

PŘÍHLÁŠKA VYNÁLEZU

zveřejněná podle § 31 zákona č. 527/1990 Sb.

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(22) Přihlášeno: 18.11.2000

(32) Datum podání prioritní přihlášky: 09.12.1999

(31) Číslo prioritní přihlášky: 1999/19959291

(33) Země priority: DE

(40) Datum zveřejnění přihlášky vynálezu: 16.10.2002
(Věstník č. 10/2002)

(86) PCT číslo: PCT/EP00/11501

(87) PCT číslo zveřejnění: WO01/42226

(21) Číslo dokumentu:

2002 - 2003

(13) Druh dokumentu: A3

(51) Int. Cl. ⁷:

C 07 D 239/42

C 07 C 309/59

(71) Přihlašovatel:

AVENTIS CROPS SCIENCE GMBH, Frankfurt, DE;

(72) Původce:

Ford Mark James, Bad Soden, DE;

Vermehren Jan, Idstein, DE;

(74) Zástupce:

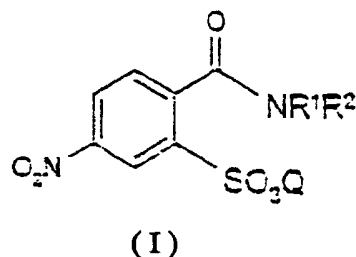
Všetečka Miloš JUDr., Hálkova 2, Praha 2, 12000;

(54) Název přihlášky vynálezu:

**Nitrosulfobenzamidové sloučeniny, způsob jejich
přípravy a použití**

(57) Anotace:

Sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém R¹ znamená nesubstituovaný nebo substituovaný uhlovodíkový zbytek obsahující celkově 1 až 10 atomů uhlíku, výhodně 1 až 6 atomů uhlíku, R² znamená nesubstituovaný nebo substituovaný uhlovodíkový zbytek obsahující celkově 1 až 10 atomů uhlíku, výhodně 1 až 6 atomů uhlíku, nebo skupina NR¹R² představuje heterocyklický kruh obsahující 3 až 8 atomů v kruhu, přičemž tato skupina je nesubstituovaná nebo substituovaná a obsahuje dusíkový atom skupiny NR¹R² jako kruhový heteroatom, přičemž může rovněž obsahovat další jeden nebo dva kruhové heteroatomy ze skupiny zahrnující N, O a A, a Q znamená atom vodíku nebo kation. Tyto sloučeniny jsou výhodně k použití pro přípravu sulfonylmočovinyových sloučenin a jejich prekurzorů, jako jsou například sulfochloridy nebo sulfonamidy.



JUDr. MILOŠ VŠETEČKA
advokát
160 00 PRAHA 2, Národní 2

2002-2005

Nitrosulfobenzamidové sloučeniny, způsob jejich přípravy a použití

Oblast techniky

Vynález se týká nových substituovaných benzamidových sloučenin a technického oboru zabývajícího se chemickými zpracovávacími postupy sloužícími pro přípravu substituovaných benzamidových sloučenin, které je možno použít pro přípravu herbicidně účinných sulfonylmočovinových sloučenin, meziproduktů nebo produktů uvažovaných pro použití při ochraně kulturních plodin.

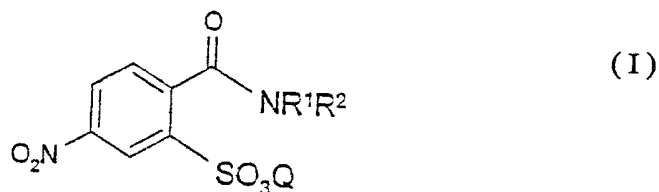
Dosavadní stav techniky

V patentech Spojených států amerických č. 3 055 928 a 5 550 237 se popisují různé substituované sulfobenzamidové sloučeniny. Ovšem tyto sloučeniny není možno snadno použít pro syntézu sulfonylmočovinových herbicidně účinných látek a jejich prekurzorů.

Vzhledem k výše uvedenému je cílem předmětného vynálezu vyvinout nové sulfobenzamidové sloučeniny, které by bylo možno výhodně použít pro přípravu herbicidně účinných sulfonylmočovinových sloučenin a jejich prekurzorů, jako jsou například sulfochloridy a sulfonamidy. Dalším cílem předmětného vynálezu je vyvinout postup přípravy herbicidně účinných sulfonylmočovinových sloučenin a jejich prekurzorů, jako například sulfochloridů a sulfonamidů.

Podstata vynálezu

Předmětný vynález se týká nových 4-nitro-2-sulfo-benzamidových sloučenin obecného vzorce I:



ve kterém:

R^1 znamená nesubstituovaný nebo substituovaný uhlovodík nebo zbytek obsahující celkově 1 až 10 atomů uhlíku, výhodně 1 až 6 atomů uhlíku,

R^2 znamená nesubstituovaný nebo substituovaný uhlovodíkový zbytek obsahující celkově 1 až 10 atomů uhlíku, výhodně 1 až 6 atomů uhlíku a ještě výhodněji 1 až 4 atomy uhlíku,

nebo skupina NR^1R^2 představuje heterocyklický kruh obsahující 3 až 8 atomů v kruhu, přičemž tato skupina je nesubstituovaná nebo substituovaná a obsahuje dusíkový atom skupiny NR^1R^2 jako kruhový heteroatom, přičemž může rovněž obsahovat jeden nebo dva další heteroatomy v kruhu vybrané ze skupiny zahrnující N, O a S, a

Q znamená atom vodíku nebo kation, jako je alkalický kation nebo kation alkalické zeminy, například lithium, sodík, draslík, hořčík nebo vápník nebo kation amonný nebo fosfoniový, jako například R_4N , R_3NH , R_2NH_2 , RNH_3 , NH_4 , R_4P , kde R znamená stejné nebo rozdílné nesubstituované nebo substituované uhlovodíkové zbytky obsahující 1 až 24 atomů uhlíku, jako je například alkylová skupina obsahující 1 až 18 atomů uhlíku, alkenylová skupina obsahující 2 až 18 atomů

uhlíku, alkinylová skupina obsahující 2 až 18 atomů uhlíku nebo cykloalkylová skupina obsahující 5 až 18 atomů uhlíku, přičemž každá z výše uvedených posledních čtyř skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více zbytky vybranými ze skupiny zahrnující halogen, arylovou skupinu obsahující 6 až 10 atomů uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthio skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, mono- a di-alkylaminoskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, kyanoskupinu, azidovou skupinu, formylovou skupinu, alkylkarbonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, alkoxykarbonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy-části, alkylsulfinylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku a alkylsulfonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo R znamená fenylovou skupinu, která je nesubstituovaná nebo substituovaná zbytky vybranými ze skupiny zahrnující halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku a nitroskupinu.

Ve výhodném provedení se předmětný vynález týká sloučenin výše uvedeného obecného vzorce I, ve kterém:

R^1 je alkylová skupina obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkenylová skupina obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinylová skupina obsahující 2 až 6 atomů uhlíku nebo cykloalkylová skupina obsahující 5 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z výše uvedených posledních čtyř skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více zbytky vybranými ze skupiny zahrnující halogen, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,

halogenalkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, mono-
a di-alkylaminoskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku
v alkylové části, kyanoskupinu, azidovou skupinu, formylovou
skupinu, alkylkarbonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy
uhlíku v alkylové části, alkoxykarbonylovou skupinu
obsahující 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy-části,
alkylsulfinylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku
a alkylsulfonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
nebo R^1 znamená fenylovou skupinu, která je nesubstituovaná
nebo substituovaná zbytky vybranými ze skupiny zahrnující
halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
alkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
halogenalkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
halogenalkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku
a nitroskupinu,

R^2 je alkylová skupina obsahující 1 až 6 atomů uhlíku,
alkenylová skupina obsahující 2 až 6 atomů uhlíku,
alkinylová skupina obsahující 2 až 6 atomů uhlíku nebo
cykloalkylová skupina obsahující 5 až 6 atomů uhlíku,
příčemž každá z výše uvedených posledních čtyř skupin může
být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více
zbytky vybranými ze skupiny zahrnující halogen,
alkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
halogenalkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, mono-
a di-alkylaminoskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku
v alkylové části, kyanoskupinu, azidovou skupinu, formylovou
skupinu, alkylkarbonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy
uhlíku v alkylové části, alkoxykarbonylovou skupinu
obsahující 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy-části,
alkylsulfinylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku
a alkylsulfonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,

nebo skupina NR^1R^2 představuje heterocyklický kruh obsahující 4, 5 nebo 6 atomů v kruhu, který může obsahovat dva další heteroatomy v kruhu vybrané ze skupiny zahrnující N a O, přičemž tato skupina je nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více alkylovými skupinami obsahujícími 1 až 4 atomy uhlíku, a

Q znamená atom vodíku nebo alkalický kation nebo kation alkalické zeminy nebo amonný nebo fosfoniový kation, ve výhodném provedení kation alkalického kovu, jako je například lithium, sodík nebo draslík.

Výhodné jsou sloučeniny výše uvedeného obecného vzorce I, ve kterém:

R^1 znamená alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, zejména methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu,

R^2 znamená alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, zejména methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu, a

Q znamená atom vodíku, sodíku nebo draslíku.

Jako konkrétní příklad sloučenin výše uvedeného obecného vzorce I je možno uvést:

draselná sůl N,N-dimethyl-4-nitro-2-sulfobenzamidu,

sodná sůl N,N-dimethyl-4-nitro-2-sulfobenzamidu,

N,N-dimethyl-4-nitro-2-sulfobenzamid,

draselná sůl N,N-diethyl-4-nitro-2-sulfobenzamidu,

sodná sůl N,N-diethyl-4-nitro-2-sulfobenzamidu,

N,N-diethyl-4-nitro-2-sulfobenzamid,

draselná sůl N,N-methylethyl-4-nitro-2-sulfobenzamidu,

sodná sůl N,N-methylethyl-4-nitro-2-sulfobenzamidu,

N,N-methylethyl-4-nitro-2-sulfobenzamid.

V souvislosti s výše uvedeným obecným vzorcem I a kdekoliv v dalším popisu předmětného vynálezu (včetně

části týkající se rozpouštědel), mohou být alkylové skupiny, alkoxy skupiny, halogenalkylové skupiny, halogenalkoxy skupiny, alkylaminové skupiny a alkylthio skupiny a jejich nenasycené a/nebo substituované analogické skupiny v každém jednotlivém případě s přímým řetězcem nebo s rozvětveným řetězcem pokud se týče uhlíkové kostry. Pokud nebude výslovně v konkrétním případě uvedeno jinak, potom výhodné jsou takové skupiny, které mají kostru s nižším počtem atomů uhlíku, jako například skupiny obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo v případě nenasycených skupin skupiny obsahující 2 až 4 atomy uhlíku. Alkylovými skupinami, ať již samotnými nebo jako součástmi jiných skupin, jako je například alkoxy skupina, halogenalkylová skupina, atd., jsou například metylová skupina, ethylová skupina, n-propylová skupina, isopropylová skupina, n-butylová skupina, terc-butylová skupina nebo 2-butylová skupina, pentylové skupiny, hexylové skupiny, jako je například n-hexylová skupina isohexylová skupina a 1,3-dimethylbutylová skupina, a heptylové skupiny, jako je například n-heptylová skupina 1-methylhexylová skupina a 1,4-dimethylpentylová skupina; alkenylové a alkinylové skupiny mají význam existujících nenasycených zbytků odpovídajících alkylovým skupinám; alkenylovou skupinou je například allylová skupina, 1-methylprop-2-en-1-ylová skupina, 2-methylprop-2-en-1-ylová skupina, but-2-en-1-ylová skupina, but-3-en-1-ylová skupina, 1-methylbut-3-en-1-ylová skupina a 1-methylbut-2-en-1-ylová skupina; alkinylovou skupinou je například propargylová skupina, but-2-in-1-ylová skupina, but-3-in-1-ylová skupina, 1-methylbut-3-in-1-ylová skupina.

Halogenem je například fluor, chlor, brom nebo jód. Halogenarylovou skupinou, halogenalkylovou skupinou,

halogenalkenylovou skupinou a halogenalkinylovou skupinou jsou arylové, alkylové, alkenylové resp. alkinylové skupiny, které jsou částečně nebo úplně substituované halogenem, výhodně fluorem, chlorem a/nebo bromem, zejména fluorem nebo chlorem, přičemž jako příklady těchto skupin je možno uvést CF_3 , CHF_2 , CH_2F , CF_3CF_2 , CH_2FCHCl , CCl_3 , CHCl_2 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$; halogenalkoxyskupinou je například skupina OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2F , $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{O}$, OCH_2CF_3 a $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$; odpovídající diskuzi by bylo možno aplikovat i na halogenalkenylové skupiny a jiné zbytky substituované halogeny.

Uhlovodíkovým zbytkem se míní řetězec s přímým řetězcem, s rozvětveným řetězcem nebo cyklický zbytek a nasycené nebo nenasyčené alifatické nebo aromatické uhlovodíkové zbytky, například alkylové zbytky, alkenylové zbytky, alkinylové zbytky, cykloalkylové zbytky, cykloalkenylové zbytky nebo arylové zbytky, výhodně alkylové zbytky, alkenylové zbytky nebo alkinylové zbytky obsahující až 12 atomů uhlíku nebo cykloalkylové zbytky obsahující 5 nebo 6 atomů v kruhu, nebo fenylový zbytek, přičemž odpovídající komentář je možno aplikovat rovněž na hydrogenkarbonoxy zbytky.

Heterocyklický zbytek nebo kruh může být nasycený, nenasyčený nebo heteroaromatický, přičemž obsahuje jeden nebo více heteroatomů v kruhu, výhodně jsou tyto heteroatomy vybrány ze skupiny zahrnující N, O a S. Ve výhodném provedení se jedná o pětičlenné nebo šestičlenné zbytky, které obsahují jeden, dva nebo tři heteroatomy. Tímto zbytkem může být například heteroaromatický zbytek nebo kruh (heteroarylový), definovaný výše, nebo částečně hydrogenovaný zbytek, jako je například oxiranylový zbytek, pyrrolidinylový zbytek, piperidylový zbytek, piperazinylový

zbytek, dioxolanylový zbytek, morfolinylový zbytek a tetrahydrofurylový zbytek. Výhodnými substituenty pro substituované heterocyklické zbytky jsou substituenty uvedené v dalším textu a rovněž oxo-skupina. Tato oxo-skupina může být rovněž na heteroatomech v kruhu, které se mohou v případě například dusíku a síry vyskytovat v různých oxidačních stavech.

Substituovanými skupinami, jako jsou substituované uhlovodíkové zbytky, například substituovaná alkylová skupina, substituovaná alkenylová skupina, substituovaná alkinylová skupina, substituovaná arylová skupina, substituovaná fenylová skupina a substituovaná benzylová skupina nebo substituovaná heteroarylová skupina, substituované bicyklické skupiny nebo kruhy nebo substituované bicyklické zbytky, obsahující nebo neobsahující aromatické komponenty, jsou například substituované zbytky odvozené od nesubstituované základní struktury, přičemž substituenty jsou například jeden nebo více, ve výhodném provedení 1, 2 nebo 3 zbytky, vybrané ze souboru zahrnujícího halogen, alkoxyskupinu, halogenalkoxyskupinu, alkylthioskupinu, hydroxylovou skupinu, aminoskupinu, nitroskupinu, kyanoskupinu, azidovou skupinu, alkoxykarbonylovou skupinu, alkylkarbonylovou skupinu, formylovou skupinu, karbamoylovou skupinu, mono- a di-alkylaminokarbonylovou skupinu, substituovanou aminoskupinu, jako je například acylaminoskupina, mono- a di-alkylaminovou skupinu, a alkylsulfinylovou skupinu, halogenalkylsulfinylovou skupinu, alkylsulfonylovou skupinu, halogenalkylsulfonylovou skupinu, a v případě cyklických zbytků, rovněž alkylovou skupinu a halogenalkylovou skupinu a nenasycené alifatické zbytky odpovídající nasyceným zbytkům obsahujícím uvedenou uhlovodíkovou část, jako je

například alkenylová skupina, alkinylová skupina, alkenyloxyskupina, alkinyloxyskupina, atd. V případě zbytků obsahujících atomy uhlíku jsou výhodné takové zbytky, které obsahují 1 až 4 atomy uhlíku, zejména 1 nebo 2 atomy uhlíku. Obecně je možno uvést, že výhodné jsou substituenty vybrané ze souboru zahrnujícího halogeny, jako je například fluor nebo chlor, alkylové skupiny obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, s výhodou methylová skupina nebo ethylová skupina, halogenalkylové skupiny obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, s výhodou trifluormethylová skupina, alkoxy skupiny obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, s výhodou methoxyskupina nebo ethoxyskupina, halogenalkoxyskupiny obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nitroskupina a kyanoskupina. V této souvislosti je třeba uvést, že zejména výhodnými substituenty jsou methylová skupina, methoxyskupina a chlor.

Aryl představuje monocyklický, bicyklický nebo polycyklický aromatický systém, jako je například fenylová skupina, naftylová skupina, indenylová skupina nebo fluorenylová skupina, s výhodou se jedná o fenylovou skupinu, Substituovanou nebo nesubstituovanou fenylovou skupinou je ve výhodném provedení fenylová skupina, která je nesubstituovaná nebo je substituovaná jednou nebo vícekrát, s výhodou až třikrát, stejnými nebo odlišnými skupinami ze souboru zahrnujícího halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku a nitroskupinu, přičemž jako příklad je možno uvést o-, m- a p-tolylovou skupinu, dimethylfenylové skupiny, 2-, 3- a 4-chlorfenylovou skupinu, 2-, 3- a 4-trifluor- a -trichlorfenylovou skupinu a 2,4-, 3,5-, 2,5- a 2,3-dichlorfenylovou skupinu, a o-, m- a p-methoxy-

-fenylovou skupinu.

Acylovým zbytkem je zbytek organické kyseliny, jako například zbytek karboxylové kyseliny, a zbytky od nich odvozených kyselin, jako je například thiokarboxylová kyselina, nesubstituovaných nebo N-substituovaných iminokarboxylových kyselin nebo se jedná o zbytek monoesterů karbonových kyselin, nesubstituované nebo N-substituované karbamové kyseliny, sulfonových kyselin, sulfinových kyselin, fosfonových kyselin a fosfinových kyselin. Acylovým zbytkem je například formylová skupina, alkylkarbonylová skupina, jako například alkylkarbonylová skupina obsahující 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, fenyلكarbonylová skupina, kde fenylový kruh může být substituován, například stejným způsobem jako bylo uvedeno shora pro fenylovou skupinu, nebo alkyloxykarbonylová skupina, fenyloxykarbonylová skupina, benzyloxykarbonylová skupina, alkylsulfonylová skupina, alkylsulfinylová skupina, N-alkyl-1-iminoalkylová skupina a další zbytky organických kyselin.

Pro následující popis různých provedení postupu podle vynálezu, se v případě použití termínů amid, katalyzátor pro přenos fází, terciární amin, aktivační reakční činidlo a acylační reakční činidlo těmito termíny míní dále definované látky.

Termínem "amid" se kromě jiného míní takové amidy jako je například dimethylformamid, diethylformamid, dimethylacetamid, N-methylformanilid, N-methylacetanilid, 4-formylmorfolin, N-formylpiperidin, N-formylpyrolidin nebo jejich směsi.

Termínem katalyzátor pro přenos fází se kromě jiného míní amoniové nebo fosfoniové sloučeniny, ve výhodném provedení hydrokarbylamoniové nebo hydrokarbylfosfoniové sloučeniny, jako jsou například tetraalkylamonné sloučeniny, jako například tetrabutylamonium, tetraethylamonium, tetramethylamonium, cetyltrimethylamonium nebo methyltrioktylamoniumchlorid (Alliquat^R 336), benzyltriethylamonium, benzyltrimethylamonium nebo tetrafenylfosfonium, každá z těchto sloučenin jako chlorid, bromid, hydrogensulfát, sulfát nebo jejich směsi.

Termínem terciární amin se kromě jiného míní alkylaminy, jako je například triethylamin, tributylamin, benzyldialkylamin, N-alkylmorfolin, N-alkylpiperidin, N-alkylpyrrolidin nebo aromatické aminy, jako je například pyridin, 2-, 3- nebo 4-methylpyridin, 2,3- nebo 2,4- nebo 2,5- nebo 2,6- nebo 3,4- nebo 3,5-dimethylpyridin, N,N-dialkylanilin, jako například N,N-dimethylanilin nebo jejich směsi.

Termínem aktivační reakční činidlo se míní reakční činidlo, které je schopné převést kyselinu na chlorid kyseliny nebo anhydrid kyseliny nebo podobné reaktivní deriváty kyseliny, přičemž kromě jiného mezi tyto látky patří fosgen, thionylchlorid, oxychlorid fosforu, chlorid fosforitý, chlorid fosforečný, sulfonylchlorid nebo směsi těchto látek.

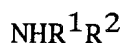
Termínem acylační reakční činidlo se míní reakční činidlo, které je schopné substituovat vodík za acylový zbytek, přičemž kromě jiného mezi tyto látky patří kyselina mravenčí a anhydridy karboxylových kyselin obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, jako je například anhydrid kyseliny octové

nebo anhydrid kyseliny mravenčí a octové.

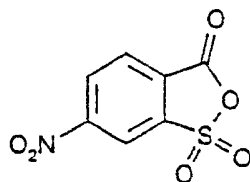
Pokud se týče popisu různých procesů, které jsou uvedeny dále, mají chemické skupiny rozpouštědel zmiňovaných v souvislosti s tímto popisem následující význam.

Termín aryl (nebo arylové sloučeniny) kromě jiného zahrnuje nitrobenzen, toluen, xylen, chlorbenzen a dichlorbenzen. Termín alkyl (nebo alkylové sloučeniny) kromě jiného zahrnuje pentan, hexan, dichlormethan a dichlorethan. Termín ester (nebo esterové sloučeniny) kromě jiného zahrnuje ethylacetát, propylacetát a butylacetát. Termín ether (nebo etherové sloučeniny) kromě jiného zahrnuje dibutylether, dipropylether, dioxan a tetrahydrofuran. Termín nitril (nebo nitrilové sloučeniny) kromě jiného zahrnuje acetonitril, propionitril a benzonitril. Termín karboxylová kyselina kromě jiného zahrnuje kyselinu mravenčí, kyselinu octovou, kyselinu propionovou a kyselinu máselnou. Termín uhličitán kromě jiného zahrnuje diethyluhličitán. Termín amid kromě jiného zahrnuje N-methylpyrrolidon, dimethylformamid a dimethylacetamid. Termín sulfon kromě jiného zahrnuje dimethylsulfon. Termín keton kromě jiného zahrnuje aceton, ethylmethylketon, diethylketon a cyklohexanon. Termín karbamát kromě jiného zahrnuje trimethylkarbamát. Termín alkohol kromě jiného zahrnuje methanol, ethanol, propanol a butanol.

Benzamidové sloučeniny výše uvedeného obecného vzorce I podle předmětného vynálezu je možno získat například reakcí vhodného substituovaného aminu obecného vzorce:



nebo soli této sloučeniny, ve kterém R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo uvedeno u sloučeniny obecného vzorce I, s anhydridem obecného vzorce II:



(II)

Reakce uvedeného anhydridu obecného vzorce II s asi 1 až 10 ekvivalenty uvedeného vhodně substituovaného aminu (NHR^1R^2), ve výhodném provedení s 1 až 4 ekvivalenty této sloučeniny a podle zejména výhodného provedení s 1 až 2 ekvivalenty této sloučeniny, provedená v přítomnosti nebo výhodně v nepřítomnosti terciárního aminu požadovanou benzamidovou sloučeninu výše uvedeného obecného vzorce I ve vynikajícím výtěžku. Tuto reakci je možno provést při teplotě pohybující v rozmezí od asi $-50\text{ }^{\circ}\text{C}$ do asi $300\text{ }^{\circ}\text{C}$, ve výhodném provedení při teplotě v rozmezí od $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ do $180\text{ }^{\circ}\text{C}$, v rozpouštědlech nebo směsích rozpouštědel jako jsou například nesubstituované nebo substituované uhlovodíky, jako například nesubstituované nebo substituované arylové sloučeniny (jako například alkylarylové sloučeniny nebo halogenarylové sloučeniny) nebo nesubstituované nebo substituované alkylové sloučeniny (jako například halogenalkylové sloučeniny), estery a ethery, čímž ovšem není rozsah možných použitelných rozpouštědel nijak omezen, přičemž se tato reakce provádí při atmosférickém tlaku, sníženém tlaku nebo zvýšeném tlaku.

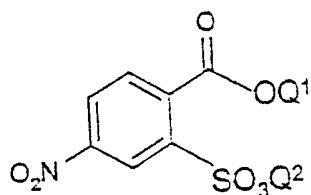
Anhydridy obecného vzorce II je možno získat například postupem uvedeným v publikaci *Helv. Chim. Acta*, 1949, 32,

172, reakcí:

(a) 4-nitro-2-sulfobenzoátu dvojdraselného obecného vzorce III, ve kterém $Q^1 = Q^2 = K$, s chloridem fosforečným, nebo

(b) 4-nitro-2-sulfobenzoátu draselného obecného vzorce III, ve kterém $Q^1 = H$, $Q^2 = K$, s thionylchloridem, nebo

(c) 4-nitro-2-sulfobenzoové kyseliny obecného vzorce III, ve kterém $Q^1 = Q^2 = H$, s acetylchloridem při teplotě varu pod zpětným chladičem, destilací při teplotě asi 184 °C nebo s oxidem fosforečným ve formě taveniny;



(III)

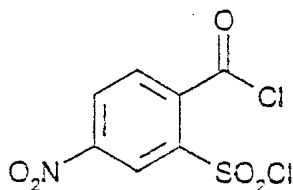
Výše uvedený anhydrid obecného vzorce II je možno rovněž získat reakcí dvojkyseliny obecného vzorce III s případně až 4 ekvivalenty aktivačního reakčního činidla, ve výhodném provedení s 1 až 2 ekvivalenty tohoto aktivačního činidla, kterým je výhodně thionylchlorid nebo fosgen, přičemž se tato reakce provede v přítomnosti katalyzátoru pro přenos fází, ve výhodném provedení benzyltriethylamoniumchloridem, a případně v přítomnosti amidového katalyzátoru, ve výhodném provedení je tímto katalyzátorem dimethylformamid, a případně v přítomnosti terciárního aminu jako katalyzátoru, kterým je výhodně pyridin. Potom se odstraní přebytek reakčního činidla, například destilací při atmosférickém tlaku nebo při tlaku vyšším než je tlak atmosférický nebo za vakua, přičemž ovšem tímto není způsob odstranění uvedeného přebytku nijak

omezen. Tuto reakci je možno provést v rozpouštědlech nebo ve směsích rozpouštědel, jako jsou například nesubstituované nebo substituované uhlovodíky, jako například nesubstituované nebo substituované arylové sloučeniny (jako jsou například alkylarylové sloučeniny nebo halogenarylové sloučeniny) nebo nesubstituované nebo substituované alkylové sloučeniny (jako například halogenalkylové sloučeniny), uhličitany, karbamáty, estery, ethery a sulfony, čímž ovšem není rozsah možných použitelných rozpouštědel nijak omezen, přičemž se reakce provede při jejich teplotě varu nad touto teplotou nebo pod touto teplotou, při atmosférickém tlaku, při nižším než atmosférickém tlaku nebo vyšším než atmosférickém tlaku, při teplotě pohybující se v rozmezí od asi 0 °C do 300 °C, ve výhodném provedení mezi 40 °C a 150 °C.

Podle předmětného vynálezu bylo zcela neočekávatelně zjištěno, že anhydrid obecného vzorce II je možno rovněž získat reakcí dichloridu obecného vzorce IV s dvojkyselinou obecného vzorce III. Při této reakce je možno dichlorid obecného vzorce IV (nebo jiné dvojité aktivované isomery nebo deriváty této sloučeniny, jaké jsou například uvedeny v DE 2616611, viz například sloučeniny dále uvedeného obecného vzorce V) po odstranění přebytku reakčního činidla například destilací při atmosférickém tlaku nebo při tlaku vyšším než je tlak atmosférický nebo za vakua, čímž ovšem není výčet použitých metod nijak omezen, uvést do reakce s čerstvou dvojkyselinou obecného vzorce III nebo se solí této sloučeniny, s jinou karboxylovou kyselinou (RCO_2H , kde R znamená alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku), nebo s jinými molekulami schopnými dodat nezbytný kyslíkový atom, jako jsou například sulfoxidy terciárních N-oxidů, přičemž tato reakce se provede v přítomnosti terciárního

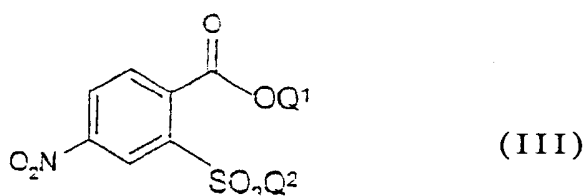
aminu, výhodně pyridinu. Tuto reakci je možno provést v rozpouštědlech nebo ve směsích rozpouštědel, jako jsou například nesubstituované nebo substituované uhlovodíky, jako nesubstituované nebo substituované arylové sloučeniny (například alkylarylové sloučeniny nebo halogenarylové sloučeniny) nebo nesubstituované nebo substituované alkylové sloučeniny (například halogenalkylové sloučeniny), uhličitany, karbamáty, amidy, estery, ethery, nitrilové sloučeniny a sulfony, čímž ovšem není rozsah možných použitelných rozpouštědel nebo jejich směsí nijak omezen, a reakce se provede při jejich teplotě varu, nad touto teplotou varu nebo pod touto teplotou varu, při atmosférickém tlaku, při tlaku nižším než je tlak atmosférický nebo při tlaku vyšším než je tlak atmosférický, při teplotách v rozmezí od asi 0 °C do asi 300 °C, ve výhodném provedení při teplotách v rozmezí od 40 °C do 150 °C, přičemž se získá anhydrid obecného vzorce II ve vynikajícím výtěžku.

Tento dichlorid obecného vzorce IV (nebo jeho jiné dvojitě aktivované isomery nebo deriváty, jako jsou například látky uvedené v DE 2616611, viz například sloučeniny dále uvedeného obecného vzorce V) je možno získat například reakcí volné dvojkyseliny obecného vzorce III ($Q^1 = Q^2 = H$) nebo dvojdraselné soli této sloučeniny obecného vzorce III ($Q^1 = Q^2 = K$) s thionylchloridem nebo fosgenem v přítomnosti amidu jako katalyzátoru, ve výhodném provedení v přítomnosti formamidu (viz například DE 1616611).



(IV)

Zcela překvapivě je možno benzamidové sloučeniny obecného vzorce I podle předmětného vynálezu je možno rovněž připravit přímou reakcí dvojkyseliny obecného vzorce III nebo její soli:



ve kterém: Q^1 a Q^2 jsou stejné nebo rozdílné a představují atom vodíku nebo kation, jako například alkalický kation nebo kation kovu alkalické zeminy, například Li, Na, K, Mg nebo Ca nebo amonný kation nebo fosfoniový kation, například R_4N , R_3NH , R_2NH_2 , RNH_3 , NH_4 , R_4P , kde R znamená stejné nebo rozdílné nesubstituované nebo substituované uhlovodíkové zbytky obsahující 1 až 24 atomů uhlíku, jako je například alkylová skupina obsahující 1 až 18 atomů uhlíku, alkenylová skupina obsahující 2 až 18 atomů uhlíku, alkinylová skupina obsahující 2 až 18 atomů uhlíku nebo cykloalkylová skupina obsahující 5 až 18 atomů uhlíku, přičemž každá z výše uvedených posledních čtyř skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více zbytky vybranými ze skupiny zahrnující halogen, arylovou skupinu obsahující 6 až 10 atomů uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthio skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, mono- a di-alkylaminoskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, kyanoskupinu, azidovou skupinu, formylovou skupinu, alkylkarbonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, alkoxykarbonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy-části,

alkylsulfinylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku
a alkylsulfonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
nebo R znamená fenylovou skupinu, která je nesubstituovaná
nebo substituovaná zbytky vybranými ze skupiny zahrnující
halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
alkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
halogenalkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
halogenalkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku
a nitroskupinu,
se vhodným substituovaným aminem nebo jeho solí,
v přítomnosti aktivačního reakčního činidla, ve výhodném
provedení thionylchloridu.

Tuto reakci je možno provést případně v přítomnosti
katalyzátoru pro přenos fází, ve výhodném provedení je možno
použít benzyltriethylamoniumchlorid, a v přítomnosti
terciárního aminu jako katalyzátoru. Tuto reakci je možno
provést se samotnými substancemi nebo v rozpouštědle
(rozpuštědlech), jako jsou například, jako jsou například
nesubstituované nebo substituované uhlovodíky, jako
nesubstituované nebo substituované arylové sloučeniny
(například alkylarylové sloučeniny nebo halogenarylové
sloučeniny) nebo nesubstituované nebo substituované alkylové
sloučeniny (jako například halogenalkylové sloučeniny),
dále uhličitany, karbamáty, estery, ethery, nitrilové
sloučeniny a sulfony, přičemž ovšem tímto není rozsah
možných použitelných rozpouštědel nijak omezen, při teplotě
nad jejich teplotou varu nebo pod touto teplotou při
atmosférickém tlaku, při tlaku nižším než je atmosférický
nebo vyšší než je tlak atmosférický, a při teplotách
pohybujících se rozmezí od asi 0 °C do 300 °C, ve výhodném
provedení v rozmezí od 40 °C do 150 °C, přičemž tímto
způsobem se získají benzamidy výše uvedeného obecného vzorce

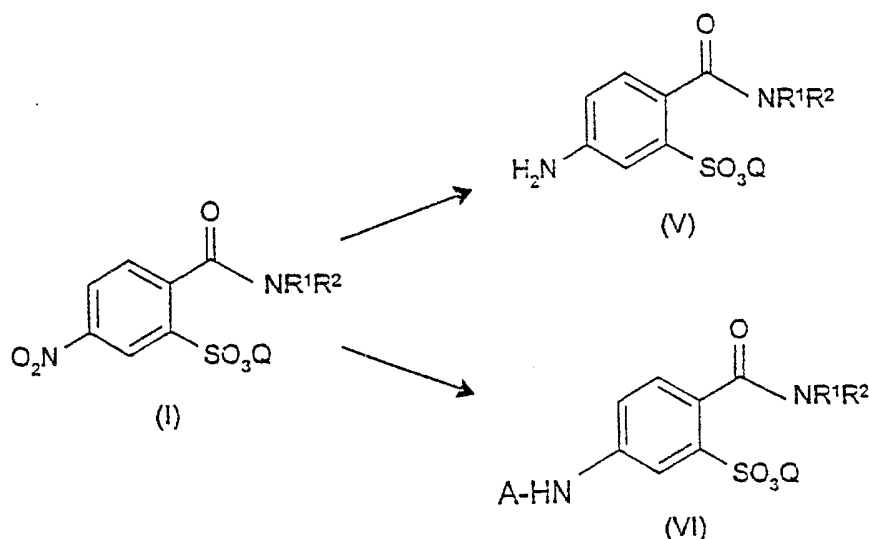
I ve vynikajícím výtěžku.

Tyto benzamidové sloučeniny výše uvedeného obecného vzorce I je možno izolovat metodami všeobecně používanými v běžné laboratorní praxi a pro odborníky pracující v daném oboru obecně známými, jako je například filtrace, nebo je možno tyto látky použít pro další reakce bez izolování. Tyto benzamidové sloučeniny obecného vzorce I jsou cennými meziprodukty pro přípravu různých produktů, jako jsou například sloučeniny sulfonylové řady, které se používají pro ochranu kulturních plodin.

Například je možno uvést, že hydrogenací nitrobenzamidových sloučenin obecného vzorce I je možno převést tyto sloučeniny na odpovídající aminobenzamidy obecného vzorce V, ve kterých Q, R¹ a R² mají stejný význam jako bylo definováno v souvislosti se sloučeninami obecného vzorce I. Tuto hydrogenaci je možno provést za použití vodíku nebo zdroje vodíku, jako je například cyklohexadien, v přítomnosti kovového katalyzátoru, jako například Pd/C, Pt/C nebo Raneyův nikl samotný nebo v kombinaci, případně v přítomnosti jiných kovových derivátů, jako jsou například oxidy nebo soli kovů manganu, molybdenu, wolframu, železa a kobaltu, ve kterých je kov přítomen jako kation, oxoanion nebo polyoxoanion, v inertním rozpouštědle nebo směsi těchto rozpouštědel, jako je například voda, alkoholy, ethery, karboxylové kyseliny a ketony, samotné nebo jako směsi, přičemž ovšem tímto není rozsah možných použitelných rozpouštědel nijak omezen, nebo je možno tuto reakci provést ve směsi s rozpouštědly používanými pro přípravu benzamidových sloučenin výše uvedeného obecného vzorce I, při teplotách pohybujících se v rozmezí od asi -30 °C do 300 °C, výhodně v rozmezí od -10 °C do 150 °C.

Tyto benzamidové sloučeniny obecného vzorce I je možno rovněž hydrogenovat a v následném postupu současně (redukční acylací) uvést do reakce s acylačním reakčním činidlem. Například je možno tyto benzamidy obecného vzorce I uvést do reakce s vodíkem nebo se zdrojem vodíku, jako je například cyklohexadien, v přítomnosti (a) kovového katalyzátoru, jako je například Pd/C, Pt/C, Ru/C nebo Raneyův nikl, samotný nebo v kombinaci, případně v přítomnosti jiných kovových derivátů, jako jsou například oxidy nebo soli kovů manganu, molybdenu, wolframu, železa a kobaltu, ve kterých je kov přítomen jako kation, oxoanion nebo polyoxoanion, a (b) acylačního činidla, jako je například kyselina mravenčí a/nebo anhydridy karboxylových kyselin obsahující 1 až 8 atomů uhlíku, nebo případně v přítomnosti jiných rozpouštědel nebo směsí těchto rozpouštědel, jako jsou například alkylarylové sloučeniny, arylové sloučeniny, uhličitany, karbamáty, estery, ethery, halogenalkylové sloučeniny, halogenarylové sloučeniny, ketony, nitrilové sloučeniny, sulfony a voda, přičemž ovšem tímto není rozsah možných použitelných rozpouštědel nijak omezen, nebo je možno použít inertních rozpouštědel nebo směsí těchto rozpouštědel, jako jsou například nesubstituované nebo substituované uhlovodíky, jako například nesubstituované nebo substituované arylové sloučeniny (například alkylarylové sloučeniny nebo halogenarylové sloučeniny) nebo nesubstituované nebo substituované alkylové sloučeniny (jako jsou například halogenalkylové sloučeniny), dále uhličitany, karbamáty, estery, ethery, ketony, nitrilové sloučeniny a sulfony, přičemž ovšem tímto není rozsah možných použitelných rozpouštědel nijak omezen, a reakci je možno provést při teplotách pohybujících se v rozsahu od asi -30 °C do 300 °C a ve výhodném provedení v rozmezí od -10 °C

do 150 °C, přičemž tímto způsobem se získají odpovídající acylamidové deriváty obecného vzorce VI, ve kterých Q, R¹ a R² mají stejný význam jako bylo uvedeno v souvislosti se sloučeninami obecného vzorce I, a A znamená acylový zbytek, ve výhodném provedení formylový zbytek nebo hydrokarbyl-karbonylový zbytek obsahující 1 až 8 atomů uhlíku v hydrokarbylové části, jako je například alkylkarbonylový zbytek s přímým nebo rozvětveným řetězcem obsahující 1 až 8 atomů uhlíku v alkylové části.



Tyto benzamidové sloučeniny obecného vzorce I je možno uvést do reakce s aktivačním reakčním činidlem, ve výhodném provedení s thionylchloridem nebo fosgenem, v přítomnosti amidové sloučeniny jako katalyzátoru, ve výhodném provedení se použije dimethylformamid, případně v přítomnosti katalyzátoru pro přenos fází, ve výhodném provedení se použije benzyltriethylamoniumchloridu, a popřípadě v přítomnosti terciárního aminu jako katalyzátoru, ve výhodném provedení se použije pyridinu, přičemž se dosáhne

vynikajících výtěžků, pokud se týče získání sulfonylchloridů obecného vzorce VII, ve kterém mají R^1 a R^2 stejný význam jako bylo definováno v souvislosti se sloučeninami obecného vzorce I. Potom se v dalším postupu odstraní přebytek reakčního činidla, například, destilací při atmosférickém tlaku nebo při tlaku vyšším než atmosférickém nebo za vakua, čímž ovšem není rozsah těchto metod a podmínek nijak omezen, v takových rozpouštědlech jako jsou například nesubstituované nebo substituované uhlovodíky, jako například nesubstituované nebo substituované aryllové sloučeniny (například alkylarylové sloučeniny nebo halogenarylové sloučeniny) nebo nesubstituované nebo substituované alkylové sloučeniny (jako jsou například halogenalkylové sloučeniny), dále estery, uhličitany a ethery, přičemž ovšem tímto není rozsah možných použitelných rozpouštědel nijak omezen, a reakci je možno provést při jejich teplotě varu nebo pod touto teplotou, při atmosférickém tlaku, při tlaku nižším než atmosférickém nebo při tlaku vyšším než atmosférickém, při teplotách pohybujících se v rozsahu od asi 0 °C do 200 °C a ve výhodném provedení v rozmezí od 50 °C do 150 °C.

Takto získanou sloučeninu obecného vzorce VII je možno izolovat některou z běžně používaných metod v laboratorní praxi, které jsou odborním pracujícím v daném oboru známy, jako je například filtrace. Tyto sulfonylchloridy obecného vzorce VII je možno rovněž použít pro další postup bez izolování a uvést je do reakce při teplotách pohybujících se v rozmezí od -100 °C do 200 °C, ve výhodném provedení při teplotách v rozmezí od -30 °C do 100 °C, s amoniakem, primárními nebo sekundárními aminy, případně v přítomnosti terciárního aminu, ve výhodném provedení se použije pyridinu, a tímto způsobem se dosáhne vynikajících výtěžků

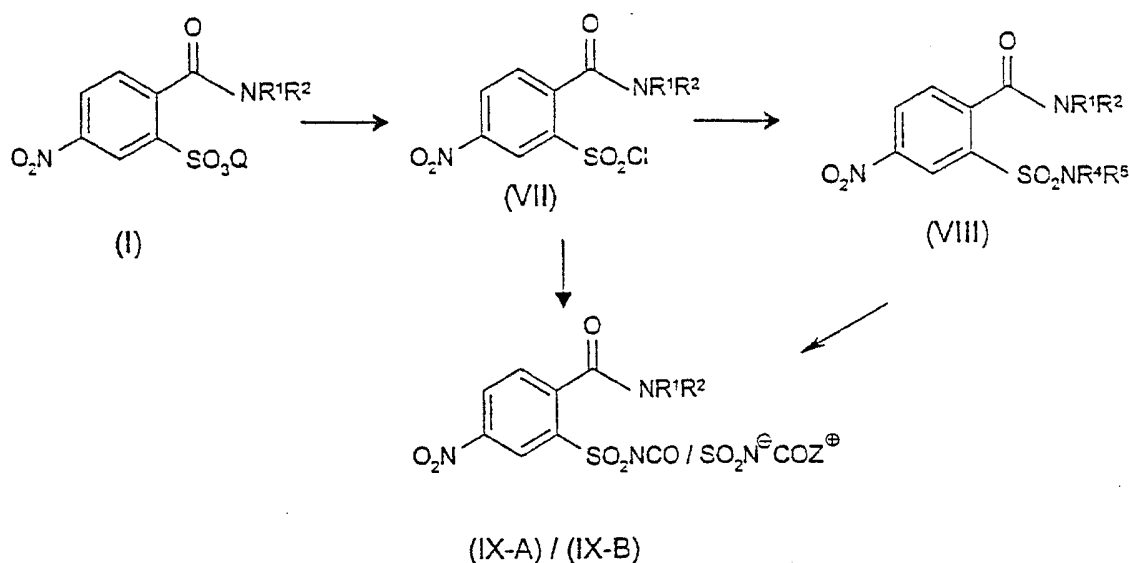
pokud se týče odpovídajících sulfonamidových sloučenin obecného vzorce VIII, ve kterém mají R^1 a R^2 stejný význam jako bylo uvedeno v souvislosti se sloučeninami obecného vzorce I, a R^4 a R^5 znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku jako například alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku s přímým nebo rozvětveným řetězcem, alkenylovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku s přímým nebo rozvětveným řetězcem nebo alkinylovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku s přímým nebo rozvětveným řetězcem, arylovou skupinu obsahující 6 až 12 atomů uhlíku nebo heteroarylovou skupinu, přičemž tento kruh nebo řetězec může obsahovat jeden nebo více z následujících substituentů nebo funkčních skupin: acyloxyskupinu, amidovou skupinu, aminosulfonylovou skupinu, arylovou skupinu, heteroarylovou skupinu, aryloxyskupinu, heteroaryloxyskupinu, karbonylaminovou skupinu, dialkylaminovou skupinu, etherovou skupinu, esterovou skupinu, halogen, nitrilovou skupinu, nitroskupinu, sulfonamidovou skupinu, alkylmerkaptoskupinu, arylmerkaptoskupinu, heteroarylmerkaptoskupinu, přičemž R^4 může být nebo nemusí být totožný s R^5 .

Tyto sulfonylchloridy obecného vzorce VII je možno rovněž uvést do reakce s kyanátovými solemi (jako je například MOCN, kde M je kation, jako například kation alkalického kovu nebo kation alkalické zeminy, jako například Li, Na, K, Mg nebo Ca, nebo amonný kation nebo fosfoniový kation), případně v přítomnosti katalyzátoru pro přenos fází (kromě již uvedených látek v předchozím textu je možno rovněž použít polyethylen, glykoly a polyethery), a případně v přítomnosti terciárního aminu jako katalyzátoru, ve výhodném provedení se použije pyridin, triethylamin nebo tributylamin nebo jejich směsi, a reakce

se provádí při teplotách pohybujících se v rozmezí od asi -100 °C do asi 150 °C, ve výhodném provedení při teplotách v rozmezí od -30 °C do 100 °C, přičemž tímto způsobem se dosáhne vynikajících výtěžků pokud se týče takto získaných sulfonylisokyanátů obecného vzorce IX-A nebo IX-B, ve kterých R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo uvedeno v souvislosti s obecným vzorcem I a Z ve sloučenině obecného vzorce IX-B znamená terciární amonný zbytek vzniklý z terciárního aminu, který byl definován výše, jako například pyridiniový zbytek, tributylamonný zbytek nebo triethylamonný zbytek. Sulfonylisokyanát obecného vzorce IX-B je možno získat v případě, že se tato reakce provede v přítomnosti nukleofilního terciárního aminu jako katalyzátoru.

Isokyanát obecného vzorce IX-A nebo IX-B, ve kterém R^1 a R^2 mají stejný význam jako je uvedeno v souvislosti s obecným vzorcem I a Z ve sloučenině obecného vzorce IX-B znamená terciární amonný zbytek vzniklý z terciárního aminu, jak bylo definováno shora, jako je například pyridiniový zbytek, tributylamonný zbytek nebo triethylamonný zbytek, je možno rovněž připravit reakcí sulfonamidů obecného vzorce VIII, ve kterých $R^4 = R^5 =$ vodík s fosgenem, případně v přítomnosti terciárního aminu jako katalyzátoru, ve výhodném provedení se použije pyridin, triethylamin nebo tributylamin nebo jejich směsí, při teplotě pohybující se v rozmezí od asi -100 °C do 150 °C, ve výhodném provedení v rozmezí od -30 °C do 100 °C. Sulfonylisokyanáty obecného vzorce IX-B je možno získat v případě, že se reakce provede v přítomnosti nukleofilního terciárního aminu jako katalyzátoru.

03.07.02



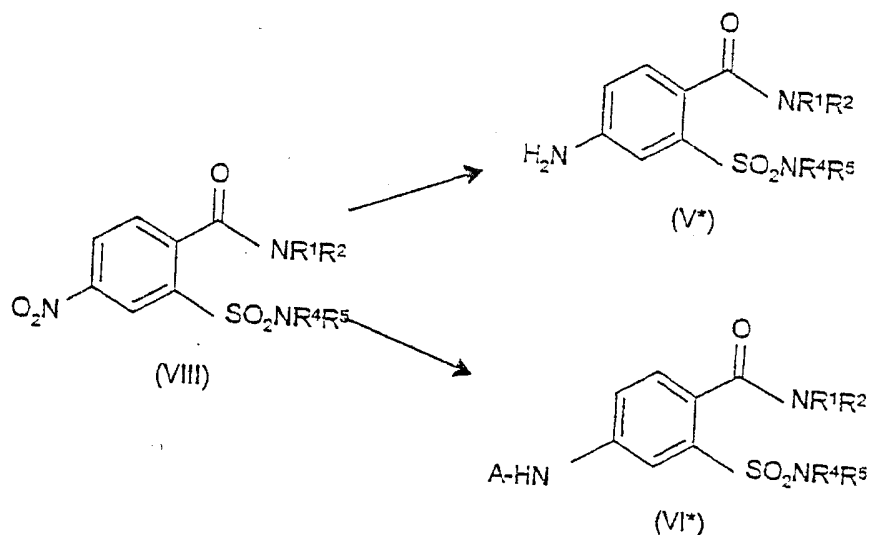
Tyto sulfonamidové sloučeniny výše uvedeného obecného vzorce VIII je možno izolovat metodami všeobecně používanými v běžné laboratorní praxi a pro odborníky pracující v daném oboru obecně známými, jako je například filtrace, nebo je možno tyto látky použít pro další reakce bez izolování. Tyto sulfonamidové sloučeniny obecného vzorce VIII jsou cennými meziprodukty pro přípravu různých produktů, jako jsou například sloučeniny sulfonylové řady, které se používají pro ochranu kulturních plodin.

Například je možno uvést, že hydrogenací sulfonamidů obecného vzorce VIII je možno konverzí připravit odpovídající sulfonamidy obecného vzorce V*, ve kterém R^1 , R^2 , R^4 a R^5 mají stejný význam jako bylo definováno shora v případě sloučenin obecného vzorce VIII. Tuto hydrogenaci je možno provést vodíkem nebo za použití zdroje vodíku, jako je například cyklohexadien, v přítomnosti kovového katalyzátoru, jako je například Pd/C, Pt/C, Ru/C nebo Raneyův nikl, samotný nebo v kombinaci, případně

v přítomnosti jiných kovových derivátů, jako jsou například oxidy nebo soli kovů manganu, molybdenu, wolframu, železa a kobaltu, ve kterých je kov přítomen jako kation, oxoanion nebo polyoxoanion, v inertním rozpouštědle nebo ve směsi těchto rozpouštědel, jako je například voda, alkoholy, nesubstituované nebo substituované uhlovodíky, jako například nesubstituované nebo substituované aryllové sloučeniny (například alkylarylové sloučeniny nebo halogenarylové sloučeniny) nebo nesubstituované nebo substituované alkylové sloučeniny (jako například halogenalkylové sloučeniny), dále ethery, uhličitany, karbamáty, estery, nitrilové sloučeniny, sulfony, karboxylové kyseliny a ketony, které se použijí jako samotné nebo ve směsích, nebo je možno použít směsí s rozpouštědly používanými pro přípravu sulfonamidů obecného vzorce VIII, přičemž ovšem tímto není rozsah možných použitelných rozpouštědel nijak omezen, a reakci je možno provést při teplotách pohybujících se v rozmezí od asi -30 °C do 300 °C, ve výhodném provedení v rozmezí od -10 °C do 150 °C.

Sulfonamidy obecného vzorce VIII je možno rovněž hydrogenovat a v následné fázi nebo současně (redukční acylací) je uvést do reakce s acylačním činidlem. Například je možno tyto sulfonamidy obecného vzorce VIII uvést do reakce s vodíkem nebo se zdrojem vodíku, jako je například cyklohexadien, v přítomnosti (a) kovového katalyzátoru, jako je například Pd/C, Pt/C, Ru/C nebo Raneyův nikl, samotný nebo v kombinaci, případně v přítomnosti jiných kovových derivátů, jako jsou například oxidy nebo soli kovů manganu, molybdenu, wolframu, železa a kobaltu, ve kterých je kov přítomen jako kation, oxoanion nebo polyoxoanion, a (b) acylačního činidla, jako je například kyselina mravenčí a/nebo anhydridy karboxylových kyselin obsahující 1 až 8

atomů uhlíku, nebo případně v přítomnosti jiných rozpouštědel nebo směsí těchto rozpouštědel, jako jsou například nesubstituované nebo substituované uhlovodíky, například nesubstituované nebo substituované arylové sloučeniny (například alkylarylové sloučeniny nebo halogenarylové sloučeniny) nebo nesubstituované nebo substituované alkylové sloučeniny (jako například halogenalkylové sloučeniny), dále uhličitany, karbamáty, estery, ethery, ketony, nitrilové sloučeniny a sulfony, přičemž se reakce provede při teplotě pohybující se v rozmezí od asi $-30\text{ }^{\circ}\text{C}$ do asi $300\text{ }^{\circ}\text{C}$, a ve výhodném provedení v rozmezí od $-10\text{ }^{\circ}\text{C}$ do $150\text{ }^{\circ}\text{C}$, za vzniku odpovídajících acylamidových derivátů obecného vzorce VI*, ve kterých R^1 , R^2 , R^4 a R^5 mají stejný význam jako bylo definované v souvislosti s obecným vzorcem VIII a A znamená acylový zbytek, ve výhodném provedení formylový zbytek nebo hydrokarbylkarbonylový zbytek obsahující 1 až 8 atomů uhlíku v hydrokarbylové části, jako je například alkylkarbonylový zbytek s přímým nebo rozvětveným řetězcem obsahující 1 až 8 atomů uhlíku v alkylové části.



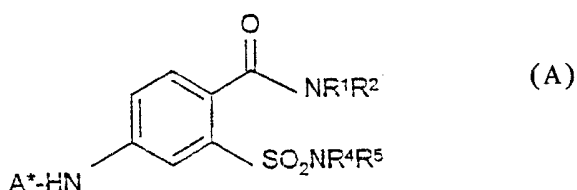
Tyto sulfonamidové sloučeniny obecného vzorce VIII a sulfonylisokyanátové sloučeniny obecného vzorce IX-A a IX-B je možno s výhodou použít k přípravě sulfonylmočovinových sloučenin, které projevují herbicidní účinnost, s vynikajícím výtěžkem. Jako příklad těchto herbicidně účinných sloučenin sulfonylového typu je možno uvést sulfonylové sloučeniny obecných vzorců XII a XIV, které jsou specifikovány níže, jako například

N-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-ylaminokarbonyl)-2-(N,N-dimethylaminokarbonyl)-5-(N-methoxykarbonylamino)-benzensulfonamid, sodná sůl

N-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-ylaminokarbonyl)-2-(N,N-dimethylaminokarbonyl)-5-(N-propionylamino)benzen-sulfonamidu, N-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-ylaminokarbonyl)-2-(N,N-dimethylaminokarbonyl)-5-(N-formylamino)benzensulfonamid, sodná sůl N-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-ylaminokarbonyl)-2-(N,N-dimethylaminokarbonyl)-5-(N-formylamino)-benzensulfonamidu, nebo N-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-ylaminokarbonyl)-2-(N,N-dimethylaminokarbonyl)-5-(N-methoxykarbonylamino)benzensulfonamid. Tyto sulfonylové sloučeniny mohou tvořit soli v případě, že se vodík skupiny $-SO_2-NH-$ nahradí zemědělsky vhodným kationtem. Těmito solemi jsou například kovové soli, zejména soli s alkalickými kovy nebo soli s kovy alkalických zemin, zejména je možno uvést sodné soli a draselné soli, nebo ještě amonné soli nebo soli s organickými aminy. Podobným způsobem je možno přípravu soli provést přidáním kyseliny k bazické skupině, jako je například aminová skupina nebo alkylaminová skupina. Vhodnými kyselinami pro tento účel jsou silné anorganické a organické kyseliny, jako je například kyselina chlorovodíková, kyselina bromovodíková, kyselina sírová nebo kyselina dusičná.

Například je možno uvést, že sulfonamidové sloučeniny obecného vzorce VIII je možno uvést do reakce, jak bylo shora uvedeno:

(A) s vodíkem nebo se zdrojem vodíku, jako je například cyklohexadien, v přítomnosti kovového katalyzátoru a případně acylačního reakčního činidla, jako je například kyselina mravenčí nebo anhydridy karboxylových kyselin obsahující 1 až 8 atomů uhlíku, případně v přítomnosti rozpouštědla nebo směsi rozpouštědel, jako jsou například alkylarylové sloučeniny, amidové sloučeniny, arylové sloučeniny, estery, ethery, halogenalkylové sloučeniny, halogenarylové sloučeniny, nitrilové sloučeniny, alkoholy, ketony, karboxylové kyseliny nebo směsi těchto rozpouštědel s vodou, přičemž ovšem tímto není rozsah možných použitelných rozpouštědel nijak omezen, a tuto reakci je možno provést při teplotách pohybujících se v rozmezí od asi 0 °C do asi 250 °C při tlaku v rozmezí od asi 0,1 MPa do 20 MPa, přičemž tímto způsobem se získají sloučeniny obecného vzorce A (ve vzorci A jsou zahrnuty vzorce V* a VI*):



ve kterém:

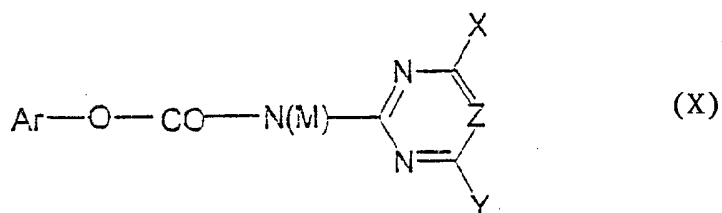
R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno shora v případě sloučenin obecného vzorce I,

R^4 a R^5 znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkový zbytek

obsahující 1 až 12 atomů uhlíku, a

A* znamená atom vodíku nebo acylovou skupinu, přičemž potom následuje reakce této sloučeniny obecného vzorce A, definované výše;

(i) se sloučeninou obecného vzorce X:



ve kterém:

Ar znamená nesubstituovaný nebo substituovaný fenylový zbytek,

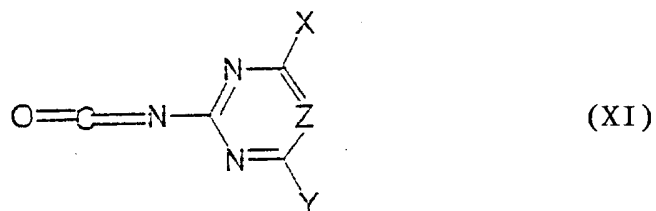
M znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku nebo kovový kation,

X a Y navzájem na sobě nezávisle znamenají halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkenyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo alkinyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a

Z znamená skupinu CH nebo N, při teplotě pohybující se v rozmezí od asi -50 °C do asi

150 °C, při atmosférickém tlaku, při tlaku nižším než atmosférickém nebo při tlaku vyšším než atmosférickém, případně v přítomnosti rozpouštědla nebo směsi rozpouštědel, jako jsou například nesubstituované nebo substituované uhlovodíky, jako například nesubstituované nebo substituované arylové sloučeniny (například alkylarylové sloučeniny nebo halogenarylové sloučeniny) nebo nesubstituované nebo substituované alkylové sloučeniny (například halogenalkylové sloučeniny), dále estery, ethery, amidy, nitrilové sloučeniny a ketony, přičemž ovšem tímto není rozsah možných použitelných rozpouštědel nijak omezen, a případně v přítomnosti bazické látky, jako jsou například uhličitany, alkoxidy, hydroxidy nebo terciární aminy, čímž ovšem není rozsah použitelných bazických látek nijak omezen; nebo

(ii) se sloučeninou obecného vzorce XI:



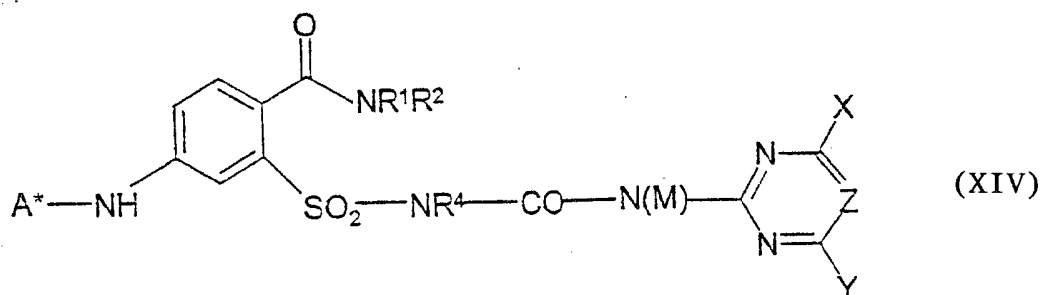
ve kterém:

X a Y navzájem na sobě nezávisle znamenají halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkenyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo alkinyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a

Z znamená skupinu CH nebo N,

při teplotě pohybující se v rozmezí od asi -50 °C do asi 150 °C, při atmosférickém tlaku, při tlaku nižším než atmosférickém nebo při tlaku vyšším než atmosférickém, případně v přítomnosti rozpouštědla nebo směsi rozpouštědel, jako jsou například nesubstituované nebo substituované uhlovodíky, jako například nesubstituované nebo substituované arylové sloučeniny (například alkylarylové sloučeniny nebo halogenarylové sloučeniny) nebo nesubstituované nebo substituované alkylové sloučeniny (například halogenalkylové sloučeniny), dále estery, ethery, amidy a nitrilové sloučeniny, přičemž tímto způsobem se získají sulfonylové sloučeniny obecného vzorce XIV nebo jejich soli:



ve kterém:

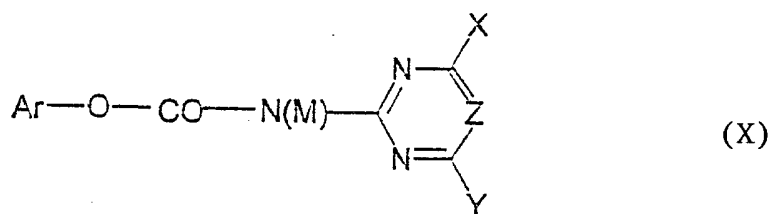
R^1 , R^2 a R^4 mají stejný význam jako bylo definováno v souvislosti s obecným vzorcem VIII,

M, X, Y a Z mají stejný význam jako v případě sloučeniny obecného vzorce X, a

A* znamená atom vodíku nebo acylovou skupinu.

Tyto sulfonamidové sloučeniny obecného vzorce VIII je možno rovněž uvést do reakce:

(B) stejným způsobem jako je to popsáno v mezinárodní zveřejněné patentové přihlášce WO 97/16419, která zde slouží svým plným obsahem jako odkazový materiál, se sloučeninou obecného vzorce X:



ve kterém:

Ar znamená nesubstituovanou nebo substituovanou fenylovou skupinu,

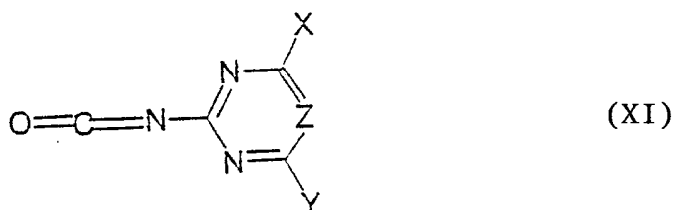
M znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku nebo kovový kation,

X a Y znamenají navzájem na sobě nezávisle každý halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku,

alkenyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo
alkinyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a

Z znamená skupinu CH nebo N,
nebo

(C) stejným způsobem jako je to popsáno v mezinárodní
zveřejněné patentové přihlášce WO 95/29899 (odpovídá
EP-A-757679, která zde slouží svým plným obsahem jako
odkazový materiál, se sloučeninou obecného vzorce XI:



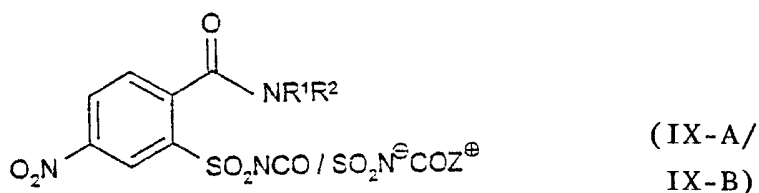
ve kterém:

X a Y znamenají navzájem na sobě nezávisle každý
halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku,
alkoxyskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku,
alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž
každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být
nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více
skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen,
alkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku,
alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo
představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů
uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku,
alkinylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku,
alkenyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo
alkinyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a

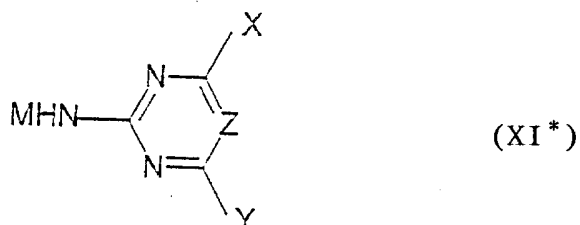
Z znamená skupinu CH nebo N,
nebo

03.07.02

(D) stejným způsobem jako je to popsáno v mezinárodní zveřejněné patentové přihlášce WO 00/05220, která zde slouží svým plným obsahem jako odkazový materiál, s aktivačním reakčním činidlem, jako je například fosgen, a aminem, přičemž se připraví sloučenina obecného vzorce IX-A nebo IX-B:



ve kterém mají R^1 a R^2 stejný význam jako bylo uvedeno v souvislosti s obecným vzorcem I, přičemž potom následuje reakce sloučeniny obecného vzorce IX, předtím získané, se sloučeninou obecného vzorce XI*:



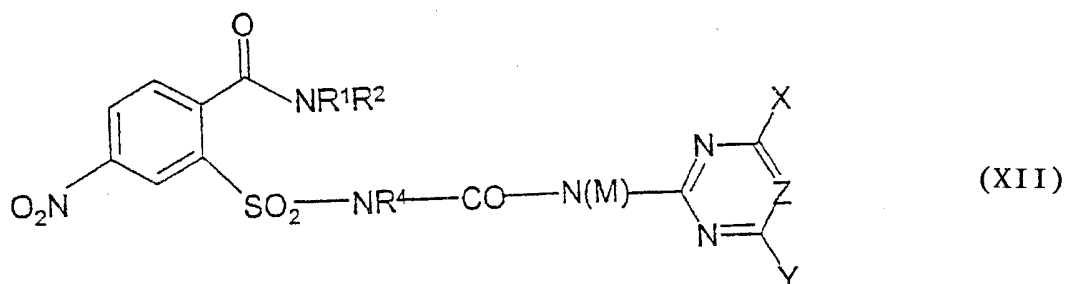
ve kterém:

M znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku nebo kovový kation,

X a Y znamenají navzájem na sobě nezávisle každý halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být

nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen, alkokyskupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkenyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo alkinyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a

Z znamená skupinu CH nebo N, při teplotě pohybující se v rozmezí od asi -50 °C do asi 150 °C, při atmosférickém tlaku, při tlaku nižším než atmosférickém nebo při tlaku vyšším než atmosférickém, případně v přítomnosti rozpouštědla nebo směsi rozpouštědel, jako jsou například nesubstituované nebo substituované uhlovodíky, jako například nesubstituované nebo substituované arylové sloučeniny (například alkylarylové sloučeniny nebo halogenarylové sloučeniny) nebo nesubstituované nebo substituované alkylové sloučeniny (například halogenalkylové sloučeniny), dále estery, ethery a nitrilové sloučeniny, přičemž tímto způsobem se získají nitrofenyl-sulfonylové sloučeniny obecného vzorce XII nebo jejich soli:

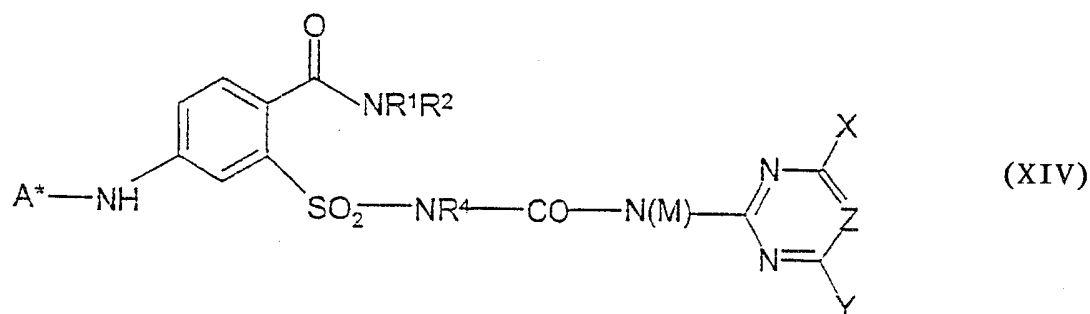


ve kterém:

R^1 , R^2 a R^4 mají stejný význam jako bylo definováno v souvislosti s obecným vzorcem VIII,

M, X, Y a Z mají stejný význam jako v případě sloučeniny obecného vzorce X.

Tyto nitrofenyl-sulfonylmočoviny obecného vzorce XII nebo jejich soli je možno dále převést na odpovídající aminofenyl-sulfonylmočoviny obecného vzorce XIV nebo jejich soli:



ve kterém:

R^1 , R^2 a R^4 mají stejný význam jako bylo definováno v souvislosti s obecným vzorcem VIII,

M, X, Y a Z mají stejný význam jako v případě sloučeniny obecného vzorce X, a

A^* znamená atom vodíku, hydrogenací, jako například hydrogenací provedenou stejným způsobem jako v případě sloučenin obecného vzorce I a VIII nebo způsobem popsáným v mezinárodní zveřejněné patentové přihlášce WO 97/16419, která je zde uváděna jako odkazový materiál.

Například hydrogenaci je možno provést vodíkem nebo zdrojem vodíku, jako je například cyklohexadien,

v přítomnosti kovového katalyzátoru, jako je například Pd/C, Pt/C, Ru/C nebo Raneyův nikl, samotný nebo v kombinaci, případně v přítomnosti jiných kovových derivátů, jako jsou například oxidy nebo soli kovů manganu, molybdenu, wolframu, železa a kobaltu, ve kterých je kov přítomen jako kation, oxoanion nebo polyoxoanion, v inertním rozpouštědle nebo v jejich rozpouštědlové směsi, jako je například voda, alkoholy, nesubstituované nebo substituované uhlovodíky, jako například nesubstituované nebo substituované arylové sloučeniny (například alkylarylové sloučeniny nebo halogenarylové sloučeniny) nebo nesubstituované nebo substituované alkylové sloučeniny (například halogenalkylové sloučeniny), ethery, uhličitany, karbamáty, estery, nitrilové sloučeniny, sulfony, karboxylové kyseliny a ketony, přičemž ovšem tímto není rozsah možných použitelných rozpouštědel nijak omezen, při teplotách pohybujících se v rozmezí od asi -30 °C do 300 °C a ve výhodném provedení při teplotách v rozmezí od -10 °C do 150 °C.

Nitrofenyl-sulfonylmočovinné sloučeniny obecného vzorce XII nebo jejich soli je možno rovněž dále převést na odpovídající acylamidofenyl-sulfonylmočoviny obecného vzorce XIV nebo jejich soli, ve kterém R^1 , R^2 a R^4 mají stejný význam jako bylo definováno v souvislosti s obecným vzorcem VIII, M, X, Y a Z mají stejný význam jako bylo definováno v souvislosti s obecným vzorcem X, a A^* znamená acylovou skupinu, ve výhodném provedení formylovou skupinu nebo hydrokarbyl-karbonylovou skupinu obsahující 1 až 8 atomů uhlíku v hydrokarbylové části, jako je například alkylkarbonylová skupina s přímým nebo rozvětveným řetězcem obsahující 1 až 8 atomů uhlíku v alkylové části, hydrogenací po které následuje acylace nebo je možno provést současnou

acylaci (redukční acylace = hydrogenace v přítomnosti acylačního činidla), jako například hydrogenací provedenou stejným způsobem jako v případě sloučenin obecného vzorce I a VIII nebo způsobem popsáním v mezinárodní zveřejněné patentové přihlášce WO 97/16419, která je zde uváděna jako odkazový materiál.

Například je možno uvést, že tuto reakci je možno provést za použití vodíku nebo zdroje vodíku, jako je například cyklohexadien v přítomnosti (a) kovového katalyzátoru, jako je například Pd/C, Pt/C, Ru/C nebo Raneyův nikl, samotný nebo v kombinaci, případně v přítomnosti jiných kovových derivátů, jako jsou například oxidy nebo soli kovů manganu, molybdenu, wolframu, železa a kobaltu, ve kterých je kov přítomen jako kation, oxoanion nebo polyoxoanion, a (b) acylačního činidla, jako je například kyselina mravenčí a/nebo anhydridy karboxylových kyselin obsahující 1 až 8 atomů uhlíku, nebo případně v přítomnosti jiných rozpouštědel nebo směsí těchto rozpouštědel, jako jsou například nesubstituované nebo substituované uhlovodíky, například nesubstituované nebo substituované arylové sloučeniny (například alkylarylové sloučeniny nebo halogenarylové sloučeniny) nebo nesubstituované nebo substituované alkylové sloučeniny (jako například halogenalkylové sloučeniny), dále uhličitany, karbamáty, estery, ethery, ketony, nitrilové sloučeniny a sulfony, přičemž se reakce provede při teplotě pohybující se v rozmezí od asi -30 °C do asi 300 °C, a ve výhodném provedení v rozmezí od -10 °C do 150 °C, za vzniku odpovídajících acylamidofenyl-sulfonylmočovinových derivátů obecného vzorce XIV nebo jejich solí.

Postupy popisované shora v tomto popisu umožňují přípravu herbicidně účinných sulfonylmočovinových sloučenin a jejich prekurzorů, jako například sulfochloridů nebo sulfonamidů, ve vysokém výtěžku.

Příklady provedení vynálezu

Postup podle předmětného vynálezu bude v dalším blíže ilustrován pomocí konkrétních příkladů provedení, které jsou ovšem pouze příkladné a nijak neomezují rozsah tohoto vynálezu.

P ř í k l a d 1

Draselná sůl N,N-dimethyl-4-nitro-2-sulfobenzamidu, obecný vzorec (I).

(A)

Podle tohoto postupu byla použita suspenze obsahující 31,9 gramu draselné soli 4-nitro-2-sulfobenzoové kyseliny v toluenu (240 mililitrů), která byla zahřívána při teplotě varu pod zpětným chladičem, načež bylo azeotropickým způsobem odstraněno 0,6 až 0,8 mililitru vody. Takto získaná směs byla potom ochlazena na teplotu v rozmezí od 85 do 90 °C, přičemž byl přidán dimethylformamid (0,23 mililitru) a pyridin (0,16 mililitru) a během 4 hodin byl přidáván fosgen (10,1 gramu). Potom byl tento podíl zahříván po dobu dalších 2 hodin při teplotě 85 až 90 °C, načež byl odstraněn přebytek fosgenu profukováním dusíku tímto roztokem. Potom byl k tomuto roztoku, který byl prostý fosgenu, přidán dimethylamin (4,78 gramu) při teplotě 98 až 103 °C. po jedné hodině byla takto získaná suspenze ochlazena na teplotu 20 °C, zfiltrována a pevný podíl byl promyt toluenem (dva podíly po 20 mililitrech), dobře komprimován a usušen při

teplotě 75 °C a tlaku 5 kPa.

Výtěžek : 35,1 gramu (= 90%), 80,1% hmot/hmot,

Teplota tavení : 320 °C za rozkladu.

(B)

Podle tohoto postupu byla použita směs obsahující draselnou sůl 4-nitro-2-sulfobenzoové kyseliny (50 gramů), dimethylaminhydrochlorid (14,2 gramu) a tetrabutylamonium-bromid (1,0 gram) v xylenu (120 mililitrů), přičemž tato směs byla zahřáta na teplotu 100 °C a potom byl po kapkách během intervalu 45 minut přidáván thionylchlorid (15 mililitrů). Po 2 hodinách byla tato reakční směs ochlazena na teplotu 20 °C, získaný produkt byl zfiltrován a promyt xylenem (dva podíly po 50 mililitrech).

Výtěžek : 61,72 gramu (= 91,3%), 70,0% hmot/hmot.

P ř í k l a d 2

N,N-dimethyl-2-aminosulfonyl-4-nitrobenzamid, obecný vzorec VIII.

(A)

Podle tohoto postupu byla použita suspenze obsahující 79,9 gramu draselné soli 4-nitro-2-sulfobenzoové kyseliny v xylenu (570 mililitrů), přičemž tato suspenze byla zahřívána při teplotě 88 až 92 °C, načež byl přidán dimethylformamid (1 mililitr) a fosgen (58 gramů) ve formě plynu během intervalu 3 hodin. Po další 1 hodině byl přebytkový podíl fosgenu odstraněn destilací, načež byl přidán druhý podíl draselné soli 4-nitro-2-sulfobenzamidu (75,7 gramu) a pyridinu (0,6 mililitru). Takto získaná směs byla potom zahřívána při teplotě 138 °C po dobu 1 hodiny, načež byla ochlazena na teplotu 95 až 100 °C a potom byl během intervalu 2 hodin přidáván dimethylamin (23,5 gramu)

a takto získaná směs byla zahřívána po dobu 30 minut při výše uvedené teplotě. Získaná suspenze byla potom ochlazena na teplotu 70 až 75 °C, přičemž během intervalu 2 hodin byl přidán roztok dimethylformamidu (0,38 mililitru) v xylenu (10 mililitrů) a fosgen (77,1 gramu). Přebytkový podíl fosgenu byl potom po jedné hodině odstraněn oddestilováním, přičemž tato reakční směs byla ochlazena na teplotu v rozmezí od 0 do 5 °C. V tomto okamžiku byl přidán amoniak (19,5 gramu) takovým způsobem, aby teplota zůstávala pod 5 °C. Nakonec byla tato reakční směs zahřáta na teplotu 20 °C, načež byla přidána voda (420 mililitrů) a koncentrovaná kyselina sírová (7,4 gramu) (konečné pH = 4) a tato směs byla potom promíchávána po dobu 15 minut. Pevný podíl byl potom zfiltrován, promyt vodou (pět podílů po 100 mililitrech), dobře zkomprimován a usušen při teplotě 75 °C a tlaku 5 kPa.

Výtěžek : 111,4 gramu (=81%), 93,4% hmot/hmot.

(B)

Podle tohoto postupu byla použita směs obsahující 31,9 gramu draselné soli 4-nitro-2-sulfobenzoové kyseliny (obecný vzorec III) a toluen (240 mililitrů), přičemž tato směs byla zahřívána při teplotě varu pod zpětným chladičem a tímto způsobem bylo azeotropicky odstraněno 0,6 až 0,8 mililitru vody. Získaná směs byla potom ochlazena na teplotu v rozmezí od 82 do 87 °C načež byl přidán benzyltriethylamoniumchlorid (0,91 gramu) a během dvou hodin byl po kapkách přidáván thionylchlorid (9,2 mililitru). Po další jedné hodině byla směs toluenu a thionylchloridu (25 mililitrů) odstraněna destilací a potom byl při teplotě v rozmezí 95 až 100 °C přidán dimethylamin (7,5 gramu) ve formě plynu. Po 1 hodině, kdy byla tato směs ponechána při výše uvedené teplotě, byla potom tato směs ochlazena na teplotu 70 až 75 °C, přičemž

potom byl během dvou hodin přidáván dimethylformamid (0,08 mililitru) ve formě roztoku v toluenu (2 mililitry) a fosgen (15,8 gramu). Po další jedné hodině byl použitý fosgen odstraněn probubláváním dusíkem touto směsí a potom byl při teplotě v rozmezí 0 až 5 °C přidáván amoniak (4 gramy). Po ohřátí za použití vakua na teplotu 40 °C byl potom takto získaný produkt izolován filtrací, promyt toluenem (tři podíly po 20 mililitrech) a dobře komprimován. Tento pevný podíl byl potom opětně suspendován ve vodě (85 mililitrů) a acetonu (2,5 mililitru), promíchán, zfiltrován, promyt vodou (5 podílů po 20 mililitrech) a nakonec usušen při teplotě 75 °C a tlaku 5 kPa.

Výtěžek : 23,6 gramu (=82%), 95,6% hmot/hmot.

Teplota tání : 161 - 162 °C.

P ř í k l a d 3

N,N-dimethyl-2-aminosulfonyl-4-formamidobenzamid, obecný vzorec VI*.

Podle tohoto příkladu byla použita suspenze obsahující 40 gramů N,N-dimethyl-2-aminosulfonyl-4-nitrobenzamidů obecného vzorce VIII, molybdenan sodný (0,08 gramu) a Pd/C (3 gramy, 5%, 50% voda) v kyselině mravenčí (200 mililitrů), přičemž tato suspenze byla podrobena hydrogenaci při teplotě 50 °C a tlaku 4 MPa (40 barů) po dobu 7 hodin. Použitý katalyzátor byl potom zfiltrován a promyt kyselinou mravenčí (20 mililitrů). Získaný filtrát byl potom zkoncentrován ve vakuu a potom byl přidán ethylacetát (200 mililitrů). Po promíchání, které bylo prováděno po dobu 2 hodin při teplotě 20 °C, byl získaný produkt zfiltrován, filtrát byl zkoncentrován a opětně zfiltrován. Jednotlivé podíly pevných látek byly spojeny a tento spojený podíl byl promyt ethylacetátem (20 mililitrů) a sušen při teplotě 50 °C

a tlaku 5 kPa.

Výtěžek : 35,3 gramu (=84,3%), 94,1% hmot/hmot.

Teplota tání : 192 - 193 °C.

P ř í k l a d 4

N,N-dimethyl-2-(N-(N-(4,6-dimethoxypyrimid-2-yl)-amino-
-karbonyl)aminosulfonyl)-4-nitrobenzamid, obecný vzorec XII.

Při provádění postupu podle tohoto příkladu byl k roztoku, který obsahoval fosgen (20 gramů) v ethylacetátu (70 mililitrů), při teplotě 0 °C v intervalu 2,5 hodiny přidávána směs obsahující 20 gramů N,N-dimethyl-2-aminosulfonyl-4-nitrobenzamidů obecného vzorce VIII a triethylamin (39 mililitrů) v ethylacetátu (200 mililitrů). Po 30 minutách byl přebytkový fosgen odstraněn profukováním dusíkem touto směsí, načež byl potom po kapkách přidáván roztok 2-amino-4,6-dimethoxypyrimidinu (11,9 gramu) v ethylacetátu (80 mililitrů). Po další 1,5 hodině byla přidána voda (200 mililitrů) a hydroxid draselný (5 N roztok, 45 mililitrů) a po vyčištění byly jednotlivé fáze odděleny. Organická fáze byla potom extrahována vodou (dva podíly po 50 mililitrech) a spojené vodné fáze byly potom okyseleny na pH 2 kyselinou chlorovodíkovou (93 N, 35 mililitrů). Podíl pevných látek byl potom oddělen odfiltrováním, načež byl promyt vodou a usušen při teplotě 40 °C a tlaku 5 kPa.

Výtěžek : 22,3 gramu (=58%), 87,1% hmot/hmot.

P ř í k l a d 5

N,N-dimethyl-2-(N-(N-(4,6-dimethoxypyrimid-2-yl)amino-
-karbonyl)aminosulfonyl)-4-formamidobenzamid, obecný vzorec XIV.

(A)

Podle tohoto příkladu byla použita směs obsahující 75 gramů N,N-dimethyl-2-(N-(-(4,6-dimethoxypyrimid-2-yl)-aminokarbonyl)aminosulfonyl)-4-nitrobenzamidů obecného vzorce XII, molybdenan sodný (0,05 gramu) a Pd/C (3 gramy, 5%, 50% voda) v kyselině mravenčí (225 mililitrů), přičemž tato směs byla podrobena hydrogenaci prováděné po dobu 3 hodin při teplotě 30 až 35 °C. Použitý katalyzátor byl potom zfiltrován a promyt kyselinou mravenčí (20 mililitrů). Získaný filtrát byl potom zkoncentrován ve vakuu (35 °C) a potom byl přidán ethylacetát (240 mililitrů). Po promíchání, které bylo prováděno po dobu 1 hodiny při teplotě 45 °C, byla takto získaná směs ochlazená na teplotu v rozmezí od 0 do 5 °C, načež byla promíchávána po dobu další 2 hodiny a zfiltrována. Po promytí ethylacetátem (dva podíly po 25 mililitrech) byl takto získaný produkt opětně suspendován v ethylacetátu (200 mililitrů), zahříván po dobu 2 hodin při teplotě 50 až 55 °C, načež byl potom ochlazen na teplotu 20 °C, zfiltrován, promyt ethylacetátem (dva podíly po 25 mililitrech) a usušen při teplotě 45 °C při tlaku 5 kPa.

Výtěžek : 60,6 gramu (=83,6%), 95,5% hmot/hmot.

(B)

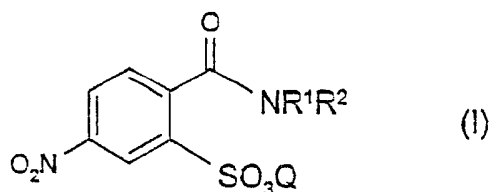
Podle tohoto postupu byla použita směs obsahující 30 gramů N,N-dimethyl-2-aminosulfonyl-4-formamidobenzamidů obecného vzorce VI* a 3,3 gramu N-(4,6-dimethoxypyrimid-2-yl)fenylkarbamátu (3,3 gramu) v acetonitrilu (250 mililitrů), přičemž tato směs byla zpracována uhličitánem draselným (30 gramů) při teplotě 20 °C. Potom byl po 3 hodinách přidán další podíl N-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)fenylkarbamátu (2 gramy). Za další jednu hodinu byl potom přidán xylen (400 mililitrů) a použitý acetonitril byl

odstraněn oddestilováním ve vakuu (45 °C). Potom byla přidána kyselina chlorovodíková (1 N roztok, 400 mililitrů), přičemž takto získaný produkt byl zfiltrován, promyt vodou (dva podíly po 200 mililitrech), xylenem (dva podíly po 200 mililitrech) a usušen.

Výtěžek : 42 gramů (=66,1%), 78,7% hmot/hmot.

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. Sloučenina obecného vzorce I:



ve kterém:

R^1 znamená nesubstituovaný nebo substituovaný uhlovodíkový zbytek obsahující celkově 1 až 10 atomů uhlíku,

R^2 znamená nesubstituovaný nebo substituovaný uhlovodíkový zbytek obsahující celkově 1 až 10 atomů uhlíku, nebo skupina NR^1R^2 představuje heterocyklický kruh obsahující 3 až 8 atomů v kruhu, přičemž tato skupina je nesubstituovaná nebo substituovaná a obsahuje dusíkový atom skupiny NR^1R^2 jako kruhový heteroatom, a

Q znamená atom vodíku nebo kation.

2. Sloučenina obecného vzorce I podle nároku 1, ve kterém:

R^1 je alkylová skupina obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkenylová skupina obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinylová skupina obsahující 2 až 6 atomů uhlíku nebo cykloalkylová skupina obsahující 5 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z výše uvedených posledních čtyř skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více zbytky vybranými ze skupiny zahrnující halogen, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,

halogenalkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, mono-
a di-alkylaminoskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku
v alkylové části, kyanoskupinu, azidovou skupinu, formylovou
skupinu, alkylkarbonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy
uhlíku v alkylové části, alkoxykarbonylovou skupinu
obsahující 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy-části,
alkylsulfinylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku
a alkylsulfonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
nebo R^1 znamená fenylovou skupinu, která je nesubstituovaná
nebo substituovaná zbytky vybranými ze skupiny zahrnující
halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
alkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
halogenalkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
halogenalkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku
a nitroskupinu,

R^2 je alkylová skupina obsahující 1 až 6 atomů uhlíku,
alkenylová skupina obsahující 2 až 6 atomů uhlíku,
alkinylová skupina obsahující 2 až 6 atomů uhlíku nebo
cykloalkylová skupina obsahující 5 až 6 atomů uhlíku,
přičemž každá z výše uvedených posledních čtyř skupin může
být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více
zbytky vybranými ze skupiny zahrnující halogen,
alkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
halogenalkoxyskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,
alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, mono-
a di-alkylaminoskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku
v alkylové části, kyanoskupinu, azidovou skupinu, formylovou
skupinu, alkylkarbonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy
uhlíku v alkylové části, alkoxykarbonylovou skupinu
obsahující 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy-části,
alkylsulfinylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku
a alkylsulfonylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku,

nebo skupina NR^1R^2 představuje heterocyklický kruh obsahující 4, 5 nebo 6 atomů v kruhu, který může obsahovat dva další heteroatomy v kruhu vybrané ze skupiny zahrnující N a O, přičemž tato skupina je nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více alkylovými skupinami obsahujícími 1 až 4 atomy uhlíku, a

Q znamená atom vodíku nebo alkalický kation nebo kation alkalické zeminy nebo amonný nebo fosfoniový kation.

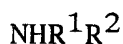
3. Sloučenina obecného vzorce I podle nároku 1 nebo 2, ve kterém:

R^1 znamená alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, zejména methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu,

R^2 znamená alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, zejména methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu, a

Q znamená atom vodíku, sodíku nebo draslíku.

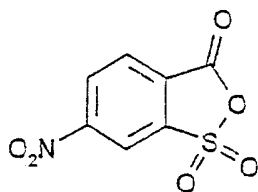
4. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce I podle nároků 1 až 3, vyznačující se tím, že zahrnuje reakci aminu obecného vzorce:



nebo soli této sloučeniny, ve kterém R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo uvedeno u sloučeniny obecného vzorce

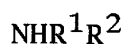
I v nárocích 1 až 3,

s anhydridem obecného vzorce II:

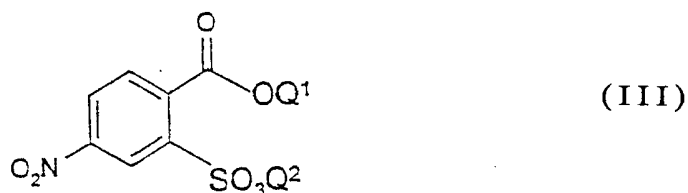


(II)

5. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce I podle nároků 1 až 3, vyznačující se tím, že zahrnuje reakci aminu obecného vzorce:

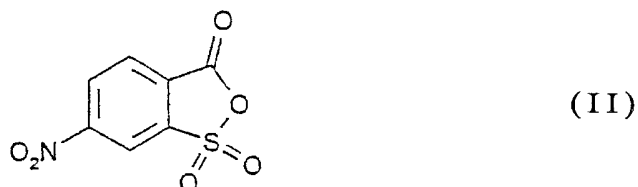


nebo soli této sloučeniny, ve kterém R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo uvedeno u sloučeniny obecného vzorce I v nárocích 1 až 3,
s dvojkyselinou obecného vzorce III:

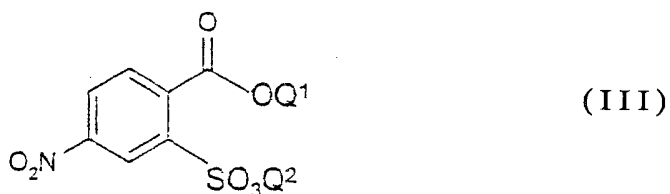


ve kterém mají Q^1 a Q^2 stejný nebo odlišný význam a znamenají atom vodíku nebo kation.

6. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce II:

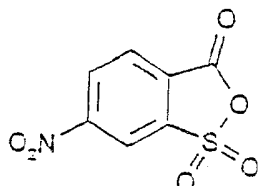


vyznačující se tím, že zahrnuje reakci dvojkyseliny obecného vzorce III:



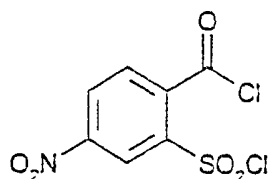
ve kterém mají Q^1 a Q^2 stejný nebo odlišný význam
a znamenají atom vodíku nebo kation,
s aktivačním reakčním činidlem v rozpouštědle.

7. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce II:



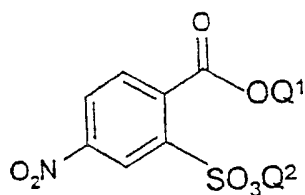
(II)

vyznačující se tím, že zahrnuje reakci dichloridu obecného
vzorce IV:



(IV)

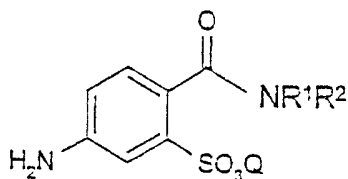
s dvojkyselinou obecného vzorce III:



(III)

ve kterém mají Q^1 a Q^2 stejný nebo odlišný význam
a znamenají atom vodíku nebo kation.

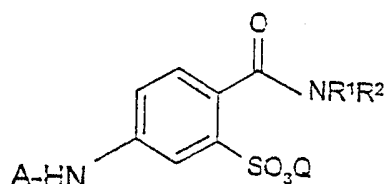
8. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce V:



(V)

ve kterém mají Q, R¹, R² stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, **vyznačující se tím, že zahrnuje reakci sloučeniny obecného vzorce I, definované v nárocích 1 až 3. s vodíkem nebo vodíkovým zdrojem v přítomnosti kovového katalyzátoru.**

9. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce VI:



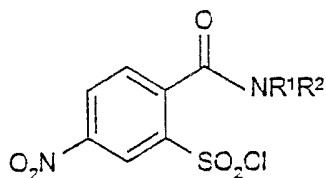
(VI)

ve kterém :

Q, R¹ a R² mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

A znamená acylovou skupinu, zahrnující reakci sloučeniny obecného vzorce I, nárokované v nárocích 1 až 3, s vodíkem nebo zdrojem vodíku v přítomnosti kovového katalyzátoru a acylačního činidla.

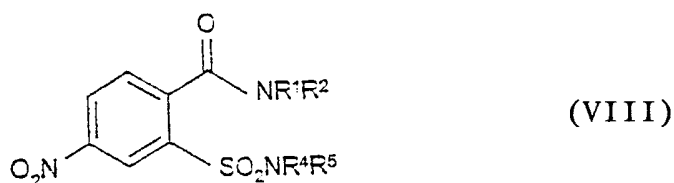
10. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce VII:



(VII)

ve kterém R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, vyznačující se tím, že zahrnuje reakci sloučeniny obecného vzorce I, nárokované v nárocích 1 až 3, s aktivačním reakčním činidlem v přítomnosti amidového katalyzátoru.

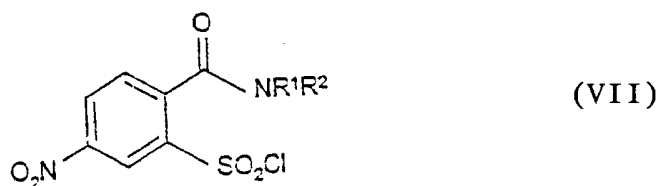
11. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce VIII:



ve kterém :

R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

R^4 a R^5 znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku, vyznačující se tím, že zahrnuje reakci sloučeniny obecného vzorce VII:



ve kterém:

R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, se sloučeninou obecného vzorce



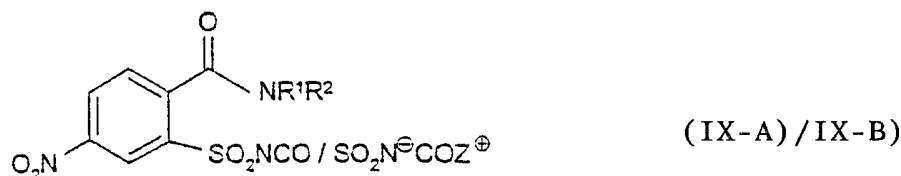
ve kterém:

R^4 a R^5 znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku.

12. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce VIII, vyznačující se tím, že zahrnuje následné provedení reakčních stupňů definovaných v nárocích 6, 4, 10 a 11, nebo v nárocích 7, 4, 10 a 11, nebo v nárocích 4, 10 a 11, nebo v nárocích 6, 5, 10 a 11, nebo v nárocích 7, 5, 10 a 11, nebo v nárocích 5, 10 a 11, nebo v nárocích 10 a 11.

13. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce VII, vyznačující se tím, že zahrnuje následné provedení reakčních stupňů definovaných v nárocích 6, 4 a 10, nebo v nárocích 7, 4 a 10, nebo v nárocích 4 a 10, nebo v nárocích 6, 5 a 10, nebo v nárocích 7, 5 a 10, nebo v nárocích 5 a 10.

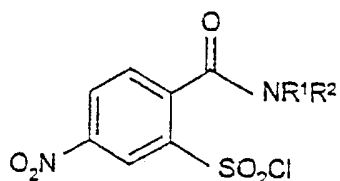
14. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce IX-A nebo IX-B:



ve kterém :

R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

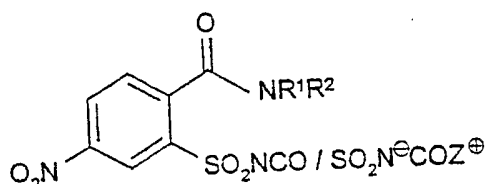
Z v obecném vzorci IX-B znamená terciární amonnou skupinu, vyznačující se tím, že zahrnuje reakci sloučeniny obecného vzorce VII



(VII)

ve kterém R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, s kyanátovou solí.

15. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce IX-A nebo IX-B:

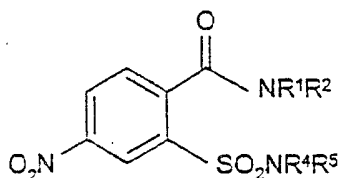


(IX-A)/IX-B)

ve kterém :

R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

Z v obecném vzorci IX-B znamená terciární amonnou skupinu, vyznačující se tím, že zahrnuje reakci sloučeniny obecného vzorce VIII:



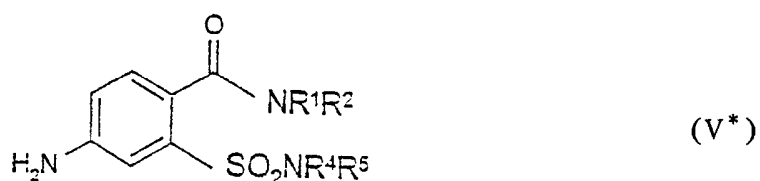
(VIII)

ve kterém :

R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

R^4 a R^5 znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku, s fosgenem.

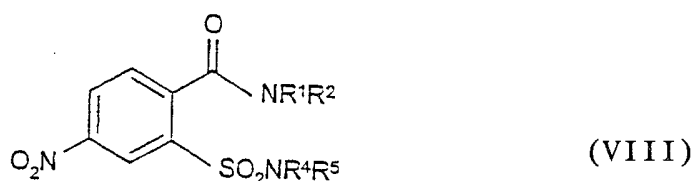
16. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce V^* :



ve kterém:

R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

R^4 a R^5 znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku, vyznačující se tím, že zahrnuje reakci sloučeniny obecného vzorce VIII:



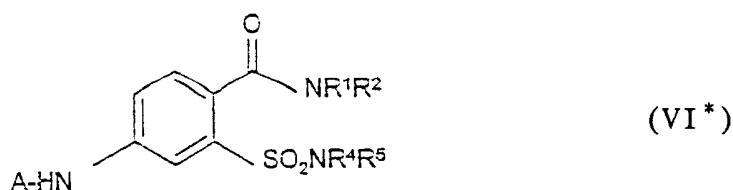
ve kterém:

R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

R^4 a R^5 znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku,

s vodíkem nebo zdrojem vodíku v přítomnosti kovového katalyzátoru.

17. Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce VI*:

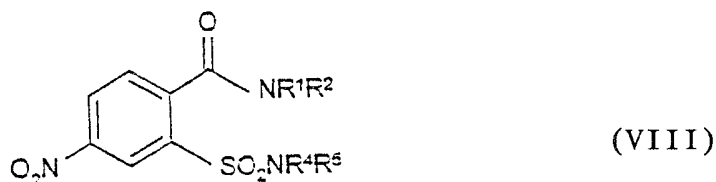


ve kterém:

R¹ a R² mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

R⁴ a R⁵ znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku, a

A znamená acylovou skupinu, vyznačující se tím, že zahrnuje reakci sloučeniny obecného vzorce VIII:



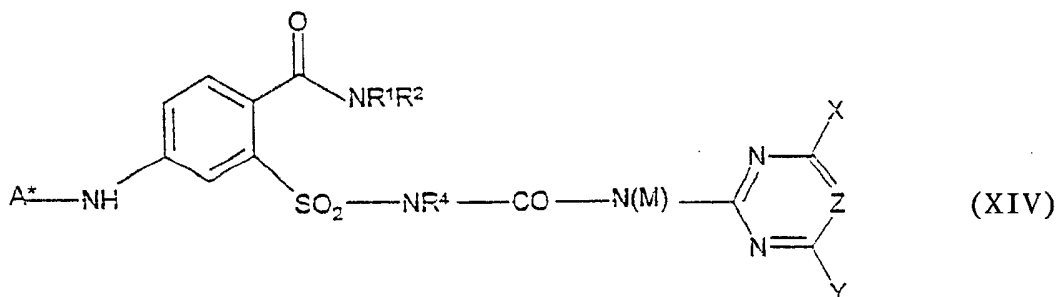
ve kterém:

R¹ a R² mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

R⁴ a R⁵ znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku,

s vodíkem nebo zdrojem vodíku v přítomnosti kovového katalyzátoru a acylačního reakčního činidla.

18. Způsob přípravy sulfonylmočovinové sloučeniny obecného vzorce XIV nebo její soli:



ve kterém:

R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

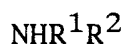
R^4 znamená atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku,

A^* znamená atom vodíku nebo acylovou skupinu,

M znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku nebo kovový kation,

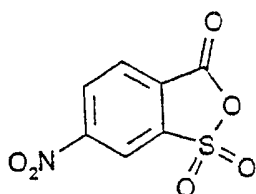
X a Y navzájem na sobě nezávisle každý jednotlivě znamenají halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkoxykupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen, alkoxykupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkenyloxykupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo alkenyloxykupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a

Z znamená skupinu CH nebo N,
vyznačující se tím, že zahrnuje
(a) reakci aminu obecného vzorce



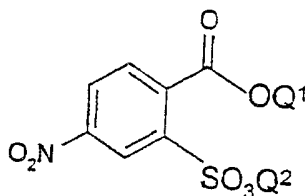
nebo soli této sloučeniny, ve kterém R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3,

(i) s anhydridem obecného vzorce II:



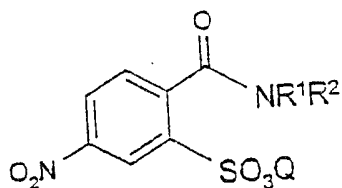
(II)

(ii) nebo s dvojkyselinou obecného vzorce III
nebo s její solí:



(III)

ve kterém Q^1 a Q^2 mají stejný nebo rozdílný význam
a znamenají atom vodíku nebo kation,
za vzniku sloučeniny obecného vzorce I:



(I)

ve kterém:

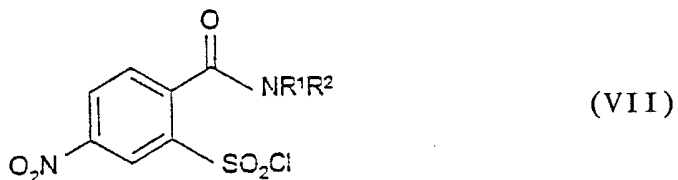
R^1 znamená nesubstituovaný nebo substituovaný uhlovodíkový zbytek obsahující celkově 1 až 10 atomů uhlíku,

R^2 znamená nesubstituovaný nebo substituovaný uhlovodíkový zbytek obsahující celkově 1 až 10 atomů uhlíku,

nebo skupina NR^1R^2 představuje heterocyklický kruh obsahující 3 až 8 atomů v kruhu, přičemž tato skupina je nesubstituovaná nebo substituovaná a obsahuje dusíkový atom skupiny NR^1R^2 jako kruhový heteroatom, přičemž může rovněž obsahovat dva další heteroatomy v kruhu vybrané ze skupiny zahrnující N, O a S, a

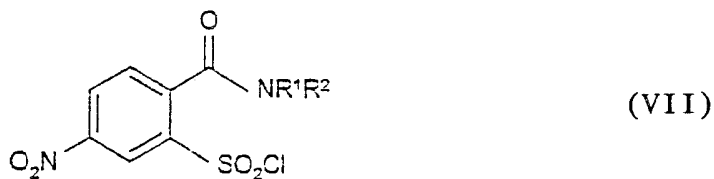
Q znamená atom vodíku nebo kation,

(b) reakci sloučeniny obecného vzorce I, získané ve stupni (a), s aktivačním reakčním činidlem v přítomnosti amidového katalyzátoru za vzniku sloučeniny obecného vzorce VII:



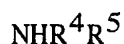
ve kterém R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3,

(c) reakci sloučeniny obecného vzorce VII:

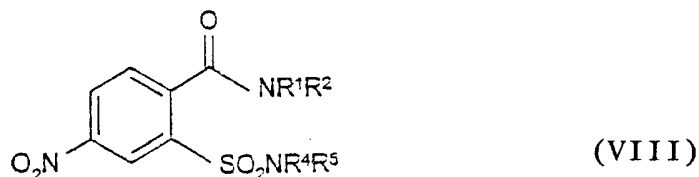


získané ve stupni (b), ve kterém R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3,

se sloučeninou obecného vzorce:



ve kterém R^4 a R^5 znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku, za vzniku sloučeniny obecného vzorce VIII:



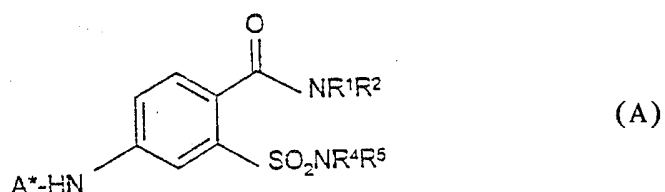
ve kterém:

R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

R^4 a R^5 znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku,

(d) reakci sloučeniny obecného vzorce VIII získané ve stupni (c)

(i) s vodíkem nebo zdrojem vodíku v přítomnosti kovového katalyzátoru a případně s acylačním reakčním činidlem, za vzniku sloučeniny obecného vzorce A:



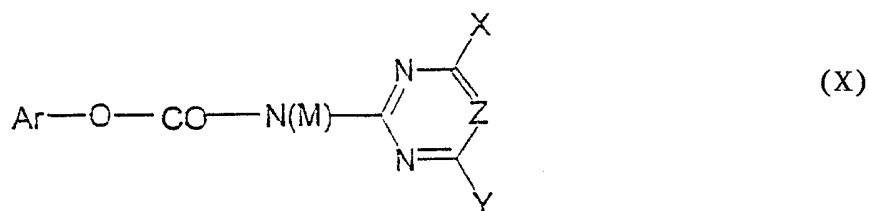
ve kterém:

R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3,

R^4 a R^5 znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku, a

A^* znamená atom vodíku nebo acylovou skupinu, přičemž potom následuje reakce takto získané sloučeniny obecného vzorce A

(α) se sloučeninou obecného vzorce X:



ve kterém:

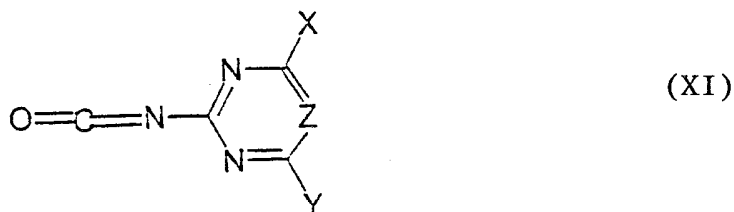
Ar znamená nesubstituovanou nebo substituovanou fenylovou skupinu,

M znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku nebo kovový kation,

X a Y navzájem na sobě nezávisle každý jednotlivě znamenají halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkenyloxy skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo

alkynyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a
Z znamená skupinu CH nebo N,

(β) se sloučeninou obecného vzorce XI:



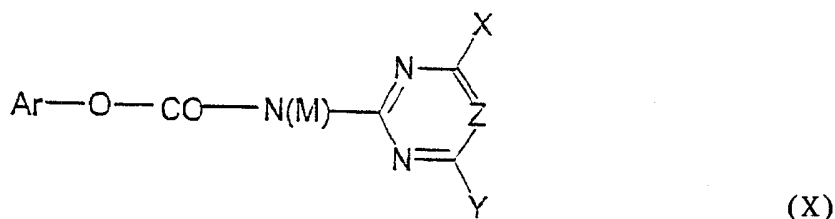
ve kterém:

X a Y navzájem na sobě nezávisle každý jednotlivě znamenají halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkoxykupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen, alkoxykupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkynylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkenyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo alkynyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a
Z znamená skupinu CH nebo N,

za vzniku sloučeniny obecného vzorce XIV nebo její soli, ve které A* znamená atom vodíku nebo acylovou skupinu,

(ii) nebo se sloučeninou obecného vzorce X:

03.07.02



ve kterém:

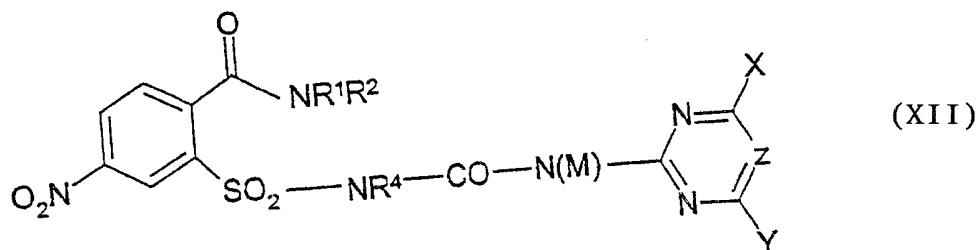
Ar znamená nesubstituovanou nebo substituovanou fenylovou skupinu,

M znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku nebo kovový kation,

X a Y navzájem na sobě nezávisle každý jednotlivě znamenají halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkenyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo alkinyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a

Z znamená skupinu CH nebo N,

za vzniku nitrofenyl-sulfonylmočoviny sloučeniny obecného vzorce XII nebo její soli:

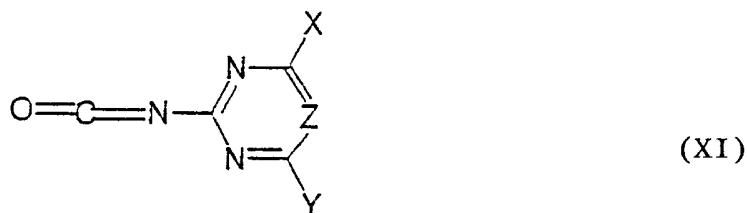


ve kterém:

R^1 , R^2 a R^4 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce VIII, a

M, X, Y a Z mají stejný význam jako bylo definováno v případě sloučeniny obecného vzorce X,

(iii) nebo se sloučeninou obecného vzorce XI:

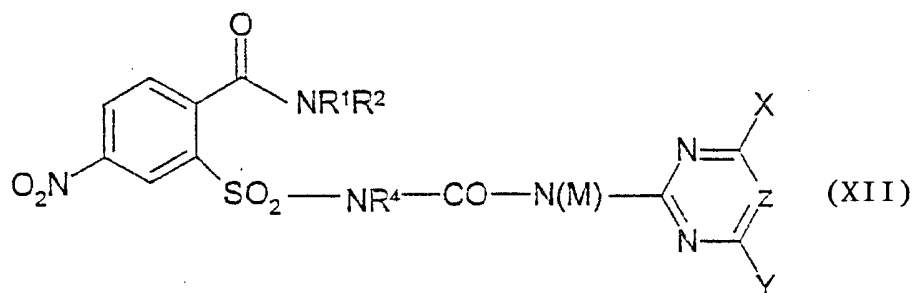


ve kterém:

X a Y navzájem na sobě nezávisle každý jednotlivě znamenají halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo alkinyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a

Z znamená skupinu CH nebo N,

za vzniku nitrofenyl-sulfonylmočoviny obecného vzorce XII nebo její soli:

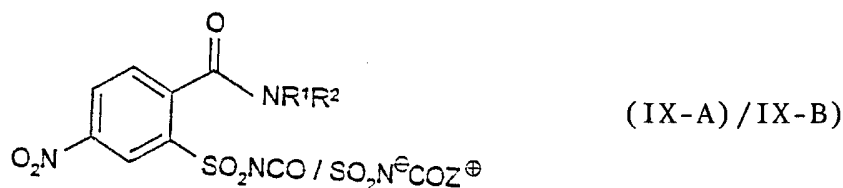


ve kterém:

R^1 , R^2 a R^4 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce VIII, a

M, X, Y a Z mají stejný význam jako bylo definováno v případě sloučeniny obecného vzorce X,

(iv) nebo s fosgenem za vzniku sloučeniny obecného vzorce IX-A nebo IX-B:

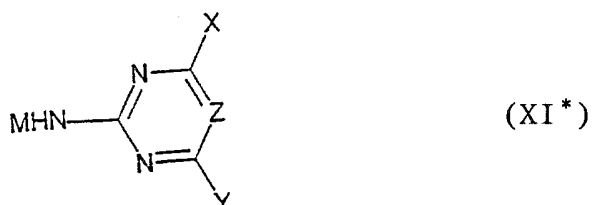


ve kterém :

R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

Z v obecném vzorci IX-B znamená terciární amonnou skupinu,

přičemž potom následuje reakce takto získané sloučeniny obecného vzorce IX-A nebo IX-B se sloučeninou obecného vzorce XI*:



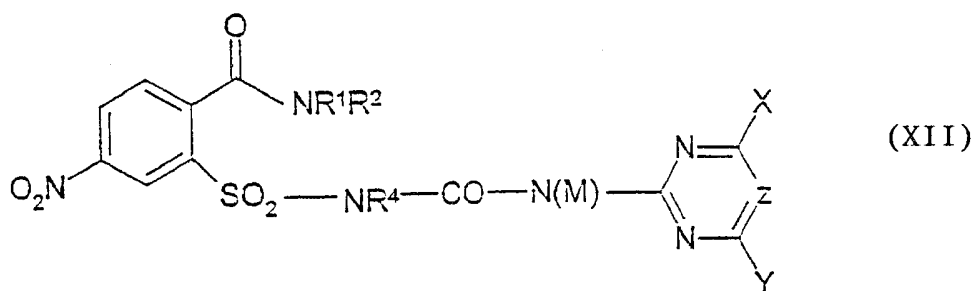
ve kterém:

M znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku nebo kovový kation,

X a Y navzájem na sobě nezávisle každý jednotlivě znamenají halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkenyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo alkinyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a

Z znamená skupinu CH nebo N,

za vzniku nitrofenyl-sulfonylmočoviny sloučeniny obecného vzorce XII nebo její soli:



ve kterém:

R^1 , R^2 a R^4 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce VIII, a

M, X, Y a Z mají stejný význam jako bylo definováno v

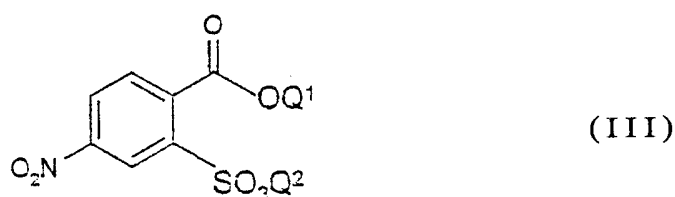
případě sloučeniny obecného vzorce X,
a potom

(e)

(i) se hydrogenuje takto získaná sloučenina obecného vzorce XII ve stupni (d), (ii), (iii) nebo (iv) za vzniku sloučeniny obecného vzorce XIV, ve kterém A* znamená atom vodíku, nebo její soli,

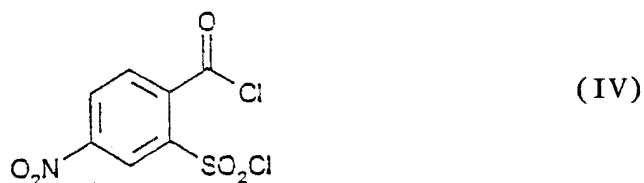
(ii) nebo se hydrogenuje a acyluje sloučenina obecného vzorce XII získaná ve stupni (d), (ii), (iii) nebo (iv) za vzniku sloučeniny obecného vzorce XIV, ve kterém A* znamená acylovou skupinu, nebo její soli.

19. Způsob podle nároku 4 nebo 18, vyznačující se tím, že anhydrid obecného vzorce II, použitý ve stupni (a)(i) se získá reakcí dvojkyseliny obecného vzorce III:

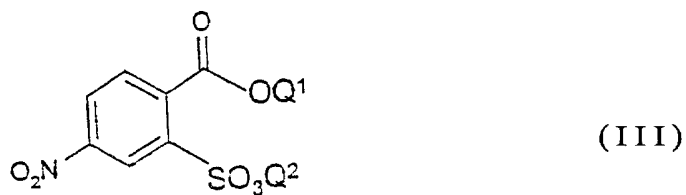


ve kterém Q¹ a Q² jsou stejné nebo rozdílné a každý představuje atom vodíku nebo kation, s aktivačním reakčním činidlem.

20. Způsob podle nároku 4 nebo 18, vyznačující se tím, že anhydrid obecného vzorce II, použitý ve stupni (a)(i) se získá reakcí dichloridu kyseliny obecného vzorce IV:

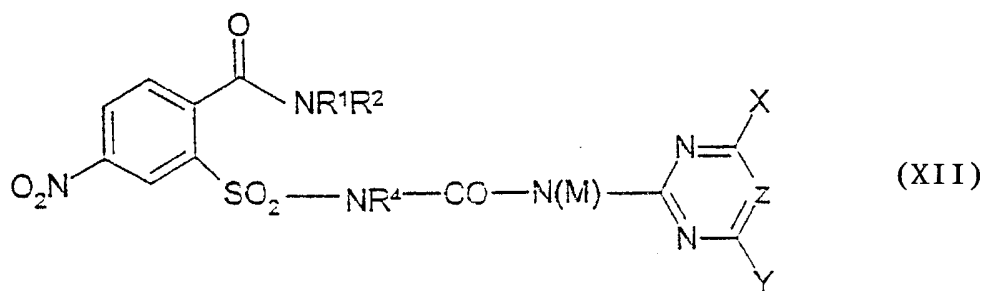


s dvojkyselinou obecného vzorce III:



ve kterém Q^1 a Q^2 jsou stejné nebo rozdílné a každý představuje atom vodíku nebo kation.

21. Způsob přípravy nitrofenylsulfonylmočovinové sloučeniny obecného vzorce XII nebo její soli:



ve kterém:

R^1 , R^2 a R^4 mají stejný význam jako bylo definováno u obecného vzorce VIII, a

M, X, Y a Z mají stejný význam jako bylo definováno v souvislosti s obecným vzorcem X, vyznačující se tím, že

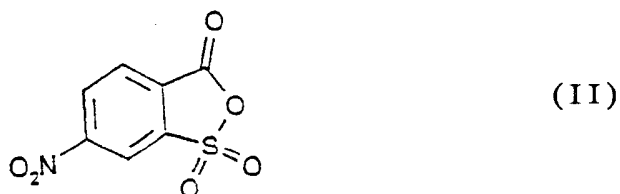
(a) se do reakce uvede aminová sloučenina obecného vzorce:



nebo sůl této sloučeniny, ve kterém R^1 a R^2 mají stejný

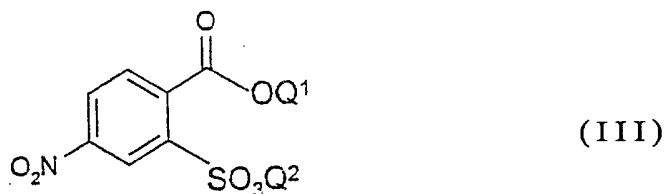
význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3,

(α) s anhydridem obecného vzorce II:

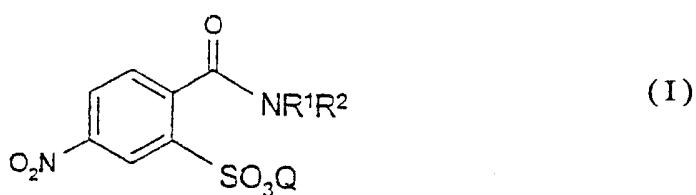


nebo

(β) s dvojkyselinou obecného vzorce III nebo se solí této sloučeniny:



ve kterém Q^1 a Q^2 jsou stejné nebo rozdílné a každý představuje atom vodíku nebo kation, za vzniku sloučeniny obecného vzorce I:



ve kterém:

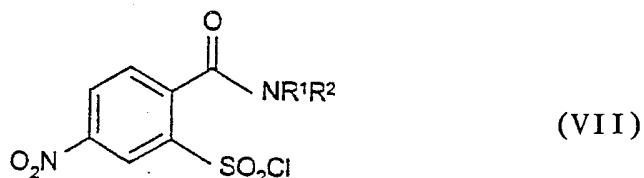
R^1 znamená nesubstituovaný nebo substituovaný uhlovodíkový zbytek obsahující celkově 1 až 10 atomů uhlíku,

R^2 znamená nesubstituovaný nebo substituovaný uhlovodíkový zbytek obsahující celkově 1 až 10 atomů uhlíku,

nebo skupina NR^1R^2 představuje heterocyklický kruh obsahující 3 až 8 atomů v kruhu, přičemž tato skupina je nesubstituovaná nebo substituovaná a obsahuje dusíkový atom skupiny NR^1R^2 jako kruhový heteroatom, přičemž může rovněž obsahovat jeden nebo dva další kruhové heteroatomy ze skupiny zahrnující N, O a S, a

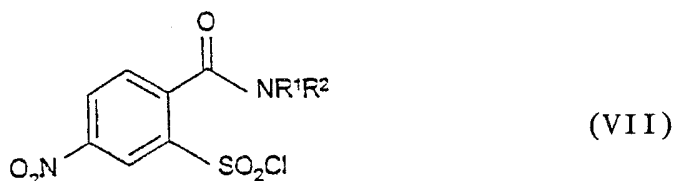
Q znamená atom vodíku nebo kation,

(b) nebo se do reakce uvede sloučenina obecného vzorce I získaná ve stupni (a) s aktivačním reakčním činidlem za vzniku sloučeniny obecného vzorce VII:

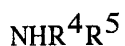


ve kterém R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3,

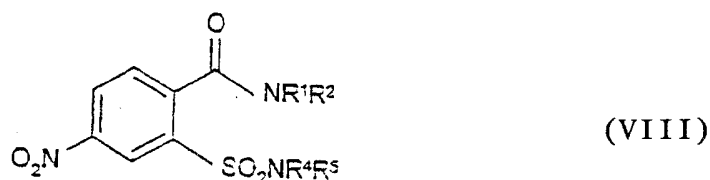
(c) nebo se do reakce uvádí sloučenina obecného vzorce VII získaná ve stupni (b):



ve kterém R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, se sloučeninou obecného vzorce :



ve kterém R^4 a R^5 znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku, za vzniku sloučeniny obecného vzorce VIII:



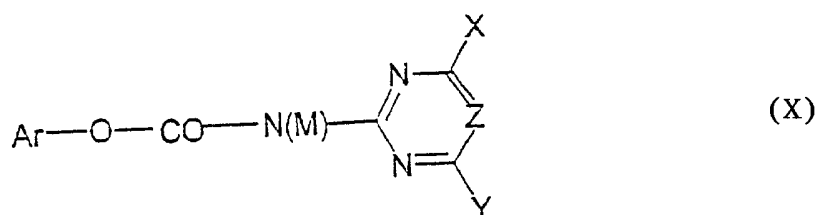
ve kterém:

R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

R^4 a R^5 znamenají atom vodíku nebo uhlovodíkovou skupinu obsahující 1 až 12 atomů uhlíku,

(d) nebo se do reakce uvede sloučenina obecného vzorce VIII, získaná ve stupni (c)

(i) se sloučeninou obecného vzorce X:



ve kterém:

Ar znamená nesubstituovanou nebo substituovanou fenylovou skupinu,

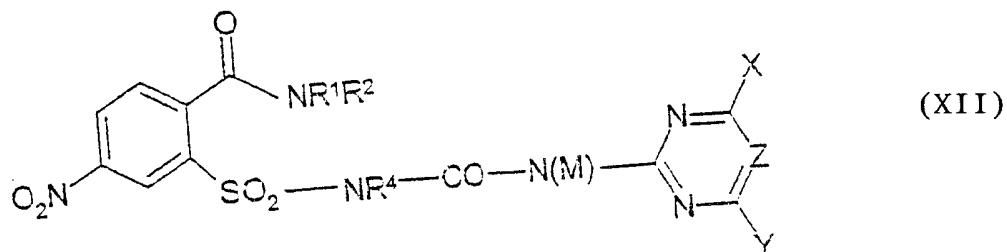
M znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku nebo kovový kation,

X a Y navzájem na sobě nezávisle každý jednotlivě

znamenají halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkoxykupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen, alkoxykupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkenyloxykupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo alkinyloxykupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a

Z znamená skupinu CH nebo N,

za vzniku nitrofenyl-sulfonylmočoviny sloučeniny obecného vzorce XII nebo její soli:

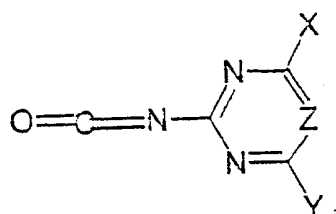


ve kterém :

R^1 , R^2 a R^4 mají stejný význam jako bylo definováno u obecného vzorce VIII, a

M, X, Y a Z mají stejný význam jako bylo definováno v souvislosti s obecným vzorcem X,

(ii) nebo se sloučeninou obecného vzorce XI:



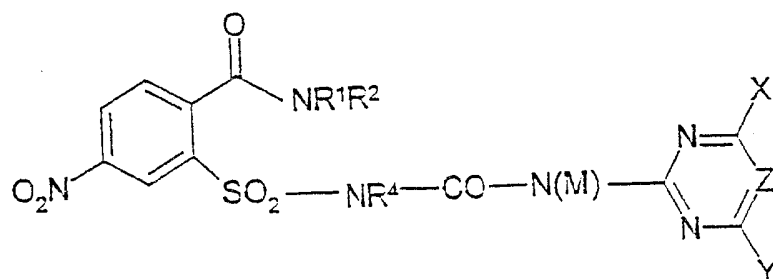
(XI)

ve kterém:

X a Y navzájem na sobě nezávisle každý jednotlivě znamenají halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkenyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo alkinyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a

Z znamená skupinu CH nebo N,

za vzniku nitrofenyl-sulfonylmočoviny sloučeniny obecného vzorce XII nebo její soli:



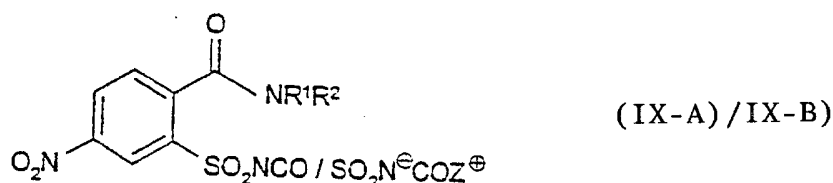
(XII)

ve kterém:

R^1 , R^2 a R^4 mají stejný význam jako bylo definováno u obecného vzorce VIII, a

M, X, Y a Z mají stejný význam jako bylo definováno v souvislosti s obecným vzorcem X,

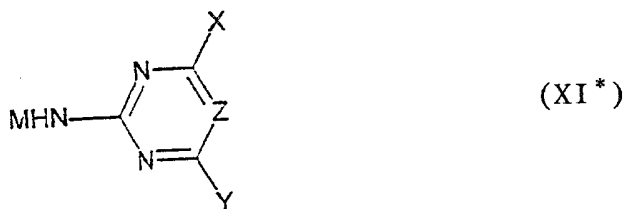
(iii) nebo s fosgenem za vzniku sloučeniny obecného vzorce IX-A nebo IX-B:



ve kterém :

R^1 a R^2 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce I v nárocích 1 až 3, a

Z v obecném vzorci IX-B znamená terciární amonnou skupinu, přičemž potom následuje reakce takto získané sloučeniny obecného vzorce IX-A nebo IX-B se sloučeninou obecného vzorce XI*:



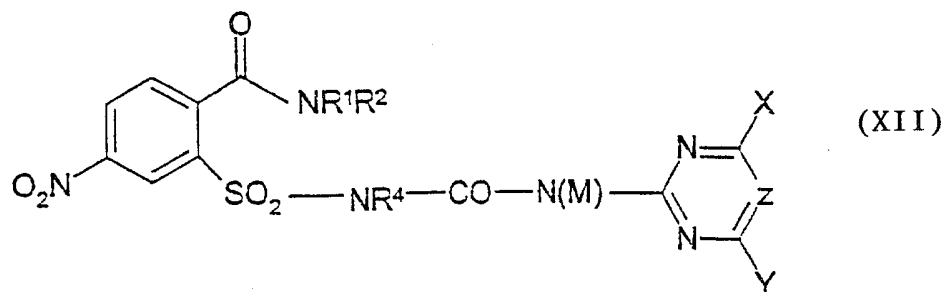
ve kterém:

M znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku nebo kovový kation,

X a Y navzájem na sobě nezávisle každý jednotlivě

znamenají halogen, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkoxy skupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, přičemž každá z těchto tří posledně uvedených skupin může být nesubstituovaná nebo substituovaná jedním nebo více skupinami vybranými ze souboru zahrnujícího halogen, alkoxy skupinu obsahující 1 až 4 atomů uhlíku, alkylthioskupinu obsahující 1 až 4 atomy uhlíku, nebo představují cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, alkenylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkinylovou skupinu obsahující 2 až 6 atomů uhlíku, alkenyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku nebo alkinyloxyskupinu obsahující 3 až 6 atomů uhlíku, a
Z znamená skupinu CH nebo N,

za vzniku nitrofenyl-sulfonylmočoviny obecného vzorce XII nebo její soli:



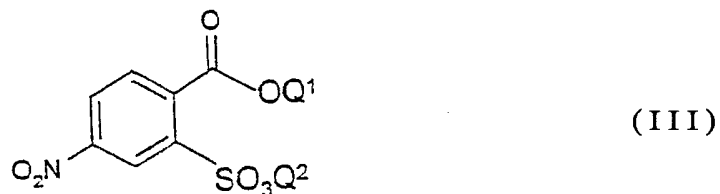
ve kterém:

R^1 , R^2 a R^4 mají stejný význam jako bylo definováno v případě obecného vzorce VIII, a

M, X, Y a Z mají stejný význam jako bylo definováno v případě sloučeniny obecného vzorce X.

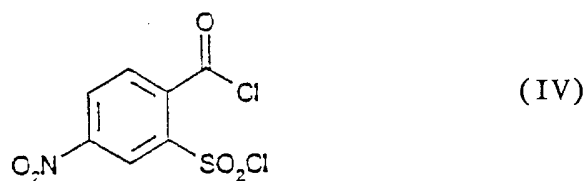
22. Způsob podle nároku 21, vyznačující se tím, že se anhydrid obecného vzorce II, použitý ve stupni (a)(i) získá

reakcí dvojkyseliny obecného vzorce III:

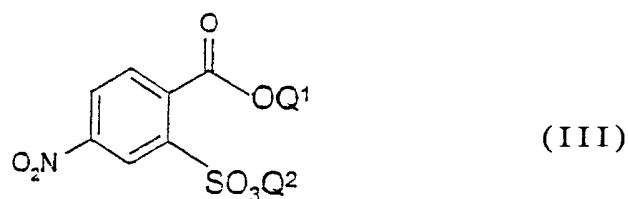


ve kterém Q^1 a Q^2 jsou stejné nebo rozdílné a každý představuje atom vodíku nebo kation, s aktivačním reakčním činidlem.

23. Způsob podle nároku 21, vyznačující se tím, že anhydrid obecného vzorce II, použitý ve stupni (a)(i) se získá reakcí dichloridu obecného vzorce IV:



s dvojkyselinou obecného vzorce III:



ve kterém Q^1 a Q^2 jsou stejné nebo rozdílné a každý představuje atom vodíku nebo kation.

24. Použití sloučeniny obecného vzorce I, podle nároků

03.07.02

1 až 3, pro přípravu sulfonylmočovinových sloučenin obecného vzorce XIV nebo jejich solí, definovaných v nároku 18 nebo sulfonylmočovinových sloučenin obecného vzorce XII nebo jejich solí, definovaných v nároku 21.

Zastupuje:

Dr. Miloš Všeťka