

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

245800
(11) (B2)



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

(22) Přihlášeno 14 06 83

(21) (PV 413-85)

(32) (31) (33) Právo přednosti od 14 06 82
(3671/82) Švýcarsko

(40) Zveřejněno 17 09 85

(45) Vydáno 15 12 87

(51) Int. Cl.⁴
A 01 N 47/36
C 07 D 239/47

(72)

Autor vynálezu

BÖHNER BEAT dr., BINNINGEN; FÖRY WERNER dr., BASILEJ;
GASS KARL, MAGDEN; MEYER WILLY, RIEHEN (Švýcarsko)

(73)

Majitel patentu

CIBA-GEIGY AG, BASILEJ (Švýcarsko)

(54) Způsob výroby nových derivátů N-heterocyklosulfonyl-N'-pyrimidinylmočoviny

1

Předložený vynález se týká způsobu výroby nových derivátů N-heterocyklosulfonyl-N'-pyrimidinylmočoviny, které se používají k hubení plevelů, především k selektivnímu hubení plevelů v kulturách užitkových rostlin nebo k regulaci a zbrzdění růstu rostlin.

Bylo zjištěno, že N-heterocyklosulfonyl-N'-pyrimidinylmočoviny obecného vzorce I v němž

X znamená síru, skupinu —NH— nebo skupinu —CH=N—,

R₁ znamená alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogen nebo dialkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylových částech,

R₂ znamená atom vodíku, atom halogenu, alkoxykupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku nebo skupinu —CO—R₃, přičemž

R₃ znamená alkoxykupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxykupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinyloxykupinu se 3 až 6 atomy

2

uhlíku nebo methoxyethoxykupinu, a soli těchto sloučenin, mají herbicidní účinek a schopnost regulovat růst rostlin a mohou se používat jako účinné složky herbicidních prostředků a prostředků k regulaci růstu rostlin.

Alkylovou skupinou ve shora uvedeném obecném vzorci I, jakož i na jiných místech se rozumí přímá nebo rozvětvená alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako například skupina methylová, ethylová, n-propylová, isopropylová, isomerní butylové skupiny.

Alkoxykupinou se obecně rozumí methoxykupina, ethoxykupina, n-propyloxykupina, isopropyloxykupina, čtyři isomerní butyloxykupiny, n-amylloxykupina, isoamylloxykupina, 2-amylloxykupina nebo 3-amylloxykupina, zejména však methoxykupina, ethoxykupina nebo isopropyloxykupina.

Podle významu symbolu X přicházejí jako heterocykly, které jsou vázány přes sulfo-

skupinu, v úvahu: thiofen, pyrrol a pyridin.

Jako příklady alkenylových zbytků lze u-

vést allyl, isopropenyl, 1-propenyl, 1-butenyl, 2-butenyl-1-isobutenyl, 2-isobutenyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, jakož i isomerní hexenylové zbytky, zejména však allyl a 4-pentyl.

Jako příklady alkylsulfonylových skupin lze uvést skupinu methylsulfonylovou, ethylsulfonylovou nebo skupinu n-propylsulfonylovou, zejména však skupinu methylsulfonylovou a ethylsulfonylovou.

Halogenem se v definicích, jakož i v části halogenalkoxyskupiny rozumí fluor, chlor a brom, výhodně však fluor a chlor.

Alkinylovými zbytky ve shora uvedených substituentech se rozumí zpravidla propargylový zbytek, 2-butylový zbytek, 3-butylový zbytek, jakož i isomerní pentinylové zbytky; výhodně je alkinylový zbytek představován propargylovým nebo 2- nebo 3-butylovým zbytkem.

Jako soli přicházejí v úvahu soli, které mohou tvořit sloučeniny vzorce I s aminy, bázeckými sloučeninami, zvláště pak hydroxidy alkalických kovů a kovů alkalických zemin nebo kvarterními amoniiovými bázeckými.

Z hydroxidů alkalických kovů a kovů alkalických zemin jako solitvorných sloučenin nutno zdůraznit hydroxid sodný, hydroxid lithný, hydroxid draselný, hydroxid hořečnatý nebo hydroxid vápenatý, zvláště však hydroxid sodný nebo hydroxid draselný.

Jako příklady aminů vhodných pro tvorbu solí lze uvést primární, sekundární a terciární alifatické a aromatické aminy, jako methylamin, ethylamin, propylamin, isopropylamin, čtyři isomerní butylaminy, dimethylamin, diethylamin, diethanolamin, dipropylamin, diisopropylamin, di-n-butylamin, pyrrolidin, piperidin, morfolin, trimethylamin, triethylamin, tripropylamin, chinuklidin, pyridin, chinolin a isochinolin, zejména však ethylamin, propylamin, diethylamin nebo triethylamin, především isopropylamin a diethanolamin.

Příklady kvarterních amoniiových bází jsou obecně kationty halogenamoniiových solí, například tetramethylamoniiový kationt, trimethylbenzylamoniiový kationt, triethylbenzylamoniiový kationt, tetraethylamoniiový kationt, trimethylethylamoniiový kationt avšak také amoniiový kationt.

Ze sloučenin obecného vzorce I vyráběných podle tohoto vynálezu jsou výhodné ty sloučeniny, ve kterých buď

a) R_1 znamená chlor, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, ethoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu nebo

b) zbytek R_2 je v sousední poloze k sulfonylové skupině.

Dalšími výhodnými sloučeninami jsou ta-

kové sloučeniny obecného vzorce I, v němž R_2 znamená atom vodíku, fluoru, chloru, alkoxyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$, $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$, $-\text{SO}_2-\text{CH}_3$ nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části.

Další výhodnou podskupinu tvoří sloučeniny obecného vzorce I, v němž R_1 znamená chlor, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, ethoxyskupinu, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu, R_2 se nachází v sousedství k sulfonylové skupině a znamená atom vodíku, atom fluoru, chloru, alkoxyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, methylsulfonylovou skupinu, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$, $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$, nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části.

Zcela zvláště výhodné podskupiny účinných látek vzorce I tvoří ty sloučeniny, ve kterých X znamená atom síry, R_1 znamená chlor, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu, R_2 se nachází v sousedství k sulfonylové skupině a znamená atom vodíku, atom fluoru, chloru, alkoxyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, methylsulfonylovou skupinu, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$, $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části;

dále pak ty sloučeniny, ve kterých X znamená skupinu $-\text{NH}$, R_1 znamená chlor, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu, R_2 se nachází v sousední poloze k sulfonylové skupině a znamená atom vodíku, fluoru, chloru, alkoxyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, methylsulfonylovou skupinu, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části; a dále pak ty sloučeniny, ve kterých X znamená skupinu $-\text{CH}=\text{N}$, R_1 znamená chlor, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, ethoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu, R_2 se nachází v sousední poloze k sulfonylové skupině a znamená atom vodíku, fluoru, chloru, alkoxyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, methylsulfonylovou skupinu, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části.

Jako výhodné jednotlivé sloučeniny spadající pod obecný vzorec I lze uvést:

N-(2-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu,

N-(4-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu,

N-(4-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu,

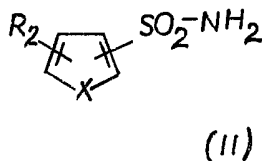
N-(2-chlor-3-pyridylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu,

N-(2-pyridinylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu,

N-(2-pyrrolylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu,

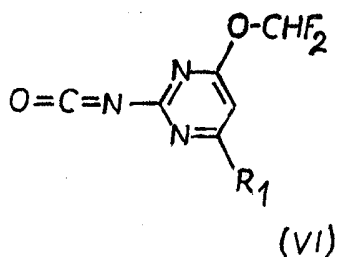
N-(3-pyrrolylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu.

Sloučeniny obecného vzorce I a jejich soli se podle tohoto vynálezu připravují tím, že se při teplotě -20°C až $+120^{\circ}\text{C}$ nechá reagovat heterocyklosulfonamid obecného vzorce II



v němž

R_2 a X mají význam uvedený pod vzorcem I, popřípadě za přítomnosti báze, s isokyanátem obecného vzorce VI



R_1 má význam uvedený pod vzorcem I, načež se popřípadě získané sloučeniny prevedou na své soli tím, že se na sulfonylmočovinu vzorce I působí aminem, hydroxidem alkalického kovu nebo hydroxidem kovu al-

kalické zeminy nebo kvarterní amoniovou bázi.

Soli se připravují například reakcí s ekvimolárním množstvím báze v rozpouštědle a odpařením rozpouštědla.

Reakce podle vynálezu se provádí výhodně v aprotických, inertních, organických rozpouštědlech, jako je methylenchlorid, tetrahydrofuran, acetonitril, dioxan a toluen.

Reakční teploty se pohybují výhodně mezi -20°C a $+120^{\circ}\text{C}$. Reakce probíhá obecně mírně exotermně a může se provádět při teplotě místnosti. Ke zkrácení reakční doby nebo také k zahájení reakce se účelně reakční směs po krátkou dobu zahřívá až na teplotu varu reakční směsi. Reakční doba se může rovněž zkrátit přidáním několika kapek báze nebo isokyanátu jako reakčního katalyzátoru.

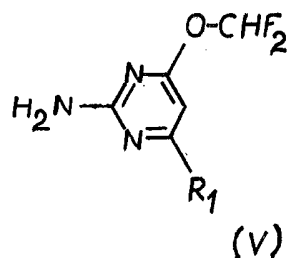
Jako báze se mohou používat jak organické báze, jako aminy, například triethylamin, chinuklidin, pyridin atd., tak i anorganické báze, jako hydridy, jako hydrid sodný nebo hydrid vápenatý, hydroxidy, jako hydroxid draselný, uhličitany, jako uhličitán sodný a uhličitán draselný nebo hydrogenuhličitany, jako hydrogenuhličitán draselný a hydrogenuhličitán sodný.

Reakční produkty se mohou izolovat za huštění nebo/a odpařením rozpouštědla a překrystalováním nebo roztíráním pevného zbytku v rozpouštědlech, ve kterých se dobře nerozpouští, jako jsou ethery, aromatické uhlovodíky nebo chlorované uhlovodíky, se čistí.

Účinné látky vzorce I jsou stálými sloučeninami. Manipulace s nimi nevyžaduje žádných bezpečnostních opatření.

Výchozí sloučeniny obecného vzorce II jsou známé nebo se mohou vyrábět analogicky jako známé sloučeniny.

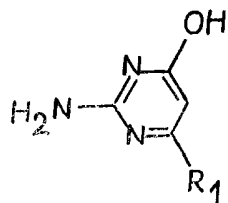
Sloučeniny obecného vzorce VI, které se rovněž používají jako výchozí látky, se připravují analogicky podle známých postupů ze sloučenin obecného vzorce V



v němž

R_1 má shora uvedený význam.

Sloučeniny obecného vzorce V se připravují postupem popsáním v evropské přihlášce vynálezu č. 70 804 tím, že se nechá reagovat aminopyrimidin obecného vzorce VIII



(VIII)

ve kterém

R_1 má význam uvedený pod vzorcem I, v přítomnosti báze s difluorchlormethanem nebo difluorbrommethanem.

Způsob výroby sloučenin obecného vzorce V se provádí výhodně v inertním polárním rozpouštědle nebo ve směsi rozpouštědel. Vhodnými rozpouštědly jsou ethery, jako dioxan, tetrahydrofuran, ethylenglykoldimethylether, diethylenglykoldimethylether, alkoholy, jako methanol, ethanol; ketony, jako aceton, ethylmethylketon, dimethylformamid, acetonitril nebo dimethylsulfoxid.

Jako báze jsou zvláště vhodné hydrid sodný a hydrid vápenatý, hydroxid draselný a hydroxid sodný, uhličitán draselný a uhličitán sodný. Ve vhodných případech lze bázi přidávat ve formě vodného roztoku.

Výchozí látky obecného vzorce VIII jsou známé nebo se připravují analogicky podle známých postupů.

Způsob výroby sloučenin obecného vzorce I blíže objasňují následující příklady, které však rozsah vynálezu v žádném směru neomezuji.

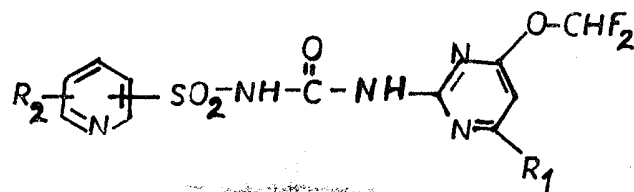
Příklad 1

N-(3-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonfyl)-N'-[4,6-bis(difluormethoxy)pyrimidin-2-yl]-močovina

K roztoku 3,4 g 4-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonamidu a 3,9 g 4,6-bis(difluormethoxy)-2-isokyanatopyrimidinu ve 40 ml dioxanu se přikape 2,4 g 1,8-diazabicyklo-[5,4,0]undec-7-enu při teplotě 20 až 25 °C. Roztok se míchá po dobu dalších 8 hodin a potom se odpaří k suchu. Zbytek se rozpustí ve vodě. Vodný roztok se okyslí 1N roztokem chlorovodíkové kyseliny a extrahuje se ethylacetátem. Oddělením a odpařením organické fáze a překrystalováním zbytku se získá 6,9 g N-(4-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonfyl)-N'-[4,6-bis(difluormethoxy)pyrimidin-2-yl]močoviny o teplotě tání 178 až 179 °C.

Analogickým postupem se získají sloučeniny uvedené v následujících tabulkách:

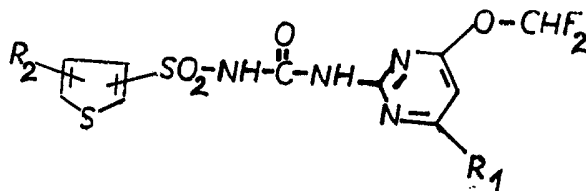
Tabulka 1



slouče- nina číslo	R ₁	R ₂	poloha sulfony- lové skupiny	teplota tání °C
1.1	CH ₃	H	2	150—151
1.2	OCH ₃	H	2	
1.3	Cl	H	2	
1.4	—N(CH ₃) ₂	H	2	
1.5	C ₂ H ₅	H	2	138—141
1.7	—OCHF ₂	H	2	
1.8	CH ₃	H	3	
1.9	OCH ₃	H	3	
1.10	Cl	H	3	
1.11	—N(CH ₃) ₂	H	3	
1.12	C ₂ H ₅	H	3	
1.14	—OCHF ₂	H	3	
1.15	CH ₃	2-Cl	3	161—162
1.16	OCH ₃	2-Cl	3	
1.17	Cl	2-Cl	3	
1.18	—N(CH ₃) ₂	2-Cl	3	
1.19	C ₂ H ₅	2-Cl	3	
1.21	—OCHF ₂	2-Cl	3	
1.22	CH ₃	2-COOCH ₃	3	
1.23	OCH ₃	2-COOCH ₃	3	
1.24	Cl	2-COOCH ₃	3	
1.25	—N(CH ₃) ₂	2-COOCH ₃	3	
1.26	C ₂ H ₅	2-COOCH ₃	3	
1.28	—OCHF ₂	2-COOCH ₃	3	
1.29	CH ₃	2-SO ₂ -CH ₃	3	184 (rozklad)
1.30	OCH ₃	2-SO ₂ -CH ₃	3	
1.31	Cl	2-SO ₂ -CH ₃	3	
1.32	—N(CH ₃) ₂	2-SO ₂ -CH ₃	3	
1.33	C ₂ H ₅	2-SO ₂ -CH ₃	3	
1.35	—OCHF ₂	2-SO ₂ -CH ₃	3	
1.36	CH ₃	2-F	3	
1.37	OCH ₃	2-F	3	
1.38	Cl	2-F	3	
1.39	—N(CH ₃) ₂	2-F	3	
1.40	C ₂ H ₅	2-F	3	
1.42	—OCHF ₂	2-F	3	
1.43	CH ₃	3-Cl	3	
1.44	OCH ₃	3-Cl	2	
1.45	Cl	3-Cl	2	
1.46	—N(CH ₃) ₂	3-Cl	2	
1.47	C ₂ H ₅	3-Cl	2	
1.49	—OCHF ₂	3-Cl	2	
1.50	CH ₃	3-OCH ₃	2	
1.51	OCH ₃	3-OCH ₃	2	
1.52	Cl	3-OCH ₃	2	
1.53	—N(CH ₃) ₂	3-OCH ₃	2	
1.54	C ₂ H ₅	3-OCH ₃	2	
1.56	—OCHF ₂	3-OCH ₃	2	
1.71	CH ₃	6-F	2	
1.72	OCH ₃	6-F	2	
1.73	Cl	6-F	2	
1.74	—N(CH ₃) ₂	6-F	2	
1.75	C ₂ H ₅	6-F	2	

slouče- nina číslo	R ₁	R ₂	poloha sulfony- lové skupiny	teplota tání °C
1.77	—OCH ₃	6-F	2	
1.78	CH ₃	6-OCH ₃	2	
1.79	OCH ₃	6-OCH ₃	2	
1.80	Cl	6-OCH ₃	2	
1.81	—N(CH ₃) ₂	6-OCH ₃	2	
1.82	C ₂ H ₅	6-OCH ₃	2	
1.84	—OCHF ₂	6-OCH ₃	2	
1.85	CH ₃	4-Cl	3	126—128
1.86	CH ₃	2-OCH ₃	3	148—150
1.87	CH ₃	2-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	3	138—140
1.88	OCH ₃	2-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	3	
1.89	CH ₃	4-COOC ₂ H ₅	3	
1.90	OCH ₃	4-COOC ₂ H ₅	3	

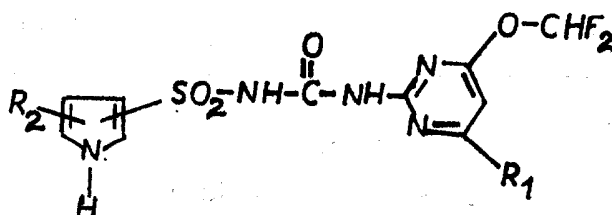
Tabulka 2



slouče- nina číslo	R ₁	R ₂	poloha sulfo- nylové skupiny	teplota tání °C
2.1	CH ₃	2-COOCH ₃	3	178—179
2.2	OCH ₃	2-COOCH ₃	3	171—174
2.3	Cl	2-COOCH ₃	3	119—120
2.4	—N(CH ₃) ₂	2-COOCH ₃	3	232
2.5	C ₂ H ₅	2-COOCH ₃	3	
2.7	—OCHF ₂	2-COOCH ₃	3	198—200
2.8	CH ₃	4-COOCH ₃	3	159—161
2.9	OCH ₃	4-COOCH ₃	3	161—162
2.10	Cl	4-COOCH ₃	3	
2.11	—N(CH ₃) ₂	4-COOCH ₃	3	225—227
2.12	C ₂ H ₅	4-COOCH ₃	3	
2.14	—OCHF ₂	4-COOCH ₃	3	178—179
2.15	CH ₃	2-CO-OCH(CH ₃) ₂	3	186—189
2.16	OCH ₃	2-CO-OCH(CH ₃) ₂	3	
2.17	Cl	2-CO-OCH(CH ₃) ₂	3	
2.18	—N(CH ₃) ₂	2-CO-OCH(CH ₃) ₂	3	
2.19	OC ₂ H ₅	2-CO-OCH(CH ₃) ₂	3	
2.21	—OCHF ₂	2-CO-OCH(CH ₃) ₂	3	
2.22	CH ₃	2-CO-OCH ₂ —CH=CH ₂	3	
2.23	OCH ₃	2-CO-OCH ₂ —CH=CH ₂	3	
2.24	Cl	2-CO-OCH ₂ —CH=CH ₂	3	
2.25	—N(CH ₃) ₂	2-CO-OCH ₂ —CH=CH ₂	3	
2.26	C ₂ H ₅	2-CO-OCH ₂ —CH=CH ₂	3	
2.28	—OCHF ₂	2-CO-OCH ₂ —CH=CH ₂	3	
2.29	CH ₃	5-Cl	2	
2.30	OCH ₃	5-Cl	2	
2.31	Cl	5-Cl	2	
2.32	—N(CH ₃) ₂	5-Cl	2	
2.33	C ₂ H ₅	5-Cl	2	
2.35	—OCHF ₂	5-Cl	2	
2.36	CH ₃	H	2	
2.37	OCH ₃	H	2	
2.38	Cl	H	2	
2.39	—N(CH ₃) ₂	H	2	

slouče- nina číslo	R1	R2	poloha sulfo- nylové skupiny	teplota tání °C
2.40	C ₂ H ₅	H	2	
2.42	-OCHF ₂	H	2	
2.43	CH ₃	H	3	
2.44	OCH ₃	H	3	
2.45	Cl	H	3	
2.46	-N(CH ₃) ₂	H	3	
2.47	C ₂ H ₅	H	3	
2.49	-OCHF ₂	H	3	
2.92	CH ₃	2-SO ₂ -CH ₃	3	
2.93	OCH ₃	2-SO ₂ -CH ₃	3	
2.94	Cl	2-SO ₂ -CH ₃	3	
2.95	-N(CH ₃) ₂	2-SO ₂ -CH ₃	3	
2.96	C ₂ H ₅	2-SO ₂ -CH ₃	3	
2.98	-OCHF ₂	2-SO ₂ -CH ₃	3	
2.99	CH ₃	3-SO ₂ -CH ₃	2	
2.100	OCH ₃	3-SO ₂ -CH ₃	2	
2.101	Cl	3-SO ₂ -CH ₃	2	
2.102	-N(CH ₃) ₂	3-SO ₂ -CH ₃	2	
2.103	C ₂ H ₅	3-SO ₂ -CH ₃	2	
2.105	-OCHF ₂	3-SO ₂ -CH ₃	2	
2.106	CH ₃	4-SO ₂ -CH ₃	3	
2.107	OCH ₃	4-SO ₂ -CH ₃	3	
2.108	Cl	4-SO ₂ -CH ₃	3	
2.109	-N(CH ₃) ₂	4-SO ₂ -CH ₃	3	
2.110	C ₂ H ₅	4-SO ₂ -CH ₃	3	
2.112	-OCHF ₂	4-SO ₂ -CH ₃	3	
2.141	CH ₃	2-CO-OC ₂ H ₅	3	
2.142	OCH ₃	2-CO-OC ₂ H ₅	3	
2.143	Cl	2-CO-OC ₂ H ₅	3	
2.144	-N(CH ₃) ₂	2-CO-OC ₂ H ₅	3	
2.145	C ₂ H ₅	2-CO-OC ₂ H ₅	3	
2.147	-OCHF ₂	3-COOC ₂ H ₅	3	
2.148	CH ₃	2-CO-OCH ₂ -C ≡ CH	3	
2.149	OCH ₃	2-CO-OCH ₂ -C ≡ CH	3	
2.150	Cl	2-CO-OCH ₂ -C ≡ CH	3	
2.151	-N(CH ₃) ₂	2-CO-OCH ₂ -C ≡ CH	3	
2.152	C ₂ H ₅	2-CO-OCH ₂ -C ≡ CH	3	
2.154	-OCHF ₂	2-CO-OCH ₂ -C ≡ CH	3	
2.155	CH ₃	3-COOCH ₃	2	
2.156	OCH ₃	3-COOCH ₃	2	
2.157	Cl	3-COOCH ₃	2	
2.158	-N(CH ₃) ₂	3-COOCH ₃	2	
2.159	C ₂ H ₅	3-COOCH ₂	2	
2.161	-OCHF ₂	3-COOCH ₃	2	
2.162	CH ₃	3-COOC ₂ H ₅	2	
2.163	OCH ₃	3-COOC ₂ H ₅	2	
2.164	Cl	3-COOC ₂ H ₅	2	
2.165	-N(CH ₃) ₂	3-COOC ₂ H ₅	2	
2.166	C ₂ H ₅	3-COOC ₂ H ₅	2	
2.168	-OCHF ₂	3-COOC ₂ H ₅	2	
2.169	CH ₃	3-CO-OCH(CH ₃) ₂	2	
2.170	OCH ₃	3-CO-OCH(CH ₃) ₂	2	
2.171	Cl	3-CO-OCH(CH ₃) ₂	2	
2.172	-N(CH ₃) ₂	3-CO-OCH(CH ₃) ₂	2	
2.173	C ₂ H ₅	3-CO-OCH(CH ₃) ₂	2	
2.175	-OCHF ₂	3-CO-OCH(CH ₃) ₂	2	
2.206	CH ₃	4-COO-CH ₂ -C ≡ CH	3	178—180
2.207	OCH ₃	4-COO-CH ₂ -C ≡ CH	3	
2.208	OCH ₃	4-COO-CH ₂ -CH = CH ₂	3	147—149
2.209	CH ₃	4-COOC ₂ H ₅	3	161
2.210	OCH ₃	4-COOC ₂ H ₅	3	158
2.211	CH ₃	2-COO(CH ₂) ₂ -OCH ₃	3	134—135

Tabulka 3

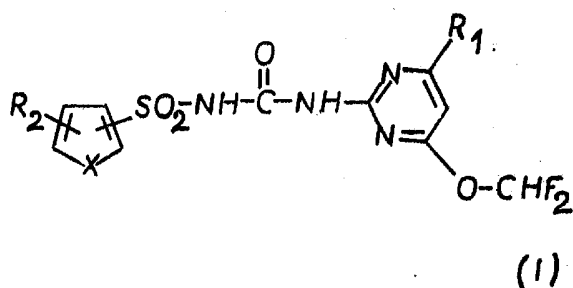


sloučenina číslo	R ₁	R ₂	poloha sulfonylové skupiny	teplota tání °C
4.1	CH ₃	H	2	189
4.2	OCH ₃	H	2	
4.3	Cl	H	2	
4.4	-N(CH ₃) ₂	H	2	
4.5	C ₂ H ₅	H	2	
4.7	OCHF ₂	H	2	
4.8	CH ₃	H	3	173—174
4.9	OCH ₃	H	3	
4.10	Cl	H	3	
4.11	-N(CH ₃) ₂	H	3	
4.12	C ₂ H ₅	H	3	
4.14	-OCHF ₂	H	3	

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Způsob výroby nových derivátů N-heterocyklosulfonyl-N'-pyrimidinylmočoviny obecného vzorce I

nechá reagovat heterocyklosulfonamid obecného vzorce II



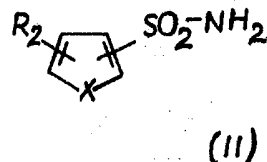
v němž

X znamená atom síry, skupinu -NH- nebo skupinu -CH=N-.

R₁ znamená alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, atom halogenu nebo dialkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylových zbytcích,

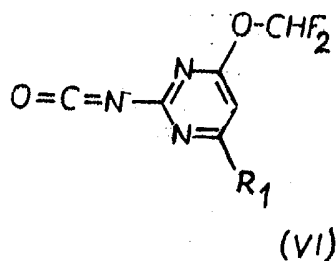
R₂ znamená atom vodíku, atom halogenu, alkoxy skupinu s 1 a 3 atomy uhlíku, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku nebo skupinu -CO-R₃,
kde

R₃ znamená alkoxy skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxy skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinyloxy skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku nebo methoxyethoxy skupinu, jakož i soli těchto sloučenin, vyznačující se tím, že se při teplotě mezi -20 °C a +120 °C



v němž

R₂ a X mají shora uvedený význam, popřípadě v přítomnosti báze s isokyanátem obecného vzorce VI



v němž

R₁ má shora uvedený význam, načež se získaný derivát sulfonylmočoviny vzorce I, popřípadě převede na sůl působením aminu, hydroxidu alkalického kovu nebo hydroxidu kovu alkalické zeminy nebo působením kvartérní amoniové báze.

2. Způsob podle bodu 1, vyznačující se tím, že se jako výchozí látky použijí odpovídající sloučeniny obecného vzorce II a VI, za vzniku sloučenin obecného vzorce I, v němž R_1 znamená atom chloru, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, ethoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu a X a R_2 mají významy uvedené v bodě 1.

3. Způsob podle bodu 1, vyznačující se tím, že se jako výchozí látky použijí odpovídající sloučeniny obecného vzorce II a VI, za vzniku sloučenin obecného vzorce I, v němž R_2 zaujímá sousední polohu vůči sulfonylové skupině, přičemž X, R_1 a R_2 mají významy uvedené v bodě 1.

4. Způsob podle bodů 1 a 3, vyznačující se tím, že se jako výchozí látky použijí odpovídající sloučeniny obecného vzorce II a VI, za vzniku sloučenin obecného vzorce I, v němž R_2 znamená atom vodíku, atom fluoru, atom chloru, alkoxykupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, methylsulfonylovou skupinu, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, a X a R_1 mají významy uvedené v bodě 1.

5. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že se jako výchozí látky použijí odpovídající sloučeniny obecného vzorce II a VI, za vzniku sloučenin obecného vzorce I, v němž R_1 znamená atom chloru, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, ethoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu, R_2 se nachází v sousední poloze k sulfonylové skupině a znamená atom vodíku, atom chloru, atom fluoru, alkoxykupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, methylsulfonylovou skupinu, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, a X má význam uvedený v bodě 1.

6. Způsob podle bodu 1, vyznačující se tím,

že se jako výchozí látky použijí odpovídající sloučeniny obecného vzorce II a VI, za vzniku sloučenin obecného vzorce I, v němž X znamená atom síry, R_1 znamená atom chloru, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu nebo methylovou skupinu a R_2 zaujímá sousední polohu vůči sulfonylové skupině a znamená skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části.

7. Způsob podle bodu 1, vyznačující se tím, že se jako výchozí látky použijí odpovídající sloučeniny obecného vzorce II a VI, za vzniku sloučenin obecného vzorce I, v němž X znamená skupinu $-\text{CH}=\text{N}-$, R_1 znamená methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu a R_2 se nachází v sousední poloze vůči sulfonylové skupině a znamená atom vodíku, atom chloru, alkoxykupinu s 1 až 3 atomy uhlíku.

8. Způsob podle bodu 1, vyznačující se tím, že se jako výchozí látky použijí odpovídající sloučeniny obecného vzorce II a VI za vzniku N-(4-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methoxypyrimidin-2-yl)močoviny.

9. Způsob podle bodu 1, vyznačující se tím, že se jako výchozí látky použijí odpovídající sloučeniny obecného vzorce II a VI za vzniku N-(2-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močoviny.

10. Způsob podle bodu 1, vyznačující se tím, že se jako výchozí látky použijí odpovídající sloučeniny obecného vzorce II a VI za vzniku N-(4-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močoviny.

11. Způsob podle bodu 1, vyznačující se tím, že se jako výchozí látky použijí odpovídající sloučeniny obecného vzorce II a VI za vzniku N-(2-chlor-3-pyridinylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močoviny.