G. HOLLMANN RESTREPO
ABOGADOS LTDA.

116 +20

10957

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

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00008334 00000001 Folios: 130
Fecha (AMD): 2000-03-13 16:02:22
Tramite : 032 PATENTES D 1 REGISTRO/ 329 COMPLEMEN
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Re: **Expediente No. 00008334**
Solicitud de Patente.
Solicitante: HOECHST SCHERING AGREVO GmbH

Yo, GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO, identificado como aparece al pie de mi firma, obrando como apoderado en este negocio, digo a usted que acompaño al presente memorial, para que sea agregada al expediente de la referencia, copia certificada de la solicitud de patente alemana No. 199 05 453.3 ✓de febrero 10 de 1999, con su correspondiente traducción al castellano.

Señor Superintendente,

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

mm.

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

10957

2

BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

Bescheinigung

Die Hoechst Schering AgrEvo GmbH in Berlin/Deutschland hat eine Patentanmeldung unter der Bezeichnung

"Phenylsulfonylharnstoffe, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren"

am 10. Februar 1999 beim Deutschen Patent- und Markenamt eingereicht.

Das angeheftete Stück ist eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlage dieser Patentanmeldung.

Die Anmeldung hat im Deutschen Patent- und Markenamt vorläufig die Symbole C 07 D und A 01 N der Internationalen Patentklassifikation erhalten.

München, den 28. Dezember 1999
Deutsches Patent- und Markenamt
Der Präsident
Im Auftrag

Aktenzeichen: 199 05 453.3

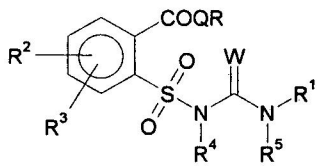
Zitzenzier

A 9161
06.90
11/98

Beschreibung

Phenylsulfonylharnstoffe, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren

Es ist bekannt, daß substituierte Phenylsulfonylharnstoffe herbizide Eigenschaften besitzen. Dabei handelt es sich um Benzoesäurederivate der allgemeinen Formel A (EP-A-7 687 und EP-A-30 138).

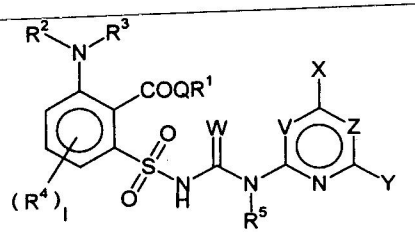


(A)

Weiter ist aus DE-4 322 067 bekannt, daß acylaminosubstituierte Phenylsulfonylharnstoffe herbizide Eigenschaften aufweisen.

Überraschenderweise wurden nun spezielle 1,2,3-substituierte Phenylsulfonylharnstoffe gefunden, welche sich besonders gut als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren eignen.

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



(I)

worin

R^1 ein Wasserstoffatom, ein Kohlenwasserstoffrest oder ein Heterocyclylrest bedeutet, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 30 C-Atome, vorzugsweise 1 bis 20 C-Atome aufweist,

R^2 eine Gruppe der Formel R^0-Q^0-, worin

R^0 ein Wasserstoffatom, ein Kohlenwasserstoffrest oder ein Heterocyclylrest bedeutet, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 30 C-Atome, vorzugsweise 1 bis 20 C-Atome aufweist, und

Q^0 eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel -O- oder $-N(R^\#)$- bedeutet, wobei $R^\#$ ein Wasserstoffatom, ein Acylrest oder ein Kohlenwasserstoffrest bedeutet und wobei der letztgenannte Rest unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 30 C-Atome, vorzugsweise 1 bis 20 C-Atome aufweist,

R^3 ein Wasserstoffatom, ein Kohlenwasserstoffrest oder ein Heterocyclylrest bedeutet, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 30 C-Atome, vorzugsweise 1 bis 20 C-Atome aufweist, oder

R^4 unabhängig voneinander Halogen, OH, SH, ein kohlenstoffreier stickstoffhaltiger Rest oder ein kohlenstoffhaltiger Rest, der 1 bis 30 C-Atome, vorzugsweise 1 bis 20 C-Atome aufweist, bedeuten,

l 0, 1, 2 oder 3, vorzugsweise 0 oder 1 ist,

R^5 ein Wasserstoffatom oder ein Kohlenwasserstoffrest bedeutet, der unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 20

C-Atome, vorzugsweise 1 bis 10 C-Atome aufweist, z.B. unsubstituiertes oder substituiertes (C_1-C_4)Alkyl, vorzugsweise H oder CH_3,

Q O, S oder NR* ist,

R* ein Wasserstoffatom oder ein Kohlenwasserstoffrest bedeutet, der unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 20 C-Atome, vorzugsweise 1 bis 10 C-Atome aufweist, z.B. (C_1-C_4)Alkyl, (C_3-C_4)Alkenyl oder (C_3-C_4)Alkinyl, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkoxy und (C_1-C_4)Alkylthio substituiert ist,

W ein Sauerstoff- oder Schwefelatom,

X,Y unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkoxy und (C_1-C_4)Alkylthio substituiert ist, oder Mono- oder Di[(C_1-C_4)alkyl]amino, (C_2-C_6)Alkenyl, (C_2-C_6)Alkinyl, (C_3-C_6)Alkenyloxy oder (C_3-C_6)Alkinyloxy bedeuten, und

V, Z unabhängig voneinander CH oder N bedeuten.

Die Verbindungen der Formel (I) können Salze bilden, bei denen der Wasserstoff der -SO_2-NH-Gruppe durch ein für die Landwirtschaft geeignetes Kation ersetzt ist. Diese Salze sind beispielsweise Metallsalze, insbesondere Alkalimetallsalze oder Erdalkalimetallsalze, insbesondere Natrium- und Kaliumsalze, oder auch Ammoniumsalze oder Salze mit organischen Aminen. Ebenso kann Salzbildung durch Anlagerung einer Säure an basischen Gruppen, wie z.B. Amino und Alkylamino, erfolgen. Geeignete Säuren hierfür sind starke anorganische und organische Säuren, beispielsweise HCl, HBr, H_2SO_4 oder HNO_3.

In Formel (I) können jeweils die beiden Reste R^0 und $R^\#$, R^2 und R^3 und R* und R^1 miteinander einen stickstoffhaltigen heterocyclischen Ring bilden.

Kohlens ..haltige Reste sind organische Reste, die mindestens ein Kohlenstoffatom, vorzugsweise 1 bis 30 C-Atome, besonders bevorzugt 1 bis 20 C-Atome und außerdem mindestens ein Atom eines oder mehrerer anderer Elemente des Periodensystems der Elemente wie H, Si, N, P, O, S, F, Cl, Br oder J enthalten. Beispiele für kohlenstoffhaltige Reste sind unsubstituierte oder substituierte Kohlenwasserstoffreste, die direkt oder über ein Heteroatom wie N, S, P oder O an den Grundkörper gebunden sein können, unsubstituierte oder substituierte Heterocyclylreste, kohlenstoffhaltige Acylreste oder Cyano.

In Formel (I) und allen nachfolgenden Formeln können die kohlenstoffhaltigen Reste wie Alkyl, Alkoxy, Haloalkyl, Haloalkoxy, Alkylamino und Alkylthio sowie die entsprechenden ungesättigten und/oder substituierten Reste im Kohlenstoffgerüst jeweils geradkettig oder verzweigt sein. Wenn nicht speziell angegeben, sind bei diesen Resten die niederen Kohlenstoffgerüste, z.B. mit 1 bis 6 C-Atomen bzw. bei ungesättigten Gruppen mit 2 bis 6 C-Atomen, bevorzugt. Alkylreste, auch in den zusammengesetzten Bedeutungen wie Alkoxy, Haloalkyl usw., bedeuten z.B. Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, t- oder 2-Butyl, Pentyle, Hexyle, wie n-Hexyl, i-Hexyl und 1,3-Dimethylbutyl, Heptyle, wie n-Heptyl, 1-Methylhexyl und 1,4-Dimethylpentyl; Alkenyl- und Alkinylreste haben die Bedeutung der den Alkylresten entsprechenden möglichen ungesättigten Reste; Alkenyl bedeutet z.B. Allyl, 1-Methylprop-2-en-1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, But-2-en-1-yl, But-3-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl und 1-Methyl-but-2-en-1-yl; Alkinyl bedeutet z.B. Propargyl, But-2-in-1-yl, But-3-in-1-yl, 1-Methyl-but-3-in-1-yl.

Alkenyl in der Form "(C_3-C_4)Alkenyl", (C_3-C_5)Alkenyl, (C_3-C_6)Alkenyl", "(C_3-C_8)Alkenyl" oder (C_3-C_{12})-Alkenyl bedeutet vorzugsweise einen Alkenylrest mit 3 bis 4, 3 bis 5, 3 bis 6, 3 bis 8 bzw.3 bis 12 C-Atomen, bei dem die Doppelbindung nicht an dem C-Atom liegt, das mit dem übrigen Molekülteil der Verbindung (I) verbunden ist ("yl"-Position). Entsprechendes gilt für (C_3-C_4)Alkinyl etc., (C_3-C_4)Alkenyloxy etc. und (C_3-C_4)Alkinyloxy etc.

Cycloalkyl bedeutet ein carbocyclisches, gesättigtes Ringsystem mit 3-8 C-Atomen, z.B. Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

Kohlenstoffreie stickstoffhaltige Reste sind Reste die vorzugsweise 1 bis 10 N-Atome, besonders bevorzugt 1 oder 2 N-Atome enthalten und außerdem vorzugsweise eines oder mehrere Atome eines oder mehrerer von Kohlenstoff verschiedener Elemente des Periodensystems der Elemente wie H, O oder S enthalten. Beispiele für kohlenstoffreie stickstoffhaltige Reste sind NH_2, NO_2, NHOH, NO, NH-NH_2 oder N_3.

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

Ein Kohlenwasserstoffrest ist ein geradkettiger, verzweigter oder cyclischer und gesättigter oder ungesättigter aliphatischer oder aromatischer Kohlenwasserstoffrest, z.B. Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Aryl; Aryl bedeutet dabei ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System, beispielsweise Phenyl, Naphthyl, Tetrahydronaphthyl, Indenyl, Indanyl, Pentalenyl, Fluorenyl und ähnliches, vorzugsweise Phenyl;
vorzugsweise bedeutet ein Kohlenwasserstoffrest Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl mit bis zu 12 C-Atomen oder Cycloalkyl mit 3, 4, 5, 6 oder 7 Ringatomen oder Phenyl.

Ein heterocyclischer Rest oder Ring (Heterocyclyl) kann gesättigt, ungesättigt oder heteroaromatisch und unsubstituiert oder substituiert sein; er enthält vorzugsweise ein oder mehrere Heteroatome im Ring, vorzugsweise aus der Gruppe N, O und S; vorzugsweise ist er ein aliphatischer Heterocyclylrest mit 3 bis 7 Ringatomen oder

ein heteroaromatischer Rest mit 5 oder 6 Ringatomen und enthält 1, 2 oder 3 Heteroatome. Der heterocyclische Rest kann z.B. ein heteroaromatischer Rest oder Ring (Heteroaryl) sein, wie z.B. ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System, in dem mindestens 1 Ring ein oder mehrere Heteroatome enthält, beispielsweise Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Triazinyl, Thienyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Furyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl und Imidazolyl, oder ist ein partiell oder vollständig hydrierter Rest wie Oxiranyl, Oxetanyl, Pyrrolidyl, Piperidyl, Piperazinyl, Dioxolanyl, Morpholinyl, Tetrahydrofuryl. Als Substituenten für einen substituierten heterocyclischen Rest kommen die weiter unten genannten Substituenten in Frage, zusätzlich auch Oxo. Die Oxogruppe kann auch an den Heteroringatomen, die in verschiedenen Oxidationsstufen existieren können, z.B. bei N und S, auftreten.

Substituierte Reste, wie substituierte Kohlenwasserstoffreste, z.B. substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Aryl, Phenyl und Benzyl, oder substituiertes Heterocyclyl oder Heteroaryl, bedeuten beispielsweise einen vom unsubstituierten Grundkörper abgeleiteten substituierten Rest, wobei die Substituenten beispielsweise einen oder mehrere, vorzugsweise 1, 2 oder 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Alkoxy, Haloalkoxy, Alkylthio, Hydroxy, Amino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Dialkylaminocarbonyl, substituiertes Amino, wie Acylamino, Mono- und Dialkylamino, und Alkylsulfinyl, Haloalkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch Alkyl und Haloalkyl sowie den genannten gesättigten kohlenwasserstoffhaltigen Resten entsprechende ungesättigte aliphatische Reste, wie Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy etc. bedeuten. Bei Resten mit C-Atomen sind solche mit 1 bis 4 C-Atomen, insbesondere 1 oder 2 C-Atomen, bevorzugt. Bevorzugt sind in der Regel Substituenten aus der Gruppe Halogen, z.B. Fluor und Chlor, (C_1-C_4)Alkyl, vorzugsweise Methyl oder Ethyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, vorzugsweise Trifluormethyl, (C_1-C_4)Alkoxy, vorzugsweise Methoxy oder Ethoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, Nitro und Cyano. Besonders bevorzugt sind dabei die Substituenten Methyl, Methoxy und Chlor.

Gegebenenfalls substituiertes Phenyl ist vorzugsweise Phenyl, das unsubstituiert oder ein- oder mehrfach, vorzugsweise bis zu dreifach durch gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Halogenalkyl, (C_1-C_4)Halogenalkoxy und Nitro substituiert ist, z.B. o-, m- und p-Tolyl, Dimethylphenyle, 2-, 3- und 4-Chlorphenyl, 2-, 3- und 4-Trifluor- und -Trichlorphenyl, 2,4-, 3,5-, 2,5- und 2,3-Dichlorphenyl, o-, m- und p-Methoxyphenyl.

Mono- oder disubstituiertes Amino bedeutet einen chemisch stabilen Rest aus der Gruppe der substituierten Aminoreste, welche beispielsweise durch einen bzw. zwei gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Alkyl, Alkoxy, Acyl und Aryl N-substituiert sind; vorzugsweise Monoalkylamino, Dialkylamino, Acylamino, Arylamino, N-Alkyl-N-arylamino sowie N-Heterocyclen; dabei sind Alkylreste mit 1 bis 4 C-Atomen bevorzugt; Aryl ist dabei vorzugsweise Phenyl oder substituiertes Phenyl; für Acyl gilt dabei die weiter unten genannte Definition, vorzugsweise Formyl, (C_1-C_4)Alkylcarbonyl oder (C_1-C_4)Alkylsulfonyl. Entsprechenes gilt für substituiertes Hydroxylamino oder Hydrazino.

Ein Acylrest bedeutet den Rest einer organischen Säure, der formal durch Abspaltung einer OH-Gruppe aus der organischen Säure entsteht, z.B. der Rest einer Carbonsäure und Reste davon abgeleiteter Säuren wie der Thiocarbonsäure, gegebenenfalls N-substituierten Iminocarbonsäuren oder die Reste von Kohlensäuremonoestern, gegebenenfalls N-substituierter Carbaminsäuren, Sulfonsäuren, Sulfinsäuren, Phosphonsäuren, Phosphinsäuren.

Ein Acylrest ist bevorzugt Formyl oder aliphatisches Acyl aus der Gruppe CO-R^x, CS-R^x, CO-OR^x, CS-OR^x, CS-SR^x, SOR^Y oder SO_2R^Y, wobei R^x und R^Y jeweils einen C_1-C_{10}-Kohlenwasserstoffrest bedeutet, der unsubstituiert oder substituiert ist, oder Aminocarbonyl oder Aminosulfonyl, wobei die beiden letztgenannten Reste unsubstituiert, N-monosubstituiert oder N,N-disubstituiert sind.

Acyl bedeutet beispielsweise Formyl, Halogenalkylcarbonyl, Alkylcarbonyl wie (C_1-C_4)Alkylcarbonyl, Phenylcarbonyl, wobei der Phenylring substituiert sein kann,

121

z.B. wie oben für Phenyl angegeben, oder Alkyloxycarbonyl, Phenyloxycarbonyl, Benzyloxycarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfinyl, N-Alkyl-1-iminoalkyl und andere Reste von organischen Säuren.

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

Die vorstehenden Beispiele für Reste oder Restebereiche, die unter die allgemeinen Begriffe wie "Alkyl", "Acyl", "substituierten Reste" etc., fallen, bedeuten keine vollständige Aufzählung. Die allgemeinen Begriffe umfassen auch die weiter unten angeführten Definitionen für Restebereiche in Gruppen bevorzugter Verbindungen, insbesondere Restebereiche, welche spezifische Reste aus den Tabellenbeispielen umfassen.

Vor allem aus Gründen der höheren herbiziden Wirkung, besseren Selektivität und/oder besseren Herstellbarkeit sind erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze von besonderem Interesse, worin

R^1 H, (C_1-C_6)Alkyl, (C_3-C_6)Alkenyl, (C_3-C_6)Alkinyl, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, unsubstituiertes und substituiertes Phenyl, unsubstituiertes und substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen, unsubstituiertes und substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl und [(C_1-C_4)Haloalkoxy]carbonyl, substituiert ist, oder unsubstituiertes oder substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkyl, substituiertes oder unsubstituiertes (C_3-C_6)Cycloalkenyl,unsubstituiertes oder

125

substituiertes Phenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen,

wobei substituiertes Phenyl, substituiertes Heterocyclyl, substituiertes Cycloalkyl oder substituiertes Cycloalkenyl als Substituenten einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl, Di[(C_1-C_4)alkoxy](C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, (C_1-C_4)Haloalkylsulfonyl, NR^8R^9, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Haloalkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, OH, Phenyl, CN und NO_2 trägt und

R^2 eine Gruppe der Formel R^0-Q^0-,

worin R^0 ein Wasserstoffatom, (C_1-C_{12})Alkyl, (C_2-C_{12})Alkenyl oder (C_2-C_{12})Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten drei Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkoxy, (C_1-C_6)Haloalkoxy, (C_1-C_6)Alkylthio, (C_1-C_6)Haloalkylthio, (C_1-C_6)Alkylsulfinyl, (C_1-C_6)Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_6)Alkylsulfonyl, (C_1-C_6)Haloalkylsulfonyl, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_6)Haloalkoxy]carbonyl, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, SH, (C_3-C_6)Cycloalkyl, NR^8R^9, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl substituiert ist, oder

(C_3-C_6)Cycloalkyl, (C_3-C_6)Cycloalkenyl, Phenyl oder Heterocyclyl, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen, wobei die vier zuletzt genannten Reste unsubstituiert oder substituiert sein können, bedeutet und

worin Q^0 eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel -O- oder -N($R^\#$)- bedeutet, wobei $R^\#$ ein Wasserstoffatom, ein Acylrest oder (C_1-C_{12})Alkyl, (C_2-C_{12})Alkenyl oder (C_2-C_{12})Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkoxy, (C_1-C_6)Haloalkoxy, (C_1-C_6)-Alkylthio, (C_1-C_6)-Haloalkylthio, CN, OH, (C_3-C_6)Cycloalkyl, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl, substituiert ist, oder unsubstituiertes oder

122

substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkyl, unsubstituiertes oder substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkenyl, oder

unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl bedeutet, und R^0 und $R^\#$ gemeinsam mit dem N-Atom der $NR^\#R^0$-Gruppe einen Heterocyclylrest, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen bilden können, der unsubstituiert oder substituiert ist, vorzugsweise durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkyl, (C_1-C_6)Alkoxy, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, (C_1-C_6)Haloalkyl und Oxo,

R^3 ein Wasserstoffatom, (C_1-C_{12})Alkyl, (C_2-C_{12})Alkenyl oder (C_2-C_{12})Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkoxy, (C_1-C_6)Haloalkoxy, (C_1-C_6)-Alkylthio, (C_1-C_6)-Haloalkylthio, (C_1-C_6)Alkylsulfinyl, (C_1-C_6)Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_6)Alkylsulfonyl, (C_1-C_6)Haloalkylsulfonyl, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_6)Haloalkoxy]carbonyl, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, (C_3-C_6)Cycloalkyl, NR^8R^9, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl substituiert ist, oder unsubstituiertes oder substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkyl, unsubstituiertes oder substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen, oder unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl bedeutet, und

R^2 und R^3 gemeinsam mit dem N-Atom der NR^2R^3-Gruppe (N^1) einen Heterocyclylrest, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen bilden können, der unsubstituiert oder substituiert ist, vorzugsweise durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkyl, (C_1-C_6)Alkoxy, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, (C_1-C_6)Haloalkyl und Oxo, wobei sich der Oxo-Rest vorzugsweise nicht in Nachbarposition zum N-Atom (N^1) befindet, und

R^4 unabhängig voneinander Halogen, CN, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_2-C_6)Alkenyl, (C_2-C_6)Alkinyl, (C_3-C_6)Alkenyloxy, (C_3-C_6)Alkinyloxy, wobei jeder der letztgenannten 6 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkoxy,

126

(C_1-C_6)Haloalkoxy, (C_1-C_6)-Alkylthio, (C_1-C_6)-Haloalkylthio, (C_1-C_6)Alkylsulfinyl, (C_1-C_6)Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_6)Alkylsulfonyl, (C_1-C_6)Haloalkylsulfonyl, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_6)Haloalkoxy]carbonyl, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, (C_3-C_6)Cycloalkyl, NR^8R^9, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl oder unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl, substituiert ist, oder

unsubstituiertes oder substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkyl, unsubstituiertes oder substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl oder [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl bedeuten, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder im Alkylteil durch ein oder mehrere Halogenatome substituiert ist, oder ein Rest der Formel C(O)-NR'-R'', C(S)-NR'-R'', CR'=N-Q^1-R'', $S(O)_m$-Q^1-R'''', $P(O)_n(-Q^1\text{-}R''''Q^2\text{-}R'')$, NR'-$Q^1$-R'' oder NR'''-N=CR'-R'' bedeuten, wobei R', R'' und R''' unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, einen Acylrest oder einen unsubstituierten oder substituierten (C_1-C_{10})Kohlenstoffwasserstoffrest, R'''' einen kohlenstoffhaltigen Acylrest oder einen unsubstituierten oder substituierten (C_1-C_{10})Kohlenstoffwasserstoffrest, und Q^1 und Q^2 unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel -O- oder -N(R^*)- bedeuten, wobei R^* ein Wasserstoffatom, ein Acylrest oder ein unsubstituierter oder substituierter (C_1-C_{10})Kohlenwasserstoffrest bedeutet, und m = 0, 1, 2 oder 3, sowie n = 0, 1 oder 2 sein kann, und R' mit R'', R^* mit R', R^* mit R'' oder R^* mit R'''' jeweils einen Heterocyclylrest, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen bilden kann,
der unsubstituiert oder substituiert ist, vorzugsweise durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkyl, (C_1-C_6)Alkoxy, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, (C_1-C_6)Haloalkyl und Oxo,

l gleich 0, 1 oder 2, vorzugsweise 0 oder 1 ist,

R^5 H oder C_1-C_4(Alkyl) ist, das unsubstituiert oder substituiert ist,

R^6 und R^7 unabhängig voneinander H, (C_1-C_6)Alkyl, (C_3-C_6)Alkenyl, (C_3-C_6)Alkinyl, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl oder unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl bedeuten oder R^6 und R^7 gemeinsam mit dem N-Atom der NR^6R^7-Gruppe einen Heterocyclylrest mit 5 oder 6 Ringatomen bilden können, der gegebenenfalls eines oder mehrere zusätzliche Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach durch Reste aus der Gruppe (C_1-C_4)Alkyl und Oxo substituiert ist, und

R^8 und R^9 unabhängig voneinander (C_1-C_4)Alkylcarbonyl, (C_1-C_4)Haloalkylcarbonyl, (C_1-C_4)Alkoxycarbonyl oder (C_1-C_4)Alkylsulfonyl bedeuten oder gemeinsam mit dem N-Atom der NR^8R^9-Gruppe einen Heterocyclylrest mit 5 oder 6 Ringatomen bilden können, der gegebenenfalls eines oder mehrere zusätzliche Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach durch Reste aus der Gruppe (C_1-C_4)Alkyl und Oxo substituiert ist, und

Q O, S oder NR* ist,

R* (C_1-C_4)Alkyl, (C_3-C_4)Alkenyl oder (C_3-C_4)Alkinyl bedeutet, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkoxy und (C_1-C_4)Alkylthio substituiert ist, und R* und R^1 gemeinsam mit dem N-Atom der NR^*R^1-Gruppe einen Heterocyclylrest bilden können, der unsubstituiert oder substituiert ist, vorzugsweise durch oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkyl, (C_1-C_6)Alkoxy, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, (C_1-C_6)Haloalkyl und Oxo,

X, Y unabhängig voneinander H, Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkoxy und (C_1-C_4)Alkylthio substituiert ist, Mono- oder Di[(C_1-C_4)alkyl]amino, (C_3-C_5)Alkenyl, (C_3-C_5)Alkenyloxy, (C_3-C_5)Alkinyl oder (C_3-C_5)Alkinyloxy bedeuten, und

123

wobei die Reste R^1, R^2, R^3 und R^4 inklusive Substituenten bis zu 20 C-Atome aufweisen.

Von besonderem Interesse sind erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I), worin

R^1 H, (C_1-C_6)Alkyl, (C_3-C_6)Alkenyl oder (C_3-C_6)Alkinyl, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Phenyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio (C_3-C_6)Cycloalkyl, Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen, und [(C_1-C_4)Alkoxy]-carbonyl substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkyl oder Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen bedeutet, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl und (C_1-C_4)Alkoxy substituiert ist,

R^2 eine Gruppe der Formel R^0-Q^0-, worin

R^0 ein Wasserstoffatom, (C_1-C_8)Alkyl, (C_3-C_8)Alkenyl oder (C_3-C_8)Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Haloalkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, (C_1-C_4)Haloalkylsulfonyl, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, (C_3-C_6)Cycloalkyl, NR^8R^9 und Phenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsufonyl, NR^8R^9, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, Phenyl, [(C_1-C_4)Alkyl]-carbonyl, CN und NO_2 substituiert ist, substituiert ist, oder Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, NR^8R^9, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, Phenyl, CN und NO_2 substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus

124

der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)-Haloalkoxy, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, CN, OH und Phenyl substituiert ist, oder

(C_3-C_6)Cycloalkenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy und [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl substituiert ist, oder

Phenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, NR^8R^9, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, Phenyl, CN und NO_2 substituiert ist, und

Q^0 eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel -O- oder -$NR^\#$, worin $R^\#$ ein Wasserstoffatom oder unsubstituiertes oder substituiertes (C_1-C_4)Alkyl ist, bedeutet,

R^3 ein Wasserstoffatom, (C_1-C_8)Alkyl, (C_3-C_8)Alkenyl oder (C_3-C_8)Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Haloalkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, (C_1-C_4)Haloalkylsulfonyl, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, (C_3-C_6)Cycloalkyl, NR^8R^9 und Phenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, NR^8R^9, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, Phenyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, CN und NO_2 substituiert ist, substituiert ist, oder Heterocyclyl, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsufonyl, NR^8R^9, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, Phenyl, CN und NO_2 substituiert ist, substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus

der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, CN, OH und Phenyl substituiert ist, oder

(C_3-C_6)Cycloalkenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy und [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl substituiert ist, oder

Phenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsufonyl, NR^8R^9, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, Phenyl, CN und NO_2 substituiert ist, und

R^2 und R^3 gemeinsam mit dem N-Atom (N^1) einen Heterocyclus von 3-6 Ringatomen bilden können, der gesättigt, ungesättigt oder aromatisch ist und zusätzlich zum N-Atom (N^1) ein oder zwei Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C_1-C_3)Alkyl, (C_1-C_3)Alkoxy, Halogen, [(C_1-C_3)Alkoxy]carbonyl, (C_1-C_3)Haloalkyl und Oxo, wobei sich der Oxo-Rest vorzugsweise nicht in Nachbarposition zum N-Atom (N^1) befindet, substituiert ist,

R^4 Halogen, CN, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_2-C_6)Alkenyl, (C_2-C_6)-Alkinyl, (C_3-C_6)Alkenyloxy, (C_3-C_6)Alkinyloxy,

wobei jeder der letztgenannten 6 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkoxy, (C_1-C_6)Haloalkoxy, (C_1-C_6)Alkylthio, (C_1-C_6)Haloalkylthio, (C_1-C_6)Alkylsulfinyl, (C_1-C_6)Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_6)Alkylsulfonyl, (C_1-C_6)Haloalkylsulfonyl, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_6)Haloalkoxy]carbonyl, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, (C_3-C_6)Cycloalkyl, NR^8R^9, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl substituiert ist, oder

unsubstituiertes oder substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkyl, unsubstituiertes oder substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen, unsubstituiertes oder substituiertes

Phenyl oder [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl oder [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl bedeuten, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder im Alkylteil durch ein oder mehrere Halogenatome substituiert ist, oder ein Rest der Formel C(O)-NR'-R'', C(S)-NR'-R'', CR'=N-Q^1-R'', NR'-Q^1-R'' oder NR'''-N=CR'-R'' bedeuten, wobei R', R'' und R''' unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, einen Acylrest oder einen unsubstituierten oder substituierten (C_1-C_{10})Kohlenstoffwasserstoffrest und Q^1 und Q^2 unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel -O- oder -N(R^+)- bedeuten, wobei R^+ ein Wasserstoffatom, ein Acylrest oder ein unsubstituierter oder substituierter (C_1-C_4)Alkylrest bedeutet, und R' mit R'' oder R^+ mit R' oder R^+ mit R'' jeweils einen Heterocyclylrest mit 3 bis 6 Ringatomen bilden kann, der unsubstituiert oder substituiert ist, vorzugsweise durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkyl, (C_1-C_6)Alkoxy, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, (C_1-C_6)Haloalkyl und Oxo,

l gleich 0 oder 1 ist,

R^6 und R^7 unabhängig voneinander H, (C_1-C_4)Alkyl, (C_3-C_4)Alkenyl, (C_3-C_4)Alkinyl oder Phenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, CN und NO_2 substituiert ist, oder

R^6 und R^7 gemeinsam mit dem N-Atom der NR^6R^7-Gruppe einen Heterocyclylrest mit 5 oder 6 Ringgliedern bilden können, der gegebenenfalls eines oder mehrere Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach durch Reste aus der Gruppe (C_1-C_4)Alkyl und Oxo substituiert ist,

R^8 und R^9 (C_1-C_4)Alkylcarbonyl, (C_1-C_4)Haloalkylcarbonyl, (C_1-C_4)Alkoxycarbonyl oder (C_1-C_4)Alkylsulfonyl sind, oder gemeinsam mit dem N-Atom der NR^8R^9-Gruppe einen Heterocyclylrest mit 5 oder 6 Ringatomen bilden können, der gegebenenfalls eines oder mehrere Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach durch Reste aus der

Gruppe (C_1-C_4)Alkyl und Oxo substituiert ist.

Von besonderem Interesse sind auch erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, worin

R^1 (C_1-C_6)Alkyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen und (C_1-C_4)Alkoxy substituiert ist, oder 3-Oxetanyl, (C_3-C_4)Alkenyl oder (C_3-C_4)Alkinyl,

R^2 H, (C_1-C_6)Alkyl, (C_3-C_6)Alkenyl, (C_3-C_6)Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten drei Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, (C_3-C_6)Cycloalkyl, CN und OH substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, CN und OH substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkenyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkenyloxy, (C_1-C_4)Alkylamino oder Di[(C_1-C_4)alkyl]amino und

R^3 H, (C_1-C_6)Alkyl, (C_3-C_6)Alkenyl, (C_3-C_6)Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten drei Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, (C_3-C_6)Cycloalkyl, CN und OH substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, CN und OH substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkenyl oder

R^2 und R^3 gemeinsam mit dem N-Atom (N^1) einen Heterocyclus von 3-6 Ringatomen bilden können, der gesättigt, ungesättigt oder heteroaromatisch ist, zusätzlich zu dem N-Atom (N^1) ein oder zwei Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_3)Alkyl, (C_1-C_3)Alkoxy, [(C_1-C_3)Alkoxy]carbonyl und Oxo, wobei sich der Oxo-Rest vorzugsweise nicht in Nachbarposition zum N-Atom (N^1) befindet, substituiert ist, und

R^4 (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy oder Halogen,

l gleich 0 oder 1 ist, vorzugsweise 0 ist,

R^5 H oder Methyl,

Q O oder NR*,

R* H oder (C_1-C_4)Alkyl,

X und Y unabhängig voneinander (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, wobei jeder der letztgenannten zwei Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Halogenatome substituiert ist, oder (C_1-C_4)Alkylthio, Halogen oder Mono- oder Di[(C_1-C_2)alkyl]amino bedeuten, und

W ein Sauerstoffatom bedeutet.

Bevorzugte erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze sind solche, worin

R^1 (C_1-C_3)Alkyl, Allyl oder Propargyl,

R^2 H, (C_1-C_4)Alkyl, (C_3-C_5)Alkenyl, (C_3-C_5)Alkinyl, (C_3-C_6)Cycloalkyl oder (C_3-C_6)Cycloalkenyl,

R^3 H, (C_1-C_4)Alkyl, (C_3-C_5)Alkenyl, (C_3-C_5)Alkinyl, (C_3-C_6)Cycloalkyl oder (C_3-C_6)Cycloalkenyl,

R^4 (C_1-C_3)Alkyl oder Halogen,

l gleich 0 oder 1, vorzugsweise 0 ist,

Q O oder NR*,

R* (C_1-C_3)Alkyl,

X (C_1-C_2)Alkyl, (C_1-C_2)Alkoxy, (C_1-C_2)Alkylthio, (C_1-C_2)Haloalkyl oder (C_1-C_2)Haloalkoxy,

Y (C_1-C_2)Alkyl, (C_1-C_2)Alkoxy, Halogen, $NHCH_3$ oder $N(CH_3)_2$,

V CH oder N, vorzugsweise N und

Z CH oder N bedeuten.

Besonders bevorzugte erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze sind solche, worin

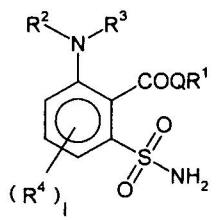
R^1 (C_1-C_3)Alkyl, Allyl oder Propargyl und/oder

Q ein Sauerstoffatom bedeutet.

Besonders bevorzugt sind auch erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, welche eine Kombination von Resten aus den obengenannten Verbindungen von besonderem Interesse bzw. den bevorzugten Verbindungen enthalten, sowie solche, welche einzelne oder mehrere Reste aus den in den Tabellen 1 und 2 (s. u.) aufgeführten Verbindungen enthalten. Ebenfalls bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I) in denen V=N ist.

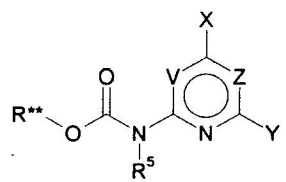
Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Verfahren zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze, wobei man

a) eine Verbindung der Formel (II)



(II)

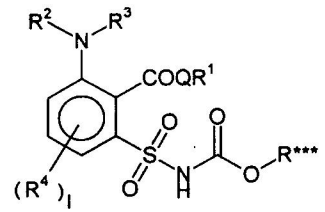
mit einem heterocyclischen Carbamat der Formel (III),



(III)

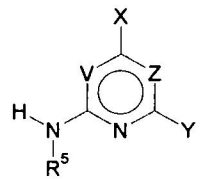
worin R** ein substituierter oder unsubstituierter C_1-C_{20}-Kohlenwasserstoffrest wie Aryl oder Alkyl, vorzugsweise gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder gegebenenfalls substituiertes (C_1-C_4)Alkyl bedeutet, umsetzt oder

b) ein Sulfonylcarbamat der Formel (IV),



(IV)

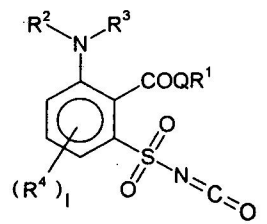
worin R*** ein substituierter oder unsubstituierter C_1-C_{20}-Kohlenwasserstoffrest wie gebenenfalls substituiertes Phenyl oder gegebenenfalls substituiertes (C_1-C_4)Alkyl bedeutet, mit einem Aminoheterocyclus der Formel (V)



(V)

umsetzt oder

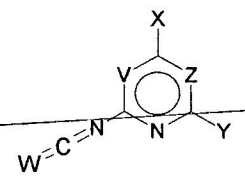
c) ein Sulfonylisocyanat der Formel (VI)



(VI)

mit einem Aminoheterocyclus der Formel (V) umsetzt oder

d) ein Sulfonamid der Formel (II) mit einem (Thio)-Isocyanat der Formel (VII)

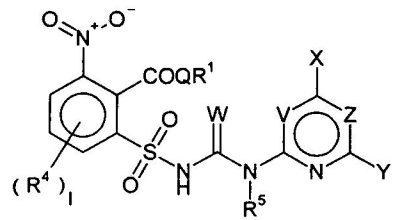


(VII)

in Gegenwart einer Base umsetzt oder

e) einen Aminoheterocyclus der Formel (V) zunächst basenkatalysiert mit einem Kohlensäureester, z.B. Diphenylcarbonat, umsetzt und das gebildete Intermediat in einer Eintopfreaktion mit einem Sulfonamid der Formel (II) (siehe Variante a) umsetzt, oder

f) einen Phenylsulfonylharnstoff der Formel (VIII)



(VIII)

durch Reduktion der Nitrogruppe, und gegebenenfalls weiterer Umsetzung der freigesetzten Hydroxylamino- oder Aminofunktion, zu einem Sulfonylharnstoff der Formel (I) umsetzt,

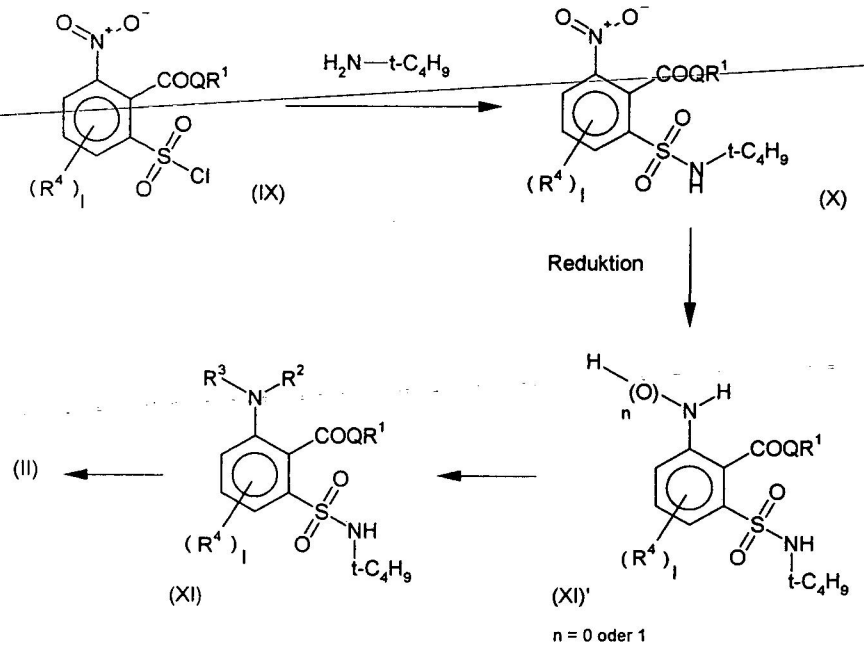
wobei in den Formeln (II)-(VIII) die Reste, Gruppen bzw. Indizes R^1-R^5, Q, V, W, X, Y, Z und l wie in Formel (I) definiert sind. In Verfahrensvarianten a) bis c), e) und f) zunächst Verbindungen der Formel (I) mit W = O erhalten.

Die Umsetzung der Verbindungen der Formeln (II) und (III) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel, wie z.B. Dichlormethan, Acetonitril, Dioxan oder THF bei Temperaturen zwischen 0 °C, vorzugsweise 20 °C, und dem Siedepunkt des Lösungsmittels. Als Base werden

dabei beispielsweise organische Aminbasen, wie 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU), Alkali-tert.-butoxide, wie z.B. NaO-t-C_4H_9, oder Alkalihydroxide, wie z.B. NaOH, insbesondere bei R** = (subst.) Phenyl (vgl. EP-A-44 807), oder Trimethylaluminium oder Triethylaluminium, letztere insbesondere bei R** = Alkyl (vgl. EP-A-166 516) verwendet. Die jeweilige Base wird dabei beispielsweise im Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten, bezogen auf die Verbindung der Formel (II), eingesetzt.

Die Sulfonamide (II) und damit strukturell verwandte Verbindungen der Formeln (IV) und (VI) sowie die Phenylsulfonylharnstoffe (VIII) sind neue Verbindungen. Sie und ihre Herstellung sind ebenfalls Gegenstand dieser Erfindung.

Man erhält die Verbindungen der Formel (II) wie in Schema 1 gezeigt beispielsweise ausgehend von Verbindungen der Formel (IX)



Schema 1

Die Behandlung von Sulfochloriden der Formel (IX) mit tert.-Butylamin ergibt Sulfonamide der Formel (X). Durch Reduktion der Nitrogruppe in den Verbindungen der Formel (X) gelangt man zu den entsprechenden Hydroxylaminen bzw. Aminen (XI)' wobei die freigesetzte Funktionalität gegebenenfalls derivatisiert z.B. alkyliert werden kann. Die so erhaltenen Zwischenstufen der Formel (XI) werden schließlich durch Säurebehandlung in die Verbindungen (II) übergeführt. Die Reste R^1 bis R^4, Q und I sind in Schema 1 wie in Formel (I) definiert.

Die Sulfonamidbildung wird beispielsweise in inerten Lösungsmitteln wie z.B. Dichlormethan, Tetrahydrofuran (THF), Dioxan, Toluol oder Dimethylformamid (DMF) bei Temperaturen von -70 °C bis zum Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bis 25 °C durchgeführt. Dabei kommt bevorzugt eine Aminmenge von 1.5 – 2.5 Äquivalenten bezogen auf Sulfochlorid zum Einsatz.

Die Reduktion der Nitrofunktion in (X) zu Aminen bzw. Hydroxylaminen der allgemeinen Formel (XI)' erfolgt analog zu bekannten Methoden (vgl. hierzu Houben-Weyl, "Methoden der Organischen Chemie", 4. Aufl. Bd. XI/1 S. 360 ff, Thieme Verlag Stuttgart, 1957 sowie Bd. X/1 S. 1138 ff, Thieme Verlag Stuttgart, 1971).

Verbindungen der allgemeinen Formel (XI)' (wobei n = 0) lassen sich mit Carbonylverbindungen reduktiv alkylieren (vgl. hierzu Houben-Weyl, "Methoden der Organischen Chemie", 4. Aufl. Bd. XI/1 S. 618-643, Thieme Verlag Stuttgart, 1957; J. Am. Chem. Soc. 96 (1974) 7812-7814; J. Med. Chem. 38 (1995) 3132-3137).

Durch nachfolgende tert.-Butylspaltung gelingt so beispielsweise die Darstellung sekundärer und tertiärer Aniline der allgemeinen Formel (II).

Die Abspaltung der tert.-Butyl-Schutzgruppe in den Verbindungen (XI) erfolgt durch Behandlung mit einer starken Säure (siehe WO 89/10921). Als starke Säuren kommen z.B. Mineralsäuren, wie H_2SO_4 oder HCl, oder starke organische Säuren, wie Trifluoressigsäure in Frage. Die Reaktion erfolgt beispielsweise bei Temperaturen von -20 °C bis zur jeweiligen Rückflußtemperatur des Reaktionsgemisches, vorzugsweise bei 0 °C bis 40 °C. Die Umsetzung kann in Substanz oder auch in einem inerten Solvens, wie z.B. Dichlormethan oder Trichlormethan, durchgeführt werden.

Für I = 0, Q = O und R^1 = H, Me, Et und Allyl sind die Verbindungen (IX) bekannt (siehe US-4 647 588, US-4 694 020, EP-A-197 386 und US-4 603 133). Die erfindungsgemäßen neuen Verbindungen der Formel (IX) können ausgehend von kernsubstituierten Phtalsäuren (für I = 0 beispielsweise aus käuflicher 3-Nitrophtalsäure), analog zu bekannten Methoden hergestellt werden (siehe J. Heterocyclic Chem. 23 (1986) 1253-1255).

Die Carbamate der Formel (III) können nach Methoden hergestellt werden, wie sie in den südafrikanischen Patentanmeldungen 82/5671 und 82/5045 bzw. EP-A-70 804 (US-A-4 480 101) oder RD 275 056 beschrieben sind.

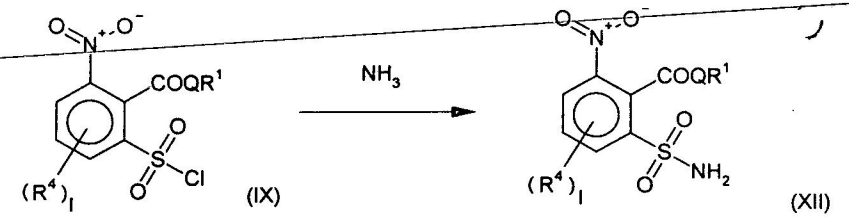
Die Umsetzung der Verbindungen (IV) mit den Aminoheterocyclen (V) führt man vorzugsweise in inerten, aprotischen Lösungsmitteln wie z.B. Dioxan, Acetonitril oder Tetrahydrofuran bei Temperaturen zwischen 0 °C und der Siedetemperatur des Lösungsmittels durch. Die Phenylsulfonylcarbamate der Formel (IV) erhält man analog US-A-4 684 393 oder US-A-4 743 290. Die benötigten Ausgangsmaterialien (V) sind literaturbekannt oder können nach literaturbekannten Verfahren hergestellt werden (siehe hierzu DE-A-38 42 621; Dudley J. R. et al. J. Am. Chem. Soc. 73 (1951) 1968-2990; Braker et al. J. Am. Chem. Soc. 69 (1947) 3072, 3075; Rose et al. J. Chem. Soc. (1946) 81, 84; Huffman, K. R.; Schaefer, F. C. J. Org. Chem. 28 (1963) 1816-1821; Gabriel et al. Chem.Ber. 32 (1899) 2924).

Die Phenylsulfonylisocyanate der Formel (VI) lassen sich analog US-A-4 481 029 herstellen und mit den Aminoheterocyclen (V) umsetzen.

Die (Thio)-Isocyanate der Formel (VII) sind nach literaturbekannten Verfahren erhältlich (EP-A-232 067, EP-A-166 516). Die Umsetzung der (Thio)-Isocyanate (VII) mit Verbindungen (II) erfolgt beispielsweise bei -10 °C bis 100 °C, vorzugsweise bei 20 °C bis 100 °C, in einem inerten aprotischen Lösungsmittel, wie z.B. Aceton oder Acetonitril, in Gegenwart einer geeigneten Base, z.B. Triethylamin oder Kaliumcarbonat.

Die Zwischenprodukte der Formel (VIII) lassen sich beispielsweise unter Umgehung der Isolierung der Isocyanate der Formel (VI) direkt aus den Sulfochloriden (IX) und den Aminoheterocyclen (V) in Gegenwart eines Alkali- oder Ammoniumcyanats oder -thiocyanats und Pyridin herstellen (vgl. hierzu US-A-5 157 119). Alternativ dazu können die Verbindungen (VIII) aber auch durch Umsetzung eines Sulfonamids (XII) mit Carbamaten der Formel (III) entsprechend dem unter a) beschriebenen Verfahren gewonnen werden.

Die Sulfonamide (XII) können durch Umsetzung der Verbindungen (IX) mit Ammoniak erhalten werden (Schema 2).

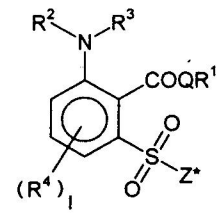


Schema 2

Die Sulfonamidbildung wird beispielsweise in wässrigem Medium oder inerten Lösungsmitteln wie z.B. Dichlormethan, Tetrahydrofuran (THF), Dioxan, Toluol oder Dimethylformamid (DMF) bei Temperaturen von -70 °C bis zum Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bis 25 °C durchgeführt. Dabei kommt bevorzugt eine Aminmenge von 1.5 – 2.5 Äquivalenten bezogen auf Sulfochlorid zum Einsatz.

Die Umsetzung eines Aminoheterocyclus der Formel (V) mit Diphenylcarbonat und einem Sulfonamid der Formel (II) in einer Eintopfreaktion kann gemäß EP-A-562 575 durchgeführt werden.

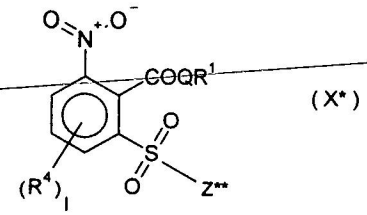
Die genannten Verbindungen der Formel (II), (IV), (VI), (XI) und (XI)' sind strukturverwandte neue Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (II*)



(II*)

worin Z*= NH_2, NHCOOR***, NCO oder NH-tert.-Butyl bedeutet und R^1-R^4, I und Q wie in Formel (I) und R*** wie in Formel (IV) definiert sind.

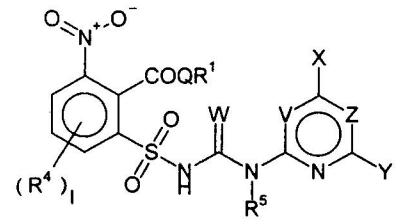
Die genannten Verbindungen der Formel (IX), (X) und (XII) sind strukturverwandte neue Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (X*)



(X*)

worin Z^{**}= NH_2, NH-tert.-Butyl oder Cl bedeutet und R^1, R^4, I und Q wie in Formel (I) definiert sind und wobei Verbindungen ausgenommen sind, in denen Z^{**} = Cl, I = 0, Q = O und R^1 = H, Methyl, Ethyl oder Allyl ist.

Ebenfalls neu sind die Zwischenprodukte der allgemeinen Formel (VIII)



(VIII)

worin R^1, R^4, R^5, Q, V, W, X, Y, Z und I wie in Formel (I) definiert sind.

Die Salze der Verbindungen der Formel (I) werden vorzugsweise in inerten polaren Lösungsmitteln wie z.B. Wasser, Methanol oder Aceton bei Temperaturen von 0 °C bis 100 °C hergestellt. Geeignete Basen zur Herstellung der erfindungsgemäßen Salze sind beispielsweise Alkalicarbonate, wie Kaliumcarbonat, Alkali- und Erdalkalihydroxide, z.B. NaOH oder KOH, oder Alkalialkoholate, wie Natriummethanolat oder Natrium-tert.-butanolat, oder Ammoniak oder Ethanolamin.

Mit den in den vorstehenden Verfahrensvarianten bezeichneten "inerten Lösungsmitteln" sind jeweils Lösungsmittel gemeint, die unter den jeweiligen

Reaktionsbedingungen inert sind, jedoch nicht unter beliebigen Reaktionsbedingungen inert sein müssen.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, im folgenden zusammen als (erfindungsgemäße) Verbindungen der Formel (I) bezeichnet, weisen eine ausgezeichnete herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger mono- und dikotyler Schadpflanzen auf. Auch schwer bekämpfbare perennierende Unkräuter, die aus Rhizomen, Wurzelstöcken oder anderen Dauerorganen austreiben, werden durch die Wirkstoffe gut erfaßt. Dabei ist es gleichgültig, ob die Substanzen im Vorsaat-, Vorauflauf- oder Nachauflaufverfahren ausgebracht werden. Im einzelnen seien beispielhaft einige Vertreter der mono- und dikotylen Unkrautflora genannt, die durch die erfindungsgemäßen Verbindungen kontrolliert werden können, ohne daß durch die Nennung eine Beschränkung auf bestimmte Arten erfolgen soll.

Auf der Seite der monokotylen Unkrautarten werden z.B. Avena, Lolium, Alopecurus, Phalaris, Echinochloa, Digitaria, Setaria sowie Cyperusarten aus der annuellen Gruppe und auf seiten der perennierenden Spezies Agropyron, Cynodon, Imperata sowie Sorghum und auch ausdauernde Cyperusarten gut erfaßt.

Bei dikotylen Unkrautarten erstreckt sich das Wirkungsspektrum auf Arten wie z.B. Galium, Viola, Veronica, Lamium, Stellaria, Amaranthus, Sinapis, Ipomoea, Matricaria, Abutilon und Sida auf der annuellen Seite sowie Convolvulus, Cirsium, Rumex und Artemisia bei den perennierenden Unkräutern.

Unter den spezifischen Kulturbedingungen im Reis vorkommende Schadpflanzen wie z.B. Echinochloa, Sagittaria, Alisma, Eleocharis, Scirpus und Cyperus werden von den erfindungsgemäßen Wirkstoffen ebenfalls hervorragend bekämpft.

Werden die erfindungsgemäßen Verbindungen vor dem Keimen auf die Erdoberfläche appliziert, so wird entweder das Auflaufen der Unkrautkeimlinge vollständig verhindert oder die Unkräuter wachsen bis zum Keimblattstadium heran,

stellen jedoch dann ihr Wachstum ein und sterben schließlich nach Ablauf von drei bis vier Wochen vollkommen ab.

Bei Applikation der Wirkstoffe auf die grünen Pflanzenteile im Nachauflaufverfahren tritt ebenfalls sehr rasch nach der Behandlung ein drastischer Wachstumsstop ein und die Unkrautpflanzen bleiben in dem zum Applikationszeitpunkt vorhandenen Wachstumsstadium stehen oder sterben nach einer gewissen Zeit ganz ab, so daß auf diese Weise eine für die Kulturpflanzen schädliche Unkrautkonkurrenz sehr früh und nachhaltig beseitigt wird.

Obgleich die erfindungsgemäßen Verbindungen eine ausgezeichnete herbizide Aktivität gegenüber mono- und dikotylen Unkräutern aufweisen, werden Kulturpflanzen wirtschaftlich bedeutender Kulturen z.B. zweikeimblättriger Kulturen wie Soja, Baumwolle, Raps, Zuckerrüben, vorzugsweise Soja, oder Gramineen-Kulturen wie Weizen, Gerste, Roggen, Reis oder Mais, nur unwesentlich oder gar nicht geschädigt. Die vorliegenden Verbindungen eignen sich aus diesen Gründen sehr gut zur selektiven Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Nutzpflanzungen oder in Zierpflanzungen.

Darüberhinaus weisen die erfindungsgemäßen Substanzen hervorragende wachstumsregulatorische Eigenschaften bei Kulturpflanzen auf. Sie greifen regulierend in den pflanzeneigenen Stoffwechsel ein und können damit zur gezielten Beeinflussung von Pflanzeninhaltsstoffen und zur Ernteerleichterung wie z.B. durch Auslösen von Desikkation und Wuchsstauchung eingesetzt werden. Desweiteren eignen sie sich auch zur generellen Steuerung und Hemmung von unerwünschtem vegetativen Wachstum, ohne dabei die Pflanzen abzutöten. Eine Hemmung des vegetativen Wachstums spielt bei vielen mono- und dikotylen Kulturen eine große Rolle, da das Lagern hierdurch verringert oder völlig verhindert werden kann.

Aufgrund ihrer herbiziden und pflanzenwachstumsregulatorischen Eigenschaften können die Wirkstoffe auch zur Bekämpfung von Schadpflanzen in Kulturen von bekannten oder noch zu entwickelnden gentechnisch veränderten Pflanzen eingesetzt werden. Die transgenen Pflanzen zeichnen sich in der Regel durch besondere vorteilhafte Eigenschaften aus, beispielsweise durch Resistenzen gegenüber bestimmten Pestiziden, vor allem bestimmten Herbiziden, Resistenzen gegenüber Pflanzenkrankheiten oder Erregern von Pflanzenkrankheiten wie bestimmten Insekten oder Mikroorganismen wie Pilzen, Bakterien oder Viren. Andere besondere Eigenschaften betreffen z. B. das Erntegut hinsichtlich Menge, Qualität, Lagerfähigkeit, Zusammensetzung und spezieller Inhaltsstoffe. So sind transgene Pflanzen mit erhöhtem Stärkegehalt oder veränderter Qualität der Stärke oder solche mit anderer Fettsäurezusammensetzung des Ernteguts bekannt.

Bevorzugt ist die Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze in wirtschaftlich bedeutenden transgenen Kulturen von Nutz-und Zierpflanzen, z. B. von Getreide wie Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Hirse, Reis, Maniok und Mais oder auch Kulturen von Zuckerrübe, Baumwolle, Soja, Raps, Kartoffel, Tomate, Erbse und anderen Gemüsesorten.
Vorzugsweise können die Verbindungen der Formel (I) als Herbizide in Nutzpflanzenkulturen eingesetzt werden, welche gegenüber den phytotoxischen Wirkungen der Herbizide resistent sind bzw. gentechnisch resistent gemacht worden sind.

Herkömmliche Wege zur Herstellung neuer Pflanzen, die im Vergleich zu bisher vorkommenden Pflanzen modifizierte Eigenschaften aufweisen, bestehen beispielsweise in klassischen Züchtungsverfahren und der Erzeugung von Mutanten. Alternativ können neue Pflanzen mit veränderten Eigenschaften mit Hilfe gentechnischer Verfahren erzeugt werden (siehe z. B. EP-A-0221044, EP-A-0131624). Beschrieben wurden beispielsweise in mehreren Fällen

- gentechnische Veränderungen von Kulturpflanzen zwecks Modifikation der in den Pflanzen synthetisierten Stärke (z. B. WO 92/11376, WO 92/14827,

WO 91/19806),

- transgene Kulturpflanzen, welche gegen bestimmte Herbizide vom Typ Glufosinate (vgl. z. B. EP-A-0242236, EP-A-242246) oder Glyphosate (WO 92/00377) oder der Sulfonylharnstoffe (EP-A-0257993, US-A-5013659) resistent sind,
- transgene Kulturpflanzen, beispielsweise Baumwolle, mit der Fähigkeit Bacillus thuringiensis-Toxine (Bt-Toxine) zu produzieren, welche die Pflanzen gegen bestimmte Schädlinge resistent machen (EP-A-0142924, EP-A-0193259).
- transgene Kulturpflanzen mit modifizierter Fettsäurezusammensetzung (WO 91/13972).

Zahlreiche molekularbiologische Techniken, mit denen neue transgene Pflanzen mit veränderten Eigenschaften hergestellt werden können, sind im Prinzip bekannt; siehe z.B. Sambrook et al., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2. Aufl. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; oder Winnacker "Gene und Klone", VCH Weinheim 2. Auflage 1996 oder Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431).

Für derartige gentechnische Manipulationen können Nucleinsäuremoleküle in Plasmide eingebracht werden, die eine Mutagenese oder eine Sequenzveränderung durch Rekombination von DNA-Sequenzen erlauben. Mit Hilfe der obengenannten Standardverfahren können z. B. Basenaustausche vorgenommen, Teilsequenzen entfernt oder natürliche oder synthetische Sequenzen hinzugefügt werden. Für die Verbindung der DNA-Fragmente untereinander können an die Fragmente Adaptoren oder Linker angesetzt werden.

Die Herstellung von Pflanzenzellen mit einer verringerten Aktivität eines Genprodukts kann beispielsweise erzielt werden durch die Expression mindestens einer entsprechenden antisense-RNA, einer sense-RNA zur Erzielung eines Cosuppressionseffektes oder die Expression mindestens eines entsprechend

konstruierten Ribozyms, das spezifisch Transkripte des obengenannten Genprodukts spaltet.

Hierzu können zum einen DNA-Moleküle verwendet werden, die die gesamte codierende Sequenz eines Genprodukts einschließlich eventuell vorhandener flankierender Sequenzen umfassen, als auch DNA-Moleküle, die nur Teile der codierenden Sequenz umfassen, wobei diese Teile lang genug sein müssen, um in den Zellen einen antisense-Effekt zu bewirken. Möglich ist auch die Verwendung von DNA-Sequenzen, die einen hohen Grad an Homologie zu den codiereden Sequenzen eines Genprodukts aufweisen, aber nicht vollkommen identisch sind.

Bei der Expression von Nucleinsäuremolekülen in Pflanzen kann das synthetisierte Protein in jedem beliebigen Kompartiment der pflanzlichen Zelle lokalisiert sein. Um aber die Lokalisation in einem bestimmten Kompartiment zu erreichen, kann z. B. die codierende Region mit DNA-Sequenzen verknüpft werden, die die Lokalisierung in einem bestimmten Kompartiment gewährleisten. Derartige Sequenzen sind dem Fachmann bekannt (siehe beispielsweise Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106).

Die transgenen Pflanzenzellen können nach bekannten Techniken zu ganzen Pflanzen regeneriert werden. Bei den transgenen Pflanzen kann es sich prinzipiell um Pflanzen jeder beliebigen Pflanzenspezies handeln, d.h. sowohl monokotyle als auch dikotyle Pflanzen.

So sind transgene Pflanzen erhältlich, die veränderte Eigenschaften durch Überexpression, Suppression oder Inhibierung homologer (= natürlicher) Gene oder Gensequenzen oder Expression heterologer (= fremder) Gene oder Gensequenzen aufweisen.

Vorzugsweise können die erfindungsgemäßen Verbindungen (I) in transgenen Kulturen eingesetzt werden, welche gegen Herbizide aus der Gruppe der Sulfonylharnstoffe, Glufosinate-ammonium oder Glyphosate-isopropylammonium und analoge Wirkstoffe resistent sind.

Bei der Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe in transgenen Kulturen treten neben den in anderen Kulturen zu beobachtenden Wirkungen gegenüber Schadpflanzen oftmals Wirkungen auf, die für die Applikation in der jeweiligen transgenen Kultur spezifisch sind, beispielsweise ein verändertes oder speziell erweitertes Unkrautspektrum, das bekämpft werden kann, veränderte Aufwandmengen, die für die Applikation eingesetzt werden können, vorzugsweise gute Kombinierbarkeit mit den Herbiziden, gegenüber denen die transgene Kultur resistent ist, sowie Beeinflussung von Wuchs und Ertrag der transgenen Kulturpflanzen.

Gegenstand der Erfindung ist deshalb auch die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen (I) als Herbizide zur Bekämpfung von Schadpflanzen in transgenen Kulturpflanzen.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in Form von Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, versprühbaren Lösungen, Stäubemitteln oder Granulaten in den üblichen Zubereitungen angewendet werden. Gegenstand der Erfindung sind deshalb auch herbizide und pflanzenwachstumsregulierende Mittel, die Verbindungen der Formel (I) enthalten.

Die Verbindungen der Formel (I) können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem welche biologischen und/oder chemisch-physikalischen Parameter vorgegeben sind. Als Formulierungsmöglichkeiten kommen beispielsweise in Frage: Spritzpulver (WP), wasserlösliche Pulver (SP), wasserlösliche Konzentrate, emulgierbare Konzentrate (EC), Emulsionen (EW), wie Öl-in-Wasser- und Wasser-in-Öl-Emulsionen, versprühbare Lösungen, Suspensionskonzentrate (SC),

Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis, ölmischbare Lösungen, Kapselsuspensionen (CS), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate für die Streu- und Bodenapplikation, Granulate (GR) in Form von Mikro-, Sprüh-, Aufzugs- und Adsorptionsgranulaten, wasserdispergierbare Granulate (WG), wasserlösliche Granulate (SG), ULV-Formulierungen, Mikrokapseln und Wachse.
Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Die notwendigen Formulierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside, Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

Auf der Basis dieser Formulierungen lassen sich auch Kombinationen mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, wie z.B. Insektiziden, Akariziden, Herbiziden, Fungiziden, sowie mit Safenern, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren herstellen, z.B. in Form einer Fertigformulierung oder als Tankmix.

Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Tenside ionischer und/oder nichtionischer Art (Netzmittel, Dispergiermittel), z.B. polyoxyethylierte

Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, polyoxethylierte Fettamine, Fettalkoholpolyglykolethersulfate, Alkansulfonate, Alkylbenzolsulfonate, ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium, dibutylnaphthalin-sulfonsaures Natrium oder auch oleoylmethyltaurinsaures Natrium enthalten. Zur Herstellung der Spritzpulver werden die herbiziden Wirkstoffe beispielsweise in üblichen Apparaturen wie Hammermühlen, Gebläsemühlen und Luftstrahlmühlen feingemahlen und gleichzeitig oder anschließend mit den Formulierungshilfsmitteln vermischt.

Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösungsmittel z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen oder Mischungen der organischen Lösungsmittel unter Zusatz von einem oder mehreren Tensiden ionischer und/oder nichtionischer Art (Emulgatoren) hergestellt. Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calzium-Salze wie Ca-Dodecylbenzolsulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykolether, Fettalkoholpolyglykolether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanester wie z.B. Sorbitanfettsäureester oder Polyoxethylensorbitanester wie z.B. Polyoxyethylensorbitanfettsäureester.

Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen, wie Kaolin, Bentonit und Pyrophyllit, oder Diatomeenerde.

Suspensionskonzentrate können auf Wasser- oder Ölbasis sein. Sie können beispielsweise durch Naß-Vermahlung mittels handelsüblicher Perlmühlen und gegebenenfalls Zusatz von Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, hergestellt werden.

Emulsionen, z.B. Öl-in-Wasser-Emulsionen (EW), lassen sich beispielsweise mittels Rührern, Kolloidmühlen und/oder statischen Mischern unter Verwendung von wäßrigen organischen Lösungsmitteln und gegebenenfalls Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, herstellen.

Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebemitteln, z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise - gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln - granuliert werden.

Wasserdispergierbare Granulate werden in der Regel nach den üblichen Verfahren wie Sprühtrocknung, Wirbelbett-Granulierung, Teller-Granulierung, Mischung mit Hochgeschwindigkeitsmischern und Extrusion ohne festes Inertmaterial hergestellt.

Zur Herstellung von Teller-, Fließbett-, Extruder- und Sprühgranulate siehe z.B. Verfahren in "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, Seiten 147 ff; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973; S. 8-57.

Für weitere Einzelheiten zur Formulierung von Pflanzenschutzmitteln siehe z.B. G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Seiten 81-96 und J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, Seiten 101-103.

Die agrochemischen Zubereitungen enthalten in der Regel 0.1 bis 99 Gew.-%, insbesondere 0.1 bis 95 Gew.-%, Wirkstoff der Formel (I).
In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z.B. etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei

emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 1 bis 90, vorzugsweise 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten 1 bis 30 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise meistens 5 bis 20 Gew.-% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen enthalten etwa 0.05 bis 80, vorzugsweise 2 bis 50 Gew.-% Wirkstoff. Bei wasserdispergierbaren Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden. Bei den in Wasser dispergierbaren Granulaten liegt der Gehalt an Wirkstoff beispielsweise zwischen 1 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 10 und 80 Gew.-%.

Daneben enthalten die genannten Wirkstofformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Konservierungs-, Frostschutz- und Lösungsmittel, Füll-, Träger- und Farbstoffe, Entschäumer, Verdunstungshemmer und den pH-Wert und die Viskosität beeinflussende Mittel.

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Mischungsformulierungen oder im Tank-Mix sind beispielsweise bekannte Wirkstoffe einsetzbar, wie sie z.B. aus Weed Research 26 (1986) 441-445 oder "The Pesticide Manual", 11th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 1997 und dort zitierter Literatur beschrieben sind. Als bekannte Herbizide, die mit den Verbindungen der Formel (I) kombiniert werden können, sind z.B. folgende Wirkstoffe zu nennen (Anmerkung: Die Verbindungen sind entweder mit dem "common name" nach der International Organization for Standardization (ISO) oder mit dem chemischen Namen, ggf. zusammen mit einer üblichen Codenummer bezeichnet):
acetochlor; acifluorfen; aclonifen; AKH 7088, d.h. [[[1-[5-[2-Chloro-4-(trifluoromethyl)-phenoxy]-2-nitrophenyl]-2-methoxyethylidene]-amino]-oxy]-essigsäure und -essigsäuremethylester; alachlor; alloxydim; ametryn; amidosulfuron; amitrol; AMS, d.h. Ammoniumsulfamat; anilofos; asulam; atrazin; azafenidin; azimsulfuron (DPX-A8947); aziprotryn; barban; BAS 516 H, d.h. 5-Fluor-2-phenyl-4H-3,1-benzoxazin-4-on; BAS 620 H; BAS 65400H; BAY FOE 5043; benazolin; benfluralin; benfuresate; bensulfuron-methyl; bensulide; bentazone; benzofenap; benzofluor; benzoylprop-ethyl; benzthiazuron; bialaphos; bifenox; bispyribac-Na; bromacil; bromobutide; bromofenoxim; bromoxynil; bromuron; buminafos; busoxinone; butachlor; butamifos; butenachlor; buthidazole; butralin; butroxydim; butylate; cafenstrole (CH-900); caloxydim; carbetamide; carfentrazone-ethyl; CDAA, d.h. 2-Chlor-N,N-di-2-propenylacetamid; CDEC, d.h. Diethyldithiocarbaminsäure-2-chlorallylester; chlomethoxyfen; chloramben; chlorazifop-butyl, chlorbromuron; chlorbufam; chlorfenac; chlorflurecol-methyl; chloridazon; chlorimuron ethyl; chlornitrofen; chlorotoluron; chloroxuron; chlorpropham; chlorsulfuron; chlorthal-dimethyl; chlorthiamid; cinmethylin; cinosulfuron; clethodim; clodinafop und dessen Esterderivate (z.B. clodinafop-propargyl); clomazone; clomeprop; cloproxydim; clopyralid; cloransulam-methyl; cumyluron (JC 940); cyanazine; cycloate; cyclosulfamuron (AC 104); cycloxydim; cycluron; cyhalofop und dessen Esterderivate (z.B. Butylester, DEH-112); cyperquat; cyprazine; cyprazole; daimuron; 2,4-DB; dalapon; desmedipham; desmetryn; di-allate; dicamba; dichlobenil; dichlorprop; diclofop und dessen Ester wie diclofop-methyl; diclosulam, d.h. N-(2,6-Dichlorphenyl)-5-ethoxy-7-fluor-[1,2,4]triazolo[1,5-c]pyrimidin-2-sulfonamid; diethatyl; difenoxuron; difenzoquat; diflufenican; diflufenzopyr (BAS 654 00H), dimefuron; dimethachlor; dimethametryn; dimethenamid (SAN-582H); dimethazone, clomazon; dimethipin; dimetrasulfuron, dinitramine; dinoseb; dinoterb; diphenamid; dipropetryn; diquat; dithiopyr; diuron; DNOC; eglinazine-ethyl; EL 77, d.h. 5-Cyano-1-(1,1-dimethylethyl)-N-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamid; endothal; EPTC; esprocarb; ethalfluralin; ethametsulfuron-methyl; ethidimuron; ethiozin; ethofumesate; F5231, d.h. N-[2-Chlor-4-fluor-5-[4-(3-fluorpropyl)-4,5-dihydro-5-oxo-1H-tetrazol-1-yl]-phenyl]-ethansulfonamid; ethoxyfen und dessen Ester (z.B. Ethylester, HN-252); etobenzanid (HW 52); fenoprop; fenoxan, fenoxaprop und fenoxaprop-P sowie deren Ester, z.B. fenoxaprop-P-ethyl und fenoxaprop-ethyl; fenoxydim; fenuron; flamprop-methyl; flazasulfuron; fluazifop und fluazifop-P und deren Ester, z.B. fluazifop-butyl und fluazifop-P-butyl; fluchloralin; flumetsulam; flumeturon; flumiclorac und dessen Ester (z.B. Pentylester, S-23031); flumioxazin

(S-482); flumipropyn; flupoxam (KNW-739); fluorodifen; fluoroglycofen-ethyl; flupropacil (UBIC-4243); flupyrsulfuron-methyl-sodium; fluridone; flurochloridone; fluroxypyr; flurtamone; fluthiacet-methyl; fomesafen; fosamine; furyloxyfen; glufosinate; glyphosate; halosafen; halosulfuron und dessen Ester (z.B. Methylester, NC-319); haloxyfop und dessen Ester; haloxyfop-P (= R-haloxyfop) und dessen Ester; hexazinone; imazamethabenz-methyl; imazamox; imazapyr; imazaquin und Salze wie das Ammoniumsalz; imazethamethapyr; imazethapyr; imazosulfuron; indanofan (MK-243), ioxynil; isocarbamid; isopropalin; isoproturon; isouron; isoxaben; isoxaflutole; isoxapyrifop; karbutilate; lactofen; lenacil; linuron; MCPA; MCPB; mecoprop; mefenacet; mefluidid; metamitron; metazachlor; methabenzthiazuron; metham; methazole; methoxyphenone; methyldymron; metobenzuron; metobromuron; metolachlor; metosulam (XRD 511); metoxuron; metribuzin; metsulfuron-methyl; MH; molinate; monalide; monocarbamide dihydrogensulfate; monolinuron; monuron; MT 128, d.h. 6-Chlor-N-(3-chlor-2-propenyl)-5-methyl-N-phenyl-3-pyridazinamin; MT 5950, d.h. N-[3-Chlor-4-(1-methylethyl)-phenyl]-2-methylpentanamid; naproanilide; napropamide; naptalam; NC 310, d.h. 4-(2,4-dichlorbenzoyl)-1-methyl-5-benzyloxypyrazol; neburon; nicosulfuron; nipyraclophen; nitralin; nitrofen; nitrofluorfen; norflurazon; orbencarb; oryzalin; oxadiargyl (RP-020630); oxadiazon; oxasulfuron; oxaziclomefone (MY-100); oxyfluorfen; paraquat; pebulate; pendimethalin; pentoxazone (KPP-314); perfluidone; phenisopham; phenmedipham; picloram; piperophos; piributicarb; pirifenop-butyl; pretilachlor; primisulfuron-methyl; procyazine; prodiamine; profluralin; proglinazine-ethyl; prometon; prometryn; propachlor; propanil; propaquizafop und dessen Ester; propazine; propham; propisochlor; propyzamide; prosulfalin; prosulfocarb; prosulfuron (CGA-152005); prynachlor; pyroflufen-ethyl; pyrazolinate; pyrazon; pyrazosulfuron-ethyl; pyrazoxyfen; pyribenzoxim (LGC-40836); pyributicarb; pyridate; pyriminobac-methyl; pyrithiobac (KIH-2031); pyroxofop und dessen Ester (z.B. Propargylester); quinclorac; quinmerac; quinofop und dessen Esterderivate, quizalofop und quizalofop-P und deren Esterderivate z.B. quizalofop-ethyl; quizalofop-P-tefuryl und -ethyl; renriduron; rimsulfuron (DPX-E 9636); S 275, d.h. 2-[4-Chlor-2-fluor-5-(2-propynyloxy)-phenyl]-

4,5,6,7-tetrahydro-2H-indazol; secbumeton; sethoxydim; siduron; simazine; simetryn; SN 106279, d.h. 2-[[7-[2-Chlor-4-(trifluor-methyl)-phenoxy]-2-naphthalenyl]-oxy]-propansäure und -methylester; sulcotrione; sulfentrazon (FMC-97285, F-6285); sulfazuron; sulfometuron-methyl; sulfosate (ICI-A0224); sulfosulfuron; TCA; tebutam (GCP-5544); tebuthiuron; terbacil; terbucarb; terbuchlor; terbumeton; terbuthylazine; terbutryn; TFH 450, d.h. N,N-Diethyl-3-[(2-ethyl-6-methylphenyl)-sulfonyl]-1H-1,2,4-triazol-1-carboxamid; thenylchlor (NSK-850); thiazafluron; thiazopyr (Mon-13200); thidiazimin (SN-24085); thifensulfuron-methyl; thiobencarb; tiocarbazil; tralkoxydim; tri-allate; triasulfuron; triaziflam, triazofenamide; tribenuron-methyl; triclopyr; tridiphane; trietazine; trifluralin; triflusulfuron und Ester (z.B. Methylester, DPX-66037); trimeturon; tsitodef; vernolate; WL 110547, d.h. 5-Phenoxy-1-[3-(trifluormethyl)-phenyl]-1H-tetrazol; JTC-101; UBH-509; D-489; LS 82-556; KPP-300; NC-324; NC-330; KH-218; DPX-N8189; SC-0774; DOWCO-535; DK-8910; V-53482; PP-600; MBH-001; KIH-9201; ET-751; KIH-6127 und KIH-2023.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Formulierungen gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und wasserdispergierbaren Granulaten mittels Wasser. Staubförmige Zubereitungen, Boden- bzw. Streugranulate sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit, der Art des verwendeten Herbizids, u.a. variiert die erforderliche Aufwandmenge der Verbindungen der Formel (I). Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z.B. zwischen 0.001 und 10.0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch zwischen 0.005 und 5 kg/ha.

A. Chemische Beispiele

Beispiel A1

Methyl 2-[(*tert*-butylamino)sulfonyl]-6-nitrobenzoat

Zu einer Lösung von 1.00 g (3.58 mmol) Methyl 2-(chlorsulfonyl)-6-nitrobenzoat in 8 ml Dichlormethan tropft man bei 0 °C 1.4 ml (13.3 mmol) tert.-Butylamin und läßt das Reaktionsgemisch dann auf Raumtemperatur kommen. Nach 2 h wird das Reaktionsgemisch auf Eiswasser gegossen, mit 2 N wässriger Salzsäure auf pH 3 eingestellt und mit Dichlormethan extrahiert. Anschließend wird die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet, abfiltriert und im Vakuum zur Trockne eingeengt. Der verbleibende Rückstand wird mit Diethylether digeriert und abgesaugt. Man erhält so 1.06 g (91 % d. Th.) Methyl 2-[(*tert*-butylamino)sulfonyl]-6-nitrobenzoat vom Schmp. 89-91 °C.

Beispiel A2

Methyl 2-(aminosulfonyl)-6-nitrobenzoat

300 mg (0.948 mmol) Methyl 2-[(*tert*-butylamino)sulfonyl]-6-nitrobenzoat werden in 8 ml Trifluoressigsäure 4 h bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird im Vakuum zur Trockne eingeengt und der Rückstand wird mit Diethylether digeriert. Nach Absaugen und Trocknen verbleiben 230 mg (93 % d. Th.) Methyl 2-(aminosulfonyl)-6-nitrobenzoat vom Schmp. 227-229 °C.

Beispiel A3

Methyl 2-[(*tert*-butylamino)sulfonyl]-6-(isopropylamino)benzoat

Bei einer Temperatur von 5 – 10 °C werden 925 mg (24.4 mmol) Natriumborhydrid in 14 ml Essigsäure eingerührt. Nach 1 h wird dieses Gemisch erst mit 1.42 g

(24.4 mmol) Aceton, dann mit 700 mg (2.44 mmol) Methyl 2-amino-6-[(*tert*-butylamino)sulfonyl]benzoat versetzt und 2.5 h bei 5 – 10 °C gerührt. Zur Aufarbeitung wird das Reaktionsgemisch auf Eiswasser gegeben, mit wässriger Ammoniaklösung neutralisiert und mit Dichlormethan extrahiert. Die organische Phase wird eingeengt und der verbleibende Rückstand mit Diisopropylether verrrieben. Nach Absaugen und Trocknen verbleiben 700 mg (89 % d. Th.) Methyl 2-[(*tert*-butylamino)sulfonyl]-6-(isopropylamino)benzoat als weißer Feststoff vom Schmp. 110 - 112 °C.

Beispiel A4

Methyl 2-amino-6-[(*tert*-butylamino)sulfonyl]benzoat

Eine Lösung von 8.00 g (25.3 mmol) Methyl 2-[(*tert*-butylamino)sulfonyl]-6-nitrobenzoat wird mit 3.2 g Palladium auf Aktivkohle (5 %ig) versetzt und bei Raumtemperatur 6 h unter Normaldruck hydriert. Anschließend filtriert man das Reaktionsgemisch, engt das Filtrat zur Trockne ein und reinigt den Rückstand durch Chromatographie an Kieselgel [DC (SiO_2) Ethylacetat/n-Heptan 1:1; R_f = 0.38] mit Ethylacetat/n-Heptan (1:1). Nach Evaporation erhält man 6.23 g (86 % d. Th.) Methyl 2-amino-6-[(*tert*-butylamino)sulfonyl]benzoat als beiger Feststoff vom Schmelzpunkt 132 - 133 °C.

Beispiel A5

Methyl 2-(diisobutylamino)-6-[([[(4,6-dimethoxy-2-pyrimidinyl)amino]carbonylamino)sulfonyl]benzoat

700 mg (2.04 mmol) Methyl 2-(diisobutylamino)-6-(sulfonylamino)benzoat und 619 mg (2.25 mmol) N-(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)carbaminsäurephenylester werden in 10 ml Acetonitril vorgelegt. Bei Raumtemperatur werden dann 375 mg (2.51 mmol) 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (1,5-5) (DBU) zugetropft und das

Reaktionsgemisch 3 h bei dieser Temperatur gerührt. Anschließend gießt man auf Eiswasser und stellt die Lösung mit 2 N Salzsäure langsam auf pH 1 ein. Der ausgefallene Feststoff wird abgesaugt, mit Wasser nachgewaschen und getrocknet. Man erhält so 910 mg (91 % d.Th.) Methyl 2-(diisobutylamino)-6-[([(4,6-dimethoxy-2-pyrimidinyl)amino]carbonylamino)sulfonyl]benzoat vom Schmp. 166 - 167 °C.

Beispiel A6

Methyl 2-[([(4,6-dimethoxy-1,3,5-triazin-2-yl)amino]carbonylamino)sulfonyl]-6-nitrobenzoat

Zu einer Suspension aus 2.79 g (17.9 mmol) 2-Amino-4,6-dimethoxy-1,3,5-triazin, 1.28 g (19.7 mmol) Natriumcyanat, 1.45 ml (17.9 mmol) Pyridin und 500 mg frisch aktiviertem Molekularsieb (Porengröße 3 Å) in 85 ml trockenem Acetonitril, tropft man bei 55 - 60 °C binnen 2 h unter Argon eine Lösung von 5.0 g (17.9 mmol) 2-Chlorsulfonyl-6-nitrobenzoesäuremethylester in 55 ml trockenem Dichlormethan. Nach 7 h Rühren bei dieser Temperatur läßt man auf Raumtemperatur kommen. Nach weiteren 12 h engt man das Reaktionsgemisch ein, suspendiert den Rückstand in 200 ml Wasser und stellt mit 2 N wässriger Natriumhydroxidlösung auf pH 10 ein. Der ausgefallene Feststoff wird abgesaugt und das Filtrat mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wird abgetrennt und die wässrige Phase mit 3 N wässriger Salzsäurelösung auf pH 1.5 eingestellt und 15 min im Eisbad nachgerührt. Anschließend wird der ausgefallene Feststoff abgesaugt, erst mit Wasser dann mit Methanol nachgewaschen und im Vakuum getrocknet. Man erhält so 2.88 g (36 % d. Th.) Methyl 2-[([(4,6-dimethoxy-1,3,5-triazin-2-yl)amino]carbonylamino)sulfonyl]-6-nitrobenzoat vom Schmp. 185 - 195 °C (Zers.).

Beispiel A7

Methyl 2-amino-6-[([(4,6-dimethoxy-1,3,5-triazin-2-yl)amino]carbonylamino)sulfonyl]benzoat

50 mg (113 µmol) Methyl 2-[([(4,6-dimethoxy-1,3,5-triazin-2-yl)amino]carbonylamino)sulfonyl]-6-nitrobenzoat werden in einem Gemisch aus 3 ml Methanol/Dimethylformamid (5:1) suspendiert, mit 10 mg Palladium auf Aktivkohle (5 %ig) und 1 mg (8.20 µmol) Natrium(meta)vanadat versetzt und 3 h unter Normaldruck bei Raumtemperatur hydriert. Anschließend wird abfiltriert, das Filtrat eingeengt, der Rückstand in Wasser aufgenommen und mit 3 N wässriger Salzsäurelösung auf pH 1.5 eingestellt. Der ausgefallene Niederschlag wird 10 min im Eisbad nachgerührt, dann abgesaugt und im Vakuum getrocknet. Man erhält 41 mg (87 % d. Th.) Methyl 2-amino-6-[([(4,6-dimethoxy-1,3,5-triazin-2-yl)amino]carbonylamino)sulfonyl]benzoat vom Schmp. 129 - 134 °C (Zers.).

Beispiel A8

Methyl 2-(diisobutylamino)-6-[([(4,6-dimethoxy-2-pyrimidinyl)amino]carbonylamino)sulfonyl]benzoat, Natriumsalz

In 5 ml Tetrahydrofuran werden 0.2 g (0.382 mmol) Methyl 2-(diisobutylamino)-6-[([(4,6-dimethoxy-2-pyrimidinyl)amino]carbonylamino)sulfonyl]benzoat eingerührt und anschließend 0.04 g (416 µmol) Natrium-tert.-butylat zugeben. Nach 6 h wird der entstandene Feststoff abgesaugt und getrocknet. Man erhält 0.19 g (93 % d. Th.) Methyl 2-(diisobutylamino)-6-[([(4,6-dimethoxy-2-pyrimidinyl)amino]carbonylamino)sulfonyl]benzoat, Natriumsalz als farblosen Feststoff vom Schmp. 215 - 217 °C.

Die in den nachfolgenden Tabellen 1 und 2 beschriebenen Verbindungen werden nach bzw. analog den obigen Beispielen A1 – A8 erhalten.

Abkürzungen in den Tabellen 1 und 2:

Smp. = Schmelzpunkt in °C

(Z) = Schmelzpunkt unter Zersetzung

Bu = n-Butyl; (entsprechend Pentyl = n-Pentyl, Hexyl = n-Hexyl)

Et = Ethyl

Me = Methyl

Ph = Phenyl

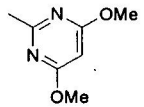
Pr, i-Pr, c-Pr = n-Propyl, Isopropyl bzw. Cyclopropyl

Ein Diradikal wie Butylen der Formel

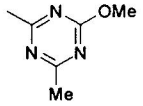


in den Spalten für R^2, R^3 heißt, daß R^2 und R^3 zusammen die Diradikalbrücke bedeuten und mit dem N-Atom der Gruppe R^2R^3N ein cyclisches Amin bilden.

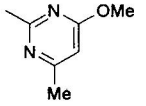
Het = Heterocyclus, wobei Het für einen der Reste T1 bis T20 steht



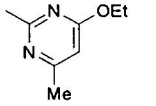
T1



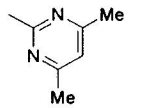
T2



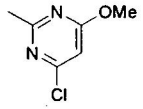
T3



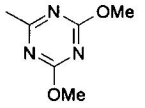
T4



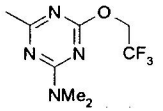
T5



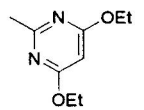
T6



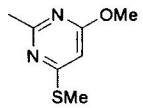
T7



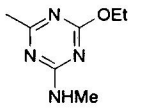
T8



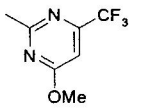
T9



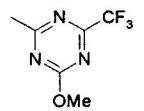
T10



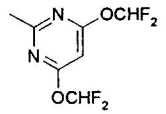
T11



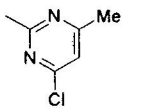
T12



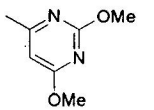
T13



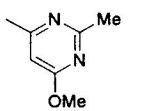
T14



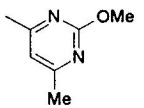
T15



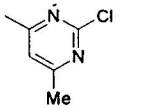
T16



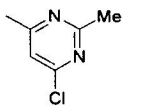
T17



T18

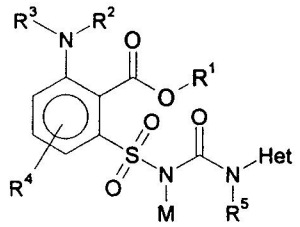


T19



T20

Tabelle 1: Verbindungen der Formel (Ia)



(Ia)

Bsp. Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	Smp.
1-1.	H	H	H	-	H	H	T1	
1-2.	H	H	H	-	H	Na	T1	
1-3.	H	H	H	-	H	H	T2	
1-4.	H	H	H	-	H	Na	T2	
1-5.	H	H	H	-	H	H	T5	
1-6.	H	H	H	-	H	Na	T5	
1-7.	H	H	H	-	H	H	T6	
1-8.	H	H	H	-	H	Na	T6	
1-9.	H	H	H	-	H	H	T7	
1-10.	H	H	H	-	H	Na	T7	
1-11.	Me	H	H	-	H	H	T1	171-173
1-12.	Me	H	H	-	H	Na	T1	
1-13.	Me	H	H	-	Me	H	T2	
1-14.	Me	H	H	-	Me	Na	T2	
1-15.	Me	H	H	-	H	H	T2	126-127
1-16.	Me	H	H	-	H	Na	T2	
1-17.	Me	H	H	-	H	H	T3	
1-18.	Me	H	H	-	H	Na	T3	
1-19.	Me	H	H	-	H	H	T4	
1-20.	Me	H	H	-	H	Na	T4	
1-21.	Me	H	H	-	H	H	T5	
1-22.	Me	H	H	-	H	Na	T5	
1-23.	Me	H	H	-	H	H	T6	137-139
1-24.	Me	H	H	-	H	Na	T6	
1-25.	Me	H	H	-	H	H	T7	129-134 (Z)
1-26.	Me	H	H	-	H	Na	T7	
1-27.	Me	H	H	-	Me	H	T7	
1-28.	Me	H	H	-	Me	Na	T7	
1-29.	Me	H	H	-	H	H	T8	
1-30.	Me	H	H	-	H	Na	T8	
1-31.	Me	H	H	-	H	H	T9	
1-32.	Me	H	H	-	H	Na	T9	
1-33.	Me	H	H	-	H	H	T10	
1-34.	Me	H	H	-	H	Na	T10	
1-35.	Me	H	H	-	H	H	T11	
1-36.	Me	H	H	-	H	Na	T11	
1-37.	Me	H	H	-	H	H	T12	
1-38.	Me	H	H	-	H	Na	T12	

Bsp. Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	Smp.
1-39.	Me	H	H	-	H	H	T13	
1-40.	Me	H	H	-	H	Na	T13	
1-41.	Me	H	H	-	H	H	T14	
1-42.	Me	H	H	-	H	Na	T14	
1-43.	Me	H	H	-	H	H	T15	
1-44.	Me	H	H	-	H	Na	T15	
1-45.	Et	H	H	-	H	H	T1	164-166
1-46.	Et	H	H	-	H	Na	T1	
1-47.	Et	H	H	-	H	H	T2	149-151
1-48.	Et	H	H	-	H	Na	T2	
1-49.	Et	H	H	-	H	H	T3	
1-50.	Et	H	H	-	H	Na	T3	
1-51.	Et	H	H	-	H	H	T4	
1-52.	Et	H	H	-	H	Na	T4	
1-53.	Et	H	H	-	H	H	T5	
1-54.	Et	H	H	-	H	Na	T5	
1-55.	Et	H	H	-	H	H	T6	157-158
1-56.	Et	H	H	-	H	Na	T6	
1-57.	Et	H	H	-	H	H	T7	158-160
1-58.	Et	H	H	-	H	Na	T7	
1-59.	Et	H	H	-	H	H	T8	
1-60.	Et	H	H	-	H	Na	T8	
1-61.	Et	H	H	-	H	H	T9	
1-62.	Et	H	H	-	H	Na	T9	
1-63.	Et	H	H	-	H	H	T10	
1-64.	Et	H	H	-	H	Na	T10	
1-65.	Et	H	H	-	H	H	T11	
1-66.	Et	H	H	-	H	Na	T11	
1-67.	Et	H	H	-	H	H	T12	
1-68.	Et	H	H	-	H	Na	T12	
1-69.	Et	H	H	-	H	H	T13	
1-70.	Et	H	H	-	H	Na	T13	
1-71.	Et	H	H	-	H	H	T14	
1-72.	Et	H	H	-	H	Na	T14	
1-73.	Et	H	H	-	H	H	T15	
1-74.	Et	H	H	-	H	Na	T15	
1-75.	i-Pr	H	H	-	H	H	T1	
1-76.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T1	
1-77.	i-Pr	H	H	-	H	H	T2	
1-78.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T2	
1-79.	i-Pr	H	H	-	H	H	T5	
1-80.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T5	
1-81.	i-Pr	H	H	-	H	H	T6	
1-82.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T6	
1-83.	i-Pr	H	H	-	H	H	T7	
1-84.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T7	
1-85.	Allyl	H	H	-	H	H	T1	
1-86.	Allyl	H	H	-	H	Na	T1	
1-87.	Allyl	H	H	-	H	H	T2	
1-88.	Allyl	H	H	-	H	Na	T2	
1-89.	Allyl	H	H	-	H	H	T5	
1-90.	Allyl	H	H	-	H	Na	T5	
1-91.	Allyl	H	H	-	H	H	T6	
1-92.	Allyl	H	H	-	H	Na	T6	
1-93.	Allyl	H	H	-	H	H	T7	
1-94.	Allyl	H	H	-	H	Na	T7	

Bsp. Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	Smp.
1-95.	3-Oxetanyl	H	H	-	H	H	T1	
1-96.	3-Oxetanyl	H	H	-	H	Na	T1	
1-97.	3-Oxetanyl	H	H	-	H	H	T2	
1-98.	3-Oxetanyl	H	H	-	H	Na	T2	
1-99.	3-Oxetanyl	H	H	-	H	H	T5	
1-100.	3-Oxetanyl	H	H	-	H	Na	T5	
1-101.	3-Oxetanyl	H	H	-	H	H	T6	
1-102.	3-Oxetanyl	H	H	-	H	Na	T6	
1-103.	3-Oxetanyl	H	H	-	H	H	T7	
1-104.	3-Oxetanyl	H	H	-	H	Na	T7	
1-105.	Me	Me	H	-	H	H	T1	
1-106.	Me	Me	H	-	H	Na	T1	
1-107.	Me	Me	H	-	H	H	T2	
1-108.	Me	Me	H	-	H	Na	T2	
1-109.	Me	Me	H	-	H	H	T6	
1-110.	Me	Me	H	-	H	Na	T6	
1-111.	Me	Me	H	-	H	H	T7	
1-112.	Me	Me	H	-	H	Na	T7	
1-113.	Et	Me	H	-	H	H	T1	
1-114.	Et	Me	H	-	H	Na	T1	
1-115.	Et	Me	H	-	H	H	T2	
1-116.	Et	Me	H	-	H	Na	T2	
1-117.	i-Pr	Me	H	-	H	H	T1	
1-118.	i-Pr	Me	H	-	H	Na	T1	
1-119.	i-Pr	Me	H	-	H	H	T2	
1-120.	i-Pr	Me	H	-	H	Na	T2	
1-121.	Allyl	Me	H	-	H	H	T1	
1-122.	Allyl	Me	H	-	H	Na	T1	
1-123.	Allyl	Me	H	-	H	H	T2	
1-124.	Allyl	Me	H	-	H	Na	T2	
1-125.	3-Oxetanyl	Me	H	-	H	H	T1	
1-126.	3-Oxetanyl	Me	H	-	H	Na	T1	
1-127.	3-Oxetanyl	Me	H	-	H	H	T2	
1-128.	3-Oxetanyl	Me	H	-	H	Na	T2	
1-129.	Me	Et	H	-	H	H	T1	
1-130.	Me	Et	H	-	H	Na	T1	
1-131.	Me	Et	H	-	H	H	T2	
1-132.	Me	Et	H	-	H	Na	T2	
1-133.	Me	Et	H	-	H	H	T6	
1-134.	Me	Et	H	-	H	Na	T6	
1-135.	Me	Et	H	-	H	H	T7	
1-136.	Me	Et	H	-	H	Na	T7	
1-137.	Et	Et	H	-	H	H	T1	
1-138.	Et	Et	H	-	H	Na	T1	
1-139.	Et	Et	H	-	H	H	T2	
1-140.	Et	Et	H	-	H	Na	T2	
1-141.	i-Pr	Et	H	-	H	H	T1	
1-142.	i-Pr	Et	H	-	H	Na	T1	
1-143.	i-Pr	Et	H	-	H	H	T2	
1-144.	i-Pr	Et	H	-	H	Na	T2	
1-145.	Allyl	Et	H	-	H	H	T1	
1-146.	Allyl	Et	H	-	H	Na	T1	
1-147.	Allyl	Et	H	-	H	H	T2	
1-148.	Allyl	Et	H	-	H	Na	T2	
1-149.	3-Oxetanyl	Et	H	-	H	H	T1	
1-150.	3-Oxetanyl	Et	H	-	H	Na	T1	

Bsp. Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	Smp.
1-151.	3-Oxetanyl	Et	H	-	H	H	T2	
1-152.	3-Oxetanyl	Et	H	-	H	Na	T2	
1-153.	Me	i-Pr	H	-	H	H	T1	165-167
1-154.	Me	i-Pr	H	-	H	Na	T1	124-126
1-155.	Me	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-156.	Me	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-157.	Me	i-Pr	H	-	H	H	T6	
1-158.	Me	i-Pr	H	-	H	Na	T6	
1-159.	Me	i-Pr	H	-	H	H	T7	
1-160.	Me	i-Pr	H	-	H	Na	T7	
1-161.	Et	i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-162.	Et	i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-163.	Et	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-164.	Et	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-165.	i-Pr	i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-166.	i-Pr	i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-167.	i-Pr	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-168.	i-Pr	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-169.	Allyl	i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-170.	Allyl	i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-171.	Allyl	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-172.	Allyl	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-173.	3-Oxetanyl	i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-174.	3-Oxetanyl	i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-175.	3-Oxetanyl	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-176.	3-Oxetanyl	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-177.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-178.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-179.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-180.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-181.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T6	
1-182.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T6	
1-183.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T7	
1-184.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T7	
1-185.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-186.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-187.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-188.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-189.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T6	
1-190.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T6	
1-191.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T7	
1-192.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T7	
1-193.	i-Pr	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-194.	i-Pr	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-195.	i-Pr	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-196.	i-Pr	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-197.	Allyl	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-198.	Allyl	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-199.	Allyl	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-200.	Allyl	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-201.	3-Oxetanyl	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-202.	3-Oxetanyl	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-203.	3-Oxetanyl	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-204.	3-Oxetanyl	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-205.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-206.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	

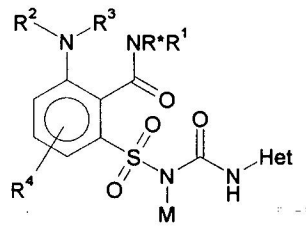
Bsp. Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	Smp.
1-207.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-208.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-209.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T6	
1-210.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T6	
1-211.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T7	
1-212.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T7	
1-213.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-214.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	
1-215.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-216.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-217.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T6	
1-218.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T6	
1-219.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T7	
1-220.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T7	
1-221.	i-Pr	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-222.	i-Pr	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	
1-223.	i-Pr	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-224.	i-Pr	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-225.	Allyl	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-226.	Allyl	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	
1-227.	Allyl	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-228.	Allyl	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-229.	3-Oxetanyl	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-230.	3-Oxetanyl	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	
1-231.	3-Oxetanyl	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-232.	3-Oxetanyl	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-233.	Me	Allyl	H	-	H	H	T1	
1-234.	Me	Allyl	H	-	H	Na	T1	
1-235.	Me	Allyl	H	-	H	H	T2	
1-236.	Me	Allyl	H	-	H	Na	T2	
1-237.	Me	Allyl	H	-	H	H	T6	
1-238.	Me	Allyl	H	-	H	Na	T6	
1-239.	Me	Allyl	H	-	H	H	T7	
1-240.	Me	Allyl	H	-	H	Na	T7	
1-241.	Et	Allyl	H	-	H	H	T1	
1-242.	Et	Allyl	H	-	H	Na	T1	
1-243.	Et	Allyl	H	-	H	H	T2	
1-244.	Et	Allyl	H	-	H	Na	T2	
1-245.	Et	Allyl	H	-	H	H	T6	
1-246.	Et	Allyl	H	-	H	Na	T6	
1-247.	Et	Allyl	H	-	H	H	T7	
1-248.	Et	Allyl	H	-	H	Na	T7	
1-249.	i-Pr	Allyl	H	-	H	H	T1	
1-250.	i-Pr	Allyl	H	-	H	Na	T1	
1-251.	i-Pr	Allyl	H	-	H	H	T2	
1-252.	i-Pr	Allyl	H	-	H	Na	T2	
1-253.	Allyl	Allyl	H	-	H	H	T1	
1-254.	Allyl	Allyl	H	-	H	Na	T1	
1-255.	Allyl	Allyl	H	-	H	H	T2	
1-256.	Allyl	Allyl	H	-	H	Na	T2	
1-257.	3-Oxetanyl	Allyl	H	-	H	H	T1	
1-258.	3-Oxetanyl	Allyl	H	-	H	Na	T1	
1-259.	3-Oxetanyl	Allyl	H	-	H	H	T2	
1-260.	3-Oxetanyl	Allyl	H	-	H	Na	T2	
1-261.	Me	Propargyl	H	-	H	H	T1	
1-262.	Me	Propargyl	H	-	H	Na	T1	

Bsp. Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	Smp.
1-263.	Me	Propargyl	H	-	H	H	T2	
1-264.	Me	Propargyl	H	-	H	Na	T2	
1-265.	Me	Propargyl	H	-	H	H	T6	
1-266.	Me	Propargyl	H	-	H	Na	T6	
1-267.	Me	Propargyl	H	-	H	H	T7	
1-268.	Me	Propargyl	H	-	H	Na	T7	
1-269.	Et	Propargyl	H	-	H	H	T1	
1-270.	Et	Propargyl	H	-	H	Na	T1	
1-271.	Et	Propargyl	H	-	H	H	T2	
1-272.	Et	Propargyl	H	-	H	Na	T2	
1-273.	Et	Propargyl	H	-	H	H	T6	
1-274.	Et	Propargyl	H	-	H	Na	T6	
1-275.	Et	Propargyl	H	-	H	H	T7	
1-276.	Et	Propargyl	H	-	H	Na	T7	
1-277.	i-Pr	Propargyl	H	-	H	H	T1	
1-278.	i-Pr	Propargyl	H	-	H	Na	T1	
1-279.	i-Pr	Propargyl	H	-	H	H	T2	
1-280.	i-Pr	Propargyl	H	-	H	Na	T2	
1-281.	Allyl	Propargyl	H	-	H	H	T1	
1-282.	Allyl	Propargyl	H	-	H	Na	T1	
1-283.	Allyl	Propargyl	H	-	H	H	T2	
1-284.	Allyl	Propargyl	H	-	H	Na	T2	
1-285.	3-Oxetanyl	Propargyl	H	-	H	H	T1	
1-286.	3-Oxetanyl	Propargyl	H	-	H	Na	T1	
1-287.	3-Oxetanyl	Propargyl	H	-	H	H	T2	
1-288.	3-Oxetanyl	Propargyl	H	-	H	Na	T2	
1-289.	Me	OMe	H	-	H	H	T1	
1-290.	Me	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-291.	Me	OMe	H	-	H	H	T2	
1-292.	Me	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-293.	Me	OMe	H	-	H	H	T6	
1-294.	Me	OMe	H	-	H	Na	T6	
1-295.	Me	OMe	H	-	H	H	T7	
1-296.	Me	OMe	H	-	H	Na	T7	
1-297.	Et	OMe	H	-	H	H	T1	
1-298.	Et	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-299.	Et	OMe	H	-	H	H	T2	
1-300.	Et	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-301.	Et	OMe	H	-	H	H	T6	
1-302.	Et	OMe	H	-	H	Na	T6	
1-303.	Et	OMe	H	-	H	H	T7	
1-304.	Et	OMe	H	-	H	Na	T7	
1-305.	i-Pr	OMe	H	-	H	H	T1	
1-306.	i-Pr	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-307.	i-Pr	OMe	H	-	H	H	T2	
1-308.	i-Pr	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-309.	Allyl	OMe	H	-	H	H	T1	
1-310.	Allyl	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-311.	Allyl	OMe	H	-	H	H	T2	
1-312.	Allyl	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-313.	3-Oxetanyl	OMe	H	-	H	H	T1	
1-314.	3-Oxetanyl	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-315.	3-Oxetanyl	OMe	H	-	H	H	T2	
1-316.	3-Oxetanyl	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-317.	Me	NMe_2	H	-	H	H	T1	
1-318.	Me	NMe_2	H	-	H	Na	T1	

Bsp. Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	Smp.
1-319.	Me	NMe_2	H	-	H	H	T2	
1-320.	Me	NMe_2	H	-	H	Na	T2	
1-321.	Me	NHCHO	H	-	H	H	T1	
1-322.	Me	NHCHO	H	-	H	Na	T1	
1-323.	Me	NHCHO	H	-	H	H	T2	
1-324.	Me	NHCHO	H	-	H	Na	T2	
1-325.	Me	NHC(O)Me	H	-	H	H	T1	
1-326.	Me	NHC(O)Me	H	-	H	Na	T1	
1-327.	Me	NHC(O)Me	H	-	H	H	T2	
1-328.	Me	NHC(O)Me	H	-	H	Na	T2	
1-329.	Me	$NHSO_2Me$	H	-	H	H	T1	
1-330.	Me	$NHSO_2Me$	H	-	H	Na	T1	
1-331.	Me	$NHSO_2Me$	H	-	H	H	T2	
1-332.	Me	$NHSO_2Me$	H	-	H	Na	T2	
1-333.	Me	CH_2Ph	H	-	H	H	T1	
1-334.	Me	CH_2Ph	H	-	H	Na	T1	
1-335.	Me	CH_2Ph	H	-	H	H	T2	
1-336.	Me	CH_2Ph	H	-	H	Na	T2	
1-337.	Me	CH_2OMe	H	-	H	H	T1	
1-338.	Me	CH_2OMe	H	-	H	Na	T1	
1-339.	Me	CH_2OMe	H	-	H	H	T2	
1-340.	Me	CH_2OMe	H	-	H	Na	T2	
1-341.	Me	$CH_2C(O)Me$	H	-	H	H	T1	
1-342.	Me	$CH_2C(O)Me$	H	-	H	Na	T1	
1-343.	Me	$CH_2C(O)Me$	H	-	H	H	T2	
1-344.	Me	$CH_2C(O)Me$	H	-	H	Na	T2	
1-345.	Me	$CH_2C(O)OMe$	H	-	H	H	T1	
1-346.	Me	$CH_2C(O)OMe$	H	-	H	Na	T1	
1-347.	Me	$CH_2C(O)OMe$	H	-	H	H	T2	
1-348.	Me	$CH_2C(O)OMe$	H	-	H	Na	T2	
1-349.	Me	Me	Me	-	H	H	T1	
1-350.	Me	Me	Me	-	H	Na	T1	
1-351.	Me	Me	Me	-	H	H	T2	
1-352.	Me	Me	Me	-	H	Na	T2	
1-353.	Me	Me	Me	-	H	H	T6	
1-354.	Me	Me	Me	-	H	Na	T6	
1-355.	Me	Me	Me	-	H	H	T7	
1-356.	Me	Me	Me	-	H	Na	T7	
1-357.	Me	Me	Et	-	H	H	T1	
1-358.	Me	Me	Et	-	H	Na	T1	
1-359.	Me	Me	Et	-	H	H	T2	
1-360.	Me	Me	Et	-	H	Na	T2	
1-361.	Me	Me	i-Pr	-	H	H	T1	
1-362.	Me	Me	i-Pr	-	H	Na	T1	
1-363.	Me	Me	i-Pr	-	H	H	T2	
1-364.	Me	Me	i-Pr	-	H	Na	T2	
1-365.	Me	Et	Et	-	H	H	T1	207-209
1-366.	Me	Et	Et	-	H	Na	T1	
1-367.	Me	Et	Et	-	H	H	T2	
1-368.	Me	Et	Et	-	H	Na	T2	
1-369.	Me	i-Pr	i-Pr	-	H	H	T1	
1-370.	Me	i-Pr	i-Pr	-	H	Na	T1	
1-371.	Me	i-Pr	i-Pr	-	H	H	T2	
1-372.	Me	i-Pr	i-Pr	-	H	Na	T2	
1-373.	Me	CH_2i-Pr	CH_2i-Pr	-	H	H	T1	166-167
1-374.	Me	CH_2i-Pr	CH_2i-Pr	-	H	Na	T1	215-217

Bsp. Nr.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	Smp.
1-375.	Me	CH_2i-Pr	CH_2i-Pr	-	H	H	T2	
1-376.	Me	CH_2i-Pr	CH_2i-Pr	-	H	Na	T2	
1-377.	Me			-	H	H	T1	
1-378.	Me	"		-	H	Na	T1	
1-379.	Me	"		-	H	H	T2	
1-380.	Me	"		-	H	Na	T2	
1-381.	Me			-	H	H	T1	
1-382.	Me	"		-	H	Na	T1	
1-383.	Me	"		-	H	H	T2	
1-384.	Me	"		-	H	Na	T2	
1-385.	Me	H	H	5-Me	H	H	T1	
1-386.	Me	H	H	5-Me	H	Na	T1	
1-387.	Me	H	H	5-Me	H	H	T2	
1-388.	Me	H	H	5-Me	H	Na	T2	
1-389.	Me	H	H	5-F	H	H	T1	
1-390.	Me	H	H	5-F	H	Na	T1	
1-391.	Me	H	H	5-F	H	H	T2	
1-392.	Me	H	H	5-F	H	Na	T2	
1-393.	Me	H	H	5-Cl	H	H	T1	
1-394.	Me	H	H	5-Cl	H	Na	T1	
1-395.	Me	H	H	5-Cl	H	H	T2	
1-396.	Me	H	H	5-Cl	H	Na	T2	
1-397.	Me	H	H	5-OMe	H	H	T1	
1-398.	Me	H	H	5-OMe	H	Na	T1	
1-399.	Me	H	H	5-OMe	H	H	T2	
1-400.	Me	H	H	5-OMe	H	Na	T2	
1-401.	Me	H	H	5-NO_2	H	H	T1	
1-402.	Me	H	H	5-NO_2	H	Na	T1	
1-403.	Me	H	H	5-NO_2	H	H	T2	
1-404.	Me	H	H	5-NO_2	H	Na	T2	
1-405.	Me	H	H	6-Me	H	H	T1	
1-406.	Me	H	H	6-Me	H	Na	T1	
1-407.	Me	H	H	6-Me	H	H	T2	
1-408.	Me	H	H	6-Me	H	Na	T2	
1-409.	Me	H	H	6-Cl	H	H	T1	
1-410.	Me	H	H	6-Cl	H	Na	T1	
1-411.	Me	H	H	6-Cl	H	H	T2	
1-412.	Me	H	H	6-Cl	H	Na	T2	

Tabelle 2: Verbindungen der Formel (Ib)



(Ib)

Bsp. Nr.	R^1	R*	R^2	R^3	R^4	M	Het	Smp.
2-1.	H	H	H	H	-	H	T1	
2-2.	H	H	H	H	-	Na	T1	
2-3.	H	H	H	H	-	H	T2	
2-4.	H	H	H	H	-	Na	T2	
2-5.	Me	Me	H	H	-	H	T1	
2-6.	Me	Me	H	H	-	Na	T1	
2-7.	Me	Me	H	H	-	H	T2	
2-8.	Me	Me	H	H	-	Na	T2	
2-9.	Me	Me	H	H	-	H	T5	
2-10.	Me	Me	H	H	-	Na	T5	
2-11.	Me	Me	H	H	-	H	T6	
2-12.	Me	Me	H	H	-	Na	T6	
2-13.	Me	Me	H	H	-	H	T7	
2-14.	Me	Me	H	H	-	Na	T7	
2-15.	Me	Me	Me	H	-	H	T1	
2-16.	Me	Me	Me	H	-	Na	T1	
2-17.	Me	Me	Me	H	-	H	T2	
2-18.	Me	Me	Me	H	-	Na	T2	
2-19.	Me	Me	Me	H	-	H	T5	
2-20.	Me	Me	Me	H	-	Na	T5	
2-21.	Me	Me	Me	H	-	H	T6	
2-22.	Me	Me	Me	H	-	Na	T6	
2-23.	Me	Me	Me	H	-	H	T7	
2-24.	Me	Me	Me	H	-	Na	T7	
2-25.	Me	Me	H	H	5-Me	H	T1	
2-26.	Me	Me	H	H	5-Me	Na	T1	
2-27.	Me	Me	H	H	5-Me	H	T2	
2-28.	Me	Me	H	H	5-Me	Na	T2	
2-29.	Me	Me	H	H	5-F	H	T1	
2-30.	Me	Me	H	H	5-F	Na	T1	
2-31.	Me	Me	H	H	5-F	H	T2	
2-32.	Me	Me	H	H	5-F	Na	T2	
2-33.	Me	Me	H	H	5-Cl	H	T1	
2-34.	Me	Me	H	H	5-Cl	Na	T1	
2-35.	Me	Me	H	H	5-OMe	H	T1	
2-36.	Me	Me	H	H	5-OMe	Na	T1	
2-37.	Me	Me	H	H	5-NO_2	H	T1	
2-38.	Me	Me	H	H	5-NO_2	Na	T1	
2-39.	Me	Me	H	H	6-Me	H	T1	
2-40.	Me	Me	H	H	6-Me	Na	T1	
2-41.	Me	Me	H	H	6-Cl	H	T1	
2-42.	Me	Me	H	H	6-Cl	Na	T1	
2-43.	Me	Me	Me	H	5-Me	H	T1	
2-44.	Me	Me	Me	H	5-Me	Na	T1	
2-45.	Me	Me	Me	H	5-Cl	H	T1	
2-46.	Me	Me	Me	H	5-Cl	Na	T1	
2-47.	Me	Me	Me	H	5-OMe	H	T1	
2-48.	Me	Me	Me	H	5-OMe	Na	T1	
2-49.	Me	Me	Me	H	5-NO_2	H	T1	
2-50.	Me	Me	Me	H	5-NO_2	Na	T1	
2-51.	Me	Me	Me	H	6-Me	H	T1	
2-52.	Me	Me	Me	H	6-Me	Na	T1	
2-53.	Me	Me	Me	H	6-Cl	H	T1	
2-54.	Me	Me	Me	H	6-Cl	Na	T1	

B. Formulierungsbeispiele

a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.

b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I), 64 Gew.-Teile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gewichtsteile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.

c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat wird erhalten, indem man 20 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) mit 6 Gew.-Teilen Alkylphenolpolyglykolether (®Triton X 207), 3 Gew.-Teilen Isotridecanolpolyglykolether (8 EO) und 71 Gew.-Teilen paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z.B. ca. 255 bis über 277 C) mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.

d) Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus 15 Gew.-Teilen einer Verbindung der Formel (I), 75 Gew.-Teilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertes Nonylphenol als Emulgator.

e) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird erhalten indem man
75 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I),
10 Gew.-Teile ligninsulfonsaures Calcium,
5 Gew.-Teile Natriumlaurylsulfat,
3 Gew.-Teile Polyvinylalkohol und
7 Gew.-Teile Kaolin
mischt, auf einer Stiftmühle mahlt und das Pulver in einem Wirbelbett durch Aufsprühen von Wasser als Granulierflüssigkeit granuliert.

f) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird auch erhalten, indem man
25 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I),
5 Gew.-Teile 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium
2 Gew.-Teile oleoylmethyltaurinsaures Natrium,
1 Gew.-Teil Polyvinylalkohol,
17 Gew.-Teile Calciumcarbonat und
50 Gew.-Teile Wasser
auf einer Kolloidmühle homogenisiert und vorzerkleinert, anschließend auf einer Perlmühle mahlt und die so erhaltene Suspension in einem Sprühturm mittels einer Einstoffdüse zerstäubt und trocknet.

C. Biologische Beispiele

1. Unkrautwirkung im Vorauflauf

Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Unkrautpflanzen wurden in Papptöpfen in sandiger Lehmerde ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Die in Form von benetzbaren Pulvern oder Emulsionskonzentraten formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen wurden dann als wäßrige Suspensionen bzw. Emulsionen mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 l/ha in unterschiedlichen Dosierungen auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert.

Nach der Behandlung wurden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten Wachstumsbedingungen für die Unkräuter gehalten. Die optische Bonitur der Pflanzen- bzw. Auflaufschäden erfolgte nach dem Auflaufen der Versuchspflanzen nach einer Versuchszeit von 3 bis 4 Wochen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen. Wie die Ergebnisse zeigen, weisen erfindungsgemäße Verbindungen eine gute herbizide Vorauflaufwirksamkeit gegen ein breites Spektrum von Ungräsern und Unkräutern auf. Beispielsweise haben die Beispiele Nr. 1-11, 1-15,

1-23, 1-25, 1-45, 1-47, 1-55, 1-57, 1-153, 1-154, 1-365, 1-373, 1-374 und andere Verbindungen aus Tabellen 1 und 2 sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen wie Sinapis alba, Chrysanthemum segetum, Avena sativa, Stellaria media, Echinochloa crus-galli, Lolium multiflorum, Setaria spp., Abutilon theophrasti, Amaranthus retroflexus und Panicum miliaceum im Vorauflaufverfahren bei einer Aufwandmenge von 0.3 kg und weniger Aktivsubstanz pro Hektar.

2. Unkrautwirkung im Nachauflauf

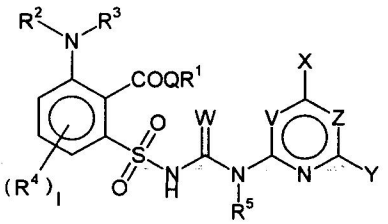
Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Unkräutern wurden in Plastiktöpfen in sandigem Lehmboden ausgelegt, mit Erde abgedeckt und im Gewächshaus unter guten Wachstumsbedingungen angezogen. Drei Wochen nach der Aussaat wurden die Versuchspflanzen im Dreiblattstadium behandelt. Die als Spritzpulver bzw. als Emulsionskonzentrate formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen wurden in verschiedenen Dosierungen mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 l/ha auf die grünen Pflanzenteile gesprüht. Nach ca. 3 bis 4 Wochen Standzeit der Versuchspflanzen im Gewächshaus unter optimalen Wachstumsbedingungen wurde die Wirkung der Präparate optisch im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen bonitiert. Die erfindungsgemäßen Mittel weisen auch im Nachauflauf eine gute herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger Ungräser und Unkräuter auf. Beispielsweise haben die Beispiele Nr. 1-11, 1-15, 1-23, 1-25, 1-45, 1-47, 1-55, 1-57, 1-153, 1-154, 1-365, 1-373, 1-374 und andere Verbindungen aus Tabellen 1 und 2 sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen wie Sinapis alba, Echinochloa crus-galli, Lolium multiflorum, Chrysanthemum segetum, Setaria spp., Abutilon theophrasti, Amaranthus retroflexus, Panicum miliaceum und Avena sativa im Nachauflaufverfahren bei einer Aufwandmenge von 0.3 kg und weniger Aktivsubstanz pro Hektar.

3. Kulturpflanzenverträglichkeit

In weiteren Versuchen im Gewächshaus wurden Samen einer größeren Anzahl von Kulturpflanzen und Unkräutern in sandigem Lehmboden ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Ein Teil der Töpfe wurde sofort wie unter Abschnitt 1 beschrieben behandelt, die übrigen im Gewächshaus aufgestellt, bis die Pflanzen zwei bis drei echte Blätter entwickelt haben und dann wie unter Abschnitt 2 beschrieben mit den erfindungsgemäßen Substanzen der Formel (I) in unterschiedlichen Dosierungen besprüht. Vier bis fünf Wochen nach der Applikation und Standzeit im Gewächshaus wurde mittels optischer Bonitur festgestellt, daß erfindungsgemäße Verbindungen zweikeimblättrige Kulturen wie Soja, Baumwolle, Raps, Zuckerrüben oder Kartoffeln im Vor- und Nachauflaufverfahren selbst bei hohen Wirkstoffdosierungen ungeschädigt ließen. Einige Substanzen schonten darüber hinaus auch Gramineen-Kulturen wie Gerste, Weizen, Roggen, Hirsen, Mais oder Reis. Die Verbindungen der Formel (I) zeigen teilweise eine hohe Selektivität und eignen sich deshalb zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Kulturen.

Patentansprüche:

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



(I)

worin

R^1 ein Wasserstoffatom, ein Kohlenwasserstoffrest oder ein Heterocyclylrest bedeutet, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 30 C-Atome aufweist,

R^2 eine Gruppe der Formel R^0-Q^0-, worin

R^0 ein Wasserstoffatom, ein Kohlenwasserstoffrest oder ein Heterocyclylrest bedeutet, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 30 C-Atome aufweist, und

Q^0 eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel -O- oder –N($R^\#$)- bedeutet, wobei $R^\#$ ein Wasserstoffatom, ein Acylrest oder ein Kohlenwasserstoffrest bedeutet und wobei der letztgenannte Rest unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 30 C-Atome, aufweist,

R^3 ein Wasserstoffatom, ein Kohlenwasserstoffrest oder ein Heterocyclylrest bedeutet, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 30 C-Atome, aufweist, oder

R^4 unabhängig voneinander Halogen, OH, SH, ein kohlenstoffreier stickstoffhaltiger Rest oder ein kohlenstoffhaltiger Rest, der 1 bis 30 C-Atome aufweist, bedeuten,

l 0, 1, 2 oder 3, vorzugsweise 0 oder 1 ist,

R^5 ein Wasserstoffatom oder ein Kohlenwasserstoffrest bedeutet, der unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 20 C-Atome aufweist,

Q O, S oder NR* ist,

R* ein Wasserstoffatom oder ein Kohlenwasserstoffrest bedeutet, der unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 20 C-Atome aufweist,

W ein Sauerstoff- oder Schwefelatom,

X,Y unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkoxy und (C_1-C_4)Alkylthio substituiert ist, oder Mono- oder Di[(C_1-C_4)alkyl]amino, (C_2-C_6)Alkenyl, (C_2-C_6)Alkinyl, (C_3-C_6)Alkenyloxy oder (C_3-C_6)Alkinyloxy bedeuten, und

V, Z unabhängig voneinander CH oder N bedeuten.

2. Verbindung der Formel (I) oder deren Salze nach Anspruch 1, worin

R^1 H, (C_1-C_6)Alkyl, (C_3-C_6)Alkenyl, (C_3-C_6)Alkinyl, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, unsubstituiertes und substituiertes Phenyl, unsubstituiertes und substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen, unsubstituiertes und substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl und [(C_1-C_4)Haloalkoxy]carbonyl, substituiert ist, oder unsubstituiertes oder substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkyl, substituiertes oder unsubstituiertes (C_3-C_6)Cycloalkenyl,unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen,

wobei substituiertes Phenyl, substituiertes Heterocyclyl, substituiertes Cycloalkyl oder substituiertes Cycloalkenyl als Substituenten einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl,

$(C_1$-$C_4)$Alkoxy-$(C_1$-$C_4)$alkyl, Di[$(C_1$-$C_4)$alkoxy]$(C_1$-$C_4)$alkyl, $(C_1$-$C_4)$Haloalkoxy, $(C_1$-$C_4)$ Alkylthio, $(C_1$-$C_4)$Alkylsulfinyl, $(C_1$-$C_4)$Haloalkylsulfinyl, $(C_1$-$C_4)$Alkylsulfonyl, $(C_1$-$C_4)$Haloalkylsulfonyl, NR^8R^9, [$(C_1$-$C_4)$Alkoxy]carbonyl, [$(C_1$-$C_4)$Haloalkoxy]carbonyl, [$(C_1$-$C_4)$Alkyl]carbonyl, OH, Phenyl, CN und NO_2 trägt und

R^2 eine Gruppe der Formel R^0-Q^0-,

worin R^0 ein Wasserstoffatom, $(C_1$-$C_{12})$Alkyl, $(C_2$-$C_{12})$Alkenyl oder $(C_2$-$C_{12})$Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten drei Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1$-$C_6)$Alkoxy, $(C_1$-$C_6)$Haloalkoxy, $(C_1$-$C_6)$Alkylthio, $(C_1$-$C_6)$Haloalkylthio, $(C_1$-$C_6)$Alkylsulfinyl, $(C_1$-$C_6)$Haloalkylsulfinyl, $(C_1$-$C_6)$Alkylsulfonyl, $(C_1$-$C_6)$Haloalkylsulfonyl, [$(C_1$-$C_6)$Alkoxy]carbonyl, [$(C_1$-$C_6)$Haloalkoxy]carbonyl, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, SH, $(C_3$-$C_6)$Cycloalkyl, NR^8R^9, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl substituiert ist, oder $(C_3$-$C_6)$Cycloalkyl, $(C_3$-$C_6)$Cycloalkenyl, Phenyl oder Heterocyclyl, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen, wobei die vier zuletzt genannten Reste unsubstituiert oder substituiert sein können, bedeutet und

worin Q^0 eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel -O- oder -N($R^\#$)- bedeutet, wobei $R^\#$ ein Wasserstoffatom, ein Acylrest oder $(C_1$-$C_{12})$Alkyl, $(C_2$-$C_{12})$Alkenyl oder $(C_2$-$C_{12})$Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1$-$C_6)$Alkoxy, $(C_1$-$C_6)$Haloalkoxy, $(C_1$-$C_6)$-Alkylthio, $(C_1$-$C_6)$-Haloalkylthio, CN, OH, $(C_3$-$C_6)$Cycloalkyl, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl substituiert ist, oder unsubstituiertes oder substituiertes $(C_3$-$C_6)$Cycloalkyl, unsubstituiertes oder substituiertes $(C_3$-$C_6)$Cycloalkenyl, oder unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl bedeutet, und R^0 und $R^\#$ gemeinsam mit dem N-Atom der $NR^\#R^\circ$-Gruppe einen Heterocyclylrest, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen bilden können, der unsubstituiert oder

substituiert ist, vorzugsweise durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1$-$C_6)$Alkyl, $(C_1$-$C_6)$Alkoxy, [$(C_1$-$C_6)$Alkoxy]carbonyl, $(C_1$-$C_6)$Haloalkyl und Oxo,

R^3 ein Wasserstoffatom, $(C_1$-$C_{12})$Alkyl, $(C_2$-$C_{12})$Alkenyl oder $(C_2$-$C_{12})$Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1$-$C_6)$Alkoxy, $(C_1$-$C_6)$Haloalkoxy, $(C_1$-$C_6)$-Alkylthio, $(C_1$-$C_6)$-Haloalkylthio, $(C_1$-$C_6)$Alkylsulfinyl, $(C_1$-$C_6)$Haloalkylsulfinyl, $(C_1$-$C_6)$Alkylsulfonyl, $(C_1$-$C_6)$Haloalkylsulfonyl, [$(C_1$-$C_6)$Alkoxy]carbonyl, [$(C_1$-$C_6)$Haloalkoxy]carbonyl, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, $(C_3$-$C_6)$Cycloalkyl, NR^8R^9, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl substituiert ist, oder unsubstituiertes oder substituiertes $(C_3$-$C_6)$Cycloalkyl, unsubstituiertes oder substituiertes $(C_3$-$C_6)$Cycloalkenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen, oder unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl bedeutet, und

R^2 und R^3 gemeinsam mit dem N-Atom der NR^2R^3-Gruppe (N^1) einen Heterocyclylrest, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen bilden können, der unsubstituiert oder substituiert ist, vorzugsweise durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1$-$C_6)$Alkyl, $(C_1$-$C_6)$Alkoxy, [$(C_1$-$C_6)$Alkoxy]carbonyl, $(C_1$-$C_6)$Haloalkyl und Oxo, wobei sich der Oxo-Rest vorzugsweise nicht in Nachbarposition zum N-Atom (N^1) befindet, und

R^4 unabhängig voneinander Halogen, CN, $(C_1$-$C_4)$Alkyl, $(C_1$-$C_4)$Alkoxy, $(C_2$-$C_6)$Alkenyl, $(C_2$-$C_6)$Alkinyl, $(C_3$-$C_6)$Alkenyloxy, $(C_3$-$C_6)$Alkinyloxy, wobei jeder der letztgenannten 6 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1$-$C_6)$Alkoxy, $(C_1$-$C_6)$Haloalkoxy, $(C_1$-$C_6)$-Alkylthio, $(C_1$-$C_6)$-Haloalkylthio, $(C_1$-$C_6)$Alkylsulfinyl, $(C_1$-$C_6)$Haloalkylsulfinyl, $(C_1$-$C_6)$Alkylsulfonyl, $(C_1$-$C_6)$Haloalkylsulfonyl, [$(C_1$-$C_6)$Alkoxy]carbonyl, [$(C_1$-$C_6)$Haloalkoxy]carbonyl, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, $(C_3$-$C_6)$Cycloalkyl, NR^8R^9, unsubstituiertes oder substituiertes

Phenyl oder unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl, substituiert ist, oder unsubstituiertes oder substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkyl, unsubstituiertes oder substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl oder [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl bedeuten, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder im Alkylteil durch ein oder mehrere Halogenatome substituiert ist, oder ein Rest der Formel C(O)-NR'-R'', C(S)-NR'-R'', CR'=N-Q^1-R'', $S(O)_m$-Q^1-R'''', $P(O)_n$(-Q^1-R''''Q^2-R''), NR'-Q^1-R'' oder NR'''-N=CR'-R'' bedeuten, wobei R', R'' und R''' unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, einen Acylrest oder einen unsubstituierten oder substituierten (C_1-C_{10})Kohlenstoffwasserstoffrest, R'''' einen kohlenstoffhaltigen Acylrest oder einen unsubstituierten oder substituierten (C_1-C_{10})Kohlenstoffwasserstoffrest, und Q^1 und Q^2 unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel -O- oder -N(R^+)- bedeuten, wobei R^+ ein Wasserstoffatom, ein Acylrest oder ein unsubstituierter oder substituierter (C_1-C_{10})Kohlenwasserstoffrest bedeutet, und m = 0, 1, 2 oder 3, sowie n = 0, 1 oder 2 sein kann, und R' mit R'', R^+ mit R', R^+ mit R'' oder R^+ mit R'''' jeweils einen Heterocyclylrest, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen bilden kann,
der unsubstituiert oder substituiert ist, vorzugsweise durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkyl, (C_1-C_6)Alkoxy, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, (C_1-C_6)Haloalkyl und Oxo,

l gleich 0, 1 oder 2, vorzugsweise 0 oder 1 ist,

R^5 H oder C_1-C_4(Alkyl) ist, das unsubstituiert oder substituiert ist,

R^6 und R^7 unabhängig voneinander H, (C_1-C_6)Alkyl, (C_3-C_6)Alkenyl, (C_3-C_6)Alkinyl, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl oder unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl bedeuten oder

R^6 und R^7 gemeinsam mit dem N-Atom der NR^6R^7-Gruppe einen Heterocyclylrest mit 5 oder 6 Ringatomen bilden können, der gegebenenfalls eines oder mehrere zusätzliche Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach durch Reste aus der Gruppe (C_1-C_4)Alkyl und Oxo substituiert ist, und

R^8 und R^9 unabhängig voneinander (C_1-C_4)Alkylcarbonyl, (C_1-C_4)Haloalkylcarbonyl, (C_1-C_4)Alkoxycarbonyl oder (C_1-C_4)Alkylsulfonyl bedeuten oder gemeinsam mit dem N-Atom der NR^8R^9-Gruppe einen Heterocyclylrest mit 5 oder 6 Ringatomen bilden können, der gegebenenfalls eines oder mehrere zusätzliche Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach durch Reste aus der Gruppe (C_1-C_4)Alkyl und Oxo substituiert ist, und

Q O, S oder NR* ist,

R* (C_1-C_4)Alkyl, (C_3-C_4)Alkenyl oder (C_3-C_4)Alkinyl bedeutet, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkoxy und (C_1-C_4)Alkylthio substituiert ist, und R* und R^1 gemeinsam mit dem N-Atom der NR^*R^1-Gruppe einen Heterocyclylrest bilden können, der unsubstituiert oder substituiert ist, vorzugsweise durch oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkyl, (C_1-C_6)Alkoxy, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, (C_1-C_6)Haloalkyl und Oxo,

X, Y unabhängig voneinander H, Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkoxy und (C_1-C_4)Alkylthio substituiert ist, Mono- oder Di[(C_1-C_4)alkyl]amino, (C_3-C_5)Alkenyl, (C_3-C_5)Alkenyloxy, (C_3-C_5)Alkinyl oder (C_3-C_5)Alkinyloxy bedeuten, und

wobei die Reste R^1, R^2, R^3 und R^4 inklusive Substituenten bis zu 20 C-Atomen aufweisen.

3. Verbindung der Formel (I) oder deren Salze nach Anspruch 1 oder 2,

R^1 H, (C_1-C_6)Alkyl, (C_3-C_6)Alkenyl oder (C_3-C_6)Alkinyl, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Phenyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio (C_3-C_6)Cycloalkyl,

Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen, und [(C_1-C_4)Alkoxy]-carbonyl substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkyl oder Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen bedeutet, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl und (C_1-C_4)Alkoxy substituiert ist,

R^2 eine Gruppe der Formel R^0-Q^0-, worin

R^0 ein Wasserstoffatom, (C_1-C_8)Alkyl, (C_3-C_8)Alkenyl oder (C_3-C_8)Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Haloalkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, (C_1-C_4)Haloalkylsulfonyl, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, (C_3-C_6)Cycloalkyl, NR^8R^9 und Phenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsufonyl, NR^8R^9, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, Phenyl, [(C_1-C_4)Alkyl]-carbonyl, CN und NO_2 substituiert ist, substituiert ist, oder Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, NR^8R^9, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, Phenyl, CN und NO_2 substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)-Haloalkoxy, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, CN, OH und Phenyl substituiert ist, oder

(C_3-C_6)Cycloalkenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy und [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl substituiert ist, oder

Phenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy,

151

(C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, NR^8R^9, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, Phenyl, CN und NO_2 substituiert ist, und

Q^0 eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel -O- oder -$NR^\#$, worin $R^\#$ ein Wasserstoffatom oder unsubstituiertes oder substituiertes (C_1-C_4)Alkyl ist, bedeutet,

R^3 ein Wasserstoffatom, (C_1-C_8)Alkyl, (C_3-C_8)Alkenyl oder (C_3-C_8)Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Haloalkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, (C_1-C_4)Haloalkylsulfonyl, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, (C_3-C_6)Cycloalkyl, NR^8R^9 und Phenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, NR^8R^9, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, Phenyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, CN und NO_2 substituiert ist, substituiert ist, oder Heterocyclyl, vorzugsweise mit 3 bis 6 Ringatomen, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsufonyl, NR^8R^9, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, Phenyl, CN und NO_2 substituiert ist, substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Haloalkoxy, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, CN, OH und Phenyl substituiert ist, oder

(C_3-C_6)Cycloalkenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy und [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl substituiert ist, oder

Phenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy,

(C_1-C_4)Haloalkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsufonyl, NR^8R^9, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl, Phenyl, CN und NO_2 substituiert ist, und

R^2 und R^3 gemeinsam mit dem N-Atom (N^1) einen Heterocyclus von 3-6 Ringatomen bilden können, der gesättigt, ungesättigt oder aromatisch ist und zusätzlich zum N-Atom (N^1) ein oder zwei Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C_1-C_3)Alkyl, (C_1-C_3)Alkoxy, Halogen, [(C_1-C_3)Alkoxy]carbonyl, (C_1-C_3)Haloalkyl und Oxo, wobei sich der Oxo-Rest vorzugsweise nicht in Nachbarposition zum N-Atom (N^1) befindet, substituiert ist,

R^4 Halogen, CN, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_2-C_6)Alkenyl, (C_2-C_6)-Alkinyl, (C_3-C_6)Alkenyloxy, (C_3-C_6)Alkinyloxy,
wobei jeder der letztgenannten 6 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkoxy, (C_1-C_6)Haloalkoxy, (C_1-C_6)Alkylthio, (C_1-C_6)Haloalkylthio, (C_1-C_6)Alkylsulfinyl, (C_1-C_6)Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_6)Alkylsulfonyl, (C_1-C_6)Haloalkylsulfonyl, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, [(C_1-C_6)Haloalkoxy]carbonyl, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, (C_3-C_6)Cycloalkyl, NR^8R^9, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl substituiert ist,
oder
unsubstituiertes oder substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkyl, unsubstituiertes oder substituiertes (C_3-C_6)Cycloalkenyl, unsubstituiertes oder substituiertes Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen, unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl oder [(C_1-C_4)Alkyl]carbonyl oder [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl bedeuten, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder im Alkylteil durch ein oder mehrere Halogenatome substituiert ist, oder ein Rest der Formel C(O)-NR'-R'', C(S)-NR'-R'', CR'=N-Q^1-R'', NR'-Q^1-R'' oder NR'''-N=CR'-R'' bedeuten, wobei R', R'' und R''' unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, einen Acylrest oder einen unsubstituierten oder substituierten (C_1-C_{10})Kohlenstoffwasserstoffrest, und Q^1 und Q^2 unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel -O-

oder -N(R^+)- bedeuten, wobei R^+ ein Wasserstoffatom, ein Acylrest oder ein unsubstituierter oder substituierter (C_1-C_4)Alkylrest bedeutet, und R' mit R'' oder R^+ mit R' oder R^+ mit R'' jeweils einen Heterocyclylrest mit 3 bis 6 Ringatomen bilden kann, der unsubstituiert oder substituiert ist, vorzugsweise durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_6)Alkyl, (C_1-C_6)Alkoxy, [(C_1-C_6)Alkoxy]carbonyl, (C_1-C_6)Haloalkyl und Oxo,

l gleich 0 oder 1 ist,

R^6 und R^7 unabhängig voneinander H, (C_1-C_4)Alkyl, (C_3-C_4)Alkenyl, (C_3-C_4)Alkinyl oder Phenyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, [(C_1-C_4)Alkoxy]carbonyl, CN und NO_2 substituiert ist, oder
R^6 und R^7 gemeinsam mit dem N-Atom der NR^6R^7-Gruppe einen Heterocyclylrest mit 5 oder 6 Ringgliedern bilden können, der gegebenenfalls eines oder mehrere Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach durch Reste aus der Gruppe (C_1-C_4)Alkyl und Oxo substituiert ist,

R^8 und R^9 (C_1-C_4)Alkylcarbonyl, (C_1-C_4)Haloalkylcarbonyl, (C_1-C_4)Alkoxycarbonyl oder (C_1-C_4)Alkylsulfonyl sind, oder gemeinsam mit dem N-Atom der NR^8R^9-Gruppe einen Heterocyclylrest mit 5 oder 6 Ringatomen bilden können, der gegebenenfalls eines oder mehrere Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach durch Reste aus der Gruppe (C_1-C_4)Alkyl und Oxo substituiert ist.

4. Verbindung der Formel (I) oder deren Salze nach einem der Ansprüche 1 bis 3, worin

R^1 (C_1-C_6)Alkyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen und (C_1-C_4)Alkoxy substituiert ist, oder 3-Oxetanyl, (C_3-C_4)Alkenyl oder (C_3-C_4)Alkinyl,

R^2 H, (C_1-C_6)Alkyl, (C_3-C_6)Alkenyl, (C_3-C_6)Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten

drei Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, $[(C_1-C_4)$Alkoxy]carbonyl, (C_3-C_6)Cycloalkyl, CN und OH substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, $[(C_1-C_4)$Alkoxy]carbonyl, CN und OH substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkenyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkenyloxy, (C_1-C_4)Alkylamino oder Di$[(C_1-C_4)$alkyl]amino und

R^3 H, (C_1-C_6)Alkyl, (C_3-C_6)Alkenyl, (C_3-C_6)Alkinyl, wobei jeder der letztgenannten drei Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl, $[(C_1-C_4)$Alkoxy]carbonyl, (C_3-C_6)Cycloalkyl, CN und OH substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkyl, das unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, $[(C_1-C_4)$Alkoxy]carbonyl, CN und OH substituiert ist, oder (C_3-C_6)Cycloalkenyl oder

R^2 und R^3 gemeinsam mit dem N-Atom (N^1) einen Heterocyclus von 3-6 Ringatomen bilden können, der gesättigt, ungesättigt oder heteroaromatisch ist, zusätzlich zu dem N-Atom (N^1) ein oder zwei Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_3)Alkyl, (C_1-C_3)Alkoxy, $[(C_1-C_3)$Alkoxy]carbonyl und Oxo, wobei sich der Oxo-Rest vorzugsweise nicht in Nachbarposition zum N-Atom (N^1) befindet, substituiert ist, und

R^4 (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Alkoxy oder Halogen,

l gleich 0 oder 1 ist, vorzugsweise 0 ist,

R^5 H oder Methyl,

Q O oder NR*,

R* H oder (C_1-C_4)Alkyl,

X und Y unabhängig voneinander (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, wobei jeder der letztgenannten zwei Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Halogenatome substituiert ist, oder (C_1-C_4)Alkylthio, Halogen oder Mono- oder Di$[(C_1-C_2)$alkyl]amino bedeuten, und

W ein Sauerstoffatom bedeutet.

153

5. Verbindung der Formel (I) oder deren Salze nach einem der Ansprüche 1 bis 4, worin

R^1 (C_1-C_3)Alkyl, Allyl oder Propargyl,

R^2 H, (C_1-C_4)Alkyl, (C_3-C_5)Alkenyl, (C_3-C_5)Alkinyl, (C_3-C_6)Cycloalkyl oder (C_3-C_6)Cycloalkenyl,

R^3 H, (C_1-C_4)Alkyl, (C_3-C_5)Alkenyl, (C_3-C_5)Alkinyl, (C_3-C_6)Cycloalkyl oder (C_3-C_6)Cycloalkenyl,

R^4 (C_1-C_3)Alkyl oder Halogen,

l gleich 0 oder 1, vorzugsweise 0 ist,

Q O oder NR*,

R* (C_1-C_3)Alkyl,

X (C_1-C_2)Alkyl, (C_1-C_2)Alkoxy, (C_1-C_2)Alkylthio, (C_1-C_2)Haloalkyl oder (C_1-C_2)Haloalkoxy,

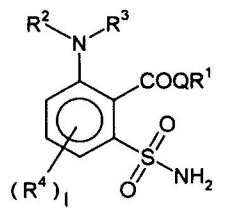
Y (C_1-C_2)Alkyl, (C_1-C_2)Alkoxy, Halogen, $NHCH_3$ oder $N(CH_3)_2$

V CH oder N, vorzugsweise N und

Z CH oder N bedeuten.

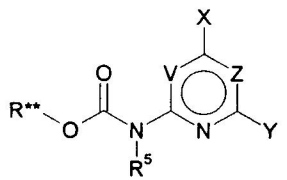
6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) oder deren Salzen, wie in einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 5 definiert, worin

a) eine Verbindung der Formel (II)



(II)

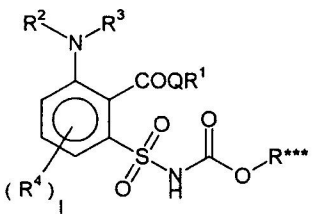
mit einem heterocyclischen Carbamat der Formel (III),



(III)

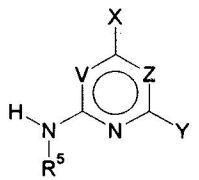
worin R** einen substituierten oder unsubstituierten C_1-C_{20}-Kohlenwasserstoffrest bedeutet, umgesetzt wird oder

b) ein Sulfonylcarbamat der Formel (IV),



(IV)

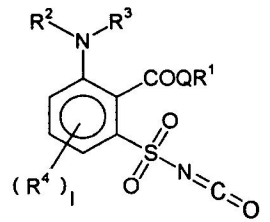
worin R*** einen substituierten oder unsubstituierten C_1-C_{20}-Kohlenwasserstoffrest bedeutet, mit einem Aminoheterocyclus der Formel (V)



(V)

umgesetzt wird oder

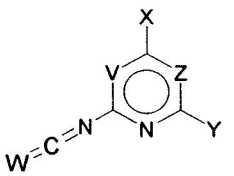
c) ein Sulfonylisocyanat der Formel (VI)



(VI)

mit einem Aminoheterocyclus der Formel (V) umgesetzt wird oder

d) ein Sulfonamid der Formel (II) mit einem (Thio)-Isocyanat der Formel (VII)

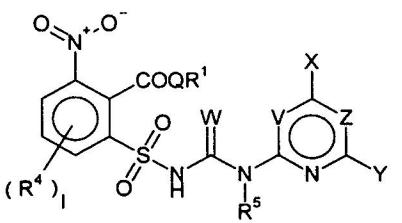


(VII)

in Gegenwart einer Base umgesetzt wird oder

e) ein Aminoheterocyclus der Formel (V) zunächst basenkatalysiert mit einem Kohlensäureester, umgesetzt wird und das gebildete Intermediat in einer Eintopfreaktion mit einem Sulfonamid der Formel (II) (siehe Variante a) umgesetzt wird, oder

f) einen Phenylsulfonylharnstoff der Formel (VIII)



(VIII)

durch Reduktion der Nitrogruppe, und gegebenenfalls weiterer Umsetzung der freigesetzten Hydroxylamin- oder Aminfunktion, zu einem Sulfonylharnstoff der Formel (I) umgesetzt wird,

wobei in den Formeln (II)-(VIII) die Reste, Gruppen und Indizes R^1-R^5, Q, V, W, X, Y, Z und l wie in Formel (I) nach Anspruch 1 definiert sind.

7. Herbizides oder pflanzenwachstumsregulierendes Mittel, enthaltend a) mindestens eine Verbindung der Formel (I) oder deren Salz nach einem der Ansprüche 1 bis 5 und b) im Pflanzenschutz übliche Formulierungshilfsmittel.

8. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpflanzen oder zur Wachstumsregulierung von Pflanzen, wobei eine wirksame Menge von mindestens einer Verbindung der Formel (I) oder deren Salz nach einem der Ansprüche 1 bis 5 auf die Schadpflanzen bzw. Pflanzen, deren Pflanzensamen oder die Fläche, auf der sie wachsen, appliziert wird.

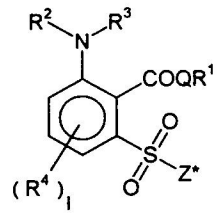
9. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze nach einem der Ansprüche 1 bis 5 als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren.

10. Verwendung nach Anspruch 9, wobei die Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze zur Bekämpfung von Schadpflanzen oder zur Wachstumsregulierung in Kulturen von Nutz- oder Zierpflanzen eingesetzt werden.

11. Verwendung nach Anspruch 10, wobei die Kulturpflanzen transgene Kulturpflanzen sind.

155

12. Verbindung der Formel (II*)

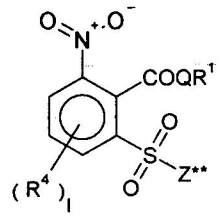


(II*)

worin Z*= NH_2, NHCOOR***, NCO oder NH-tert.-Butyl bedeutet und R^1-R^4, l und Q wie in Formel (I) nach Anspruch 1 und R*** wie in Formel (IV) nach Anspruch 6 definiert sind.

13. Verwendung einer Verbindung der Formel (II*), wie in Anspruch 12 definiert zur Herstellung einer Verbindung der Formel (I) gemäß Anspruch 1.

14. Verbindung der Formel (X*)

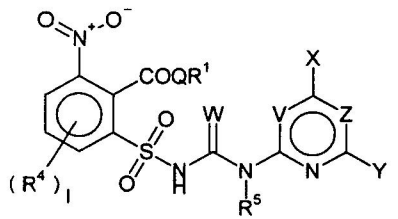


(X*)

worin Z**= NH_2, NH-tert.-Butyl oder Cl bedeutet und R^1, R^4, l und Q wie in Formel (I) nach Anspruch 1 definiert sind, und wobei Verbindungen ausgenommen sind, in denen Z** = Cl, l = 0, Q = O und R^1 = H, Methyl, Ethyl oder Allyl ist.

15. Verwendung einer Verbindung der Formel (X*) wie in Anspruch 14 definiert worin Z*** gleich NH_2 oder NH-tert.-Butyl ist, zur Herstellung einer Verbindung der Formel (II*) wie in Anspruch 12 definiert, worin Z* gleich NH_2 oder NH-tert.-Butyl ist.

16. Verbindungen der Formel (VIII)



(VIII)

worin R^1, R^4, R^5, Q, V, W, X, Y, Z und l wie in Formel (I) nach Anspruch 1 definiert sind.

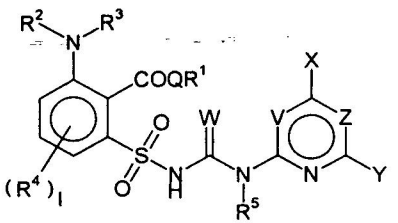
17. Verwendung einer Verbindung der Formel (VIII) wie in Anspruch 16 definiert zur Herstellung einer Verbindung der Formel (I) wie in Anspruch 1 definiert.

156

Zusammenfassung

Phenylsulfonylharnstoffe, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren

Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze,



(I)

worin

R^1 ein Wasserstoffatom, ein Kohlenwasserstoffrest oder ein Heterocyclylrest bedeutet, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 30 C-Atome, vorzugsweise 1 bis 20 C-Atome aufweist,

R^2 eine Gruppe der Formel R^0-Q^0-, worin

R^0 ein Wasserstoffatom, ein Kohlenwasserstoffrest oder ein Heterocyclylrest bedeutet, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 30 C-Atome, vorzugsweise 1 bis 20 C-Atome aufweist, und

Q^0 eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel -O- oder –N($R^\#$)- bedeutet, wobei $R^\#$ ein Wasserstoffatom, ein Acylrest oder ein Kohlenwasserstoffrest bedeutet und wobei der letztgenannte Rest unsubstituiert oder substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 30 C-Atome, vorzugsweise 1 bis 20 C-Atome aufweist,

R^3 ein Wasserstoffatom, ein Kohlenwasserstoffrest oder ein Heterocyclylrest bedeutet, wobei jeder der letztgenannten beiden Reste unsubstituiert oder

substituiert ist und inklusive Substituenten 1 bis 30 C-Atome, vorzugsweise 1 bis 20 C-Atome aufweist, oder

R^4 unabhängig voneinander Halogen, OH, SH, ein kohlenstoffreier stickstoffhaltiger Rest oder ein kohlenstoffhaltiger Rest bedeuten,

l 0, 1, 2 oder 3, vorzugsweise 0 oder 1 ist,

R^5 ein Wasserstoffatom oder ein C_1-C_{10}-Kohlenwasserstoffrest, der unsubstituiert oder substituiert ist, wie (C_1-C_4)Alkyl bedeutet, vorzugsweise H oder CH_3,

Q O, S oder NR* ist,

R* ein Wasserstoffatom oder ein C_1-C_{10}-Kohlenwasserstoffrest, der unsubstituiert oder substituiert ist, wie (C_1-C_4)Alkyl, (C_3-C_4)Alkenyl oder (C_3-C_4)Alkinyl bedeutet, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkoxy und (C_1-C_4)Alkylthio substituiert ist,

W ein Sauerstoff- oder Schwefelatom,

X,Y unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, Halogen, (C_1-C_4)Alkyl, (C_1-C_4)Alkoxy, (C_1-C_4)Alkylthio, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4)Alkoxy und (C_1-C_4)Alkylthio substituiert ist, oder Mono- oder Di[(C_1-C_4)alkyl]amino, (C_2-C_6)Alkenyl, (C_2-C_6)Alkinyl, (C_3-C_6)Alkenyloxy oder (C_3-C_6)Alkinyloxy bedeuten, und

V, Z unabhängig voneinander CH oder N bedeuten,

eignen sich als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren, z.B. zur Bekämpfung von Schadpflanzen in Kulturpflanzen, auch transgenen Kulturpflanzen. Sie lassen sich nach Verfahren gemäß Anspruch 6 über z. T. neue Zwischenprodukte (vgl. Verbindungen (II*) und (X*) und (VIII) gemäß Ansprüchen 12, 14 und 16) herstellen.

10957
43
462
158

TRADUCCION

REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

C e r t i f i c a c i ó n

La Hoechst Schering AgrEvo GmbH, con domicilio en Berlin/Alemania ha depositado en la Oficina Alemana de Patentes y Marcas el día 10 de febrero de 1999 una solicitud de patente con el enunciado:

"Fenil-sulfonil-ureas, procedimiento para su preparación y su utilización como herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas".

Las piezas fijadas son una reproducción correcta y exacta de los documentos originarios de esta solicitud de patente.

La solicitud ha recibido en la Oficina Alemana de Patentes y Marcas provisionalmente los símbolos C 07 D y A 01 N de la Clasificación Internacional de Patentes.

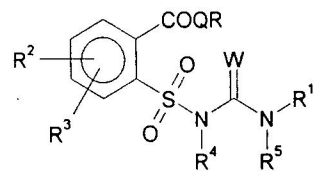
Munich, 28 diciembre 1999

Oficina Alemana de Patentes y Marcas
El Presidente
En representación,
firma ilegible
Zitzenzier

Acta: 199 05 453.3

Fenil-sulfonil-ureas, procedimiento para su preparación y su utilización como herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas

Es sabido que ciertas fenil-sulfonil-ureas sustituidas poseen propiedades herbicidas. En tal caso se trata de derivados de ácido benzoico de la fórmula general A (documentos de solicitudes de patente europea EP-A-7.687 y EP-A-30.138)

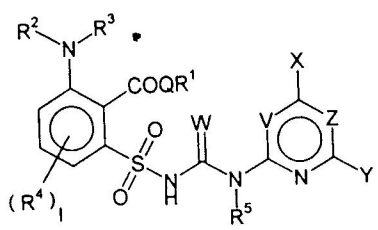


(A)

Además, por el documento de patente alemana DE-4.322.067 es conocido que ciertas fenil-sulfonil-ureas sustituidas con acil-amino presentan propiedades herbicidas.

Sorprendentemente, se encontraron por fin unas especiales fenil-sulfonil-ureas sustituidas en 1,2,3 que se adecuan especialmente bien como agentes herbicidas o reguladores del crecimiento de las plantas.

Son objeto del presente invento por consiguiente compuestos de la fórmula (I) o sus sales,



(I)

en la que

R^1 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0-, en la que

R^0 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C, y

Q^0 significa un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó -N($R^\#$)-, significando $R^\#$ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo y estando el radical mencionado en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

R^3 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C, o los

R^4 independientemente unos de otros, significan halógeno OH, SH, un radical que contiene nitrógeno y está exento de carbono o un radical que contiene carbono, que tiene de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

l es 0, 1, 2 ó 3, preferiblemente 0 ó 1,

R^5 significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo, que está sin sustituir o sustituido e, inclusive los sustituyentes, tiene de 1 a 20 átomos de C, preferiblemente de 1 a 10 átomos de C, p.ej. alquilo (C_1-C_4)

sin sustituir o sustituido, preferiblemente H ó CH_3,

Q es O, S ó NR*,

R* significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo que está sin sustituir o sustituido e, inclusive los sustituyentes, tiene de 1 a 20 átomos de C, preferiblemente de 1 a 10 átomos de C, p.ej. alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4) o alquinilo (C_3-C_4), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio,

W significa un átomo de oxígeno o azufre,

X, Y independientemente uno de otro, significan un átomo de hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, o mono- o di-[alquil (C_1-C_4)]amino, alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alquenil (C_3-C_6)-oxi o alquinil (C_3-C_6)-oxi, y

V, Z independientemente uno de otro, significan CH ó N.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden formar sales, en las cuales el hidrógeno del grupo $-SO_2-NH$ ha sido reemplazado por un catión apropiado para la agricultura. Estas sales son por ejemplo sales de metales, especialmente sales de metales alcalinos o sales de metales alcalinotérreos, especialmente sales de sodio y potasio, o también sales de amonio o sales con aminas orgánicas. Asimismo la formación de sales puede efectuarse mediante reacción por adición de un ácido con grupos básicos, tales como p.ej. amino y alquil-amino. Ácidos apropiados para ello son ácidos inorgánicos y orgánicos fuertes, por ejemplo HCl, HBr, H_2SO_4 o HNO_3.

En la fórmula (I), en cada caso ambos radicales R^0 y $R^{\#}$, R^2 y R^3 así como R* y R^1 forman uno con otro un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno.

Los radicales que contienen carbono son radicales orgánicos que contienen por lo menos un átomo de carbono, preferiblemente de 1 a 30 átomos de C, de modo especialmente preferido de 1 a 20 átomos de C, y además por lo menos un átomo de uno o varios otros elementos del Sistema Periódico de los Elementos tales como H, Si, N, P, O, S, F, Cl, Br ó I. Ejemplos de radicales que contienen carbono son radicales hidrocarbilo sin sustituir o sustituidos, que pueden estar unidos al entramado fundamental directamente o a través de un heteroátomo tal como N, S, P u O, o significan radicales heterociclilo sin sustituir o sustituidos, radicales acilo que contienen carbono o ciano.

En la fórmula (I) y en todas las fórmulas subsiguientes, los radicales que contienen carbono tales como alquilo, alcoxi, halo-alquilo, halo-alcoxi, alquil-amino y alquil-tio así como los correspondientes radicales insaturados y/o sustituidos existentes en el entramado de carbonos pueden ser en cada caso lineales o ramificados. Cuando no se indica de modo especial, en estos radicales son preferidos los entramados de carbono inferiores, p.ej. con 1 a 6 átomos de C o, en el caso de grupos insaturados, con 2 a 6 átomos de C. Los radicales alquilo, también en los significados compuestos, tales como alcoxi, halo-alquilo, etc., significan p.ej. metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, t- o 2-butilo, pentilos, hexilos, tales como n-hexilo, i-hexilo y 1,3-dimetil-butilo, heptilos, tales como n-heptilo, 1-metil-hexilo y 1,4-dimetil-pentilo; los radicales alquenilo y alquinilo tienen los significados de los radicales insaturados posibles correspondientes a los radicales alquilo; alquenilo significa p.ej. alilo, 1-metil-prop-2-en-1-ilo, 2-metil-prop-2-en-1-ilo, but-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo, 1-metil-but-3-en-1-ilo y 1-metil-but-2-en-1-ilo; alquinilo significa p.ej. propargilo, but-2-in-1-ilo, but-3-in-1-ilo y 1-metil-but-3-in-1-ilo.

Alquenilo en la forma de "alquenilo (C_3-C_4)", alquenilo (C_3-C_5), alquenilo (C_3-C_6)", "alquenilo (C_3-C_8)" o alquenilo (C_3-C_{12}) significa preferiblemente un radical alquenilo con

3 a 4, 3 a 5, 3 a 6, 3 a 8 ó 3 a 12 átomos de C respectivamente, en el que el doble enlace no está situado junto al átomo de C, que está unido con la parte restante de la molécula del compuesto (I) (posición de "ilo"). Lo correspondiente es válido para alquinilo (C_3-C_4), etc., alquenil (C_3-C_4)-oxi, etc., y alquinil (C_3-C_4)-oxi, etc.

Cicloalquilo significa un sistema anular saturado carbocíclico con 3-8 átomos de C, p.ej. ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

Los radicales que contienen nitrógeno y están exentos de carbono son radicales que contienen preferiblemente de 1 a 10 átomos de N, de modo especialmente preferido 1 ó 2 átomos de N y además de ello preferiblemente uno o varios átomos de uno o varios elementos distintos del carbono del Sistema Periódico de los Elementos tales como H, O ó S. Ejemplos de radicales que contienen nitrógeno y están exentos de carbono son NH_2, NO_2, NHOH, NO, $NH\text{-}NH_2$ ó N_3.

Halógeno significa por ejemplo fluoro, cloro, bromo o yodo. Los halo-alquilo, -alquenilo y -alquinilo significan respectivamente radicales alquilo, alquenilo o alquinilo parcial o totalmente sustituidos con halógeno, preferiblemente con fluoro, cloro y/o bromo, especialmente con fluoro o cloro, p.ej. CF_3, CHF_2, CH_2F, CF_3CF_2, CH_2FCHCl, CCl_3, $CHCl_2$, CH_2CH_2Cl; halo-alcoxi es p.ej. OCF_3, $OCHF_2$, OCH_2F, CF_3CF_2O, OCH_2CF_3 y OCH_2CH_2Cl; lo correspondiente es válido para halo-alquenilo y otros radicales sustituidos con halógeno.

Un radical hidrocarbilo es un radical hidrocarbilo alifático lineal, ramificado o cíclico y saturado o insaturado o aromático, p.ej. alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquenilo o arilo; arilo significa en este caso un sistema aromático mono-, bi- o poli-cíclico, por ejemplo fenilo, naftilo, tetrahidronaftilo, indenilo, indanilo, pentalenilo, fluorenilo y similares, preferiblemente fenilo;

preferiblemente, un radical hidrocarbilo significa alquilo, alquenilo o alquinilo con hasta 12 átomos de C, o cicloal-

quilo con 3, 4, 5, 6 ó 7 átomos de anillo, o fenilo.

Un radical o anillo heterocíclico (heterociclilo) puede ser saturado, insaturado o heteroaromático, y estar sin sustituir o sustituido; contiene preferiblemente uno o varios heteroátomos en el anillo, preferiblemente tomados entre el grupo formado por N, O y S; preferiblemente, es un radical heterociclilo alifático con 3 a 7 átomos de anillo o un radical heteroaromático con 5 ó 6 átomos de anillo y contiene 1, 2 ó 3 heteroátomos. El radical heterocíclico puede ser p.ej. un radical o anillo heteroaromático (heteroarilo), tal como p.ej. un sistema aromático, mono-, bi-, o poli-cíclico, en el que por lo menos 1 anillo contiene uno o varios heteroátomos, por ejemplo piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, oxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo e imidazolilo, o es un radical parcial o totalmente hidrogenado tal como oxiranilo, oxetanilo, pirrolidilo, piperidilo, piperazinilo, dioxolanilo, morfolinilo y tetrahidrofurilo. Como sustituyentes para un radical heterocíclico sustituido entran en cuestión los sustituyentes mencionados más adelante en esta memoria, y adicionalamente también oxo. El grupo oxo puede presentarse también junto a los heteroátomos de anillo, que pueden existir en diferentes etapas de oxidación, p.ej. en los casos de N y S.

Los radicales sustituidos, tales como los radicales hidrocarbilo sustituidos, p.ej. alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, fenilo y bencilo sustituidos, o heterociclilo o heteroarilo sustituidos, significan por ejemplo un radical sustituido que se deriva del entramado fundamental sin sustituir, significando los sustituyentes por ejemplo uno o varios, preferiblemente 1, 2 ó 3 radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi, halo-alcoxi, alquil-tio, hidroxi, amino, nitro, carboxi, ciano, azido, alcoxi-carbonilo, alquil-carbonilo, formilo, carbamoílo, (mono- y di-alquil)-amino-carbonilo, amino sustituido, tal como acil-amino, mono- y di-alquil-amino, y alquil-sulfinilo, halo-alquil-sulfinilo, alquil-sulfonilo, halo-alquil-sulfonilo

y, en el caso de radicales cíclicos, también alquilo y halo-alquilo así como los radicales alifáticos insaturados correspondientes a los radicales que contienen hidrocarbilo saturados que se han mencionado, tales como alquenilo, alquinilo, alquenil-oxi, alquinil-oxi, etc. En el caso de los radicales con átomos de C, son preferidos los que tienen de 1 a 4 átomos de C, especialmente 1 ó 2 átomos de C. Son preferidos por regla general los sustituyentes tomados entre el grupo formado por halógeno, p.ej. fluoro y cloro, alquilo (C_1-C_4), preferiblemente metilo o etilo, halo-alquilo (C_1-C_4), preferiblemente trifluorometilo, alcoxi (C_1-C_4), preferiblemente metoxi o etoxi, halo-alcoxi (C_1-C_4), nitro y ciano. Se prefieren especialmente en este caso los sustituyentes metilo, metoxi y cloro.

Un fenilo eventualmente sustituido es preferiblemente fenilo, que está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces, preferiblemente hasta tres veces con radicales iguales o diferentes tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halógeno-alquilo (C_1-C_4), halógeno-alcoxi (C_1-C_4) y nitro, p.ej. o-, m- y p-tolilo, dimetil-fenilos, 2-, 3- y 4-cloro-fenilo, 2-, 3- y 4-trifluoro- y -tricloro-fenilo, 2,4-, 3,5-, 2,5- y 2,3-dicloro-fenilo, o-, m- y p-metoxi-fenilo.

Un amino mono- o di-sustituido significa un radical químicamente estable tomado entre el grupo formado por los radicales amino sustituidos, que por ejemplo están sustituidos en N con uno o dos radicales iguales o diferentes tomados entre el grupo formado por alquilo, alcoxi, acilo y arilo; preferiblemente monoalquil-amino, dialquil-amino, acil-amino, aril-amino, N-alquil-N-aril-amino así como heterociclos con N; en tal caso se prefieren los radicales alquilo con 1 a 4 átomos de C; arilo es en tal caso preferiblemente fenilo o fenilo sustituido; para acilo es válida en este caso la definición mencionada más adelante, preferiblemente formilo, alquil (C_1-C_4)-carbonilo o alquil (C_1-C_4)-sulfonilo. Lo correspondiente es válido para hidroxil-amino o hidrazino sustituido.

Un radical acilo significa el radical de un ácido orgánico, que resulta formalmente por separación de un grupo OH desde el ácido orgánico, p.ej. el radical de un ácido carboxílico y radicales de ácidos derivados de éste, tales como el ácido tio-carboxílico, ácidos imino-carboxílicos eventualmente sustituidos en N, o los radicales de monoésteres de ácido carbónico, ácidos carbámicos eventualmente sustituidos en N, ácidos sulfónicos, ácidos sulfínicos, ácidos fosfónicos y ácidos fosfínicos.

Un radical acilo es preferiblemente formilo o acilo alifático tomado entre el grupo formado por CO-R^x, CS-R^x, CO-OR^x, CS-OR^x, CS-SR^x, SOR^y ó SO_2R^y, significando R^x y R^y en cada caso un radical hidrocarbilo C_1-C_{10}, que está sin sustituir o sustituido, o amino-carbonilo o amino-sulfonilo, estando los dos radicales mencionados en último término sin sustituir, monosustituidos en N o disustituidos en N,N. Acilo significa por ejemplo formilo, halógeno-alquil-carbonilo, alquil-carbonilo tal como alquil (C_1-C_4)-carbonilo, fenil-carbonilo, pudiendo el anillo de fenilo estar sustituido, p.ej. tal como antes se señala para fenilo, o alquiloxi-carbonilo, feniloxi-carbonilo, benciloxi-carbonilo, alquil-sulfonilo, alquil-sulfinilo, N-alquil-1-imino-alquilo y otros radicales de ácidos orgánicos.

Son objeto del invento también todos los estereoisómeros, que están abarcados por la fórmula (I), y sus mezclas. Tales compuestos de la fórmula (I) contienen uno o varios átomos de C asimétricos o también dobles enlaces, que no se indican por separado en la fórmula general (I). Los estereoisómeros posibles, definidos por su forma espacial específica, tales como enantiómeros, diastereoisómeros, e isómeros Z y E, están abarcados todos ellos por la fórmula (I) y se pueden obtener según métodos usuales a partir de mezclas de los estereoisómeros o también por reacciones estéreoselectivas en combinación con el empleo de sustancias de partida estereoquímicamente puras.

Los ejemplos precedentes de radicales o conjuntos de radicales, que entran dentro de los conceptos generales

tales como "alquilo", "acilo", "radicales sustituidos", etc., no significan ninguna enumeración completa. Los conceptos generales abarcan también las definiciones señaladas más adelante en esta memoria para conjuntos de radicales en grupos de compuestos preferidos, especialmente conjuntos de radicales, que abarcan radicales específicos en los Ejemplos de las Tablas.

Sobre todo por razones del más alto efecto herbicida, la mejor selectividad y/o la mejor preparabilidad tienen interés especial los compuestos conformes al invento de la fórmula (I) o sus sales, en los que

R^1 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, fenilo sin sustituir y sustituido, heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo sin sustituir y sustituido, cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir y sustituido, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, [alcoxi (C_1-C_4)]carbonilo y [halo-alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, o significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sustituido o sin sustituir, fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo sin sustituir o sustituido,

llevando el fenilo sustituido, el heterociclilo sustituido, el cicloalquilo sustituido o el cicloalquenilo sustituido como sustituyentes uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), di-[alcoxi (C_1-C_4)]-alquilo (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, OH, fenilo, CN y NO_2, y

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0,
en la que R^0 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, SH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalquenilo (C_3-C_6), fenilo o heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, pudiendo los cuatro radicales mencionados en último término estar sin sustituir o sustituidos, y
en la que Q^0 significa un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó -N($R^\#$)-, significando $R^\#$ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquiltio (C_1-C_6), halo-alquil (C_1-C_6)-tio, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, o fenilo sin sustituir o sustituido, y R^0 y $R^\#$, en común con el átomo de N del grupo $NR^\#R^0$ pueden formar un radical heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el

grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo;

R^3 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, o fenilo sin sustituir o sustituido, y

R^2 y R^3 en común con el átomo de N del grupo NR^2R^3 (N^1), pueden formar un radical heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo, no encontrándose preferiblemente el radical oxo en una posición contigua al átomo de N (N^1), y los

R^4 independientemente unos de otros, significan halógeno, CN, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alqueniloxi (C_3-C_6), alquiniloxi (C_3-C_6), estando cada uno de los 6 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6),

alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, o heterociclilo sin sustituir o sustituido, o significan cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, fenilo sin sustituir o sustituido, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo o [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido en la parte de alquilo con uno o varios átomos de halógeno, o significan un radical de la fórmula C(O)-NR'-R'', C(S)-NR'-R'', CR'=N-Q^1-R'', $S(O)_m$-Q^1-R'''', $P(O)_n$(-Q^1-R''''-Q^2-R''), NR'-Q^1-R'' ó NR'''-N=CR'-R'', significando **R'**, **R''** y **R'''**, independientemente unos de otros, un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, significando **R''''** un radical acilo que contiene carbono o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, y significando Q^1 y Q^2, independientemente uno de otro, un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó $-N(R^+)-$, significando R^+ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, y pudiendo ser **m** = 0, 1, 2 ó 3, así como **n** = 0, 1 ó 2, y pudiendo formar **R'** con **R''**, R^+ con **R'**, R^+ con **R''** ó R^+ con **R''''** en cada caso un radical heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, que puede estar sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo,

l es igual a 0, 1 ó 2, preferiblemente 0 ó 1,

R^5 es H o alquilo (C_1-C_4), que está sin sustituir o sustituido,

R^6 y R^7 independientemente uno de otro, significan H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6), fenilo sin sustituir o sustituido, o heterociclilo sin sustituir o sustituido, o

R^6 y R^7 en común con el átomo de N del grupo NR^6R^7 pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 átomos de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos adicionales tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo, y

R^8 y R^9 independientemente uno de otro, significan alquil (C_1-C_4)-carbonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-carbonilo, alcoxi (C_1-C_4)-carbonilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo o, en común con el átomo de N del grupo NR^8R^9, pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 átomos de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos adicionales tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo, y

Q es O, S ó NR*,

R* significa alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4) o alquinilo (C_3-C_4), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio y

R* y R^1 en común con el átomo de N del grupo NR^*R^1 pueden formar un radical heterociclilo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo,

X, Y independientemente uno de otro, significan H, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, mono- o di-[alquil (C_1-C_4)]-amino, alquenilo (C_3-C_5), alquenil (C_3-C_5)-oxi, alquinilo (C_3-C_5) o alquinil (C_3-C_5)-oxi, y

teniendo los radicales R^1, R^2, R^3 y R^4, inclusive los sustituyentes, en cada caso hasta 20 átomos de C.

Tienen interés especial los compuestos conformes al invento de la fórmula (I), en la que

R^1 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6) o alquinilo (C_3-C_6), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, fenilo, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio cicloalquilo (C_3-C_6), heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo y [alcoxi (C_1-C_4)]carbonilo, o significa cicloalquilo (C_3-C_6) o heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4) y alcoxi (C_1-C_4),

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0-, en la que

R^0 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_3-C_8) o alquinilo (C_3-C_8), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, halo-alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo

(C_3-C_6), NR^8R^9 y fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y NO_2, o

significa heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, o

significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN, OH y fenilo, o

significa cicloalquenilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) y [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo o

significa fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, y

Q^0 significa un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó $-NR^{\#}$, en el que $R^{\#}$ es un átomo de hidrógeno o alquilo (C_1-C_4) sin sustituir o sustituido,

R^3 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_8),

alquenilo (C_3-C_8) o alquinilo (C_3-C_8), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, halo-alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3–C_6), NR^8R^9 y fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y NO_2, o

significa heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, o

significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN, OH y fenilo, o

significa cicloalquenilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) y [alcoxi (C_1–C_4)]-carbonilo, o

significa fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo

formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, y

R^2 y R^3 en común con el átomo de N (N^1) pueden formar un heterociclo con 3-6 átomos de anillo, que es saturado, insaturado o aromático, y adicionalmente al átomo de N (N^1) puede contener uno o dos heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), halógeno, [alcoxi (C_1-C_3)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_3) y oxo, no encontrándose preferiblemente el radical oxo en posición contigua al átomo de N (N^1),

R^4 significa halógeno, CN, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alquenil (C_3-C_6)-oxi, alquinil (C_3-C_6)-oxi,
estando cada uno de los 6 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, o heterociclilo sin sustituir o sustituido, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo sin sustituir o sustituido, fenilo sin sustituir o sustituido o [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo o [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido en la parte de alquilo con uno o varios

átomos de halógeno, o significando un radical de la fórmula C(O)-NR'-R'', C(S)-NR'-R'', CR'=N-Q^1-R'', NR'-Q^1-R'' ó NR'''-N=CR'-R'', significando R', R'' y R''' independientemente unos de otros un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, y significando Q^1 y Q^2 independientemente uno de otro un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó -N(R^+)-, significando R^+ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical alquilo (C_1-C_4) sin sustituir o sustituido, y pudiendo formar R' con R'' o R^+ con R' o R^+ con R'' en cada caso un radical heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo,

l es igual a 0 ó 1,

R^6 y R^7, independientemente uno de otro, significan H, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4), alquinilo (C_3-C_4), o fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y NO_2, o R^6 y R^7 en común con el átomo de N del grupo NR^6R^7, pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 miembros de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S, y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados del grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo,

R^8 y R^9 son alquil (C_1-C_4)-carbonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-carbonilo, alcoxi (C_1-C_4)-carbonilo o alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, o en común con el átomo de N del grupo NR^8R^9 pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 átomos de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos tomados entre el grupo formado por

N, O y S y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo.

Tienen interés especial también los compuestos de la fórmula (I) conformes al invento y sus sales, en los que

R^1 significa alquilo (C_1-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno y alcoxi (C_1-C_4), o
significa 3-oxetanilo, alquenilo (C_3-C_4) o alquinilo (C_3-C_4),

R^2 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6) o alquinilo (C_3-C_6),
estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, cicloalquilo (C_3-C_6), CN y OH, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y OH, o
significa cicloalquenilo (C_3-C_6), alcoxi (C_1-C_4), alquenil (C_1-C_4)-oxi, alquil (C_1-C_4)-amino o di-[alquil (C_1-C_4)]-amino y

R^3 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6),
estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, cicloalquilo (C_3-C_6), CN y OH, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y OH, o

significa cicloalquenilo (C_3-C_6), o

R^2 y R^3 en común con el átomo de N (N^1), pueden formar un heterociclo de 3-6 átomos de anillo, que es saturado, insaturado o heteroaromático, que adicionalmente al átomo de N (N^1) puede contener uno o dos heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S, y está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), [alcoxi (C_1-C_3)]-carbonilo y oxo, no encontrándose preferiblemente el radical oxo en posición contigua al átomo de N (N^1), y

R^4 significa alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) o halógeno,

l es igual a 0 ó 1, preferiblemente 0,

R^5 significa H o metilo,

Q significa O ó NR*,

R* significa H o alquilo (C_1-C_4),

X e Y independientemente uno de otro, significan alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios átomos de halógeno, o significan alquil (C_1-C_4)-tio, halógeno o mono- o di-[alquil (C_1-C_2)]-amino, y

W significa un átomo de oxígeno.

Compuestos de la fórmula (I) preferidos conforme al invento o sus sales, son aquéllos en los que

R^1 significa alquilo (C_1-C_3), alilo o propargilo,

R^2 significa H, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_5), alquinilo (C_3-C_5), cicloalquilo (C_3-C_6) o cicloalquenilo (C_3-C_6),

R^3 significa H, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_5), alquinilo (C_3-C_5), cicloalquilo (C_3-C_6) o cicloalquenilo (C_3-C_6),

R^4 significa alquilo (C_1-C_3) o halógeno,

l es igual a 0 ó 1, preferiblemente 0,

Q significa O ó NR*,

R* significa alquilo (C_1-C_3),

X significa alquilo (C_1-C_2), alcoxi (C_1-C_2), alquil (C_1-C_2)-tio, halo-alquilo (C_1-C_2) o halo-alcoxi (C_1-C_2),

Y significa alquilo (C_1-C_2), alcoxi (C_1-C_2), halógeno, $NHCH_3$ ó $N(CH_3)_2$,

V significa CH ó N, preferiblemente N y

Z significa CH ó N.

Compuestos de la fórmula (I) especialmente preferidos conforme al invento o sus sales, son aquéllos en los que

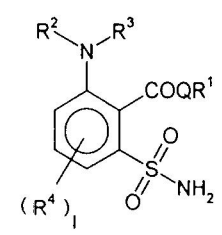
R^1 significa alquilo (C_1-C_3), alilo o propargilo y/o

Q significa un átomo de oxígeno.

Son especialmente preferidos también los compuestos de la fórmula (I) conformes al invento y sus sales, que contienen una combinación de radicales de los compuestos antes mencionados o contienen los compuestos preferidos, así como aquéllos que contienen radicales individuales o múltiples de los compuestos que se exponen en las Tablas 1 y 2 (véase más adelante). Son asimismo preferidos los compuestos de la fórmula (I) en los que V es = N.

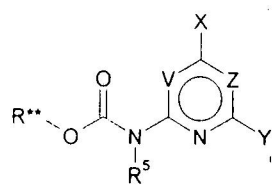
Son objeto del presente invento también procedimientos para la preparación de los compuestos de la fórmula general (I) conformes al invento o de sus sales, en los que

a) se hace reaccionar un compuesto de la fórmula (II)



(II)

con un carbamato heterocíclico de la fórmula (III),

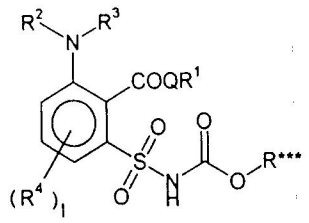


(III)

en la que R** significa un radical hidrocarbilo C_1-C_{20}

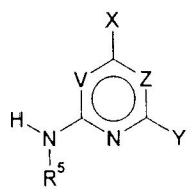
sustituido o sin sustituir, tal como arilo o alquilo, preferiblemente fenilo eventualmente sustituido o alquilo (C_1-C_4) eventualmente sustituido, o

b) se hace reaccionar un sulfonil-carbamato de la fórmula (IV)



(IV)

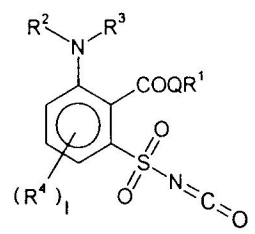
en la que **R***** significa un radical hidrocarbilo C_1-C_{20} sustituido o sin sustituir, tal como fenilo eventualmente sustituido y alquilo (C_1-C_4) eventualmente sustituido, con un amino-heterociclo de la fórmula (V)



(V)

o

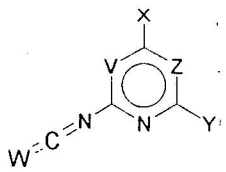
c) se hace reaccionar un sulfonil-isocianato de la fórmula (VI)



(VI)

con un amino-heterociclo de la fórmula (V) o

d) se hace reaccionar una sulfonamida de la fórmula (II) con un (tio)-isocianato de la fórmula (VII)

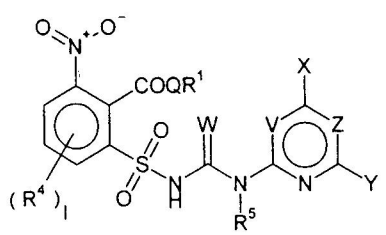


(VII)

en presencia de una base, o

e) se hace reaccionar un amino-heterociclo de la fórmula (V) en primer lugar de un modo catalizado por una base con un éster de ácido carbónico, p.ej. carbonato de difenilo, y el compuesto intermedio formado se hace reaccionar en una reacción de un solo recipiente (sin aislamiento de los productos intermedios) con una sulfonamida de la fórmula (II) (véase la variante a), o

f) se hace reaccionar una fenil-sulfonil-urea de la fórmula (VIII)



(VIII)

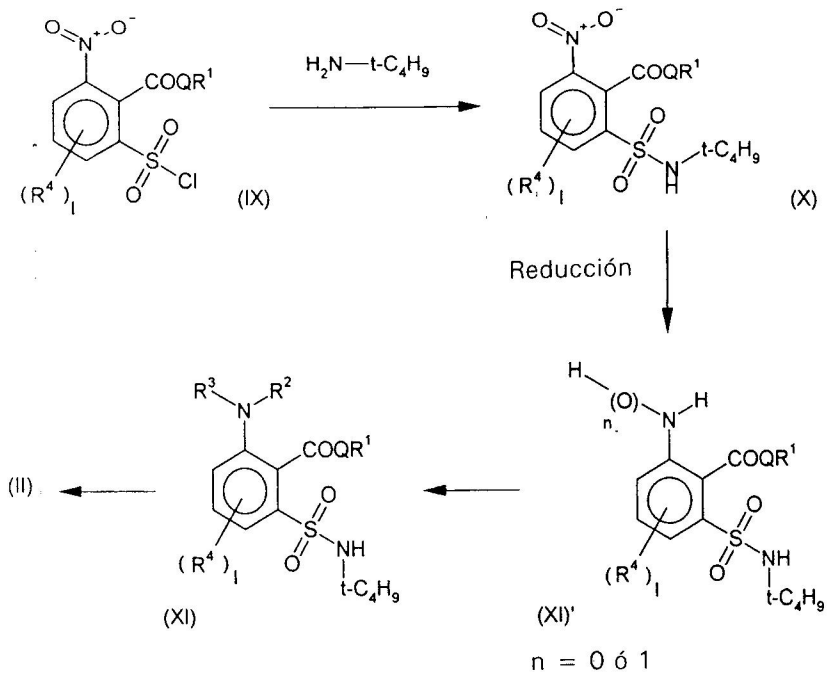
por reducción del grupo nitro, y eventualmente reacción ulterior de la función hidroxil-amino o amino puesta en libertad, para dar una sulfonil-urea de la fórmula (I), estando en las fórmulas (II)-(VIII) los radicales, grupos e índices R^1-R^5, Q, V, W, Y, Z y l definidos como en la fórmula (I). En las variantes a) hasta c), e) y f) del procedimiento se obtienen en primer lugar compuestos de la fórmula (I) en la que W = O.

La reacción de los compuestos de las fórmulas (II) y

(II) se efectúa preferiblemente de un modo catalizado por una base en el seno de un disolvente orgánico inerte, tal como p.ej. diclorometano, acetonitrilo, dioxano o THF a temperaturas comprendidas entre 0°C, preferiblemente 20°C, y el punto de ebullición del disolvente. Como base se utilizan en tal casos por ejemplo bases de aminas orgánicas, tales como 1,8-diaza-biciclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU), terc.-butóxidos de metales alcalinos, tales como p.ej. NaO-t-C_4H_9, o hidróxidos de metales alcalinos, tales como p.ej. NaOH, especialmente en el caso de que **R**** sea = fenilo (sustituido) (compárese el documento EP-A-44.807), o trimetil-aluminio o trietil-aluminio, este último especialmente en el caso de que **R**** sea = alquilo (compárese el documento EP-A-166.516). La respectiva base se emplea en tal caso por ejemplo en el margen de 1 a 3 equivalentes molares, referido al compuesto de la fórmula (II).

Las sulfonamidas (II) y los compuestos de las fórmulas (IV) y (VI), afines estructuralmente a ellas así como las fenil-sulfonil-ureas (VIII) son nuevos compuestos. Éstos y su preparación son asimismo objeto de este invento.

Se obtienen los compuestos de la fórmula (II) tal como se muestra en el Esquema 1, por ejemplo partiendo de compuestos de la fórmula (IX)



Esquema 1

El tratamiento de los sulfo-cloruros de la fórmula (IX) con terc.-butil-amina proporciona sulfonamidas de la fórmula (X). Por reducción del grupo nitro en los compuestos de la fórmula (X) se llega a los correspondientes hidroxil-aminas o aminas (XI)', pudiendo la funcionalidad puesta en libertad estar eventualmente derivatizada, p.ej. alquilada. Los compuestos intermedios de la fórmula (XI) así obtenidos se transforman finalmente en los compuestos (II) por tratamiento con un ácido. Los radicales R^1 hasta R^4, Q y l se definen en el Esquema 1 como en la fórmula (I).

La formación de las sulfonamidas se lleva a cabo por ejemplo en el seno de disolventes inertes tales como p.ej. diclorometano, tetrahidrofurano (THF), dioxano, tolueno o dimetil-formamida (DMF) a temperaturas de -70°C hasta del punto de ebullición del disolvente, preferiblemente hasta 25°C. En tal caso pasa a emplearse preferiblemente una cantidad de amina de 1,5-2,5 equivalentes, referida al sulfo-cloruro.

La reducción de la función nitro en (X) para dar aminas o hidroxil-aminas de la fórmula general (XI)' se efectúa análogamente a métodos conocidos (compárense para ello Houben-Weyl, "Methoden der Organischen Chemie", 4ª edición tomo XI/1, páginas 360 y siguientes, editorial Thieme Stuttgart 1957, así como tomo X/1, páginas 1.138 y siguientes, editorial Thieme Stuttgart, 1971).

Los compuestos de la fórmula general (XI)' (siendo **n** = 0) se pueden alquilar reductoramente con compuestos carbonílicos (compárense para ello Houben-Weyl, "Methoden der Organischen Chemie", 4ª edición tomo XI/1, páginas 618-643, editorial Thieme Stuttgart 1957; y las citas J. Am. Chem. Soc. 96 (1974) 7.812-7.814; J. Med. Chem. 38 (1995) 3.132-3.137). Por subsiguiente separación de terc.-butilo se consigue de este modo por ejemplo la preparación de anilinas secundarias y terciarias de la fórmula general (II).

La separación del grupo protector terc.-butilo en los compuestos (XI) se efectúa por tratamiento con un ácido fuerte (véase el documento WO 89/10921). Como ácidos fuertes entran en cuestión p.ej. ácidos minerales, tales como H_2SO_4 ó HCl, o bases orgánicas fuertes, tales como ácido trifluoroacético. La reacción se efectúa por ejemplo a temperaturas de -20°C hasta la respectiva temperatura de reflujo de la mezcla de reacción, preferiblemente a 0°C hasta 40°C. La reacción puede llevarse a cabo en sustancia o también en el seno de un disolvente inerte, tal como p.ej. diclorometano o triclorometano.

Para **l** = 0, **Q** = O y R^1 = H, Me, Et y alilo los compuestos (IX) son conocidos (véanse los documentos de patente de

los Estados Unidos de América US-4.647.588, US-4.694.020, de patente europea EP-A-197.386 y US-4.603.133). Los nuevos compuestos de la fórmula (IX) conformes al invento se pueden preparar partiendo de ácidos ftálicos sustituidos en el núcleo (para l = 0 por ejemplo a partir de ácido 3-nitro-ftálico comercial), análogamente a métodos conocidos (véase J. Heterocyclic Chem. 23 (1986) 1.253-1.255).

Los carbamatos de la fórmula (III) se pueden preparar de acuerdo con métodos, como se han descrito en las solicitudes de patente surafricanas 82/5671 y 82/5045 o en los documentos EP-A-70.804 (US-A-4.480.101) o RD 275.056.

La reacción de los compuestos (IV) con los amino-heterociclos (V) se lleva a cabo preferiblemente en el seno de disolventes apróticos inertes tales como p.ej. dioxano, acetonitrilo o tetrahidrofurano a temperaturas comprendidas entre 0°C y la temperatura de ebullición del disolvente. Los fenil-sulfonil-carbamatos de las fórmulas (IV) y (XII') se obtienen a partir de compuestos de las fórmulas (II) o (XII) análogamente a los documentos US-A-4.684.393 o US-A-4.743.290. Los materiales de partida (V) necesarios son conocidos por la bibliografía o se pueden preparar de acuerdo con procedimientos conocidos por la bibliografía (véanse para ello los documentos de patente alemana DE-A-3842621; y las citas de Dudley J.R. y colaboradores J. Am. Chem. Soc. 73 (1951) 1.968-2.990; Braker y colaboradores, J. Am. Chem. Soc. 69 (1947) 3.072, 3.075; Rose y colaboradores J. Chem. Soc. (1946) 81, 84; Huffman, K.R.; Schaefer, F.C. J. Org. Chem. 28 (1963) 1.816-1.821; Gabriel y colaboradores, Chem. Ber. (1899) 2.924).

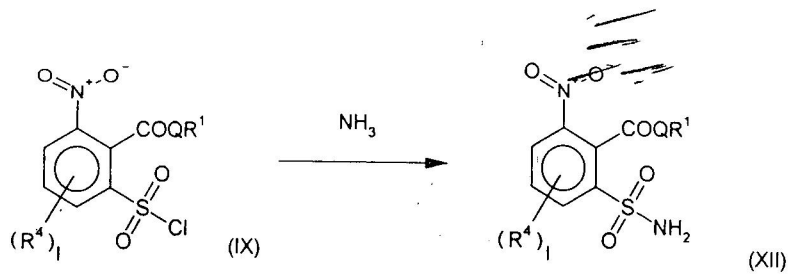
Los fenil-sulfonil-isocianatos de la fórmula (VI) se pueden preparar análogamente a como en el documento US-A-4.481.029 y hacer reaccionar con los amino-heterociclos (V).

Los (tio)-isocianatos de la fórmula (VII) son obtenibles de acuerdo con procedimientos conocidos por la bibliografía (documentos EP-A-232.067, EP-A-166.516). La reacción de los (tio)-isocianatos (VII) con compuestos (II) se efectúa por ejemplo a -10°C hasta 100°C, preferiblemente

a 20°C hasta 100°C, en el seno de un disolvente aprótico inerte, tal como p.ej. acetona o acetonitrilo, en presencia de una base apropiada, p.ej. trietil-amina o carbonato de potasio.

Los productos intermedios de la fórmula (VIII) se pueden preparar por ejemplo orillando el aislamiento de los sulfonil-isocianatos intermedios, directamente a partir de los sulfo-cloruros (IX) y los amino-heterociclos (V) en presencia de un cianato o tiocianato de metal alcalino o amonio y piridina (compárese para ello el documento US-A-5.157.119). Alternativamente a ello, los compuestos (VIII) se pueden obtener también por reacción de una sulfonamida (XII) con carbamatos de la fórmula (III) correspondientemente al procedimiento descrito en el apartado a).

Las sulfonamidas (XII) se pueden obtener por reacción de los compuestos (IX) con amoníaco (Esquema 2).



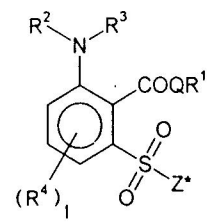
Esquema 2

La formación de una sulfonamida se lleva a cabo por ejemplo en un medio acuoso o en el seno de disolventes inertes tales como p.ej. diclorometano, tetrahidrofurano (THF), dioxano, tolueno o dimetil-formamida (DMF) a temperaturas de -70°C hasta del punto de ebullición del disolvente, preferiblemente a 25°C. En tal caso pasa a emplearse

preferiblemente una cantidad de amoníaco de 1,5-2,5 equivalentes, referida al sulfo-cloruro.

La reacción de un amino-heterociclo de la fórmula (V) con carbonato de difenilo y una sulfonamida de la fórmula (II) en una reacción de un solo recipiente se puede llevar a cabo de acuerdo con el documento EP-A-562.575.

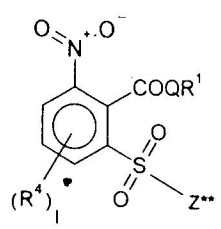
Los mencionados compuestos de las fórmulas (II), (IV), (VI), (XI) y (XI)' son nuevos productos intermedios estructuralmente afines de la fórmula general (II*)



(II*)

en la que **Z*** significa = NH_2, NHCOOR***, NCO ó NH-terc.-butilo, y R^1-R^4, **l** y **Q** están definidos como en la fórmula (I) y **R***** está definido como en la fórmula (IV).

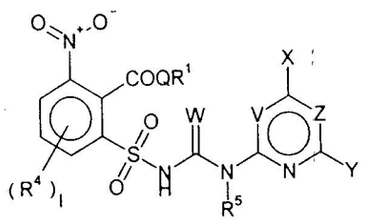
Los mencionados compuestos de las fórmulas (IX), (X) y (XII) son nuevos productos intermedios afines estructuralmente de la fórmula general (X*)



(X*)

en la que **Z**** significa = NH_2, NH-terc.-butilo o Cl y R^1, R^4, **l** y **Q** están definidos como en la fórmula (I) y estando excluidos los compuestos, en los cuales **Z**** es = Cl, **l** = 0, **Q** = O y R^1 = H, metilo, etilo o alilo.

Son asimismo nuevos los productos intermedios de la fórmula general (VIII)



(VIII)

en la que R^1, R^4, R^5, Q, V, W, X, Y, Z y l están definidos como en la fórmula (I).

Las sales de los compuestos de la fórmula (I) se preparan preferiblemente en el seno de disolventes polares inertes tales como p.ej. agua, metanol o acetona a temperaturas de 0°C a 100°C. Bases apropiadas para la preparación de las sales conformes al invento son por ejemplo carbonatos de metales alcalinos, tales como carbonato de potasio, hidróxidos de metales alcalinos y alcalinotérreos, p.ej. NaOH ó KOH, o alcoholatos de metales alcalinos, tales como metanolato de sodio o terc.-butanolato de sodio, o amoníaco o etanol-amina.

Con los "disolventes inertes" que se señalan en las precedentes variantes del procedimiento se piensa en cada caso en los disolventes que son inertes en las respectivas condiciones de reacción, pero no deben de ser inertes en cualesquiera condiciones de reacción.

Los compuestos de la fórmula (I) conformes al invento y sus sales, designados en lo sucesivo en común como compuestos de la fórmula (I) (conformes al invento) presentan una actividad herbicida excelente contra un amplio espectro de plantas dañinas mono- y di-cotiledóneas económicamente importantes. También están perfectamente abarcadas por las sustancias activas las malezas perennes difícilmente combatibles, que brotan a partir de rizomas, cepellones de raíces y otros órganos permanentes. En tal caso es indiferente que las sustancias sean esparcidas según los procedimientos de antes de la siembra, antes del brote o después

75 194 190

Aun cuando los compuestos conformes al invento presentan una excelente actividad herbicida frente a malezas mono- y di-cotiledóneas, las plantas cultivadas de cultivos económicamente importantes, p.ej. cultivos de plantas dicotiledóneas tales como soja, algodón, colza, remolacha azucarera, especialmente soja, o cultivos de gramíneas tales como trigo, cebada, centeno, arroz o maíz, son dañadas sólo insignificantemente o nada en absoluto. Los presentes compuestos se adecuan por estas razones muy bien para la represión selectiva del crecimiento indeseado de las plantas en plantaciones útiles agrícolas o en plantaciones ornamentales.

Además de ello, las sustancias conformes al invento presentan sobresalientes propiedades reguladoras del crecimiento en el caso de plantas cultivadas. Intervienen regulando en el metabolismo propio de las plantas y con ello se pueden emplear para el influenciamiento planeado sobre sustancias constitutivas de las plantas y para facilitar las cosechas tal como p.ej. por provocación de desecación y sofocamiento del crecimiento. Además, se adecuan también para el control y la inhibición generales de un crecimiento vegetativo indeseado, sin aniquilar con ello a las plantas. Una inhibición del crecimiento vegetativo desempeña un gran papel en muchos cultivos de plantas mono- y di-cotiledóneas, puesto que con ello se puede disminuir o impedir totalmente el tumbamiento.

Por causa de sus propiedades herbicidas y reguladoras del crecimiento de las plantas, las sustancias activas se pueden emplear también para combatir plantas dañinas en cultivos de plantas modificadas por tecnología genética conocidas o que todavía se hayan de desarrollar. Las plantas transgénicas se distinguen por regla general por propiedades ventajosas especiales, por ejemplo por resistencias frente a determinados plaguicidas, sobre todo determinados herbicidas, por resistencias frente a enfermedades de plantas o patógenos de enfermedades de plantas tales como determinados insectos o microorganismos tales como hongos, bacterias o

76
195
191

virus. Otras propiedades especiales conciernen p.ej. al material cosechado en lo referente a la cantidad, la calidad, la capacidad de almacenamiento, la composición y las sustancias constitutivas especiales. Así, se conocen plantas transgénicas con un contenido aumentado de almidón o una calidad modificada del almidón, o las que poseen una composición de ácidos grasos distinta de la del material cosechado.

Se prefiere la aplicación de los compuestos conformes al invento de la fórmula (I) o sus sales en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y ornamentales, p.ej. de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz, o también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patata, tomate, guisantes y otras especies de legumbres.

Preferiblemente, los compuestos de la fórmula (I) se pueden emplear como herbicidas en cultivos de plantas útiles, que son resistentes, o han sido hechos resistentes por tecnología genética, frente a los efectos fitotóxicos de los herbicidas.

Las vías habituales para la producción de nuevas plantas, que tienen propiedades modificadas en comparación con las plantas hasta ahora existentes, consisten por ejemplo en procedimientos de cultivación clásicos y en la producción de mutantes. Alternativamente, se pueden producir nuevas plantas con propiedades mejoradas con ayuda de procedimientos de tecnología genética (véanse p.ej. los documentos EP-A-221044 y EP-A-0131624). Se describieron por ejemplo en varios casos

- alteraciones por tecnología genética de plantas cultivadas para la modificación del almidón sintetizado en las plantas (véanse p.ej. los documentos WO 92/11376, WO 92/14827 y WO 91/19806),
- plantas cultivadas transgénicas, que son resistentes frente a determinados herbicidas del tipo de glufosinato (compárese p.ej. los documentos EP-A-0242236, EP-A-242246) o glifosato (documento WO 92/00377) o de las

sulfonil-ureas (documentos EP-A-0257993, US-A-5013659),

- plantas cultivadas transgénicas, por ejemplo algodón, con la capacidad de producir toxinas de Bacillus thuringiensis (Bt-toxinas), que hacen a las plantas resistentes frentes a determinadas plagas (documentos EP-A 0142924 y EP-A 0193259).
- plantas cultivadas transgénicas con una composición modificada de ácidos grasos (WO 91/13972).

Numerosas técnicas de biología molecular, con las cuales se pueden producir nuevas plantas transgénicas con propiedades mejoradas, son conocidas en principio (véanse p.ej. las obras de Sambrook y colaboradores, 1989, Molecular Clonig, A Laboratory Manual (un manual de laboratorio), 2ª edición, Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; de Winnacker "Gene und Klone" (genes y clones), VCH Weinheim 2ª edición 1996; o de Christou, "Trends in Plant Science" (tendencias en la ciencia de los vegetales), 1 (1996) 423-431).

Para tales manipulaciones por tecnología genética se pueden incorporar en plásmidos moléculas de ácidos nucleicos, que permiten una mutagénesis o una modificación de las secuencias por recombinación de secuencias de ADN. Con ayuda de los procedimientos clásicos antes mencionados, se pueden llevar a cabo p.ej. intercambios entre bases, se pueden eliminar secuencias parciales o se pueden agregar secuencias naturales o sintéticas. Para la unión de los fragmentos de ADN unos con otros se pueden adosar a los fragmentos adaptadores o enlazadores.

La producción de células de plantas con una actividad disminuida de un producto de gen se puede conseguir por ejemplo mediante la expresión de por lo menos un correspondiente ARN antisentido, de un ARN del mismo sentido para conseguir un efecto de supresión conjunta o la expresión de por lo menos una ribozima correspondientemente construida, que disocia específicamente a transcritos del producto de gen antes mencionado.

Para ello se pueden utilizar por una parte moléculas de

ADN que abarcan la secuencia codificadora total de un producto de gen inclusive secuencias flanqueadoras eventualmente presentes, así como también moléculas de ADN, que abarcan solamente partes de la secuencia codificadora, debiendo estas partes ser lo suficientemente largas como para producir en las células un efecto antisentido. Es posible también la utilización de secuencias de ADN, que presentan un alto grado de homología con las secuencias codificadoras de un producto de gen, pero no son totalmente idénticas a ellas.

En el caso de la expresión de moléculas de ácidos nucleicos en plantas, la proteína sintetizada puede estar localizada en cualquier compartimiento deseado de la célula vegetal. No obstante, con el fin de conseguir la localización en un determinado compartimiento, p.ej. la región codificadora puede ser unida con secuencias de ADN que garanticen la localización en un determinado compartimiento. Tales secuencias son conocidas por un experto en la materia (véanse por ejemplo las citas de Braun y colaboradores, EMBO J. 11 (1992), 3.219-3.227; Wolter y colaboradores, Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988) 856-850; Sonnewald y colaboradores, Plant J. 1 (1991), 95-106).

Las células de plantas transgénicas pueden ser regeneradas de acuerdo con técnicas conocidas para dar plantas enteras. En el caso de las plantas transgénicas puede tratarse en principio de plantas de cualquier especie deseada de plantas, es decir de plantas tanto monocotiledóneas como también dicotiledóneas.

Así son obtenibles plantas transgénicas, que presentan propiedades alteradas mediante sobreexpresión, supresión o inhibición de genes o secuencias de genes homólogos (= naturales) o expresión de genes o secuencias de genes heterólogos (= ajenos).

Preferiblemente, los compuestos (I) conformes al invento se pueden haber empleado en cultivos transgénicos, que son resistentes frente a herbicidas tomados entre el grupo de las sulfonil-ureas, glufosinato-amonio y glifosato-

198
194

isopropilamonio y sustancias activas análogas.

En el caso de la aplicación de las sustancias conformes al invento en cultivos transgénicos, junto a los efectos contra plantas dañinas que se pueden observar en otros cultivos, aparecen con frecuencia efectos, que son específicos para la aplicación en el respectivo cultivo transgénico, por ejemplo un espectro modificado o especialmente ampliado de malezas que se pueden combatir, cantidades consumidas modificadas, que se pueden emplear para la aplicación, preferiblemente una buena combinabilidad con los herbicidas, frente a los cuales es resistente el cultivo transgénico, así como el influenciamiento sobre el crecimiento y el rendimiento de las plantas cultivadas transgénicas.

Es por lo tanto objeto del invento también la utilización de los compuestos (I) conformes al invento como herbicidas para combatir plantas dañinas en plantas cultivadas transgénicas.

Los compuestos conformes al invento se pueden aplicar en forma de polvos para proyectar, concentrados emulsionables, soluciones atomizables, agentes para espolvorear o granulados en los preparados usuales. Por lo tanto, son objeto del invento también agentes herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas, que contienen compuestos de la fórmula (I).

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden formular de modos diferentes, dependiendo de qué parámetros biológicos y/o químicos-físicos estén preestablecidos. Como posibilidades de formulación entran en cuestión por ejemplo: polvos para proyectar (WP), polvos solubles en agua (SP), concentrados solubles en agua, concentrados emulsionables (EC), emulsiones (EW), tales como emulsiones del tipo de aceite en agua y del tipo de agua en aceite, soluciones atomizables, concentrados para suspensión (SC), dispersiones a base de aceites o de agua, soluciones miscibles con aceites, suspensiones para encapsular (CS), agentes para espolvorear (DP), agentes desinfectantes, granulados para la aplicación por esparcimiento y sobre el suelo, granulados

(GR) en forma de microgranulados, granulados por atomización, extensión y adsorción, granulados dispersables en agua (WG), granulados solubles en agua (SG), formulaciones ULV (de volumen ultra-bajo), microcápsulas y ceras. Estos tipos individuales de formulaciones son conocidos en principio y se describen por ejemplo en las obras de: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" (tecnología química), tomo 7, editorial C. Hauser München, 4ª edición, 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations" (formulaciones plaguicidas), Marcel Dekker, N.Y., 1973, K. Martens, "Spray Drying" Handbook (manual del secado por atomización) 3ª edición, 1979, G. Goodwin Ltd., Londres.

Los necesarios agentes coadyuvantes de formulaciones tales como materiales inertes, agentes tensioactivos, disolventes y otros materiales aditivos son asimismo conocidos y se describen por ejemplo en las obras de: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers" (manual de diluyentes y vehículos para polvos insecticidas), 2ª edición, Darland Books, Caldwell N.J.; H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry" (introducción a la química de los coloides de arcillas), 2ª edición J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide" (guía de disolventes), 2ª edición, Interscience, N. Y. 1963; "Detergents and Emulsifiers Annual" (anual de los detergentes y emulsionantes) de McCutcheon, MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley y Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents" (enciclopedia de agentes tensioactivos), Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" (aductos con óxido de etileno interfacialmente activos), Wiss. Verlagsgesell. Stuttgart, 1976; Winnacker-Küchler; "Chemische Technologie" (tecnología química), tomo 7, editorial C. Hauser München, 4ª edición, 1986.

Sobre la base de estas formulaciones se pueden producir también combinaciones con otras sustancias activas como plaguicidas, tales como p.ej. insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, así como con antídotos, fertilizan-

tes y/o reguladores del crecimiento, p.ej. en forma de una formulación acabada o como una mezcla de depósito (*Tankmix*).

Los polvos para proyectar son unos preparados uniformemente dispersables en agua, los cuales junto con la sustancia activa, aparte de un material diluyente o inerte, contienen también agentes tensioactivos de tipos iónicos y/o no iónicos (agentes humectantes, agentes dispersantes), p.ej. alquil-fenoles poli(oxietilados), alcoholes grasos poli(oxietilados), aminas grasas poli(oxietiladas), (alcohol graso)-poliglicol-éter-sulfatos, alcano-sulfonatos, alquil-benceno-sulfonatos, sales de sodio de ácido lignina-sulfónico, sales de sodio de ácido 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-disulfónico, sales de sodio de ácido dibutilnaftaleno-sulfónico o también sales de sodio de ácido oleoil-metil-táurico. Para la producción de los polvos para proyectar, las sustancias activas herbicidas se muelen finamente, por ejemplo en instalaciones usuales, tales como las de molinos de martillos, molinos de soplantes y molinos de chorros de aire y se mezclan simultáneamente o a continuación con los agentes coadyuvantes de formulaciones.

Los concentrados emulsionables se preparan por disolución de la sustancia activa en un disolvente orgánico, p.ej. butanol, ciclohexanona, dimetil-formamida, xileno o también compuestos aromáticos o hidrocarburos de elevado punto de ebullición, o mezclas de tales disolventes orgánicos, mediando adición de uno o varios agentes tensioactivos de tipos iónicos y/o no iónicos (emulsionantes). Como emulsionantes se pueden utilizar por ejemplo: sales de calcio de ácidos alquil-aril-sulfónicos tales como dodecil-benceno-sulfonato de calcio o emulsionantes no iónicos tales como ésteres poliglicólicos de ácidos grasos, alquil-aril-poliglicol-éteres, (alcoholes grasos)-poliglicol-éteres, productos de condensación de óxido de propileno y óxido de etileno, alquil-poliéteres, ésteres de sorbitán tales como p.ej. ésteres de ácidos grasos de sorbitán o poli-(oxietilen)-ésteres de sorbitán tales como p.ej. poli-(oxietilen)-ésteres de ácidos grasos de sorbitan.

Se obtienen agentes para espolvorear mediante molienda de la sustancia activa con materiales sólidos finamente divididos, p.ej. talco, arcillas naturales, tales como caolín, bentonita y pirofilita, o tierra de diatomeas.

Los concentrados para suspensión pueden estar constituidos a base de agua o de aceites. Se pueden preparar por ejemplo por molienda en húmedo mediante molinos de perlas usuales en el comercio y eventualmente adición de agentes tensioactivos tales como ya se han expuesto anteriormente en los casos de los otros tipos de formulaciones.

Las emulsiones, p.ej. las emulsiones del tipo de aceite en agua (EW), se pueden preparar por ejemplo mediante agitadores, molinos de coloides y/o mezcladores estáticos mediando utilización de disolventes orgánicos acuosos y eventualmente de agentes tensioactivos, tal como ya se han señalado p.ej. anteriormente en los casos de los otros tipos de formulaciones.

Los granulados se pueden preparar o bien por inyección de la sustancia activa sobre un material inerte granulado, capaz de adsorción, o por aplicación de concentrados de sustancias activas mediante pegamentos, p.ej. un poli(alcohol vinílico), un poli(acrilato de sodio) o también aceites minerales, sobre la superficie de materiales de soporte tales como arena, caolinitas o de un material inerte granulado. También se pueden granular sustancias activas apropiadas del modo que es usual para la preparación de granallas de agentes fertilizantes - en caso deseado en mezclas con agentes fertilizantes -.

Los granulados dispersables en agua se preparan por regla general de acuerdo con los procedimientos usuales tales como secado por atomización, granulación en lecho fluidizado, granulación en bandejas, mezcladura con mezcladores de alta velocidad y extrusión sin ningún material inerte sólido.

Para la producción de granulados en bandejas, en lecho fluidizado, en extrusores y por atomización, véanse, p.ej. los procedimientos que aparecen en las obras "Spray-Drying

83
2-02
198

Handbook" (manual del secado por atomización), 3ª edición 1979, G. Goodwin Ltd., Londres; J.E. Browning, "Agglomeration" (aglomeración), Chemical and Engineering 1967, páginas 147 y siguientes; "Perry's Chemical Engineer's Handbook" (manual del ingeniero químico de Perry), 5ª edición, McGraw-Hill, Nueva York 1973, páginas 8-57.

Para más detalles acerca de la formulación de agentes fitoprotectores véase por ejemplo la obra de G.C. Klingman, "Weed Control as a Science" (la represión de malezas como una ciencia), John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, páginas 81-96 y J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook" (manual de la represión de malezas), 5ª edición, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.

Los preparados agroquímicos contienen por regla general de 0,1 a 99 % en peso, especialmente de 0,1 a 95 % en peso, de una sustancia activa de la fórmula (I).

En polvos para proyectar, la concentración de la sustancia activa asciende p.ej. a aproximadamente 10 a 90 % en peso, el resto hasta 100 % en peso consta de constituyentes usuales de formulaciones. En el caso de concentrados emulsionables, la concentración de la sustancia activa puede ascender aproximadamente a 1 hasta 90, preferiblemente a 5 hasta 80 % en peso. Las formulaciones en forma de polvos finos contienen de 1 a 30 % en peso de la sustancia activa, preferiblemente en la mayor parte de los casos de 5 a 20 % en peso de la sustancia activa, las soluciones atomizables contienen aproximadamente de 0,05 a 80, preferiblemente de 2 a 50 % en peso de la sustancia activa. En el caso de granulados dispersables en agua, el contenido de la sustancia activa depende en parte de que el compuesto activo se presente en estado líquido o sólido y de cuáles agentes coadyuvantes de granulación, materiales de carga, etc., se utilicen. En el caso de los granulados dispersables en agua, el contenido de sustancia activa está situado por ejemplo entre 1 y 95 % en peso, preferiblemente entre 10 y 80 % en peso.

Junto a ello, las mencionadas formulaciones de sustancias activas contienen eventualmente los agentes adhesivos, humectantes, dispersantes, emulsionantes, penetrantes, conservantes, protectores frente a las heladas y disolventes, materiales de carga, de vehículo, de soporte y colorantes, antiespumantes, inhibidores de la evaporación y agentes que influyen sobre el valor del pH y sobre la viscosidad, en cada caso usuales.

Como partícipes en las combinaciones para las sustancias activas conformes al invento en formulaciones de mezclas o en una mezcla de depósito se pueden emplear por ejemplo sustancias activas conocidas, tal como se describen p.ej. en las citas de Weed Research 26 (1986), 441-445 o "The Pesticide Manual", 11ª edición, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry 1997, y la bibliografía allí mencionada. Como agentes herbicidas conocidos, que se pueden combinar con los compuestos de la fórmula (I), han de mencionarse p.ej. las siguientes sustancias activas (observación: los compuestos son designados o bien con el "nombre común" de acuerdo con la International Organization for Standardization (ISO) o con el nombre químico, eventualmente junto con un número de código usual):

acetocloro; acifluorfeno; aclonifeno; AKH 7088, es decir ácido [[[1-[5-[2-cloro-4-(trifluorometil)-fenoxi]-2-nitrofenil]-2-metoxi-etiliden]-amino]-oxi]-acético y su éster metílico; alacloro, alloxidim; ametrin, amidosulfurón; amitrol; AMS, es decir sulfamato de amonio; anilofos; asulam; atrazina; azafenidina; azimsulfurón (DPX-A8947); aziprotrin; barbán; BAS 516 H, es decir 5-fluoro-2-fenil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona; BAS 620 H; BAS 65400H; BAY FOE 5043; benazolin; benfluralina; benfuresato; bensulfurón-metilo; bensulida; bentazona; benzofenap; benzofluoro; benzoilprop-etilo; benzotiazurón; bialafos; bifenox; bispiribaco-Na; bromacilo; bromobutida; bromofenoxim; bromoxinilo; bromurón; buminafos; busoxinona; butacloro; butamifos; butenacloro; butidazol; butralina; butroxidim; butilate; cafenstrole (CH-

900); caloxidim, carbetamida; carfentrazona-etilo; CDAA, es decir 2-cloro-N,N-di-2-propenil-acetamida; CDEC, es decir éster 2-cloro-alílico de ácido dietil-ditiocarbámico; clometoxifeno; clorambeno; clorazifop-butilo; clorbromurón; clorbufam; clorfenaco; clorflurecol-metilo; cloridazona; clorimuron-etilo; clornitrofeno; clorotolurón; cloroxurón; clorprofam; clorsulfurón; clortal-dimetilo; clortiamida; cinmetilina; cinosulfurón; cletodim; clodinafop y sus derivados ésteres (p.ej. clodinafop-propargilo); clomazona; clomeprop; cloproxidim; clopiralida; cloransulam-metilo; cumilurón (JC 940); cianazina; cicloato; ciclosulfamurón (AC 104); cicloxidim; ciclurón; cihalofop y sus derivados ésteres (p.ej. el éster butílico, DEH-112); ciperquat; ciprazina; ciprazol; daimurón; 2,4-DB; dalapón; desmedifam; desmetrin; di-allato; dicamba; diclobenilo; diclorprop; diclofop y sus ésteres tales como diclofop-metilo; diclosulam, es decir N-(2,6-dicloro-fenil)-5-etoxi-7-fluoro-[1,2,4] triazolo][1,5-c]pirimidin-2-sulfonamida; dietatil; difenoxurón; difenzoquat; diflufenicán, diflufenzopir BAS 654 00H), dimefurón; dimetacloro; dimetametrin; dimetenamida (SAN-582H); dimetazona, clomazón; dimetipin; dimetrasulfurón, dinitramina; dinoseb; dinoterb; difenamida; dipropetrin; diquat; ditiopir; diurón; DNOC; eglinazina-etilo; EL 77, es decir 5-ciano-1-(1,1-dimetil-etil)-N-metil-1H-pirazol-4-carboxamida; endotal; EPTC; esprocarb; etalfluralina; etametsulfurón-metilo; etidimurón; etiozina; etofumesato; F5231, es decir N-[2-cloro-4-fluoro-5-[4-(3-fluoro-propil)-4,5-dihidro-5-oxo-1H-tetrazol-1-il]-fenil]-etano-sulfonamida; etoxifeno y sus ésteres (p.ej. el éster etílico, HN-252); etoxisulfurón; etobenzanida (HW 52); fenoprop; fenoxano, fenoxaprop y fenoxaprop-P así como sus ésteres, p.ej. fenoxaprop-P-etilo y fenoxaprop-etilo; fenoxidim, fenurón; flamprop-metilo, flazasulfurón; florasulam; fluazifop y fluazifop-P y sus ésteres fluazifop-butilo y fluazifop-P-butilo; flucloralina; flumetsulam; flumeturón; flumicloraco y sus ésteres (p.ej. el éster pentílico, S-23031); flumioxazina (S-482); flumipropin; flupoxam (KNW-

739); fluorodifeno; fluoroglicofeno-etilo; flupropacilo (UBIC-4243); flupirsulfurón-metilo-sodio; fluridona; flurocloridona; fluroxipir; flurtamona; flutiacet-metilo; fomesafeno; fosamina; furiloxifeno; glufosinato; glifosato; halosafeno; halosulfurón y sus ésteres (p.ej. el éster metílico, NC-319); haloxifop y sus ésteres; haloxifop-P (= R-haloxifop) y sus ésteres; hexazinona; imazametabenz-metilo); imazamox; imazapic; imazapir; imazaquin y sales tales como la sal de amonio; imazetametapir; imazetapir; imazosulfurón; indanofano (MK-243); ioxinilo; isocarbamida; isopropalina; isoproturón; isourón; isoxabeno; isoxaflutole; isoxapirifop; karbutilato; lactofeno; lenacilo; linurón; MCPA; MCPB; mecoprop; mefenacet; mefluidida; metamitrón; metazacloro; metabenztiazurón; metam; metazol; metoxifenona; metildimron; metobenzurón; metobromurón; metolacloro; metosulam (XRD 511); metoxurón; metribuzina; metsulfurón-metilo; MH; molinato; monalida; monocarbamida-dihidrógeno-sulfato; monolinurón; monurón; MT 128, es decir 6-cloro-N-(3-cloro-2-propenil)-5-metil-N-fenil-3-piridazinamina; MT 5950, es decir N-[3-cloro-4-(1-metil-etil)-fenil]-2-metil-pentanamida; naproanilida; napropamida; naptalam; NC 310, es decir 4-(2,4-dicloro-benzoil)-1-metil-5-benciloxi-pirazol; neburón; nicosulfurón, nipiraclofeno; nitralina; nitrofeno; nitrofluorfeno; norflurazona; orbencarb; orizalina; oxadiargilo (RP-020630); oxadiazona; oxasulfurón; oxaziclomefona (MY-100); oxifluorfeno; paraquat; pebulato; pendimetalina; pentoxazona (KPP-314); perfluidona; fenisofam; fenmedifam; picloram; piperofos; piributicarb; pirifenop-butilo; pretilacloro; primisulfurón-metilo; prociazina; prodiamina; profluralina; proglinazina-etilo; prometón; prometrin; propacloro; propanilo; propaquizafop y sus ésteres; propazina; profam; propisocloro; propizamida; prosulfalina; prosulfocarb; prosulfurón (CGA-152005); prinacloro; piroflufeno-etilo; pirazolinato; pirazona; pirazosulfurón-etilo; pirazoxifeno; piribenzoxima (LGC-40836); piributicarb; piridato; piriminobaco-metilo; piritiobaco (KIH-2031); piroxofop y sus ésteres (p.ej. el éster propargílico);

quincloraco; quinmeraco; quinofop y sus derivados ésteres; quizalofop y quizalofop-P y sus derivados ésteres p.ej. quizalofop-etilo; quizalofop-p-tefurilo y -etilo; renridurón; rimsulfurón (DPX-E 9636); S 275, es decir 2-[4-cloro-2-fluoro-5-(2-propiniloxi)-fenil]-4,5,6,7-tetrahidro-2H -indazol; secbumetona; setoxidim; sidurón; simazina; simetrin; SN 106279, es decir ácido 2-[[7-[2-cloro-4-(trifluorometil)-fenoxi]-2-naftalenil]-oxi]-propanoico y su éster metílico; sulcotriona; sulfentrazona (FMC-97285, F-6285); sulfazurón; sulfometurón-metilo; sulfosato (ICI-A0224); sulfosulfurón; TCA; tebutam (CGP-5544); tebutiurón; terbacilo; terbucarb; terbumetón; terbutilazina; terbutrin; TFH 450, es decir N,N-dietil-3-[(2-etil-6-metil-fenil)-sulfonil]-1H-1,2,4-triazol-1-carboxamida; tenilcloro (NSK-850); tiazaflurón; tiazopir (Mon-13200); tidiazimina (SN-24085); tifensulfurón-metilo; tiobencarb; tiocarbazilo; tralcoxidim; tri-allato; triasulfurón; triaziflam; triazofenamida; tribenurón-metilo; triclopir; tridifano; trietazina; trifluralina; triflusulfurón y sus ésteres (p.ej. el éster metílico, DPX 66037); trimeturón; tsitodef; vernolato; WL 110547, es decir 5-fenoxi-1-[3-(trifluorometil)-fenil]-1H-tetrazol; JTC-101; UBH-509; D-489; LS 82-556; KPP-300; NC-324; NC-330; KH-218; DPX-N8189; SC-0774; DOWCO-535; DK-8910; V-53482; PP-600; MBH-001; KIH-9201; ET-751; KIH-9201; ET-751; KIH-6127 y KIH-2023.

Para la aplicación, las formulaciones presentes en una forma usual en el comercio se diluyen eventualmente de un modo usual, p.ej. mediante agua en el caso de polvos para proyectar, concentrados emulsionables, dispersiones y granulados dispersables en agua. Los preparados en forma de polvos finos, los granulados para el suelo o para esparcir así como las soluciones atomizables ya no se diluyen usualmente antes de la aplicación con otros materiales inertes.

Con las condiciones externas, tales como la temperatura, la humedad, el tipo del herbicida utilizado, etc, varía la cantidad consumida necesaria de los compuestos de la

fórmula (I). Ésta puede fluctuar dentro de amplios límites, p.ej. entre 0,001 y 10,0 kg/ha o más de sustancia activa, pero preferiblemente está situada entre 0,005 y 5 kg/ha.

A. Ejemplos químicos

Ejemplo A1
2-[(*terc.*-Butil-amino)sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo

A una solución de 1,00 g (3,58 mmol) de 2-(cloro-sulfonil)-6-nitro-benzoato de metilo en 8 ml de diclorometano se le añaden gota a gota a 0°C 1,4 ml (13,3 mmol) de terc.-butil-amina y la mezcla de reacción se deja llegar luego a la temperatura ambiente. Después de 2 h la mezcla de reacción se vierte sobre una mezcla de hielo y agua, se ajusta a pH 3 con ácido clorhídrico acuoso 2 N y se extrae con diclorometano. A continuación, la fase orgánica se seca sobre sulfato de sodio, se separa por filtración y se concentra hasta sequedad en vacío. El residuo remanente se digiere con dietil-éter y se filtra con succión. De esta manera se obtienen 1,06 g (91 % del rendimiento teórico) de 2-[(*terc.*-butil-amino)sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo de p. f. 89-91°C.

Ejemplo A2
2-(Amino-sulfonil)-6-nitro-benzoato de metilo

300 mg (0,948 mmol) de 2-[(*terc.*-butil-amino)sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo se agitan a la temperatura ambiente durante 4 h en 8 ml de ácido trifluoroacético. A continuación se concentra hasta sequedad en vacío y el residuo se digiere con dietil-éter. Después de haber filtrado con succión y secado quedan 230 mg (93 % del rendimiento teórico) de 2-(amino-sulfonil)-6-nitro-benzoato de metilo de p. f. 227-229°C.

Ejemplo A3

2-[(*terc.*-Butil-amino)sulfonil]-6-(isopropil-amino)benzoato de metilo

A una temperatura de 5 - 10°C se incorporan con agitación 925 mg (24,4 mmol) de borohidruro de sodio en 14 ml de ácido acético. Después de 1 h, esta mezcla se reúne primeramente con 1,42 g (24,4 mmol) de acetona, luego se mezcla con 700 mg (2,44 mmol) de 2-amino-6-[(*terc.*-butil-amino)sulfonil]-benzoato de metilo y se agita durante 2,5 h a 5 - 10°C). Para el tratamiento, la mezcla de reacción se vierte sobre una mezcla de hielo y agua, se neutraliza con una solución acuosa de amoníaco y se extrae con diclorometano. La fase orgánica se concentra y el residuo remanente se tritura con diisopropil-éter. Después de haber filtrado con succión y secado quedan 700 mg (89 % del rendimiento teórico) de 2-[(*terc.*-butil-amino)sulfonil]-6-(isopropil-amino)benzoato de metilo como un material sólido de color blanco de p.f. 110 - 112°C.

Ejemplo A4

2-Amino-6-[(*terc.*-butil-amino)sulfonil]benzoato de metilo

Una solución de 8,00 g (25,3 mmol) de 2-[(*terc.*-butil-amino)sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo se mezcla con 3,2 g de paladio sobre carbón activo (al 5 %) y se hidrogena bajo la presión normal durante 6 h a la temperatura ambiente. A continuación, la mezcla de reacción se filtra, el material filtrado se concentra hasta sequedad y el residuo se purifica por cromatografía en gel de sílice [DC (SiO_2) en acetato de etilo/n-heptano 1:1; R_f = 0,38] con una mezcla de acetato de etilo y n-heptano (1:1). Después de evaporación se obtienen 6,23 g (86 % del rendimiento teórico) de 2-amino-6-[(*terc.*-butil-amino)sulfonil]benzoato de metilo como un material sólido de color beige con un punto de fusión de 132 - 133°C.

Ejemplo A5

2-(Diisobutil-amino)-6-[([(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)-amino]carbonil-amino)sulfonil]benzoato de metilo

700 mg (2,04 mmol) de 2-(diisobutil-amino)-6-(sulfonil-amino)benzoato de metilo y 619 mg (2,25 mmol) de éster fenílico de ácido N-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)carbámico se disponen previamente en 10 ml de acetonitrilo. A la temperatura ambiente se añaden luego gota a gota 375 mg (2,51 mmol) de 1,8-diaza-biciclo[5.4.0]undec-7-eno(1,5-5) (DBU) y la mezcla de reacción se agita a esta temperatura durante 3 h. A continuación se vierte sobre una mezcla de hielo y agua y la solución se ajusta lentamente a pH 1 con ácido clorhídrico 2 N. El material sólido precipitado se filtra con succión, se lava posteriormente con agua y se seca. Se obtienen de esta manera 910 mg (91 % del rendimiento teórico) de 2-(diisobutil-amino)-6-[([(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)amino]carbonil-amino)sulfonil]benzoato de metilo de p.f. 166 - 167°C.

Ejemplo A6

2-[([(4,6-Dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)amino]carbonil-amino)-sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo

A una suspensión de 2,79 g (17,9 mmol) de 2-amino-4,6-dimetoxi-1,3,5-triazina, 1,28 g (19,7 mmol) de cianato de sodio, 1,45 ml (17,9 mmol) de piridina y 500 mg de un tamiz molecular recientemente activado (tamaño de poros 3Å) en 85 ml de acetonitrilo seco, se le añade gota a gota a 55 - 60°C en el transcurso de 2 h bajo argón una solución de 5,0 g (17,9 mmol) de éster metílico de ácido 2-cloro-sulfonil-6-nitro-benzoico en 55 ml de diclorometano seco. Después de haber agitado durante 7 h a esta temperatura se deja llegar a la temperatura ambiente. Después de otras 12 h la mezcla de reacción se concentra, el residuo se suspende en 200 ml de agua y se ajusta a pH 10 con una solución acuosa 2 N de hidróxido de sodio. El material sólido precipitado se filtra

con succión y el material filtrado se extrae con acetato de etilo. La fase orgánica se separa y la fase acuosa se ajusta a pH 1,5 con una solución acuosa 3 N de ácido clorhídrico y se sigue agitando durante 15 min en un baño de hielo. A continuación el material sólido precipitado se filtra con succión, se lava posteriormente primero con agua y luego con metanol, y se seca en vacío. De este modo se obtienen 2,88 g (36 % del rendimiento teórico) de 2-[([(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)amino]carbonil-amino)sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo de p.f. 185 - 195°C (con descomposición).

Ejemplo A7

2-Amino-6-[([(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)amino]-carbonil-amino)sulfonil]benzoato de metilo

50 mg (113 µmol) de 2-[([(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)-amino]carbonil-amino)sulfonil]-6-nitro-benzoato de metilo se suspenden en 3 ml de una mezcla de metanol y dimetil-formamida (5:1), se mezclan con 10 mg de paladio sobre carbón activo (al 5 %) y 1 mg (8,20 µmol) de (meta)vanadato de sodio y se hidrogena durante 3 h a la temperatura ambiente bajo la presión normal. A continuación, se separa por filtración, el material filtrado se concentra, el residuo se recoge en agua y se ajusta a pH 1,5 con una solución acuosa 3 N de ácido clorhídrico. El precipitado depositado se sigue agitando durante 10 min en un baño de hielo, luego se filtra con succión y se seca en vacío. Se obtienen 41 mg (87 % del rendimiento teórico) de 2-amino-6-[([(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)amino]carbonil-amino)-sulfonil]benzoato de metilo de p.f. 129 - 134°C (con descomposición).

Ejemplo A8

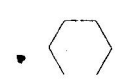
2-(Diisobutil-amino)-6-[([(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)-amino]carbonil-amino)sulfonil]benzoato de metilo, sal de sodio

En 5 ml de tetrahidrofurano se incorporan con agitación 0,2 g (0,382 mmol) de 2-(diisobutil-amino)-6-[([(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)amino]carbonil-amino)sulfonil]-benzoato de metilo y a continuación se añaden 0,04 g (416 µmol) de terc.-butilato de sodio. Después de 6 h, el material sólido resultante se filtra con succión y se seca. Se obtienen 0,19 g (93 % del rendimiento teórico) de 2-(diisobutil-amino)-6-[([(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)amino]carbonil-amino)-sulfonil]benzoato de metilo, sal de sodio, como un material sólido incoloro de p.f. 215 - 217°C.

Los compuestos descritos en las siguientes Tablas 1 y 2 se obtienen de acuerdo con los Ejemplos A1 - A8 anteriores o análogamente a ellos.

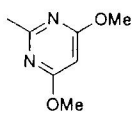
Abreviaturas en las Tablas 1 y 2

p.f. = punto de fusión en °C
(Z) = punto de fusión con descomposición
Bu = n-butilo (correspondientemente Pentilo = n-pentilo, Hexilo = n-hexilo)
Et = etilo
Me = metilo
Ph = fenilo
Pr, i-Pr, c-Pr = n-propilo, isopropilo o ciclopropilo
Un di-radical tal como butileno de la fórmula

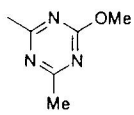


en las columnas para R^2, R^3 significa que R^2 y R^3 significan en común el puente de di-radical y forman con el átomo de N del grupo R^2R^3N una amina cíclica.

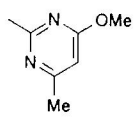
Het = heterociclo, representando Het uno de los radicales desde T1 hasta T20



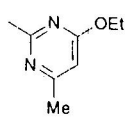
T1



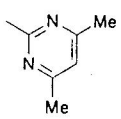
T2



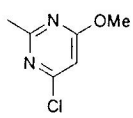
T3



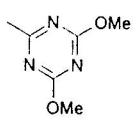
T4



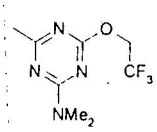
T5



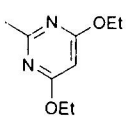
T6



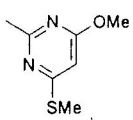
T7



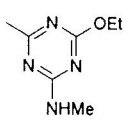
T8



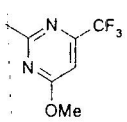
T9



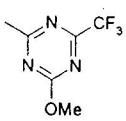
T10



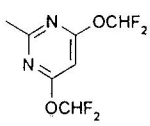
T11



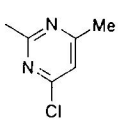
T12



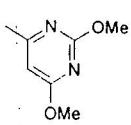
T13



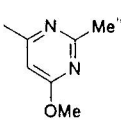
T14



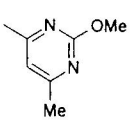
T15



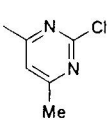
T16



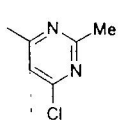
T17



T18

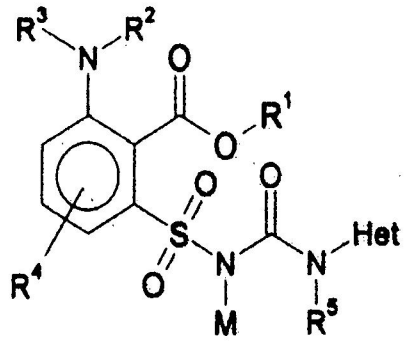


T19



T20

Tabla 1: Compuestos de la fórmula (Ia)



(Ia)

Ej.N°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-1.	H	H	H	-	H	H	T1	
1-2.	H	H	H	-	H	Na	T1	
1-3.	H	H	H	-	H	H	T2	
1-4.	H	H	H	-	H	Na	T2	
1-5.	H	H	H	-	H	H	T5	
1-6.	H	H	H	-	H	Na	T5	
1-7.	H	H	H	-	H	H	T6	
1-8.	H	H	H	-	H	Na	T6	
1-9.	H	H	H	-	H	H	T7	
1-10.	H	H	H	-	H	Na	T7	
1-11.	Me	H	H	-	H	H	T1	171-173
1-12.	Me	H	H	-	H	Na	T1	
1-13.	Me	H	H	-	Me	H	T2	
1-14.	Me	H	H	-	Me	Na	T2	
1-15.	Me	H	H	-	H	H	T2	126-127
1-16.	Me	H	H	-	H	Na	T2	
1-17.	Me	H	H	-	H	H	T3	
1-18.	Me	H	H	-	H	Na	T3	
1-19.	Me	H	H	-	H	H	T4	
1-20.	Me	H	H	-	H	Na	T4	
1-21.	Me	H	H	-	H	H	T5	
1-22.	Me	H	H	-	H	Na	T5	
1-23.	Me	H	H	-	H	H	T6	137-139
1-24.	Me	H	H	-	H	Na	T6	
1-25.	Me	H	H	-	H	H	T7	129-134 (Z)
1-26.	Me	H	H	-	H	Na	T7	
1-27.	Me	H	H	-	Me	H	T7	
1-28.	Me	H	H	-	Me	Na	T7	
1-29.	Me	H	H	-	H	H	T8	
1-30.	Me	H	H	-	H	Na	T8	
1-31.	Me	H	H	-	H	H	T9	
1-32.	Me	H	H	-	H	Na	T9	
1-33.	Me	H	H	-	H	H	T10	
1-34.	Me	H	H	-	H	Na	T10	
1-35.	Me	H	H	-	H	H	T11	
1-36.	Me	H	H	-	H	Na	T11	
1-37.	Me	H	H	-	H	H	T12	
1-38.	Me	H	H	-	H	Na	T12	

Ej. N°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-39.	Me	H	H	-	H	H	T13	
1-40.	Me	H	H	-	H	Na	T13	
1-41.	Me	H	H	-	H	H	T14	
1-42.	Me	H	H	-	H	Na	T14	
1-43.	Me	H	H	-	H	H	T15	
1-44.	Me	H	H	-	H	Na	T15	
1-45.	Et	H	H	-	H	H	T1	164-166
1-46.	Et	H	H	-	H	Na	T1	
1-47.	Et	H	H	-	H	H	T2	149-151
1-48.	Et	H	H	-	H	Na	T2	
1-49.	Et	H	H	-	H	H	T3	
1-50.	Et	H	H	-	H	Na	T3	
1-51.	Et	H	H	-	H	H	T4	
1-52.	Et	H	H	-	H	Na	T4	
1-53.	Et	H	H	-	H	H	T5	
1-54.	Et	H	H	-	H	Na	T5	
1-55.	Et	H	H	-	H	H	T6	157-158
1-56.	Et	H	H	-	H	Na	T6	
1-57.	Et	H	H	-	H	H	T7	158-160
1-58.	Et	H	H	-	H	Na	T7	
1-59.	Et	H	H	-	H	H	T8	
1-60.	Et	H	H	-	H	Na	T8	
1-61.	Et	H	H	-	H	H	T9	
1-62.	Et	H	H	-	H	Na	T9	
1-63.	Et	H	H	-	H	H	T10	
1-64.	Et	H	H	-	H	Na	T10	
1-65.	Et	H	H	-	H	H	T11	
1-66.	Et	H	H	-	H	Na	T11	
1-67.	Et	H	H	-	H	H	T12	
1-68.	Et	H	H	-	H	Na	T12	
1-69.	Et	H	H	-	H	H	T13	
1-70.	Et	H	H	-	H	Na	T13	
1-71.	Et	H	H	-	H	H	T14	
1-72.	Et	H	H	-	H	Na	T14	
1-73.	Et	H	H	-	H	H	T15	
1-74.	Et	H	H	-	H	Na	T15	
1-75.	i-Pr	H	H	-	H	H	T1	
1-76.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T1	
1-77.	i-Pr	H	H	-	H	H	T2	
1-78.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T2	
1-79.	i-Pr	H	H	-	H	H	T5	
1-80.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T5	
1-81.	i-Pr	H	H	-	H	H	T6	
1-82.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T6	
1-83.	i-Pr	H	H	-	H	H	T7	
1-84.	i-Pr	H	H	-	H	Na	T7	
1-85.	Allil	H	H	-	H	H	T1	
1-86.	Allil	H	H	-	H	Na	T1	
1-87.	Allil	H	H	-	H	H	T2	
1-88.	Allil	H	H	-	H	Na	T2	
1-89.	Allil	H	H	-	H	H	T5	
1-90.	Allil	H	H	-	H	Na	T5	
1-91.	Allil	H	H	-	H	H	T6	
1-92.	Allil	H	H	-	H	Na	T6	
1-93.	Allil	H	H	-	H	H	T7	
1-94.	Allil	H	H	-	H	Na	T7	

Ej.N°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-95.	3-Oxetanil	H	H	-	H	H	T1	
1-96.	3-Oxetanil	H	H	-	H	Na	T1	
1-97.	3-Oxetanil	H	H	-	H	H	T2	
1-98.	3-Oxetanil	H	H	-	H	Na	T2	
1-99.	3-Oxetanil	H	H	-	H	H	T5	
1-100.	3-Oxetanil	H	H	-	H	Na	T5	
1-101.	3-Oxetanil	H	H	-	H	H	T6	
1-102.	3-Oxetanil	H	H	-	H	Na	T6	
1-103.	3-Oxetanil	H	H	-	H	H	T7	
1-104.	3-Oxetanil	H	H	-	H	Na	T7	
1-105.	Me	Me	H	-	H	H	T1	
1-106.	Me	Me	H	-	H	Na	T1	
1-107.	Me	Me	H	-	H	H	T2	
1-108.	Me	Me	H	-	H	Na	T2	
1-109.	Me	Me	H	-	H	H	T6	
1-110.	Me	Me	H	-	H	Na	T6	
1-111.	Me	Me	H	-	H	H	T7	
1-112.	Me	Me	H	-	H	Na	T7	
1-113.	Et	Me	H	-	H	H	T1	
1-114.	Et	Me	H	-	H	Na	T1	
1-115.	Et	Me	H	-	H	H	T2	
1-116.	Et	Me	H	-	H	Na	T2	
1-117.	i-Pr	Me	H	-	H	H	T1	
1-118.	i-Pr	Me	H	-	H	Na	T1	
1-119.	i-Pr	Me	H	-	H	H	T2	
1-120.	i-Pr	Me	H	-	H	Na	T2	
1-121.	Alil	Me	H	-	H	H	T1	
1-122.	Alil	Me	H	-	H	Na	T1	
1-123.	Alil	Me	H	-	H	H	T2	
1-124.	Alil	Me	H	-	H	Na	T2	
1-125.	3-Oxetanil	Me	H	-	H	H	T1	
1-126.	3-Oxetanil	Me	H	-	H	Na	T1	
1-127.	3-Oxetanil	Me	H	-	H	H	T2	
1-128.	3-Oxetanil	Me	H	-	H	Na	T2	
1-129.	Me	Et	H	-	H	H	T1	
1-130.	Me	Et	H	-	H	Na	T1	
1-131.	Me	Et	H	-	H	H	T2	
1-132.	Me	Et	H	-	H	Na	T2	
1-133.	Me	Et	H	-	H	H	T6	
1-134.	Me	Et	H	-	H	Na	T6	
1-135.	Me	Et	H	-	H	H	T7	
1-136.	Me	Et	H	-	H	Na	T7	
1-137.	Et	Et	H	-	H	H	T1	
1-138.	Et	Et	H	-	H	Na	T1	
1-139.	Et	Et	H	-	H	H	T2	
1-140.	Et	Et	H	-	H	Na	T2	
1-141.	i-Pr	Et	H	-	H	H	T1	
1-142.	i-Pr	Et	H	-	H	Na	T1	
1-143.	i-Pr	Et	H	-	H	H	T2	
1-144.	i-Pr	Et	H	-	H	Na	T2	
1-145.	Alil	Et	H	-	H	H	T1	
1-146.	Alil	Et	H	-	H	Na	T1	
1-147.	Alil	Et	H	-	H	H	T2	
1-148.	Alil	Et	H	-	H	Na	T2	
1-149.	3-Oxetanil	Et	H	-	H	H	T1	
1-150.	3-Oxetanil	Et	H	-	H	Na	T1	

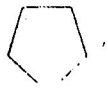
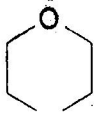
Ej.N°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-151.	3-Oxetanil	Et	H	-	H	H	T2	
1-152.	3-Oxetanil	Et	H	-	H	Na	T2	
1-153.	Me	i-Pr	H	-	H	H	T1	165-167
1-154.	Me	i-Pr	H	-	H	Na	T1	124-126
1-155.	Me	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-156.	Me	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-157.	Me	i-Pr	H	-	H	H	T6	
1-158.	Me	i-Pr	H	-	H	Na	T6	
1-159.	Me	i-Pr	H	-	H	H	T7	
1-160.	Me	i-Pr	H	-	H	Na	T7	
1-161.	Et	i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-162.	Et	i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-163.	Et	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-164.	Et	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-165.	i-Pr	i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-166.	i-Pr	i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-167.	i-Pr	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-168.	i-Pr	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-169.	Alil	i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-170.	Alil	i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-171.	Alil	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-172.	Alil	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-173.	3-Oxetanil	i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-174.	3-Oxetanil	i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-175.	3-Oxetanil	i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-176.	3-Oxetanil	i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-177.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-178.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-179.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-180.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-181.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T6	
1-182.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T6	
1-183.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T7	
1-184.	Me	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T7	
1-185.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-186.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-187.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-188.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-189.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T6	
1-190.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T6	
1-191.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T7	
1-192.	Et	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T7	
1-193.	i-Pr	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-194.	i-Pr	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-195.	i-Pr	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-196.	i-Pr	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-197.	Alil	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-198.	Alil	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-199.	Alil	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-200.	Alil	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-201.	3-Oxetanil	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T1	
1-202.	3-Oxetanil	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T1	
1-203.	3-Oxetanil	CH_2i-Pr	H	-	H	H	T2	
1-204.	3-Oxetanil	CH_2i-Pr	H	-	H	Na	T2	
1-205.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-206.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	

Ej.N°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-207.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-208.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-209.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T6	
1-210.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T6	
1-211.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T7	
1-212.	Me	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T7	
1-213.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-214.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	
1-215.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-216.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-217.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T6	
1-218.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T6	
1-219.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T7	
1-220.	Et	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T7	
1-221.	i-Pr	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-222.	i-Pr	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	
1-223.	i-Pr	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-224.	i-Pr	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-225.	Alil	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-226.	Alil	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	
1-227.	Alil	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-228.	Alil	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-229.	3-Oxetanil	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T1	
1-230.	3-Oxetanil	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T1	
1-231.	3-Oxetanil	CH_2CH_2F	H	-	H	H	T2	
1-232.	3-Oxetanil	CH_2CH_2F	H	-	H	Na	T2	
1-233.	Me	Alil	H	-	H	H	T1	
1-234.	Me	Alil	H	-	H	Na	T1	
1-235.	Me	Alil	H	-	H	H	T2	
1-236.	Me	Alil	H	-	H	Na	T2	
1-237.	Me	Alil	H	-	H	H	T6	
1-238.	Me	Alil	H	-	H	Na	T6	
1-239.	Me	Alil	H	-	H	H	T7	
1-240.	Me	Alil	H	-	H	Na	T7	
1-241.	Et	Alil	H	-	H	H	T1	
1-242.	Et	Alil	H	-	H	Na	T1	
1-243.	Et	Alil	H	-	H	H	T2	
1-244.	Et	Alil	H	-	H	Na	T2	
1-245.	Et	Alil	H	-	H	H	T6	
1-246.	Et	Alil	H	-	H	Na	T6	
1-247.	Et	Alil	H	-	H	H	T7	
1-248.	Et	Alil	H	-	H	Na	T7	
1-249.	i-Pr	Alil	H	-	H	H	T1	
1-250.	i-Pr	Alil	H	-	H	Na	T1	
1-251.	i-Pr	Alil	H	-	H	H	T2	
1-252.	i-Pr	Alil	H	-	H	Na	T2	
1-253.	Alil	Alil	H	-	H	H	T1	
1-254.	Alil	Alil	H	-	H	Na	T1	
1-255.	Alil	Alil	H	-	H	H	T2	
1-256.	Alil	Alil	H	-	H	Na	T2	
1-257.	3-Oxetanil	Alil	H	-	H	H	T1	
1-258.	3-Oxetanil	Alil	H	-	H	Na	T1	
1-259.	3-Oxetanil	Alil	H	-	H	H	T2	
1-260.	3-Oxetanil	Alil	H	-	H	Na	T2	
1-261.	Me	Propargil	H	-	H	H	T1	
1-262.	Me	Propargil	H	-	H	Na	T1	

Ej.N°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-263.	Me	Propargil	H	-	H	H	T2	
1-264.	Me	Propargil	H	-	H	Na	T2	
1-265.	Me	Propargil	H	-	H	H	T6	
1-266.	Me	Propargil	H	-	H	Na	T6	
1-267.	Me	Propargil	H	-	H	H	T7	
1-268.	Me	Propargil	H	-	H	Na	T7	
1-269.	Et	Propargil	H	-	H	H	T1	
1-270.	Et	Propargil	H	-	H	Na	T1	
1-271.	Et	Propargil	H	-	H	H	T2	
1-272.	Et	Propargil	H	-	H	Na	T2	
1-273.	Et	Propargil	H	-	H	H	T6	
1-274.	Et	Propargil	H	-	H	Na	T6	
1-275.	Et	Propargil	H	-	H	H	T7	
1-276.	Et	Propargil	H	-	H	Na	T7	
1-277.	i-Pr	Propargil	H	-	H	H	T1	
1-278.	i-Pr	Propargil	H	-	H	Na	T1	
1-279.	i-Pr	Propargil	H	-	H	H	T2	
1-280.	i-Pr	Propargil	H	-	H	Na	T2	
1-281.	Alil	Propargil	H	-	H	H	T1	
1-282.	Alil	Propargil	H	-	H	Na	T1	
1-283.	Alil	Propargil	H	-	H	H	T2	
1-284.	Alil	Propargil	H	-	H	Na	T2	
1-285.	3-Oxetanil	Propargil	H	-	H	H	T1	
1-286.	3-Oxetanil	Propargil	H	-	H	Na	T1	
1-287.	3-Oxetanil	Propargil	H	-	H	H	T2	
1-288.	3-Oxetanil	Propargil	H	-	H	Na	T2	
1-289.	Me	OMe	H	-	H	H	T1	
1-290.	Me	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-291.	Me	OMe	H	-	H	H	T2	
1-292.	Me	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-293.	Me	OMe	H	-	H	H	T6	
1-294.	Me	OMe	H	-	H	Na	T6	
1-295.	Me	OMe	H	-	H	H	T7	
1-296.	Me	OMe	H	-	H	Na	T7	
1-297.	Et	OMe	H	-	H	H	T1	
1-298.	Et	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-299.	Et	OMe	H	-	H	H	T2	
1-300.	Et	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-301.	Et	OMe	H	-	H	H	T6	
1-302.	Et	OMe	H	-	H	Na	T6	
1-303.	Et	OMe	H	-	H	H	T7	
1-304.	Et	OMe	H	-	H	Na	T7	
1-305.	i-Pr	OMe	H	-	H	H	T1	
1-306.	i-Pr	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-307.	i-Pr	OMe	H	-	H	H	T2	
1-308.	i-Pr	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-309.	Alil	OMe	H	-	H	H	T1	
1-310.	Alil	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-311.	Alil	OMe	H	-	H	H	T2	
1-312.	Alil	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-313.	3-Oxetanil	OMe	H	-	H	H	T1	
1-314.	3-Oxetanil	OMe	H	-	H	Na	T1	
1-315.	3-Oxetanil	OMe	H	-	H	H	T2	
1-316.	3-Oxetanil	OMe	H	-	H	Na	T2	
1-317.	Me	NMe_2	H	-	H	H	T1	
1-318.	Me	NMe_2	H	-	H	Na	T1	

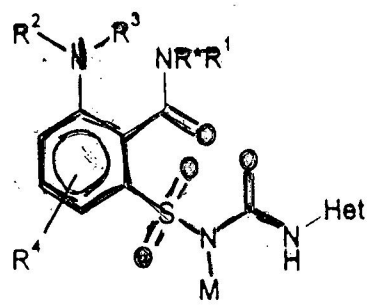
Ej.N°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^6	M	Het	P.f.
1-319.	Me	NMe_2	H	-	H	H	T2	
1-320.	Me	NMe_2	H	-	H	Na	T2	
1-321.	Me	NHCHO	H	-	H	H	T1	
1-322.	Me	NHCHO	H	-	H	Na	T1	
1-323.	Me	NHCHO	H	-	H	H	T2	
1-324.	Me	NHCHO	H	-	H	Na	T2	
1-325.	Me	NHC(O)Me	H	-	H	H	T1	
1-326.	Me	NHC(O)Me	H	-	H	Na	T1	
1-327.	Me	NHC(O)Me	H	-	H	H	T2	
1-328.	Me	NHC(O)Me	H	-	H	Na	T2	
1-329.	Me	$NHSO_2Me$	H	-	H	H	T1	
1-330.	Me	$NHSO_2Me$	H	-	H	Na	T1	
1-331.	Me	$NHSO_2Me$	H	-	H	H	T2	
1-332.	Me	$NHSO_2Me$	H	-	H	Na	T2	
1-333.	Me	CH_2Ph	H	-	H	H	T1	
1-334.	Me	CH_2Ph	H	-	H	Na	T1	
1-335.	Me	CH_2Ph	H	-	H	H	T2	
1-336.	Me	CH_2Ph	H	-	H	Na	T2	
1-337.	Me	CH_2OMe	H	-	H	H	T1	
1-338.	Me	CH_2OMe	H	-	H	Na	T1	
1-339.	Me	CH_2OMe	H	-	H	H	T2	
1-340.	Me	CH_2OMe	H	-	H	Na	T2	
1-341.	Me	$CH_2C(O)Me$	H	-	H	H	T1	
1-342.	Me	$CH_2C(O)Me$	H	-	H	Na	T1	
1-343.	Me	$CH_2C(O)Me$	H	-	H	H	T2	
1-344.	Me	$CH_2C(O)Me$	H	-	H	Na	T2	
1-345.	Me	$CH_2C(O)OMe$	H	-	H	H	T1	
1-346.	Me	$CH_2C(O)OMe$	H	-	H	Na	T1	
1-347.	Me	$CH_2C(O)OMe$	H	-	H	H	T2	
1-348.	Me	$CH_2C(O)OMe$	H	-	H	Na	T2	
1-349.	Me	Me	Me	-	H	H	T1	
1-350.	Me	Me	Me	-	H	Na	T1	
1-351.	Me	Me	Me	-	H	H	T2	
1-352.	Me	Me	Me	-	H	Na	T2	
1-353.	Me	Me	Me	-	H	H	T6	
1-354.	Me	Me	Me	-	H	Na	T6	
1-355.	Me	Me	Me	-	H	H	T7	
1-356.	Me	Me	Me	-	H	Na	T7	
1-357.	Me	Me	Et	-	H	H	T1	
1-358.	Me	Me	Et	-	H	Na	T1	
1-359.	Me	Me	Et	-	H	H	T2	
1-360.	Me	Me	Et	-	H	Na	T2	
1-361.	Me	Me	i-Pr	-	H	H	T1	
1-362.	Me	Me	i-Pr	-	H	Na	T1	
1-363.	Me	Me	i-Pr	-	H	H	T2	
1-364.	Me	Me	i-Pr	-	H	Na	T2	
1-365.	Me	Et	Et	-	H	H	T1	207-209
1-366.	Me	Et	Et	-	H	Na	T1	
1-367.	Me	Et	Et	-	H	H	T2	
1-368.	Me	Et	Et	-	H	Na	T2	
1-369.	Me	i-Pr	i-Pr	-	H	H	T1	
1-370.	Me	i-Pr	i-Pr	-	H	Na	T1	
1-371.	Me	i-Pr	i-Pr	-	H	H	T2	
1-372.	Me	i-Pr	i-Pr	-	H	Na	T2	
1-373.	Me	CH_2i-Pr	CH_2i-Pr	-	H	H	T1	166-167
1-374.	Me	CH_2i-Pr	CH_2i-Pr	-	H	Na	T1	215-217

101
220
216

Ej.N°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	M	Het	P.f.
1-375.	Me	CH_2i-Pr	CH_2i-Pr	-	H	H	T2	
1-376.	Me	CH_2i-Pr	CH_2i-Pr	-	H	Na	T2	
1-377.	Me			-	H	H	T1	
1-378.	Me	"		-	H	Na	T1	
1-379.	Me	"		-	H	H	T2	
1-380.	Me	"		-	H	Na	T2	
1-381.	Me			-	H	H	T1	
1-382.	Me	"		-	H	Na	T1	
1-383.	Me	"		-	H	H	T2	
1-384.	Me	"		-	H	Na	T2	
1-385.	Me	H	H	5-Me	H	H	T1	
1-386.	Me	H	H	5-Me	H	Na	T1	
1-387.	Me	H	H	5-Me	H	H	T2	
1-388.	Me	H	H	5-Me	H	Na	T2	
1-389.	Me	H	H	5-F	H	H	T1	
1-390.	Me	H	H	5-F	H	Na	T1	
1-391.	Me	H	H	5-F	H	H	T2	
1-392.	Me	H	H	5-F	H	Na	T2	
1-393.	Me	H	H	5-Cl	H	H	T1	
1-394.	Me	H	H	5-Cl	H	Na	T1	
1-395.	Me	H	H	5-Cl	H	H	T2	
1-396.	Me	H	H	5-Cl	H	Na	T2	
1-397.	Me	H	H	5-OMe	H	H	T1	
1-398.	Me	H	H	5-OMe	H	Na	T1	
1-399.	Me	H	H	5-OMe	H	H	T2	
1-400.	Me	H	H	5-OMe	H	Na	T2	
1-401.	Me	H	H	5-NO_2	H	H	T1	
1-402.	Me	H	H	5-NO_2	H	Na	T1	
1-403.	Me	H	H	5-NO_2	H	H	T2	
1-404.	Me	H	H	5-NO_2	H	Na	T2	
1-405.	Me	H	H	6-Me	H	H	T1	
1-406.	Me	H	H	6-Me	H	Na	T1	
1-407.	Me	H	H	6-Me	H	H	T2	
1-408.	Me	H	H	6-Me	H	Na	T2	
1-409.	Me	H	H	6-Cl	H	H	T1	
1-410.	Me	H	H	6-Cl	H	Na	T1	
1-411.	Me	H	H	6-Cl	H	H	T2	
1-412.	Me	H	H	6-Cl	H	Na	T2	

102
221
217

Tabla 2: Compuestos de la fórmula (Ib)



(Ib)

Ej.N°	R^1	R^*	R^2	R^3	R^4	M	Het	P.f.
2-1.	H	H	H	H	-	H	T1	
2-2.	H	H	H	H	-	Na	T1	
2-3.	H	H	H	H	-	H	T2	
2-4.	H	H	H	H	-	Na	T2	
2-5.	Me	Me	H	H	-	H	T1	
2-6.	Me	Me	H	H	-	Na	T1	
2-7.	Me	Me	H	H	-	H	T2	
2-8.	Me	Me	H	H	-	Na	T2	
2-9.	Me	Me	H	H	-	H	T5	
2-10.	Me	Me	H	H	-	Na	T5	
2-11.	Me	Me	H	H	-	H	T6	
2-12.	Me	Me	H	H	-	Na	T6	
2-13.	Me	Me	H	H	-	H	T7	
2-14.	Me	Me	H	H	-	Na	T7	
2-15.	Me	Me	Me	H	-	H	T1	
2-16.	Me	Me	Me	H	-	Na	T1	
2-17.	Me	Me	Me	H	-	H	T2	
2-18.	Me	Me	Me	H	-	Na	T2	
2-19.	Me	Me	Me	H	-	H	T5	
2-20.	Me	Me	Me	H	-	Na	T5	
2-21.	Me	Me	Me	H	-	H	T6	
2-22.	Me	Me	Me	H	-	Na	T6	
2-23.	Me	Me	Me	H	-	H	T7	
2-24.	Me	Me	Me	H	-	Na	T7	
2-25.	Me	Me	H	H	5-Me	H	T1	
2-26.	Me	Me	H	H	5-Me	Na	T1	
2-27.	Me	Me	H	H	5-Me	H	T2	
2-28.	Me	Me	H	H	5-Me	Na	T2	
2-29.	Me	Me	H	H	5-F	H	T1	
2-30.	Me	Me	H	H	5-F	Na	T1	
2-31.	Me	Me	H	H	5-F	H	T2	
2-32.	Me	Me	H	H	5-F	Na	T2	
2-33.	Me	Me	H	H	5-Cl	H	T1	
2-34.	Me	Me	H	H	5-Cl	Na	T1	
2-35.	Me	Me	H	H	5-OMe	H	T1	
2-36.	Me	Me	H	H	5-OMe	Na	T1	

103
222
218

Ej.N°	R^1	R^*	R^2	R^3	R^4	M	Het	P.f.
2-37.	Me	Me	H	H	5-NO_2	H	T1	
2-38.	Me	Me	H	H	5-NO_2	Na	T1	
2-39.	Me	Me	H	H	6-Me	H	T1	
2-40.	Me	Me	H	H	6-Me	Na	T1	
2-41.	Me	Me	H	H	6-Cl	H	T1	
2-42.	Me	Me	H	H	6-Cl	Na	T1	
2-43.	Me	Me	Me	H	5-Me	H	T1	
2-44.	Me	Me	Me	H	5-Me	Na	T1	
2-45.	Me	Me	Me	H	5-Cl	H	T1	
2-46.	Me	Me	Me	H	5-Cl	Na	T1	
2-47.	Me	Me	Me	H	5-OMe	H	T1	
2-48.	Me	Me	Me	H	5-OMe	Na	T1	
2-49.	Me	Me	Me	H	5-NO_2	H	T1	
2-50.	Me	Me	Me	H	5-NO_2	Na	T1	
2-51.	Me	Me	Me	H	6-Me	H	T1	
2-52.	Me	Me	Me	H	6-Me	Na	T1	
2-53.	Me	Me	Me	H	6-Cl	H	T1	
2-54.	Me	Me	Me	H	6-Cl	Na	T1	

B. **Ejemplos de formulación**

a) Se obtiene un agente para espolvorear, mezclando 10 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I) y 90 partes en peso de talco como material inerte y desmenuzándolas en un molino de impactos.

b) Se obtiene un polvo humectable, fácilmente dispersable en agua, mezclando 25 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I), 64 partes en peso de cuarzo que contiene caolín como material inerte, 10 partes en peso de la sal de potasio de ácido lignina-sulfónico y 1 parte en peso de la sal de sodio de ácido oleoil-metil-táurico como agente humectante y dispersante y moliéndolas en un molino de púas.

c) Se obtiene un concentrado para dispersión fácilmente dispersable en agua, mezclando 20 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I) con 6 partes en peso de un alquilfenol-poliglicol-éter (®Triton X-207), 3 partes en peso de isotridecanol-poliglicol-éter (8 OE = óxido de etileno) y 71 partes en peso de un aceite mineral parafínico (margen de ebullición p.ej. aproximadamente 255° hasta más de 277°C) y moliéndolas en un molino de bolas con fricción hasta una finura inferior a 5 micrómetros.

d) Se obtiene un concentrado emulsionable a partir de 15 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I), 75 partes en peso de ciclohexanona como disolvente y 10 partes en peso de nonilfenol oxietilado como emulsionante.

e) Se obtiene un granulado dispersable en agua, mezclando 75 partes en peso de un compuesto de fórmula (I), 10 partes en peso de la sal de calcio de ácido lignina-sulfónico,

5 partes en peso de lauril-sulfato de sodio,
3 partes en peso de un poli(alcohol vinílico) y
7 partes en peso de caolín
moliéndolas en un molino de púas y granulando el polvo en un lecho fluidizado mediante aplicación por atomización de agua como líquido de granulación.

f) Se obtiene también un granulado dispersable en agua, homogeneizando y desmenuzando previamente en un molino de coloides
25 partes en peso de un compuesto de la fórmula (I),
5 partes en peso de la sal de sodio de ácido 2,2'-dinaftilmetano-6,6-disulfónico,
2 partes en peso de la sal de sodio de ácido oleoil-metiltáurico,
1 parte en peso de un poli(alcohol vinílico),
17 partes en peso de carbonato de calcio y
50 partes en peso de agua
a continuación moliéndolas en un molino de perlas, y atomizando y secando la suspensión así obtenida en una torre de atomización mediante una boquilla para un sólo material y secándola.

C. Ejemplos biológicos

1. Efecto sobre las malezas según el procedimiento de antes del brote

Semillas o trozos de rizomas de plantas de malezas mono- y di-cotiledóneas se extendieron sobre macetas de cartón dentro de tierra de légamo arenosa y se cubrieron con tierra. Los compuestos conformes al invento formulados en forma de polvos humectables o concentrados para emulsión se aplicaron luego como suspensiones o emulsiones acuosas con una cantidad consumida de agua, que convertida por cálculo es de 600 a 800 l/ha en diferentes dosificaciones sobre la superficie de la tierra cubriente.

Después del tratamiento, las macetas se colocaron en un invernadero y se mantuvieron en buenas condiciones de crecimiento para las malezas. La evaluación visual de los daños para las plantas o para el brote se efectuó después de haber brotado las plantas experimentales después de un tiempo del experimento de 3 a 4 semanas en comparación con testigos sin tratar. Tal como lo muestran los resultados, los compuestos conformes al invento presentan una buena actividad herbicida antes del brote contra un amplio espectro de malezas y malas hierbas. Por ejemplo, los Ejemplos N°S. 1-11, 1–15, 1-23, 1-25, 1-45, 1-47, 1-55, 1-57, 1–153, 1-154, 1–365, 1-373, 1-374 y otros compuestos de las Tablas 1 y 2 manifiestan un muy buen efecto herbicida contra plantas dañinas tales como Sinapis alba, Chrysanthemun segetum, Avena sativa, Stellaria media, Echinochloa crus-gralli, Lolium multiflorum, Setaria spp; Abutilon theoprasti, Amaranthus retroflexus y Panicum miliaceun según el procedimiento de antes del brote con una cantidad consumida de 0,3 kg y menos de sustancia activa por hectárea.

2. Efecto sobre las malezas según el procedimiento de después del brote

Semillas o trozos de rizomas de malezas mono- y di-cotiledóneas se extendieron dentro de macetas de material plástico en tierra de légamo arenosa, se cubrieron con tierra y se cultivaron en un invernadero en buenas condiciones de crecimiento. A las tres semanas después de la siembra, las plantas experimentales se trataron en el estadio de tres hojas. Los compuestos conformes al invento formulados como polvos para proyectar o como concentrados para emulsión se proyectaron sobre las partes verdes de las plantas en diferentes dosificaciones con una cantidad consumida de agua que, convertida por cálculo, es de 600 a 800 l/ha. Después de un tiempo de permanencia en reposo de 3 a 4 semanas de las plantas experimentales en el invernadero en condiciones

107
226
222

óptimas de crecimiento, se valoró visualmente el efecto de los preparados en comparación con el de los testigos sin tratar. Los agentes conformes al invento presentan también después del brote una buena actividad herbicida contra un amplio espectro de malezas y malas hierbas económicamente importantes. Por ejemplo, los Ejemplos 1-11, 1-15, 1-23, 1-25, 1-45, 1-47, 1-55, 1-57, 1—153, 1-154, 1-365, 1-373, 1—374 y otros compuestos de las Tablas 1 y 2 tienen un efecto herbicida muy bueno contra plantas dañinas tales como Sinapis alba, Echinochloa crus-galli, Lolium multiflorum, Chrysanthemun segetum, Setaria spp, Abutilon theoprasti, Amaranthus retroflexus, Panicum miliaceum y Avena sativa, según el procedimiento de después del brote con una cantidad consumida de 0,3 kg y menos de sustancia activa por hectárea.

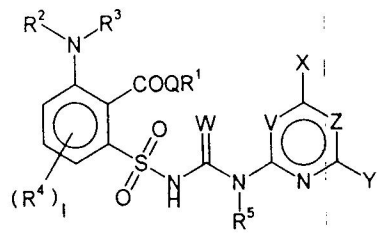
3. Compatibilidad con plantas cultivadas

En otros experimentos en un invernadero se colocaron semillas de un elevado número de plantas cultivadas y malezas en tierra de légamo arenoso y se cubrieron con tierra. Una parte de las macetas se trataron inmediatamente tal como se ha descrito en el párrafo 1, y las demás se colocaron en un invernadero hasta que las plantas hubieron desarrollado de dos a tres hojas verdaderas y luego se rociaron con las sustancias conformes al invento de la fórmula (I) en diferentes dosificaciones como se describe en el párrafo 2. A las cuatro hasta cinco semanas después de la aplicación y de tiempo de permanencia en el invernadero, se comprobó mediante valoración visual que los compuestos conformes al invento dejaron sin dañar a plantas cultivadas dicotiledóneas tales como de soja, algodón, colza, remolacha azucarera o patatas según los procedimientos de antes y después del brote incluso en el caso de altas dosificaciones de sustancias activas. Algunas sustancias protegieron además de ello también a cultivos de gramíneas tales como cebada, trigo, centeno, mijo, maíz o arroz. Los compuestos de las

fórmula (I) manifiestan en parte una alta selectividad y se adecuan por lo tanto para combatir un crecimiento indeseado de plantas en presencia de cultivos agrícolas.

Reivindicaciones

1. Compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales,



(I)

en la que

R^1 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C,

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0-, en la que

R^0 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, y

Q^0 significa un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó -N($R^\#$)-, significando **$R^\#$** un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo y estando el radical mencionado en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C,

R^3 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C,

o los

R^4 independientemente unos de otros, significan halógeno

OH, SH, un radical que contiene nitrógeno y está exento de carbono o un radical que contiene carbono, que tiene de 1 a 30 átomos de C,

l es 0, 1, 2 ó 3, preferiblemente 0 ó 1,

R^5 significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo, que está sin sustituir o sustituido e, inclusive los sustituyentes, tiene de 1 a 20 átomos de C,

Q es O, S ó NR*,

R* significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo, que está sin sustituir o sustituido e, inclusive los sustituyentes, tiene de 1 a 20 átomos de C,

W significa un átomo de oxígeno o azufre,

X, Y independientemente uno de otro, significan un átomo de hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, o mono- o di-[alquil (C_1-C_4)]amino, alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alquenil (C_3-C_6)-oxi o alquinil (C_3-C_6)-oxi, y

V, Z independientemente uno de otro, significan CH ó N.

2. Compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales según la reivindicación 1, en el que

R^1 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, fenilo sin sustituir y sustituido, heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo sin sustituir y sustituido, cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir y sustituido, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, [alcoxi (C_1-C_4)]carbonilo y [halo-alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, o significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sustituido o sin sustituir, fenilo sin sustituir o sustituido,

111
230
226

heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo sin sustituir o sustituido,

llevando el fenilo sustituido, el heterociclilo sustituido, el cicloalquilo sustituido o el cicloalquenilo sustituido como sustituyentes uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), di-[alcoxi (C_1-C_4)]-alquilo (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, OH, fenilo, CN y NO_2, y

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0,

en la que R^0 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, SH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, o significa cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalquenilo (C_3-C_6), fenilo o heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, pudiendo los cuatro radicales mencionados en último término estar sin sustituir o sustituidos, y

en la que Q^0 significa un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó -N($R^\#$)-, significando $R^\#$ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}),

estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquiltio (C_1-C_6), halo-alquil (C_1-C_6)-tio, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, o fenilo sin sustituir o sustituido, y R^0 y $R^{\#}$, en común con el átomo de N del grupo $NR^{\#}R^0$ pueden formar un radical heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo;

R^3 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_{12}), alquenilo (C_2-C_{12}) o alquinilo (C_2-C_{12}), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, o fenilo sin sustituir o sustituido, y

R^2 y R^3 en común con el átomo de N del grupo NR^2R^3 (N^1), pueden formar un radical heterociclilo, preferiblemente

con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo, no encontrándose preferiblemente el radical oxo en una posición contigua al átomo de N (N^1), y los

R^4 independientemente unos de otros, significan halógeno, CN, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alqueniloxi (C_3-C_6), alquiniloxi (C_3-C_6), estando cada uno de los 6 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, o hetrociclilo sin sustituir o sustituido, o

significan cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, heterociclilo sin sustituir o sustituido, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, fenilo sin sustituir o sustituido, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo o [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido en la parte de alquilo con uno o varios átomos de halógeno, o significan un radical de la fórmula C(O)-NR'-R'', C(S)-NR'-R'', CR'=N-Q^1-R'', $S(O)_m$-Q^1-R'''', $P(O)_n$(-Q^1-R''''Q^2-R''), NR'-Q^1-R'' ó NR'''-N=CR'-R'', significando R', R'' y R''', independientemente unos de otros, un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, significando R'''' un radical acilo que contiene carbono o un radical hidrocarbilo

114
235
229

(C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, y significando Q^1 y Q^2, independientemente uno de otro, un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula –O- ó –N(R^+)-, significando R^+ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, y pudiendo ser m = 0, 1, 2 ó 3, así como n = 0, 1 ó 2, y pudiendo formar R' con R'', R^+ con R', R^+ con R'' ó R^+ con R'''' en cada caso un radical heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, que puede estar sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo,

l es igual a 0, 1 ó 2, preferiblemente 0 ó 1,

R^5 es H o alquilo (C_1-C_4), que está sin sustituir o sustituido,

R^6 y R^7 independientemente uno de otro, significan H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6), fenilo sin sustituir o sustituido, o heterociclilo sin sustituir o sustituido, o

R^6 y R^7 en común con el átomo de N del grupo NR^6R^7 pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 átomos de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos adicionales tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo, y

R^8 y R^9 independientemente uno de otro, significan alquil (C_1-C_4)-carbonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-carbonilo, alcoxi (C_1-C_4)-carbonilo o alquil (C_1-C_4)-sulfonilo o, en común con el átomo de N del grupo NR^8R^9, pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 átomos de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos adicionales tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados entre el grupo

115 234 230

formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo, y

Q es O, S ó NR*,

R* significa alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4) o alquinilo (C_3-C_4), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio y

R* y R^1 en común con el átomo de N del grupo NR*R^1 pueden formar un radical heterociclilo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo,

X, Y independientemente uno de otro, significan H, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, mono- o di-[alquil (C_1-C_4)]-amino, alquenilo (C_3-C_5), alquenil (C_3-C_5)-oxi, alquinilo (C_3-C_5) o alquinil (C_3-C_5)-oxi, y

teniendo los radicales R^1, R^2, R^3 y R^4, inclusive los sustituyentes, en cada caso hasta 20 átomos de C.

3. Compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales según la reivindicación 1 ó 2, en el que

R^1 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6) o alquinilo (C_3-C_6), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, fenilo, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, cicloalquilo (C_3-C_6), heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo y [alcoxi (C_1-C_4)]carbonilo, o significa cicloalquilo (C_3-C_6) o heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, estando cada uno de los dos

radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4) y alcoxi (C_1-C_4),

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0-, en la que

R^0 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_3-C_8) o alquinilo (C_3-C_8), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, halo-alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3–C_6), NR^8R^9 y fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y NO_2, o

significa heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, o

significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN, OH y fenilo, o

significa cicloalquenilo (C_3-C_6), que está sin susti-

tuir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) y [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo o

significa fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, y

Q^0 significa un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó -$NR^{\#}$-, en el que $R^{\#}$ es un átomo de hidrógeno o alquilo (C_1-C_4) sin sustituir o sustituido,

R^3 significa un átomo de hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_3-C_8) o alquinilo (C_3-C_8), estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, halo-alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9 y fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y NO_2, o

significa heterociclilo, preferiblemente con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil

118
237
233

(C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, o

significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN, OH y fenilo, o

significa cicloalquenilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) y [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, o

significa fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), halo-alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, NR^8R^9, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo, fenilo, CN y NO_2, y

R^2 y R^3 en común con el átomo de N (N^1) pueden formar un heterociclo con 3-6 átomos de anillo, que es saturado, insaturado o aromático, y adicionalmente al átomo de N (N^1) puede contener uno o dos heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), halógeno, [alcoxi (C_1-C_3)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_3) y oxo, no encontrándose preferiblemente el radical oxo en posición contigua al átomo de N (N^1),

R^4 significa halógeno, CN, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alquenil (C_3-C_6)-oxi, alquinil (C_3-C_6)-oxi,

estando cada uno de los 6 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), halo-alcoxi (C_1-C_6), alquil

(C_1-C_6)-tio, halo-alquil (C_1-C_6)-tio, alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfinilo, alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, halo-alquil (C_1-C_6)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, [halo-alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, $CONR^6R^7$, $SO_2NR^6R^7$, CN, OH, cicloalquilo (C_3-C_6), NR^8R^9, fenilo sin sustituir o sustituido, o heterociclilo sin sustituir o sustituido, o significa cicloalquilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, cicloalquenilo (C_3-C_6) sin sustituir o sustituido, heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo sin sustituir o sustituido, fenilo sin sustituir o sustituido o [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo o [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido en la parte de alquilo con uno o varios átomos de halógeno, o significando un radical de la fórmula C(O)-NR'-R'', C(S)-NR'-R'', CR'=N-Q^1-R'', NR'-Q^1-R'' ó NR'''-N=CR'-R'', significando R', R'' y R''' independientemente unos de otros un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo (C_1-C_{10}) sin sustituir o sustituido, y significando Q^1 y Q^2 independientemente uno de otro un enlace directo o un grupo divalente de la fórmula -O- ó -N(R^+)-, significando R^+ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical alquilo (C_1-C_4) sin sustituir o sustituido, y pudiendo formar R' con R'' o R^+ con R' o R^+ con R'' en cada caso un radical heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, que está sin sustituir o sustituido, preferiblemente con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), [alcoxi (C_1-C_6)]-carbonilo, halo-alquilo (C_1-C_6) y oxo,

l es igual a 0 ó 1,

R^6 y R^7, independientemente uno de otro, significan H, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4), alquinilo (C_3-C_4), o fenilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi

(C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y NO_2, o

R^6 y R^7 en común con el átomo de N del grupo NR^6R^7, pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 miembros de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S, y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados del grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo,

R^8 y R^9 son alquil (C_1-C_4)-carbonilo, halo-alquil (C_1-C_4)-carbonilo, alcoxi (C_1-C_4)-carbonilo o alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, o en común con el átomo de N del grupo NR^8R^9 pueden formar un radical heterociclilo con 5 ó 6 átomos de anillo, que eventualmente puede contener uno o varios heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S y está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces con radicales tomados entre el grupo formado por alquilo (C_1-C_4) y oxo.

4. Compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales según una de las reivindicaciones 1 a 3, en el que

R^1 significa alquilo (C_1-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno y alcoxi (C_1-C_4), o
significa 3-oxetanilo, alquenilo (C_3-C_4) o alquinilo (C_3-C_4),

R^2 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6) o alquinilo (C_3-C_6), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, cicloalquilo (C_3-C_6), CN y OH, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y OH, o

significa cicloalquenilo (C_3-C_6), alcoxi (C_1-C_4), alquenil (C_1-C_4)-oxi, alquil (C_1-C_4)-amino o di-[alquil (C_1-C_4)]-amino y

R^3 significa H, alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, cicloalquilo (C_3-C_6), CN y OH, o
significa cicloalquilo (C_3-C_6), que está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), [alcoxi (C_1-C_4)]-carbonilo, CN y OH, o
significa cicloalquenilo (C_3-C_6), o

R^2 y R^3 en común con el átomo de N (N^1), pueden formar un heterociclo de 3-6 átomos de anillo, que es saturado, insaturado o heteroaromático, que adicionalmente al átomo de N (N^1) puede contener uno o dos heteroátomos tomados entre el grupo formado por N, O y S, y está sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), [alcoxi (C_1-C_3)]-carbonilo y oxo, no encontrándose preferiblemente el radical oxo en posición contigua al átomo de N (N^1), y

R^4 significa alquilo (C_1-C_4), halo-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) o halógeno,

l es igual a 0 ó 1, preferiblemente 0,

R^5 significa H o metilo,

Q significa O ó NR*,

R* significa H o alquilo (C_1-C_4),

X e Y independientemente uno de otro, significan alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios átomos de halógeno, o significan alquil (C_1-C_4)-tio, halógeno o mono- o di-[alquil (C_1-C_2)]-amino, y

W significa un átomo de oxígeno.

5. Compuesto de la fórmula (I) o sus sales según una de las reivindicaciones 1 a 4, en el que

R^1 significa alquilo (C_1-C_3), alilo o propargilo,

R^2 significa H, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_5), alquinilo (C_3-C_5), cicloalquilo (C_3-C_6) o cicloalquenilo (C_3-C_6),

R^3 significa H, alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_5), alquinilo (C_3-C_5), cicloalquilo (C_3-C_6) o cicloalquenilo (C_3-C_6),

R^4 significa alquilo (C_1-C_3) o halógeno,

l es igual a 0 ó 1, preferiblemente 0,

Q significa O ó NR*,

R* significa alquilo (C_1-C_3),

X significa alquilo (C_1-C_2), alcoxi (C_1-C_2), alquil (C_1-C_2)-tio, halo-alquilo (C_1-C_2) o halo-alcoxi (C_1-C_2),

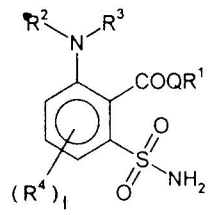
Y significa alquilo (C_1-C_2), alcoxi (C_1-C_2), halógeno, $NHCH_3$ ó $N(CH_3)_2$,

V significa CH ó N, preferiblemente N y

Z significa CH ó N.

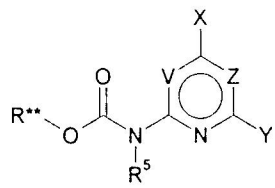
6. Procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula (I) o de sus sales como se definen en una o varias de las reivindicaciones 1 a 5, en el que

a) se hace reaccionar un compuesto de la fórmula (II)



(II)

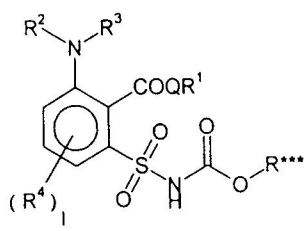
con un carbamato heterocíclico de la fórmula (III),



(III)

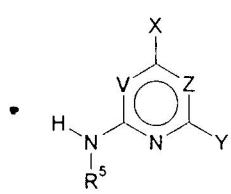
en la que **R**** significa un radical hidrocarbilo C_1-C_{20} sustituido o sin sustituir, o

b) se hace reaccionar un sulfonil-carbamato de la fórmula (IV)



(IV)

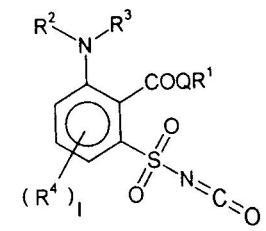
en la que **R***** significa un radical hidrocarbilo C_1-C_{20} sustituido o sin sustituir, con un amino-heterociclo de la fórmula (V)



(V)

o

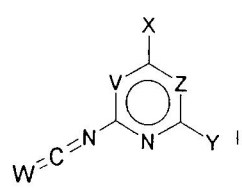
c) se hace reaccionar un sulfonil-isocianato de la fórmula (VI)



(VI)

con un amino-heterociclo de la fórmula (V), o

d) se hace reaccionar una sulfonamida de la fórmula (II) con un (tio)-isocianato de la fórmula (VII)

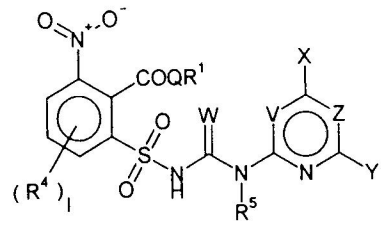


(VII)

en presencia de una base, o

e) se hace reaccionar un amino-heterociclo de la fórmula (V) en primer lugar de un modo catalizado por una base con un éster de ácido carbónico, y el compuesto intermedio formado se hace reaccionar en una reacción de un solo recipiente con una sulfonamida de la fórmula (II) (véase la variante a), o

f) se hace reaccionar una fenil-sulfonil-urea de la fórmula (VIII)



(VIII)

por reducción del grupo nitro, y eventualmente reacción ulterior de la función hidroxil-amino o amino puesta en libertad, para dar una sulfonil-urea de la fórmula (I)

estando en las fórmulas (II)-(VIII) los radicales, grupos e índices R^1-R^5, V, W, Y, Z y l definidos como en la fórmula (I) según la reivindicación 1.

7. Agente herbicida o regulador del crecimiento de las plantas, que contiene a) por lo menos un compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales según una de las reivindicaciones 1 a 5, y b) agentes coadyuvantes de formulaciones usuales en la protección de plantas.

8. Procedimiento para combatir plantas dañinas o para regular el crecimiento de plantas, aplicándose una cantidad eficaz de por lo menos un compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales según una de las reivindicaciones 1 a 5, sobre las plantas dañinas o sobre las plantas útiles, sus semillas de plantas o la superficie sobre la que crecen.

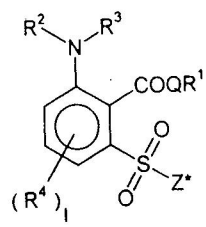
9. Utilización de los compuestos de la fórmula (I) o sus sales según una de las reivindicaciones 1 a 5 como agentes herbicidas o reguladores del crecimiento de las plantas.

10. Utilización según la reivindicación 9, empleándose los compuestos de las fórmulas (I) o sus sales para combatir

plantas dañinas o para regular el crecimiento en cultivos de plantas útiles u ornamentales.

11. Utilización según la reivindicación 10, en que las plantas cultivadas son plantas cultivadas transgénicas.

12. Compuesto de la fórmula (II*)

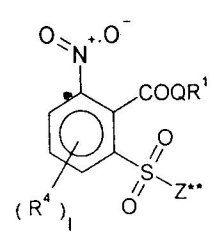


(II*)

en la que **Z*** = NH_2, NHCOOR***, NCO o NH-terc.-butilo, y R^1–R^4, **l** y **Q** están definidos como en la fórmula (I) según la reivindicación 1 y **R***** está definido como en la fórmula (IV) según la reivindicación 6.

13. Utilización de un compuesto de la fórmula (II') como se define en la reivindicación 12, para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) según la reivindicación 1.

14. Compuesto de la fórmula (X*)

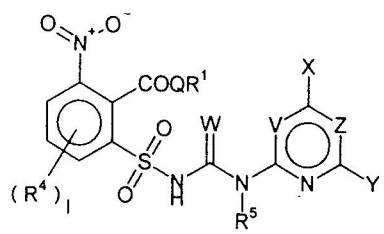


(X*)

en la que **Z**** significa = NH_2, NH-terc.-butilo o Cl y R^1, R^4, **l** y **Q** están definidos como en la fórmula (I) según la reivindicación 1, y estando excluidos los compuestos en los que **Z**** es Cl, **l** = 0, **Q** = O y R^1 = H, metilo, etilo o alilo.

15. Utilización de un compuesto de la fórmula (X') como se define en la reivindicación 14, en la que **Z***** es igual a NH_2, o NH-terc.-butilo, para la preparación de un compuesto de la fórmula (II*) como se define en la reivindicación 12, en la que **Z*** es igual a NH_2 o NH-terc.-butilo.

16. Compuestos de la fórmula (VIII)



(VIII)

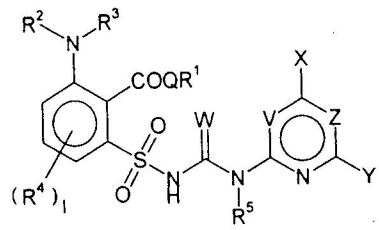
en la que R^1, R^4, R^5, Q, V, W, X, Y, Z y l están definidos como en la fórmula (I) según la reivindicación 1.

17. Utilización de un compuesto de la fórmula (VIII) como se ha definido en la reivindicación 16, para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) como se ha definido en la reivindicación 1.

Resumen

Fenil-sulfonil-ureas, procedimientos para su preparación y su utilización como herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas

Los compuestos de la fórmula (I) o sus sales



(I)

en la que

R^1 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

R^2 significa un grupo de la fórmula R^0-Q^0-, en la que

R^0 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C, y

Q^0 significa un enlace directo o un grupo de la fórmula -O- ó -N($R^{\#}$)-, significando $R^{\#}$ un átomo de hidrógeno, un radical acilo o un radical hidrocarbilo y estando el radical mencionado en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C,

R^3 significa un átomo de hidrógeno, un radical hidrocarbilo o un radical heterociclilo, estando cada uno de los dos radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido y teniendo, inclusive los sustituyentes, de 1 a 30 átomos de C, preferiblemente de 1 a 20 átomos de C, o los

R^4 independientemente unos de otros, significan halógeno OH, SH, un radical que contiene nitrógeno y está exento de carbono, o un radical que contiene carbono,

l es 0, 1, 2 ó 3, preferiblemente 0 ó 1,

R^5 significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo C_1-C_{10}, que está sin sustituir o sustituido, tal como alquilo (C_1-C_4), preferiblemente H ó CH_3,

Q es O, S ó NR*,

R* significa un átomo de hidrógeno o un radical hidrocarbilo C_1-C_{10}, que está sin sustituir o sustituido, tal como alquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_3-C_4) o alquinilo (C_3-C_4), estando cada uno de los tres radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio,

W significa un átomo de oxígeno o azufre,

X, Y independientemente uno de otro, significan un átomo de hidrógeno, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4)-tio, estando cada uno de los 3 radicales mencionados en último término sin sustituir o sustituido con uno o varios radicales tomados entre el grupo formado por halógeno, alcoxi (C_1-C_4) y alquil (C_1-C_4)-tio, o mono- o di-[alquil (C_1-C_4)]amino, alquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), alquenil (C_3-C_6)-oxi o alquinil (C_3-C_6)-oxi, y

V, Z independientemente uno de otro, significan CH ó N,

se adecuan como herbicidas o reguladores del crecimiento de las plantas, p.ej. para combatir plantas dañinas en presencia de plantas cultivadas, también plantas cultivadas transgénicas. Se pueden preparar estos compuestos de acuerdo con procedimientos según la reivindicación 6 pasando en

parte por productos intermedios nuevos (compárense los compuestos (II*) y (X*) y (VIII) según las reivindicaciones 12, 14 y 16).