

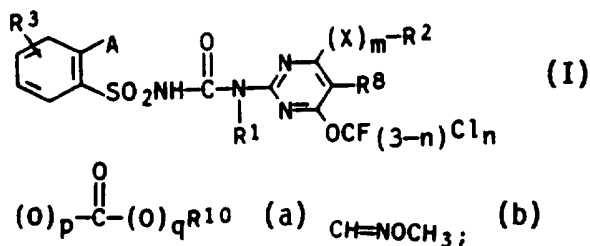


**PCT**  
WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales Büro  
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

<p><b>(51) Internationale Patentklassifikation<sup>5</sup> :</b> C07D 521/00, A01N 47/36 C07D 239/47, 239/48, 239/52</p>	<b>A3</b>	<p><b>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer:</b> WO 93/05048</p> <p><b>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum:</b> 18. März 1993 (18.03.93)</p>
<p><b>(21) Internationales Aktenzeichen:</b> PCT/EP92/01879</p> <p><b>(22) Internationales Anmeldedatum:</b> 25. August 1992 (25.08.92)</p> <p><b>(30) Prioritätsdaten:</b> P 41 28 441.0      28. August 1991 (28.08.91)      DE</p> <p><b>(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US):</b> BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Carl-Bosch-Strasse 38, D-6700 Ludwigshafen (DE).</p> <p><b>(72) Erfinder; und</b> <b>(75) Erfinder/Anmelder (nur für US) :</b> HAMPRECHT, Gerhard [DE/DE]; Rote-Turm-Strasse 28, D-6940 Weinheim (DE). MAYER, Horst [DE/DE]; Faselwiese 19, D-6700 Ludwigshafen (DE). WESTPHALEN, Karl-Otto [DE/DE]; Mausbergweg 58, D-6720 Speyer (DE). WALTER, Helmut [DE/DE]; Gruenstadter Strasse 82, D-6719 Ob-origheim (DE). GERBER, Matthias [DE/DE]; Ritterstrasse 3, D-6704 Mutterstadt (DE). KARDORFF, Uwe [DE/DE]; D 3, 4, D-6800 Mannheim 1 (DE).</p>	<p><b>(74) Gemeinsamer Vertreter:</b> BASF AKTIENGESELLSCHAFT; Carl-Bosch-Strasse 38, D-6700 Ludwigshafen (DE).</p> <p><b>(81) Bestimmungsstaaten:</b> CA, HU, JP, KR, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, SE).</p> <p><b>Veröffentlicht</b> <i>Mit internationalem Recherchenbericht. Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen einreffen.</i></p> <p><b>(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts:</b> 27. Mai 1993 (27.05.93)</p>	

**(54) Title:** HERBICIDAL SULPHONYL UREAS, PROCESS AND INTERMEDIATES FOR PRODUCING THE SAME

**(54) Bezeichnung:** HERBIZIDE SULFONYLHARNSTOFFE, VERFAHREN UND ZWISCHENPRODUKTE ZU IHRER HERSTELLUNG



**(57) Abstract**

Substituted sulphonyl ureas have the general formula (I), in which n and m equal 0 or 1 and the substituents have the following meaning: R<sup>1</sup> is hydrogen, alkyl, alkenyl or alkynyl; R<sup>2</sup> is halogen or trifluoromethyl, when m equals 0 or, when m equals 1, R<sup>2</sup> is alkyl, alkenyl or alkynyl, and when X stands for O or S and m equals 1, trifluoromethyl or chlorodifluoromethyl; X is O, S or N-R<sup>4</sup>, whereas R<sup>4</sup> is hydrogen or alkyl; R<sup>3</sup> is hydrogen, halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy or halogenalkoxy; A is NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, OH, CN, SCN, S(O)<sub>o</sub>R<sup>5</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, ER<sup>7</sup>, whereas E stands for O, S or NR<sup>9</sup>, the groups (a), (b) possibly substituted C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkenyl; R<sup>5</sup> is a possibly substituted alkyl group, a possibly substituted cycloalkyl group, an alkenyl group or an alkynyl group; R<sup>6</sup> is hydrogen, an alkoxy group, an alkyl group, or represents together with R<sup>7</sup> a C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-alkylene chain, wherein a methylene group may be substituted by an oxygen atom or a C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylimino group; R<sup>7</sup> is a possibly substituted alkyl, alkenyl or alkynyl group, a cycloalkyl group and may also represent, when E = NR<sup>9</sup>, methyl sulphone, trifluoromethyl sulphone, ethylsulphone, possibly halogen-substituted acetyl, dimethylcarbamoyl, dimethylsulphamoyl; o equals 0, 1 or 2; p, q equal 0 and/or 1 (when p = 0, q = 0); R<sup>8</sup> is hydrogen or halogen; R<sup>9</sup> is hydrogen, methyl, ethyl; R<sup>10</sup> is alkyl, halogenalkyl, alkoxyalkyl, alkenyl, cycloalkyl, halogenalkenyl or, when p = 1 and q = 0, it may also be alkylamino or dialkylamino. Also disclosed are their environmentally compatible salts, a process and intermediates for producing the compounds having the formula (I) and their use as herbicides.

**(57) Zusammenfassung** Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte Sulfonylharnstoffe der allgemeinen Formel (I), in der n und m für 0 oder 1 stehen und die Substituenten folgende Bedeutung haben: R<sup>1</sup> Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl; R<sup>2</sup> Halogen oder Trifluormethyl, wenn m für 0 steht oder, wenn m 1 bedeutet, Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl sowie wenn X für O oder S und m für 1 steht, Trifluor- oder Chlordifluormethyl; X O, S oder N-R<sup>4</sup>, wobei R<sup>4</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht; R<sup>3</sup> Wasserstoff, Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy oder Halogenalkoxy; A NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, OH, CN, SCN, S(O)<sub>0</sub>R<sup>5</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, ER<sup>7</sup>, worin E für O, S oder NR<sup>9</sup> steht, der Rest (a), (b); ggf. substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl; R<sup>5</sup> eine ggf. substituierte Alkylgruppe, eine ggf. substituierte Cycloalkylgruppe, eine Alkenylgruppe oder eine Alkynylgruppe; R<sup>6</sup> Wasserstoff, eine Alkoxygruppe, eine Alkylgruppe, oder gemeinsam mit R<sup>7</sup> eine C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylkette, worin eine Methylengruppe durch ein Sauerstoffatom oder eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyliminogruppe ersetzt sein kann, bedeutet; R<sup>7</sup> eine ggf. substituierte Alkyl-, Alkenyl- oder Alkynylgruppe, eine Cycloalkylgruppe, ferner im Fall von E = NR<sup>9</sup> noch Methylsulfon, Trifluormethylsulfon, Ethylsulfon, ggf. halogensubstituiertes Acetyl, Dimethylcarbamoyl, Dimethylsulfamoyl; o 0, 1 oder 2, p, q 0 und/oder 1 (wenn p = 0, q = 0); R<sup>8</sup> Wasserstoff oder Halogen; R<sup>9</sup> Wasserstoff, Methyl, Ethyl; R<sup>10</sup> Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxyalkyl, Alkenyl, Cycloalkyl, Halogenalkenyl sowie, wenn p = 1 und q = 0 noch Alkyl- oder Dialkylamino; und deren umweltverträgliche Salze; Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung der Verbindungen I und deren Verwendung als herbizid wirksame Mittel.

#### LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Code, die zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AT	Österreich	FI	Finnland	MN	Mongolei
AU	Australien	FR	Frankreich	MR	Mauritanien
BB	Barbados	GA	Gabon	MW	Malawi
BE	Belgien	GB	Vereinigtes Königreich	NL	Niederlande
BF	Burkina Faso	GN	Guinea	NO	Norwegen
BG	Bulgarien	GR	Griechenland	PL	Polen
BJ	Benin	HU	Ungarn	RO	Rumänien
BR	Brasilien	IE	Irland	RU	Russische Föderation
CA	Kanada	IT	Italien	SD	Sudan
CF	Zentrale Afrikanische Republik	JP	Japan	SE	Schweden
CG	Kongo	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SN	Senegal
CH	Schweiz	KR	Republik Korea	SU	Sowjet Union
CI	Côte d'Ivoire	LI	Liechtenstein	TD	Tschad
CM	Kamerun	LK	Sri Lanka	TG	Togo
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	US	Vereinigte Staaten von Amerika
DE*	Deutschland	MC	Monaco		
DK	Dänemark	MG	Madagaskar		
ES	Spanien	ML	Mali		

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.  
PCT/EP 92/01879

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b>		
Int.Cl. <sup>5</sup> C07D521/00; A01N47/36; C07D239/47; C07D239/48; C07D239/52		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)		
Int.Cl. <sup>5</sup> C07D		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
<b>Category*</b>	<b>Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages</b>	<b>Relevant to claim No.</b>
X	EP,A,0169815 (CIBA-GEIGY AG) 29 January 1986 cited in the application see claims; table 2	1-7
P,X	---	
	EP,A,0446743 (BASF) 18 September 1991 cited in the application see claims; tables	1-7
	-----	
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
16 March 1993 (16.03.93)		27 April 1993 (27.04.93)
Name and mailing address of the ISA/ EUROPEAN PATENT OFFICE		Authorized officer
Facsimile No.		Telephone No.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.  
PCT/EP 92/01879

**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of Item 1 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

- 1.  Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
  
- 2.  Claims Nos.:  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
  
- 3.  Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of Item 2 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

- 1. Claims: 1-8 (partly)
- 2. Claims: 1-8 (partly)
- 3. Claims: 1-8 (partly)
- 4. Claims: 1-8 (partly)

- 1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
- 2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
- 3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
  
- 4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

**Remark on Protest**

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
- No protest accompanied the payment of additional search fees.

**ANNEX TO THE INTERNATIONAL SEARCH REPORT  
ON INTERNATIONAL PATENT APPLICATION NO.**

EP 9201879  
SA 63547

This annex lists the patent family members relating to the patent documents cited in the above-mentioned international search report. The members are as contained in the European Patent Office EDP file on  
The European Patent Office is in no way liable for these particulars which are merely given for the purpose of information. 16/03/93

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP-A-0169815	29-01-86	AU-B- 581445	23-02-89
		AU-A- 4536185	30-01-86
		CA-A- 1223591	30-06-87
		DE-A- 3565983	08-12-88
		JP-A- 61047470	07-03-86
-----	-----	-----	-----
EP-A-0446743	18-09-91	DE-A- 4007683	12-09-91
-----	-----	-----	-----

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 92/01879

<b>I. KLASSEIFIKATION DES ANMELDUNGSGEGENSTANDS</b> (bei mehreren Klassifikationssymbolen sind alle anzugeben) <sup>6</sup>		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
Int.Kl. 5 C07D521/00; C07D239/52	A01N47/36;	C07D239/47; C07D239/48
<b>II. RECHERCHIERTE SACHGEBIETE</b>		
Recherchiertes Mindestprüfstoff <sup>7</sup>		
Klassifikationssystem	Klassifikationssymbole	
Int.Kl. 5	C07D	
Recherchierte nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Sachgebiete fallen <sup>8</sup>		
<b>III. EINSCHLAGIGE VERÖFFENTLICHUNGEN <sup>9</sup></b>		
Art. <sup>o</sup>	Kennzeichnung der Veröffentlichung <sup>11</sup> , soweit erforderlich unter Angabe der maßgeblichen Teile <sup>12</sup>	Betr. Anspruch Nr. <sup>13</sup>
X	EP,A,0 169 815 (CIBA-GEIGY AG) 29. Januar 1986 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche; Tabelle 2 -----	1-7
P,X	EP,A,0 446 743 (BASF) 18. September 1991 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche; Tabellen -----	1-7
<p><sup>o</sup> Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen <sup>10</sup> :</p> <p>"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist</p> <p>"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist</p> <p>"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie angeführt)</p> <p>"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht</p> <p>"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist</p> <p>"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis der der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist</p> <p>"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden</p> <p>"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist</p> <p>"&amp;" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist</p>		
<b>IV. BESCHEINIGUNG</b>		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absenddatum des internationalen Recherchenberichts	
16. MAERZ 1993	27. 04. 93	
Internationale Recherchenbehörde	Unterschrift des bevollmächtigten Bediensteten	
EUROPAISCHES PATENTAMT	DE JONG B.S.	

**Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 1 auf Blatt 1)**

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1.  Ansprüche Nr. weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
  
2.  Ansprüche Nr. weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
  
3.  Ansprüche Nr. weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

**Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)**

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

1. Patentansprüche: 1-8 (teil)
2. Patentansprüche: 1-8 (teil)
3. Patentansprüche: 1-8 (teil)
4. Patentansprüche: 1-8 (teil)

1.  Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche der internationalen Anmeldung.
  
2.  Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Internationale Recherchenbehörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
  
3.  Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche der internationalen Anmeldung, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
  
4.  Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

**Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs**

- Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
- Die Zahlung zusätzlicher Gebühren erfolgte ohne Widerspruch.

**ANHANG ZUM INTERNATIONALEN RECHERCHENBERICHT  
 ÜBER DIE INTERNATIONALE PATENTANMELDUNG NR.**

EP 9201879  
 SA 63547

In diesem Anhang sind die Mitglieder der Patentfamilien der im obengenannten internationalen Recherchenbericht angeführten Patentdokumente angegeben.  
 Die Angaben über die Familienmitglieder entsprechen dem Stand der Datei des Europäischen Patentamts am  
 Diese Angaben dienen nur zur Unterrichtung und erfolgen ohne Gewähr.

16/03/93

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP-A-0169815	29-01-86	AU-B- 581445	23-02-89
		AU-A- 4536185	30-01-86
		CA-A- 1223591	30-06-87
		DE-A- 3565983	08-12-88
		JP-A- 61047470	07-03-86
-----	-----	-----	-----
EP-A-0446743	18-09-91	DE-A- 4007683	12-09-91
-----	-----	-----	-----

EPO FORM P0473

Für nähere Einzelheiten zu diesem Anhang : siehe Amtsblatt des Europäischen Patentamts, Nr.12/82