



Industria y Comercio

Organización CSA Ltda

SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 00-058177-A-00000-0000

Fecha: 2000-08-02 17:22:00 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 2 PATENTES Eve: 1 REGDEPOSITO
Act. 411 PRESENTACION Folios: 181

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones



SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

00-58177A

21. EXPEDIENTE No. 00-58177A

54. TÍTULO TIENIL (AMINO) SULFONILUREAS COMPUESTOS Y HERBICIDAS PARA
PREPARAR DICHOS COMPUESTOS Y HERBICIDAS QUE LOS CONTIENEN

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO LEVERKUSEN, REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

74. APODERADO EMILIO FERRERO

C.C. 438,019 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D. C.,



No. 00-058177-A-00000-0000

Fecha: 2000-08-02 17:22:00 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 2 PATENTES Eve: 1 REGDEPOSITO
Act. 411 PRESENTACION Folios: 181**FORMULARIO ÚNICO DE CONVERSIÓN, DIVISIÓN Y FUSIÓN DE SOLICITUDES**

1

SOLICITUD DE:☐ Conversión.☒ División☐ Fusión☒ Patente de Invención☐ Patente de Modelo de Utilidad☐ Registro de Diseño Industrial☐ Esquemas de Trazado para Circuitos Integrados

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

Dirección: Leverkusen 51368

República Fed. de Alemania

Nacionalidad o Domicilio:

Lugar de Constitución: Sociedad constituida
y existente bajo las leyes Rep. Alemana

Teléfono: 546 09 70 Fax: 249 40 70

E-mail: clientes@camyp.com

IDENTIFICACIÓNC.C. ☐ NIT ☐C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: EMILIO FERRERO

Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35

Teléfono: 347 36 11 Fax: 217 92 11

E-mail: clientes@camyp.com.

IDENTIFICACIÓNC.C. ☒ NIT ☐C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 438.019 T.P. 31.929

4

CONVERSIÓN

Expediente No: _____

De: _____

A: _____

5

DIVISIÓN

Expediente No: 00058177

No. de Divisionales: 1

6

FUSIÓN

Expediente No: _____

Expediente No: _____

7

Comprobante de pago No.: 06-65,86 Fecha: 28 de agosto de 2006
06-65,935 28 de agosto de 2006

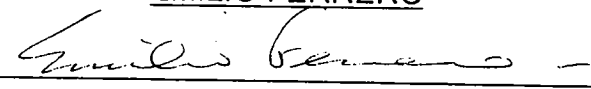
8

Anexos

EP 1598351

- ☒ Comprobante de pago de la tasa
- ☒ Poderes, si fuere el caso
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.
- ☒ Copia de la Solicitud Divisional.

9

NOMBRE: EMILIO FERRERO**FIRMA:** 

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

NOTA: Esta es una solicitud de división de la materia contenida originalmente en la solicitud de patente No. 00.058.177 La solicitud de división de la materia se hace como consecuencia de las observaciones hechas por ese Despacho y que fueron dadas a conocer al solicitante por medio del oficio No. 5868 notificado por fijación en lista del 1 de junio de 2006. Por lo tanto pido que esta solicitud de división de materia sea tratada con el beneficio de la fecha 2 de agosto de 2000.

De acuerdo con el artículo 36 de la Decisión 486, el solicitante aclara que la materia de la presente solicitud queda cubierta por la prioridad DE.. No. 199 37 118.0 del 6 de agosto de 1999.

Nota: La copia básica original se encuentra en el expediente No. 00.058.177.

0698
6028

CONSULADO DE COLOMBIA

CERTIFICACION

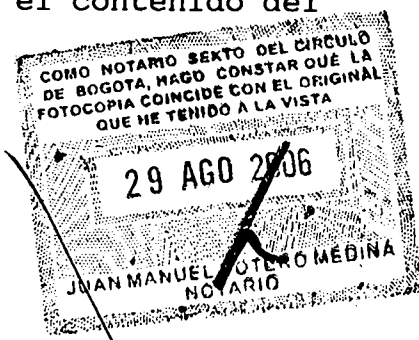
No. 145

Bonn, 8 de agosto de 1996

El suscrito Segundo Secretario Encargado de las Funciones Consulares de Colombia en Bonn, vistos los documentos presentados por los interesados, CERTIFICA: Que el señor Dirk Heiderhoff quien como Notario en Leverkusen autenticó la firma de los signatarios DR. ROLF BRAUN y DR. JOACHIM GREMM del documento precedente, ejercían en la fecha las funciones indicadas y su firma corresponde a la registrada en este Consulado; que la empresa BAYER AKTIENGESELLSCHAFT está constituida de acuerdo con las leyes de la República Federal de Alemania y cumple su objeto conforme a las mismas según el Registro Comercial HRB 1122 del Tribunal de Primera Instancia de Leverkusen; que los señores BRAUN y GREMM, quienes firmaron el documento precedente, son los representantes legales de la empresa arriba mencionada.

El suscrito Segundo Secretario Encargado de las Funciones Consulares no asume responsabilidad alguna por el contenido del documento.

Pagado el impuesto de timbre
y derechos consulares.
Valor US\$106,00 = DM\$169,60



JUAN PABLO GONZALEZ
Segundo Secretario
Encargado de las Funciones Consulares

COPIA DE LA FOTOCOPIA
DOCUMENTO DESEMPENA
LAS FUNCIONES INDICADAS
1996 AGO 23 A LAS 5:38
NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
SANTAFE DE BOGOTA D.C.
JEFE DE LEGALIZACIONES

1.045/1996/2006

REPRESENTACION Y PODER

For patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, slogans.

Para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales.

REPRESENTATION AND
POWER OF ATTORNEY

I (we), the undersigned / Yo (nosotros), abajo firmado (s)

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

of / domiciliado (s) en D-51368 Leverkusen,
GERMANY,

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, variedades vegetales y denominaciones de origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

In due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; and LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciled at Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in their turn, or both of them, shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above-named attorneys to obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose we authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

Given and signed this / Dado y firmado hoy _____

31st July 1996

in/en Leverkusen

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

Signature

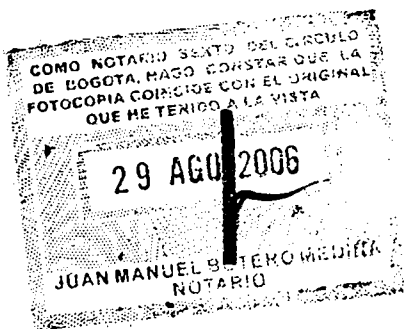
Firma

LEGALIZACION

El Señor Cónsul de Colombia debe expedir un *certificado consular* sobre (1) la existencia legal de la compañía que otorga el poder, (2) que ésta ejerce su objeto social, y (3) que las personas que otorgan el poder están autorizadas para darlo. A este efecto les solicitamos que muestren al Señor Cónsul las pruebas que acreditan esos hechos (1), (2) y (3).

LEGALIZATION

The Colombia Consul must issue a *consular certificate* the legal existence of the company which is a Power-of-Attorney, (2) that it is in actual exercise of company purposes, and (3) that the persons who execute the Power of Attorney is authorized to do so. To this effect, show the Consul the evidence to prove the above facts and (3).



NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL DE COLOMBIA: Según los artículos 65 del C. de P.C. y 480 del C. de Co., el poderdante es una sociedad, el Señor Cónsul debe certificar que tuvo a la vista las pruebas de su existencia, que ejerce su objeto social y que quien confiere el poder es su representante.

GRNr. 799/1996

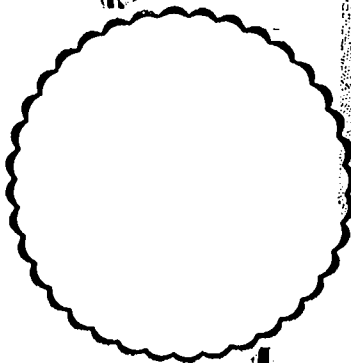
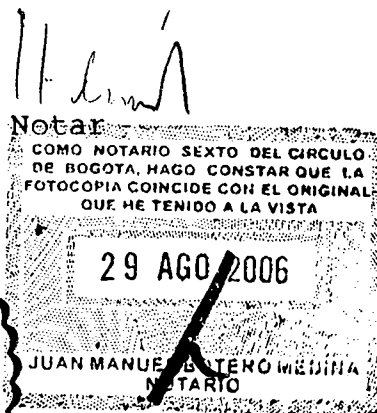
Ich beglaubige die vor mir vollzogenen Unterschriften der Herren :

1. Dr. Rolf Braun, geschäftsansässig in D 51368
Leverkusen, Bayerwerk,
2. Dr. Joachim Gremm , geschäftsansässig in D 51368
Leverkusen, Bayerwerk,

- persönlich bekannt -.

Ich bescheinige aufgrund Einsicht vom heutigen Tage in das Handelsregister des Amtsgerichts Leverkusen - HRB 1122 -, daß die genannten Herren berechtigt sind, die Bayer Aktiengesellschaft in Leverkusen als Prokuristen gemeinschaftlich zu vertreten.

Leverkusen, den 31. Juli 1996



Die Echtheit der vorstehenden Unterschrift des Notars *Juan Manuelintero Medina* in Leverkusen sowie die Echtheit des beigefügten Dienststempels - siegels werden hiermit bestätigt. Zugleich wird bescheinigt, daß der Notar zur Vornahme der Amtshandlung befugt war.

Köln, den 02. Aug. 1996
Der Präsident des Landgerichts

R. Wohlschlag
(Dr. Wohlschlag)





COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO LA VISTA

29 AGO 2006

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO



6

TRADUCCION OFICIAL No. 5424

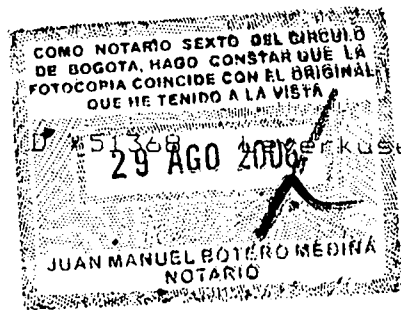
de un documento escrito en Alemán, el cual para su identificación se sella con el sello de la traductora, lo mismo que la presente.-

(A continuación de la representación y poder conferido a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO tpa, 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555, domiciliados en la Carrera 4 No. 72-35, Bogotá, Colombia, el 31 de julio de 1996 por los señores Dr. Rolf Braun y Dr. Joachim Gremm, apoderados de la Bayer Aktiengesellschaft, Leverkusen, RFA:)

Protocolo notarial 1799/1996

Certifico la autenticidad de las firmas puestas ante mí por los señores

1. Dr. Rolf Braun, domiciliado en D 51368 Leverkusen, Bayerwerk,
 2. Dr. Joachim Gremm, domiciliado en D 51368 Leverkusen, Bayerwerk,
- a quienes conozco en persona-.



Certifico por haber tenido a la vista el Registro de Comercio del Juzgado Municipal de Leverkusen - HRB 1122 - que los señores mencionados están facultados, en su calidad de apoderados, para representar conjuntamente a la Bayer Aktiengesellschaft, domiciliada en Leverkusen.

Leverkusen, 31 de julio de 1996

Fdo.: firma ilegible

Notario

(Hilo y oblea notarial en relieve:)

Dirke Heiderhoff - Notario de Leverkusen

(dorso:)

Se certifica la autenticidad de la firma antecedente del notario de Leverkusen, Dirke Heiderhoff, y la del sello oficial que la acompaña. Igualmente se certifica que el mencionado notario estaba facultado para realizar ese acto oficial.

Colonia, 02 de agosto de 1996

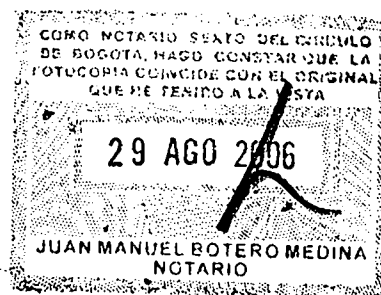
El Presidente del Juzgado Municipal

Fdo.: firma ilegible

(Dr. Wohlmich)

(sello redondo en tinata:)

El Presidente del Juzgado Municipal de Colonia



EN ESPAÑOL: La legalización de las firmas antecedentes por el Consulado de Colombia en Bonn bajo el No. 145 del 08 de agosto de 1996 y por el Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia bajo el No. 198692 del 23 de agosto de 1996.

Pagados Impuesto de timbre y derechos consulares US\$ 106,--

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, de la cual se deja copia en los archivos de estas oficinas para su confrontación.

Santafé de Bogotá, 2 de septiembre de 1996

COMO NOTARIO SEXTO DE SANTAFE DE BOGOTA
HAGO CONSTAR QUE LA FIRMA DE

[Handwritten signature]

COINCIDE CON LA REGISTRADA POR EL (ELLOS)
EN ESTA NOTARIA.

SANTAFE DE BOGOTA, D.C.

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

1996 SET 14 10:16

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD

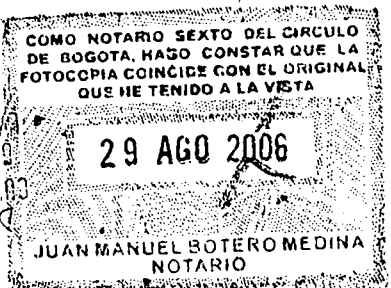


COPIA FIRMA A LA LEGALIZACION
DE LA FIRMA A LA LEGALIZACION
DE LA FIRMA A LA LEGALIZACION

205398
2027568

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

[Handwritten signature]



9

CAVELIER

ABOGADOS

TELEFAX: (57) (1) 2358850
CABLES CAVELEYES
TELEX: 45479

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4ª, No 72-35
BOGOTA 8, COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE
TELEFONO: (57) (1) 2120100

Señor Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

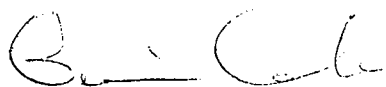
Poderdante: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el: 31-07-96

Yo, GERMAN CAVELIER, obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado, atentamente manifiesto a Usted que sustituyo el poder que me ha sido conferido en la persona del doctor EMILIO FERRERO, Abogado con Tarjeta Profesional No. 31.929, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos faltan en este momento.

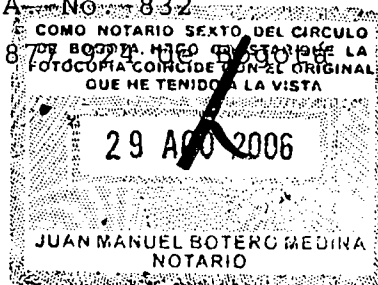
Señor Jefe,



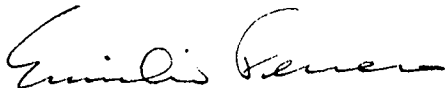
GERMAN CAVELIER

T.P.A. No. 832

C.C. No. 2.87



Acepto:



EMILIO FERRERO

T.P.A. No 31.929

C.C. No. 438.019 de Usaquén

NOTARIA SEXTA DE BOGOTA
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
06 SET 1998

Santafé de Bogotá D. C.
Ante Mí JUAN MANUEL BOTEK MEDINA
NOTARIO SEXTO DEL CÍRCULO DE BOGOTÁ
Compareció(eron) personalmente,

[Signature]
[Signature]

quien(és) exhibió(eron) los) c. 428019

y la(s) libreta(s) de) 2877924

77852 7737929

domiciliado en Bogotá, D. C., al que se le(s) firmó(s) que
aparece(n) en el documento que se le(s) suya(s) y que
el contenido es verdadero y correcto.
En constancia se le(s) otorgó este documento.

[Signature]

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
29 AGO 2006
JUAN MANUEL BOTEK MEDINA
NOTARIO

[Signature]





**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung
einer Patentanmeldung**

Aktenzeichen: 199 37 118.0
Anmeldetag: 6. August 1999
Anmelder/Inhaber: Bayer Aktiengesellschaft, Leverkusen/DE
Bezeichnung: Substituierte Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe
IPC: C 07 D, A 01 N

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

München, den 10. Juli 2000
Deutsches Patent- und Markenamt
Der Präsident
Im Auftrag

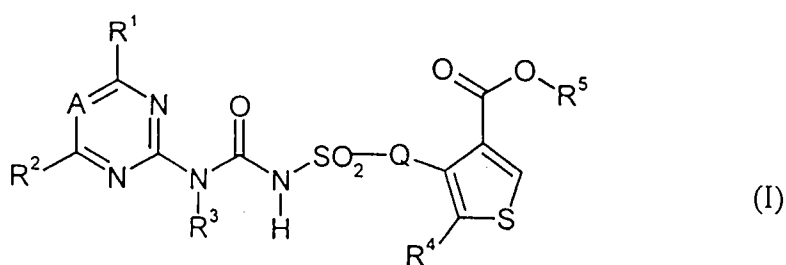
Agurks

Substituierte Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe

Die Erfindung betrifft neue substituierte Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

Es ist bereits bekannt, daß bestimmte substituierte Thienylsulfonylharnstoffe herbizide Eigenschaften aufweisen (vgl. EP-A-30142 / US-A-4481029 / US-A-4599103 / US-A-4701535, EP-A-97122 / US-A-4549898, EP-A-207609 / US-A-4668281). Die herbizide Wirksamkeit dieser bekannten Verbindungen ist jedoch nicht in allen Belangen zufriedenstellend.

Es wurden nun die neuen substituierten Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe der allgemeinen Formel (I)



in welcher

A für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung steht,

Q für eine Einfachbindung oder für NH steht,

R¹ für Wasserstoff, Halogen oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Aryloxy oder Heterocycl-
oxy steht,

- R² für Wasserstoff, Halogen oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Aryloxy oder Heterocycl-
oxy steht,
- 5 R³ für Wasserstoff oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht,
- R⁴ für Halogen oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht und - für den Fall,
daß Q für NH steht - auch für Wasserstoff steht, und
- 10 R⁵ für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl,
Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl oder Heterocyclyl steht,
- sowie Salze von Verbindungen der Formel (I) gefunden.
- 15 Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffgruppierungen, wie Alkyl, Alkenyl
oder Alkynyl, sind - auch in Verknüpfungen mit Heteroatomen, wie in Alkoxy -
soweit möglich jeweils geradkettig oder verzweigt.
- 20 Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein,
wobei bei Mehrfachsubstitution die Substituenten gleich oder verschieden sein
können.
- Bevorzugte Substituenten bzw. Bereiche der in den oben und nachstehend aufge-
führten Formeln vorhandenen Reste werden im folgenden definiert.
- 25 A steht bevorzugt für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung.
- Q steht bevorzugt für eine Einfachbindung oder für NH.
- 30 R¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, für Halogen, für jeweils gegebenenfalls
durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy,

Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenoxy, Oxetanyloxy, Furyloxy oder Tetrahydrofuryloxy.

5

R² steht bevorzugt für Wasserstoff, für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenoxy, Oxetanyloxy, Furyloxy oder Tetrahydrofuryloxy.

10

R³ steht bevorzugt für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.

15

R⁴ steht bevorzugt für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht und - für den Fall, daß Q für NH steht - auch für Wasserstoff.

20

R⁵ steht bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Oxetanyl, Furyl oder Tetrahydrofuryl.

25

30

A steht besonders bevorzugt für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung.

- Q steht besonders bevorzugt für eine Einfachbindung oder für NH.
- 5 R¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino.
- 10 R² steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino.
- 15 R³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl substituiertes Methyl oder Ethyl.
- 20 R⁴ steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl.
- 25 R⁵ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl,
- 30

Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl.

- 5 A steht ganz besonders bevorzugt für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung.
- Q steht ganz besonders bevorzugt für eine Einfachbindung oder für NH.
- 10 R¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylamino, Ethylamino, oder für Dimethylamino.
- 15 R² steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylamino oder Ethylamino, oder für Dimethylamino.
- 20 R³ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.
- R⁴ steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl.
- 25 R⁵ steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Propenyl oder Propinyl.
- A steht am meisten bevorzugt für eine CH-Gruppierung.
- 30 R¹ und R² stehen am meisten bevorzugt für Methoxy.

R^3 steht am meisten bevorzugt für Wasserstoff.

Gegenstand der Erfindung sind vorzugsweise auch die Natrium-, Kalium-, Magnesium-, Calcium-, Ammonium-, C₁-C₄-Alkyl-ammonium-, Di-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium-, Tri-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium-, Tetra-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium-, Tri-(C₁-C₄-alkyl)-sulfonium-, C₅- oder C₆-Cycloalkyl-ammonium- und Di-(C₁-C₂-alkyl)-benzyl-ammonium-Salze von Verbindungen der Formel (I), in welcher A, Q, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ die oben vorzugsweise angegebene Bedeutung haben.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen angegebenen Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zu Herstellung benötigten Ausgangsstoffe bzw. Zwischenprodukte. Diese Restdefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen Bereichen bevorzugter Verbindungen, beliebig kombiniert werden.

Erfindungsgemäß bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), bei welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

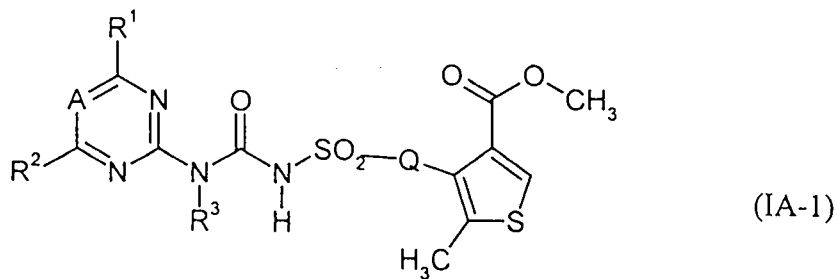
Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), bei welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), bei welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß am meisten bevorzugt sind die Verbindungen, bei denen R¹, R², R³ oder A eine der als am meisten bevorzugt ausgeführte Bedeutung bestehen.

Beispiele für die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) sind in den nachstehenden Gruppen aufgeführt.

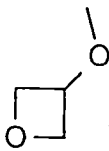
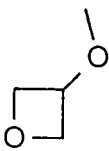
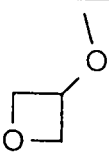
Gruppe 1

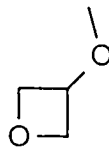


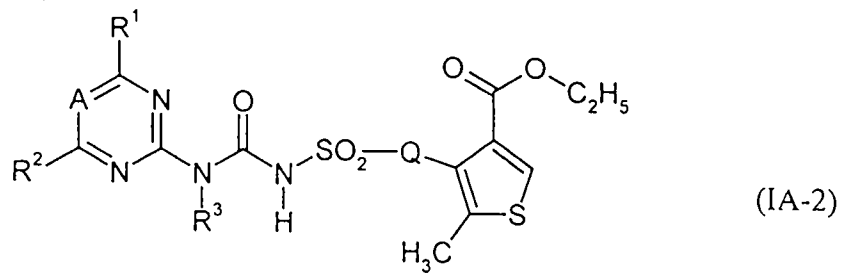
5

A, Q, R¹, R² und R³ haben darin beispielhaft die nachstehend aufgeführte Bedeutung:

A	Q	R ¹	R ²	R ³
CH	-	OCH ₃	OCH ₃	H
CH	NH	OCH ₃	OCH ₃	H
CH	-	CH ₃	OCH ₃	H
CH	NH	CH ₃	OCH ₃	H
CH		CH ₃	CH ₃	H
CH	NH	CH ₃	CH ₃	H
CH	-	Cl	OCH ₃	H
CH	-	H	CH ₃	H
N	-	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
N	-	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
N	-	CH ₃	OCH ₃	H

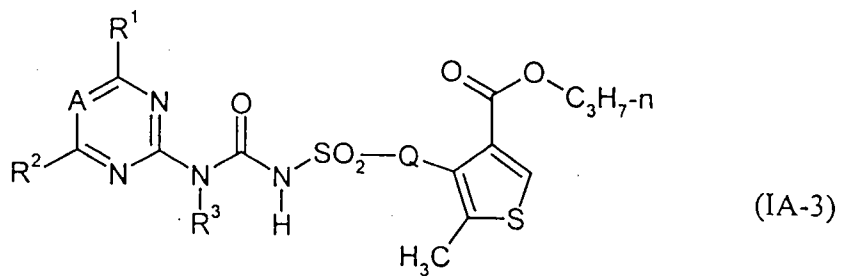
A	Q	R ¹	R ²	R ³
N	NH	CH ₃	OCH ₃	H
N	-	OCH ₃	OCH ₃	H
N	NH	OCH ₃	OCH ₃	H
N	-	CH ₃	CH ₃	H
N	-	OCHF ₂	N(CH ₃) ₂	H
N	-	CH ₃	SCH ₃	H
N	-	C ₂ H ₅	OCH ₃	H
N	-	CH ₃	OC ₂ H ₅	H
N	-	H	OCH ₃	H
N	-	OCH ₃		H
N	-	CH ₃	N(CH ₃) ₂	H
CH	-	OCH ₃		H
CH	-	CH ₃		H
CH	-	Cl		H

A	Q	R ¹	R ²	R ³
N	-	H		H
N	-	N(CH ₃) ₂	OCH ₂ CF ₃	H

Gruppe 2

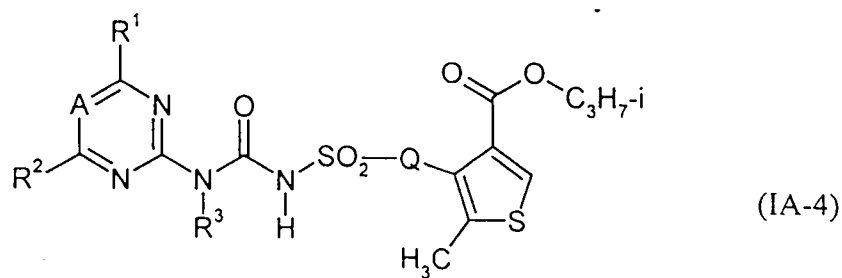
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 3

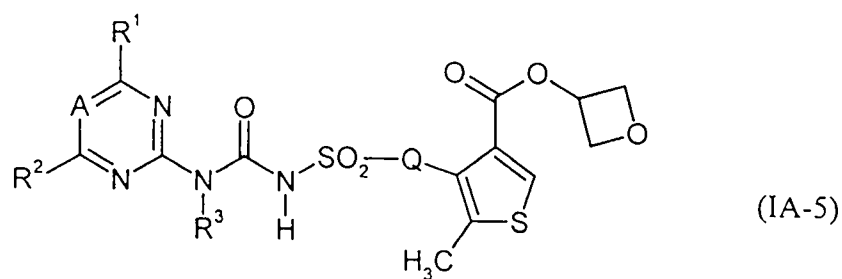
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

10

Gruppe 4

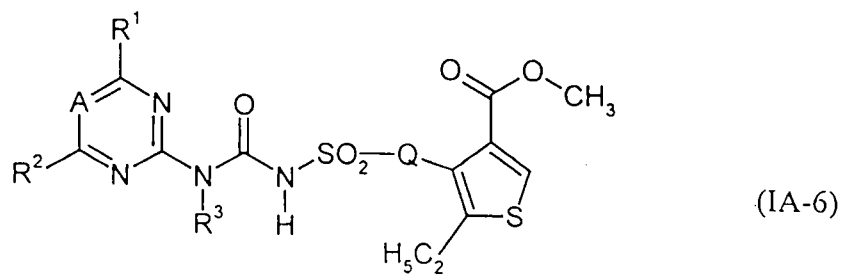
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 5

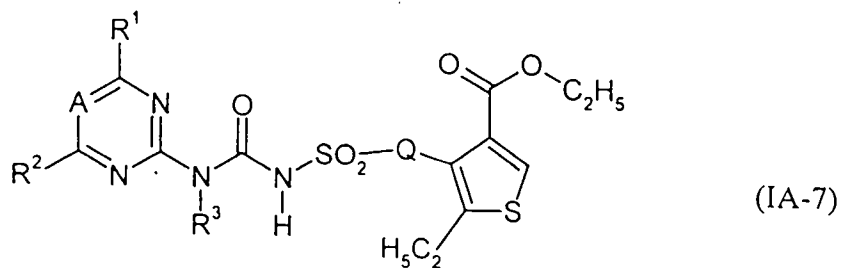
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

10

Gruppe 6

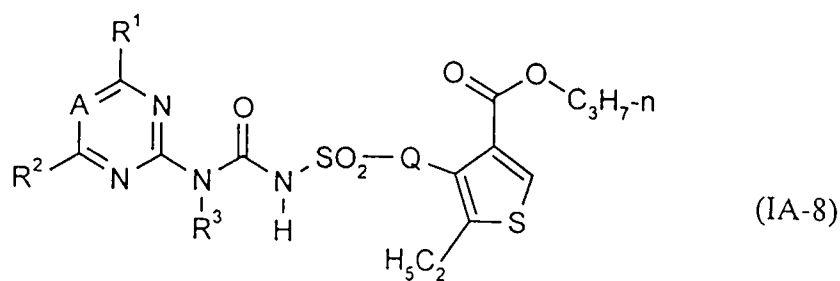
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

15

Gruppe 7

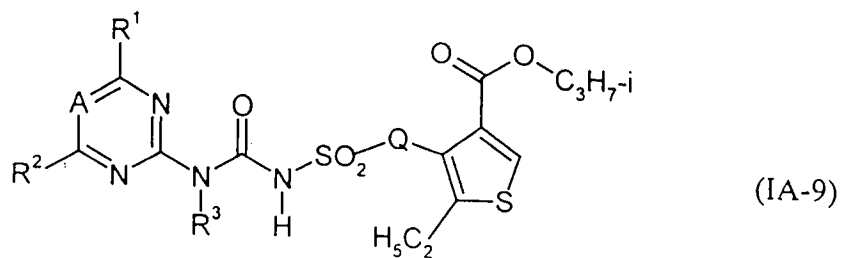
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 8

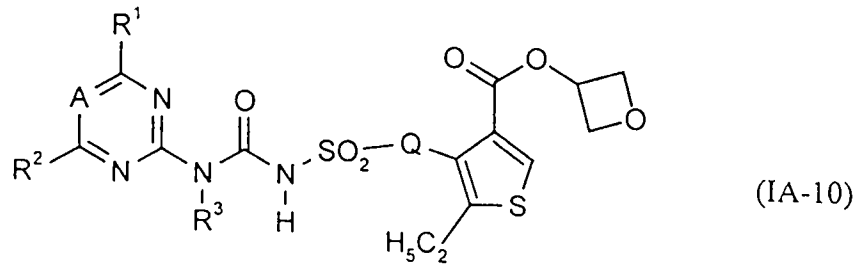
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

10

Gruppe 9

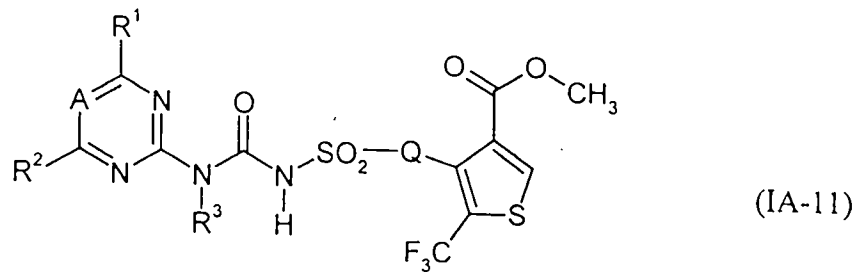
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

15

Gruppe 10

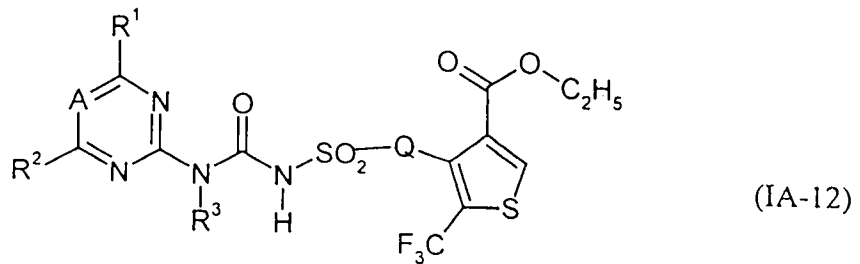
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 11

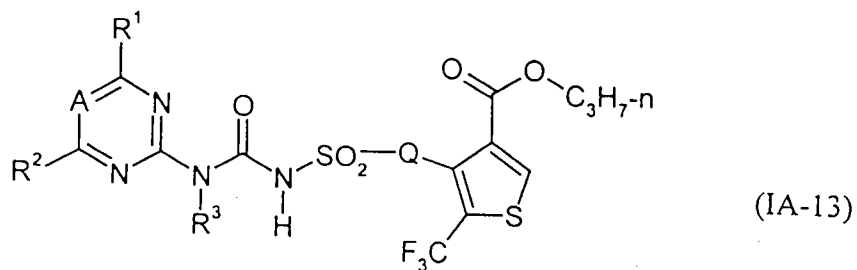
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

10

Gruppe 12

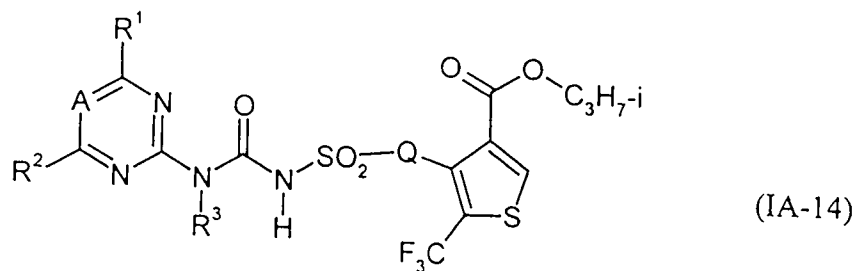
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

15

Gruppe 13

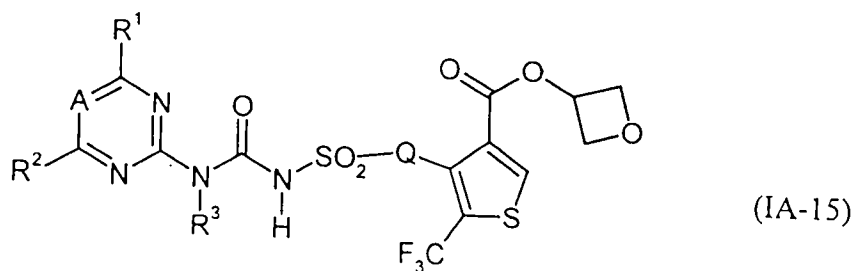
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 14

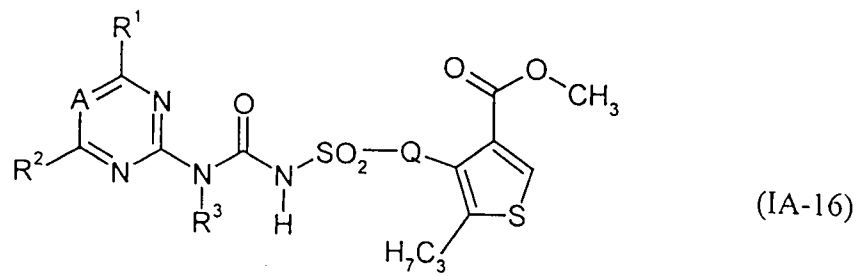
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

10

Gruppe 15

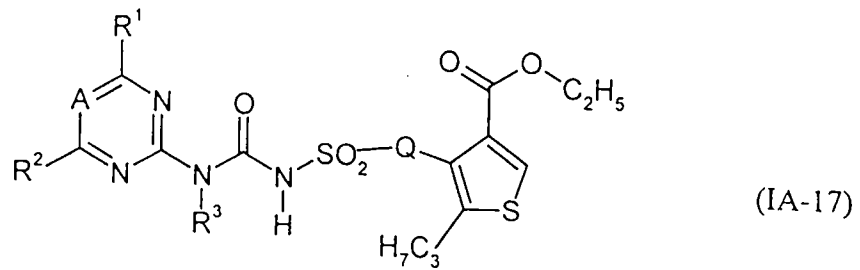
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

15

Gruppe 16

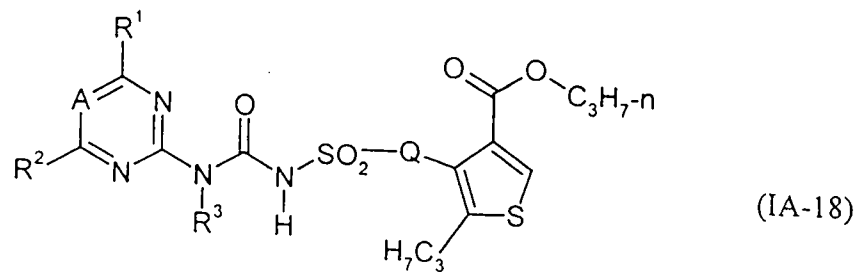
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 17

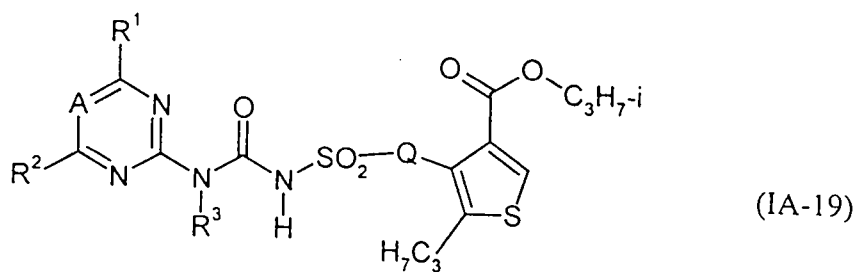
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

10

Gruppe 18

A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

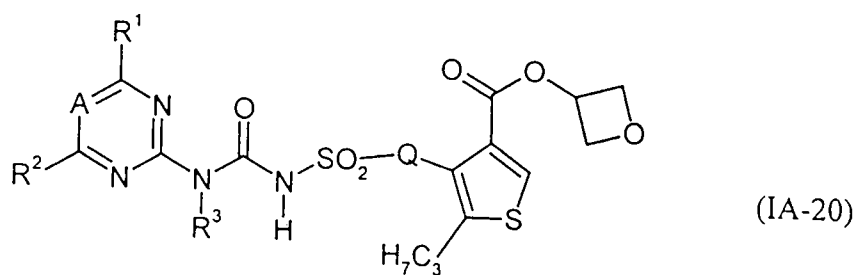
15

Gruppe 19

(IA-19)

A, Q, R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

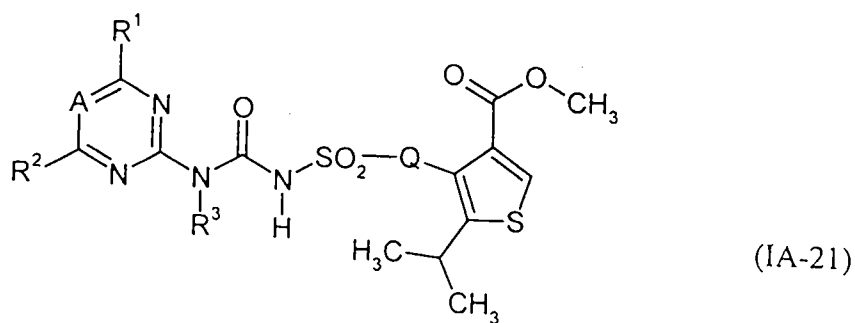
5

Gruppe 20

(IA-20)

A, Q, R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

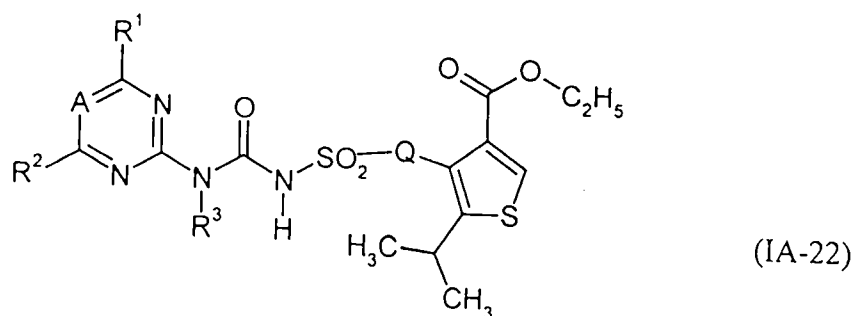
10

Gruppe 21

(IA-21)

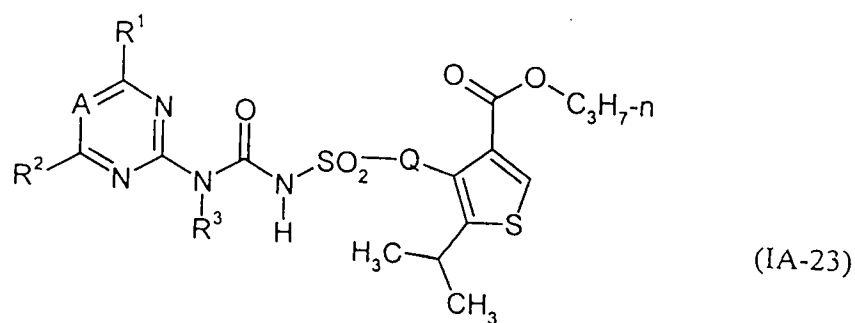
A, Q, R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

15

Gruppe 22

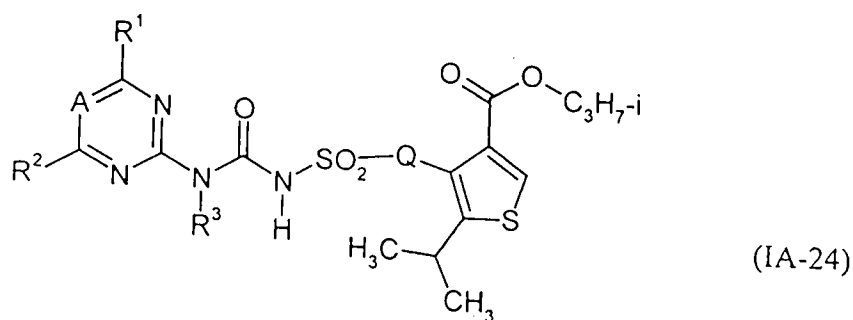
A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 23

A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

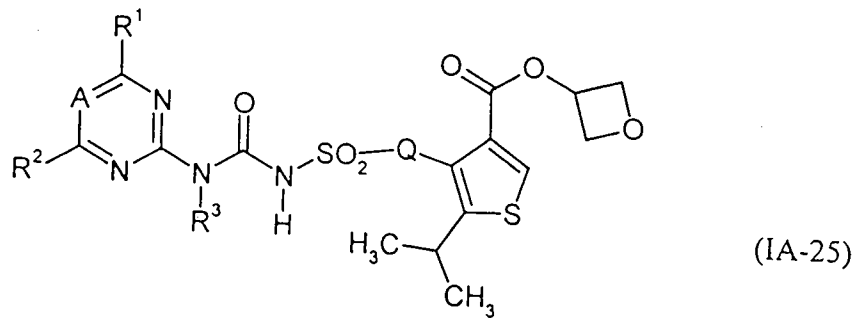
10

Gruppe 24

A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

15

Gruppe 25



A, Q, R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

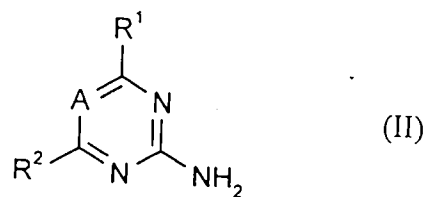
5

Die neuen substituierten Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke herbizide Wirksamkeit aus.

Man erhält die neuen substituierten Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe der allgemeinen Formel (I), wenn man

10

(a) Aminoazine der allgemeinen Formel (II)



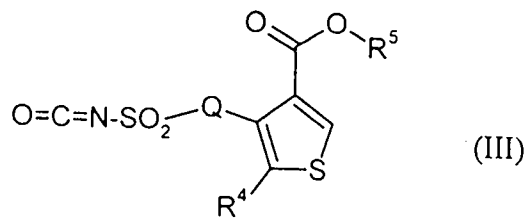
15

in welcher

A, R¹ und R² die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Thienyl(amino)sulfonylisocyanaten der allgemeinen Formel (III)

20



in welcher

Q, R⁴ und R⁵ die oben angegebene Bedeutung haben,

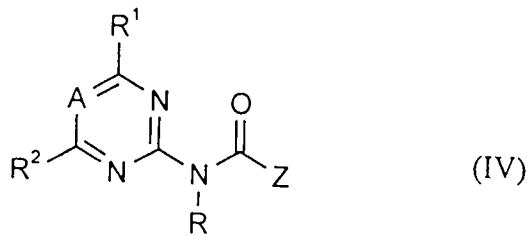
5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder wenn man

10

(b) substituierte Aminoazine der allgemeinen Formel (IV)



in welcher

15

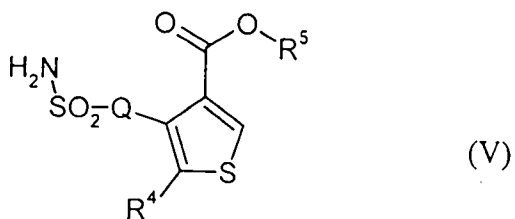
A, R¹ und R² die oben angegebene Bedeutung haben,

Z für Halogen, Alkoxy oder Aryloxy steht und

20

R die oben für R³ angegebene Bedeutung hat oder für die Gruppierung -C(O)-Z steht,

mit Thiophenderivaten der allgemeinen Formel (V)



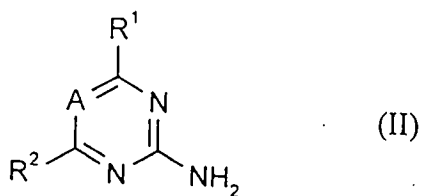
in welcher

5 Q, R⁴ und R⁵ die oben angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

10 oder wenn man

(c) Aminoazine der allgemeinen Formel (II)

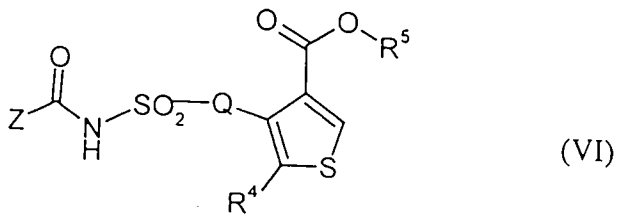


15 in welcher

A, R¹ und R² die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Thiophenderivaten der allgemeinen Formel (VI)

20



in welcher

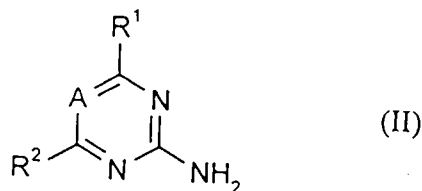
Q, R⁴ und R⁵ die oben angegebene Bedeutung haben und

5 Z für Halogen, Alkoxy oder Aryloxy steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

10 oder wenn man

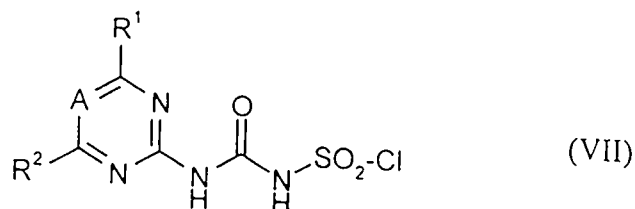
(d) Aminoazine der allgemeinen Formel (II)



15 in welcher

A, R¹ und R² die oben angegebene Bedeutung haben,

20 mit Chlorsulfonylisocyanat gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die hierbei gebildeten Chlorsulfonylaminocarbonylamino-azine der allgemeinen Formel (VII)

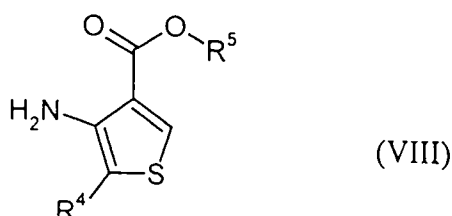


in welcher

A, R¹ und R² die oben angegebene Bedeutung haben,

- nach Zwischenisolierung oder „in situ“ -

5 mit substituierten Aminothiophenen der allgemeinen Formel (VIII)



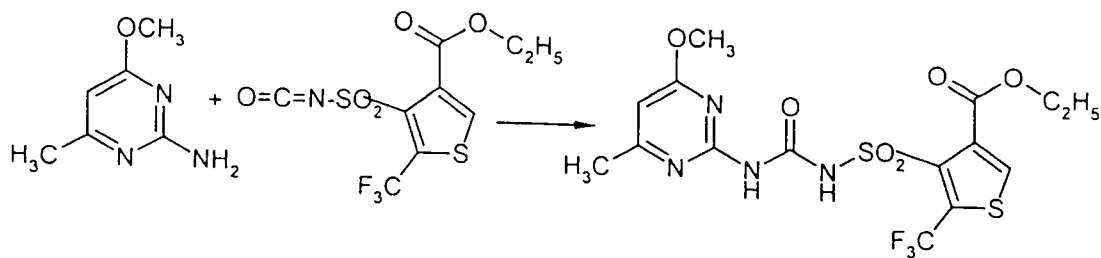
in welcher

10 R⁴ und R⁵ die oben angegebene Bedeutung haben,

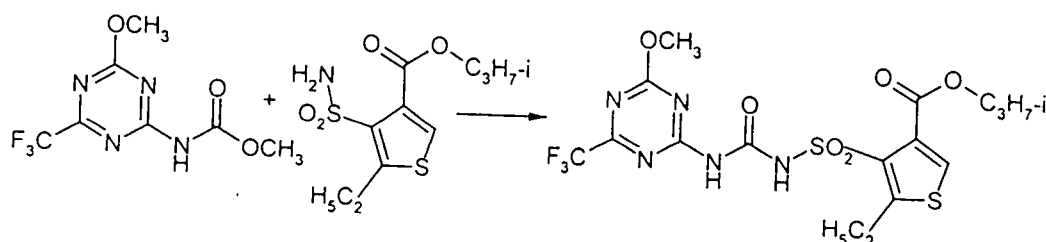
gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

15 und gegebenenfalls die nach den Verfahren (a), (b), (c) oder (d) erhaltenen Verbindungen der Formel (I) nach üblichen Methoden in Salze überführt.

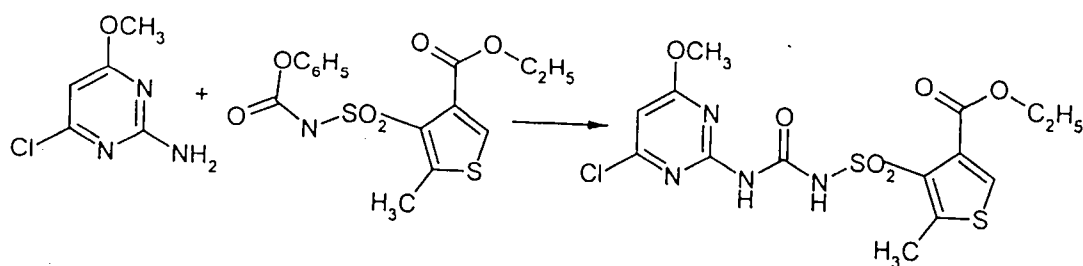
Verwendet man beispielsweise 2-Amino-4-methoxy-6-methyl-pyrimidin und 4-Ethoxycarbonyl-2-trifluormethyl-thien-3-yl-sulfonylisocyanat als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



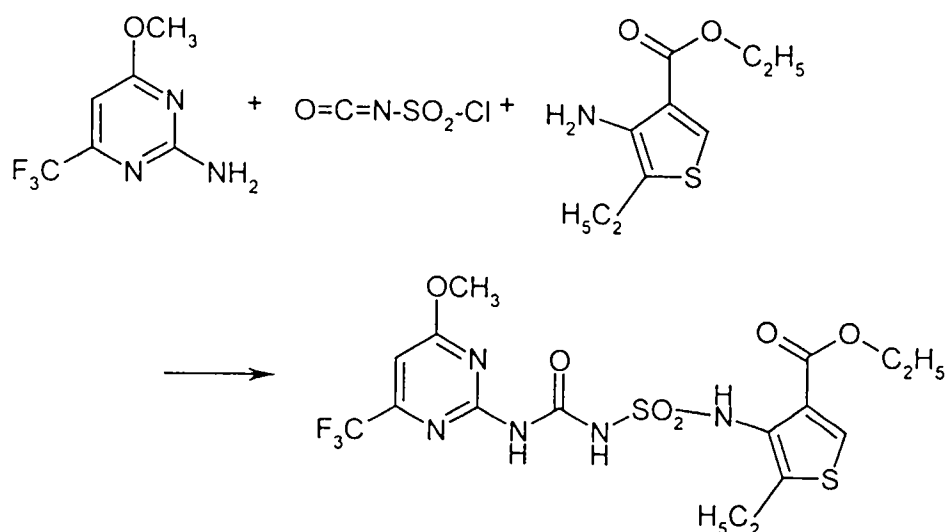
Verwendet man beispielsweise 2-Methoxycarbonylamino-4-methoxy-6-trifluor-methyl-1,3,5-triazin und 2-Ethyl-4-i-propoxycarbonyl-thiophen-3-sulfonamid als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Verwendet man beispielsweise 2-Amino-4-chlor-6-methoxy-pyrimidin und N-(4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-thien-3-yl-sulfonyl)-O-phenyl-urethan als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Verwendet man beispielsweise 2-Amino-4-methoxy-6-trifluormethyl-pyrimidin, Chlorsulfonylisocyanat und 3-Amino-2-ethyl-thiophen-4-carbonsäure-ethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Die bei den erfindungsgemäßen Verfahren (a), (c) und (d) zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Aminoazine sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der Formel (II) haben A, R^1 und R^2 vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für A, R^1 und R^2 angegeben wurden.

Die Aminoazine der Formel (II) sind bekannte, zum Teil im Handel erhältliche Syntheschemikalien.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Thienyl(amino)sulfonylisocyanate sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der Formel (III) haben Q, R^4 und R^5 vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für Q, R^4 und R^5 angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (III) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP 30142 / US-A-4481029 / US-A-4599103 / US-A-4701535).

Man erhält die Thienyl(amino)sulfonylisocyanate der Formel (III), wenn man Thiophenderivate der allgemeinen Formel (V) - oben - mit Phosgen bzw. Thiophosgen, gegebenenfalls in Gegenwart eines Alkylisocyanats, wie z.B. Butylisocyanat, gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels, wie z.B. Diazabicyclo[2.2.2]-octan, und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Toluol, Xylol oder Chlorbenzol, bei Temperaturen zwischen 80°C und 150°C umsetzt und nach Ende der Umsetzung die flüchtigen Komponenten unter vermindertem Druck abdestilliert.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Aminoazine sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In der Formel (IV) haben A, R¹ und R² vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für A, R¹ und R² angegeben wurden; Z steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkoxy oder Phenoxy, insbesondere für Chlor, Methoxy, Ethoxy oder Phenoxy.

Die Ausgangsstoffe der Formel (IV) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. US 4690707, DE 19501174).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Thiophenderivate sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In der Formel (V) haben Q, R⁴ und R⁵ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für Q, R⁴ und R⁵ angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (V) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP 30142 / US-A-4481029 / US-A-4599103 / US-A-4701535, Herstellungsbeispiele).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Thiophenderivate sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In der Formel (VI) haben Q, R⁴ und R⁵ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für Q, R⁴ und R⁵ angegeben wurden; Z steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkoxy oder Phenoxy, insbesondere für Chlor, Methoxy, Ethoxy oder Phenoxy.

Die Ausgangsstoffe der Formel (VI) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Amino-thiophene sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (VIII) haben R⁴ und R⁵ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für R⁴ und R⁵ angegeben worden sind.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (VIII) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. Aust. J. Chem. 48 (1995), 1907-1916).

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) kommen vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone,

wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, sowie Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) werden vorzugsweise in Gegenwart eines geeigneten Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören beispielsweise Erdalkali- oder Alkalimetall- -hydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonat, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natriummethylat, Natriumethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C, vorzugsweise zwischen -10°C und +120°C.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, die erfindungsgemäßen Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist

jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuß zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Aus den erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können gegebenenfalls Salze hergestellt werden. Man erhält solche Salze in einfacher Weise nach üblichen Salzbildungsmethoden, beispielsweise durch Lösen oder Dispergieren einer Verbindung der Formel (I) in einem geeigneten Lösungsmittel, wie z.B. Methylenchlorid, Aceton, tert-Butyl-methylether oder Toluol, und Zugabe einer geeigneten Base. Die Salze können dann - gegebenenfalls nach längerem Rühren - durch Einengen oder Absaugen isoliert werden.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliantes, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala,

Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung, z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen sowie zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeigen starke herbizide Wirksamkeit und ein breites Wirkungsspektrum bei Anwendung auf dem Boden und auf oberirdische Pflanzenteile. Sie eignen sich in gewissem Umfang auch zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen, sowohl im Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse

Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaum-
5 erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und
10 Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospho-
15 lipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-
20 farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung
25 finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

Acetochlor, Acifluorfen(-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodium),
Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin,
5 Azimsulfuron, Benazolin(-ethyl), Benfuresate, Bensulfuron(-methyl), Bentazon,
Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop(-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-
sodium), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim,
Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-ethyl), Chlo-
methoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-ethyl), Chlornitrofen, Chlor-
10 sulfuron, Chlortoluron, Cinidon(-ethyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim,
Clethodim, Clodinafop(-propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyra-
sulfuron(-methyl), Cloransulam(-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne,
Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP,
Desmedipham, Diallate, Dicamba, Diclofop(-methyl), Diclosulam, Diethatyl(-ethyl),
15 Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor,
Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Di-
thiopyr, Diuron, Dymron, Epropodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulf-
uron(-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop-
(-P-ethyl), Fentrazamide, Flamprop(-isopropyl), Flamprop(-isopropyl-L), Flamprop(-
20 methyl), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butyl), Fluazolate, Flucarbazone,
Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentyl), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumet-
sulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-ethyl), Flupoxam, Fluprop-
acil, Flurpysulfuron(-methyl, -sodium), Flurenol(-butyl), Fluridone, Fluroxypyr(-
meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-methyl), Fluthiamide, Fomesafen,
25 Glufosinate(-ammonium), Glyphosate(-isopropylammonium), Halosafen, Haloxyfop-
(-ethoxyethyl), Haloxyfop(-P-methyl), Hexazinone, Imazamethabenz(-methyl),
Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazo-
sulfuron, Iodosulfuron(-methyl, -sodium), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron,
Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron,
30 MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiaz-
uron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron,

Metribuzin, Metsulfuron(-methyl), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Naprop-
amide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxa-
diazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendi-
methalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor, Primi-
sulfuron(-methyl), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor,
Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen(-ethyl), Pyrazolate, Pyrazosulf-
uron(-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-
methyl), Pyrithiobac(-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop-
(-P-ethyl), Quizalofop(-P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn,
Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-methyl), Sulfosate, Sulfosulfuron,
Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thia-
fluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-methyl), Thiobencarb, Tiocarb-
azil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-methyl), Triclopyr, Tri-
diphane, Trifluralin und Triflusulfuron.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insekti-
ziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen
und Bodenstruktur-verbesserungsmitteln ist möglich.

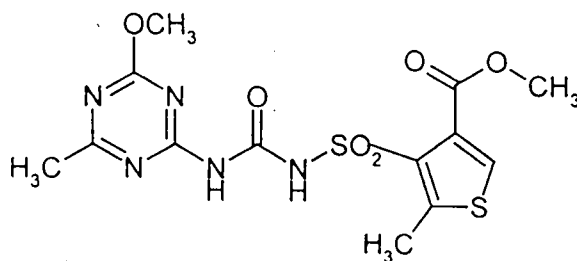
Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus
durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige
Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt
werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen,
Sprühen, Streuen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen
der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden einge-
arbeitet werden.

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie
hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen

liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

5 Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

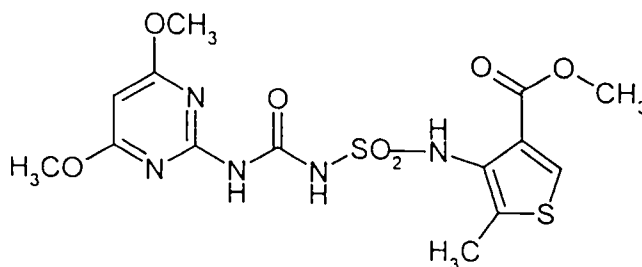
Herstellungsbeispiele:Beispiel 1

5 (Verfahren (b))

0,75 g (2,9 mMol) 2-Phenoxycarbonylamino-4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin
werden in 40 ml Acetonitril gelöst und nacheinander mit 0,75 g (3,2 mMol) 2-
Methyl-3-sulfamoyl-thiophen-4-carbonsäure-methylester und 0,49 g (3,2 mMol)
10 Diazabicycloundecen (DBU) versetzt. Die Reaktionsmischung wird 12 Stunden bei
Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt und anschließend im Wasserstrahlvakuum einge-
engt. Der Rückstand wird in Methylenchlorid aufgenommen, mit 2N-Salzsäure und
mit Wasser gewaschen, mit Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat
wird im Wasserstrahlvakuum eingeengt, der Rückstand mit Diethylether digeriert
15 und das kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.

Man erhält 0,60 g (52% der Theorie) N-(4-Methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-N'-(
4-methoxycarbonyl-2-methyl-thien-3-yl-sulfonyl)-harnstoff vom Schmelzpunkt
195°C.

20

Beispiel 2

(Verfahren (d))

1,05 g (7,5 mMol) Chlorsulfonylisocyanat werden in 75 ml Methylenchlorid vorgelegt. Nach Abkühlen auf -10°C wird zu dieser Mischung unter Rühren eine Lösung von 1,16 g (7,5 mMol) 2-Amino-4,6-dimethoxy-pyrimidin in 30 ml Methylenchlorid tropfenweise gegeben und die Mischung wird 30 Minuten bei -10°C gerührt. Dann wird bei 0°C eine Lösung von 1,28 g (7,5 mMol) 3-Amino-2-methyl-thiophen-4-carbonsäure-methylester und 0,75 g (7,5 mMol) Triethylamin in 50 ml Methylenchlorid tropfenweise dazu gegeben und die Reaktionsmischung wird 12 Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt. Anschließend werden 100 ml Wasser und 100 ml 2N-Salzsäure dazu gegeben, die organische Phase abgetrennt, mit 50 ml Wasser gewaschen, mit Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt und der Rückstand aus Ethanol kristallisiert.

Man erhält 2,1 g (66% der Theorie) N-(4,6-Dimethoxy-pyrimidin-2-yl)-N'-(4-methoxycarbonyl-2-methyl-thien-3-yl-amino-sulfonyl)-harnstoff vom Schmelzpunkt 174°C .

Analog zu den Beispielen 1 und 2 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Herstellungsverfahrens können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) hergestellt werden.

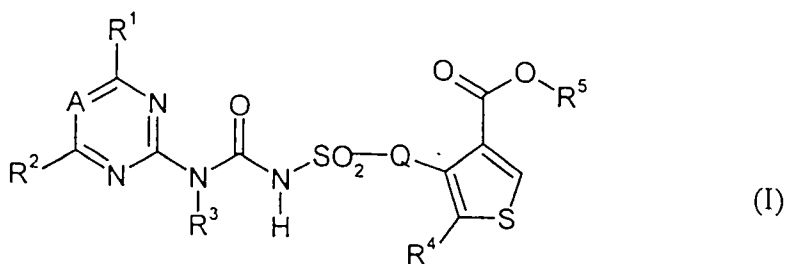
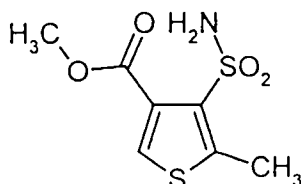
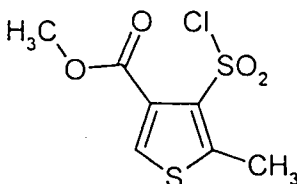


Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

Bsp.- Nr.	A	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Schmelz- punkt (°C)
3	CH	NH	OCH ₃	OCH ₃	H	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	140
4	CH	NH	OCH ₃	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	154
5	CH	NH	OCH ₃	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₃	195
6	CH	-	OCH ₃	OCH ₃	H	CH ₃	CH ₃	194

Ausgangsstoffe der Formel (V):Beispiel (V-1)

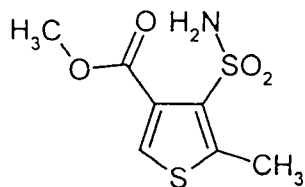
5

Stufe 1

- 10 Eine Lösung von 19,9 g (0,29 Mol) Natriumnitrit in 60 ml Wasser wird bei 0°C bis 5°C tropfenweise unter Rühren zu einer Lösung von 42,7 g (0,25 Mol) 3-Amino-2-methyl-thiophen-4-carbonsäure-methylester in 75 ml 10%iger wässriger Salzsäure gegeben. Die Reaktionsmischung wird 60 Minuten bei 0°C bis 5°C gerührt. Anschließend wird der Nitrit-Überschuß mit Amidosulfonsäure beseitigt. Die Mischung
- 15 wird dann bei 0°C bis 5°C tropfenweise unter Rühren zu einer Lösung von 35 g (0,55 Mol) Schwefeldioxid in 300 ml Methylenchlorid gegeben. Nach Zugabe von 1,5 g Kupfer(I)-chlorid und 1,5 g Dodecyl-trimethylammonium-bromid wird die Reaktionsmischung 60 Minuten bei 40°C und weiter 12 Stunden bei 20°C gerührt. Anschließend werden 18 ml 35%ige wässrige Salzsäure dazu gegeben, die Mischung
- 20 4 Stunden bei 20°C gerührt und dann die Phasen getrennt. Die wässrige Phase wird mit Methylenchlorid nachextrahiert, die vereinigten organischen Phasen mit Wasser gewaschen, mit Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingengt und der Rückstand aus Hexan kristallisiert.

Man erhält 51,7 g (81% der Theorie) 4-Methoxycarbonyl-2-methyl-thiophen-3-sulfonsäurechlorid.

Stufe 2



5

Eine Mischung aus 45 g (177 mMol) 4-Methoxycarbonyl-2-methyl-thiophen-3-sulfonsäurechlorid, 34 g (354 mMol) Ammoniumcarbonat und 400 ml Methylenchlorid wird 12 Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt. Nach Filtration wird vom Filtrat das Lösungsmittel im Wasserstrahlvakuum abdestilliert, der Rückstand mit Diethylether digeriert und das kristalline Produkt durch Absaugen isoliert.

10

Man erhält 21,5 g (52% der Theorie) 4-Methoxycarbonyl-2-methyl-thiophen-3-sulfonamid.

15

Anwendungsbeispiele:Beispiel A

5 Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach ca. 24 Stunden wird der Boden so mit der Wirkstoffzubereitung besprüht, daß die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge pro Flächeneinheit ausgebracht wird. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 1000 Liter Wasser pro Hektar die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge ausgebracht wird.

20

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

25

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 % = totale Vernichtung

30 In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1, 2, 3, 4, 5 und 6 bei teilweise guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Baumwolle, Mais und Soja, sehr starke Wirkung gegen Unkräuter.

Beispiel B

Post-emergence-Test

- 5 Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

20 Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

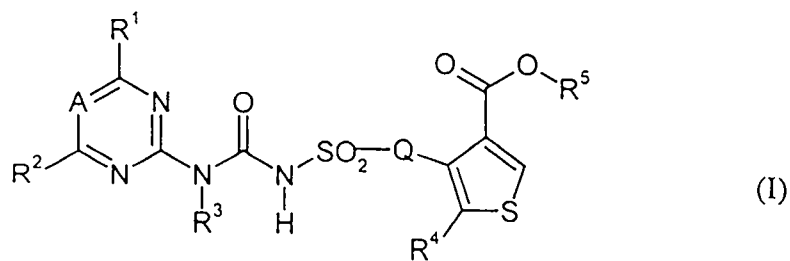
- 0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 % = totale Vernichtung

25

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1, 2, 5 und 6 bei teilweise guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Gerste und Weizen, sehr starke Wirkung gegen Unkräuter.

Patentansprüche

1. Verbindungen der allgemeinen Formel (I)



in welcher

A für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung steht,

Q für eine Einfachbindung oder für NH steht,

R¹ für Wasserstoff, Halogen oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Aryloxy oder Heterocyclyloxy steht,

R² für Wasserstoff, Halogen oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Aryloxy oder Heterocyclyloxy steht,

R³ für Wasserstoff oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht,

R⁴ für Halogen oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht und - für den Fall, daß Q für NH steht - auch für Wasserstoff steht, und

R⁵ für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl oder Heterocyclyl steht,

5 sowie Salze von Verbindungen der Formel (I).

2. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

10 R¹ für Wasserstoff, für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenoxy, Oxetanyloxy, Furyloxy oder Tetrahydrofuryloxy steht,

15 R² für Wasserstoff, für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenoxy, Oxetanyloxy, Furyloxy oder Tetrahydrofuryloxy steht,

20 R³ für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

25 R⁴ für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht und - für den Fall, daß Q für NH steht - auch für Wasserstoff steht, und

30

5
10
R⁵ für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Oxetanyl, Furyl oder Tetrahydrofuryl steht.

3. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

15
R¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino steht,

20
R² für Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino steht,

25
30
R³ für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl substituiertes Methyl oder Ethyl steht,

R⁵ für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Propenyl oder Propinyl steht.

5

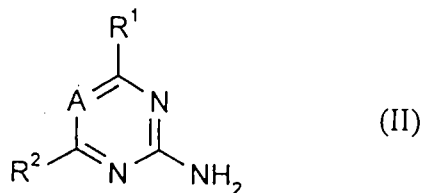
5. Natrium-, Kalium-, Magnesium-, Calcium-, Ammonium-, C₁-C₄-Alkyl-ammonium-, Di-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium-, Tri-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium-, Tetra-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium-, Tri-(C₁-C₄-alkyl)-sulfonium-, C₅- oder C₆-Cycloalkyl-ammonium- und Di-(C₁-C₂-alkyl)-benzyl-ammonium-Salze von Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 2 bis 4.

10

6. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, daß

15

(a) Aminoazine der allgemeinen Formel (II)

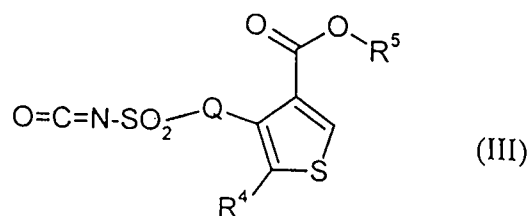


in welcher

20

A, R¹ und R² in die einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

mit Thienyl(amino)sulfonylisocyanaten der allgemeinen Formel (III)



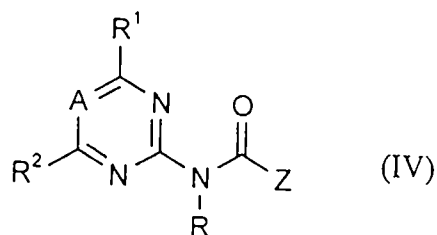
in welcher

Q, R^4 und R^5 die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt werden,

oder daß

(b) substituierte Aminoazine der allgemeinen Formel (IV)



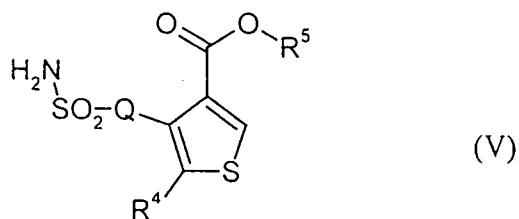
in welcher

A, R^1 und R^2 die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

Z für Halogen, Alkoxy oder Aryloxy steht und

R die in einem der Ansprüche 1 bis 4 für R^3 angegebene Bedeutung hat oder für die Gruppierung $-\text{C}(\text{O})-\text{Z}$ steht,

mit Thiophenderivaten der allgemeinen Formel (V)



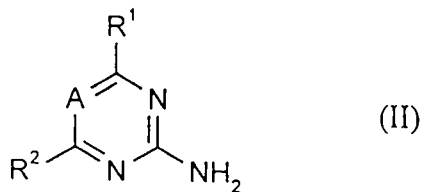
in welcher

Q , R^4 und R^5 die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt werden,

oder daß

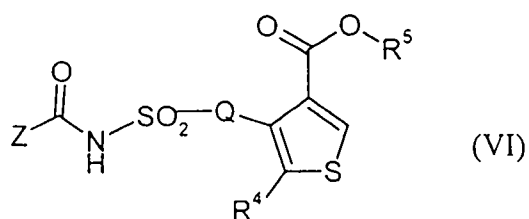
(c) Aminoazine der allgemeinen Formel (II)



in welcher

A , R^1 und R^2 die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

mit Thiophenderivaten der allgemeinen Formel (VI)



in welcher

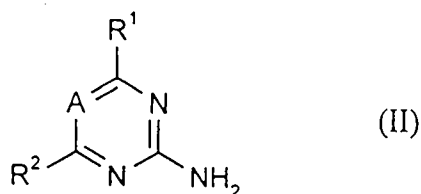
Q, R⁴ und R⁵ die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben und

Z für Halogen, Alkoxy oder Aryloxy steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt werden,

oder daß

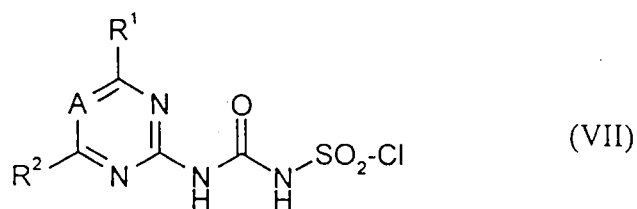
(d) Aminoazine der allgemeinen Formel (II)



in welcher

A, R¹ und R² die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

mit Chlorsulfonylisocyanat gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt werden und die hierbei gebildeten Chlorsulfonylamino-carbonylamino-azine der allgemeinen Formel (VII)

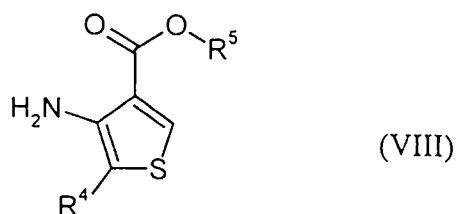


in welcher

5 A, R^1 und R^2 die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

- nach Zwischenisolierung oder „in situ“ -

10 mit substituierten Aminothiophenen der allgemeinen Formel (VIII)



in welcher

15 R^4 und R^5 die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt werden,

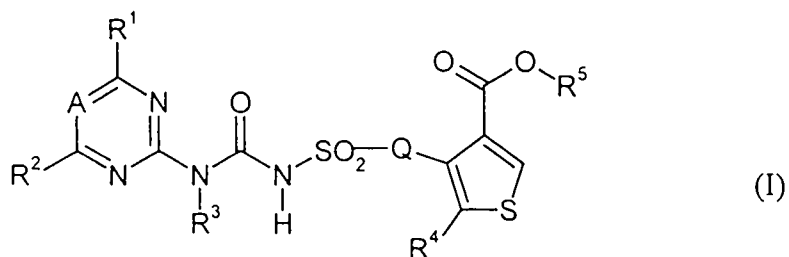
20 und gegebenenfalls die nach den Verfahren (a), (b), (c) oder (d) erhaltenen Verbindungen der Formel (I) nach üblichen Methoden in Salze überführt werden.

7. Verfahren zum Bekämpfen von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man mindestens eine Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 auf unerwünschte Pflanzen und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.
5
8. Verwendung von mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 zum Bekämpfen von unerwünschten Pflanzen.
9. Herbizides Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 und üblichen Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln.
10

Substituierte Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe

Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft neue substituierte Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe, der allgemeinen Formel (I),



in welcher A, Q, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ die in der Beschreibung angegebene Bedeutung haben,

Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

61

TRADUCCION: Se traduce la carátula, la descripción y las reivindicaciones anexas a una copia de la solicitud de patente Alemana No. 199 37 118.0 escrita en Alemán: para el invento denominado: **TIENIL(AMINO)SULFONILUREAS SUBSTITUIDAS .**

REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

(emblema)

CERTIFICACION

Expediente No. : 199 37 118.0

Fecha : 06 DE AGOSTO DE 1999

Nombre del Solicitante : **BAYER AKTIENGESELLSCHAFT**
Leverkusen/Alemania

Título del Invento : **TIENIL(AMINO)SULFONILUREAS SUBSTITUIDAS**

Clasificación : C07D, A 61N

El documento que se acompaña es una copia fiel y exacta del original de esta solicitud de patente.

Munich, el día 10 de Julio de 2000.

EL PRESIDENTE DEL REGISTRO ALEMAN DE PATENTES

Por orden

((firma ilegible))

Agurks

Cinta y Sello de
Oblea

PRIORIDAD

LeA 33 917-Lu/wa/NT/V29.07.1999

MEMORIA DESCRIPTIVA

S o b r e :

TIENIL(AMINO)SULFONILUREAS SUBSTITUIDAS.

Solicitante.- BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, entidad alemana.

Residente.- D-51368, Leverkusen, República Federal de Alemania.

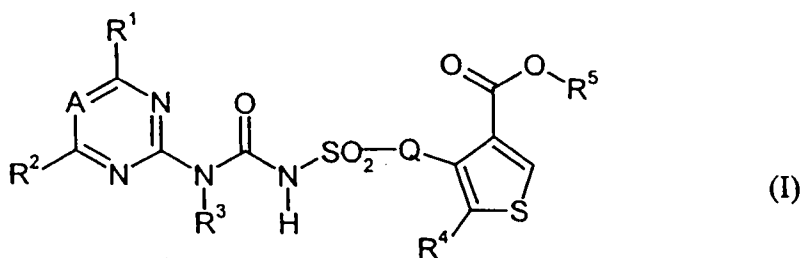
=====

TIENIL(AMINO)SULFONILUREAS SUSTITUIDAS.

La invención se refiere a nuevas tienil(amino)sulfonilureas substituidas, a procedimientos para su obtención y a su empleo como herbicidas.

Se sabe ya que determinadas tienilsulfonilureas substituidas presentan propiedades herbicidas (véanse las EP-A-30142 / US-A-4481029 / US-A-4599103 / US-A-4701535, EP-A-97122 / US-A-4549898, EP-A-207609 / US-A- 4668281). Sin embargo la actividad herbicida de estos compuestos conocidos no es satisfactoria en todos los casos.

Se han encontrado ahora las nuevas tienil(amino)sulfonilureas substituidas de la fórmula general (I)



en la que

A significa nitrógeno o un grupo CH-,

Q significa un enlace sencillo o significa NH,

R¹ significa hidrógeno, halógeno o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, ariloxi o heterocicliloxi substituidos respectivamente en caso dado,

R² significa hidrógeno, halógeno o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, ariloxi o heterocicliloxi substituidos respectivamente en caso dado,

R³ significa hidrógeno o alquilo substituido en caso dado,

R⁴ significa halógeno o significa alquilo substituido en caso dado y -en el caso en que Q signifique NH- significa también hidrógeno, y

R^5 significa hidrógeno o significa alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo o heterociclilo substituidos respectivamente en caso dado, así como sales de los compuestos de la fórmula (I).

Los agrupamientos hidrocarbonados saturados o insaturados, tales como alquilo, alquenilo o alquinilo –incluso en combinación con heteroátomos, como en alcoxi- son, en tanto en cuanto sea posible, respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada.

Los restos substituidos en caso dado pueden estar mono o polisubstituidos, pudiendo ser los substituyentes iguales o diferentes en el caso de polisubstitución.

Los substituyentes o bien los intervalos preferentes de los restos presentes en las fórmulas indicadas anteriormente o que se indicarán a continuación, se definen a continuación.

Preferentemente,

A significa nitrógeno o un grupo CH-.

Preferentemente,

Q significa un enlace sencillo o significa NH.

Preferentemente,

R^1 significa hidrógeno, significa halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino o dialquilamino con respectivamente 1 a 4 átomos de carbono en el grupo alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o significa fenoxi, oxetaniloxi, furiloxi o tetrahidrofuriloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos carbono.

Preferentemente,

R^2 significa halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino o dialquilamino con respectivamente 1 a 4 átomos de carbono en los grupos

alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o significa fenoxi, oxetanilo, furilo o tetrahidrofurilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R³ significa hidrógeno o significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido en caso dado por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁴ significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono y —en el caso en que Q signifique NH— significa también hidrógeno.

Preferentemente,

R⁵ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno, o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alqueno o alquino con respectivamente 2 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo con respectivamente 3 a 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, con 1 a 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa oxetano, furilo o tetrahidrofurilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

A significa nitrógeno o un grupo CH—.

De forma especialmente preferente,

Q significa un enlace sencillo o significa NH.

De forma especialmente preferente,

R¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R² significa flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R³ significa hidrógeno o significa metilo o etilo substituidos respectivamente en caso dado por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por acetilo, por propionilo, por n- o i-butirolilo, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxicarbonilo.

De forma especialmente preferente,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R⁵ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propenilo, butenilo, propinilo o butinilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro o por

bromo, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo.

De forma muy especialmente preferente,

A significa nitrógeno o un grupo CH-.

De forma muy especialmente preferente,

Q significa un enlace sencillo o significa NH.

De forma muy especialmente preferente,

R¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, metilamino, etilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa dimetilamino.

De forma muy especialmente preferente,

R² significa flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, metilamino o etilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa dimetilamino.

De forma muy especialmente preferente,

R³ significa hidrógeno o metilo.

De forma muy especialmente preferente,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro.

De forma muy especialmente preferente,

R⁵ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa propenilo o propinilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro.

Del modo mas preferente,

A significa un agrupamiento CH-.

Del modo mas preferente,

R^1 y R^2 significan metoxi.

Del modo mas preferente,

R^3 significa hidrógeno.

El objeto de la invención son, preferentemente, también las sales de sodio, de potasio, de magnesio, de calcio, de amonio, de alquil-amonio con 1 a 4 átomos de carbono, de di-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono(-amonio), de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tetra-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-sulfonio, de cicloalquil-amonio con 5 o 6 átomos de carbono y de di-(alquilo con 1 a 2 átomos de carbono)-bencil-amonio de los compuestos de la fórmula (I), en la que A, Q, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen el significado dado anteriormente de manera preferente.

Las definiciones de los restos dadas anteriormente de manera general o en los intervalos preferentes son válidas tanto para los productos finales de la fórmula (I) como también, de manera correspondiente, para los productos de partida o bien para los productos intermedios necesarios respectivamente para la obtención. Estas definiciones de los restos pueden combinarse arbitrariamente entre sí, es decir incluso entre los intervalos indicados de los compuestos preferentes.

Según la invención son preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera preferente.

Según la invención son especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera especialmente preferente.

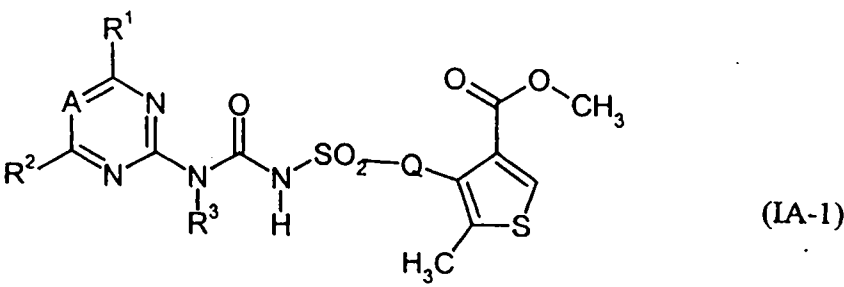
Según la invención son muy especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los

significados indicados anteriormente de manera muy especialmente preferente.

Según la invención son mas preferentes los compuestos en los cuales R¹, R², R³ o A, tienen uno de los significados indicados como mas preferentes.

Ejemplos de los compuestos según la invención de la fórmula (I) se han indicado en los grupos siguientes.

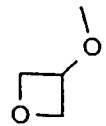
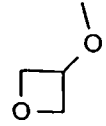
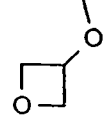
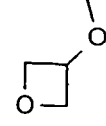
Grupo 1.

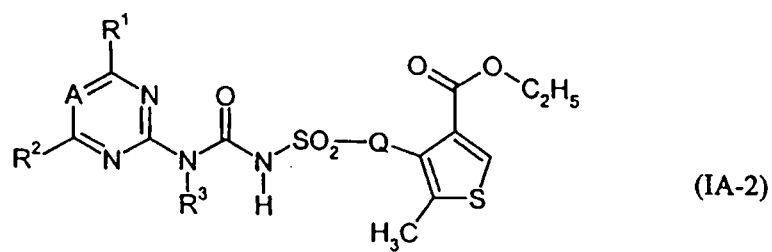


en la que A, Q, R¹, R² y R³ tienen, por ejemplo, el significado indicado a continuación:

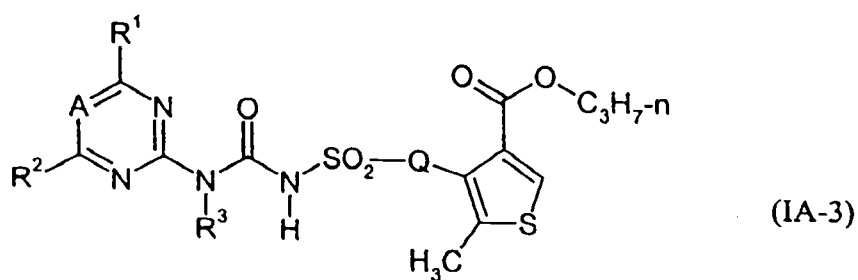
A	Q	R ¹	R ²	R ³
CH	-	OCH ₃	OCH ₃	H
CH	NH	OCH ₃	OCH ₃	H
CH	-	CH ₃	OCH ₃	H
CH	NH	CH ₃	OCH ₃	H
CH		CH ₃	CH ₃	H
CH	NH	CH ₃	CH ₃	H
CH	-	Cl	OCH ₃	H
CH	-	H	CH ₃	H
N	-	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
N	-	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
N	-	CH ₃	OCH ₃	H
N	NH	CH ₃	OCH ₃	H

N	-	OCH ₃	OCH ₃	H
N	NH	OCH ₃	OCH ₃	H
N	-	CH ₃	CH ₃	H
N	-	OCHF ₂	N(CH ₃) ₂	H
N	-	CH ₃	SCH ₃	H
N	-	C ₂ H ₅	OCH ₃	H
N	-	CH ₃	OC ₂ H ₅	H
N	-	H	OCH ₃	H

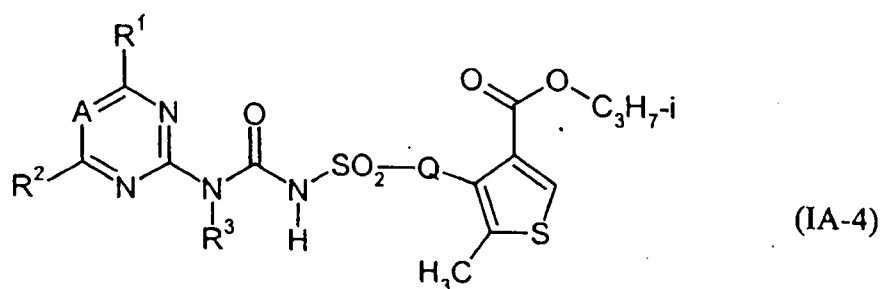
A	Q	R ¹	R ²	R ³
N	-	OCH ₃		H
N	-	CH ₃	N(CH ₃) ₂	H
CH	-	OCH ₃		H
CH	-	CH ₃		H
CH	-	Cl		H
N	-	H		H
N	-	N(CH ₃) ₂	OCH ₂ CF ₃	H

Grupo 2.

En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

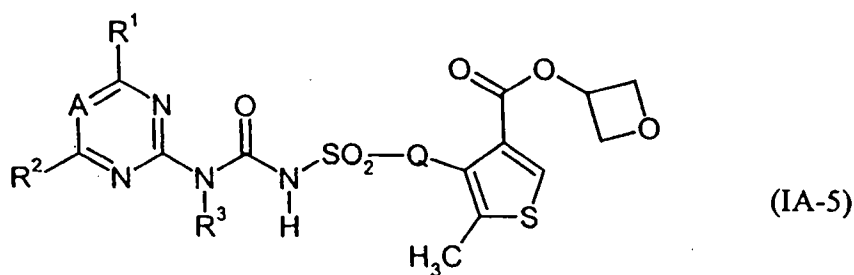
Grupo 3.

En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 4.

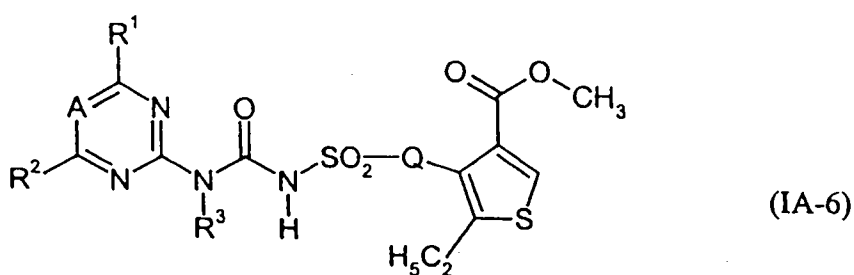
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 5.



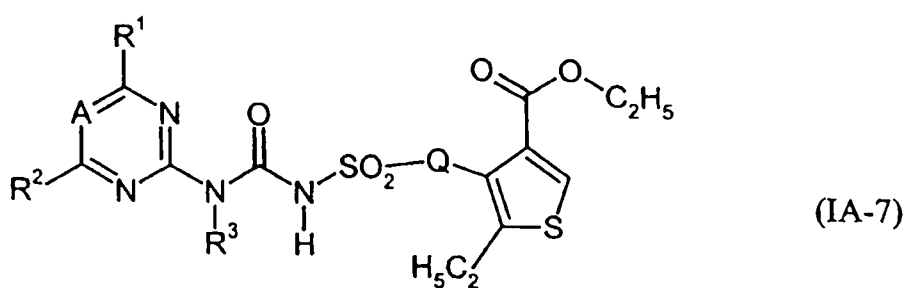
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 6.



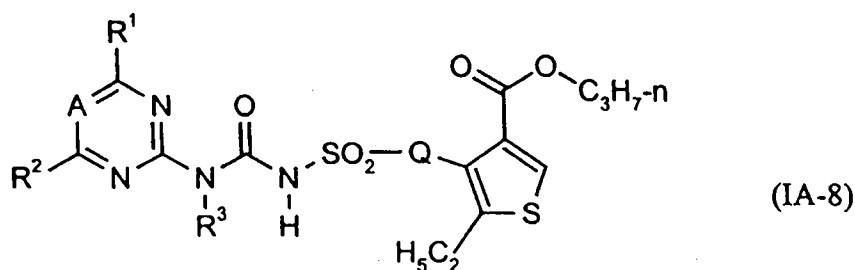
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 7.



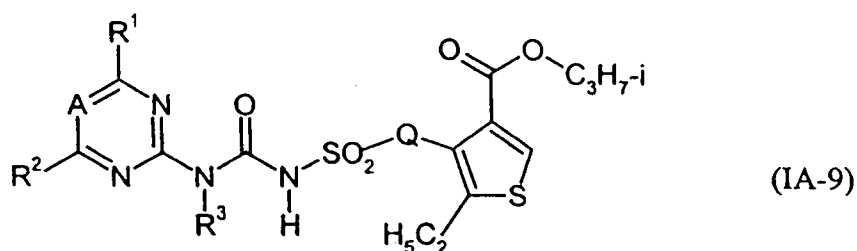
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 8.



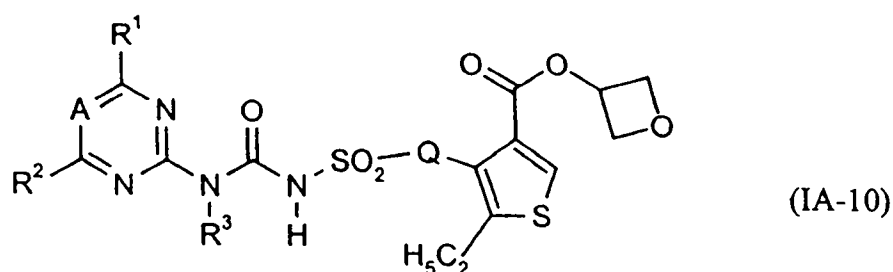
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 9.



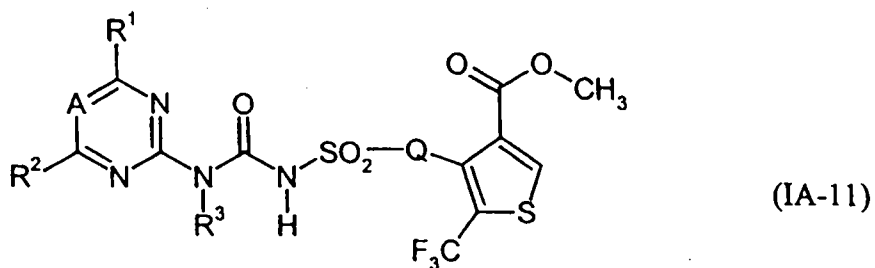
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 10.



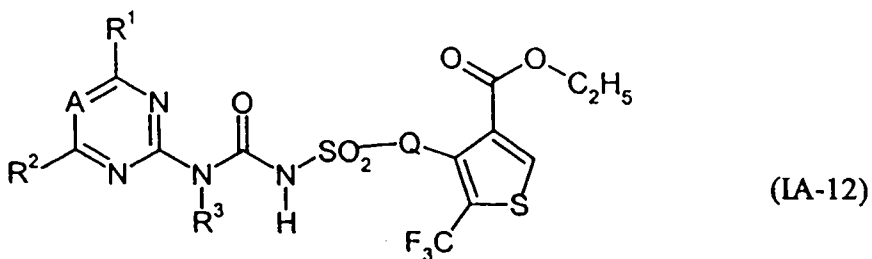
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 11.



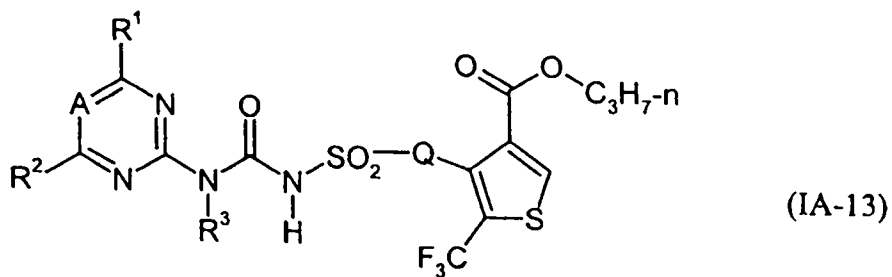
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 12.

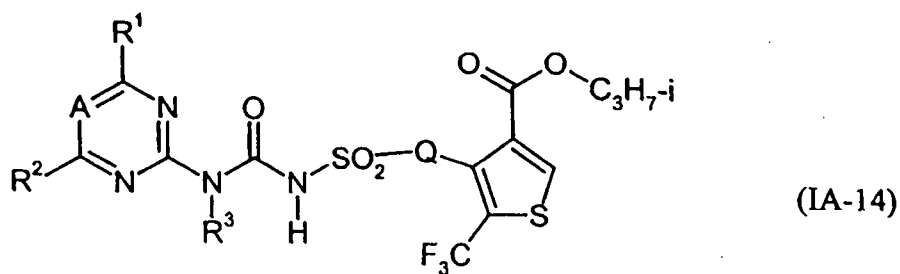


En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

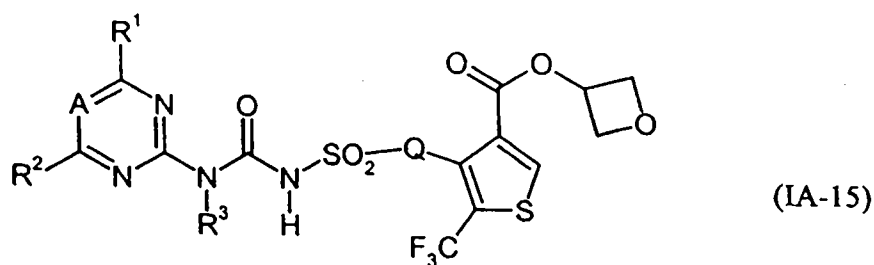
Grupo 13.



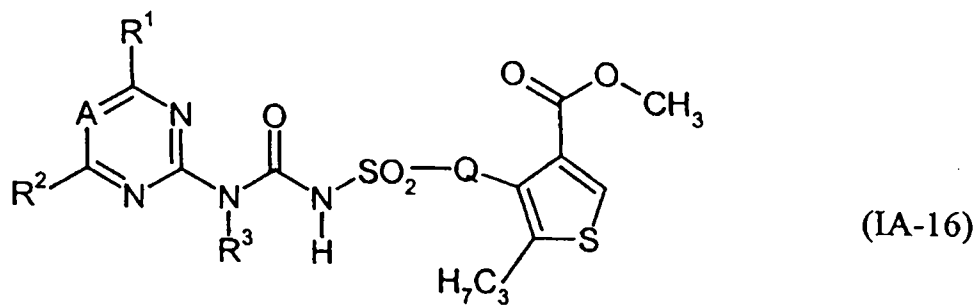
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 14.

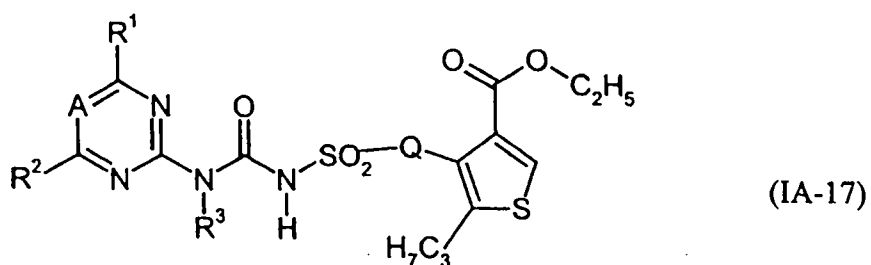
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 15.

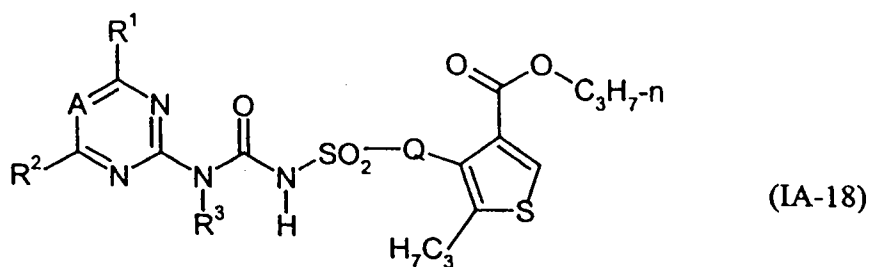
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 16.

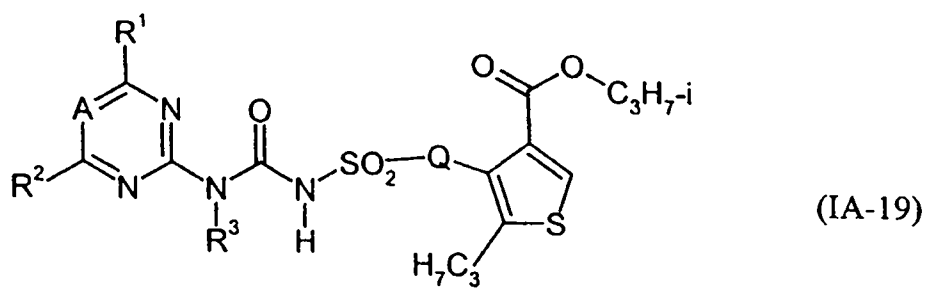
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 17.

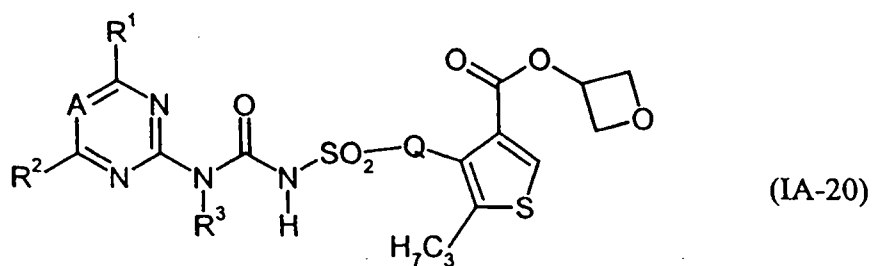
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 18.

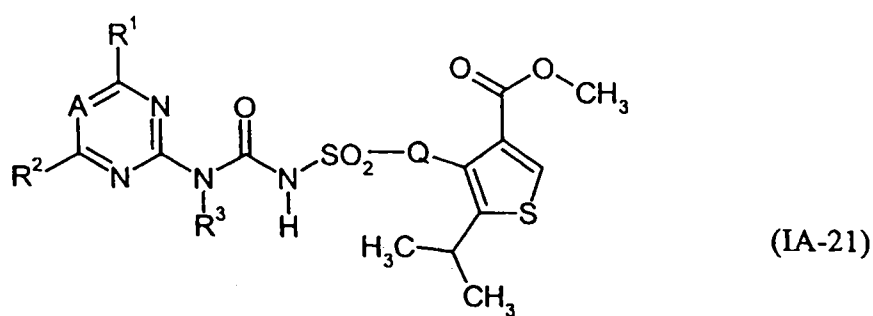
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 19.

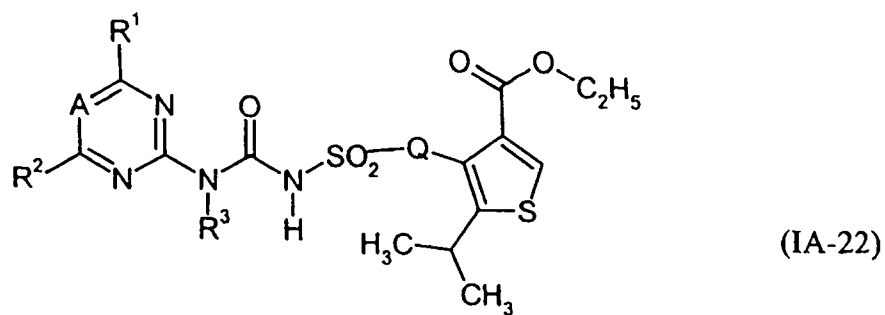
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 20.

En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

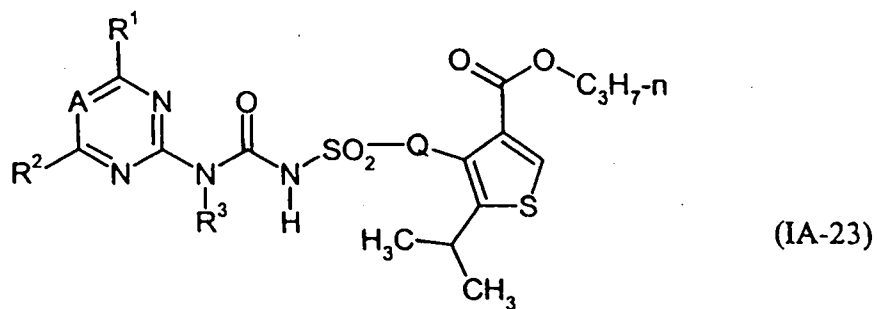
Grupo 21.

En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 22.

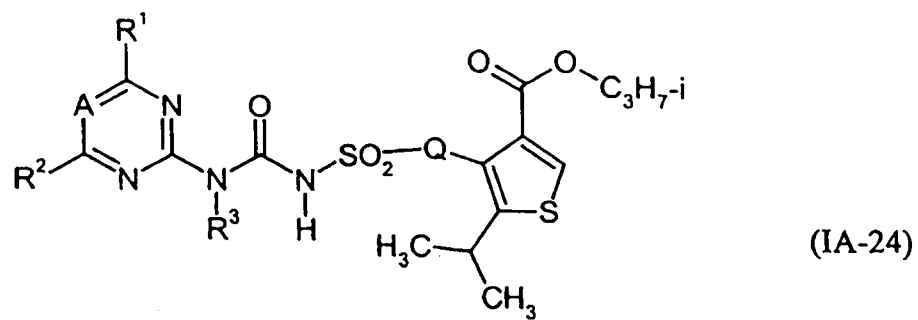
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 23.



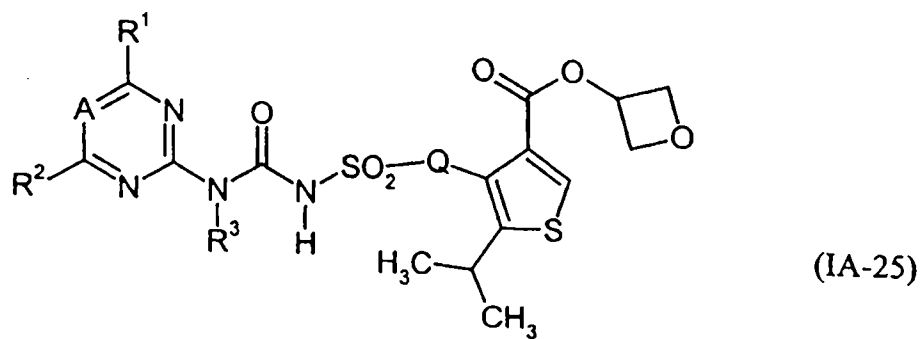
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 24.



En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 25.



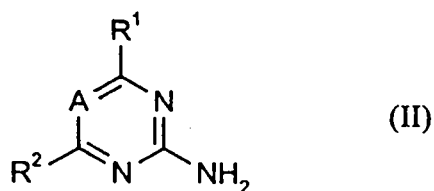
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Las nuevas tienil(amino)sulfonilureas substituidas de la fórmula general (I) se caracterizan por una potente actividad herbicida.

Se obtienen las nuevas tienil(amino)sulfonilureas substituidas de la fórmula general (I),

o si

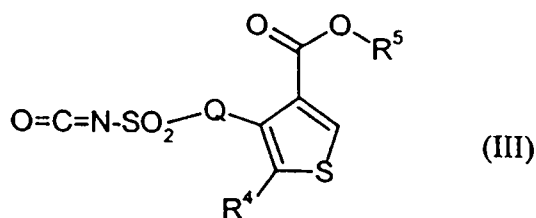
(a) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general (II)



en la que

A, R¹ y R² tienen el significado anteriormente indicado,

con tienil(amino)sulfonilisocianatos de la fórmula general (III)



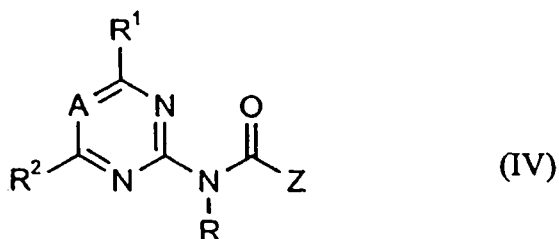
en la que

Q, R⁴ y R⁵ tienen el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

o si

(b) se hacen reaccionar aminoazinas substituidas de la fórmula general (IV)



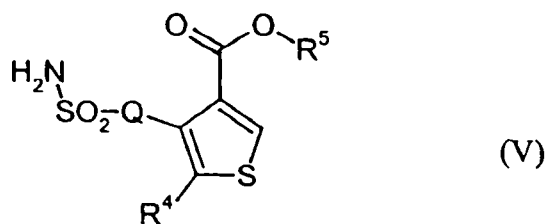
en la que

A, R¹ y R² tienen el significado anteriormente indicado,

Z significa halógeno, alcoxi o ariloxi y

R tiene el significado anteriormente indicado para R³ o significa el agrupamiento
-C(O)-Z,

con derivados de tiofeno de la fórmula general (V)



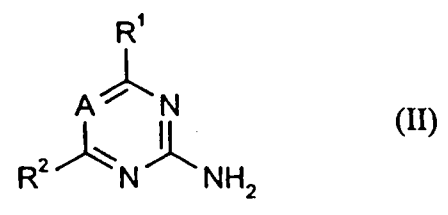
en la que

Q, R⁴ y R⁵ tienen el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

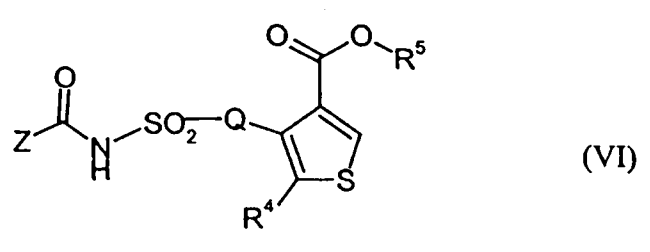
o si

(c) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general (II)



en la que

A, R¹ y R² tienen el significado anteriormente indicado,
con derivados de tiofeno de la fórmula general (VI)



en la que

Q, R⁴ y R⁵ tienen el significado anteriormente indicado y

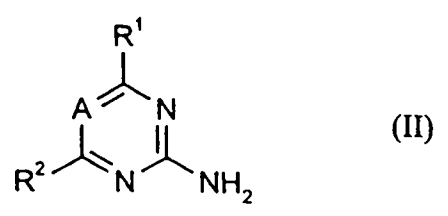
Z significa halógeno, alcoxi o ariloxi,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en

presencia de un diluyente,

o si

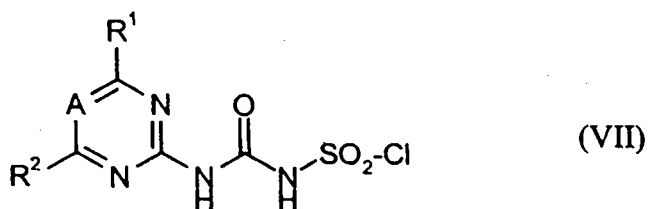
(d) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general (II),



en la que

A, R¹ y R² tienen el significado anteriormente indicado,

con clorosulfonilisocianato, en caso dado en presencia de un diluyente y las clorosulfonilaminocarbonilamino-azinas formadas en este caso de la fórmula general (VII),

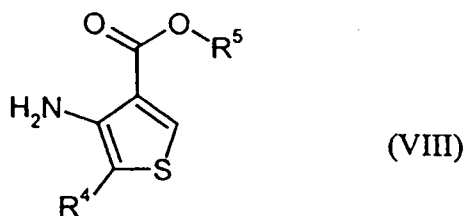


en la que

A, R¹ y R² tienen el significado anteriormente indicado,

- tras aislamiento provisional o "in situ" -

se hacen reaccionar con aminotiofenos sustituidos de la fórmula general (VIII)



en la que

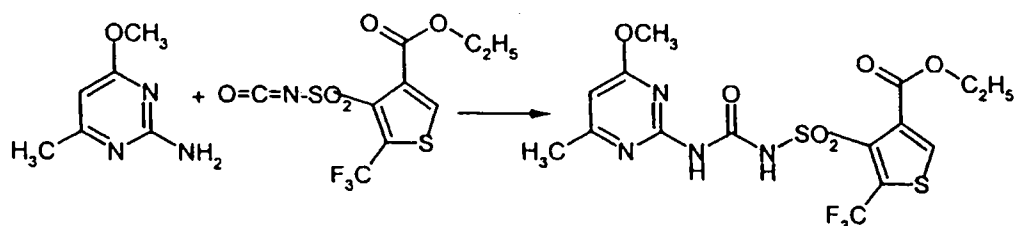
R⁴ y R⁵ tienen el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

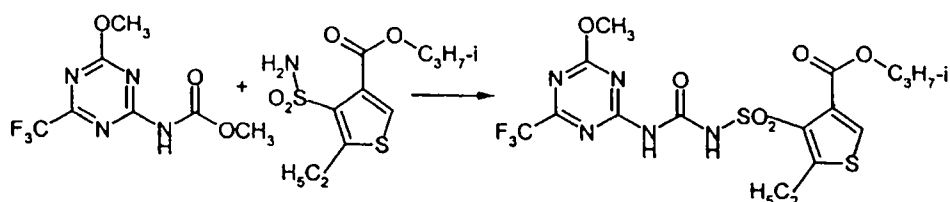
y en caso dado los compuestos de la fórmula (I), obtenidos según los procedimientos (a), (b), (c) o (d), se transforman en sales según métodos usuales.

Si se emplean, por ejemplo, la 2-amino-4-metoxi-6-metil-pirimidina y el 4-etoxycarbonil-2-trifluórmethyl-tien-3-il-sulfonilisocianato como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del

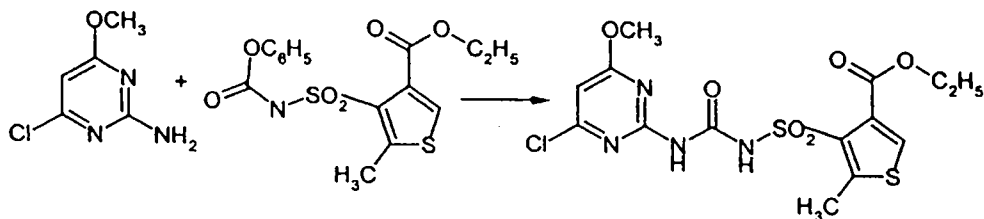
procedimiento (a) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Si se emplean, por ejemplo, la 2-metoxycarbonilamino-4-metoxi-6-trifluórmetyl-1,3,5-triazina y la 2-etil-4-i-propoxycarbonil-tiofen-3-sulfonamida como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción, en el caso del procedimiento (b) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:

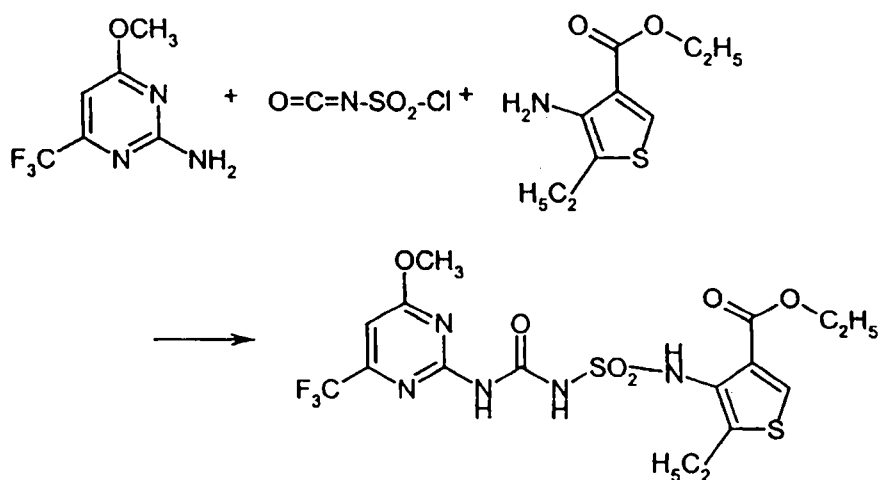


Si se emplean, por ejemplo, la 2-amino-4-cloro-6-metoxi-pirimidina y el N-(4-etoxycarbonil-2-metil-tien-3-il-sulfonil)-O-fenil-uretano como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento (c) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Si se emplean, por ejemplo, la 2-amino-4-metoxi-6-trifluórmetyl-

pirimidina, el clorosulfonilisocianato y el 3-amino-2-etil-tiofen-4-carboxilato de etilo como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento (d) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Las aminoazinas a ser empleadas como productos de partida en los procedimientos según la invención (a), (c) y (d) para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidas en general por medio de la fórmula (II). En la fórmula (II), A, R^1 y R^2 tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido indicados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para A, R^1 y R^2 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I).

Las aminoazinas de la fórmula (II) son productos químicos para síntesis conocidos, en parte obtenibles en el comercio.

Los tienil(amino)sulfonilisocianatos a ser empleados como productos de partida también en el caso del procedimiento (a) según la invención, están definidos en general por medio de la fórmula (III). En la fórmula (III), Q, R^4 y R^5 tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido

citados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para Q, R⁴ y R⁵ en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I).

Los productos de partida de la fórmula (III) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las EP 30142 / US-A-4481029 / US-A- 4599103 / US-A-4701535).

Se obtienen los tienil(amino)sulfonilisocianatos de la fórmula (III), si se hacen reaccionar derivados de tiofeno de la fórmula general (V) –anterior- con fosgeno o bien con tiofosgeno, en caso dado en presencia de un alquilisocianato, tal como por ejemplo butilisocianato, en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción, tal como por ejemplo diazabicyclo[2.2.2]-octano, y en presencia de un diluyente, tal como por ejemplo tolueno, xileno o clorobenceno, a temperaturas comprendidas entre 80°C y 150°C y, tras el final de la reacción se eliminan por destilación los componentes volátiles bajo presión reducida.

Las aminoazinas substituidas, a ser empleadas como productos de partida en el caso del procedimiento (b) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), están definidas en general por medio de la fórmula (IV). En la fórmula (IV), A, R¹ y R² tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para A, R¹ y R² en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I); en este caso Z significa preferentemente flúor, cloro, bromo, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o fenoxi, especialmente significa cloro, metoxi, etoxi o fenoxi.

Los productos de partida de la fórmula (IV) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las US 4690707, DE 19501174).

Los derivados de tiofeno a ser empleados además como productos de partida en el caso del procedimiento (b) según la invención están definidos en general por medio de la fórmula (V). En la fórmula (V), Q, R⁴ y R⁵ tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para Q, R⁴ y R⁵ en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I).

Los productos de partida de la fórmula (V) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las EP 30142 / US-A-4481029 / US-A-4599103 / US-A-4701535, ejemplos de obtención).

Los derivados de tiofeno substituidos a ser empleados como productos de partida en el caso del procedimiento (c) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), están definidos en general por medio de la fórmula (VI). En la fórmula (VI), Q, R⁴ y R⁵ tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para Q, R⁴ y R⁵ en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I); en este caso Z significa preferentemente flúor, cloro, bromo, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o fenoxi, especialmente significa cloro, metoxi, etoxi o fenoxi.

Los productos de partida de la fórmula (VI) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos.

Los aminotiofenos substituidos, a ser empleados como productos de partida en el caso del procedimiento (d) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidos en general por medio de la fórmula (VIII). En la fórmula general (VIII), R⁴ y R⁵ tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de

manera preferente o bien de manera especialmente preferente para R^4 y R^5 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los productos de partida de la fórmula general (VIII) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véase Aust. J. Chem. 48 (1995), 1907-1916).

Como diluyentes para la realización de los procedimientos (a), (b), (c) y (d) según la invención entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen especialmente, hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados, tales como por ejemplo bencina, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, diclorobenceno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano o etilenglicoldimetil- o -dietiléter; cetonas, tales como acetona, butanona o metil-isobutil-cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-formanilida, N-metil-pirrolidona o hexametilfósforotriamida; ésteres tales como acetato de metilo o acetato de etilo, así como sulfóxidos, tal como dimetilsulfóxido.

Los procedimientos (a), (b), (c) y (d) según la invención se llevan a cabo preferentemente en presencia de un agente auxiliar de la reacción adecuado. Como tales entran en consideración todas las bases inorgánicas u orgánicas usuales. A éstas pertenecen, por ejemplo, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinotérreos o de metales alcalinos, tales como por ejemplo hidruro de sodio, amida de sodio, metilato de sodio, etilato de sodio, terc.-butilato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de amonio, acetato de sodio, acetato de potasio,

acetato de calcio, acetato de amonio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio o carbonato de amonio así como aminas terciarias tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, piridina, N-metilpiperidina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

Las temperaturas de la reacción en la realización de los procedimientos (a), (b), (c) y (d) según la invención pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre -20°C y $+150^{\circ}\text{C}$, preferentemente entre -10°C y $+120^{\circ}\text{C}$.

Los procedimientos (a), (b), (c) y (d) según la invención se llevan a cabo en general bajo presión normal. No obstante es posible también llevar a cabo los procedimientos según la invención bajo presión mas elevada o a presión mas reducida —en general comprendida entre 0,1 bar y 10 bares—.

Para la realización de los procedimientos (a), (b), (c) y (d) según la invención se emplean los productos de partida, en general, en cantidades aproximadamente equimolares. No obstante es posible también emplear uno de los componentes en un exceso mayor. La reacción se lleva a cabo, en general, en un diluyente adecuado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y la mezcla de la reacción se agita, en general, durante varias horas a la temperatura necesaria. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales (véanse los ejemplos de obtención).

A partir de los compuestos de la fórmula general (I) según la invención pueden prepararse también en caso dado sales. Se obtienen tales sales de manera sencilla según métodos usuales para la formación de sales, por ejemplo mediante disociación o dispersión de un compuesto de la fórmula (I) en un disolvente

adecuado, tal como por ejemplo cloruro de metileno, acetona, terc.-butil-metiléter o tolueno, y adición de una base adecuada. Las sales pueden aislarse a continuación, -en caso dado tras agitación prolongada- mediante concentración por evaporación o separación mediante filtración por succión.

Los productos activos según la invención se pueden emplear como defoliantes, desecantes, agentes herbicidas y especialmente como agentes para eliminar las malas hierbas. Por malas hierbas, en el más amplio sentido, se han de entender las plantas que crecen en lugares donde son indeseadas. El hecho de que las sustancias, según la invención, actúen como herbicidas totales o selectivos, depende esencialmente de la cantidad empleada

Los productos activos según la invención pueden emplearse por ejemplo en las plantas siguientes:

Malas hierbas dicotiledóneas de las clases: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Cultivos dicotiledóneos de las clases: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Malas hierbas monocotiledóneas de las clases: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Cultivos monocotiledóneos de las clases: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

El empleo de los productos activos según la invención, no está sin embargo, limitado en forma alguna estas clases, sino que se extienden en igual forma también sobre otras plantas.

Los productos activos según la invención son adecuados, en función de la concentración, para combatir totalmente las hierbas malas, por ejemplo, en instalaciones industriales y viarias y en caminos y plazas, con y sin crecimiento de árboles. Del mismo modo, se pueden emplear los compuestos para combatir las hierbas malas en cultivos permanentes, por ejemplo, en instalaciones forestales, de árboles de adorno, de árboles frutales, de viñedos, de árboles cítricos, de nogales, de plátanos, de café, de té, de goma de palmas de aceite, de cacao, de frutos de bayas y de lúpulo, sobre trazados ornamentales y deportivos y en superficies de prados y para combatir las hierbas malas en forma selectiva en los cultivos mono-anales.

Los compuestos según la invención de la fórmula (I) muestran una potente actividad herbicida y un amplio espectro de actividad sobre el terreno y sobre las partes aéreas de las plantas. Son adecuados en cierta medida también para combatir de manera selectiva las malas hierbas monocotiledóneas y dicotiledóneas en cultivos

monocotiledóneos y dicotiledóneos, tanto en el procedimiento de pre-brote como en el procedimiento de post-brote.

Los productos activos se pueden transformar en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos pulverizables, suspensiones, polvos, medios de espolvoreo, pastas, polvos solubles, granulados, concentrados en suspensión-emulsión, materiales naturales y sintéticos impregnados con el producto activo, así como micro-encapsulados en materiales polímeros.

Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo, mediante mezcla de los productos activos con materiales extendedores, esto es, con disolventes líquidos y/o excipientes sólidos, en caso dado, empleando agentes tensioactivos, esto es, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios generadores de espuma.

En el caso de emplear agua como material de carga se puede emplear, por ejemplo, también disolventes orgánicos como agentes disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran especialmente en consideración: los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, los hidrocarburos aromáticos clorados y los hidrocarburos alifáticos clorados, tales como los clorobenzenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, o las parafinas, por ejemplo, las fracciones de petróleo crudo, los aceites minerales y vegetales, los alcoholes tales como butanol, o glicol, así como sus ésteres y éteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutylcetona, o ciclohexanona, los disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como el agua.

Como excipientes sólidos entran en consideración: por ejemplo, sales de amonio y los minerales naturales molturados, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierras de diatoméas y minerales

sintéticos molturados, tales como ácido silícico, altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos, como excipientes sólidos para granulados entran en consideración: por ejemplo, minerales naturales quebrados y fraccionados tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de materiales orgánicos, tales como serrines, cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco; como emul-sionantes y/o generadores de espuma entran en consideración: por ejemplo, los emulsionantes no iónicos y aniónicos, tales como ésteres polioxietilenados de ácidos grasos, éteres polioxietilenadas de alcoholes grasos, tales como por ejemplo alquilarilpoliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina; como dispersantes entran en consideración: por ejemplo, lixivitaciones sulfiticas de lignina y metilcelulosa.

En las formulaciones se pueden emplear adhesivos tales como carboximetil-celulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulados o en forma de latex, tales como goma arábica, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales, tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Se pueden emplear colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul ferrocianico y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y de ftalocianina metálicos y nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, por lo general, entre un 0,1 hasta un 95 % en peso de producto activo, preferentemente entre un 0,5 y un 90 %.

Los productos activos según la invención pueden encontrar aplicación como tales o en sus formulaciones también en mezcla con herbicidas conocidos para la

lucha contra las malas hierbas, siendo posibles preparados listos para su empleo o mezclas de tanque.

Para las mezclas entran en consideración herbicidas conocidos, por ejemplo:

Acetochlor, Acifluorfen(-sodio), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodio), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Benazolin(-etilo), Benfuresate, Bensulfuron(-metilo), Bentazon, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop(-etilo), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac (-sodio) Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-etilo), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-etilo), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Conidon(-etilo) Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim, Clethodim, Clodinafop(-propargilo), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron(-metilo), Cloransulam(-metilo), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop (-butilo), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallylate, Dicamba, Diclofop (-metilo), Diclosulam, Diethatyl(-etilo), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopir, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epoprodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-metilo), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop(-P-etilo), Fentrazamide, Flamprop(-isopropilo), Flamprop(-isopropilo-L), Flamprop(-metilo), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butilo), Fluazolate, Flucarbazone, Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentilo), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen (-etilo), Flupoxam, Flupropacil, Flupyrsulfuron(-metilo, -sodio), Flurenol(-butilo), Fluridone, Fluroxypyr(-meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-metilo), Fluthiamide, Fomesafen, Glufosinate(-amonio), Glyphosate(-

isopropilamonio), Halosafen, Haloxyfop(-etoxietilo), Haloxyfop(-P-metilo), Hexazinone, Imazamethabenz(-metilo), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron(-metilo, -sodio), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alfa-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-metilo), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, ácido pelargónico, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron(-metilo), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen(-etilo), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-etilo), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-metilo), Pyriothiobac(-sodio), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-etilo), Quizalofop(-P-tefurilo), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-metilo), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-metilo), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-metilo), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin, Triflusulfuron, Tritosulfuron.

También es posible una mezcla con otras sustancias activas conocidas, tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, sustancias protectoras contra la ingestión por pájaros, sustancias nutrientes de las plantas y medios mejoradores de la estructura del terreno.

Los productos activos pueden emplearse como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de los mismos mediante diluciones ulteriores, tales como soluciones listas para su empleo, suspensiones, emulsiones, polvos, pastas y granulados. El empleo se lleva a cabo en forma usual por ejemplo mediante riego, pulverización, aspersión, esparcido.

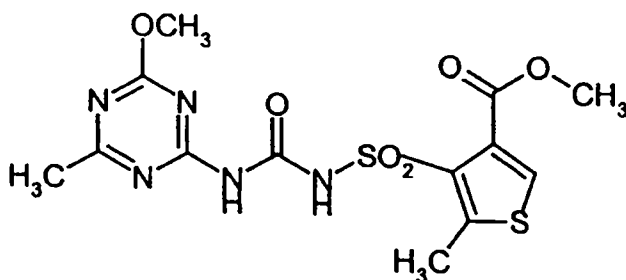
Los productos activos según la invención pueden aplicarse tanto antes como después del brote de las plantas. También pueden incorporarse, en el suelo antes de la siembra.

La cantidad de producto activo empleada puede oscilar dentro de un amplio margen. Esta depende fundamentalmente del tipo del efecto deseado. En general las cantidades empleadas se sitúa entre 1 g y 10 kg de producto activo por hectárea de superficie del terreno, preferentemente entre 5 g y 5 kg por hectárea.

La obtención y el empleo de las sustancias activas según la invención se deducen de los ejemplos siguientes:

Ejemplos de obtención:

Ejemplo 1.



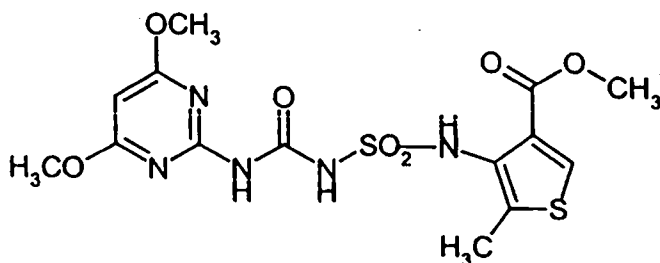
(Procedimiento (b)).

Se disuelven 0,75 g (2,9 mmoles) de la 2-fenoxycarbonilamino-4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazina en 40 ml de acetonitrilo y se combinan, sucesivamente, con 0,75 g (3,2 mmoles) de 2-metil-3-sulfamoil-tiofen-4-carboxilato de metilo y 0,49 g (3,2 mmoles) de dizabicioundeceno (DBU). La mezcla de la reacción se agita

durante 12 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) y a continuación se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua. El residuo se recoge en cloruro de metileno, se lava con ácido clorhídrico 2N y con agua, se seca con sulfato de magnesio y se filtra. El filtrado se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua, el residuo se digiere con dietiléter y el producto cristalino precipitado se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 0,60 g (52 % de la teoría) de la N-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-N'-(4-metoxicarbonil-2-metil-tien-3-il-sulfonil)-urea con un punto de fusión de 195°C.

Ejemplo 2.



(Procedimiento (d)).

Se disponen 1,05 g (7,5 mmoles) de clorosulfonilisocianato en 75 ml de cloruro de metileno. Tras refrigeración a -10°C se añade a esta mezcla, bajo agitación, gota a gota, una solución de 1,16 g (7,5 mmoles) de 2-amino-4,6-dimetoxi-pirimidina en 30 ml de cloruro de metileno y la mezcla se agita durante 30 minutos a -10°C. A continuación se añade, gota a gota, a 0°C, una solución de 1,28 g (7,5 mmoles) de 3-amino-2-metil-tiofen-4-carboxilato de metilo y 0,75 g (7,5 mmoles) de trietilamina en 50 ml de cloruro de metileno y la mezcla de la reacción se agita durante 12 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C). A continuación se añaden 100 ml de agua y 100 ml de ácido clorhídrico 2N, la fase orgánica se separa, se lava con 50 ml de agua, se seca con sulfato de

magnesio y se filtra. El filtrado se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua y el residuo se cristaliza en etanol.

Se obtienen 2,1 g (66 % de la teoría) de la N-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-N'-(4-metoxicarbonil-2-metil-tien-3-il-amino-sulfonil)-urea con un punto de fusión de 174°C.

De manera análoga a la de los ejemplos 1 y 2, así como de acuerdo con al descripción general del procedimiento de obtención según la invención pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I) indicados en la tabla 1 siguiente.

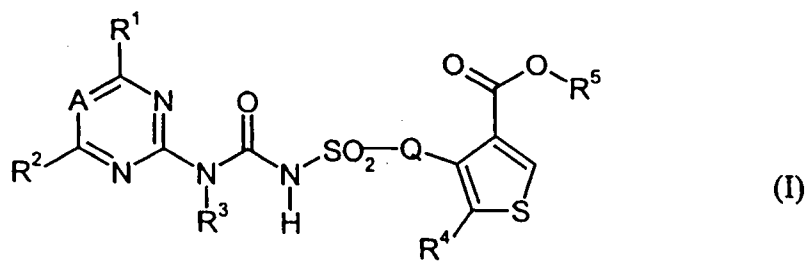
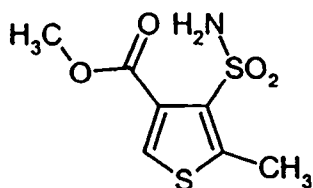


Tabla 1: Ejemplos de compuestos de la fórmula (I).

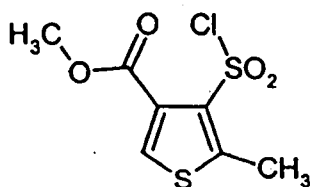
Ej. nº	A	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Punto de fusión (°C)
3	CH	NH	OCH ₃	OCH ₃	H	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	140
4	CH	NH	OCH ₃	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	154
5	CH	NH	OCH ₃	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₃	195
6	CH	-	OCH ₃	OCH ₃	H	CH ₃	CH ₃	194

Productos de partida de la fórmula (V):

Ejemplo (V-1).



Primera etapa:

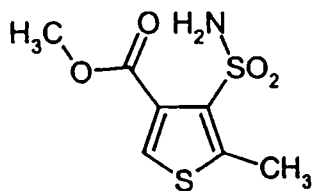


Se añade, gota a gota, una solución de 19,9 g (0,29 moles) de nitrito de sodio en 60 ml de agua, a 0°C hasta 5°C, bajo agitación, a una solución de 42,7 g (0,25 moles) de 3-amino-2-metil-tiofen-4-carboxilato de metilo en 75 ml de ácido clorhídrico acuoso al 10 %. La mezcla de la reacción se agita durante 60 minutos a 0°C hasta 5°C. A continuación se elimina el exceso de nitrito con ácido amidosulfónico. La mezcla se añade a continuación, a 0°C hasta 5°C, gota a gota, bajo agitación, a una solución de 35 g (0,55 moles) de dióxido de azufre en 300 ml de cloruro de metileno. Tras adición de 1,5 g de cloruro cuproso (I) y de 1,5 g de bromuro de dodecil-trimetilamonio, se agita la mezcla de la reacción durante 60 minutos a 40°C y durante otras 12 horas a 20°C. A continuación se añaden 18 ml de ácido clorhídrico acuoso al 35 %, la mezcla se agita durante 4 horas a 20°C y a continuación se separan las fases. La fase acuosa se extrae ulteriormente con cloruro de metileno, las fases orgánicas reunidas se lavan con agua, se secan con sulfato de magnesio y se filtran. El filtrado se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua y el residuo se cristaliza en hexano.

Se obtienen 51,7 g (81 % de la teoría) de cloruro de 4-metoxycarbonil-2-

metil-tiofen-3-sulfonilo.

Segunda etapa.



Se agita durante 12 horas a temperatura ambiente (aproximadamente a 20°C) una mezcla formada por 45 g (177 mmoles) de cloruro de 4-metoxycarbonil-2-metil-tiofen-3-sulfonilo, 34 g (354 mmoles) de carbonato de amonio y 400 ml de cloruro de metileno. Tras filtración se elimina por destilación el disolvente del filtrado al vacío de la trompa de agua, el residuo se digiere con dietiléter y el producto cristalino se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 21,5 g (52 % de la teoría) de la 4-metoxycarbonil-2-metil-tiofen-2-sulfonamida.

Ejemplos de aplicación:

Ejemplo A.

Ensayo pre-brote.

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se siembran en terreno normal semillas de las plantas de ensayo. Al cabo de 24 horas, aproximadamente, se pulveriza el suelo con la preparación del producto activo de tal manera que se aplique, respectivamente, la cantidad de producto activo

deseada por unidad de superficie. La concentración del caldo de pulverización se elegirá de tal modo que se aplique en 1.000 litros de agua por hectárea, respectivamente, la cantidad de producto activo deseada

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo del control no tratados.

Significan:

0 % = sin efecto (igual que los controles no tratados).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 2, 3, 4, 5 y 6, con una buena compatibilidad para con las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, algodón, maíz y soja, un potente efecto muy potente contra las malas hierbas.

Ejemplo B.

Ensayo de post-brote.

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se pulverizan, con la preparación del producto activo, plantas de ensayo, que tienen una altura de 5 hasta 15 cm, de tal manera que, se apliquen respectivamente las cantidades de producto activo deseadas por unidad de superficie. La concentración de los caldos pulverizables se elige de tal forma que se aplique en 1.000 litros de agua/ha la cantidad deseada en cada caso de producto activo.

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo de los controles sin tratar.

Significan:

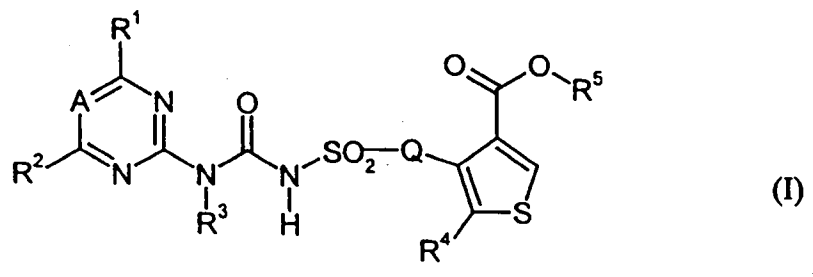
0 % = sin efecto (igual que los controles sin tratar).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 2, 5 y 6, con una compatibilidad parcialmente buena frente a las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, cebada y trigo, un efecto muy potente contra las malas hierbas.

REIVINDICACIONES

1.- Compuestos de la fórmula general (I)



en la que

A significa nitrógeno o un grupo CH-,

Q significa un enlace sencillo o significa NH,

R¹ significa hidrógeno, halógeno o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, ariloxi o heterociciloxi substituidos respectivamente en caso dado,

R² significa hidrógeno, halógeno o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, ariloxi o heterociciloxi substituidos respectivamente en caso dado,

R³ significa hidrógeno o alquilo substituido en caso dado,

R⁴ significa halógeno o significa alquilo substituido en caso dado y -en el caso en que Q signifique NH- significa también hidrógeno, y

R⁵ significa hidrógeno o significa alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo o heterociclilo substituidos respectivamente en caso dado,

así como sales de los compuestos de la fórmula (I).

2.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

R¹ significa hidrógeno, significa halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino o dialquilamino con respectivamente 1 a 4 átomos de carbono en el grupo alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por

halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o significa fenoxi, oxetaniloxi, furiloxi o tetrahidrofuriloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos carbono,

R² significa halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino o dialquilamino con respectivamente 1 a 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o significa fenoxi, oxetaniloxi, furiloxi o tetrahidrofuriloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R³ significa hidrógeno o significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido en caso dado por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R⁴ significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono y —en el caso en que Q signifique NH— significa también hidrógeno y

R⁵ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno, o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo o alquinilo con respectivamente 2 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo con respectivamente 3 a 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, con 1 a 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa oxetanilo, furilo o tetrahidrofurilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano,

por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

3.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

- R¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,
- R² significa flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,
- R³ significa hidrógeno o significa metilo o etilo substituidos respectivamente en caso dado por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por acetilo, por propionilo, por n- o i-butirol, por metoxycarbonilo, por etoxycarbonilo, por n- o i-propoxycarbonilo,
- R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, y
- R⁵ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propenilo, butenilo, propinilo o butinilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro o por bromo, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo.

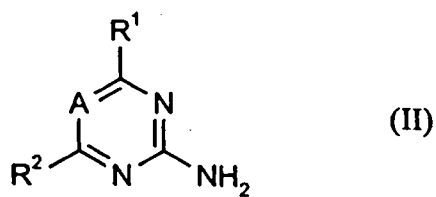
4.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

- R¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, metilamino, etilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa dimetilamino,
- R² significa flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, metilamino o etilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa dimetilamino,
- R³ significa hidrógeno o metilo,
- R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, y
- R⁵ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa propenilo o propinilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro.

5.- Sales de sodio, de potasio, de magnesio, de calcio, de amonio, de alquil-amonio con 1 a 4 átomos de carbono, de di-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono(-amonio), de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tetra-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-sulfonio, de cicloalquil-amonio con 5 o 6 átomos de carbono y de di-(alquilo con 1 a 2 átomos de carbono)-bencil-amonio, de los compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 4.

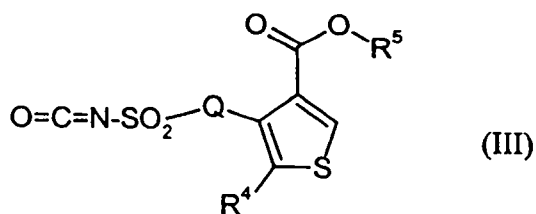
6.- Procedimiento para la obtención de los compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque

- (a) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general (II)



en la que

A, R¹ y R² tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4,
con tienil(amino)sulfonilisocianatos de la fórmula general (III)

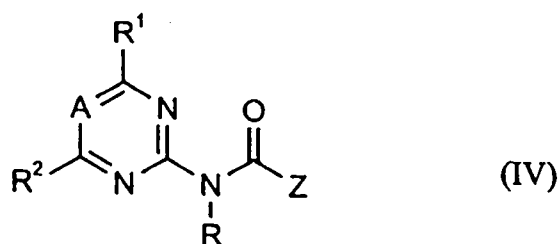


en la que

Q, R⁴ y R⁵ tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4,
en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en
presencia de un diluyente,

o porque

(b) se hacen reaccionar aminoazinas substituidas de la fórmula general (IV)

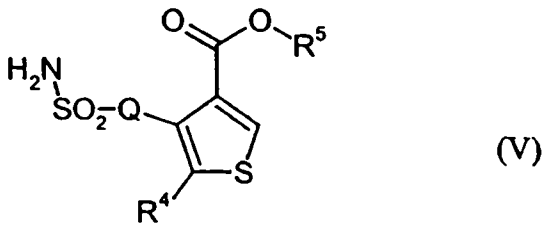


en la que

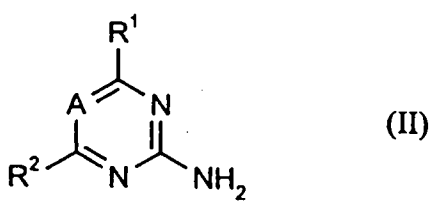
A, R¹ y R² tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4

Z significa halógeno, alcoxi o ariloxi y

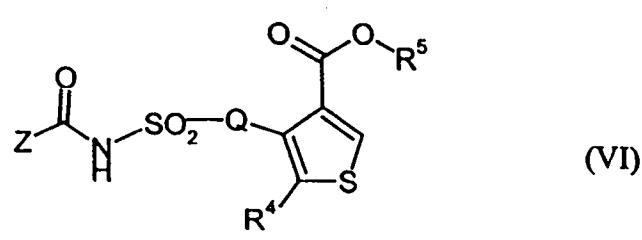
R tiene el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4 para R³ o significa el agrupamiento -C(O)-Z, con derivados de tiofeno de la fórmula general (V)



en la que
 Q, R⁴ y R⁵ tienen el significado anteriormente indicado,
 en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,
 o porque
 (c) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general (II)



en la que
 A, R¹ y R² tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4 con derivados de tiofeno de la fórmula general (VI)



en la que

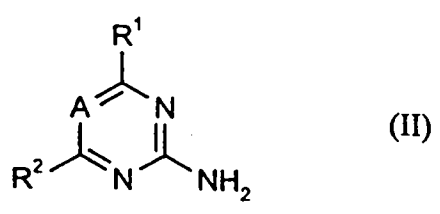
Q, R⁴ y R⁵ tienen el significado indicado en una de las reivindicaciones 1 a 4 y

Z significa halógeno, alcoxi o ariloxi,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

o porque

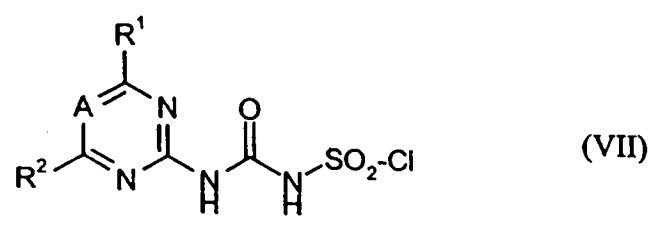
(d) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general (II),



en la que

A, R¹ y R² tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4

con clorosulfonilisocianato, en caso dado en presencia de un diluyente y las clorosulfonilaminocarbonilamino-azinas formadas en este caso de la fórmula general (VII),

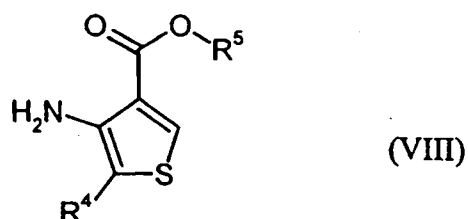


en la que

A, R¹ y R² tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4

- tras aislamiento provisional o "in situ" -

se hacen reaccionar con aminotiofenos substituidos de la fórmula general (VIII)



en la que

R⁴ y R⁵ tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

y en caso dado los compuestos de la fórmula (I), obtenidos según los procedimientos (a), (b), (c) o (d), se transforman en sales según métodos usuales.

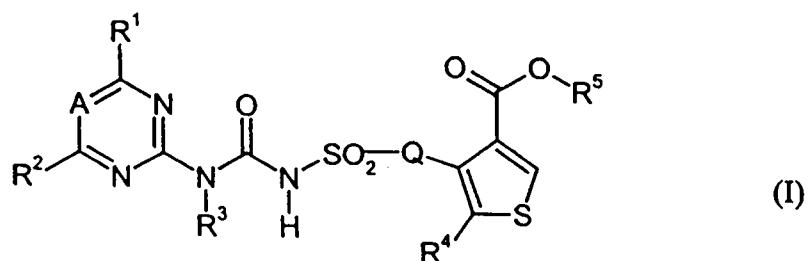
7.- Procedimiento para la lucha contra el crecimiento indeseable de las plantas, caracterizado porque se deja actuar sobre las plantas indeseables y/o sobre su medio ambiente al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 5.

8.- Empleo de al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 5, para la lucha contra las plantas indeseables.

9.- Agentes herbicidas, caracterizados porque tienen un contenido de un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 5, y extendedores y/o agentes tensioactivos usuales.

RESUMEN

La invención se refiere a nuevas tienil(amino)sulfonilureas substituidas, de la fórmula general (I),



en la que A, Q, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ tienen el significado indicado en la descripción,

a procedimientos para su obtención y a su empleo como herbicidas.

COLOMBIA

LeA 33 917-CQ

MEMORIA DESCRIPTIVA

S o b r e :

TIENIL(AMINO)SULFONILUREAS SUBSTITUIDAS.

Solicitante.- BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, entidad alemana.

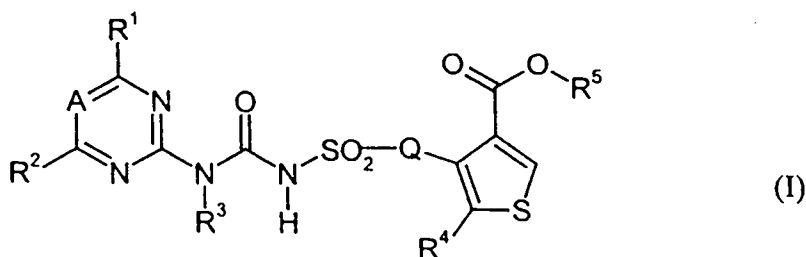
Residente.- D-51368, Leverkusen, República Federal de Alemania.

**TIENIL (AMINO) SULFONILUREAS SUBSTITUIDAS, METODO PARA
PREPARAR DICHS COMPUESTOS Y HERBICIDAS QUE LOS CONTIENEN**

La invención se refiere a nuevas tienil(amino)sulfonilureas substituidas, a procedimientos para su obtención y a su empleo como herbicidas.

Se sabe ya que determinadas tienilsulfonilureas substituidas presentan propiedades herbicidas (véanse las EP-A-30142 / US-A-4481029 / US-A-4599103 / US-A-4701535, EP-A-97122 / US-A-4549898, EP-A-207609 / US-A-4668281). Sin embargo la actividad herbicida de estos compuestos conocidos no es satisfactoria en todos los casos.

Se han encontrado ahora las nuevas tienil(amino)sulfonilureas substituidas de la fórmula general (I)



en la que

A significa nitrógeno o un grupo CH-,

Q significa un enlace sencillo o significa NH,

R¹ significa hidrógeno, halógeno o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, ariloxi o heterocicliloxi substituidos respectivamente en caso dado,

R² significa hidrógeno, halógeno o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, ariloxi o heterocicliloxi substituidos respectivamente en caso dado,

R³ significa hidrógeno o alquilo substituido en caso dado,

R⁴ significa halógeno o significa alquilo substituido en caso dado y -en el caso

en que Q signifique NH- significa también hidrógeno, y R^s significa hidrógeno o significa alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, cicloalquilalquilo o heterociclilo substituidos respectivamente en caso dado, así como sales de los compuestos de la fórmula (I).

Los agrupamientos hidrocarbonados saturados o insaturados, tales como alquilo, alqueno o alquino -incluso en combinación con heteroátomos, como en alcoxi- son, en tanto en cuanto sea posible, respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada.

Los restos substituidos en caso dado pueden estar mono o polisubstituidos, pudiendo ser los substituyentes iguales o diferentes en el caso de polisubstitución.

Los substituyentes o bien los intervalos preferentes de los restos presentes en las fórmulas indicadas anteriormente o que se indicarán a continuación, se definen a continuación.

Preferentemente,

A significa nitrógeno o un grupo CH-.

Preferentemente,

Q significa un enlace sencillo o significa NH.

Preferentemente,

R¹ significa hidrógeno, significa halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino o dialquilamino con respectivamente 1 a 4 átomos de carbono en el grupo alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o significa fenoxi, oxetaniloxi, furiloxi o tetrahidrofuriloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos carbono.

Preferentemente,

R² significa halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino o dialquilamino con respectivamente 1 a 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o significa fenoxi, oxetanilo, furilo o tetrahidrofurilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R³ significa hidrógeno o significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido en caso dado por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁴ significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono y -en el caso en que Q signifique NH- significa también hidrógeno.

Preferentemente,

R⁵ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno, o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alqueno o alquino con respectivamente 2 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo con respectivamente 3 a 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, con 1 a 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa oxetani-

furilo o tetrahidrofurilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

A significa nitrógeno o un grupo CH-.

De forma especialmente preferente,

Q significa un enlace sencillo o significa NH.

De forma especialmente preferente,

R¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R² significa flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R³ significa hidrógeno o significa metilo o etilo substituidos respectivamente en caso dado por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por acetilo, por propionilo, por n- o i-butirole, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxicarbonilo.

De forma especialmente preferente,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o

por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R⁵ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propenilo, butenilo, propinilo o butinilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro o por bromo, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo.

De forma muy especialmente preferente,

A significa nitrógeno o un grupo CH-.

De forma muy especialmente preferente,

Q significa un enlace sencillo o significa NH.

De forma muy especialmente preferente,

R¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, metilamino, etilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa dimetilamino.

De forma muy especialmente preferente,

R² significa flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, metilamino o etilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa dimetilamino.

De forma muy especialmente preferente,

R³ significa hidrógeno o metilo.

De forma muy especialmente preferente,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro.

De forma muy especialmente preferente,

R⁵ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa propenilo o propinilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro.

Del modo mas preferente,

A significa un agrupamiento CH-.

Del modo mas preferente,

R¹ y R² significan metoxi.

Del modo mas preferente,

R³ significa hidrógeno.

El objeto de la invención son, preferentemente, también las sales de sodio, de potasio, de magnesio, de calcio, de amonio, de alquil-amonio con 1 a 4 átomos de carbono, de di-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono(-amonio), de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tetra-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-sulfonio, de cicloalquil-amonio con 5 o 6 átomos de carbono y de di-(alquilo con 1 a 2 átomos de carbono)-bencil-amonio de los compuestos de la fórmula (I), en la que A, Q, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ tienen el significado dado anteriormente de manera preferente.

Las definiciones de los restos dadas anteriormente de manera general o en los intervalos preferentes son válidas tanto para los productos finales de la fórmula (I) como también, de manera correspondiente, para los productos de partida o bien para los productos intermedios necesarios respectivamente para la obtención. Estas definiciones de los restos pueden combinarse arbitrariamente

entre sí, es decir incluso entre los intervalos indicados de los compuestos preferentes.

Según la invención son preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera preferente.

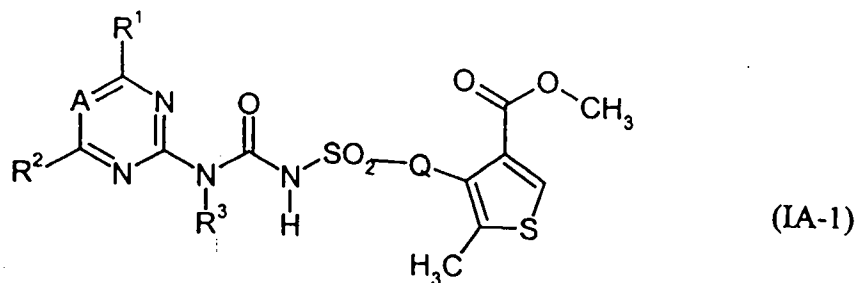
Según la invención son especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera especialmente preferente.

Según la invención son muy especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera muy especialmente preferente.

Según la invención son mas preferentes los compuestos en los cuales R^1 , R^2 , R^3 o A, tienen uno de los significados indicados como mas preferentes.

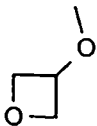
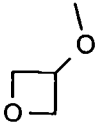
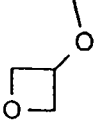
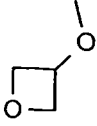
Ejemplos de los compuestos según la invención de la fórmula (I) se han indicado en los grupos siguientes.

Grupo 1.

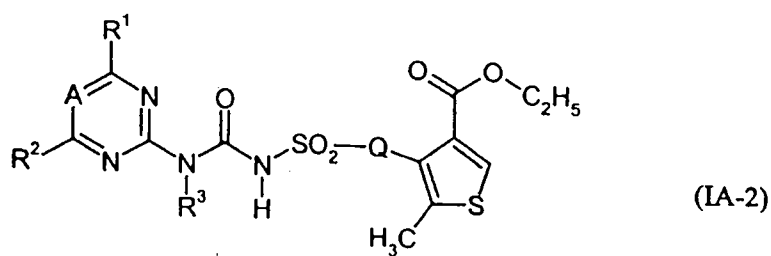


en la que A, Q, R^1 , R^2 y R^3 tienen, por ejemplo, el significado indicado a continuación:

A	Q	R ¹	R ²	R ³
CH	-	OCH ₃	OCH ₃	H
CH	NH	OCH ₃	OCH ₃	H
CH	-	CH ₃	OCH ₃	H
CH	NH	CH ₃	OCH ₃	H
CH		CH ₃	CH ₃	H
CH	NH	CH ₃	CH ₃	H
CH	-	Cl	OCH ₃	H
CH	-	H	CH ₃	H
N	-	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
N	-	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
N	-	CH ₃	OCH ₃	H
N	NH	CH ₃	OCH ₃	H
N	-	OCH ₃	OCH ₃	H
N	NH	OCH ₃	OCH ₃	H
N	-	CH ₃	CH ₃	H
N	-	OCHF ₂	N(CH ₃) ₂	H
N	-	CH ₃	SCH ₃	H
N	-	C ₂ H ₅	OCH ₃	H
N	-	CH ₃	OC ₂ H ₅	H
N	-	H	OCH ₃	H

A	Q	R ¹	R ²	R ³
N	-	OCH ₃		H
N	-	CH ₃	N(CH ₃) ₂	H
CH	-	OCH ₃		H
CH	-	CH ₃		H
CH	-	Cl		H
N	-	H		H
N	-	N(CH ₃) ₂	OCH ₂ CF ₃	H

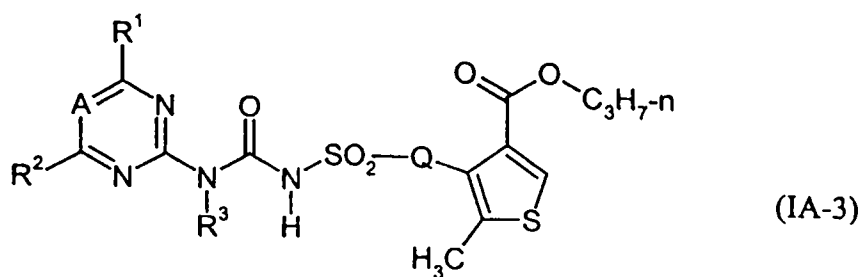
Grupo 2.



En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

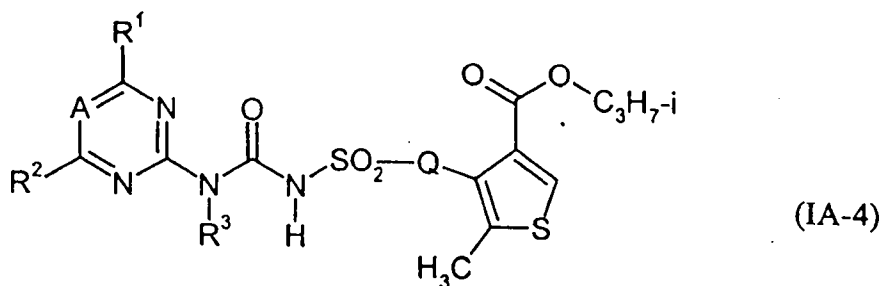
121

Grupo 3.



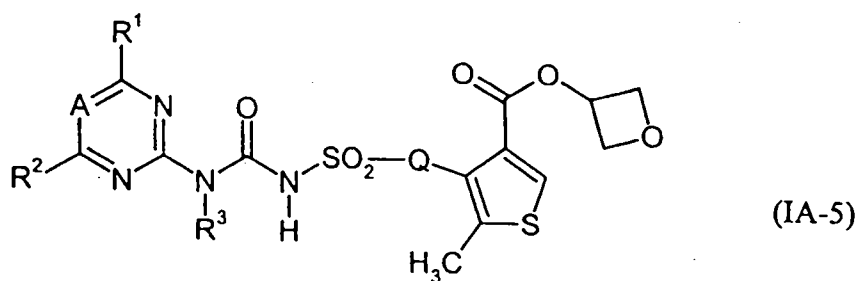
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 4.



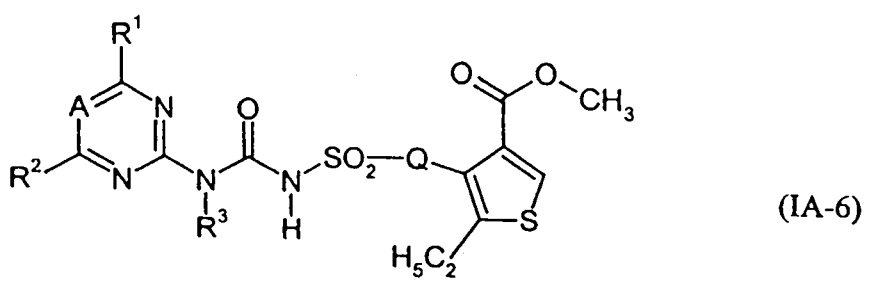
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 5.



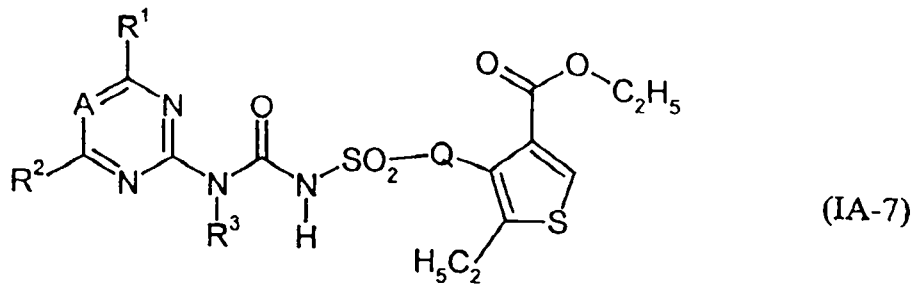
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 6.



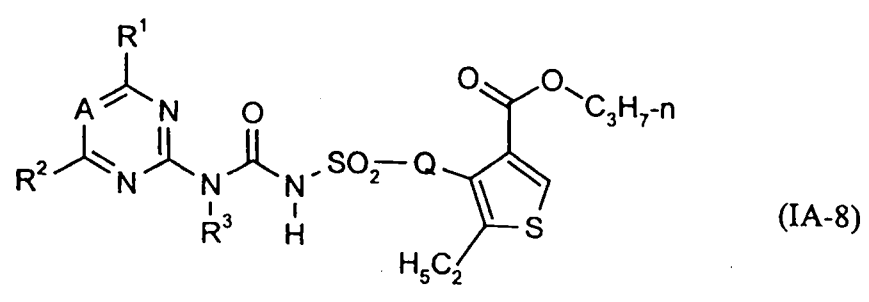
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 7.



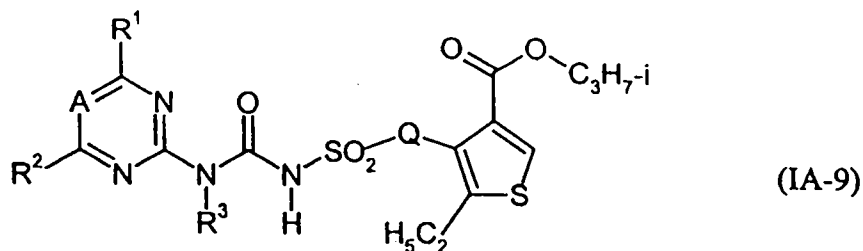
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 8.



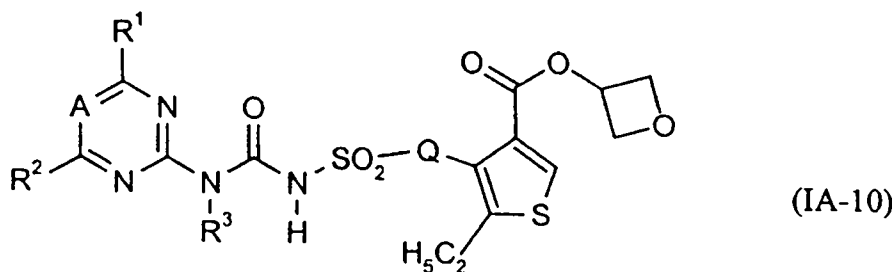
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 9.



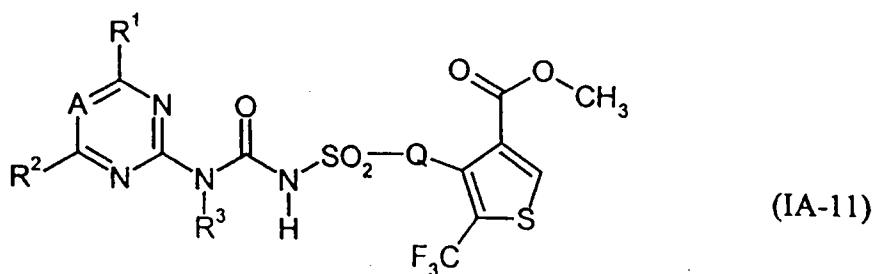
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 10.



En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

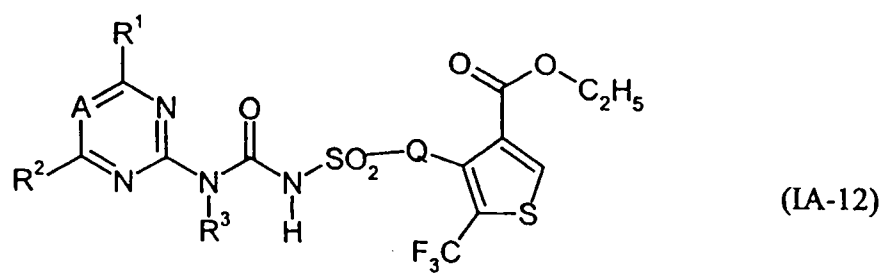
Grupo 11.



En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

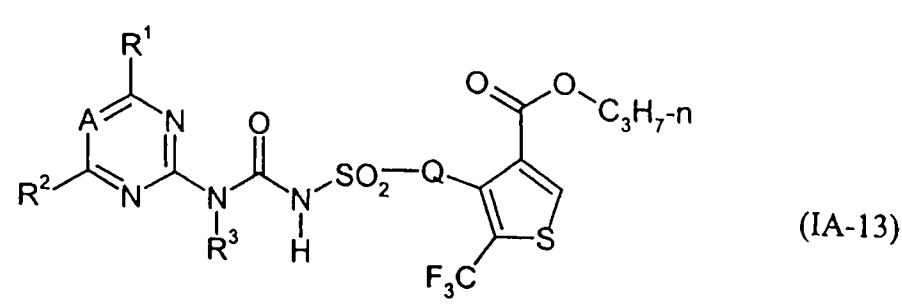
12a

Grupo 12.



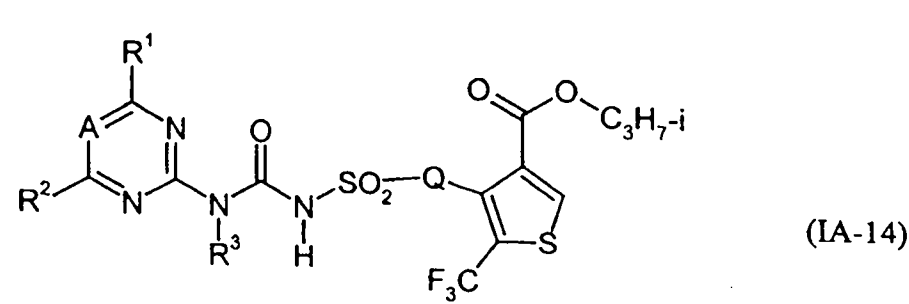
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 13.



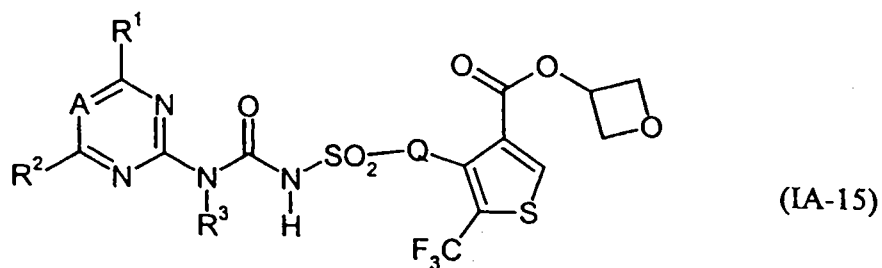
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 14.



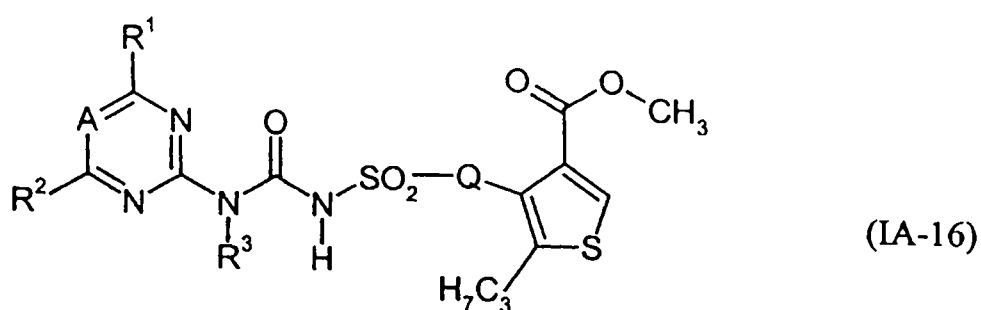
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 15.



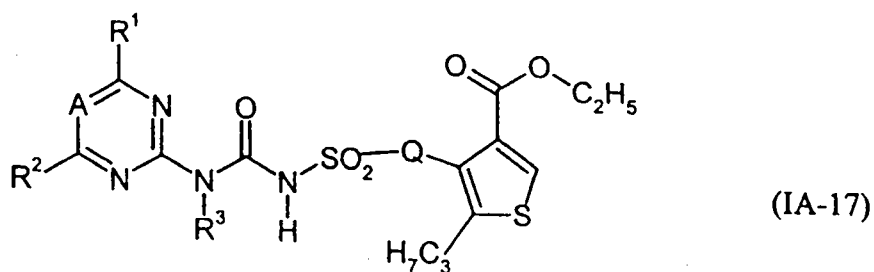
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 16.

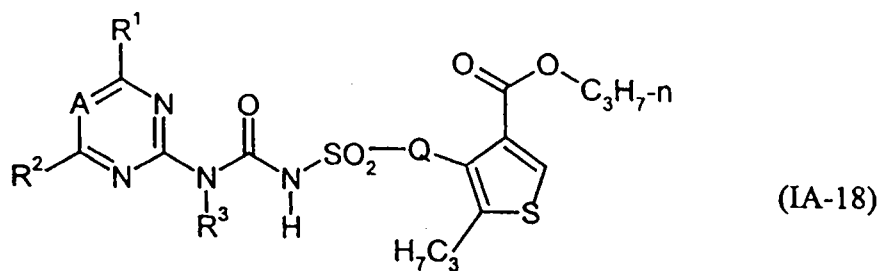


En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

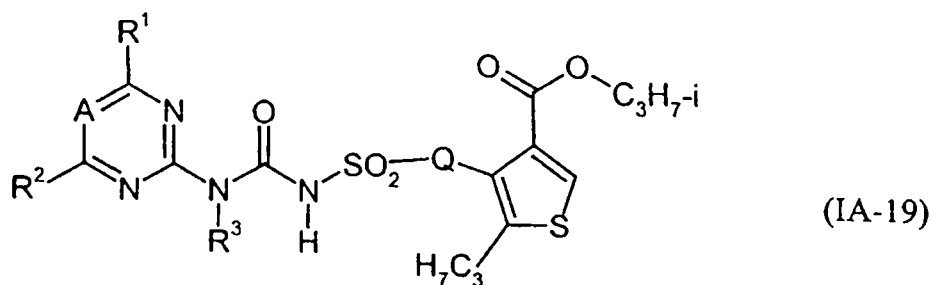
Grupo 17.



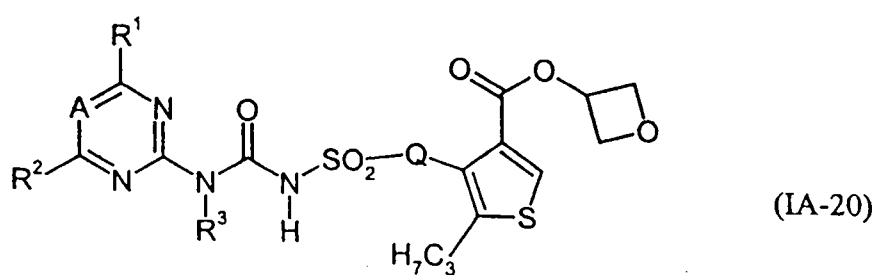
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 18.

En este caso A, Q, R^1 , R^2 y R^3 tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

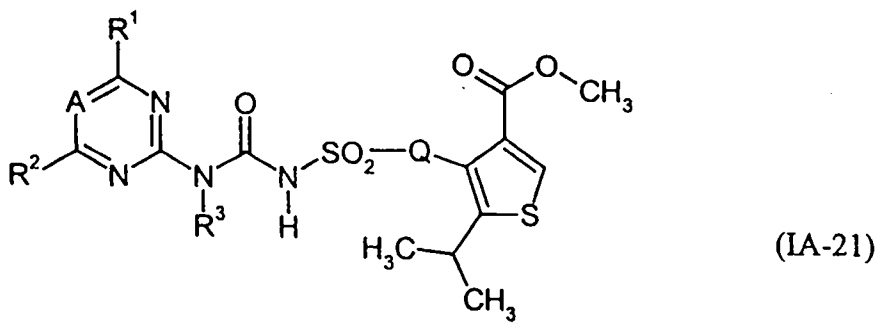
Grupo 19.

En este caso A, Q, R^1 , R^2 y R^3 tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 20.

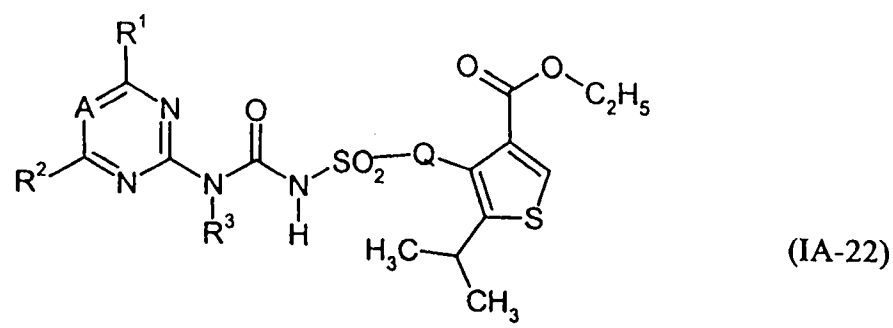
En este caso A, Q, R^1 , R^2 y R^3 tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 21.



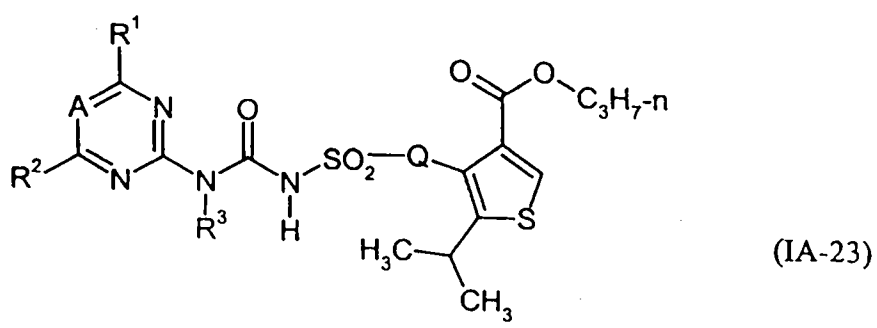
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 22.



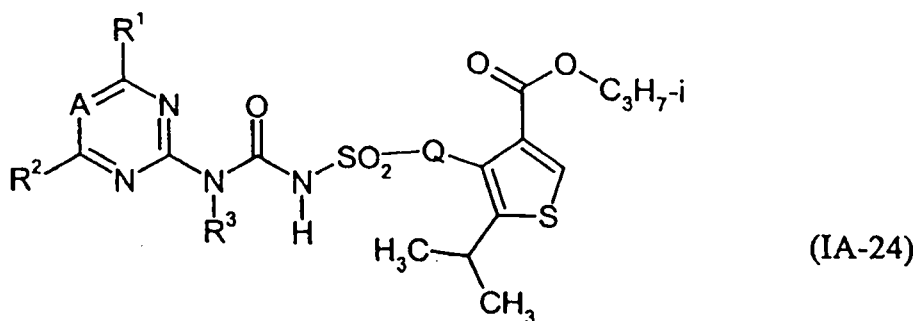
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 23.



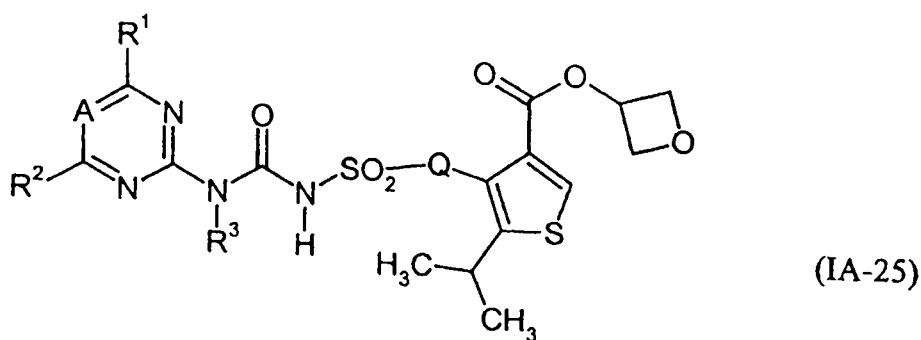
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 24.



En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Grupo 25.



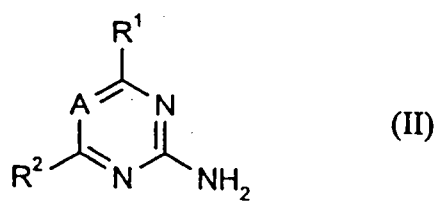
En este caso A, Q, R¹, R² y R³ tienen, de manera ejemplificativa, el significado indicado anteriormente en el grupo 1.

Las nuevas tienil(amino)sulfonilureas substituidas de la fórmula general (I) se caracterizan por una potente actividad herbicida.

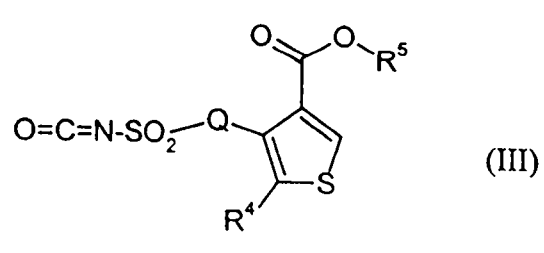
Se obtienen las nuevas tienil(amino)sulfonilureas substituidas de la fórmula general (I),

o si

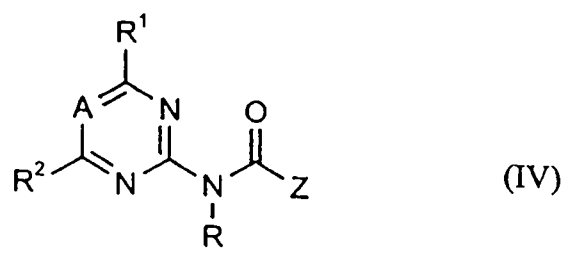
(a) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general (II)



en la que
 A, R¹ y R² tienen el significado anteriormente indicado,
 con tienil(amino)sulfonilisocianatos de la fórmula general (III)



en la que
 Q, R⁴ y R⁵ tienen el significado anteriormente indicado,
 en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado,
 en presencia de un diluyente,
 o si
 (b) se hacen reaccionar aminoazinas substituidas de la fórmula general (IV)



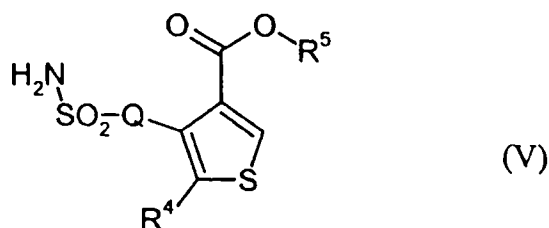
en la que
 A, R¹ y R² tienen el significado anteriormente indicado,

Z significa halógeno, alcoxi o ariloxi y

R tiene el significado anteriormente indicado para R³ o significa el agrupamiento

-C(O)-Z,

con derivados de tiofeno de la fórmula general (V)



en la que

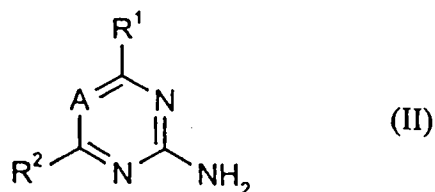
Q, R⁴ y R⁵ tienen el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado,

en presencia de un diluyente,

o si

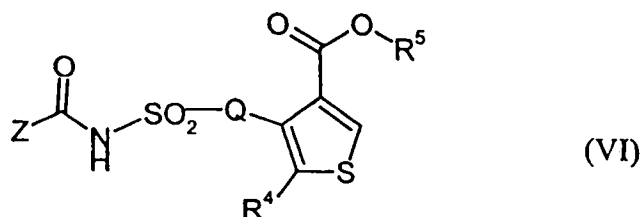
(c) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general (II)



en la que

A, R¹ y R² tienen el significado anteriormente indicado,

con derivados de tiofeno de la fórmula general (VI)



en la que

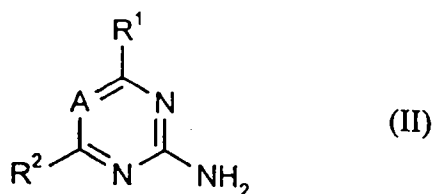
Q, R⁴ y R⁵ tienen el significado anteriormente indicado y

Z significa halógeno, alcoxi o ariloxi,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

o si

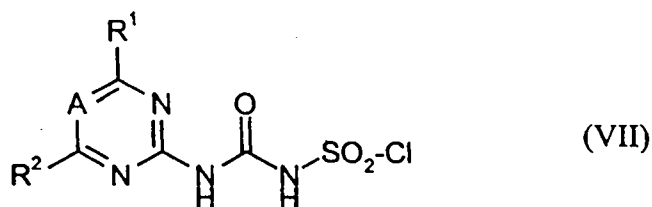
(d) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general (II),



en la que

A, R¹ y R² tienen el significado anteriormente indicado,

con clorosulfonilisocianato, en caso dado en presencia de un diluyente y las clorosulfonilaminocarbonilamino-azinas formadas en este caso de la fórmula general (VII),

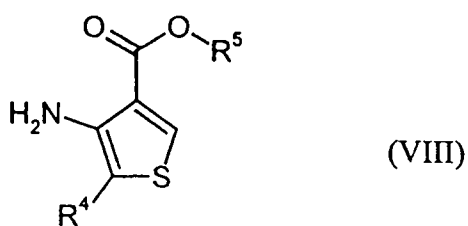


en la que

A, R¹ y R² tienen el significado anteriormente indicado,

- tras aislamiento provisional o "in situ" -

se hacen reaccionar con aminotiofenos substituidos de la fórmula general (VIII)



en la que

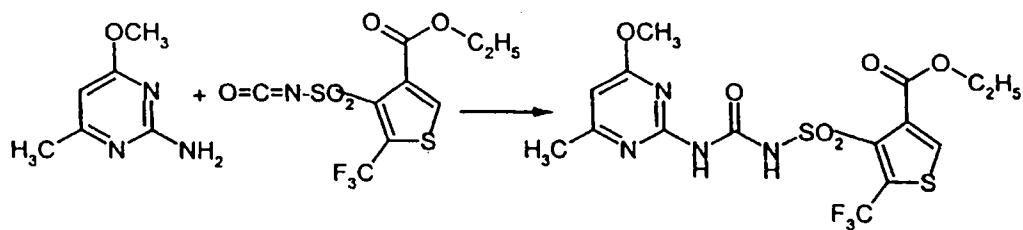
R⁴ y R⁵ tienen el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

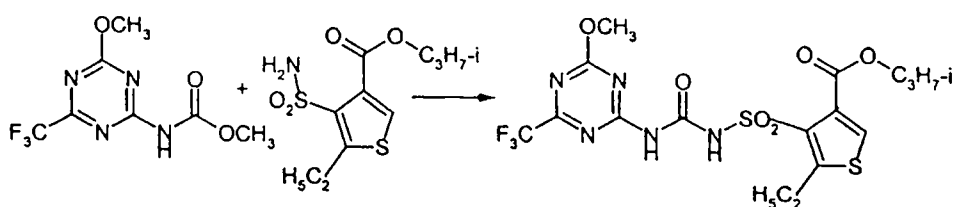
y en caso dado los compuestos de la fórmula (I), obtenidos según los procedimientos (a), (b), (c) o (d), se transforman en sales según métodos usuales.

Si se emplean, por ejemplo, la 2-amino-4-metoxi-6-metil-pirimidina y el 4-etoxicarbonil-2-trifluórmethyl-3-il-sulfonilisocianato como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento (a) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:

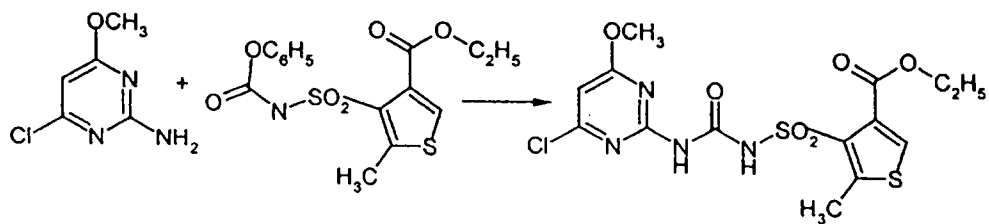
-23-



Si se emplean, por ejemplo, la 2-metoxycarbonilamino-4-metoxi-6-trifluórmethyl-1,3,5-triazina y la 2-etil-4-i-propoxycarbonil-tiofen-3-sulfonamida como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción, en el caso del procedimiento (b) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:

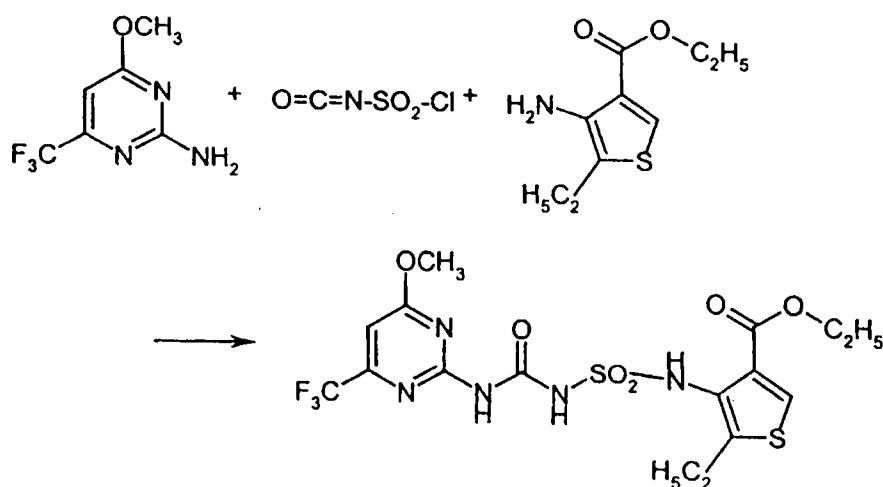


Si se emplean, por ejemplo, la 2-amino-4-cloro-6-metoxi-pirimidina y el N-(4-etoxycarbonil-2-metil-tien-3-il-sulfonil)-O-fenil-uretano como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento (c) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Si se emplean, por ejemplo, la 2-amino-4-metoxi-6-trifluórmethyl-pirimidina, el clorosulfonilisocianato y el 3-amino-2-etil-tiofen-4-carboxilato de

etilo como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento (d) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Las aminoazinas a ser empleadas como productos de partida en los procedimientos según la invención (a), (c) y (d) para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidas en general por medio de la fórmula (II). En la fórmula (II), A, R^1 y R^2 tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido indicados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para A, R^1 y R^2 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I).

Las aminoazinas de la fórmula (II) son productos químicos para síntesis conocidos, en parte obtenibles en el comercio.

Los tienil(amino)sulfonilisocianatos a ser empleados como productos de partida también en el caso del procedimiento (a) según la invención, están definidos en general por medio de la fórmula (III). En la fórmula (III), Q, R^4 y R^5 tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente

preferente para Q, R⁴ y R⁵ en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I).

Los productos de partida de la fórmula (III) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las EP 30142 / US-A-4481029 / US-A- 4599103 / US-A-4701535).

Se obtienen los tienil(amino)sulfonilisocianatos de la fórmula (III), si se hacen reaccionar derivados de tiofeno de la fórmula general (V) -anterior- con fosgeno o bien con tiofosgeno, en caso dado en presencia de un alquilisocianato, tal como por ejemplo butilisocianato, en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción, tal como por ejemplo diazabicyclo[2.2.2]-octano, y en presencia de un diluyente, tal como por ejemplo tolueno, xileno o clorobenceno, a temperaturas comprendidas entre 80°C y 150°C y, tras el final de la reacción se eliminan por destilación los componentes volátiles bajo presión reducida.

Las aminoazinas substituidas, a ser empleadas como productos de partida en el caso del procedimiento (b) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), están definidas en general por medio de la fórmula (IV). En la fórmula (IV), A, R¹ y R² tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para A, R¹ y R² en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I); en este caso Z significa preferentemente flúor, cloro, bromo, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o fenoxi, especialmente significa cloro, metoxi, etoxi o fenoxi.

Los productos de partida de la fórmula (IV) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las US 4690707, DE 19501174).

Los derivados de tiofeno a ser empleados además como productos de partida en el caso del procedimiento (b) según la invención están definidos en general por medio de la fórmula (V). En la fórmula (V), Q, R⁴ y R⁵ tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para Q, R⁴ y R⁵ en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I).

Los productos de partida de la fórmula (V) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las EP 30142 / US-A-4481029 / US-A-4599103 / US-A-4701535, ejemplos de obtención).

Los derivados de tiofeno substituidos a ser empleados como productos de partida en el caso del procedimiento (c) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), están definidos en general por medio de la fórmula (VI). En la fórmula (VI), Q, R⁴ y R⁵ tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para Q, R⁴ y R⁵ en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I); en este caso Z significa preferentemente flúor, cloro, bromo, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o fenoxi, especialmente significa cloro, metoxi, etoxi o fenoxi.

Los productos de partida de la fórmula (VI) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos.

Los aminotiofenos substituidos, a ser empleados como productos de partida en el caso del procedimiento (d) según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidos en general por medio de la fórmula (VIII). En la fórmula general (VIII), R⁴ y R⁵ tienen

preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para R^4 y R^5 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los productos de partida de la fórmula general (VIII) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véase Aust. J. Chem. 48 (1995), 1907-1916).

Como diluyentes para la realización de los procedimientos (a), (b), (c) y (d) según la invención entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen especialmente, hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados, tales como por ejemplo bencina, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, diclorobenceno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano o etilenglicoldimetil- o -dietiléter; cetonas, tales como acetona, butanona o metil-isobutil-cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-formanilida, N-metil-pirrolidona o hexametilfósforotriamida; ésteres tales como acetato de metilo o acetato de etilo, así como sulfóxidos, tal como dimetilsulfóxido.

Los procedimientos (a), (b), (c) y (d) según la invención se llevan a cabo preferentemente en presencia de un agente auxiliar de la reacción adecuado. Como tales entran en consideración todas las bases inorgánicas u orgánicas usuales. A éstas pertenecen, por ejemplo, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinotérreos o de

metales alcalinos, tales como por ejemplo hidruro de sodio, amida de sodio, metilato de sodio, etilato de sodio, terc.-butilato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de amonio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, acetato de amonio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio o carbonato de amonio así como aminas terciarias tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, piridina, N-metilpiperidina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

Las temperaturas de la reacción en la realización de los procedimientos (a), (b), (c) y (d) según la invención pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre -20°C y +150°C, preferentemente entre -10°C y +120°C.

Los procedimientos (a), (b), (c) y (d) según la invención se llevan a cabo en general bajo presión normal. No obstante es posible también llevar a cabo los procedimientos según la invención bajo presión mas elevada o a presión mas reducida -en general comprendida entre 10 kPa y 1000 kPa-.

Para la realización de los procedimientos (a), (b), (c) y (d) según la invención se emplean los productos de partida, en general, en cantidades aproximadamente equimolares. No obstante es posible también emplear uno de los componentes en un exceso mayor. La reacción se lleva a cabo, en general, en un diluyente adecuado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y la mezcla de la reacción se agita, en general, durante varias horas a la temperatura necesaria. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales (véanse los ejemplos de obtención).

A partir de los compuestos de la fórmula general (I) según la invención pueden prepararse también en caso dado sales. Se obtienen tales sales de manera sencilla según métodos usuales para la formación de sales, por ejemplo mediante disociación o dispersión de un compuesto de la fórmula (I) en un disolvente adecuado, tal como por ejemplo cloruro de metileno, acetona, terc.-butilmetiléter o tolueno, y adición de una base adecuada. Las sales pueden aislarse a continuación, -en caso dado tras agitación prolongada- mediante concentración por evaporación o separación mediante filtración por succión.

sales

Los productos activos según la invención se pueden emplear como defoliantes, desecantes, agentes herbicidas y especialmente como agentes para eliminar las malas hierbas. Por malas hierbas, en el más amplio sentido, se han de entender las plantas que crecen en lugares donde son indeseadas. El hecho de que las sustancias, según la invención, actúen como herbicidas totales o selectivos, depende esencialmente de la cantidad empleada

Los productos activos según la invención pueden emplearse por ejemplo en las plantas siguientes:

Malas hierbas dicotiledóneas de las clases: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Cultivos dicotiledóneos de las clases: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Malas hierbas monocotiledóneas de las clases: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Cultivos monocotiledóneos de las clases: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

El empleo de los productos activos según la invención, no está sin embargo, limitado en forma alguna estas clases, sino que se extienden en igual forma también sobre otras plantas.

Los productos activos según la invención son adecuados, en función de la concentración, para combatir totalmente las hierbas malas, por ejemplo, en instalaciones industriales y viarias y en caminos y plazas, con y sin crecimiento de árboles. Del mismo modo, se pueden emplear los compuestos para combatir las hierbas malas en cultivos permanentes, por ejemplo, en instalaciones forestales, de árboles de adorno, de árboles frutales, de viñedos, de árboles cítricos, de nogales, de plátanos, de café, de té, de goma de palmas de aceite, de cacao, de frutos de bayas y de lúpulo, sobre trazados ornamentales y deportivos y en superficies de prados y para combatir las hierbas malas en forma selectiva en los cultivos mono-
anuales.

Los compuestos según la invención de la fórmula (I) muestran una potente actividad herbicida y un amplio espectro de actividad sobre el terreno y sobre las partes aéreas de las plantas. Son adecuados en cierta medida también para combatir de manera selectiva las malas hierbas monocotiledóneas y dicotiledóneas en cultivos monocotiledóneos y dicotiledóneos, tanto en el procedimiento de pre-brote como en el procedimiento de post-brote.

Los productos activos se pueden transformar en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos pulverizables, suspensiones, polvos, medios de espolvoreo, pastas, polvos solubles, granulados, concentrados en suspensión-emulsión, materiales naturales y sintéticos impregnados con el producto activo, así como micro-encapsulados en materiales polímeros.

Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo, mediante mezcla de los productos activos con materiales extendedores, esto es, con disolventes líquidos y/o excipientes sólidos, en caso dado, empleando agentes tensioactivos, esto es, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios generadores de espuma.

En el caso de emplear agua como material de carga se puede emplear, por ejemplo, también disolventes orgánicos como agentes disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran especialmente en consideración: los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, los hidrocarburos aromáticos clorados y los hidrocarburos alifáticos clorados, tales como los clorobenzenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, o las parafinas, por ejemplo, las fracciones de petróleo crudo, los aceites minerales y vegetales, los alcoholes tales como butanol, o glicol, así como sus ésteres y éteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona,

metilisobutilcetona, o ciclohexanona, los disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como el agua.

Como excipientes sólidos entran en consideración: por ejemplo, sales de amonio y los minerales naturales molturados, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierras de diatoméas y minerales sintéticos molturados, tales como ácido silícico, altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos, como excipientes sólidos para granulados entran en consideración: por ejemplo, minerales naturales quebrados y fraccionados tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de materiales orgánicos, tales como serrines, cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco; como emulsionantes y/o generadores de espuma entran en consideración: por ejemplo, los emulsionantes no iónicos y aniónicos, tales como ésteres polioxietilenados de ácidos grasos, éteres polioxietilenados de alcoholes grasos, tales como por ejemplo alquilarilpoliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina; como dispersantes entran en consideración: por ejemplo, lixivitaciones sulfíticas de lignina y metilcelulosa.

En las formulaciones se pueden emplear adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulados o en forma de latex, tales como goma arábica, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales, tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Se pueden emplear colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul ferrocianico y colorantes

orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y de ftalocianina metálicos y nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, por lo general, entre un 0,1 hasta un 95 % en peso de producto activo, preferentemente entre un 0,5 y un 90 %.

Los productos activos según la invención pueden encontrar aplicación como tales o en sus formulaciones también en mezcla con herbicidas conocidos para la lucha contra las malas hierbas, siendo posibles preparados listos para su empleo o mezclas de tanque.

Para las mezclas entran en consideración herbicidas conocidos, por ejemplo:

Acetochlor, Acifluorfen(-sodio), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodio), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Benazolin(-etilo), Benfuresate, Bensulfuron(-metilo), Bentazon, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop(-etilo), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac (-sodio) Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-etilo), Chlormethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-etilo), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Conidon(-etilo) Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim, Clethodim, Clodinafop(-propargilo), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron(-metilo), Cloransulam(-metilo), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop (-butilo), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallylate, Dicamba, Diclofop (-metilo), Diclosulam, Diethatyl(-etilo), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid,

Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epoprodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-metilo), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop(-P-etilo), Fentrazamide, Flamprop(-isopropilo), Flamprop(-isopropilo-L), Flamprop(-metilo), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butilo), Fluazolate, Flucarbazone, Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentilo), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen (-etilo), Flupoxam, Flupropacil, Flupyrsulfuron(-metilo, -sodio), Flurenol(-butilo), Fluridone, Fluroxypyr(-meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-metilo), Fluthiamide, Fomesafen, Glufosinate(-amonio), Glyphosate(-isopropilamonio), Halosafen, Haloxyfop(-etoxietilo), Haloxyfop(-P-metilo), Hexazinone, Imazamethabenz(-metilo), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron(-metilo, -sodio), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alfa-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-metilo), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, ácido pelargónico, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron(-metilo), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen(-etilo), Pyrazolate, Pyrazosulfu-ron(-etilo), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-metilo), Pyriothiobac(-sodio),

Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-etilo), Quizalofop(-P-tefurilo), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-metilo), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-metilo), Thiobencarb, Tiocarbamil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-metilo), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin, Triflusulfuron, Tritosulfuron.

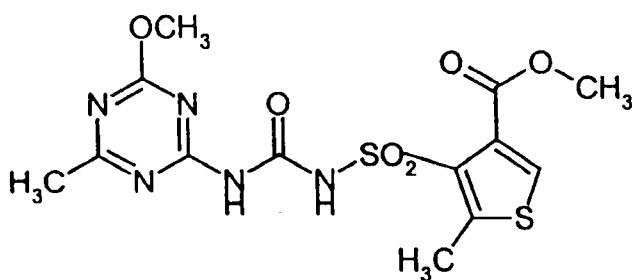
También es posible una mezcla con otras sustancias activas conocidas, tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, sustancias protectoras contra la ingestión por pájaros, sustancias nutrientes de las plantas y medios mejoradores de la estructura del terreno.

Los productos activos pueden emplearse como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de los mismos mediante diluciones ulteriores, tales como soluciones listas para su empleo, suspensiones, emulsiones, polvos, pastas y granulados. El empleo se lleva a cabo en forma usual por ejemplo mediante riego, pulverización, aspersión, esparcido.

Los productos activos según la invención pueden aplicarse tanto antes como después del brote de las plantas. También pueden incorporarse, en el suelo antes de la siembra.

La cantidad de producto activo empleada puede oscilar dentro de un amplio margen. Esta depende fundamentalmente del tipo del efecto deseado. En general las cantidades empleadas se sitúa entre 1 g y 10 kg de producto activo por hectárea de superficie del terreno, preferentemente entre 5 g y 5 kg por hectárea.

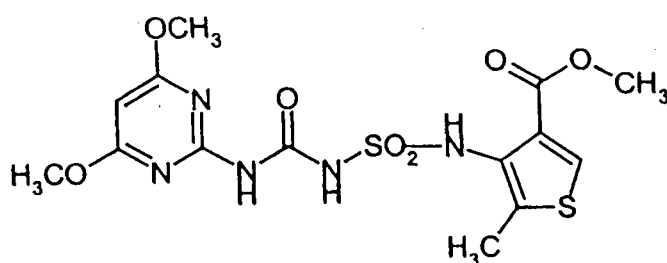
La obtención y el empleo de las sustancias activas según la invención se deducen de los ejemplos siguientes:

Ejemplos de obtención:**Ejemplo 1.****(Procedimiento (b)).**

Se disuelven 0,75 g (2,9 mmoles) de la 2-fenoxicarbonilamino-4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazina en 40 ml de acetonitrilo y se combinan, sucesivamente, con 0,75 g (3,2 mmoles) de 2-metil-3-sulfamoi-tiofen-4-carboxilato de metilo y 0,49 g (3,2 mmoles) de dizabicioundeceno (DBU). La mezcla de la reacción se agita durante 12 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) y a continuación se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua. El residuo se recoge en cloruro de metileno, se lava con ácido clorhídrico 2N y con agua, se seca con sulfato de magnesio y se filtra. El filtrado se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua, el residuo se digiere con dietiléter y el producto cristalino precipitado se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 0,60 g (52 % de la teoría) de la N-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-N'-(4-metoxycarbonil-2-metil-tien-3-il-sulfonyl)-urea con un punto de fusión de 195°C.

Ejemplo 2.



(Procedimiento (d)).

Se disponen 1,05 g (7,5 mmoles) de clorosulfonilisocianato en 75 ml de cloruro de metileno. Tras refrigeración a -10°C se añade a esta mezcla, bajo agitación, gota a gota, una solución de 1,16 g (7,5 mmoles) de 2-amino-4,6-dimetoxi-pirimidina en 30 ml de cloruro de metileno y la mezcla se agita durante 30 minutos a -10°C . A continuación se añade, gota a gota, a 0°C , una solución de 1,28 g (7,5 mmoles) de 3-amino-2-metil-tiofen-4-carboxilato de metilo y 0,75 g (7,5 mmoles) de trietilamina en 50 ml de cloruro de metileno y la mezcla de la reacción se agita durante 12 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C). A continuación se añaden 100 ml de agua y 100 ml de ácido clorhídrico 2N, la fase orgánica se separa, se lava con 50 ml de agua, se seca con sulfato de magnesio y se filtra. El filtrado se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua y el residuo se cristaliza en etanol.

Se obtienen 2,1 g (66 % de la teoría) de la N-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-N'-(4-metoxycarbonil-2-metil-tien-3-il-amino-sulfonyl)-urea con un punto de fusión de 174°C .

De manera análoga a la de los ejemplos 1 y 2, así como de acuerdo con al descripción general del procedimiento de obtención según la invención pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I)

indicados en la tabla 1 siguiente.

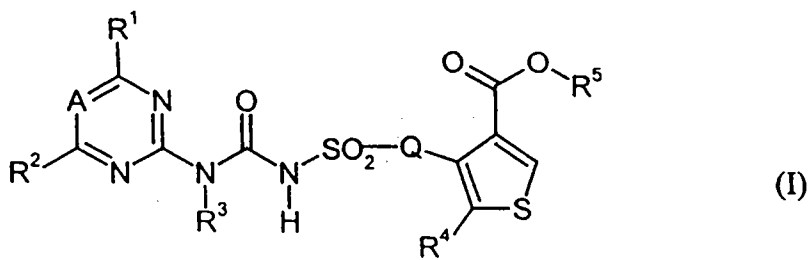
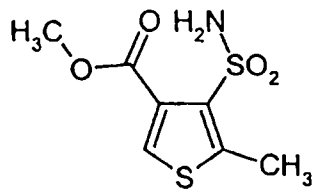


Tabla 1: Ejemplos de compuestos de la fórmula (I).

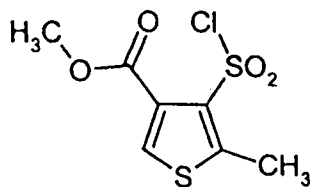
Ej. nº	A	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Punto de fusión (°C)
3	CH	NH	OCH ₃	OCH ₃	H	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	140
4	CH	NH	OCH ₃	OCH ₃	H	i-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	154
5	CH	NH	OCH ₃	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₃	195
6	CH	-	OCH ₃	OCH ₃	H	CH ₃	CH ₃	194

Productos de partida de la fórmula (V):

Ejemplo (V-1).



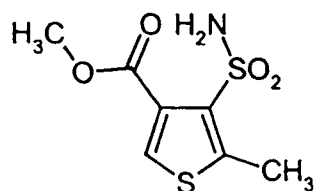
Primera etapa:



Se añade, gota a gota, una solución de 19,9 g (0,29 moles) de nitrito de sodio en 60 ml de agua, a 0°C hasta 5°C, bajo agitación, a una solución de 42,7 g (0,25 moles) de 3-amino-2-metil-tiofen-4-carboxilato de metilo en 75 ml de ácido clorhídrico acuoso al 10 %. La mezcla de la reacción se agita durante 60 minutos a 0°C hasta 5°C. A continuación se elimina el exceso de nitrito con ácido amidosulfónico. La mezcla se añade a continuación, a 0°C hasta 5°C, gota a gota, bajo agitación, a una solución de 35 g (0,55 moles) de dióxido de azufre en 300 ml de cloruro de metileno. Tras adición de 1,5 g de cloruro cuproso (I) y de 1,5 g de bromuro de dodecil-trimetilamonio, se agita la mezcla de la reacción durante 60 minutos a 40°C y durante otras 12 horas a 20°C. A continuación se añaden 18 ml de ácido clorhídrico acuoso al 35 %, la mezcla se agita durante 4 horas a 20°C y a continuación se separan las fases. La fase acuosa se extrae ulteriormente con cloruro de metileno, las fases orgánicas reunidas se lavan con agua, se secan con sulfato de magnesio y se filtran. El filtrado se concentra por evaporación al vacío de la trompa de agua y el residuo se cristaliza en hexano.

Se obtienen 51,7 g (81 % de la teoría) de cloruro de 4-metoxycarbonil-2-metil-tiofen-3-sulfonilo.

Segunda etapa.



Se agita durante 12 horas a temperatura ambiente (aproximadamente a 20°C) una mezcla formada por 45 g (177 mmoles) de cloruro de 4-

metoxycarbonil-2-metil-tiofen-3-sulfonilo, 34 g (354 mmoles) de carbonato de amonio y 400 ml de cloruro de metileno. Tras filtración se elimina por destilación el disolvente del filtrado al vacío de la trompa de agua, el residuo se digiere con dietiléter y el producto cristalino se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 21,5 g (52 % de la teoría) de la 4-metoxycarbonil-2-metil-tiofen-2-sulfonamida.

Ejemplos de aplicación:

Ejemplo A.

Ensayo pre-brote.

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se siembran en terreno normal semillas de las plantas de ensayo. Al cabo de 24 horas, aproximadamente, se pulveriza el suelo con la preparación del producto activo de tal manera que se aplique, respectivamente, la cantidad de producto activo deseada por unidad de superficie. La concentración del caldo de pulverización se elegirá de tal modo que se aplique en 1.000 litros de agua por hectárea, respectivamente, la cantidad de producto activo deseada.

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo del control no tratados.

Significan:

0 % = sin efecto (igual que los controles no tratados).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 2, 3, 4, 5 y 6, con una buena compatibilidad para con las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, algodón, maíz y soja, un potente efecto muy potente contra las malas hierbas.

152

Tabla A1: Ensayo de pre-brote/invernadero.

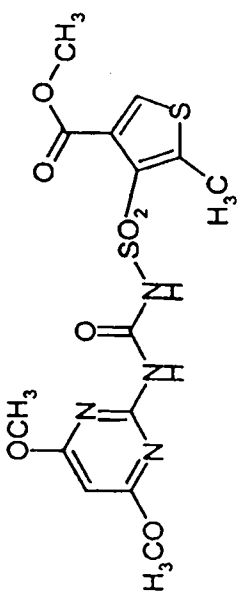
Producto activo según el ejemplo de obtención n°	Cantidad de aplicación (g ai./ha)	Algodón	Alopecurus	Amaranthus	Stellaria	Viola
						
(6)	15	0	80	90	90	100

Tabla A2: Ensayo de pre-brote/invernadero.

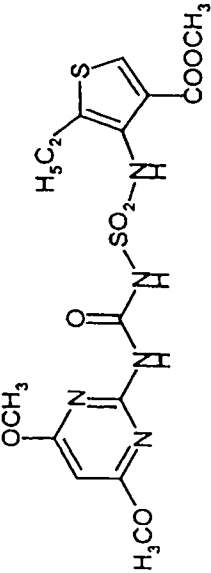
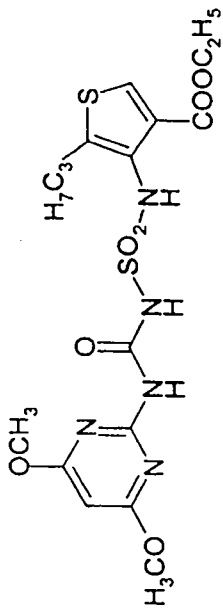
Producto activo según el ejemplo de obtención n°	Cantidad de aplicación (g ai./ha)	Maíz	Cyperus	Chenopodium	Matricaria	Viola
						
(5)	125	20	95	95	100	95

Tabla A3: Ensayo de pre-brote/invernadero.

Producto activo según el ejemplo de obtención n°	Cantidad de aplicación (g ai./ha)	Soja	Matricaria	Stellaria	Veronica	Viola
<chem>COc1nc(NC(=O)NS(=O)(=O)c2cc(C)sc2C(=O)OC)c3nc(OC)nc13</chem> (1)	4	10	95	95	95	100

Tabla A4: Ensayo de pre-brote/invernadero.

Producto activo según el ejemplo de obtención n°	Cantidad de aplicación (g ai./ha)	Alopecurus	Abutilon	Amaranthus	Sinapis
	250	70	80	90	90
(3)					

SS

Tabla A5: Ensayo de pre-brote/invernadero.

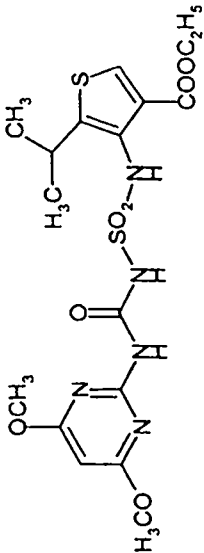
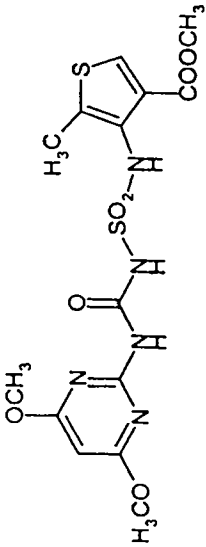
Producto activo según el ejemplo de obtención n°	Cantidad de aplicación (g ai./ha)	Alopecurus	Cyperus	Abutilon	Amaranthus	Sinapis
	250	100	90	95	90	90
(4)						

Tabla A6: Ensayo de pre-brote/invernadero.

Producto activo según el ejemplo de obtención n°	Cantidad de aplicación (g ai./ha)	Maíz	Cyperus	Abutilon	Amaranthus	Sinapis
						
(2)	250	20	95	90	95	95

Ejemplo B.**Ensayo de post-brote.**

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se pulverizan, con la preparación del producto activo, plantas de ensayo, que tienen una altura de 5 hasta 15 cm, de tal manera que, se apliquen respectivamente las cantidades de producto activo deseadas por unidad de superficie. La concentración de los caldos pulverizables se elige de tal forma que se aplique en 1.000 litros de agua/ha la cantidad deseada en cada caso de producto activo.

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo de los controles sin tratar.

Significan:

0 % = sin efecto (igual que los controles sin tratar).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 2, 5 y 6, con una compatibilidad parcialmente buena frente a las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, cebada y trigo, un efecto muy potente contra las malas hierbas.

Tabla B1: Ensayo de post-brote/invernadero.

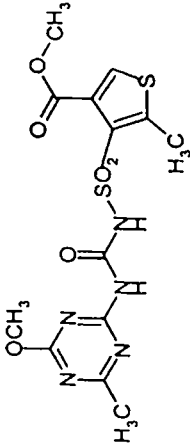
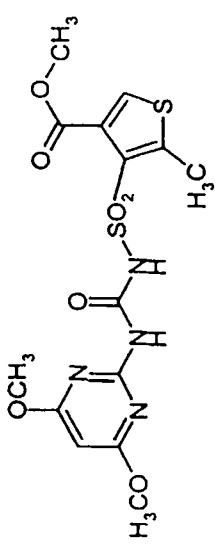
Producto activo según el ejemplo de obtención n°	Cantidad de aplicación (g ai./ha)	Alopecurus	Echinochloa	Lolium	Abutilon	Stellaria	Veronica	Viola
	15	100	100	100	100	100	100	100
(1)								

Tabla B2: Ensayo de post-brote/invernadero

Producto activo según el ejemplo de obtención n°	Cantidad de aplicación (g ai./ha)	Cebada	Alopecurus	Abutilon	Amaranthus	Stellaria
	(6)	20	90	100	100	95

160

Tabla B3: Ensayo de post-brote/invernadero

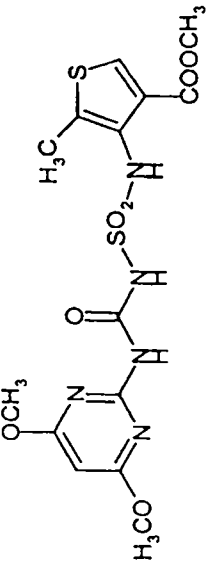
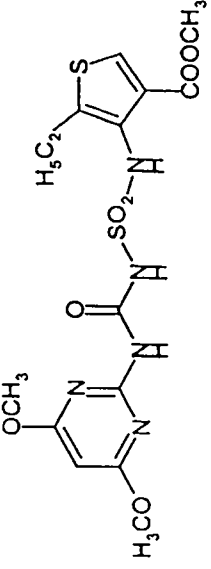
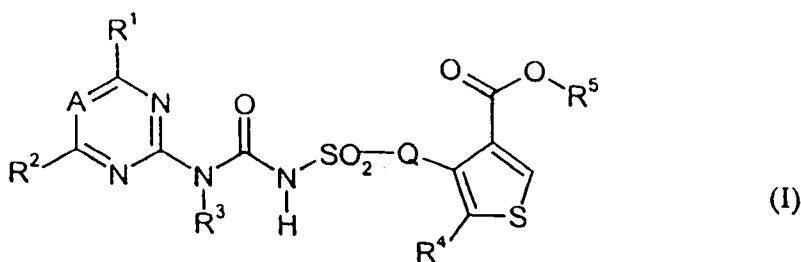
Producto activo según el ejemplo de obtención n°	Cantidad de aplicación (g ai./ha)	Trigo	Amaranthus	Matricaria	Viola	Xanthium
						
(2)	125	0	100	100	100	95

Tabla B4: Ensayo de post-brote/invernadero

Producto activo según el ejemplo de obtención n°	Cantidad de aplicación (g ai./ha)	Trigo	Setaria	Chenopodium	Ipomoea	Matricaria
	(5)	20	90	100	100	100

REIVINDICACIONES

1.- Compuestos de la fórmula general (I)



en la que

A significa CH

Q significa un enlace sencillo o significa NH,

R¹ significa hidrógeno, halógeno o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, ariloxi o heterocicliloxi substituidos respectivamente en caso dado,

R² significa hidrógeno, halógeno o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino, dialquilamino, ariloxi o heterocicliloxi substituidos respectivamente en caso dado,

R³ significa hidrógeno o alquilo substituido en caso dado,

R⁴ significa halógeno o significa alquilo substituido en caso dado y -en el caso en que Q signifique NH- significa también hidrógeno, y

R⁵ significa hidrógeno o significa alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo o heterociclilo substituidos respectivamente en caso dado,

así como sales de los compuestos de la fórmula (I).

2.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

R¹ significa hidrógeno, significa halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino o dialquilamino con respectivamente 1 a 4 átomos de carbono en

el grupo alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o significa fenoxi, oxetaniloxi, furiloxi o tetrahidrofuriloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos carbono,

R² significa halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino o dialquilamino con respectivamente 1 a 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, o significa fenoxi, oxetaniloxi, furiloxi o tetrahidrofuriloxi substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

R³ significa hidrógeno o significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido en caso dado por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquil-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R⁴ significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono y -en el caso en que Q signifique NH- significa también hidrógeno y

R⁵ significa hidrógeno, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por ciano, por halógeno, o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo o alquinilo con respectivamente 2 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo con respectivamente 3 a 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, con 1 a 4 átomos de carbono en la

parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa oxetanilo, furilo o tetrahidrofurilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

3.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

- R¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,
- R² significa flúor, cloro, bromo, o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, dimetilamino o dietilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,
- R³ significa hidrógeno o significa metilo o etilo substituidos respectivamente en caso dado por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por acetilo, por propionilo, por n- o i-butirolilo, por metoxycarbonilo, por etoxycarbonilo, por n- o i-propoxycarbonilo,
- R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, y
- R⁵ significa hidrógeno, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, por n- o i-propoxi, significa propenilo, butenilo, propinilo o butinilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro o

por bromo, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo.

4.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

R¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, metilamino, etilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa dimetilamino,

R² significa flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, metilamino o etilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa dimetilamino,

R³ significa hidrógeno o metilo,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro, y

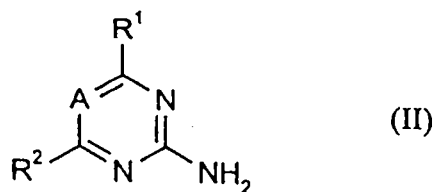
R⁵ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa propenilo o propinilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro.

5.- Sales de sodio, de potasio, de magnesio, de calcio, de amonio, de alquil-amonio con 1 a 4 átomos de carbono, de di-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono(-amonio), de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tetra-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-amonio, de tri-(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)-sulfonio, de cicloalquil-amonio con 5 o 6 átomos de carbono y de di-(alquilo con 1 a 2 átomos de carbono)-bencil-amonio, de los compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 4.

6.- Procedimiento para la obtención de los compuestos según una de las

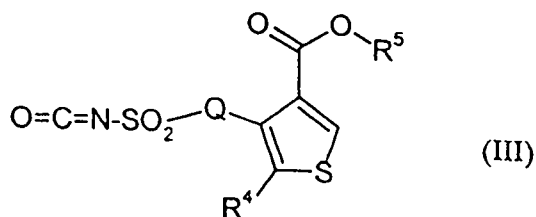
reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque

(a) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general (II)



en la que

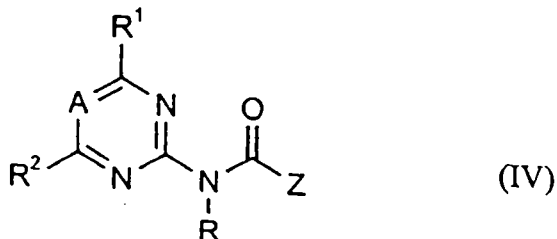
A, R¹ y R² tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4, con tienil(amino)sulfonilisocianatos de la fórmula general (III)



en la que

Q, R⁴ y R⁵ tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4, en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o porque

(b) se hacen reaccionar aminoazinas substituidas de la fórmula general (IV)



en la que

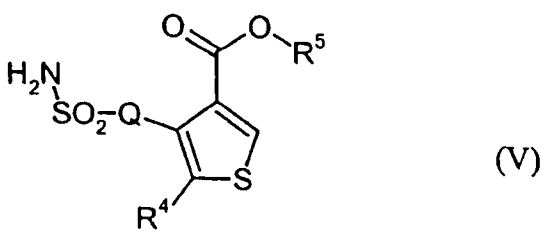
A, R¹ y R² tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4

Z significa halógeno, alcoxi o ariloxi y

R tiene el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4 para R³ o

significa el agrupamiento -C(O)-Z,

con derivados de tiofeno de la fórmula general (V)



en la que

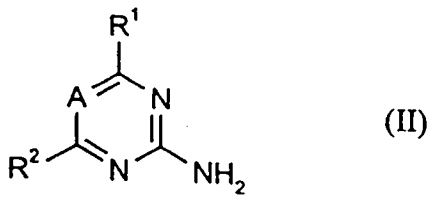
Q, R⁴ y R⁵ tienen el significado anteriormente indicado,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado,

en presencia de un diluyente,

o porque

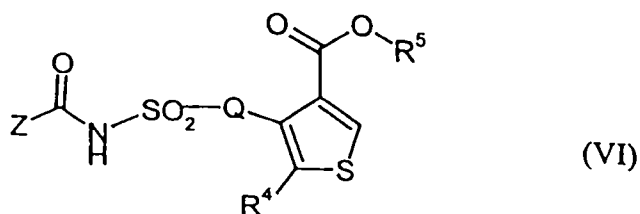
(c) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general (II)



en la que

A, R¹ y R² tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4

con derivados de tiofeno de la fórmula general (VI)



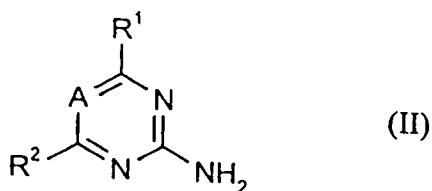
en la que

Q, R⁴ y R⁵ tienen el significado indicado en una de las reivindicaciones 1 a 4 y Z significa halógeno, alcoxi o ariloxi,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

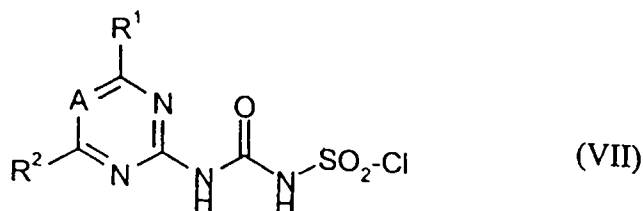
o porque

(d) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general (II),

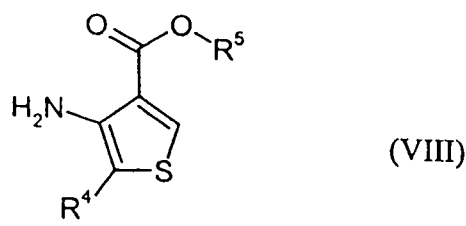


en la que

A, R¹ y R² tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4 con clorosulfonilisocianato, en caso dado en presencia de un diluyente y las clorosulfonilaminocarbonilamino-azinas formadas en este caso de la fórmula general (VII),



en la que
A, R¹ y R² tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4
- tras aislamiento provisional o "in situ" -
se hacen reaccionar con aminotiofenos sustituidos de la fórmula general (VIII)



en la que
R⁴ y R⁵ tienen el significado dado en una de las reivindicaciones 1 a 4
en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,
y en caso dado los compuestos de la fórmula (I), obtenidos según los procedimientos (a), (b), (c) o (d), se transforman en sales según métodos usuales.

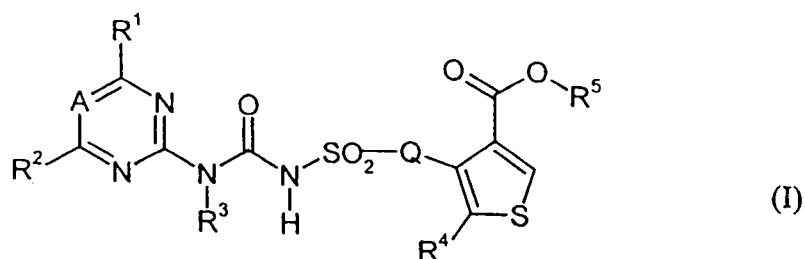
7.- Procedimiento para la lucha contra el crecimiento indeseable de las plantas, caracterizado porque se deja actuar sobre las plantas indeseables y/o sobre su medio ambiente al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 5.

8.- Compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 5, empleado para la lucha de plantas indeseables.

9.- Agentes herbicidas, caracterizados porque tienen un contenido de un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 5, y extendedores y/o agentes tensioactivos usuales.

RESUMEN

La invención se refiere a nuevas tienil(amino)sulfonilureas substituidas, de la fórmula general (I),



en la que A, Q, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ tienen el significado indicado en la descripción,

a procedimientos para su obtención y a su empleo como herbicidas.

172

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 00-058177- -00006-0000
Fec: 2006-08-30 18:21:26 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 2 PATENTES
Eve: 1 REGDEPOSITO
Ad 444 RESPUESTAREQUE Folios: 182

RECIBO OFICIAL DE CASA : 06 - 65,861
FECHA : AGOSTO 28 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	48872306	28/08/2006	20,856,500.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		02 INVOCACION DE UNA PRIORIDAD EN NU	130,000.00
		TOTAL :	\$ 130,000.00

SON: CIENTO TREINTA MIL PESOS

RESPONSABLE : 

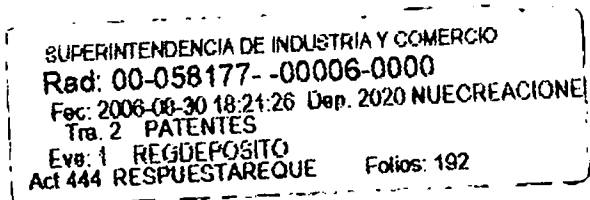
RECIBO DE CASH APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Colo 00698-801-121-6

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176009-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 65,935
FECHA : AGOSTO 28 DE 2006



***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	48872306	28/08/2006	28,856,500.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	463,000.00
		TOTAL :	\$ 463,000.00

SON: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Colo 00698-801-121-6

174

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020

Bogotá, D.C.

Doctor
Emilio Ferrero
Apoderado

Oficio N°

00010972

REFERENCIA: Radicación N° 00-58177A
Trámite 002
Evento 001
Actuación 430
Folios 008

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 112 a 162.
- Capítulo reivindicatorio: reivindicaciones 1 a 9 folios 163 a 170 correspondiente a la solicitud divisional, enviada con memorial de respuesta de 30 de agosto de 2006, folios 259 a 263 de la solicitud original, donde además se indica que la solicitud se divide de manera que en la solicitud original 00-58177 se reivindican los compuestos de tienil amino sulfonilureas substituidas de formula I donde (A) significa nitrógeno (N) y en la presente solicitud divisional expediente 00-58177A compuestos de fórmula I donde (A) significa (-CH), por lo tanto se acepta la division de la solicitud.

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 2 de agosto de 2000 en ese momento se reclamó prioridad para la solicitud DE 19937118 de agosto 6 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 INVENCION:

La invención se refiere a:

- Compuestos de fórmula I del tipo de las tienilsulfonilureas, donde A significa (-CH)
- Sales de los compuestos de tienilsulfonilureas de fórmula I
- Procedimiento para la obtención de los compuestos donde:
 - (a) se hacen reaccionar aminoazinas de fórmula general II con tienil(amino)sulfonilisocianatos de la fórmula general III, en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o porque
 - (b) se hacen reaccionar aminoazinas substituidas de fórmula general IV con derivados de tiofeno de la fórmula general V, en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o porque
 - (c) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general II con derivados de tiofeno de la fórmula general VI, en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o porque
 - (d) se hacen reaccionar aminoazinas de la fórmula general II con clorosulfonilisocianato, en caso dado en presencia de un diluyente y las clorosulfonilaminocarbonilamino-azinas en este caso de la fórmula general VII, tras aislamiento provisional o "in situ", se hacen reaccionar con aminotiofenos sustituidos de la fórmula general VIII, en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente, y en caso dado los compuestos de la fórmula (I), obtenidos según los procedimientos (a), (b), (c) o (d), se transforman en sales según métodos usuales.
- Procedimiento para la lucha contra el crecimiento indeseable de las plantas, caracterizado porque se deja actuar sobre las plantas indeseables y/o sobre su medio ambiente al menos un compuesto de fórmula (I)
- Compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 5 empleado para la lucha de plantas indeseables.
- Agentes herbicidas que tienen un contenido de un compuesto de fórmula (I) y extendedores y/o agentes tensioactivos usuales.

Clasificación Internacional de Patentes: A01N 47/28

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.

-La reivindicación N° 6 comprende procedimientos de obtención de compuestos de fórmula (I), donde solo se están indicando los reaccionantes, pero no se define realmente el procedimiento con su reacción de síntesis y las condiciones bajo las cuales se efectúa.

-La reivindicación N°8 se refiere a compuestos de acuerdo a las reivindicaciones 1 a 5, no obstante no se define ningún compuesto sino el uso de los mismos.

4- REIVINDICACIONES DE USO

La reivindicación N° 8, no obstante se encabece como “ compuestos de acuerdo a las reivindicaciones 1 a 5”, se refiere al empleo de los compuestos de fórmula I, contra plantas indeseables, lo cual de acuerdo con el Artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina que 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” no es patentable porque no corresponde a un producto ni a un procedimiento, realmente no se contempla la protección para usos.

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 dicha prioridad.

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 artículo 40.”

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 relacionados con el objeto de la invención.

N°	Documento	Título	Fecha
1	EP0030142	Herbicial ureas and isoureas, preparation, compositions and use thereof, intermediates and preparation of said intermediates.	10-06-81
2	US4481029	Triazinyl-sulfonyl-ureas and isoureas	6-11-84

3	EP0097122	N-heterocyclosulfonyl-N'-pyrimidinyl-und-triazinylhamstoffe	28-12-83
---	-----------	---	----------

(se anexa copia de las primeras páginas 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 Nivel Inventivo

El artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina dispone que "Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si 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, los compuestos reivindicados son compuestos muy próximos a los del arte previo como se desprende de los documentos citados, por ejemplo en el documento (1) se revelan compuestos con anillo tienil con un sustituyente A' que puede ubicarse en las posiciones libres de dicho anillo, este anillo se une mediante un grupo sulfonilurea a una diazina o de acuerdo a la reivindicación (1) de dicho documento, se revelan compuestos donde el anillo tienil presenta un sustituyente A' que puede ser: H, Cl, Br, alquil, -OCH3, o -CF3 . De la misma forma el documento (2) enseña compuestos similares de sulfonilureas con anillos diazina y un sustituyente en el tienil.(por ejemplo ver páginas 211,179,45)

También el documento (3) enseña compuestos de tieneilsulfonilurea de éste tipo con anillo diazina cuando "E" significa (-CH) e igualmente con sustituyente en el anillo tienil.

De la misma forma se divulgan procesos de obtención y método de aplicación contra el crecimiento de plantas indeseables que no presenta ninguna condición diferente a los métodos universalmente conocidos para este efecto.

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

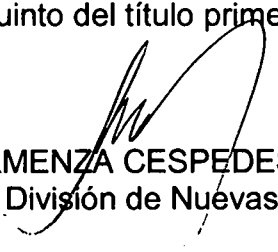
N°	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
1	EP0030142	1-9	Nivel inventivo
2	US4481029	1-9	Nivel inventivo
3	EP0097122	1-9	Nivel inventivo

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

178

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.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

28 SET. 2006

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha _____

CONCEPTO TÉCNICO Número 1488	EXAMINADOR TÉCNICO Código 202013
---------------------------------	-------------------------------------

06-09-18

12

EUROPEAN PATENT APPLICATION

21 Application number: 80304287.8

22 Date of filing: 28.11.80

51 Int. Cl.³: A 01 N 47/36

C 07 D 409/12, C 07 D 407/12
 C 07 D 307/08, C 07 D 491/04
 //C07D333/38, (C07D491/04,
 307/00, 239/00)

30 Priority: 30.11.79 US 98723
 22.10.80 US 196267

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

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

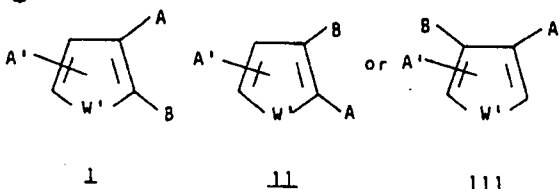
71 Applicant: E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY
 Legal Department 1007 Market Street
 Wilmington, Delaware 19898(US)

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 ureas and isoureas, preparation, compositions and use thereof, intermediates therefor and preparation of said intermediates.

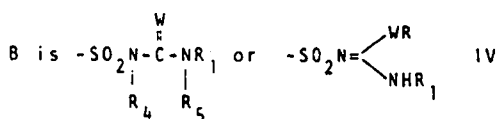
57 Ureas and isoureas of the formula



wherein W' is O or S

A' is H, Cl, Br, alkyl, OCH₃, NO₂, or CF₃;

A is a wide variety of ester or thioester groups or derivatives thereof;



where R₄ is H or CH₃;

R₅ is H, CH₃, or OCH₃;

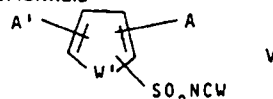
W is O or S

R^{IV} is alkyl or alkenyl; and

R₁ is a pyrimidyl or triazinyl moiety which is optionally substituted;

exhibit potent herbicidal activity and may be of interest for regulating plant growth.

The compounds can be formulated for use in conventional manner. They may be prepared by a variety of processes, e.g. by reacting a heterocyclic sulfonyl isocyanate or isothiocyanate of formula



with an appropriate amine HNR₂R₁.

Some of the compounds V form a further aspect of the invention. They can be made from the corresponding sulfonamide by reaction with CS₂ and phosgene.

Further intermediates of formula



where R^I is H or a cation of an alkali metal or tertiary amine are also within the scope of the invention.

180

United States Patent [19] Patent Number: 4,481,029
Levitt Best Available Copy [45] Date of Patent: Nov. 6, 1984

[54] TRIAZINYL-SULFONYL-UREAS AND ISOUREAS
[75] Inventor: George Levitt, Wilmington, Del.
[73] Assignee: E. I. Du Pont de Nemours and Company, Wilmington, Del.
[21] Appl. No.: 450,214
[22] Filed: Dec. 16, 1982

Related U.S. Application Data

[63] Continuation-in-part of Ser. No. 196,276, Oct. 22, 1980, abandoned, which is a continuation-in-part of Ser. No. 98,723, Nov. 30, 1979, abandoned.
[51] Int. Cl.³ C07D 405/12; C07D 405/14; A01N 43/70; A01N 43/68
[52] U.S. Cl. 71/93; 544/212; 544/207; 544/209; 544/113
[58] Field of Search 544/212, 113, 207, 209; 71/93

[56] References Cited
U.S. PATENT DOCUMENTS
4,214,890 7/1980 Levitt 544/212
4,339,266 7/1982 Levitt 544/212
4,441,910 4/1984 Shapiro 544/212
FOREIGN PATENT DOCUMENTS
64804 11/1982 European Pat. Off. 544/216
2078728 1/1982 United Kingdom 544/212

Primary Examiner—John M. Ford

[57] ABSTRACT
This invention relates to ureas and isoureas which are useful as herbicides and plant growth regulants. In particular, compounds of the instant invention have demonstrated great selectivity.

79 Claims, No Drawings

12

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

21 Anmeldenummer: 83810248.1

22 Anmeldetag: 08.06.83

51 Int. Cl.³: **C 07 D 401/12, C 07 D 409/12,**
C 07 D 403/12, C 07 D 407/12,
A 01 N 47/36

30 Priorität: 14.06.82 CH 3671/82

43 Veröffentlichungstag der Anmeldung: 28.12.83
Patentblatt 83/52

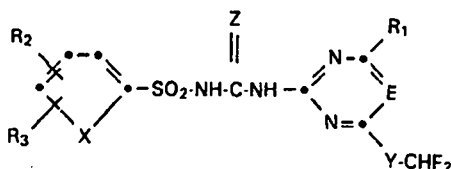
64 Benannte Vertragsstaaten: AT BE CH DE FR GB IT LI NL
SE

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

72 Erfinder: Böhner, Beat, Dr., Hügelweg 3,
CH-4102 Binningen (CH)
Erfinder: Föry, Werner, Dr., Benkenstrasse 65,
CH-4054 Basel (CH)
Erfinder: Gass, Karl, Blumenrain 4, CH-4312 Magden
(CH)
Erfinder: Meyer, Willy, Talweg 49, CH-4125 Riehen (CH)

54 N-Heterocyclosulfonyl-N'-pyrimidinyl- und -triazinylharnstoffe.

57 N-Heterocyclosulfonyl-N'-pyrimidinyl- und triazinylharn-
stoffe der allgemeinen Formel



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

In dieser Formel bedeuten

X Sauerstoff, Schwefel, -N- oder -C=N-,

Y Sauerstoff oder Schwefel,

Z Sauerstoff oder Schwefel,

E Stickstoff oder -CH=,

R1 Wasserstoff, C1-C4-Alkyl, C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogen-
alkyl, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Alkyl-

thio, Halogen, Amino oder Alkoxyalkyl mit höchstens 4
Kohlenstoffatomen,

R2 Wasserstoff, C1-C3-Alkyl, C1-C3-Alkyl, C1-C3-Halogen-
alkyl, Halogen, Nitro, C1-C3-Alkoxy, Aminosulfonyl, Al-
kylsulfonyl, deriviertes Acyl oder Carboxyl,

R3 Wasserstoff, Halogen, C1-C3-Alkyl, Methoxy, Nitro oder
Trifluormethyl,

R4 Wasserstoff, C1-C4-Alkyl, Cyanoalkyl mit höchstens 4
Kohlenstoffatomen, C3-C6-Cycloalkyl, Benzyl, -CO-
C1-C4-Alkoxy, Aminocarbonyl oder gegebenenfalls durch
1 bis 3 Halogenatome substituiertes -CO-C1-C4-Alkyl und

R5 Wasserstoff, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluor-
methyl, -SO_n-C1-C3-Alkyl, -CO-C1-C4-Alkoxy oder
C1-C3-Alkoxy, worin n für eine Zahl von Null bis zwei
steht.

EP 0 097 122 A2