

1097/99

Ez a jó kivonat.

Eljárás szulfonil-karbamid-származékok ~~(és intermedieireiként)~~
alkalmazható szulfonil-tiokarbamát ~~és szulfonil-karbamid-~~
~~-származékok előállítására~~

HOECHST AG., Frankfurt/Main, NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

A bejelentés napja: 1992. 04. 01.

Elsőbbsége: 1991. 04. 02. (P 41 10 636.9)

NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

K I V O N A T

A találmány szerint előállított szulfonil-karbamidok (I)
általános képletében

X jelentése oxigénatom, $-O-NR^2-$ vagy $-SO_2-NR^2$ általános
képletű csoport,

Y jelentése nitrogénatom vagy $-CH=$ képletű csoport,

R^1 jelentése adott esetben szubsztituált alkil-, alkenil-
vagy alkinilcsoport, vagy X oxigénatom jelentése ese-
tén adott esetben szubsztituált fenilcsoport,

R^2 jelentése hidrogénatom, alkil-, alkenil-, alkinil- vagy
cikloalkilcsoport,

R^3 és R^4 jelentése egymástól függetlenül hidrogén, halogénatom,
alkil-tio-, alkil-amino-, dialkil-amino-csoport, vagy adott
esetben szubsztituált alkil- vagy alkoxicssoport,

R^5 és R^6 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy alkil-
csoport.

A találmány szerint előállított intermedierek (II) általános képletében R^1 , R^6 és X jelentése a fenti, Z kénatomot vagy $-NR^8-$ képletű csoportot jelent, R^7 és R^8 jelentése hidrogénatom, alkilcsoport vagy a fenilrészen adott esetben szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport ~~vagy~~ R^7 és R^8 a kapcsolódó nitrogénatommal együtt 5-7 tagú gyűrűt is képezhet, amely gyűrűtagként további nitrogén- vagy oxigénatomot is tartalmazhat és adott esetben szubsztituált is lehet.

1095/92

KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY

03043

82724

Képviselő:

DANUBIA SZABADALMI ÉS VÉDJEJY IRODA KFT.

Budapest

NSZOF:

C 07 D 239/28
C 07 D 251/46
C 07 D 269/00
C 07 D 295/215
C 07 D 227/06
C 07 C 381/06

szulfonil-karbamid-származékok és intermediereiként alkalmazható
szulfonil-tiokarbamid- és

-származék

Eljárás szulfonil-karbamidok előállítására

HOECHST AG., Frankfurt/Main, NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

Feltalálók:

Dr. SCHLEGEL Günter, Liederbach

Dr. MILDENBERGER Hilmar, Kelkheim

NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

A bejelentés napja: 1992. 04. 01.

Elsőbbsége: 1991. 04. 02. (P 41 10 636.9)

NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

74673-1023/SL

A találmány tárgya eljárás herbicid hatóanyagként alkalmazható és heterociklusos csoporttal szubsztituált szulfonil-karbamidok előállítására. A találmány tárgya közelebbről eljárás az (I) általános képletű vegyületek és savakkal vagy bázisokkal képzett fiziológiailag alkalmazható sói előállítására, a képletben

X jelentése oxigénatom, $-O-NR^2-$ vagy $-SO_2-NR^2-$ általános képletű csoport,

Y jelentése nitrogénatom vagy $-CH-$ képletű csoport,

R^1 jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 2-6 szénatomos alkinilcsoport, amelyek szubsztituátlanok vagy egy vagy több szubsztituenssel szubsztituáltak lehetnek, ahol a szubsztituens lehet halogénatom, 1-4 szénatomos alkoxics csoport és 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, valamint

X = oxigénatom esetben fenilcsoport, amely szubsztituátlan vagy egy vagy több szubsztituenssel szubsztituált lehet, ahol a szubsztituens lehet halogénatom, nitrocsoport, 1-4 szénatomos alkilcsoport, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-4 szénatomos alkoxics csoport, 1-4 szénatomos halogén-alkoxi-csoport és 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport,

R^2 jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport vagy 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport,

R^3 és R^4 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport vagy 1-4 szénatomos alkoxi-

csoport, amelyek szubsztituálatlanok vagy egy vagy több szubsztituenssel szubsztituáltak lehetnek, ahol a szubsztituens lehet halogénatom, alkoxics csoport és alkiltiocsoport; valamint halogénatom, 1-4 szénatomos alkiltiocsoport, 1-4 szénatomos alkil-amino-csoport vagy alkil-részeiben 1-4 szénatomos dialkil-amino-csoport, R^5 és R^6 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport.

Az (I) általános képletű vegyületek és herbicid hatékonyságuk ismert a 131 258, 342 569 és 004 163 számú európai közrebocsátási iratból. Ezek az iratok több olyan eljárást ismertetnek, amelyek alkalmasak az (I) általános képletű vegyületek előállítására.

Az ismert eljárások hátránya azonban, hogy az elérhető kitermelés viszonylag alacsony, értéke legfeljebb mintegy 65-70 %. Ez azt jelenti, hogy az eljárás során viszonylag nagy mennyiségű szennyezőanyag és melléktermék képződik, amelyek a nagyipari termelésben jelentős veszteséget okoznak, amit gondosan el kell távolítani, illetve el kell égetni. Az ismert eljárások ezért ökológiai és ökonómiai szempontból a nagyipari termelésre kevésbé alkalmasak. További hátrány, hogy ilyen alacsony kitermelésnél a kiindulási anyagok jelentős mennyisége elvész, ami az eljárás hatékonyságát tovább csökkenti.

Meglepő módon azt találtuk, hogy az (I) általános képletű vegyületek magas kitermeléssel és tisztasággal előállíthatók, ha (II) általános képletű vegyületeket (III)

általános képletű vegyületekkel reagáltatunk, és ez az eljárás nagyipari méretekben is előnyösen alkalmazható.

Az (I) általános képletű vegyületek és sóik előállításánál a találmány értelmében tehát úgy járunk el, hogy egy (II) általános képletű vegyületet, ahol

Z jelentése kénatom vagy $-NR^8-$ általános képletű csoport, R^7 és R^8 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,

1-6 szénatomos alkilcsoport, fenilcsoport vagy benzilcsoport, ahol az aromás csoportok szubsztituálatlanok vagy egy vagy több szubsztituenssel szubsztituáltak lehetnek, ahol a szubsztituens lehet halogénatom, alkilcsoport és alkoxics csoport; valamint

Z = $-NR^8$ esetben R^7 és R^8 a kapcsolódó nitrogénatommal együtt 5-7-tagú gyűrűt képez, amely további nitrogénatomot vagy oxigénatomot, és adott esetben egy vagy több szubsztituenssel, így halogénatomot vagy alkilcsoportot tartalmazhat,

R^1 , R^6 és X jelentése a fenti,

egy (III) általános képletű vegyülettel reagáltatunk, a képletben

R^3 , R^4 , R^5 és Y jelentése a fenti.

A fenti értelmezésben az alkilcsoport lehet egyenes vagy elágazó szénláncú alkilcsoport, és ugyanez érvényes a többi csoport, így alkoxics csoport, halogén-alkil-csoport, halogén-alkoxi-csoport, alkil-karbonil-csoport, alkil-amino-csoport, alkenilcsoport, alkinilcsoport és alkil-szulfonil-csoport szénhidrogén részére. A halogénatom lehet fluor-,

klór-, bróm- vagy jódatom, előnyösen fluor-, klór- vagy brómatom. A halogén-alkil-csoport olyan alkilcsoportot jelent, amely egy vagy több halogénatommal szubsztituálva van. Ugyanez érvényes a halogén-alkoxi-csoportra. Ellenkező értelmű megjelölés hiányában az alkilcsoport és a többi említett csoport szénhidrogénrésze rövidszénláncú alkilcsoport, vagyis előnyösen 1-4 szénatomot tartalmaz.

A találmány szerinti eljárás előnyösen alkalmazható olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében R^1X jelentése N-(1-6 szénatomos alkil-szulfonil)-N-(1-3 szénatomos alkil-amino)-csoport vagy 1-4 szénatomos alkoxi-fenoxi-csoport, R^3 és R^4 jelentése egymástól függetlenül 1-2 szénatomos alkilcsoport vagy 1-2 szénatomos alkoxics csoport és R^5 és R^6 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport. Ezen belül R^1X előnyös jelentése N-(1-3 szénatomos alkil-szulfonil)-N-(1-2 szénatomos alkil-amino)-csoport, elsősorban N-metil-szulfonil-N-metil-amino-csoport, N-metil-szulfonil-N-etil-amino-csoport, N-etil-szulfonil-N-metil-amino-csoport, N-etil-szulfonil-N-etil-amino-csoport vagy N-n-propil-szulfonil-N-metil-amino-csoport, vagy 1-3 szénatomos alkoxi-fenoxi-csoport, elsősorban 2-metoxi-fenoxi-csoport, 2-etoxi-fenoxi-csoport, 2-n-propoxi-fenoxi-csoport, vagy 2-izopropoxi-fenoxi-csoport, R^3 és R^4 jelentése egymástól függetlenül 1-2 szénatomos alkilcsoport vagy 1-2 szénatomos alkoxics csoport, elsősorban metilcsoport vagy metoxics csoport és R^5 és R^6 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy metil-

csoport.

Különösen előnyösek továbbá azok a találmány szerinti eljárások, amelyekben

Z jelentése kénatom és

R⁷ jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, elsősorban metilcsoport vagy etilcsoport, fenilcsoport vagy benzilcsoport, ahol az aromás csoportok szubsztituálatlanok vagy egy vagy több csoporttal, így halogénatommal, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal és 1-2 szénatomos alkoxicssoporttal szubsztituálva lehetnek,

R¹, R⁶ és X jelentése a fenti.

Különösen előnyösek azok a találmány szerinti eljárások, amelyekben

Z jelentése -NR⁸- általános képletű csoport,

R⁷ jelentése hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport, fenilcsoport vagy benzilcsoport, ahol az aromás csoportok szubsztituálatlanok vagy egy vagy több csoporttal, így halogénatommal, 1-2 szénatomos alkilcsoporttal és 1-2 szénatomos alkoxicssoporttal szubsztituálva lehetnek,

R⁸ jelentése hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport, vagy

R⁷ és R⁸ a kapcsolódó nitrogénatommal együtt 5-7-tagú gyűrűt képez, amely további nitrogénatomot vagy oxigénatomot tartalmazhat, és egy vagy több szubsztituenst, így halogénatomot vagy 1-4 szénatomos alkilcsoportot hordozhat, példaként említhető az N-morfolinilcsoport,

N-piperidinilcsoport, N-piperazinilcsoport, N-pirro-
lidinilcsoport, N-imidazolinilcsoport, N-pirazolidinil-
csoport vagy N-oxazolinilcsoport,
R¹, R⁶ és X jelentése a fenti.

A találmány szerinti eljárás kitermelése meglepően
magas, általában 95 % vagy ennél magasabb, ahol a keletkező
(I) általános képletű szulfonil-karbamid tisztasága gyakran
nagyobb, mint 95 tömeg%.

A találmány szerinti eljárást általában a reakció körülmények között inert szerves oldószer vagy oldószerkelet jelenlétében végezzük. Előnyösen alkalmazható oldószerkeletre példaként említhetők az alifás vagy aromás, adott esetben halogénezett szénhidrogének, aprotikus poláros szerves oldószerkelet, így dialkil-alkanoil-amid, dialkil-szulfoxid, polialkilén-glikol-dialkil-éter, N-alkilezett ciklikus amidok és nitrilek, valamint ezek elegyei.

Oldószerként előnyösen alkalmazható a toluol, xilol, klór-benzol, dimetil-formamid, dimetil-szulfoxid, szulfolán, di-, tri- vagy tetraetilén-glikol-dialkil-éter, előnyösen dimetil- vagy dietil-éter, N-metil-pirrolidon, acetonitril vagy ezek elegyei.

A találmány szerinti eljárás megvalósítható vizes, például tiszta vizes közegben is.

A (II) általános képletű vegyületet a (III) általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában ekvimoláris mennyiségben vagy enyhe feleslegben alkalmazzuk. A (II) és (III) általános képletű vegyületek mólaránya előnyösen 1:1-

-1,2:1, elsősorban 1:1-1,1:1.

A találmány szerinti eljárás során a reakcióhőmérséklet széles határok között változtatható, általában 0-140 °C közötti, előnyösen 20-132 °C közötti hőmérsékleten dolgozunk.

A találmány szerinti eljárás előnye, hogy a (II) általános képletű vegyületekből kihaladó (IV) általános képletű vegyületek, a képletben

R⁷ és Z jelentése a fenti,

a találmány szerinti eljárás megvalósítása során kvantitatív módon visszanyerhető, és a (II) általános képletű vegyületek ezt követő szintézise során újból közvetlenül felhasználhatók. A (IV) általános képletű vegyületek a visszavezetés előtt kívánt esetben tisztíthatók, például desztillációval.

A találmány szerinti eljárás további előnye, hogy elkerülhető az (V) általános képletű vegyületek alkalmazása, amelyek az (I) általános képletű vegyületek szokásos előállítási eljárásánál elkerülhetetlenek, és ennek során a szokásos 110 °C feletti reakcióhőmérsékleten intermediereként képződnek. Az ilyen körülmények között azonban az (V) általános képletű izocianátok termikusan nagyon labilisak és részben bomlanak, amelynek eredménye az alacsony kitermelésben tükröződik vissza (lásd 131 258 számú európai közrebocsátási irat, 2 257 240 számú német közrebocsátási irat és G. Lohaus: Chem. Ber. 105, 2791-2799 (1972)).

A találmány szerinti eljárás további előnye, hogy az alkalmazott oldószer közel kvantitatív kitermeléssel ismét

viSSZanyerhető, mivel az (I) általános képletű vegyületek oldhatatlan termék formájában a reakcióközegtől nagy tisztasággal és kitermeléssel kiválnak. Az alkalmazott oldószer ezután például desztillálással tisztítható, és a folyamatban ismét felhasználható.

Az (I) általános képletű vegyületek találmány szerinti előállításánál alkalmazott (II) és (III) általános képletű kiindulási anyagok az irodalomból ismert eljárásokkal előállíthatók. Így például a (III) általános képletű heterociklusos vegyületek a kereskedelmi forgalomban kaphatók, vagy megfelelő körülmények között előállíthatók (lásd például 4 310 470 számú USA-beli szabadalmi leírás, 027 200 számú európai közrebecsátási irat, 4 299 960 számú USA-beli szabadalmi leírás és M.J. Langermann és C.K. Banks: J. Am. Chem. Soc. 73, 3011 (1951)).

A (II) általános képletű vegyületek újak és a szokásos eljárásokkal analóg módon előállíthatók (lásd például Tietze és Eicher: Reaktionen und Synthesen, 92. oldal, Thieme Verlag, Stuttgart (1981); vagy Houben-Weyl, IX. kötet, 636. oldal). A (II) általános képletű vegyületek előállíthatók például úgy, hogy egy megfelelő (VI) általános képletű szulfonamidot egy megfelelő (VII) általános képletű savkloriddal reagáltatunk, amelyek a szokásos módon előállíthatók (a (VI) általános képletű vegyület vonatkozásában lásd például Houben-Weyl: E11. kiegészítő kötet, 1015. oldal; a (VII) általános képletű vegyület vonatkozásában lásd például W.A. Thaler: J. Chem. Soc. Chem. Communications, 527. oldal

(1968)).

A találmány szerinti eljárás vonatkozásában meglepőnek minősül az eljárás sima lefutása és nagy kitermelése, mivel a kiindulási anyagként alkalmazott (II) általános képletű vegyületek több aktivált, elektrofil és nukleofil centrummal rendelkeznek. Elvileg valamennyi elektrofil centrum reagálhat a (III) általános képletű vegyületek nukleofil centrumaival, és így fragmentálódási reakciókon keresztül nagyszámú melléktermék képződhetne (lásd Beyer: Lehrbuch der Organischen Chemie, 19. kiadás, 128. oldal, Hirzel Verlag Stuttgart), amikor is a szulfonilcsoportok és fenoxycsoportok nagyon jó kiindulási csoportokat képeznek.

A találmány szerinti eljárás ezért egy új, egyszerű és nagyiparilag is jól reprodukálható és erősen szelektív eljárást jelent az (I) általános képletű vegyületek közel kvantitatív előállításához. Az eljárás megvalósítható folyamatosan vagy szakaszosan is.

Előállítási példák

1-[(N-Metil-szulfonil-N-metil-amino)-szulfonil]-3-
-(4,6-dimetoxi-2-pirimidil)-karbamid előállítása

1) **S-Benzil-N-(N'-metil-N'-metil-szulfonil-amino-**
-szulfonil)-tiokarbamátból kiindulva

33,9 g S-benzil-N-(N'-metil-N'-metil-szulfonil-amino-

-szulfonil)-tiokarbamátot ((II) általános képletű vegyület, R^1 jelentése metilcsoport; X jelentése SO_2NCH_3 csoport, R^6 jelentése hidrogénatom, Z jelentése kénatom, R^7 jelentése benzilcsoport) 15,5 g 2-amino-4,6-dimetoxi-pirimidinnel együtt 60 ml toluolban 2,5 órán keresztül $70\text{ }^\circ\text{C}$ hőmérsékleten kevertetünk. Az elegyet $5\text{ }^\circ\text{C}$ hőmérsékletre hűtjük, majd a csapadékot szűrjük, és 60 ml toluollal mossuk, és szárítjuk. Így 36,7 g kivánt (I) általános képletű vegyületet kapunk fehér por formájában, amelynek olvadáspontja $175\text{-}177\text{ }^\circ\text{C}$. A termék tisztasága HPLC vizsgálat szerint 97,1 tömeg%, kitermelés az elméleti 96,6 %-a.

2) S-Metil-N-(N'-metil-N'-metil-szulfonil-amino-szulfonil)-tiokarbamátból kiindulva

26,3 g S-Metil-N-(N'-metil-N'-metil-szulfonil-amino-szulfonil)-tiokarbamátot ((II) általános képletű vegyület, R^1 jelentése metilcsoport; X jelentése SO_2NCH_3 csoport, R^6 jelentése hidrogénatom, Z jelentése kénatom, R^7 jelentése metilcsoport) 15,5 g 2-amino-4,6-dimetoxi-pirimidinnel együtt 100 ml klór-benzolban 2 órán keresztül $75\text{ }^\circ\text{C}$ hőmérsékleten kevertetünk. Az elegyet egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten állni hagyjuk, a keletkezett csapadékot szűrjük, 30 ml klór-benzollal mossuk. Így 37,2 g kivánt (I) általános képletű vegyületet kapunk, amelynek tisztasága HPLC vizsgálat szerint 94,6 tömeg%, kitermelés az elméleti 95,4 %-a. A termék olvadáspontja $172\text{-}174\text{ }^\circ\text{C}$.

**3) N-(N'-Metil-N'-metil-szulfonil-amino-szulfonil)-
-karbamidból kiindulva**

23,2 g N-(N'-metil-N'-metil-szulfonil-amino-szulfonil)-
-karbamidot ((II) általános képletű vegyület, R¹ jelentése
metilcsoport, X jelentése SO₂NCH₃ csoport, R⁶ jelentése
hidrogénatom, Z jelentése NR⁸ csoport, R⁸ jelentése
hidrogénatom, R⁷ jelentése hidrogénatom) 15,5 g 2-amino-
-4,6-dimetoxi-pirimidinnel együtt 150 ml klór-benzolban 2
órán keresztül 35 °C hőmérsékleten kevertetünk katalitikus
mennyiségű ammónia bevezetése mellett. A kivált terméket
szűrjük, 50 ml klór-benzollal mossuk, és szárítjuk. Így
36,4 g kivánt (I) általános képletű terméket kapunk, amely-
nek tisztasága HPLC vizsgálat szerint 96,4 tömeg%, kiter-
melés az elméleti 95,1 %-a. A termék olvadáspontja 173-
-175 °C.

**4) N-[(N'-Metil-N'-metil-szulfonil-amino-szulfonil)-
-amino-karbonil]-morfolinból kiindulva**

26,3 g N-[(N'-metil-N'-metil-szulfonil-amino-szulfonil)-
-amino-karbonil]-morfolint ((II) általános képletű vegyület,
R¹ jelentése metilcsoport, X jelentése SO₂NCH₃ csoport, R⁶
jelentése hidrogénatom, Z jelentése NR⁸ csoport, NR⁸R⁷
csoport jelentése N-morfolinilcsoport) 15,5 g 2-amino-4,6-
-dimetoxi-pirimidinnel együtt 100 ml toluolban 6 órán
keresztül 75 °C hőmérsékleten kevertetünk. A reakcióelegyet

hagyjuk 5 °C hőmérsékletre hűlni, a csapadékot szűrjük, 20 ml toluóllal mossuk és szárítjuk. Így 35,9 g kivánt (I) általános képletű terméket kapunk, amelynek tisztaság HPLC vizsgálat szerint 97,6 tömeg%, kitermelés az elméleti 95,0 %-a. A termék olvadáspontja 174-175 °C.

Szabadalmi igénypontok

1. Eljárás (I) általános képletű szulfonil-karbamidok és sóinak előállítására, a képletben

X jelentése oxigénatom, $-O-NR^2-$ vagy $-SO_2-NR^2-$ általános képletű csoport,

Y jelentése nitrogénatom vagy $-CH-$ képletű csoport,

R^1 jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 2-6 szénatomos alkinilcsoport, amelyek szubsztituálatlanok vagy egy vagy több szubsztituenssel szubsztituáltak lehetnek, ahol a szubsztituens lehet halogénatom, 1-4 szénatomos alkoxics csoport és 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, valamint

X = oxigénatom esetben fenilcsoport, amely szubsztituálatlan vagy egy vagy több szubsztituenssel szubsztituált lehet, ahol a szubsztituens lehet halogénatom, nitro-csoport, 1-4 szénatomos alkilcsoport, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-4 szénatomos alkoxics csoport, 1-4 szénatomos halogén-alkoxi-csoport és 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport,

R^2 jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport vagy 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport,

R^3 és R^4 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport vagy 1-4 szénatomos alkoxi-csoport, amelyek szubsztituálatlanok vagy egy vagy több szubsztituenssel szubsztituáltak lehetnek, ahol a szub-

sztituens lehet halogénatom, alkoxicsoport és alkiltio-
csoport; valamint halogénatom, 1-4 szénatomos alkiltio-
csoport, 1-4 szénatomos alkil-amino-csoport vagy alkil-
részeiben 1-4 szénatomos dialkil-amino-csoport,

R^5 és R^6 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom
vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport,

azzal jellemezve, hogy egy (II) általános képletű ve-
gyületet, ahol

Z jelentése kénatom vagy $-NR^8-$ általános képletű csoport,
 R^7 és R^8 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,

1-6 szénatomos alkilcsoport, fenilcsoport vagy benzil-
csoport, ahol az aromás csoportok szubsztituálatlanok
vagy egy vagy több szubsztituenssel szubsztituáltak le-
hetnek, ahol a szubsztituens lehet halogénatom, alkil-
csoport és alkoxicsoport; valamint

Z = $-NR^8$ esetben R^7 és R^8 a kapcsolódó nitrogén-
atommal együtt 5-7-tagú gyűrűt képez, amely további nit-
rogénatomot vagy oxigénatomot, és adott esetben egy
vagy több szubsztituenst, így halogénatomot vagy alkil-
csoportot tartalmazhat,

R^1 , R^6 és X jelentése a tárgyi körben megadott,
egy (III) általános képletű vegyülettel reagáltatunk, a
képletben

R^3 , R^4 , R^5 és Y jelentése a tárgyi körben megadott.

2. Az 1. igénypont szerinti eljárás R^1X helyén N-(1-6
szénatomos alkil-szulfonil)-N-(1-3 szénatomos alkil-amino)-
-csoportot vagy 1-4 szénatomos alkoxi-fenoxi-csoportot, R^3

és R^4 helyén egymástól függetlenül 1-2 szénatomos alkilcsoportot vagy 1-2 szénatomos alkoxicssoportot és R^5 és R^6 helyén hidrogénatomot vagy metilcsoportot tartalmazó (I) általános képletű vegyületek és sói előállítására, azzal jellemezve, hogy megfelelően szubsztituált kiindulási vegyületeket alkalmazunk.

3. Az 1. vagy 2. igénypont szerinti eljárás R^1X helyén N-(1-3 szénatomos alkil-szulfonil)-N-(1-2 szénatomos alkil-amino)-csoportot vagy 1-3 szénatomos alkoxi-fenoxi-csoportot, R^3 és R^4 helyén egymástól függetlenül 1-2 szénatomos alkilcsoportot vagy 1-2 szénatomos alkoxicssoportot és R^5 és R^6 helyén hidrogénatomot vagy metilcsoportot tartalmazó (I) általános képletű vegyületek és sói előállítására, azzal jellemezve, hogy megfelelően szubsztituált kiindulási vegyületeket alkalmazunk.

4. Az 1-3. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (II) általános képletű vegyületet alkalmazunk, amelynek képletében

Z jelentése kénatom,

R^7 jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, fenilcsoport vagy benzilcsoport, ahol az aromás csoportok szubsztituálatlanok vagy egy vagy több szubsztituenssel, így halogénatommal, 1-2 szénatomos alkilcsoporttal és 1-2 szénatomos alkoxicssoporttal szubsztituálva lehetnek, R^1 , R^6 és X jelentése az 1. igénypontban megadott.

5. Az 1-3. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (II) általános képletű vegyü-

leteket alkalmazunk, amelyek képletében

Z jelentése $-NR^8-$ általános képletű csoport,

R⁷ jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, fenilcsoport vagy benzilcsoport, ahol az aromás csoportok szubsztituálatlanok vagy egy vagy több szubsztituenssel, így halogénatommal, 1-2 szénatomos alkilcsoporttal és 1-2 szénatomos alkoxicssoporttal szubsztituálva lehetnek,

R⁸ jelentése hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport vagy

R⁷ és R⁸ a kapcsolódó nitrogénatommal 5-7-tagú gyűrűt képez, amely további nitrogénatomot vagy oxigénatomot tartalmazhat, és egy vagy több szubsztituenst, így halogénatomot vagy 1-4 szénatomos alkilcsoportot hordozhat,

R¹, R⁶ és X jelentése az 1. igénypontban megadott.

6. Az 1-5. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy a reakciót a reakciókörülmények között inert szervetlen vagy szerves oldószer vagy oldószerelegy jelenlétében végezzük.

7. Az 1-6. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy a reakciót inert szerves oldószer jelenlétében végezzük.

8. Az 1-7. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy a (II) általános képletű vegyületet a (III) általános képletű vegyületre vonatkoztatva ekvimoláris mennyiségben vagy enyhe feleslegben alkalmazzuk.

9. A 8. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy a (II) és (III) általános képletű vegyületek mólaránya 1:1-1,2:1.

10. Az 1-9. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy a reakciót 0-140 °C közötti hőmérsékleten végezzük.

11. Eljárás (II) általános képletű vegyületek előállítására, a képletben

R^1 , R^6 , R^7 , X és Z jelentése a korábbi igénypontokban

megadott,

azzal jellemezve, hogy egy (VI) általános képletű szulfonamidot egy (VII) általános képletű savkloriddal reagáltatunk, a képletben

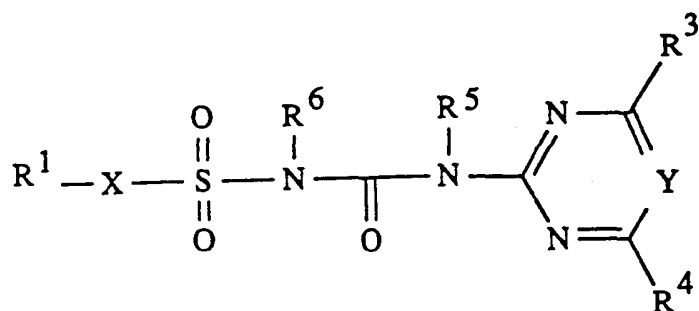
R^1 , R^6 , R^7 , X és Z jelentése a tárgyi körben megadott.

12. A 11. igénypont szerinti (II) általános képletű vegyületek alkalmazása szulfonil-karbamidok előállításához.

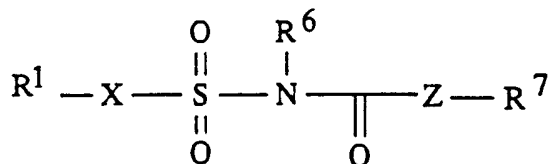
+ 2 rajzlap

A meghatalmazott:

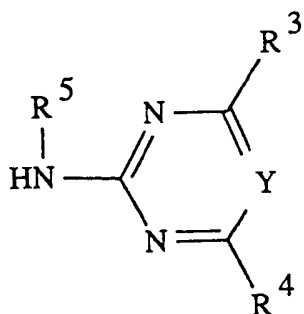
DANUBIA
Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.
10.



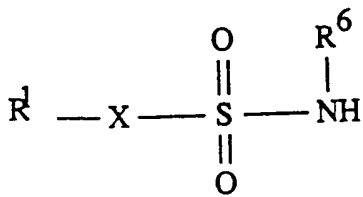
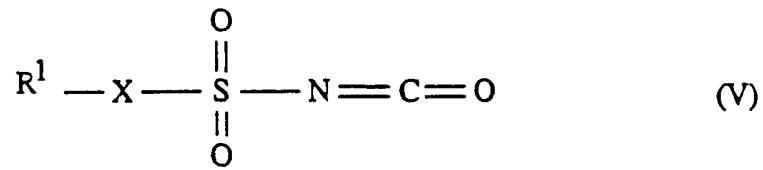
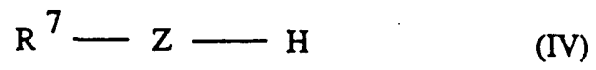
(I)



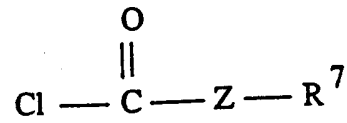
(II)



(III)



(VI)



(VII)

