crecimiento de las plantas con compuestos de fórmula I o sus sales.

Clasificación Internacional de Patentes: A01N 47/36

3. CLARIDAD DE LA SOLICITUD:

Conforme a lo establecido en el artículo 30 de la decisión 486 de la comisión de la comunidad andina las reivindicaciones deben ser claras, concisas y estar enteramente sustentadas en la descripción.

De manera que el capitulo reivindicatorio no es claro :
Primero porque, no se presenta como un único pliego que comprenda todas las reivindicaciones, numeradas en forma consecutiva.

Ahora con respecto a las reivindicaciones : la reivindicación N°1 se refiere a compuestos de fórmula I cuya estructura comprende varios sustituyentes cada uno de los cuales tiene múltiples significados, de manera que se tiene un sinnúmero de compuestos , lo cual es muy general y no delimita el alcance de la invención. Se presentan además significados de sustituyentes en forma muy general donde realmente no se especifica nada como por ejemplo cuando se indica que el radical puede ser un hidrocarbilo, lo cual técnicamente no es claro ni define el significado del radical.

De la misma forma la reivindicación N°6 relacionada con el proceso de obtención de los compuestos de fórmula I, se limita a enunciar los compuestos reaccionantes, pero no se indica como se lleva a acabo la reacción de síntesis, así como tampoco se muestran las condiciones de realización.

Las reivindicaciones N°s 9, 10 y 11 se encabezan como un procedimiento para eliminar malas hierbas o para combatir plantas dañinas con compuestos de fórmula I; realmente no describe ningún procedimiento y lo que tácitamente se pretende proteger es la utilización de dichos compuestos,
Igualmente las reivindicaciones N°s 13, 14 y 17 se encabezan como un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I y un compuesto de fórmula II, pero no describen ningún procedimiento sino se limita a describir parte de los compuestos utilizados en el proceso de obtención, o sea que se trata de la utilización de los compuestos de fórmula II´, X´ y VIII.

Las reivindicaciones deben ser concisas y claras por si mismas.

4. DETERMINACIÓN DE UNIDAD DE INVENCIÓN

Conforme al articulo 25 de la decisión 486 de la comisión de la comunidad andina, " La solicitud de patente sólo podrá comprender una invención o un grupo de invenciones relacionadas entre sí, de

manera que conforman un único concepto común inventivo.

Al respecto cabe anotar que no obstante el capitulo reivindicatorio no es claro, de acuerdo a la forma como se presenta , los procesos de obtención para los compuestos intermedios no corresponden al objeto de la solicitud, así como tampoco el compuesto de fórmula X'.

5.-DETERMINACIÓN DEL ESTADO DE LA TÉCNICA:

Considerando que se reivindicó prioridad, se buscaron documentos del estado de la técnica con fecha de publicación anterior a la fecha de presentación de la prioridad reivindicada.

El artículo 16 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que "El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida.

Sólo para el efecto de la determinación de la novedad, también se considerará dentro del estado de la técnica , el contenido de una solicitud de patente en tramite ante la oficina nacional competente, cuya fecha de presentación o de prioridad fuese anterior a la fecha de presentación o de prioridad de la solicitud de patente que se estuviese examinando, siempre que dicho contenido esté incluido en la solicitud de fecha anterior cuando ella se publique o hubiese transcurrido el plazo previsto en el articulo 40."

No obstante el capitulo reivindicatorio no es claro, dado que no delimta el alacance de la invención se realizo una búsqueda de anterioridades Consultadas las bases de datos, los archivos con que cuenta la entidad y de acuerdo con lo establecido en el articulo 16 se determinó el estado de la técnica y se encontraron los siguientes documentos.

N°	Documento	Titulo	Fecha
1	WO9406778	Hidroxyl amino phenyl suphonyl ureas, their preparation and their use as herbicides and plant growth regulators	31-03 1994
2	EP0030138	Herbicidal sulfonamides and compositions, preparation and use thereof	10-06-1981
3	EP0116518	N-Phenylsulfonyl-N¨-pyrimidinyl-und-triazinylharnstoffe	22-08-1984

Se anexa copia de los documentos

6. EVALUACIÓN DE LOS REQUISITOS DE PATENTABILIDAD:

El artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que "Los Países Miembros otorgarán Patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento en todos los campos de la tecnología siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial".

En cumplimiento del artículo 14 de la Decisión 486 se procedió a evaluar el cumplimiento de los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

6.1 Evaluación de la novedad

El artículo 16 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina dispone que: "Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica".

De acuerdo con la definición de novedad del Artículo 16 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, la novedad del objeto de la solicitud se ve afectada de acuerdo con lo divulgado en los documentos:

(1) Donde se revelan compuestos de hidroxi-aminofenil sulfonil.ureas, los cuales presentan la misma estructura básica y que de acuerdo con el significado de sus sustituyentes se superponen algunos de sus compuestos con los compuestos de sulfonil urea reivindicados en la solicitud en estudio, dada la amplia variedad de significados que se contemplan.

De la misma forma los documentos (2) y (3) revelan compuestos de sulfonil urea con la misma estructura básica y con significados de sustituyentes que dan como resultado compuestos como los de la solicitud en estudio.

Los documentos citados revelan así mismo la aplicación como herbicida.de dichos compuestos y sus procesos de obtención.

También se divulgan compuestos intermedios para la obtención de los compuestos de sulfonil urea como por ejemplo los compuestos de fórmula II*

6.2 Evaluación de Nivel Inventivo

El artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina dispone que "Se considerara que una invención tiene nivel inventivo, sí para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica."

De acuerdo con la definición de nivel inventivo del Artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el objeto de la solicitud se ve afectado dado que:

Los compuestos del tipo de las sulfonil ureas de la solicitud en estudio tal como se reivindican se derivan de lo divulgado en los documentos (1) , (2) y (3) que enseñan compuestos del mismo tipo de las sulfonil ureas, al igual que su aplicación como herbicida, así como su proceso de obtención.

El procedimiento para combatir plantas dañinas corresponde a los mismos procedimientos utilizados universalmente para la aplicación de éste tipo de productos, el cual no reviste ninguna condición o forma de realización específica; procedimiento que también se contempla en los documentos citados.

En conclusión los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
1	WO9406778	1-13 Y 17	Novedad
		1-17	Nivel Inventivo
2	EP0030138	1-13 Y 17	Novedad
		1-17	Nivel inventivo
3	EP0116518	1-13 Y 17	Novedad
		1-17	Nivel inventivo

Por lo anterior se solicita al interesado que ajuste el capítulo reivindicatorio de manera que sea claro, delimite el alcance de la invención y conforme un único concepto común inventivo, con el fin de poder

270

267

continuar con el examen de patentabilidad.

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta días contados a partir de la fecha de la notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2,literal e), del capítulo quinto del título primero de la circular única No. 10 de 2001.

DORIS POLO CORDOBA
Jefe de la División de Nuevas Creaciones €

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 19 MAYO 2005

CONCEPTO TÉCNICO Número 680	EXAMINADOR TÉCNICO Código 202013

05-04-23

PCT WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 5 :
C07D 239/42, A01N 47/36
C07D 239/46, 239/48, 239/52
C07D 251/16, 251/22, 251/52

A1

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: **WO 94/06778**

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 31. März 1994 (31.03.94)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP93/02469

(22) Internationales Anmeldedatum: 13. September 1993 (13.09.93)

(30) Prioritätsdaten:
P 42 30 933.6 16. September 1992 (16.09.92) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten ausser US):* HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-65926 Frankfurt am Main (DE).

(72) Erfinder; und
(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)* : SCHNABEL, Gerhard [DE/DE]; Lindenstraße 14, D-63868 Großwallstadt (DE). WILLMS, Lothar [DE/DE]; Lindenstraße 17, D-56204 Hillscheid (DE). BAUER, Klaus [DE/DE]; Doorner Straße 53d, D-63456 Hanau (DE). BIERINGER, Hermann [DE/DE]; Eichenweg 26, D-65817 Eppstein (DE). SCHULZ, Arno [DE/DE]; In den Amtmannswiesen 5, D-65817 Eppstein (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AU, BR, CA, JP, KR, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).

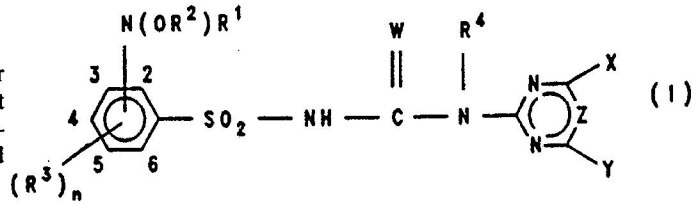
Veröffentlicht
Mit internationalem Recherchenbericht.

(54) Title: HYDROXYL AMINO PHENYL SULPHONYL UREAS, THEIR PREPARATION AND THEIR USE AS HERBICIDES AND PLANT GROWTH REGULATORS

(54) Bezeichnung: HYDROXYLAMINO-PHENYLSULFONYLHARNSTOFFE, IHRE DARSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ALS HERBIZIDE UND PFLANZENWACHSTUMSREGULATOREN

(57) Abstract

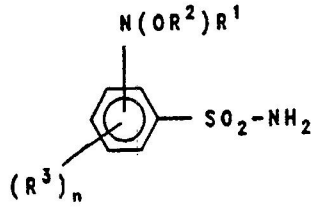
The sulphonyl ureas of formula (I) and their salts are suitable as selective herbicides to combat weeds in the cultivation of useful plants. The intermediate products of formulae (II) and (IV) may be used for their production.



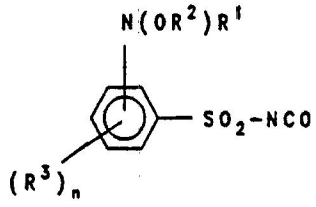
(I)

(57) Zusammenfassung

Die Sulfonylharnstoffe der Formel (I) und deren Salze eignen sich als selektive Herbizide zur Bekämpfung von Schadpflanzen in Nutzpflanzenkulturen. Zu ihrer Herstellung können die Zwischenprodukte der Formeln (II) und (IV) eingesetzt werden.



(II)



(IV)

Beschreibung

Hydroxylamino-phenylsulfonylharnstoffe, ihre Darstellung und ihre Verwendung als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren

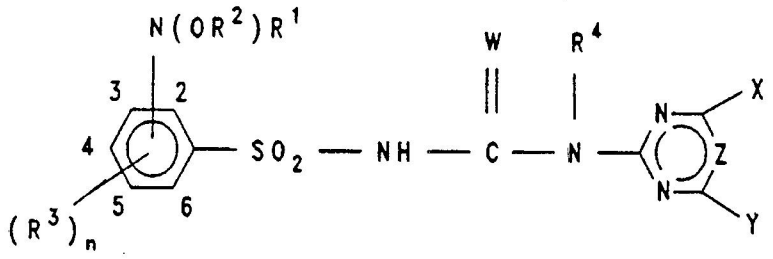
Die Erfindung betrifft das technische Gebiet der Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren, insbesondere der Herbizide zur selektiven Bekämpfung von Unkräutern und Ungräsern in Nutzpflanzenkulturen.

Es ist bekannt, daß heterocyclisch substituierte Phenylsulfonylharnstoffe, die am Phenylring eine Amino- bzw. eine funktionalisierte Aminogruppe tragen, herbizide und pflanzenwachstumsregulierende Eigenschaften besitzen (US-A-4,892,946; US-A-4,981,509; EP-A-169 815).

Weiterhin sind aus WO-89/10921 Phenylsulfonylharnstoff-Herbizide bekannt, worin der Phenylring 2,4-disubstituiert oder 2,4,6-trisubstituiert ist und in 4-Stellung unter anderem eine Alkylamino oder (substituierte) Hydroxylaminogruppe tragen kann.

Überraschenderweise wurde nun gefunden, daß bestimmte heterocyclisch substituierte Phenylsulfonylharnstoffe, die eine unsubstituierte oder eine substituierte Hydroxylamino-Funktion tragen, als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren besonders gut geeignet sind.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze,



(I)

worin

R^1 $CO\text{-}R^5$, $CO\text{-}OR^6$, $CO\text{-}NR^7R^8$, $CS\text{-}R^9$, $CS\text{-}OR^{10}$, $CS\text{-}NR^7R^8$, SO_2R^{11}, SOR^{11}, $SO_2NR^7R^8$ oder $CO\text{-}COR^{12}$,

R^2 Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_2-C_6-Alkinyl, wobei die letztgenannten 3 Reste unabhängig voneinander unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy und C_1-C_4-Alkylthio substituiert sind,

R^3 Halogen, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_2-C_6-Alkenyloxy oder C_2-C_6-Alkinyloxy, wobei die letztgenannten 6 Reste unabhängig voneinander unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy und Alkylthio substituiert sind, oder $CO\text{-}CO\text{-}R^{16}$, $CS\text{-}R^{16}$, $CO\text{-}CO\text{-}OR^{17}$, $CS\text{-}OR^{17}$, $CS\text{-}SR^{17}$, $CO\text{-}NR^{18}R^{19}$, $CS\text{-}NR^{18}R^{19}$, $NR^{18}R^{19}$, $SO_2NR^{18}R^{19}$, Cyano, $S(O)_0\text{-}R^{20}$, $CO\text{-}R^{16}$, $CO\text{-}OR^{17}$, NO_2 oder $C(R^{21})=N\text{-}R^{22}$
oder
einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten, ungesättigten oder heteroaromatischen Heterocyclus mit bis zu 4 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, C_1-C_4-Haloalkyl, CN, NO_2, CHO, (C_1-C_4-Alkyl)-carbonyl und (C_1-C_4-Alkoxy)-carbonyl substituiert ist und bei dem bis zu 2 C-Ringpositionen durch CO und bis zu zwei S-Heteroringatome durch SO_2 ersetzt sein können,

R^4 Wasserstoff oder C_1-C_4-Alkyl,

R^5 Wasserstoff oder C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_2-C_6-Alkinyl, wobei die letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, $NR^{13}R^{14}$ und NR^{15}_2 substituiert ist, oder C_3-C_7-Cycloalkyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, $NR^{13}R^{14}$ und NR^{15}_2 substituiert ist, oder Benzyl, unsubstituiertes oder substituiertes Aryl oder einen unsubstituierten oder substituierten heterocyclischen Rest,

R^6 C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_2-C_6-Alkinyl, wobei die letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, $NR^{13}R^{14}$ und NR^{15}_2 substituiert sind,

R^7 Wasserstoff oder C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl oder C_1-C_6-Alkoxy, wobei die letztgenannten 4 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio und $NR^{13}R^{14}$ substituiert sind,

R^8 Wasserstoff oder C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_2-C_6-Alkinyl, wobei die letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy und C_1-C_4-Alkylthio substituiert sind, oder COR^{23}, CO_2R^{24}, $CONR^{13}R^{14}$ oder SO_2R^{11},

R^9 analog R^5, vorzugsweise Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl oder C_3-C_6-Alkenyl, wobei die letztgenannten 2 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Halogenatome oder durch ein oder zwei Reste aus der Gruppe C_1-C_4-Alkoxy, Alkylthio und $NR^{13}R^{14}$ substituiert sind,

R^{10} analog R^6, vorzugsweise C_1-C_6-Alkyl oder C_3-C_6-Alkenyl, wobei die letztgenannten 2 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere

Halogenatome oder durch einen oder zwei Reste aus der Gruppe C_1-C_4-Alkoxy und C_1-C_4-Alkylthio substituiert sind,

R^{11} C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_2-C_6-Alkinyl, wobei die letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy und C_1-C_4-Alkylthio substituiert sind,

R^{12} Wasserstoff, OH, NH_2, Mono- oder Di-(C_1-C_4-alkyl)-amino, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Alkoxy, wobei die letztgenannten 2 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy und C_1-C_4-Alkylthio substituiert sind,

die R^{13} unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Alkenyl oder C_3-C_6-Alkinyl, wobei die letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy und C_1-C_4-Alkylthio substituiert sind, oder COR^{25} oder CO_2R^{26},

die R^{14} unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Alkenyl oder C_3-C_6 -Alkinyl, wobei die letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy und C_1-C_4-Alkylthio substituiert sind,

NR^{15}_2 unabhängig voneinander einen heterocyclischen 3- bis 7-gliedrigen Ring, der neben dem N-Atom noch ein oder zwei weitere Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder substituiert ist,

R^{16} einen Rest analog R^5,

R^{17} Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkyl oder C_2-C_6-Alkinyl, wobei die letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, $NR^{13}R^{14}$ und NR^{15}_2 substituiert sind,

R^{18} einen Rest analog R^7,

R^{19} einen Rest analog R^8,

R^{20} einen Rest analog R^{11},

R^{21} Wasserstoff oder C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_2-C_6-Alkinyl, wobei die letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy und C_1-C_4-Alkylthio substituiert sind, oder C_1-C_4-Alkoxy, OH, NH_2, Mono- oder Di-(C_1-C_4-alkyl)-amino, CO-R^{16}, CO_2-R^{17} oder SO_2-R^{20},

R^{22} Wasserstoff, OH, NH_2, Mono- oder Di-(C_1-C_4-alkyl)-amino, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Alkoxy, wobei die letztgenannten 2 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy und C_1-C_4-Alkylthio substituiert sind,

R^{23} einen Rest analog R^9,

R^{24} einen Rest analog R^{10},

R^{25} einen Rest analog R^9,

R^{26} einen Rest analog R^{10},

X, Y unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy oder C_1-C_6-Alkylthio, wobei die letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy und C_1-C_4-Alkylthio substituiert sind, oder Mono- oder Di-(C_1-C_4-alkyl)amino, C_3-C_6-Cycloalkyl, C_3-C_5-Alkenyl, C_3-C_6-Alkinyl, C_3-C_5-Alkenyloxy oder C_3-C_5-Alkinyloxy,

Z CH oder N,

W O oder S,

n 0, 1, 2 oder 3 und

o 0, 1, 2 oder 3

bedeuten.

In der Formel (I) und im folgenden können die Reste Alkyl, Alkoxy, Haloalkyl, Haloalkoxy, Alkylamino und Alkylthio sowie die entsprechenden ungesättigten und/oder substituierten Reste im Kohlenstoffgerüst jeweils geradkettig oder verzweigt sein. Wenn nicht speziell angegeben, sind bei diesen Resten die Kohlenstoffgerüste mit 1 bis 4 C-Atomen, bzw. bei ungesättigten Gruppen mit 2 bis 4 C-Atomen bevorzugt. Alkylreste, auch in den zusammengesetzten Bedeutungen wie Alkoxy, Haloalkyl usw., bedeuten z. B. Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, t- oder 2-Butyl, Pentyle, Hexyle, wie n-Hexyl, i-Hexyl und 1,3-Dimethylbutyl, Heptyle, wie n-Heptyl, 1-Methylhexyl und 1,4-Dimethylpentyl; Alkenyl- und Alkinylreste haben die Bedeutung der den Alkylresten entsprechenden möglichen ungesättigten Reste, Alkenyl bedeutet z.B. Allyl, 1-Methylprop-2-en-1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, But-2-en-1-yl, But-3-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl und 1-Methyl-but-2-en-1-yl; Alkinyl bedeutet z.B. Propargyl, But-2-in-1-yl, But-3-in-1-yl, 1-Methyl-but-3-in-1-yl.

Halogen bedeutet Fluor, Chlor, Brom oder Iod. Haloalkyl, -alkenyl und -alkinyl bedeuten durch Halogen, vorzugsweise durch Fluor, Chlor und/oder Brom, insbesondere durch Fluor oder Chlor, teilweise oder vollständig substituiertes Alkyl, Alkenyl bzw. Alkinyl, z.B. CF_3, CHF_2, CH_2F, CF_3CF_2, CH_2FCHCl, CCl_3, $CHCl_2$, CH_2CH_2Cl; Haloalkoxy ist z.B. OCF_3, $OCHF_2$, OCH_2F, CF_3CF_2O, OCH_2CF_3 und OCH_2CH_2Cl. Entsprechendes gilt für Haloalkenyl und andere durch Halogen substituierte Reste.

Aryl bedeutet ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System, beispielsweise Phenyl, Naphthyl, Tetrahydronaphthyl, Indenyl, Indanyl, Pentalenyl, Fluorenyl und ähnliches, vorzugsweise Phenyl; Aryloxy bedeutet vorzugsweise die den genannten Arylresten entsprechenden Oxy-Reste, insbesondere Phenoxy.

Heteroaryl oder ein heteroaromatischer Rest bedeutet ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System, in dem mindestens 1 Ring ein oder mehrere Heteroatome enthält, beispielsweise Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Thienyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Furyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl und Imidazolyl, aber auch bicyclische oder polycyclische aromatische oder araliphatische Verbindungen, z. B. Chinolinyl, Benzoxazolyl etc.

Substituiertes Aryl, Heteroaryl, Phenyl, Benzyl, bzw. substituierte bicyclische Reste mit aromatischen Anteilen bedeuten beispielsweise einen vom unsubstituierten Grundkörper abgeleiteten substituierten Rest, wobei die Substituenten beispielsweise einen oder mehrere, vorzugsweise 1, 2 oder 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Alkyl, Haloalkyl, Alkoxy, Haloalkoxy, Alkylthio, Hydroxy, Amino, Nitro, Cyano, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Dialkylaminocarbonyl, Mono- und Dialkylamino, Alkylsulfinyl und Alkylsulfonyl bedeuten und bei Resten mit C-Atomen solche mit 1 bis 4 C-Atomen, insbesondere 1 oder 2 C-Atomen, bevorzugt sind. Bevorzugt sind dabei in der Regel Substituenten aus der Gruppe Halogen, z. B. Fluor und Chlor, C_1-C_4-Alkyl, vorzugsweise Methyl oder Ethyl, C_1-C_4-Haloalkyl, vorzugsweise Trifluormethyl, C_1-C_4-Alkoxy, vorzugsweise Methoxy oder Ethoxy, C_1-C_4-Haloalkoxy, Nitro und Cyano. Besonders bevorzugt sind dabei die Substituenten Methyl, Methoxy und Chlor.

Gegebenenfalls substituiertes Phenyl ist beispielsweise Phenyl, das unsubstituiert oder ein- oder mehrfach, vorzugsweise bis zu dreifach durch gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkoxy und Nitro substituiert ist, z.B. o-, m- und p-Tolyl, Dimethylphenyle, 2-, 3- und 4-Chlorphenyl, 2-, 3- und 4-Trifluormethyl- und

-Trichlormethylphenyl, 2,4-, 3,5-, 2,5- und 2,3-Dichlorphenyl, o-, m- und p-Methoxyphenyl.

Ein heterocyclischer Rest ist vorzugsweise 5- oder 6-gliedrig und heteroaromatisch, gesättigt oder ungesättigt und enthält 1, 2 oder 3 Heteroatome, vorzugsweise aus der Gruppe N, O und S. Der Rest kann benzokondensiert sein. Es kommen Reste wie Oxiranyl, Pyrrolidyl, Piperidyl, Dioxolanyl, Pyrazolyl, Morpholyl, Furyl, Tetrahydrofuryl, Indolyl, Chinolinyl, Pyrimidyl, Azepinyl, Imidazolyl, Triazolyl, Thienyl und Oxazolyl in Frage.

Gegenstand der Erfindung sind auch alle Stereoisomeren, die von Formel (I) umfaßt sind, und deren Gemische. Solche Verbindungen der Formel (I) enthalten ein oder mehrere asymmetrische C-Atome oder auch Doppelbindungen, die in den allgemeinen Formeln (I) nicht gesondert angegeben sind. Die durch ihre spezifische Raumform definierten möglichen Stereoisomeren, wie Enantiomere, Diastereomere, Z- und E-Isomere sind alle von der Formel I umfaßt und können nach üblichen Methoden aus Gemischen der Stereoisomeren erhalten oder auch durch stereoselektive Reaktionen in Kombination mit dem Einsatz von stereochemisch reinen Ausgangsstoffen hergestellt werden.

Die Verbindungen der Formel (I) können Salze bilden, bei denen der Wasserstoff der $-SO_2-NH-$Gruppe oder auch andere acide Wasserstoffatome (z.B. aus COOH u.a.) durch ein für die Landwirtschaft geeignetes Kation ersetzt wird. Diese Salze sind beispielsweise Metallsalze, insbesondere Alkalisalze (z.B. Na- oder K-Salze) oder Erdalkalisalze, oder auch Ammoniumsalze oder Salze mit organischen Aminen. Ebenso kann Salzbildung durch Anlagerung einer Säure an basische Gruppen, wie z.B. Amino und Alkylamino, erfolgen. Geeignete Säuren hierfür sind starke anorganische und organische Säuren, beispielsweise HCl, HBr, H_2SO_4 oder HNO_3.

Vor allem aus Gründen der höheren herbiziden Wirkung, besseren Selektivität, und/oder besseren Herstellbarkeit sind Verbindungen der Formel (I) oder deren

Salze von besonderem Interesse, worin

R^1 $CO-R^5$, $CO-OR^6$, $CO-NR^7R^8$, $CS-R^9$, $CS-NR^7R^8$, SO_2R^{11}, $SO_2NR^7R^8$ oder $CO-COR^{12}$ oder

R^2 Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_5-Alkenyl oder C_3-C_5-Alkinyl, wobei die letztgenannten 3 Reste unabhängig voneinander unsubstituiert oder durch ein oder mehrere Halogenatome oder durch einen oder zwei Reste aus der Gruppe C_1-C_4-Alkoxy und C_1-C_4-Alkylthio substituiert sind, oder

R^3 Halogen, C_1-C_4-Alkyl, C_2-C_5-Alkenyl, C_2-C_5-Alkinyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_3-C_5-Alkenyloxy oder C_3-C_5-Alkinyloxy, wobei die letztgenannten 6 Reste unabhängig voneinander unsubstituiert oder durch ein oder mehrere Halogenatome oder durch einen oder zwei Reste aus der Gruppe C_1-C_4-Alkoxy und Alkylthio substituiert sind, oder $CO-CO-R^{16}$, $CO-CO-OR^{17}$, $CO-NR^{18}R^{19}$, $NR^{18}R^{19}$, $SO_2NR^{18}R^{19}$, Cyano, $S(O)_0-R^{20}$, $CO-R^{16}$, $CO-OR^{17}$, NO_2 oder $C(R^{21})=N-R^{22}$ oder

einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten, ungesättigten oder heteroaromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkyl, wie Methyl, C_1-C_4-Alkoxy, wie Methoxy, C_1-C_4-Alkylthio, C_1-C_4-Haloalkyl, wie CF_3, CN, NO_2, CHO, (C_1-C_4-Alkyl)-carbonyl, wie Acetyl, und (C_1-C_4-Alkoxy)-carbonyl, wie CO_2CH_3, substituiert ist und bei dem bis zu 2 C-Ringpositionen durch CO und bis zu zwei S-Heteroringatome durch SO_2 ersetzt sein können, oder

R^4 Wasserstoff oder Methyl oder

R^5 Wasserstoff oder C_1-C_6-Alkyl, das unsubstituiert oder durch ein oder mehrere Halogenatome oder durch einen oder zwei Reste aus der Gruppe C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, $NR^{13}R^{14}$ und NR^{15}_2 substituiert ist, oder C_3-C_7-Cycloalkyl, Benzyl, unsubstituiertes oder substituiertes Aryl oder unsubstituiertes oder substituiertes Heteroaryl, vorzugsweise H, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Haloalkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, Benzyl, Phenyl, das unsubstituiert oder

durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Methoxy oder Methyl substituiert ist, oder einen 5- oder 6-gliedrigen heteroaromatischen Rest, der bis zu 4 Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthält und unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, NO_2, CN, CHO, $COCH_3$, CO_2CH_3, OCH_3 und SCH_3 substituiert ist, oder

R^6 C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Alkenyl oder C_3-C_6-Alkinyl, wobei die letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch ein oder mehrere Halogenatome oder durch einen oder zwei Reste aus der Gruppe C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, $NR^{13}R^{14}$ und NR^{15}_2 substituiert sind, vorzugsweise C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Haloalkyl, C_3-C_6-Alkenyl oder C_3-C_6-Haloalkenyl, oder

R^7 Wasserstoff oder C_1-C_6-Alkyl, das unsubstituiert oder durch ein oder mehrere Halogenatome oder durch einen oder zwei Reste aus der Gruppe C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio und $NR^{13}R^{14}$ substituiert ist, vorzugsweise H, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Haloalkyl, oder

R^8 Wasserstoff oder C_1-C_4-Alkyl, das unsubstituiert oder durch ein oder mehrere Halogenatome oder durch einen oder zwei Reste aus der Gruppe C_1-C_4-Alkoxy und C_1-C_4-Alkylthio substituiert ist, oder COR^{23}, CO_2R^{24} oder SO_2R^{11}, vorzugsweise H, CH_3, C_2H_5, CHO, $COCH_3$ oder CO_2CH_3, oder

R^9 analog R^5, vorzugsweise Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Haloalkyl, oder

R^{10} analog R^6, vorzugsweise C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Haloalkyl, oder

R^{11} C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Haloalkyl oder

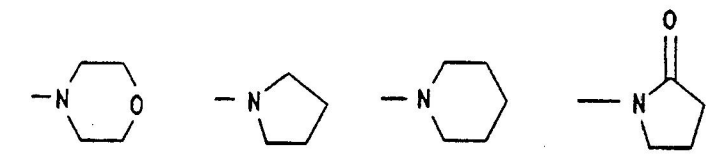
R^{12} Wasserstoff, OH, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, oder C_1-C_4-Haloalkyl, vorzugsweise H oder C_1-C_4-Alkyl, oder

die R^{13} unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_1-C_4-Alkyl, COR^{25} oder CO_2R^{26}, vorzugsweise H, CH_3, C_2H_5, CHO, $COCH_3$, CO-OCH_3 oder CO-OC_2H_5, oder

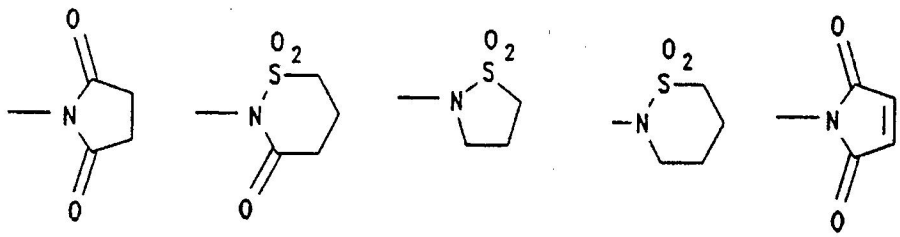
die R^{14} unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_1-C_4-Alkyl, vorzugsweise H, CH_3 oder C_2H_5, oder

NR^{15}_2 unabhängig voneinander einen heterocyclischen 3- bis 7-gliedrigen Ring, der neben dem N-Atom noch ein weiteres Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder durch einen oder

mehrere Reste aus der Gruppe C_1-C_4-Alkyl und Oxo substituiert ist, z.B. heterocyclische Reste der Formeln A_1 bis A_9



A_1 A_2 A_3 A_4



A_5 A_6 A_7 A_8 A_9

oder

R^{16} einen Rest analog R^5,

R^{17} Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Alkenyl, C_3-C_6-Alkinyl, wobei die letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch ein oder mehrere Halogenatome oder durch einen oder zwei Reste aus der Gruppe C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, $NR^{13}R^{14}$ und NR^{15}_2 substituiert sind, vorzugsweise H, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Haloalkyl, C_3-C_6-Alkenyl oder C_3-C_6-Haloalkenyl,

R^{18} einen Rest analog R^7,

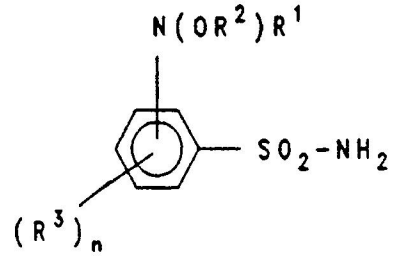
R^{19} einen Rest analog R^8,

R^{20} einen Rest analog R^{11},

R^{21} Wasserstoff, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Haloalkyl, C_1-C_4-Alkoxy, OH, NH_2, Mono- oder Di-(C_1-C_4-alkyl)-amino, vorzugsweise H, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Hydroxy, Amino, Methylamino oder

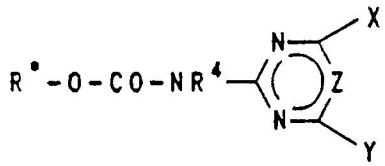
gekennzeichnet, daß man

a) eine Verbindung der Formel (II),



(II)

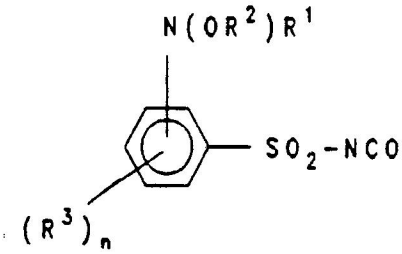
mit einem heterocyclischen Carbamat der Formel (III),



(III)

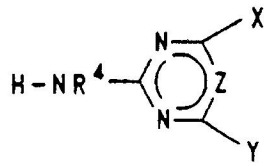
worin R^* gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder (C_1-C_4)Alkyl bedeutet, umsetzt oder

b) vorausgesetzt, daß R^2 ungleich Wasserstoff ist, ein Sulfonylisocyanat der Formel (IV),



(IV)

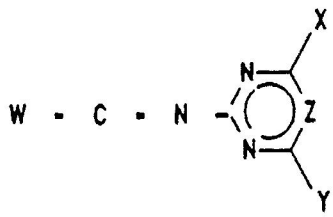
mit einem Aminoheterocyclus der Formel (V)



(V)

umsetzt oder

c) eine Verbindung der Formel (II) mit einem (Thio)Isocyanat der Formel (X)



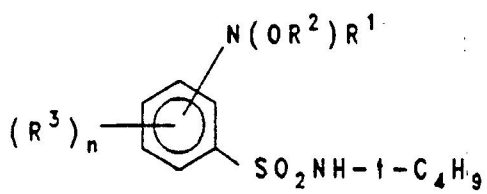
(X)

in Gegenwart einer Base umsetzt, wobei in den Formeln (II) - (V) und (X) die Reste R^1 bis R^4 und n wie in Formel (I) definiert sind und bei den Verfahrensvarianten a) und b) zunächst Verbindungen der Formel (I), worin W = O ist, erhalten werden.

Die Umsetzung der Verbindungen der Formeln (II) und (III) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel, wie z. B. Dichlormethan, Acetonitril, Dioxan oder THF bei Temperaturen zwischen 0° C, vorzugsweise 20° C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels. Als Base werden dabei beispielsweise organische Aminbasen, wie 1,8-Diazabicyclo-[5.4.0]undec-7-en (DBU), insbesondere bei R^* = (subst.) Phenyl (vgl. EP-A-44 807), oder Trimethylaluminium oder Triethylaluminium letztere insbesondere bei R^* = Alkyl (vgl. EP-A-166 516), verwendet.

Die Sulfonamide (II) sind neue Verbindungen. Sie und ihre Herstellung sind ebenfalls Gegenstand der Erfindung.

Man erhält die Verbindungen der Formel (II) z. B. ausgehend von Verbindungen der Formel (VI)



(VI)

durch Umsetzung mit einer starken Säure.

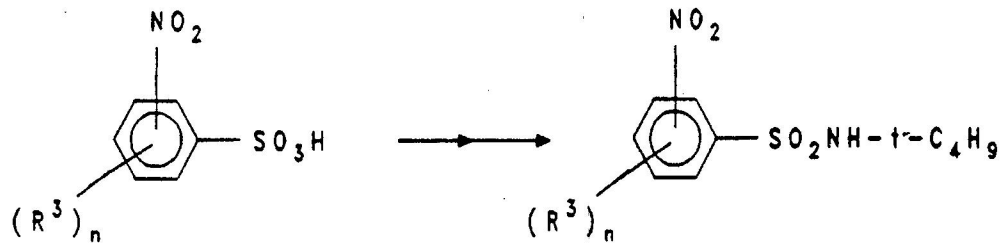
Als starke Säuren kommen z.B. Mineralsäuren, wie H_2SO_4 oder HCl, oder starke organische Säuren, wie Trifluoressigsäure in Frage. Die Abspaltung der t.-Butyl-Schutzgruppe erfolgt beispielsweise bei Temperaturen von -20°C bis der jeweiligen Rückflußtemperatur des Reaktionsgemisches, vorzugsweise bei 0°C bis 40°C. Die Umsetzung kann in Substanz oder auch in einem inerten Solvens, wie z.B. Dichlormethan oder Trichlormethan, durchgeführt werden.

Die Verbindungen der Formel (VI), worin R^2 ungleich Wasserstoff ist (Hydroxylamin-Ether), werden z.B. aus den Verbindungen der Formel (VI), worin R^2 = Wasserstoff ist, analog bekannten O-Alkylierungsreaktionen erhalten, wobei Alkylierungsmittel in Gegenwart einer Base, wie z.B. Kaliumcarbonat oder Natriumhydrid, in einem inerten Lösungsmittel, wie z.B. DMF (Dimethylformamid) oder DMSO (Dimethylsulfoxid), THF (Tetrahydrofuran) oder 1,2-Dimethoxyethan eingesetzt werden. Dialkylsulfate bzw. entsprechende Alkylhalogenide sind dabei als Alkylierungsmittel geeignet (vgl. Houben-Weyl-Klamann, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl., Bd. E XVI/a, S. 271, Thieme Verlag Stuttgart, 1990).

Die Einführung des Substituenten R^1 kann durch Umsetzung der Hydroxylamin-Aromaten (VI), worin R^1 = R^2 = H sind , mit entsprechenden Elektrophilen, wie z.B. Säurechloriden, Säureanhydriden, Isocyanaten und Thioisocyanaten erfolgen (vgl. Houben-Weyl-Klamann, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl., Bd. E XVIa/1, S. 199ff., Thieme Verlag Stuttgart, 1990).

Das Hydroxylaminderivat der Formel (VI), worin R^1 = R^2 = H sind, ist aus der entsprechenden Nitroverbindung (VII) durch Reduktion, z.B. mit Zinkpulver in mit Ammoniumchlorid gepuffertem Ethanol, erhältlich. Als weitere Reduktionsmittel für diese Transformation eignen sich beispielsweise: Platin/Tributylphosphit/4-Dimethylamino-pyridin, Hydrazinhydrat oder Wasserstoff/Raney-Nickel/Ethanol, Hydrazinhydrat/Rhodium, Natriumdihydrogenphosphat/Palladium, usw. (vgl. hierzu: Houben-Weyl-Klamann, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl., Bd. E XVIa/1, S. 49ff., Thieme Verlag Stuttgart 1990).

Die genannte Nitroverbindung der Formel (VII) kann aus der entsprechenden Nitrobenzolsulfonsäure (VIII) hergestellt werden.

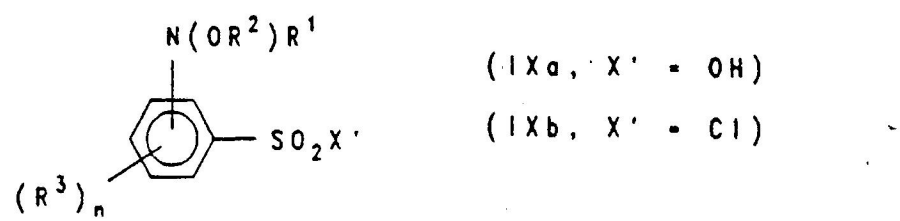


(VIII) (VII)

Zunächst erfolgt die Überführung der Sulfonsäuregruppe der Verbindungen (VIII) in die Sulfochloride, z.B. nach Standardmethoden wie Umsetzung von Phosphoroxychlorid oder Thionylchlorid mit Kalium-Salzen der entsprechenden Sulfonsäuren in inerten Solventien wie Acetonitril und/oder Sulfolan oder in Substanz durch Erwärmen zum Rückfluß (vgl. Houben-Weyl-Klamann, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl., Bd. E XI/2, S. 1067-1073, Thieme Verlag Stuttgart, 1985).

Die Sulfonamidbildung aus den Sulfochloriden mit tert.-Butylamin in Ethanol liefert die Verbindungen (VII) in guten Ausbeuten (vgl. analoge Umsetzungen in WO 89/10921).

Alternativ können die Sulfonamide der Formel II, worin R^1 und R^2 ungleich H sind, durch Aminolyse der entsprechenden Sulfochloride der Formel (IXb)



(IXa, X' = OH)
(IXb, X' = Cl)

erhalten werden, die wiederum aus den Sulfonsäuren (IXa) durch die genannten Standardmethoden (siehe Umsetzungen von (VIII) nach (VII)) leicht erhältlich sind.

Die Verbindungen (IXa) können wiederum aus der Nitrobenzolsulfonsäure (VIII) durch die Folge von Umsetzungen

(1) Reduktion analog der Reduktion von (VII),

(2) N-Acylierung und

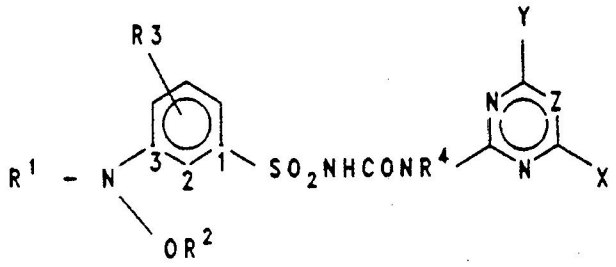
(3) O-Acylierung,

letztere wie bei der Herstellung von (VI) beschrieben, erhalten werden.

Die genannten Ausgangsverbindungen der Formel (VIII) oder deren Sulfochloride sind entweder bekannte bzw. käufliche Verbindungen oder lassen sich auf einfache Weise herstellen, z.B. durch

- Nitrierung (vgl. Houben-Weyl-Müller, "Methoden der organischen Chemie, 4. Aufl., Bd. X/1, S. 463ff., Thieme Verlag Stuttgart, 1971),
- Sulfonierung (Houben-Weyl-Klamann, "Methoden der organischen Chemie, 4. Aufl., Bd. E XI/2, S. 1055ff., Thieme Verlag Stuttgart, 1985; Houben-Weyl-Müller, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl., Bd. IX, S. 435ff., Thieme Verlag Stuttgart, 1955),
- Sulfochlorierung (Houben-Weyl-Klamann, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl., Bd. E XI/2, S. 1067ff., Thieme Verlag Stuttgart, 1985; Houben-Weyl-Müller, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl., Bd. IX, S. 563ff., Thieme Verlag Stuttgart, 1955),
- Einführung eines Restes R^3 z.B. durch Halogenierung (Houben-Weyl-Müller: "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl., Bd. V/3, S. 213ff., Thieme Verlag Stuttgart, 1962; Houben-Weyl-Müller, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl., Bd. V/3, S. 556-561 und 845-853, Thieme Verlag Stuttgart, 1962; Houben-Weyl-Müller, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl., Bd. V/4, S. 233-299 und 437-447, Thieme Verlag Stuttgart, 1960; Houben-Weyl-Müller, "Methoden der organischen Chemie", 4. Aufl., Bd. V/4, S. 557-593 und 639-647, Thieme Verlag Stuttgart, 1960) bzw.
  Alkylierung (G.A. Olah, "Friedel-Crafts-Chemistry", Wiley-Interscience, New York, 1973),
- oder durch Derivatisierung eines bereits vorhandenen Drittsubstituenten, wie z.B. durch Oxidation einer Alkylgruppe (R^3) zu einer Carbonsäure, gefolgt von

Tabelle 1



Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4	X	Y	Z	Fp.
1	CHO	H	H	H	OMe	OMe	CH	150
2	CHO	Me	H	H	OMe	OMe	CH	
3	$COCH_3$	H	H	H	OMe	OMe	CH	154
4	"	H	H	H	OMe	OMe	N	
5	"	H	H	H	OMe	Me	CH	
6	"	H	H	H	Me	Me	CH	
7	"	H	H	H	OMe	Cl	CH	
8	"	H	H	H	OMe	Me	N	
9	$COCH_3$	H	H	H	OMe	OMe	N	
10	"	H	H	H	NHMe	OCH_2CF_3	N	
11	"	H	H	H	NMe_2	SMe	N	
12	"	H	H	Me	OMe	OMe	CH	
13	"	Me	H	H	OMe	OMe	CH	
14	"	Me	H	Me	OMe	OMe	CH	
15	$COCH_2CH_3$	H	H	H	OMe	OMe	CH	158-159
16	"	H	H	H	OMe	OMe	N	
17	$COCH_2CH_3$	H	H	H	OMe	Cl	CH	
18	"	H	H	H	OMe	Me	N	
19	"	Me	H	H	OMe	OMe	CH	
20	$COCF_3$	H	H	H	OMe	OMe	CH	
21	$COCF_3$	H	H	Me	OMe	OMe	CH	
22	$COCF_3$	H	H	H	OMe	Me	N	
23	$COCH_2Br$	H	H	H	OMe	OMe	CH	
24	$COCHCl_2$	H	H	H	OMe	OMe	CH	
25	$COCH(CH_3)_2$	H	H	H	OMe	OMe	CH	
26	COPh	H	H	H	OMe	OMe	CH	
27	CO-c-Pr	H	H	H	OMe	OMe	CH	

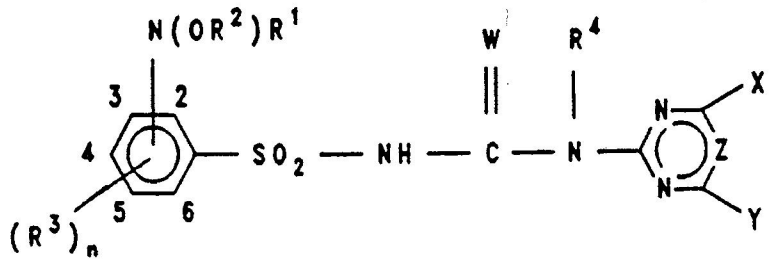
293

286

Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4	X	Y	Z	Fp.
290	"	"	"	"	OMe	Me	N	
291	"	Me	6-N(OMe)$COCH_3$	"	"	"	"	
292	"	"	"	"	"	OMe	CH	
293	CHO	H	6-N(OH)$COCH_3$	"	"	"	"	
294	CHO	Me	6-N(OMe)$COCH_3$	"	"	"	"	
295	CO_2Me	H	6-N(OH)CO_2Me	"	"	"	"	
296	CHO	H	6-NHCHO	"	"	"	"	
297	$COCH_3$	"	"	"	"	"	"	
298	$COCH_3$	H	6-NH-$COCH_3$	"	"	"	"	
299	$COCH_3$	Me	6-NMe-$COCH_3$	H	OMe	OMe	CH	
300	CO_2CHCl_2	H	6-NMe-$COCF_3$	H	OMe	OMe	CH	
301	CO_2CHCl_2	H	6-NHCOCF_3	H	OMe	OMe	CH	
302	$COCH_3$	H	2-CO_2Me	H	OMe	OMe	CH	
303	"	"	"	"	OMe	Me	N	
304	CO-i-Pr	"	"	"	"	OMe	CH	
305	CO_2Me	"	"	"	"	"	"	
306	"	"	"	"	OMe	Me	N	
307	"	"	"	"	Cl	OMe	CH	
308	$COCH_3$	"	2-Cl	"	OMe	OMe	CH	
309	SO_2NHMe	"	"	"	OMe	OMe	CH	
310	SO_2NMe_2	"	"	"	"	"	"	
311	SO_2Me	"	"	"	"	"	"	
312	CHO	H	H	H	OMe	OMe	N	
313	"	"	"	"	OMe	Me	N	
314	"	"	"	"	Me	Me	CH	
315	"	"	"	"	"	OMe	CH	
316	"	"	"	"	Cl	"	CH	
317	"	Me	"	"	OMe	OMe	N	
318	"	"	"	"	OMe	Me	N	
319	"	"	"	"	Cl	OMe	N	
320	"	"	"	"	Me	Me	N	
321	"	Et	"	"	OMe	OMe	CH	
322	"	"	"	"	"	Me	N	
323	"	"	"	"	Me	Me	CH	
324	CHO	Et	H	H	Cl	OMe	CH	
325	"	Pr	"	"	OMe	OMe	CH	

Patentansprüche:

1. Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze,



(I)

worin

R^1 $CO\text{-}R^5$, $CO\text{-}OR^6$, $CO\text{-}NR^7R^8$, $CS\text{-}R^9$, $CS\text{-}OR^{10}$, $CS\text{-}NR^7R^8$, SO_2R^{11}, SOR^{11}, $SO_2NR^7R^8$, $CO\text{-}COR^{12}$,

R^2 Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_2-C_6-Alkinyl, wobei die letztgenannten 3 Reste unabhängig voneinander unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy und C_1-C_4-Alkylthio substituiert sind,

R^3 Halogen, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_2-C_6-Alkenyloxy oder C_2-C_6-Alkinyloxy, wobei die letztgenannten 6 Reste unabhängig voneinander unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkoxy und Alkylthio substituiert sind, oder
$CO\text{-}CO\text{-}R^{16}$, $CS\text{-}R^{16}$, $CO\text{-}CO\text{-}OR^{17}$, $CS\text{-}OR^{17}$, $CS\text{-}SR^{17}$, $CO\text{-}NR^{18}R^{19}$, $CS\text{-}NR^{18}R^{19}$, $NR^{18}R^{19}$, $SO_2NR^{18}R^{19}$, Cyano, $S(O)_0\text{-}R^{20}$, $CO\text{-}R^{16}$, $CO\text{-}OR^{17}$, NO_2 oder $C(R^{21})=N\text{-}R^{22}$
oder
einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten, ungesättigten oder heteroaromatischen Heterocyclus mit bis zu 4 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, C_1-C_4-Haloalkyl, CN, NO_2, CHO, (C_1-C_4-Alkyl)-carbonyl und (C_1-C_4-Alkoxy)-carbonyl substituiert ist und bei

(19) Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets

(11) Publication number: **0 030 138**
A1

(12) EUROPEAN PATENT APPLICATION

(21) Application number: 80304283.7

(22) Date of filing: 28.11.80

(51) Int. Cl.³: A 01 N 47/36
C 07 D 239/42, C 07 D 239/46
C 07 D 239/52, C 07 D 251/16
C 07 D 251/46

(30) Priority: 30.11.79 US 98781

(43) Date of publication of application:
10.06.81 Bulletin 81/23

(84) Designated Contracting States:
AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE

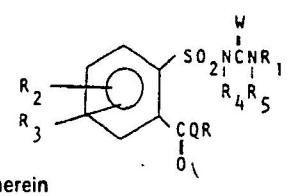
(71) Applicant: E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY
Legal Department 1007 Market Street
Wilmington, Delaware 19898(US)

(72) Inventor: Levitt, George
3218 Romilly Road
Wilmington Delaware 19810(US)

(74) Representative: Hildyard, Edward Martin et al,
Frank B. Dehn & Co. Imperial House 15-19 Kingsway
London WC2B 6UZ(GB)

(54) Herbicidal sulfonamides, and compositions, preparation and use thereof.

(57) Sulfonamide derivatives of the formula



wherein

Q is O, S or -N-
|
R_6

R_1 is optionally substituted pyrimidyl or triazinyl;

R_2 is H, halogen, alkyl, NO_2, SO_2CH_3, OCH_3, SCH_3, CF_3, $N(CH_3)_2$, NH_2 or CN;

R_3 is H, halogen or CH_3;

R_4 is H or CH_3;

R_5 is H, CH_3 or OCH_3;

R_6 is H, alkyl, cyanoalkyl or allyl;

and R is selected from a variety of acyclic and cyclic organic groups: and agriculturally suitable salts thereof;

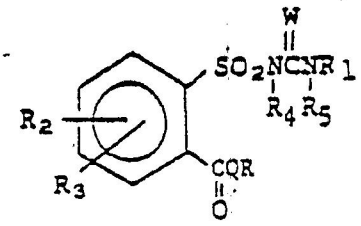
exhibit activity as herbicides and for regulating plant growth. They may be formulated into compositions in conventional manner.

The compounds may be made e.g. by reacting the appropriate 2-substituted benzene sulfonyl isocyanate or isothiocyanate with the appropriate aminopyrimidine or aminotriazine.

EP 0 030 138 A1

Claims:

1. A compound selected from

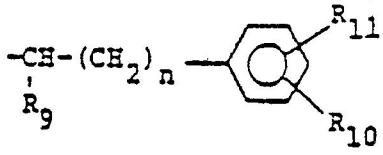


(I)

wherein

Q is O, S or $-\overset{R_6}{\underset{|}{N}}-$;

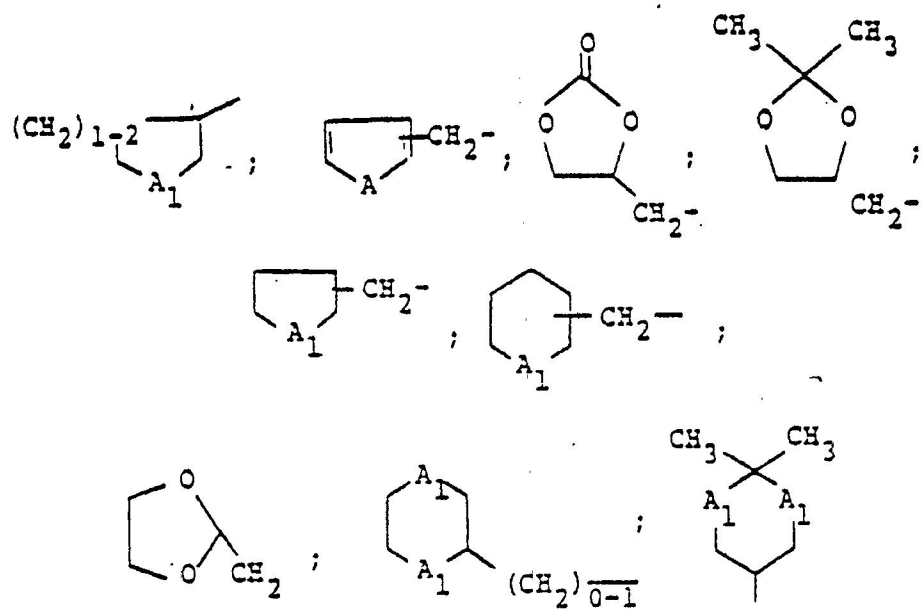
when Q is O or S then R is C_1-C_{12} alkyl; C_3-C_{10} alkenyl; C_2-C_6 alkyl substituted with one to four substituents selected from 0-3 atoms of F, Cl, Br, 0-2 methoxy groups and 0-1 cyano groups; $-CH_2CN$; $-CH_2CO_2CH_3$; $-CH_2CO_2C_2H_5$; C_3-C_6 alkenyl substituted with 1-3 atoms of F, Cl, Br; C_5-C_8 cycloalkyl; C_5-C_8 cycloalkenyl; C_5-C_6 cycloalkyl substituted with any of one to four methyl groups, OCH_3, alkyl of C_2-C_4, F, Cl or Br; C_4-C_{10} cycloalkylalkyl; C_4-C_8 cycloalkylalkyl with 1-2 CH_3; C_7-C_{10} bicycloalkyl; C_7-C_{10} bicycloalkenyl; C_{10} tricycloalkyl , C_{10} tricycloalkenyl;



where R_9 is C_1-C_3 alkyl or hydrogen, R_{10} and R_{11} are independently hydrogen, C_1-C_3 alkyl, Cl, Br, $-OCH_3$, $-OC_2H_5$, or R_{10} and R_{11} may be taken together to form a 5 or 6 member ring:



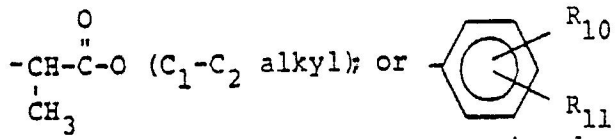
and n is 0, 1, 2 or 3 provided the total number of carbon atoms is ≤ 12;



A is O, S;

A_1 is O, S, SO_2;

1) R may also be C_3-C_{10} alkynyl; C_3-C_6 alkynyl substituted with F, Cl or Br;



where R_{10} and R_{11} are as previously defined;

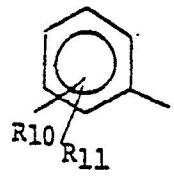
when Q is O, then R is H, M, $-CH_2CH_2OR_7$, $-CH_2CH_2CH_2OR_7$, $-\underset{CH_3}{CH}CH_2OR_7$ where R_7 is $-CH_2CH_3$, $-CH(CH_3)_2$, phenyl, $-CH_2CH_2Cl$, $-CH_2CCl_3$;

$+CH_2CH_2O+_{n'}R_8$, $+\underset{CH_3}{CH}CH_2O+_{n'}R_8$ where R_8 is $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-CH(CH_3)_2$, phenyl, $-CH_2CH_2Cl$, $-CH_2CCl_3$, and n' is 2 or 3; provided R has a total number of carbon atoms ≤ 13;

$-CH_2CH_2-\overset{(O)_{0,2}}{S}-R_{12}$ $-CH_2CH_2CH_2-\overset{(O)_{0,2}}{S}-R_{12}$;

where R_{12} is $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-CH(CH_3)_2$, or phenyl; and

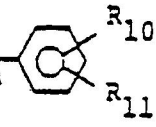
2) R may also be CH_2OR_8' where R_8' is CH_3-, CH_3CH_2, $(CH_3)_2CH-$, $ClCH_2CH_2-$, Cl_3CCH_2, phenyl,



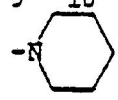
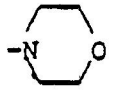
, $CH_3CH_2OCH_2CH_2$ or $CH_3OCH_2CH_2$;

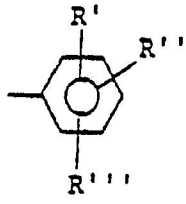
where R_{10} and R_{11} are as previously defined;

when Q is $-\overset{\overset{R_6}{|}}{N}-$ then R is hydrogen; C_1-C_{12} alkyl; $+CH_2CH_2O+_{n'''}R_{12}$; $-CH_2CH_2CH_2OR_{12}$ where R_{12} is as defined above and n''' is 1-3; C_3-C_{10} alkenyl; C_3-C_8 cycloalkyl; C_5-C_6 cycloalkenyl; C_5-C_8 cycloalkyl substituted with 1 to 3 substituents selected from 0-2 $-OCH_3$, 0-3 $-CH_3$ or $-C_2H_5$; trifluoromethylcyclohexyl; C_4-C_{10} cycloalkylalkyl; C_4-C_8 cycloalkylalkyl substituted with 1-2 $-CH_3$; $-CH_2CN$; $-CH_2CH_2CN$;

$\overset{\overset{CH_3}{|}}{-\underset{\underset{CH_3}{|}}{C}-CN}$; $-OCH_3$; $-N(CH_3)_2$; $-\overset{\overset{R_9}{|}}{CH}(CH_2)_n-$ 

where n, R_9, R_{10} and R_{11} are as defined above;

 ;  ;

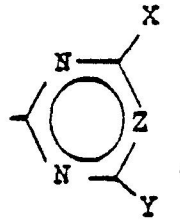
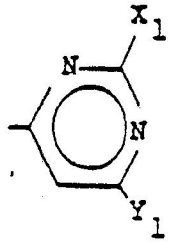


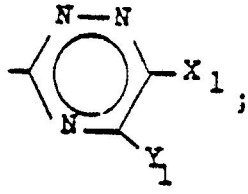
where R' is hydrogen, C_1-C_4 alkyl, $-OCH_3$, F, Br, Cl, $-CF_3$, CN, NO_2, $-SO_2CH_3$, $-SCH_3$, $-N(CH_3)_2$; R'' is hydrogen, C_1-C_4 alkyl, $-OCH_3$, F, Br, Cl; R''' is hydrogen, $-CH_3$, Cl, F or Br;

R_6 is hydrogen, C_1-C_6 alkyl, allyl, $-CH_2CN$; or $-CH_2CH_2CN$; or R_6 and R can be taken together to form $-(CH_2)_4-$, $-(CH_2)_5-$, $-(CH_2)_6-$, $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$;

or $-CH_2CH_2\underset{CH_3}{N}CH_2CH-_2$; with the proviso that when R is $-OCH_3$ or OCH_2CH_3 then R_6 is H or $-CH_3$; when R_6 is $-CH_2CH_2CN$ or $-CH_2CN$ then R is $-CH_2CH_2CN$ or CH_2CN; and R and R_6 have a total number of carbon atoms ≤ 13;

3) R may also be C_3-C_6 alkynyl;

R_1 is  ,  , or

 ;

R_2 is H, Cl, Br, F, C_1-C_3 alkyl, $-NO_2$, $-SO_2CH_3$, $-OCH_3$, $-SCH_3$, $-CF_3$, $-N(CH_3)_2$, $-NH_2$, or $-CN$;

R_3 is H, Cl, Br, F or CH_3;

R_4 is H, or $-CH_3$;

R_5 is H, $-CH_3$, or $-OCH_3$;

M is an alkali metal;

W is oxygen or sulfur;

X is H, Cl, $-CH_3$, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$ or $-OCH_2CH_2OCH_3$;

Y is H; Cl; C_1-C_4 alkyl; C_1-C_4 alkyl substituted with $-OCH_3$, $-OC_2H_5$, $-CN$, $-CO_2CH_3$, $-CO_2C_2H_5$, or 1 to 3 atoms of F, Cl, Br; C_3-C_4 alkenyl; $-CH_2C\equiv CR_{13}$ where R_{13} is H, $-CH_3$, $-CH_2Cl$; $-A-(CH_2)_{\overline{n'}}A_1$ -(C_1-C_3 alkyl), and n', A and A_1 are as previously defined;

$-ACH_2\overset{O}{\overset{\|}{C}}-L$; $-ACH\underset{CH_3}{\overset{O}{\overset{\|}{C}}}-L$; $-ACH_2CH_2\overset{O}{\overset{\|}{C}}-L$, where L is $-NH_2$, $-NCH_3$, $-NH(C_1$-C_4 alkyl), $-N(C_1$-C_4 alkyl)$_2$, $\underset{OCH_3}{|}$

x

C_1-C_6 alkoxy; SCN; $-N_3$; $NR_{16}R_{17}$ where R_{16} is H or CH_3 and R_{17} is H; $-OCH_3$; C_1-C_4 alkyl; C_1-C_4 alkyl substituted with $-CN$, $-CO_2CH_3$, $CO_2C_2H_5$; C_3-C_4 alkenyl; or C_2-C_3 alkyl substituted with $-OCH_3$, OC_2H_5; or R_{16} and R_{17} can be taken together to form $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$; $-O-R_{14}$ where R_{14} is C_1-C_4 alkyl; C_2-C_4 alkyl substituted with 1-3 atoms of F, Cl or Br; C_1-C_4 alkyl substituted with cyano; C_3-C_4 alkenyl; $-CH_2C{\equiv}CR_{13}$; where R_{13} is as previously defined; $-CH_2$-  ; $-SR_{15}$ where R_{15} is C_1-C_4 alkyl, C_1-C_2 alkyl substituted with CN, allyl, propargyl; with the provision that when Y is $\geq$4 carbon atoms, R is $\leq$4 carbon atoms, when X is Cl, then Y is Cl, and when X and Y are both H, then R is $\leq$4 carbon atoms;

4) Y may also be F; Br;

 L; C_1-C_4 alkyl substituted with  L' where L' is NH_2, OH, NCH_3, $NH(C_1$-C_4 alkyl), OCH_3

$N(C_1$-C_4 alkyl$)_2$ or C_3-C_6 alkoxy; $NR_{16}R_{17'}$ where $R_{17'}$ is C_5-C_6 alkyl or C_1-C_4 alkyl substituted with

 L';

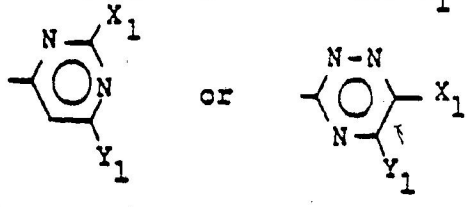
L is also OH;

Z is CH or N;

Y_1 is H, $-OCH_3$, $-CH_3$;

5) Y_1 may also be OCH_2CH_3; and

X_1 is H, Cl, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, $-CH_3$;
providing that X_1 and Y_1 are not both simultaneously hydrogen and when R_1 is



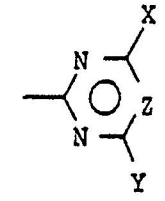
then R_4 and R_5 are both H and R is ≤ 5 carbon atoms, and

a) when Y is not as defined in 4), then R must be as defined in 1), 2) or 3;

b) when Y_1 is not as defined in 5), then R must be as defined in 1), 2) or 3,

and agriculturally suitable salts thereof.

2. A compound of Claim 1 in which

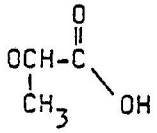
R_1 is  ;

R_4 and R_5 are H; and
W is O.

3. A compound of Claim 2 in which Q is oxygen.

4. A compound of Claim 3 in which R is C_1-C_6 alkyl, C_3-C_4 alkenyl, CH_2CH_2Cl, $CH_2CH_2OCH_3$ or $CH_2OR'_8$.

5. A compound of Claim 4 in which X is CH_3 or OCH_3.

6. A compound of Claim 5 in which Y is CH_3, OCH_3 or  .

7. A compound of Claim 6 in which R_3 is H.

8. A compound of Claim 7 in which R_2 is H.

9. A compound of Claim 8 in which R'_8 is CH_3 or CH_3CH_2 and R is CH_3, $CH_2CH_2OCH_3$ or $CH_2CH_2OC_2H_5$.

10. A compound of Claim 1, [(2-methoxyethoxy)methyl] 2-[[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]aminosulfonyl]benzoate; and agriculturally suitable salts thereof.

11. A compound of Claim 1, [(2-methoxyethoxy)methyl] 2-[[(4-ethoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)aminocarbonyl]-aminosulfonyl]benzoate; and agriculturally suitable salts thereof.

12. A compound of Claim 1, [(4-chlorophenoxy)methyl] 2-[[(4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]aminosulfonyl]benzoate; and agriculturally suitable salts thereof.

13. A compound of Claim 1, methyl 2-[[[4-(1-carboxyethoxy)-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl]aminocarbonyl]aminosulfonyl]benzoate; and agriculturally suitable salts thereof.

14. A compound of Claim 1, [(2-methoxyethoxy)methyl] 2-[[(4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]aminosulfonyl]benzoate; and agriculturally suitable salts thereof.

15. A compound of Claim 1, (4-chloro-2-butynyl) 2-[[(4-methoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-aminosulfonyl]benzoate; and agriculturally suitable salts thereof.

16. A composition suitable for controlling the growth of undesired vegetation comprising an effective amount of a herbicidal compound and at least one of the following: surfactant, solid or liquid diluent, characterised in

that said herbicidal compound comprises a compound of any of claims 1 to 15.

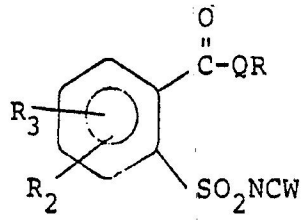
17. A method for controlling the growth of undesired vegetation by applying to the locus to be protected an effective amount of a herbicidal compound, characterised in

that said herbicidal compound comprises a compound of any of claims 1 to 15.

18. A method for regulating the growth of plants which comprises applying to the locus of said plants an effective but substantially non-phytotoxic amount of a plant growth regulant, characterised in

that said plant growth regulant comprises a compound of any of claims 1 to 15.

19. A method for preparing a compound of claim 1 which comprises (a) reacting a compound of formula



wherein

Q is O

R is C_1-C_{12} alkyl; C_3-C_{10} alkenyl; C_2-C_6 alkyl substituted with one to four substituents selected from 0-3 atoms of F, Cl, Br, 0-2 methoxy groups; C_3-C_6 alkenyl substituted with 1-3 atoms of F, Cl, Br; C_5-C_8 cycloalkyl; C_5-C_8 cycloalkenyl; C_5-C_6 cycloalkyl substituted with any of one to four methyl groups, methoxy, alkyl substituents of C_2-C_4, F, Cl or Br; C_4-C_{10} cycloalkylalkyl; C_4-C_8 cycloalkylalkyl with 1-2 CH_3;

$-CH_2CH_2OR_7$; $CH_2CH_2CH_2OR_7$; $\underset{CH_3}{\overset{|}{C}}H-CH_2OR_7$

where R_7 is $-CH_2CH_3$, $CH(CH_3)_2$, phenyl, $-CH_2CH_2Cl$, $-CH_2CCl_3$; $\left(CH_2CH_2O\right)_{\overline{n}}R_8$; $\left(\underset{CH_3}{\overset{|}{C}}HCH_2O\right)_{n'}R_8$ where R_8 is CH_3, $-CH_2CH_3$ $-CH(CH_3)_2$, phenyl, $-CH_2CH_2Cl$, $-CH_2CCl_3$, and n' is 2 or 3;

R_2 is H, Cl, Br, F, C_1-C_3 alkyl, $-NO_2$, $-OCH_3$, $-SCH_3$, CF_3, SO_2CH_3, $N(CH_3)_2$, CN;

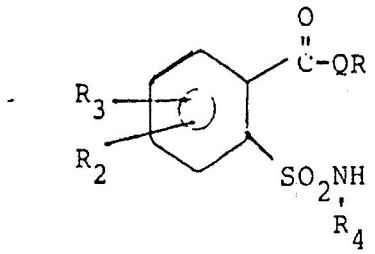
R_3 is H, Cl, Br or CH_3

and W is O or S; with an appropriate amino pyrimidine or aminotriazine of formula

$$HNR_1R_5$$

wherein R_1 and R_5 are as defined in claim 1;

(b) reacting a compound of formula



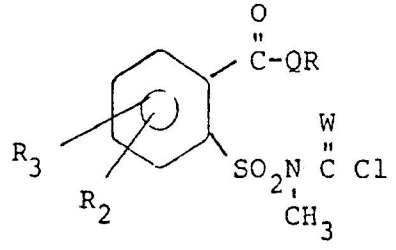
wherein Q, R_2, R_3 and R_4 are as defined in claim 1, and R is as defined in claim 1 other than H or M, with an appropriate triazine or pyrimidine isothiocyanate

$$SCN\text{-}R_1$$

wherein R_1 is as defined in claim 1;

(c) methylating a compound of claim 1 wherein R_4 is H, Q is O, S or $-N-$ (R_6), R is as defined in (a) above and W is O to obtain a compound of claim 1 wherein R_4 is methyl;

(d) reacting a carbamyl or thiocarbamyl chloride of formula



wherein Q and R as as defined in (a) above and W is O or S, with the amine HNR_1R_5 defined in (a) above; or

(e) hydrolyzing an ester of claim 1 wherein R is other than H to obtain a compound of claim 1 wherein R is H, or esterifying a compound of claim 1 wherein R is H to obtain a compound of claim 1 wherein R is other than H.

(19) Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets

(11) Veröffentlichungsnummer: **0 116 518**
A1

(12) # EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 84810056.6

(22) Anmeldetag: 30.01.84

(51) Int. Cl.³: **C 07 D 251/16**
C 07 D 239/46, C 07 D 403/12
C 07 D 417/12, C 07 D 401/12
A 01 N 47/36
//C07C143/80, C07D207/40,
C07D207/38, C07D275/02,
C07D239/42

(30) Priorität: 04.02.83 CH 643/83

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:
22.08.84 Patentblatt 84/34

(84) Benannte Vertragsstaaten:
BE CH DE FR GB IT LI NL

(71) Anmelder: CIBA-GEIGY AG
Postfach
CH-4002 Basel(CH)

(72) Erfinder: Schurter, Rolf, Dr.
Holzmattstrasse 45
CH-4102 Binningen(CH)

(72) Erfinder: Thummel, Rudolph C.
Route d'Alle 424
CH-2892 Courgenay(CH)

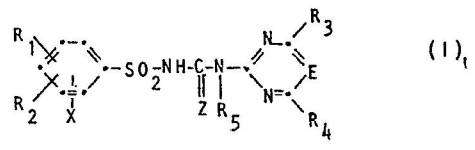
(72) Erfinder: Töpfl, Werner, Dr.
Dorneckstrasse 68
CH-4143 Dornach(CH)

(72) Erfinder: Meyer, Willy
Talweg 49
CH-4125 Riehen(CH)

(72) Erfinder: Dürr, Dieter, Dr.
Brändelistalweg 16
CH-4103 Bottmingen(CH)

(54) **N-Phenylsulfonyl-N'-pyrimidinyl- und -triazinylharnstoffe.**

(57) N-Phenylsulfonyl-N'-pyrimidinyl- und -triazinyl-harnstoffe der allgemeinen Formel I



(I)

und die Salze dieser Verbindungen mit Aminen, Alkali- oder Erdalkali-metallbasen oder mit quaternären Ammoniumbases haben gute pre- und postemergent-selektive herbizide und wuchsregulierende Eigenschaften.

In dieser Formel bedeuten

E Stickstoff-N= oder die Methingruppe –CH=,

R_1 Wassertoff, Halogen, Nitro, Cyan, eine gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxy substituierte Alkyl-, Alkoxy-, Alklythio- Alkylsulfonyl-,Alkylcarbonyl-, Alkylcarbamoyl-, Alkoxycarbonylgruppe,

R_2 Wasserstoff, Halogen, Alkyl, eine gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxy substituierte Alkyl-, Alkoxy-oder Alkylthiogruppe.

R_3 Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy,

R_4 Wasserstoff, Halogen, dasselbe wie R_3, Alkylamino oder Dialkylamino,

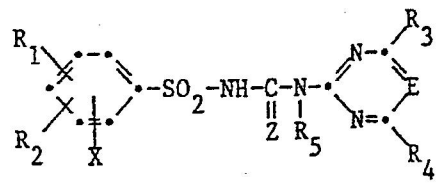
R_5 Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxy,

X eine gegebenenfalls weiter substituierte Alkenylamino-, Cycloalkylamino- oder Cycloalkenylaminogruppe, eine Carbonylamid- oder Sulfonylamidogruppe, wie in der Beschreibung definiert oder einen über das Stickstoffatom gebundenen 5-6 gliedrigen gesättigten Heterocyclus, der noch ein Sauerstoff-, Schwefel - oder Stickstoffatom im Ring enthalten kann und mindestens eine Oxo-Gruppe enthalten muss.

EP 0 116 518 A1

Patentansprüche

1. N-Phenylsulfonyl-N'-pyrimidinyl- und -triazinyl-harnstoffe der Formel



(I),

worin

E Stickstoff -N= oder die Methingruppe -CH=,

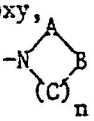
R_1 Wasserstoff, Halogen, Nitro, C_1-C_5 Alkyl, C_1-C_5 Halogenalkyl, Cyano oder einen Rest $-QR_8$, $-COQR_{15}$, $-CONR_9R_{10}$, $-SO-R_{24}$ oder $-SO_2Y$,

R_2 Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4 Alkyl, C_1-C_4 Alkoxy, C_1-C_4 Alkylthio, C_1-C_4 Halogenalkoxy, C_1-C_4-Halogenalkylthio, C_2-C_4 Alkoxyalkyl,

R_3 C_1-C_3 Alkyl, C_1-C_3 Halogenalkyl, C_1-C_3 Alkoxy, C_1-C_3 Halogenalkoxy,

R_4 Wasserstoff, Halogen, C_1-C_3 Alkyl, C_1-C_3 Halogenalkyl, C_1-C_3 Alkoxy, C_1-C_3 Halogenalkoxy, C_2-C_4 Alkoxyalkyl oder eine Gruppe $-NR_{12}R_{13}$,

R_5 Wasserstoff, C_1-C_3 Alkyl, C_1-C_3 Alkoxy,

X eine Gruppe $-NR_6R_7$, $-N(SO_2R_9)_2$ oder 

A eine Gruppe -CO-, $-SO_2-$, $-CONR_{23}-$ oder -COO-,

B C_1-C_4 Alkylen oder C_2-C_4 Alkenylen,

C -CO-, $CR_{21}R_{22}$ oder $-SO_2-$,

n 0 oder 1,

Q Sauerstoff oder Schwefel,

R_6 C_2-C_6 Alkenyl, C_2-C_6 Alkinyl, C_3-C_7 Cycloalkyl, C_5-C_7 Cycloalkenyl, unsubstituiert oder C_1-C_6 Alkyl, C_2-C_6 Alkenyl, C_2-C_6 Alkinyl, C_3-C_7 Cycloalkyl, C_5-C_7 Cycloalkenyl substituiert durch Halogen, Cyan, $-COQR_{23}$, COR_{19} oder R_6 ist eine Gruppe $-COR_{14}$, $-CO_2R_{18}$, $-CONR_{16}R_{17}$, $-N=CR_{20}-COOR_{18}$, $-COCOOR_{19}$, $-CS-NR_{16}R_{11}$,

R_7 ist dasselbe wie R_6 oder Wasserstoff, C_1-C_4 Alkyl oder eine Gruppe $-SO_2R_9$,

R_8 C_1-C_4 Alkyl, C_3-C_5 Alkenyl oder C_3-C_5 Alkinyl unsubstituiert oder substituiert durch Halogen, C_1-C_3 Alkoxy,

R_9 C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4 Halogenalkyl, C_2-C_6 Alkoxyalkyl, C_3-C_6 Alkenyl, C_3-C_6 Alkinyl, Phenyl oder Benzyl,

R_{10}, R_{11}, R_{12}, R_{13} bedeuten unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_1-C_4 Alkyl,

R_{14} Wasserstoff, C_1-C_4 Halogenalkyl, C_2-C_8 Alkoxyalkyl, C_2-C_4-Alkenyl, C_2-C_6 Halogenalkenyl oder C_2-C_4 Alkinyl,

R_{15} C_1-C_4 Halogenalkyl, C_2-C_8 Alkoxyalkyl, C_2-C_4 Alkenyl, C_2-C_4-Halogenalkenyl oder C_2-C_4 Alkinyl,

R_{16} Wasserstoff, C_1-C_4 Alkyl, C_1-C_4 Halogenalkyl, C_2-C_6 Alkoxyalkyl, C_3-C_6 Alkenyl, C_3-C_6 Alkinyl, Phenyl oder Benzyl,

R_{17} dasselbe wie R_{15} aber unabhängig davon

R_{18} dasselbe wie R_{14} aber unabhängig davon,

R_{19} dasselbe wie R_{16} aber unabhängig davon,

R_{20} dasselbe wie R_{16} oder eine Gruppe Cyan oder $-COOR_{23}$,

R_{21}, R_{22} dasselbe wie R_{10} aber unabhängig davon

R_{23} dasselbe wie R_{16} aber unabhängig davon,

R_{24} C_1-C_4 Alkyl,

Y eine Gruppe NR_9R_{23}, C_1-C_4 Alkyl, C_1-C_6 Alkoxy oder C_1-C_6 Halogenalkoxy, und

Z Sauerstoff oder Schwefel

bedeuten, sowie die Salze dieser Verbindungen.

2. Die N-Phenylsulfonyl-N'-pyrimidinyl- und -triazinylharnstoffe der Formel I gemäss Anspruch 1, worin Z Sauerstoff ist.

3. Die N-Phenylsulfonyl-N'-pyrimidinyl- und -triazinylharnstoffe der Formel I gemäss Anspruch 1, worin Z Sauerstoff bedeutet und die Reste R_3 und R_4 zusammen nicht mehr als 4 Kohlenstoffatome enthalten.

4. Die N-Phenylsulfonyl-N'-pyrimidinyl- und -triazinylharnstoffe der Formel I gemäss Anspruch 1, worin

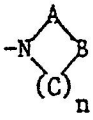
R_1 Wasserstoff, Halogen, Nitro, C_1-C_5-Alkyl, C_1-C_5 Halogenalkyl, C_1-C_5 Alkoxy, C_1-C_5 Halogenalkoxy oder C_1-C_5 Alkoxycarbonyl,

R_2 Wasserstoff,

R_3 C_1-C_3 Alkyl, C_1-C_3 Halogenalkyl, C_1-C_3 Alkoxy oder C_1-C_3 Halogenalkoxy,

R_4 Wasserstoff, Halogen, dasselbe wie R_3, C_1-C_4 Alkyl- oder Dialkylamino,

R_5 Wasserstoff oder Methyl,

X eine Gruppe $-NR_6R_7$ oder 

R_6 C_2-C_6 Alkenyl, C_2-C_6 Alkinyl, C_3-C_7 Cycloalkyl, C_5-C_7 Cycloalkenyl, unsubstituiert oder C_1-C_6 Alkyl, C_2-C_6 Alkenyl, C_2-C_6 Alkinyl, C_3-C_7 Cycloalkyl, substituiert durch Halogen, Cyan, $-COC_1$-C_5 Alkyl, COC_1-C_5 Halogenalkyl, -COOH, $-COO-C_1$-C_5 Alkyl, $COO-C_1$-C_5 Halogenalkyl, $-COC_2$-C_{10} Alkoxyalkyl, $COCOOC_1$-C_5 Alkyl oder R_6 ist eine Gruppe COC_1-C_5 Halogenalkyl, $-COC_2$-C_{10} Alkoxyalkyl, COC_3-C_7 Cycloalkyl, $-COOC_1$-C_5 Alkyl, $-COOC_1$-C_5 Halogenalkyl oder $-COCOOC_1$-C_5 Alkyl,

R_7 ist Wasserstoff, C_1-C_5 Alkyl, dasselbe wie R_6 oder $-SO_2$ C_1-C_5 Alkyl,

A eine Gruppe -CO-, $-SO_2$-, -COO-, -CONH- oder $-CONC_1$-C_5 Alkyl-,

B C_1-C_4 Alkylen oder C_2-C_4 Alkenylen,

C eine Gruppe -CO-, $-SO_2$-, $-CHC_1$-C_5 Alkyl oder $C(C_1$-C_5 Alkyl$)_2$,

n ist 0 oder 1,

E Stickstoff =N- oder Methin =CH- und

Z Sauerstoff bedeuten,

5. Die N-Phenylsulfonyl-N'-pyrimidinyl- oder -triazinyl-harnstoffe der Formel I gemäss Anspruch 1 worin

R_1 Wasserstoff, Halogen oder C_1-C_5 Alkoxycarbonyl,

R_2 Wasserstoff,

R_3 C_1-C_3 Alkyl, C_1-C_3 Halogenalkyl, C_1-C_3 Alkoxy oder C_1-C_3 Halogenalkoxy,

R_4 Wasserstoff, Halogen, dasselbe wie R_3 oder DiC_1-C_3 Alkylamin,

R_5 Wasserstoff oder Methyl,

X NHC_2-C_5 Alkenyl, NHC_3-C_7 Cycloalkyl oder NHC_5-C_7 Cycloalkenyl, welche unsubstituiert oder durch Halogen, Cyano, COC_1-C_5 Halogenalkyl, COC_2-C_6 Alkoxyalkyl oder $COOC_1$-C_5 Alkyl substituiert sind; X ist ferner NHCHO, $NHCOC_1$-C_5 Halogenalkyl, $NHCOOC_1$-C_5 Halogenalkyl, $NHCONHC_1$-C_5 Halogenalkyl, $NHCOCOOC_1$-C_5 Alkyl, $NHSO_2C_1$-C_5 Alkyl, $N(SO_2C_1$-C_5 Alkyl$)_2$ oder X ist ein über Stickstoff gebundener 5-6 gliedriger gesättigter Heterocyclus, der noch ein Sauerstoff-, Schwefel- oder Stickstoffatom im Ring enthalten kann und mindestens eine Oxo-Gruppe enthalten muss.

6. N-[2-(2',2'-Dichlorpropionylamido)phenylsulfonyl]-N'-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-harnstoff gemäss Anspruch 1.

7. N-(2-Chloracetamidophenylsulfonyl)-N'-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-harnstoff gemäss Anspruch 1.

8. N-(2-Methylsulfonylamido-6-chlorphenylsulfonyl)-N'-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-harnstoff gemäss Anspruch 1.

9. N-(2-Bromacetamidophenylsulfonyl)-N'-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-harnstoff gemäss Anspruch 1.

10. N-(2-Methoxyacetamidophenylsulfonyl)-N'-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-harnstoff gemäss Anspruch 1.

11. N-[2-Chloracetamido-6-chlorphenylsulfonyl]-N'-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-harnstoff gemäss Anspruch 1.

12. N-[2-(4'-Chlorbutyrylamido)phenylsulfonyl]-N'-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-harnstoff gemäss Anspruch 1.

13. N-(2-Methoxyoxalylamidophenylsulfonyl)-N'-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-harnstoff gemäss Anspruch 1.

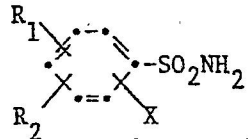
14. N-(2-Methoxyoxalylamido-6-chlorphenylsulfonyl)-N'-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-harnstoff gemäss Anspruch 1.

15. N-(2-Chloracetamidophenylsulfonyl)-N'-(4-methoxy-6-methyl-pyrimidin-2-yl)-harnstoff gemäss Anspruch 1.

16. N-[2-(4'-Chlorbutyrylamido)phenylsulfonyl]-N'-(4-methoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)-harnstoff gemäss Anspruch 1.

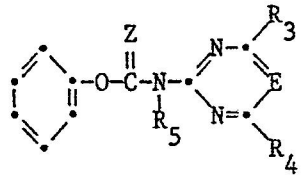
17. N-[2-(2'-Pyrrolidon-1'-yl)phenylsulfonyl]-N'-(4-methoxy-6-methyl-pyrimidin-2-yl)-harnstoff gemäss Anspruch 1.

18. Verfahren zur Herstellung der N-Phenylsulfonyl-N'-pyrimidinyl- und -triazinyl-harnstoffe der Formel I, Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man ein Benzolsulfonamid der Formel II



(II),

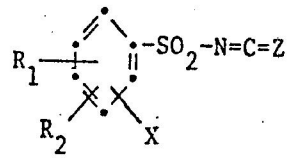
worin R_1, R_2 und X die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, in Gegenwart einer Base mit einem N-Pyrimidinyl- oder -triazinylcarbamat der Formel



(III),

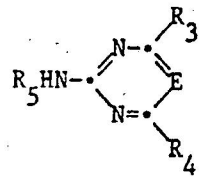
worin E, R_3, R_4, R_5 und Z die unter Formel I gegebene Bedeutung haben und der Phenylrest gegebenenfalls substituiert ist, umsetzt und gegebenenfalls in ihre Salze überführt.

19. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man ein Phenylsulfonylisocyanat oder -isothiocyanat der Formel IV



(IV),

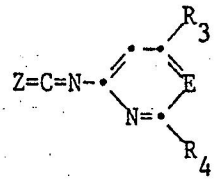
worin R_1, R_2, X und Z die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base, mit einem Amin der Formel V



(V),

worin R_3, R_4 und R_5 die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, umsetzt und gegebenenfalls in ihre Salze überführt.

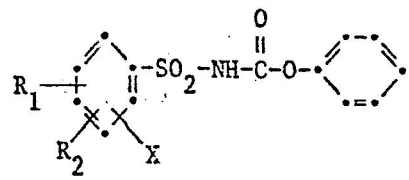
20. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, Anspruch 1, worin R_5 Wasserstoff bedeutet, dadurch gekennzeichnet, dass man Sulfonamide der oben angegebenen Formel II gegebenenfalls in Gegenwart einer Base mit einem Isocyanat oder Isothiocyanat der Formel VI



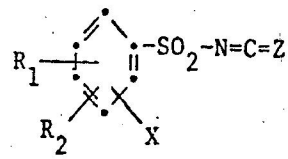
(VI)

worin E, R_3, R_4 und Z die unter Formel I gegebenen Bedeutungen haben, umsetzt und gegebenenfalls in ihre Salze überführt.

21. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man ein N-Phenylsulfonylcarbamat der Formel VII

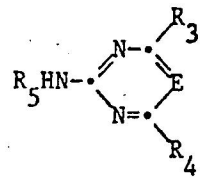


(VII)



(IV),

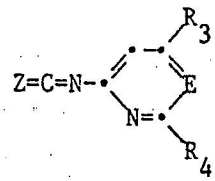
worin R_1, R_2, X und Z die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base, mit einem Amin der Formel V



(V),

worin R_3, R_4 und R_5 die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, umsetzt und gegebenenfalls in ihre Salze überführt.

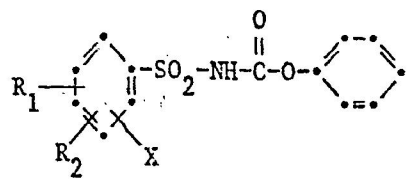
20. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, Anspruch 1, worin R_5 Wasserstoff bedeutet, dadurch gekennzeichnet, dass man Sulfonamide der oben angegebenen Formel II gegebenenfalls in Gegenwart einer Base mit einem Isocyanat oder Isothiocyanat der Formel VI



(VI)

worin E, R_3, R_4 und Z die unter Formel I gegebenen Bedeutungen haben, umsetzt und gegebenenfalls in ihre Salze überführt.

21. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man ein N-Phenylsulfonylcarbamat der Formel VII

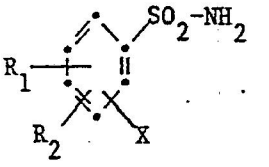


(VII)

worin R_1, R_2 und X die unter Formel I gegebene Bedeutung haben und der Phenylrest gegebenenfalls substituiert sein kann, mit einem Amin der oben angegebenen Formel V umsetzt und gegebenenfalls in ihre Salze überführt.

22. Verfahren zur Herstellung von Additionssalzen der Formel I, Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man einen Sulfonylharnstoff der Formel I mit einem Amin, einem Alkalimetall- oder Erdalkalimetallhydroxid oder einer quaternären Ammoniumbase umsetzt.

23. Phenylsulfonamide der Formel II



(II),

worin R_1, R_2 und X die unter Formel I, Anspruch 1, gegebene Bedeutung haben.

24. Ein herbizides und den Pflanzenwuchs hemmendes Mittel, dadurch gekennzeichnet, dass es neben Träger- und/oder anderen Zuschlagstoffen als Wirkstoff mindestens einen N-Phenylsulfonyl-N'-triazinyl- oder -pyrimidinyl-harnstoff der Formel I, Anspruch 1, enthält.

25. Die Verwendung der N-Phenylsulfonyl-N'-triazinyl- oder pyrimidinylharnstoffe der Formel I gemäss Anspruch 1 oder sie enthaltender Mittel zur selektiven pre- oder post-emergenten Bekämpfung von Unkräutern in Nutzpflanzenkulturen.

26. Die Verwendung der Verbindungen der Formel I gemäss Anspruch 1 oder sie enthaltender Mittel in Getreide-, Baumwolle-, Soja-, Mais- und Reiskulturen.

FO 7.5 NU/bg*

308 37-3

VII: Compuesto 1.26 de la EP 01116518 (Schurter) = Documento 3
VIII: Compuesto 306 de la WO 94/06778 (Schnabel) = Documento 1

ALOMY: Alopecurus myosuroides
AMARE: Amananthus retroflexus

9. Con el fin de superar la objeción referente a la ausencia de nivel inventivo de la presente invención, mi poderdante considera necesario reiterar que, en términos de nivel inventivo, es imprescindible conocer las directrices universales que sobre el examen de este requisito ha emitido la OMPI, especialmente mediante el sistema PCT y su reglamento (véase el párrafo IV-5.1, reglamento PCT) según el cual, el estudio de patentabilidad no debe alejarse del concepto utilizado ampliamente por los rectores de la propiedad intelectual mundial. En este orden de ideas, la directrices del examen preliminar internacional del PCT, capítulo IV, ítem 8 sobre actividad inventiva, especifica claramente que el Examinador deberá tener en cuenta el estado de la técnica en su conjunto, en relación no sólo a un documento tomado separadamente, sino a combinaciones de varios documentos, si dichas combinaciones son "evidentes" para cualquier experto en la materia. Allí mismo se determina que el término "evidente" significa que no va más allá del progreso o de la tecnología sino que se deduce simple o lógicamente del estado de la técnica, de manera que no se supone el ejercicio de alguna habilidad o capacidad más allá de la que se espera de un experto en la materia con los conocimientos a la fecha pertinente.

10. De acuerdo con las nociones generalmente aceptadas dentro del derecho de patentes en todo el mundo, la actividad, altura o nivel inventivo es la cuestión más difícil y controvertida del examen de fondo de las solicitudes de patentes.

11. La noción de persona del oficio trata de una persona con formación técnica, que ha hecho el aprendizaje o estudios en el dominio general al que se refiere la invención; que posee, además, experiencia práctica en el dominio particular de la invención. La expresión calificativa "de nivel medio" significa que si la persona del oficio debe ser un especialista en el ramo al que se refiere la invención, no se trata del mejor experto que pueda encontrarse en el país sino de una persona de calificación media teniendo en cuenta el nivel que ha alcanzado en ese ramo en el país respectivo.

12. En función de cada caso particular que se esté examinando, la noción abstracta y general de persona del oficio debe ser individualizada, es decir, precisada. En ese sentido, es importante no