

(19)



Евразийское  
патентное  
ведомство

(21) 202490200 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки  
2024.03.07

(22) Дата подачи заявки  
2022.07.06

(51) Int. Cl. C07D 239/54 (2006.01)  
C07D 401/12 (2006.01)  
A01N 43/54 (2006.01)  
A01P 13/00 (2006.01)

(54) ГЕРБИЦИДНЫЕ ФЕНИЛУРАЦИЛЫ

(31) 21185972.3

(32) 2021.07.16

(33) EP

(86) PCT/EP2022/068674

(87) WO 2023/285222 2023.01.19

(71) Заявитель:  
БАСФ СЕ (DE)

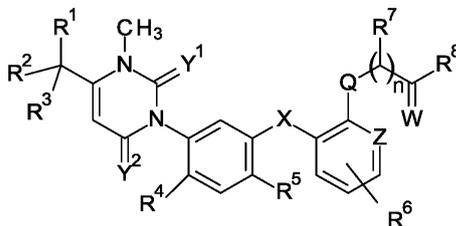
(72) Изобретатель:

Зайзер Тобиас, Вичель Маттиас,  
Петкова Десислава Славчева, Бец  
Михаэль, Ньютон Тревор Уильям,  
Парра Рапато Лилиана (DE), Павон  
Ромеро Рикардо Хуго (ES)

(74) Представитель:

Веселицкий М.Б., Кузенкова Н.В.,  
Каксис Р.А., Белоусов Ю.В., Куликов  
А.В., Кузнецова Е.В., Соколов Р.А.,  
Кузнецова Т.В. (RU)

(57) Настоящее изобретение относится к фенилурацилам формулы (I)



или к их приемлемым в сельском хозяйстве солям или производным, где переменные определены согласно описанию, к содержащим их композициям и к их применению в качестве гербицидов, т.е. для борьбы с вредными растениями, а также к способу борьбы с нежелательной растительностью, который включает в себя воздействие гербицидно эффективного количества по меньшей мере одного фенилурацила формулы (I) на растения, их семена и/или их окружающую среду.

A1

202490200

202490200

A1

## ГЕРБИЦИДНЫЕ ФЕНИЛУРАЦИЛЫ

5 Настоящее изобретение относится к фенилурацилам формулы (I), определенным ниже, и к их применению в качестве гербицидов.

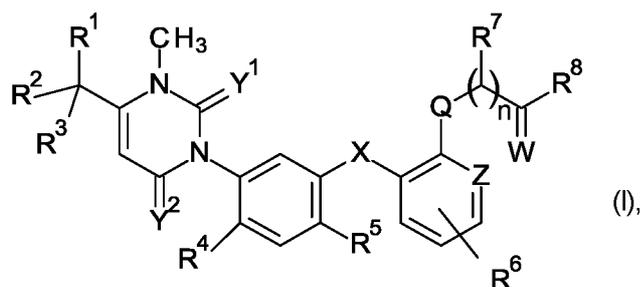
В EP 1 122 244, EP 1 106 607 и WO 19/101551 описаны аналогичные соединения, для которых заявлено гербицидное действие, однако явно раскрыты только соединения, в которых урацил замещен трифторметильной группой.

10 Гербицидные свойства этих известных соединений в отношении нежелательной растительности не всегда полностью удовлетворительны.

Поэтому целью настоящего изобретения является создание фенилурацилов формулы (I), обладающих улучшенным гербицидным действием. В частности, должны быть предложены фенилурацилы формулы (I), которые обладают  
15 высокой гербицидной активностью, в частности, даже при низких нормах внесения и которые достаточно совместимы с сельскохозяйственными растениями для коммерческого использования.

Эти и другие цели достигаются с помощью фенилурацилов формулы (I), определенных ниже, и их солей, пригодных для сельского хозяйства.

20 Соответственно, в настоящем изобретении предложены фенилурацилы формулы (I)



где заместители имеют следующие значения:

$R^1$   $CH_3$ ;

25  $R^2$  водород, галоген,  $C_1$ - $C_4$ -алкил,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкил,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси или  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси;

$R^3$  водород, галоген,  $C_1$ - $C_4$ -алкил,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкил,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси или  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси;

$R^4$  H или галоген;

30  $R^5$  галоген, CN,  $NH_2$ ,  $NO_2$ ;

$R^6$  H, галоген,  $C_1$ - $C_3$ -алкил,  $C_1$ - $C_3$ -алкокси;

$R^7$  H,  $C_1$ - $C_3$ -алкил,  $C_1$ - $C_3$ -алкокси;

$R^8$   $OR^9$ ,  $SR^9$ ,  $NR^{10}R^{11}$ ,  $NR^9OR^9$ ,  $NR^9S(O)_2R^{10}$  или  $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ , где

$R^9$  представляет собой водород,  $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -алкенил,  $C_3$ - $C_6$ -

5 алкинил,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкил,  $C_3$ - $C_6$ -галогеналкенил,  $C_3$ - $C_6$ -галогеналкинил,  $C_1$ -  
 $C_6$ -цианоалкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -  
алкил, ди( $C_1$ - $C_6$ -алкокси) $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -  
алкенилокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -галогеналкенилокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -  
алкенилокси- $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкилтио- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -  
10 алкилсульфинил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкилсульфонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -  
алкилкарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкоксикарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -  
галогеналкоксикарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -алкенилоксикарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  
 $C_3$ - $C_6$ -алкинилоксикарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил, amino, ( $C_1$ - $C_6$ -алкил)амино, ди( $C_1$ - $C_6$ -  
алкил)амино, ( $C_1$ - $C_6$ -алкилкарбонил)амино, amino- $C_1$ - $C_6$ -алкил, ( $C_1$ - $C_6$ -  
15 алкил)амино- $C_1$ - $C_6$ -алкил, ди( $C_1$ - $C_6$ -алкил)амино- $C_1$ - $C_6$ -алкил, аминокарбонил-  
 $C_1$ - $C_6$ -алкил, ( $C_1$ - $C_6$ -алкил)аминокарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил, ди( $C_1$ - $C_6$ -  
алкил)аминокарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,

- $N=CR^{12}R^{13}$ , где  $R^{12}$  и  $R^{13}$  независимо друг от друга представляют собой H,  
 $C_1$ - $C_4$ -алкил или фенил;

20  $C_3$ - $C_6$ -циклоалкил,  $C_3$ - $C_6$ -циклоалкил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -гетероциклил,  $C_3$ -  
 $C_6$ -гетероциклил- $C_1$ - $C_6$ -алкил, фенил, фенил- $C_1$ - $C_4$ -алкил или 5- или 6-членный  
гетероарил,

где каждое циклоалкильное, гетероциклильное, фенильное или  
гетероарильное кольцо может быть замещено одним-четырьмя заместителями,  
25 выбранными из  $R^{14}$  или 3-7-членного карбоцикла,

причем карбоцикл дополнительно к атомам углерода необязательно имеет  
один или два члена кольца, выбранных из группы, состоящей из

- $N(R^{12})$ -, - $N=N$ -, - $C(=O)$ -, -O- и -S-, и

30 при этом карбоцикл необязательно замещен одним-четырьмя  
заместителями, выбранными из  $R^{14}$ ;

где  $R^{14}$  представляет собой галоген,  $NO_2$ , CN,  $C_1$ - $C_4$ -алкил,  $C_1$ - $C_4$ -  
галогеналкил,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси или  $C_1$ - $C_4$ -алкоксикарбонил;

$R^{10}$ ,  $R^{11}$  независимо друг от друга представляют собой  $R^9$  или вместе  
образуют 3-7-членный карбоцикл,

причем карбоцикл дополнительно к атомам углерода необязательно имеет один или два члена кольца, выбранных из группы, состоящей из  $-N(R^{12})-$ ,  $-N=N-$ ,  $-C(=O)-$ ,  $-O-$  и  $-S-$ , и

при этом карбоцикл необязательно замещен одним-четырьмя  
5 заместителями, выбранными из  $R^{14}$ ;

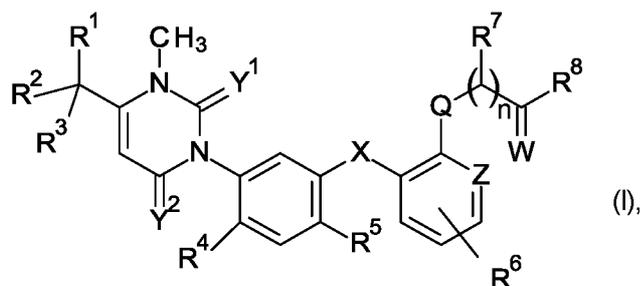
n от 1 до 3;

Q, W, X,  $Y^1$ ,  $Y^2$  независимо друг от друга означают O или S;

Z CH или N;

включая их приемлемые в сельском хозяйстве соли, амиды, сложные эфиры  
10 или тиоэфиры, при условии, что соединения формулы (I) имеют карбоксильную группу.

В настоящем изобретении дополнительно раскрыты фенилурацилы  
формулы (I)



15 где заместители имеют следующие значения:

$R^1$  C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкенил или C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкинил;

$R^2$  водород, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси или  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси;

$R^3$  водород, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси или  
20 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси;

$R^4$  H или галоген;

$R^5$  галоген, CN, NH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>;

$R^6$  H, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкокси;

$R^7$  H, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкокси;

25  $R^8$  OR<sup>9</sup>, SR<sup>9</sup>, NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, NR<sup>9</sup>OR<sup>9</sup>, NR<sup>9</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>10</sup> или NR<sup>9</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, где

$R^9$  представляет собой водород, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-  
алкинил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкинил, C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>-цианоалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-  
алкил, ди(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-

алкенилокси-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-галогеналкенилокси-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-  
алкенилокси-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкокси-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкилтио-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-  
алкилсульфинил-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкилсульфонил-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-  
алкилкарбонил-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкоксикарбонил-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-  
5 галогеналкоксикарбонил-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-алкенилоксикарбонил-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил,  
С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-алкинилоксикарбонил-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, amino, (С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил)амино, ди(С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-  
алкил)амино, (С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкилкарбонил)амино, amino-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, (С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-  
алкил)амино-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, ди(С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил)амино-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, аминокарбонил-  
С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, (С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил)аминокарбонил-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, ди(С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-  
10 алкил)аминокарбонил-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил,

-N=CR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, где R<sup>12</sup> и R<sup>13</sup> независимо друг от друга представляют собой H,  
С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкил или фенил;

С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкил, С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкил-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-гетероциклил, С<sub>3</sub>-  
С<sub>6</sub>-гетероциклил-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкил, фенил, фенил-С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкил или 5- или 6-членный  
15 гетероарил,

где каждое циклоалкильное, гетероциклильное, фенильное или  
гетероарильное кольцо может быть замещено одним-четырьмя заместителями,  
выбранными из R<sup>14</sup> или 3-7-членного карбоцикла,

20 причем карбоцикл дополнительно к атомам углерода необязательно имеет  
один или два члена кольца, выбранных из группы, состоящей из

-N(R<sup>12</sup>)-, -N=N-, -C(=O)-, -O- и -S-, и

при этом карбоцикл необязательно замещен одним-четырьмя  
заместителями, выбранными из R<sup>14</sup>;

25 где R<sup>14</sup> представляет собой галоген, NO<sub>2</sub>, CN, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкил, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-  
галогеналкил, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси или С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкоксикарбонил;

R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> независимо друг от друга представляют собой R<sup>9</sup>, или вместе  
образуют 3-7-членный карбоцикл,

30 причем карбоцикл дополнительно к атомам углерода необязательно имеет  
один или два члена кольца, выбранных из группы, состоящей из -N(R<sup>12</sup>)-, -N=N-,  
-C(=O)-, -O- и -S-, и

при этом карбоцикл необязательно замещен одним-четырьмя  
заместителями, выбранными из R<sup>14</sup>;

n от 1 до 3;

Q, W, X, Y<sup>1</sup>, Y<sup>2</sup> независимо друг от друга означают O или S;

Z СН или N;

включая их приемлемые в сельском хозяйстве соли, амиды, сложные эфиры или тиоэфиры, при условии, что соединения формулы (I) имеют карбоксильную группу.

5 В настоящем изобретении также предложены составы, содержащие по меньшей мере один фенилурацил формулы (I) и вспомогательные вещества, используемые для приготовления средств защиты растений.

10 Настоящее изобретение также относится к применению фенилурацила формулы (I) в качестве гербицидов, т.е. для борьбы с нежелательной растительностью.

Настоящее изобретение, кроме того, обеспечивает способ борьбы с нежелательной растительностью, при котором гербицидно эффективным количеством по меньшей мере одного фенилурацила формулы (I) воздействуют на растения, их семена и/или среду их обитания.

15 Кроме того, изобретение относится к способам и промежуточным соединениям для получения фенилурацила формулы (I).

20 Если фенилурацил формулы (I), как описано в настоящей заявке, способен образовывать геометрические изомеры, например E/Z-изомеры, то можно использовать как чистые изомеры, так и их смеси, в соответствии с изобретением.

25 Если фенилурацил формулы (I), как описано в настоящей заявке, имеет один или несколько центров хиральности и, как следствие, присутствует в виде энантиомеров или диастереомеров, то можно использовать как чистые энантиомеры, так и диастереомеры, а также их смеси в соответствии с изобретением.

30 Если фенилурацил формулы (I), как описано в настоящей заявке, имеет ионизируемые функциональные группы, его также можно использовать в виде его приемлемых в сельском хозяйстве солей. Подходящими являются, как правило, соли тех катионов и кислотно-аддитивные соли тех кислот, катионы и анионы которых соответственно не оказывают вредного воздействия на активность активных соединений.

Предпочтительными катионами являются ионы щелочных металлов, предпочтительно лития, натрия и калия, щелочноземельных металлов, предпочтительно кальция и магния, и переходных металлов, предпочтительно

марганца, меди, цинка и железа, кроме того, аммония и замещенного аммония, в котором от одного до четырех атомов водорода могут быть замещены посредством C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкила, гидроксид-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкила, гидроксид-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкила, фенила или бензила, предпочтительно аммония, метиламмония, изопропиламмония, диметиламмония, 5 диизопропиламмония, триметиламмония, гептиламмония, додециламмония, тетрадециламмония, тетраметиламмония, тетраэтиламмония, тетрабутиламмония, 2-гидроксиэтиламмония (соль оламина), 2-(2-гидроксиэтил-1-ил)аммония (соль диоламина), трис(2-гидроксиэтил)аммония (соль троламина), 10 трис(2-гидроксипропил)аммония, бензилтриметиламмония, бензилтриэтиламмония, N,N,N-триметилэтаноламмония (соль холина), кроме того, ионы фосфония, ионы сульфония, предпочтительно три(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил)сульфония, такие как триметилсульфония, и ионы сульфоксония, предпочтительно три(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил)сульфоксония, и, наконец, соли 15 многоосновных аминов, такие как N,N-бис-(3-аминопропил)метиламин и диэтилентриамин.

Анионами пригодных кислотно-аддитивных солей в первую очередь являются хлорид, бромид, фторид, гидросульфат, метилсульфат, сульфат, 20 дигидрофосфат, гидрофосфат, нитрат, бикарбонат, карбонат, гексафторсиликат, гексафторфосфат, бензоат, а также анионы C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкановых кислот, предпочтительно формиат, ацетат, пропионат и бутират.

Фенилурацил формулы (I), как описано в настоящей заявке, имеющие карбоксильную группу, могут быть использованы в виде кислоты, в виде приемлемой в сельском хозяйстве соли, как указано выше или же в виде 25 приемлемого в сельском хозяйстве производного, например, в виде амидов, таких как моно- и ди-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкиламида или ариламида, в виде сложных эфиров, например, в виде аллиловых сложных эфиров, пропаргиловых сложных эфиров, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкиловых сложных эфиров, алкоксиалкиловых сложных эфиров, сложных тефурил-((тетрагидрофуран-2-ил)метил)овых эфиров, а также в виде 30 сложных тиоэфиров, например, в виде сложных C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкилтиоэфиров. Предпочтительными моно- и ди-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкиламидами являются метил- и диметиламида. Предпочтительными ариламидами являются, например, анилиды и 2-хлоранилиды. Предпочтительными алкиловыми сложными эфирами являются, например, метиловый, этиловый, пропиловый, изопропиловый,

бутиловый, изобутиловый, пентиловый, мексил (1-метилгексиловый), мептил (1-метилгептиловый), гептиловый, октиловый или изооктил (2-этилгексиловый) сложные эфиры. Предпочтительными сложными C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкиловыми эфирами являются неразветвленные или разветвленные сложные C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксиэтиловые эфиры, например, 2-метоксиэтиловый, 2-этоксиэтиловый, 2-бутоксиэтиловый (бутотил), 2-бутоксипропиловый или 3-бутоксипропиловый эфир. Примером неразветвленного или разветвленного сложного C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкилтиоэфира является этилтиоэфир.

Органические фрагменты, упомянутые в определении переменных от R<sup>1</sup> до R<sup>13</sup>, являются, как и термин галоген, собирательными терминами для индивидуального перечисления отдельных членов группы. Термин галоген в каждом случае означает фтор, хлор, бром или йод. Все углеводородные цепи могут быть прямыми или разветвленными, приставка C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub> обозначает в каждом случае возможное количество атомов углерода в группе.

Примерами таких значений являются:

- C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкил: например, CH<sub>3</sub>, C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, *n*-пропил и CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>;
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, а также C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкильные фрагменты фенил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкила: например, CH<sub>3</sub>, C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, *n*-пропил, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, *n*-бутил, CH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> и C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>;
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, а также C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкильные фрагменты C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-цианоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, ди(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкенилокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкенилокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкенилокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилтио-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилсульфинил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилсульфонил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилкарбонил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкоксикарбонил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкоксикарбонил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкенилоксикарбонил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкинилоксикарбонил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилкарбонил)амино, амино-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)амино-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, ди(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)амино-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, аминокарбонил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)аминокарбонил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, ди(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)аминокарбонил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-гетероцикл-ил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, как указано выше, а также, например, *n*-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, *n*-гексил, 1,1-диметилпропил, 1,2-

диметилпропил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил или 1-этил-2-метилпропил, предпочтительно метил, этил, *n*-пропил, 1-метилэтил, *n*-бутил, 1,1-диметилэтил, *n*-пентил или *n*-гексил;

5  
10  
15  
20

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, как указано выше, который частично или полностью замещен фтором, хлором, бромом и/или йодом, например, хлорметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, бромметил, йодметил, 2-фторэтил, 2-хлорэтил, 2-бромэтил, 2-йодэтил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, 2-хлор-2-фторэтил, 2-хлор-2,2-дифторэтил, 2,2-дихлор-2-фторэтил, 2,2,2-трихлорэтил, пентафторэтил, 2-фторпропил, 3-фторпропил, 2,2-дифторпропил, 2,3-дифторпропил, 2-хлорпропил, 3-хлорпропил, 2,3-дихлорпропил, 2-бромпропил, 3-бромпропил, 3,3,3-трифторпропил, 3,3,3-трихлорпропил, 2,2,3,3,3-пентафторпропил, гептафторпропил, 1-(фторметил)-2-фторэтил, 1-(хлорметил)-2-хлорэтил, 1-(бромметил)-2-бромэтил, 4-фторбутил, 4-хлорбутил, 4-бромбутил, нонафторбутил, 1,1,2,2,-тетрафторэтил и 1-трифторметил-1,2,2,2-тетрафторэтил;

20

- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкил: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил, как указано выше, а также, например, 5-фторпентил, 5-хлорпентил, 5-бромпентил, 5-йодпентил, ундекафторпентил, 6-фторгексил, 6-хлоргексил, 6-бромгексил, 6-йодгексил и додекафторгексил;

25  
30

- C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкенил, а также C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкенильные фрагменты C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкенилокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкенилокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкенилоксикарбонил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила: например, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 1-пентенил, 2-пентенил, 3-пентенил, 4-пентенил, 1-метил-1-бутенил, 2-метил-1-бутенил, 3-метил-1-бутенил, 1-метил-2-бутенил, 2-метил-2-бутенил, 3-метил-2-бутенил, 1-метил-3-бутенил, 2-метил-3-бутенил, 3-метил-3-бутенил, 1,1-диметил-2-пропенил, 1,2-диметил-1-пропенил, 1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил, 1-этил-2-пропенил, 1-гексенил, 2-гексенил, 3-гексенил, 4-гексенил, 5-гексенил, 1-метил-1-пентенил, 2-метил-1-пентенил, 3-метил-1-пентенил, 4-метил-1-пентенил, 1-

метил-2-пентенил, 2-метил-2-пентенил, 3-метил-2-пентенил, 4-метил-2-пентенил, 1-метил-3-пентенил, 2-метил-3-пентенил, 3-метил-3-пентенил, 4-метил-3-пентенил, 1-метил-4-пентенил, 2-метил-4-пентенил, 3-метил-4-пентенил, 4-метил-4-пентенил, 1,1-диметил-2-бутенил, 1,1-диметил-3-бутенил, 1,2-диметил-1-бутенил, 1,2-диметил-2-бутенил, 1,2-диметил-3-бутенил, 1,3-диметил-1-бутенил, 1,3-диметил-2-бутенил, 1,3-диметил-3-бутенил, 2,2-диметил-3-бутенил, 2,3-диметил-1-бутенил, 2,3-диметил-2-бутенил, 2,3-диметил-3-бутенил, 3,3-диметил-1-бутенил, 3,3-диметил-2-бутенил, 1-этил-1-бутенил, 1-этил-2-бутенил, 1-этил-3-бутенил, 2-этил-1-бутенил, 2-этил-2-бутенил, 2-этил-3-бутенил, 1,1,2-триметил-2-пропенил, 1-этил-1-метил-2-пропенил, 1-этил-2-метил-1-пропенил и 1-этил-2-метил-2-пропенил;

5  
10  
-  $C_2-C_4$ -алкенил: например, этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил,

15  
20  
-  $C_3-C_6$ -галогеналкенил, а также  $C_3-C_6$ -галогеналкенильные части  $C_3-C_6$ -галогеналкенилокси- $C_1-C_6$ -алкила:  $C_3-C_6$ -алкенильный радикал, упомянутый выше, который частично или полностью замещен фтором, хлором, бромом и/или йодом, например, 2-хлорпроп-2-ен-1-ил, 3-хлорпроп-2-ен-1-ил, 2,3-дихлорпроп-2-ен-1-ил, 3,3-дихлорпроп-2-ен-1-ил, 2,3,3-трихлор-2-ен-1-ил, 2,3-дихлорбут-2-ен-1-ил, 2-бромпроп-2-ен-1-ил, 3-бромпроп-2-ен-1-ил, 2,3-дибромпроп-2-ен-1-ил, 3,3-дибромпроп-2-ен-1-ил, 2,3,3-трибром-2-ен-1-ил или 2,3-дибромбут-2-ен-1-ил;

-  $C_2-C_4$ -алкинил: например, этинил, 1-пропинил, 2-пропинил, 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 1-метил-2-пропинил;

25  
30  
-  $C_3-C_6$ -алкинил, а также  $C_3-C_6$ -алкинильные части  $C_3-C_6$ -алкинилоксикарбонил- $C_1-C_6$ -алкила: например, 1-пропинил, 2-пропинил, 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 1-метил-2-пропинил, 1-пентинил, 2-пентинил, 3-пентинил, 4-пентинил, 1-метил-2-бутинил, 1-метил-3-бутинил, 2-метил-3-бутинил, 3-метил-1-бутинил, 1,1-диметил-2-пропинил, 1-этил-2-пропинил, 1-гексинил, 2-гексинил, 3-гексинил, 4-гексинил, 5-гексинил, 1-метил-2-пентинил, 1-метил-3-пентинил, 1-метил-4-пентинил, 2-метил-3-пентинил, 2-метил-4-пентинил, 3-метил-1-пентинил, 3-метил-4-пентинил, 4-метил-1-пентинил, 4-метил-2-пентинил, 1,1-диметил-2-бутинил, 1,1-диметил-3-бутинил, 1,2-диметил-

3-бутинил, 2,2-диметил-3-бутинил, 3,3-диметил-1-бутинил, 1-этил-2-бутинил, 1-этил-3-бутинил, 2-этил-3-бутинил и 1-этил-1-метил-2-пропинил;

- C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкинил: C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкинильный радикал, как указано выше, который частично или полностью замещен фтором, хлором, бромом и/или

5 йодом, например, 1,1-дифторпроп-2-ин-1-ил, 3-хлорпроп-2-ин-1-ил, 3-бромпроп-2-ин-1-ил, 3-йодпроп-2-ин-1-ил, 4-фторбут-2-ин-1-ил, 4-хлорбут-2-ин-1-ил, 1,1-дифторбут-2-ин-1-ил, 4-йодбут-3-ин-1-ил, 5-фторпент-3-ин-1-ил, 5-йодпент-4-ин-1-ил, 6-фторгекс-4-ин-1-ил или 6-йодгекс-5-ин-1-ил;

- C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкокси: например, метокси, этокси, пропокси;

10 - C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, а также C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси фрагменты C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкилоксикарбонила: например, метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси и 1,1-диметилэтокси;

- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, а также C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси фрагменты C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, ди(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкенилокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкоксикарбонил-  
15 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, как указано выше, а также, например, пентокси, 1-метилбутокси, 2-метилбутокси, 3-метоксилбутокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 2,2-диметилпропокси, 1-этилпропокси, гексокси, 1-метилпентокси, 2-метилпентокси, 3-метилпентокси, 4-метилпентокси, 1,1-  
20 диметилбутокси, 1,2-диметилбутокси, 1,3-диметилбутокси, 2,2-диметилбутокси, 2,3-диметилбутокси, 3,3-диметилбутокси, 1-этилбутокси, 2-этилбутокси, 1,1,2-триметилпропокси, 1,2,2-триметилпропокси, 1-этил-1-метилпропокси и 1-этил-2-метилпропокси.

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси-радикал, как указано выше, который частично или полностью замещен фтором, хлором, бромом и/или  
25 йодом, т.е., например, фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, хлордифторметокси, бромдифторметокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2-бромметокси, 2-йодэтокси, 2,2-дифторэтокси, 2,2,2-трифторэтокси, 2-хлор-2-фторэтокси, 2-хлор-2,2-дифторэтокси, 2,2-дихлор-2-фторэтокси, 2,2,2-трихлорэтокси, пентафторэтокси, 2-фторпропокси, 3-фторпропокси, 2-хлорпропокси, 3-хлорпропокси, 2-бромпропокси, 3-бромпропокси, 2,2-дифторпропокси, 2,3-дифторпропокси, 2,3-дихлорпропокси, 3,3,3-трифторпропокси, 3,3,3-трихлорпропокси, 2,2,3,3,3-пентафторпропокси, гептафторпропокси, 1-(фторметил)-2-фторэтокси, 1-(хлорметил)-2-хлорэтокси,

1-(бромметил)-2-бромэтокси, 4-фторбутокси, 4-хлорбутокси, 4-бромбутокси и  
нонафторбутокси;

5 - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкокси, а также C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкокси фрагменты C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-  
галогеналкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкоксикарбонил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила: C<sub>1</sub>-  
C<sub>4</sub>-галогеналкокси, как указано выше, а также, например, 5-фторпентокси, 5-  
хлорпентокси, 5-бромпентокси, 5-йодпентокси, ундекафторпентокси, 6-  
фторгексокси, 6-хлоргексокси, 6-бромгексокси, 6-йодгексокси и  
додекафторгексокси;

10 - C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкилтио: например, метилтио, этилтио, пропилтио, 1-  
метилэтилтио, бутилтио, 1-метилпропилтио, 2-метилпропилтио и 1,1-  
диметилэтилтио;

15 - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилтио, а также C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилтио фрагменты C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилтио-  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкилтио, как указано выше, а также, например, пентилтио,  
1-метилбутилтио, 2-метилбутилтио, 3-метилбутилтио, 2,2-диметилпропилтио, 1-  
этилпропилтио, гексилтио, 1,1-диметилпропилтио, 1,2-диметилпропилтио, 1-  
метилпентилтио, 2-метилпентилтио, 3-метилпентилтио, 4-метилпентилтио, 1,1-  
диметилбутилтио, 1,2-диметилбутилтио, 1,3-диметилбутилтио, 2,2-  
диметилбутилтио, 2,3-диметилбутилтио, 3,3-диметилбутилтио, 1-этилбутилтио,  
2-этилбутилтио, 1,1,2-триметилпропилтио, 1,2,2-триметилпропилтио, 1-этил-1-  
метилпропилтио и 1-этил-2-метилпропилтио;

20 - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилсульфинил (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил-S(=O)-), а также C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-  
алкилсульфинильные фрагменты C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилсульфинил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила:  
например, метилсульфинил, этилсульфинил, пропилсульфинил, 1-  
метилэтилсульфинил, бутилсульфинил, 1-метилпропилсульфинил, 2-  
метилпропилсульфинил, 1,1-диметилэтилсульфинил, пентилсульфинил, 1-  
метилбутилсульфинил, 2-метилбутилсульфинил, 3-метилбутилсульфинил, 2,2-  
диметилпропилсульфинил, 1-этилпропилсульфинил, 1,1-  
диметилпропилсульфинил, 1,2-диметилпропилсульфинил, гексилсульфинил, 1-  
метилпентилсульфинил, 2-метилпентилсульфинил, 3-метилпентилсульфинил, 4-  
метилпентил-сульфинил, 1,1-диметилбутилсульфинил, 1,2-  
диметилбутилсульфинил, 1,3-диметилбутил-сульфинил, 2,2-  
диметилбутилсульфинил, 2,3-диметилбутилсульфинил, 3,3-диметилбутил-  
сульфинил, 1-этилбутилсульфинил, 2-этилбутилсульфинил, 1,1,2-

триметилпропилсульфинил, 1,2,2-триметилпропилсульфинил, 1-этил-1-метилпропилсульфинил и 1-этил-2-метилпропилсульфинил;

5 - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилсульфонил (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил-S(O)<sub>2</sub>-), а также C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилсульфонильные фрагменты C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилсульфонил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила: например, метилсульфонил, этилсульфонил, пропилсульфонил, 1-метилэтилсульфонил, 5  
бутилсульфонил, 1-метилпропилсульфонил, 2-метил-пропилсульфонил, 1,1-диметилэтилсульфонил, пентилсульфонил, 1-метилбутилсульфонил, 2-метилбутилсульфонил, 3-метилбутилсульфонил, 1,1-диметилпропилсульфонил, 1,2-диметилпропилсульфонил, 2,2-диметилпропилсульфонил, 1-этилпропилсульфонил, 10  
гексилсульфонил, 1-метилпентилсульфонил, 2-метилпентилсульфонил, 3-метилпентилсульфонил, 4-метилпентилсульфонил, 1,1-диметилбутилсульфонил, 1,2-диметилбутилсульфонил, 1,3-диметилбутилсульфонил, 2,2-диметилбутилсульфонил, 2,3-диметилбутилсульфонил, 3,3-диметилбутилсульфонил, 1-этилбутилсульфонил, 15  
2-этилбутилсульфонил, 1,1,2-триметил-пропилсульфонил, 1,2,2-триметилпропилсульфонил, 1-этил-1-метилпропилсульфонил и 1-этил-2-метилпропилсульфонил;

20 - (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил)амино: например, метиламино, этиламино, пропиламино, 1-метилэтиламино, бутиламино, 1-метилпропиламино, 2-метилпропиламино или 1,1-диметилэтиламино;

25 - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)амино, а также (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)амино фрагмент в (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)амино-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкиле: (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил)амино, как указано выше, а также, например, пентиламино, 1-метилбутиламино, 2-метилбутиламино, 3-метилбутиламино, 2,2-диметилпропиламино, 1-этилпропиламино, гексиламино, 25  
1,1-диметилпропиламино, 1,2-диметилпропиламино, 1-метилпентиламино, 2-метилпентиламино, 3-метилпентиламино, 4-метилпентиламино, 1,1-диметилбутиламино, 1,2-диметилбутиламино, 1,3-диметилбутиламино, 2,2-диметилбутиламино, 2,3-диметилбутил-амино 3,3-диметилбутиламино, 1-этилбутиламино, 2-этилбутиламино, 1,1,2-триметилпропиламино, 1,2,2-триметил-пропиламино, 1-этил-1-метилпропиламино или 1-этил-2-метилпропиламино;

30 - ди(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил)амино: например, N,N-диметиламино, N,N-диэтиламино, N,N-ди(1-метилэтил)амино, N,N-дипропиламино, N,N-дибутиламино, N,N-ди(1-метилпропил)амино, N,N-ди(2-метилпропил)амино,

N,N-ди(1,1-диметилэтил)амино, N-этил-N-метиламино, N-метил-N-пропиламино, N-метил-N-(1-метилэтил)амино, N-бутил-N-метиламино, N-метил-N-(1-метилпропил)амино, N-метил-N-(2-метилпропил)амино, N-(1,1-диметилэтил)-N-метиламино, N-этил-N-пропиламино, N-этил-N-(1-метилэтил)амино, N-бутил-N-этиламино, N-этил-N-(1-метилпропил)амино, N-этил-N-(2-метилпропил)амино, N-этил-N-(1,1-диметилэтил)амино, N-(1-метилэтил)-N-пропиламино, N-бутил-N-пропиламино, N-(1-метилпропил)-N-пропиламино, N-(2-метилпропил)-N-пропиламино, N-(1,1-диметилэтил)-N-пропиламино, N-бутил-N-(1-метилэтил)амино, N-(1-метилэтил)-N-(1-метилпропил)амино, N-(1-метилэтил)-N-(2-метилпропил)амино, N-(1,1-диметилэтил)-N-(1-метилэтил)амино, N-бутил-N-(1-метилпропил)амино, N-бутил-N-(2-метилпропил)амино, N-бутил-N-(1,1-диметилэтил)амино, N-(1-метилпропил)-N-(2-метилпропил)амино, N-(1,1-диметилэтил)-N-(1-метилпропил)амино или N-(1,1-диметилэтил)-N-(2-метилпропил)амино;

15           -     ди(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)амино, а также ди(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)амино фрагмент ди(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)амино-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила: ди(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил)амино, как указано выше, а также, например, N-метил-N-пентиламино, N-метил-N-(1-метилбутил)амино, N-метил-N-(2-метилбутил)амино, N-метил-N-(3-метилбутил)амино, N-метил-N-(2,2-диметилпропил)амино, N-метил-N-(1-этилпропил)амино, N-метил-N-гексиламино, N-метил-N-(1,1-диметилпропил)амино, N-метил-N-(1,2-диметилпропил)амино, N-метил-N-(1-метилпентил)амино, N-метил-N-(2-метилпентил)амино, N-метил-N-(3-метилпентил)амино, N-метил-N-(4-метилпентил)амино, N-метил-N-(1,1-диметилбутил)амино, N-метил-N-(1,2-диметилбутил)амино, N-метил-N-(1,3-диметилбутил)амино, N-метил-N-(2,2-диметилбутил)амино, N-метил-N-(2,3-диметилбутил)амино, N-метил-N-(3,3-диметилбутил)амино, N-метил-N-(1-этилбутил)амино, N-метил-N-(2-этилбутил)амино, N-метил-N-(1,1,2-триметилпропил)амино, N-метил-N-(1,2,2-триметилпропил)амино, N-метил-N-(1-этил-1-метилпропил)амино, N-метил-N-(1-этил-2-метилпропил)амино, N-этил-N-пентиламино, N-этил-N-(1-метилбутил)амино, N-этил-N-(2-метилбутил)амино, N-этил-N-(3-метилбутил)амино, N-этил-N-(2,2-диметилпропил)амино, N-этил-N-(1-этилпропил)амино, N-этил-N-гексиламино, N-этил-N-(1,1-диметилпропил)амино, N-этил-N-(1,2-диметилпропил)амино, N-этил-N-(1-метилпентил)амино, N-этил-N-(2-метилпентил)амино, N-этил-N-(3-

20

25

30

метилпентил)амино, N-этил-N-(4-метилпентил)амино, N-этил-N-(1,1-  
диметилбутил)амино, N-этил-N-(1,2-диметилбутил)амино, N-этил-N-(1,3-  
диметилбутил)амино, N-этил-N-(2,2-диметилбутил)амино, N-этил-N-(2,3-  
диметилбутил)амино, N-этил-N-(3,3-диметилбутил)амино, N-этил-N-(1-  
5 этилбутил)амино, N-этил-N-(2-этилбутил)амино, N-этил-N-(1,1,2-  
триметилпропил)амино, N-этил-N-(1,2,2-триметилпропил)амино, N-этил-N-(1-  
этил-1-метилпропил)амино, N-этил-N-(1-этил-2-метилпропил)амино, N-пропил-  
N-пентиламино, N-бутил-N-пентиламино, N,N-дипентиламино, N-пропил-N-  
гексиламино, N-бутил-N-гексиламино, N-пентил-N-гексиламино или N,N-  
10 дигексиламино;

- C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкил, а также циклоалкильные фрагменты C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-  
циклоалкил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила: моноциклические насыщенные углеводороды,  
имеющие от 3 до 6 членов кольца, такие как циклопропил, циклобутил,  
циклопентил и циклогексил;

15 - C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-гетероциклил, а также гетероциклильные фрагменты C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-  
гетероциклил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила: алифатический гетероцикл, имеющий от 3 до 6  
членов кольца, который помимо атомов углерода содержит от 1 до 4 атомов  
азота, или от 1 до 3 атомов азота и атом кислорода или серы, или атом кислорода  
или серы, например,

20 трех- или четырехчленные гетероциклы, такие как 2-оксетанил, 3-  
оксетанил, 2-тиетанил, 3-тиетанил, 1-азетидинил, 2-азетидинил, 1-азетинил, 2-  
азетинил; пятичленные насыщенные гетероциклы, такие как 2-  
тетрагидрофуранил, 3-тетрагидрофуранил, 2-тетрагидротиенил, 3-  
тетрагидротиенил, 1-пирролидинил, 2-пирролидинил, 3-пирролидинил, 3-  
25 изоксазолидинил, 4-изоксазолидинил, 5-изоксазолидинил, 2-изотиазолидинил, 3-  
изотиазолидинил, 4-изотиазолидинил, 5-изотиазолидинил, 1-пиразолидинил, 3-  
пиразолидинил, 4-пиразолидинил, 5-пиразолидинил, 2-оксазолидинил, 4-  
оксазолидинил, 5-оксазолидинил, 2-тиазолидинил, 4-тиазолидинил, 5-  
тиазолидинил, 1-имидазолидинил, 2-имидазолидинил, 4-имидазолидинил, 3-  
30 оксазолидинил, 1,2,4-оксадиазолидин-3-ил, 1,2,4-оксадиазолидин-5-ил, 3-  
тиазолидинил, 1,2,4-тиадиазолидин-3-ил, 1,2,4-тиадиазолидин-5-ил, 1,2,4-  
триазолидин-3-ил, 1,2,4-оксадиазолидин-2-ил, 1,2,4-оксадиазолидин-4-ил, 1,3,4-  
оксадиазолидин-2-ил, 1,2,4-тиадиазолидин-2-ил, 1,2,4-тиадиазолидин-4-ил, 1,3,4-  
тиадиазолидин-2-ил, 1,2,4-триазолидин-1-ил, 1,3,4-триазолидин-2-ил;

шестичленные насыщенные гетероциклы, такие как 1-пиперидинил, 2-пиперидинил, 3-пиперидинил, 4-пиперидинил, 1,3-диоксан-5-ил, 1,4-диоксанил, 1,3-дитиан-5-ил, 1,3-дитианил, 1,3-оксатиан-5-ил, 1,4-оксатианил, 2-тетрагидропиранил, 3-тетрагидропиранил, 4-тетрагидропиранил, 2-тетрагидротиопиранил, 3-тетрагидротиопиранил, 4-тетрагидротиопиранил, 1-гексагидропиридазинил, 3-гексагидропиридазинил, 4-гексагидропиридазинил, 1-гексагидропиримидинил, 2-гексагидропиримидинил, 4-гексагидропиримидинил, 5-гексагидропиримидинил, 1-пиперазинил, 2-пиперазинил, 1,3,5-гексагидротриазин-1-ил, 1,3,5-гексагидротриазин-2-ил, 1,2,4-гексагидротриазин-1-ил, 1,2,4-гексагидротриазин-3-ил, тетрагидро-1,3-оксазин-1-ил, тетрагидро-1,3-оксазин-2-ил, тетрагидро-1,3-оксазин-6-ил, 1-морфолинил, 2-морфолинил, 3-морфолинил;

- 5- или 6-членный гетероарил: ароматический гетероарил, имеющий 5 или 6 членов кольца, который помимо атомов углерода содержит от 1 до 4 атомов азота, или от 1 до 3 атомов азота и атом кислорода или серы, или атом кислорода или серы, например, 5-членные ароматические кольца типа фурила (например, 2-фурил, 3-фурил), тиенил (например, 2-тиенил, 3-тиенил), пирролил (например, пиррол-2-ил, пиррол-3-ил), пиразолил (например, пиразол-3-ил, пиразол-4-ил), изоксазолил (например, изоксазол-3-ил, изоксазол-4-ил, изоксазол-5-ил), изотиазолил (например, изотиазол-3-ил, изотиазол-4-ил, изотиазол-5-ил), имидазолил (например, имидазол-2-ил, имидазол-4-ил), оксазолил (например, оксазол-2-ил, оксазол-4-ил, оксазол-5-ил), тиазолил (например, тиазол-2-ил, тиазол-4-ил, тиазол-5-ил), оксадиазолил (например, 1,2,3-оксадиазол-4-ил, 1,2,3-оксадиазол-5-ил, 1,2,4-оксадиазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-5-ил, 1,3,4-оксадиазол-2-ил), тиадиазолил (например, 1,2,3-тиадиазол-4-ил, 1,2,3-тиадиазол-5-ил, 1,2,4-тиадиазол-3-ил, 1,2,4-тиадиазол-5-ил, 1,3,4-тиадиазолил-2-ил), триазолил (например, 1,2,3-триазол-4-ил, 1,2,4-триазол-3-ил); 1-тетразолил; 6-членные ароматические кольца, такие как пиридил (например, пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил), пиразинил (например, пиридазин-3-ил, пиридазин-4-ил), пиримидинил (например, пиримидин-2-ил, пиримидин-4-ил, пиримидин-5-ил), пиразин-2-ил, триазинил (например, 1,3,5-триазин-2-ил, 1,2,4-триазин-3-ил, 1,2,4-триазин-5-ил, 1,2,4-триазин-6-ил);

- от 3- до 7-членный карбоцикл: трех-семичленный моноциклический, насыщенный, частично ненасыщенный или ароматический цикл, имеющий от

трех до семи членов кольца, который содержит помимо атомов углерода необязательно один или два члена кольца, выбранных из группы, состоящей из  $-N(R^{12})-$ ,  $-N=N-$ ,  $-C(=O)-$ ,  $-O-$  и  $-S-$ .

5 Предпочтительные варианты осуществления изобретения, упомянутые ниже, следует понимать как предпочтительные либо независимо друг от друга, либо в сочетании друг с другом.

10 В соответствии с предпочтительным вариантом осуществления изобретения предпочтение также отдают тем фенилурацилам формулы (I), в которой переменные, независимо друг от друга или в сочетании друг с другом, имеют следующие значения:

Предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^1$  представляет собой  $C_1$ - $C_4$ -алкил; предпочтительно представляет собой  $CH_3$ .

15 Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^2$  представляет собой H, галоген или  $C_1$ - $C_4$ -алкил; предпочтительно представляет собой H, F, Cl, или  $CH_3$ ; более предпочтительно представляет собой H или F; особенно предпочтительно представляет собой H; также особенно предпочтительно представляет собой F.

20 Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^2$  представляет собой H или галоген; предпочтительно представляет собой галоген; более предпочтительно представляет собой F.

25 Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^3$  представляет собой H, галоген или  $C_1$ - $C_4$ -алкил; предпочтительно представляет собой H, F, Cl или  $CH_3$ ; более предпочтительно представляет собой H или F; особенно предпочтительно представляет собой H; также особенно предпочтительно представляет собой F.

30 Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^3$  представляет собой галоген; предпочтительно представляет собой F.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^4$  представляет собой H, F или Cl;

- особенно предпочтительно представляет собой H или F;  
особенно предпочтительно представляет собой H;  
также особенно предпочтительно представляет собой H или Cl;  
особенно предпочтительно представляет собой Cl;
- 5 также особенно предпочтительно представляет собой F или Cl;  
особенно предпочтительно представляет собой F.  
Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^4$  представляет собой галоген;  
предпочтительно представляет собой F.
- 10 Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^5$  представляет собой галоген или CN;  
предпочтительно F, Cl, Br или CN;  
особенно предпочтительным является Cl, Br или CN;  
особенно предпочтительным является Cl или Br;
- 15 более предпочтительным является Cl;  
также более предпочтительным является Br;  
Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^5$  представляет собой галоген;  
предпочтительно представляет собой Cl.
- 20 Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^6$  представляет собой H, F, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкил или C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкокси;  
особенно предпочтительно представляет собой H, CH<sub>3</sub> или OCH<sub>3</sub>;  
особенно предпочтительным является H.  
Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой
- 25  $R^7$  представляет собой H, CH<sub>3</sub> или OCH<sub>3</sub>;  
особенно предпочтительно представляет собой H или OCH<sub>3</sub>;  
особенно предпочтительным является H;  
также особенно предпочтительным является OCH<sub>3</sub>.  
Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой
- 30  $R^7$  представляет собой H или C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкокси;  
предпочтительно представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкокси.  
Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^8$  представляет собой OR<sup>9</sup>, SR<sup>9</sup>, NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, NR<sup>9</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>10</sup> или NR<sup>9</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>;

особенно предпочтительно представляет собой  $OR^9$ ,  $NR^{10}R^{11}$ ,  $NR^9S(O)_2R^{10}$  или  $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ ;

особенно предпочтительным является  $OR^9$ ,  $NR^9S(O)_2R^{10}$  или  $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ ;

5 особенно предпочтительным является  $OR^9$  или  $NR^9S(O)_2R^{10}$ ;  
более предпочтительным является  $OR^9$ .

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^9$  представляет собой водород,  $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -алкенил,  $C_3$ - $C_6$ -алкинил,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкил,  $C_3$ - $C_6$ -галогеналкенил,  $C_3$ - $C_6$ -галогеналкинил,  $C_1$ -  
10  $C_6$ -цианоалкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -  
алкил, ди( $C_1$ - $C_6$ -алкокси) $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -  
алкенилокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -галогеналкенилокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -  
алкенилокси- $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкилтио- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -  
алкилсульфинил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкилсульфонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -  
15 алкилкарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкоксикарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -  
галогеналкоксикарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -алкенилоксикарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  
 $C_3$ - $C_6$ -алкинилоксикарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил, amino, ( $C_1$ - $C_6$ -алкил)амино, ди( $C_1$ - $C_6$ -  
алкил)амино, ( $C_1$ - $C_6$ -алкилкарбонил)амино, amino- $C_1$ - $C_6$ -алкил, ( $C_1$ - $C_6$ -  
алкил)амино- $C_1$ - $C_6$ -алкил, ди( $C_1$ - $C_6$ -алкил)амино- $C_1$ - $C_6$ -алкил, аминокарбонил-  
20  $C_1$ - $C_6$ -алкил, ( $C_1$ - $C_6$ -алкил)аминокарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил, ди( $C_1$ - $C_6$ -  
алкил)аминокарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,



где  $R^{12}$  и  $R^{13}$  независимо друг от друга представляют собой H,  $C_1$ - $C_4$ -алкил или фенил;

25  $C_3$ - $C_6$ -циклоалкил,  $C_3$ - $C_6$ -циклоалкил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -гетероциклил,  
фенил, фенил- $C_1$ - $C_4$ -алкил или 5- или 6-членный гетероарил,

где каждое циклоалкильное, гетероциклильное, фенильное или гетероарильное кольцо может быть замещено одним-четырьмя заместителями, выбранными из  $R^{14}$  или 3-7-членного карбоцикла,

30 причем карбоцикл дополнительно к атомам углерода необязательно имеет один или два члена кольца, выбранных из группы, состоящей из  $-N(R^{12})-$ ,  $-N=N-$ ,  $-C(=O)-$ ,  $-O-$  и  $-S-$ , и

при этом карбоцикл необязательно замещен одним-четырьмя заместителями, выбранными из  $R^{14}$ ,

где R<sup>14</sup> представляет собой галоген, NO<sub>2</sub>, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксикарбонил;

предпочтительно представляет собой водород, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкинил или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкил;

5 в частности, предпочтительно представляет собой водород, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкенил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкинил;

в особенности предпочтительно представляет собой водород или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил;

более предпочтительно представляет собой водород, CH<sub>3</sub> или C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>.

10 Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой R<sup>9</sup> представляет собой H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-цианоалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-гетероциклил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил;

предпочтительно представляет собой H, CH<sub>3</sub>, C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, CH<sub>2</sub>CN, C<sub>2</sub>H<sub>4</sub>OSCH<sub>3</sub> или CH<sub>2</sub>-2-тетрагидрофуранил.

15 Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой R<sup>9</sup> представляет собой водород, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил;

предпочтительно представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил;

20 особенно предпочтительно представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой R<sup>10</sup> представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси;

особенно предпочтительно представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил;

более предпочтительным является CH<sub>3</sub>.

25 Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой R<sup>11</sup> представляет собой H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкоксикарбонил-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил;

особенно предпочтительно представляет собой H или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил;

более предпочтительно представляет собой H;

30 также более предпочтительно представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой R<sup>12</sup> представляет собой фенил или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил;

более предпочтительным является фенил или CH<sub>3</sub>;

также особенно предпочтительным является фенил;

также особенно предпочтительным является  $C_1$ - $C_4$ -алкил.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^{13}$  представляет собой фенил или  $C_1$ - $C_4$ -алкил;

особенно предпочтительным является фенил или  $CH_3$ ;

5 также особенно предпочтительным является фенил;

также особенно предпочтительным является  $C_1$ - $C_4$ -алкил.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $R^{14}$  представляет собой галоген или  $C_1$ - $C_6$ -алкил;

особенно предпочтительным является F, Cl или  $CH_3$ ;

10 также особенно предпочтительным является галоген;

особенно предпочтительным является F или Cl;

также особенно предпочтительным является  $C_1$ - $C_6$ -алкил;

особенно предпочтительным является  $CH_3$ .

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $n$  означает 1 или 2;

15 особенно предпочтительным является 2;

также особенно предпочтительным является 1.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой Q означает O,

20 также предпочтительно представляет собой S.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой W означает O,

также предпочтительно представляет собой S.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой X означает O,

25 также предпочтительно представляет собой S.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $Y^1$  представляет собой O,

также предпочтительно представляет собой S.

30 Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой  $Y^2$  представляет собой O,

также предпочтительно представляет собой S.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой Z представляет собой  $CH$ ,

также предпочтительно представляет собой N.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой

R<sup>1</sup> представляет собой CH<sub>3</sub>;

R<sup>2</sup> представляет собой F;

5 R<sup>3</sup> представляет собой F;

R<sup>4</sup> представляет собой F;

R<sup>5</sup> представляет собой Cl или Br;

R<sup>6</sup> представляет собой H;

R<sup>7</sup> представляет собой H или OCH<sub>3</sub>;

10 R<sup>8</sup> представляет собой OR<sup>9</sup>, где R<sup>9</sup> представляет собой H, CH<sup>3</sup> или C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

n означает 1

Q, W, X, Y<sup>1</sup> и Y<sup>2</sup> представляют собой O.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой

R<sup>1</sup> представляет собой CH<sub>3</sub>;

15 R<sup>2</sup> представляет собой F;

R<sup>3</sup> представляет собой F;

R<sup>4</sup> представляет собой F;

R<sup>5</sup> представляет собой Cl или Br;

R<sup>6</sup> представляет собой H;

20 R<sup>7</sup> представляет собой H;

R<sup>8</sup> представляет собой OR<sup>9</sup>, где R<sup>9</sup> представляет собой H, CH<sup>3</sup> или C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

n представляет собой 1

Q, W, X, Y<sup>1</sup> и Y<sup>2</sup> представляют собой O.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой

25 R<sup>1</sup> представляет собой CH<sub>3</sub>;

R<sup>2</sup> представляет собой F;

R<sup>3</sup> представляет собой F;

R<sup>4</sup> представляет собой F;

R<sup>5</sup> представляет собой Cl;

30 R<sup>6</sup> представляет собой H;

R<sup>7</sup> представляет собой H;

R<sup>8</sup> представляет собой OR<sup>9</sup>,

где R<sup>9</sup> представляет собой водород, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил;

предпочтительно представляет собой  $C_1$ - $C_6$ -алкил или  $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил;

особенно предпочтительным является  $C_1$ - $C_6$ -алкил;

$n$  означает 1

5 Q, W, X,  $Y^1$  и  $Y^2$  представляют собой O.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой

$R^1$  представляет собой  $CH_3$ ;

$R^2$  представляет собой F;

$R^3$  представляет собой F;

10  $R^4$  представляет собой F;

$R^5$  представляет собой Cl или Br;

$R^6$  представляет собой H;

$R^7$  представляет собой  $OCH_3$ ;

$R^8$  представляет собой  $OR^9$ ,

15 где  $R^9$  представляет собой H,  $CH^3$  или  $C_2H_5$ ;

$n$  означает 1

Q, W, X,  $Y^1$  и  $Y^2$  представляют собой O.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой

$R^1$  представляет собой  $CH_3$ ,  $C_2$ - $C_4$ -алкенил или  $C_2$ - $C_4$ -алкинил;

20  $R^2$  представляет собой H, F,  $C_1$ - $C_4$ -алкил,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкил,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси или  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси;

$R^3$  представляет собой H, F,  $C_1$ - $C_4$ -алкил,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкил,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси или  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси;

предпочтительно

25  $R^1$  представляет собой  $CH_3$ ;

$R^2$  представляет собой H, F;

$R^3$  представляет собой F;

особенно предпочтительно

$R^1$  представляет собой  $CH_3$ ;

30  $R^2$  представляет собой F;

$R^3$  представляет собой F.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой

$R^1$  представляет собой  $CH_3$ ,  $C_2$ - $C_4$ -алкенил или  $C_2$ - $C_4$ -алкинил;

$R^2$  представляет собой H, F, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси;

$R^3$  представляет собой H, F, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси;

5  $Z$  представляет собой CH;

предпочтительно

$R^1$  представляет собой CH<sub>3</sub>;

$R^2$  представляет собой H, F;

$R^3$  представляет собой F;

10  $Z$  представляет собой CH.

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I), в которой

$R^1$  представляет собой CH<sub>3</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкенил или C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкинил;

$R^2$  представляет собой H, F, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси;

15  $R^3$  представляет собой H, F, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси;

$Z$  представляет собой N;

предпочтительно

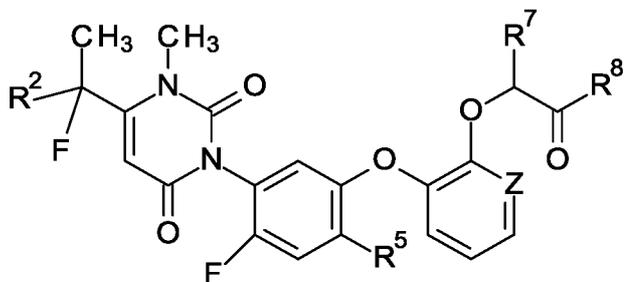
$R^1$  представляет собой CH<sub>3</sub>;

20  $R^2$  представляет собой H, F;

$R^3$  представляет собой F;

$Z$  представляет собой N.

Предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I.1) (соответствует формуле (I), в которой  $R^1$  представляет собой CH<sub>3</sub>,  $R^3$  и  $R^4$  представляют собой F,  $R^6$  представляет собой H,  $n$  означает 1, Q, W, X,  $Y^1$  и  $Y^2$  представляют собой O),



(I.1)  
= формула (I), где  $R^1 = CH_3$ ,  
 $R^3$  и  $R^4 = F$ ,  $R^6 = H$ ,  $n = 1$ ,  
Q, W, X,  $Y^1$  и  $Y^2 = O$

где

$R^2$  представляет собой H или галоген,

$R^5$  представляет собой галоген;

$R^7$  представляет собой H или  $C_1$ - $C_3$ -алкокси;

$R^8$  представляет собой  $OR^9$ , где

5  $R^9$  представляет собой H,  $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -цианоалкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил или  $C_3$ - $C_6$ -гетероциклил- $C_1$ - $C_6$ -алкил;

Z представляет собой CH или N;

Особенно предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I.1), где

$R^2$  представляет собой H или F,

$R^5$  представляет собой Cl или Br;

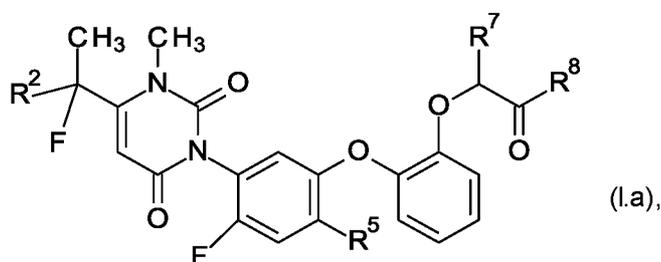
10  $R^7$  представляет собой H или  $OCH_3$ ;

$R^8$  представляет собой  $OR^9$ , где

$R^9$  представляет собой H,  $CH_3$ ,  $C_2H_5$ ,  $CH_2CN$ ,  $C_2H_4OCH_3$  или  $CH_2$ -2-тетрагидрофуранил;

Z представляет собой CH или N.

15 Особое предпочтение отдают фенилурацилам формулы (I.a) (соответствует формуле (I), в которой  $R^1$  представляет собой  $CH_3$ ,  $R^3$  и  $R^4$  представляют собой F,  $R^6$  означает H, n означает 1, Q, W, X,  $Y^1$  и  $Y^2$  представляют собой O и Z представляет собой CH),



20

где переменные  $R^2$ ,  $R^5$ ,  $R^7$  и  $R^8$  имеют значения, в частности предпочтительные значения, определенные выше.

Особое предпочтение отдают фенилурацилам формул (I.a.1) - (I.a.168), предпочтительно (I.a.1) - (I.a.144), из таблицы A, где определения переменных  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^7$  и  $R^8$  имеют особое значение для соединений в соответствии с изобретением не только в сочетании друг с другом, но в каждом случае также и сами по себе:

25

Таблица A

№	$R^2$	$R^5$	$R^7$	$R^8$
---	-------	-------	-------	-------

№	R <sup>2</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
I.a.1.	H	F	H	OH
I.a.2.	H	F	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.3.	H	F	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.4.	H	F	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.5.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.6.	H	F	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.7.	H	F	CH <sub>3</sub>	OH
I.a.8.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.9.	H	F	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.10.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.11.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.12.	H	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.13.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.14.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.15.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.16.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.17.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.18.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.19.	H	Cl	H	OH
I.a.20.	H	Cl	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.21.	H	Cl	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.22.	H	Cl	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.23.	H	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.24.	H	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.25.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	OH
I.a.26.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.27.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.28.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.29.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.30.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.31.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.32.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.33.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.34.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.35.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.36.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.37.	H	Br	H	OH
I.a.38.	H	Br	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.39.	H	Br	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.40.	H	Br	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

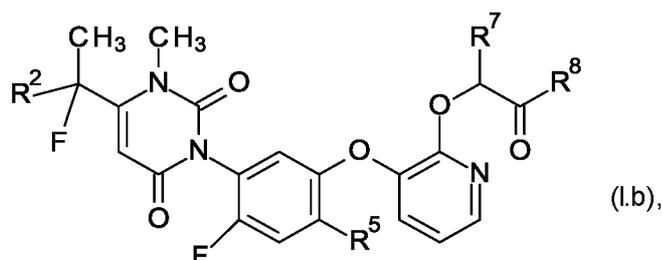
№	R <sup>2</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
I.a.41.	H	Br	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.42.	H	Br	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.43.	H	Br	CH <sub>3</sub>	OH
I.a.44.	H	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.45.	H	Br	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.46.	H	Br	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.47.	H	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.48.	H	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.49.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.50.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.51.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.52.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.53.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.54.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.55.	H	CN	H	OH
I.a.56.	H	CN	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.57.	H	CN	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.58.	H	CN	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.59.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.60.	H	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.61.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OH
I.a.62.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.63.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.64.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.65.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.66.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.67.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.68.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.69.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.70.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.71.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.72.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.73.	F	F	H	OH
I.a.74.	F	F	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.75.	F	F	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.76.	F	F	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.77.	F	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.78.	F	F	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.79.	F	F	CH <sub>3</sub>	OH
I.a.80.	F	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>

№	R <sup>2</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
I.a.81.	F	F	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.82.	F	F	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.83.	F	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.84.	F	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.85.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.86.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.87.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.88.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.89.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.90.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.91.	F	Cl	H	OH
I.a.92.	F	Cl	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.93.	F	Cl	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.94.	F	Cl	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.95.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.96.	F	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.97.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OH
I.a.98.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.99.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.100.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.101.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.102.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.103.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.104.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.105.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.106.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.107.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.108.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.109.	F	Br	H	OH
I.a.110.	F	Br	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.111.	F	Br	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.112.	F	Br	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.113.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.114.	F	Br	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.115.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OH
I.a.116.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.117.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.118.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.119.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.120.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

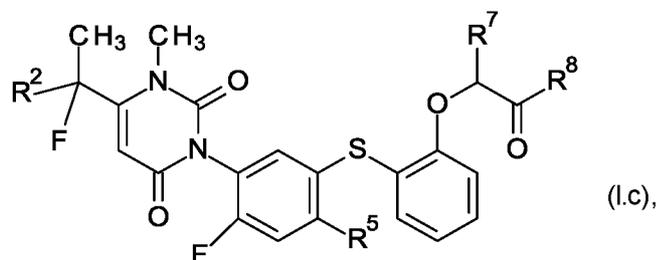
№	R <sup>2</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
I.a.121.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.122.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.123.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.124.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.125.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.126.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.127.	F	CN	H	OH
I.a.128.	F	CN	H	OCH <sub>3</sub>
I.a.129.	F	CN	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.130.	F	CN	H	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.131.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.132.	F	CN	H	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.133.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OH
I.a.134.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.135.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.136.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.137.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.138.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.139.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OH
I.a.140.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
I.a.141.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
I.a.142.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.143.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
I.a.144.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
I.a.145.	H	F	H	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.146.	H	F	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.147.	H	F	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.148.	H	Cl	H	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.149.	H	Cl	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.150.	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.151.	H	Br	H	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.152.	H	Br	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.153.	H	Br	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.154.	H	CN	H	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.155.	H	CN	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.156.	H	CN	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.157.	F	F	H	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.158.	F	F	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.159.	F	F	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.160.	F	Cl	H	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>

№	R <sup>2</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
I.a.161.	F	Cl	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.162.	F	Cl	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.163.	F	Br	H	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.164.	F	Br	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.165.	F	Br	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.166.	F	CN	H	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.167.	F	CN	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>
I.a.168.	F	CN	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>

Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I.b), особенно предпочтительны фенилурацилы формул (I.b.1) - (I.b.168), более предпочтительно (I.b.1) - (I.b.144), которые отличаются от соответствующих фенилурацилов формул (I.a.1) - (I.a.168), предпочтительно (I.a.1) - (I.a.144), только тем, что Z представляет собой N:

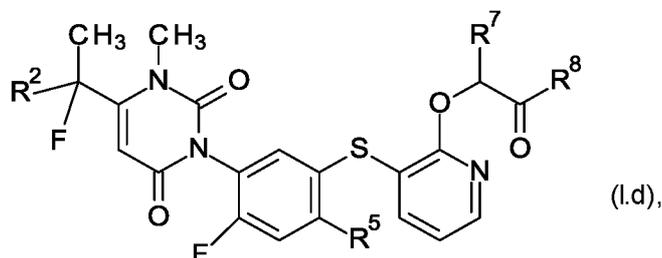


Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I.c), особенно предпочтительны фенилурацилы формул (I.c.1) - (I.c.168), более предпочтительно (I.c.1) - (I.c.144), которые отличаются от соответствующих фенилурацилов формул (I.a.1) - (I.a.168), предпочтительно (I.a.1) - (I.a.144), только тем, что X представляет собой S:

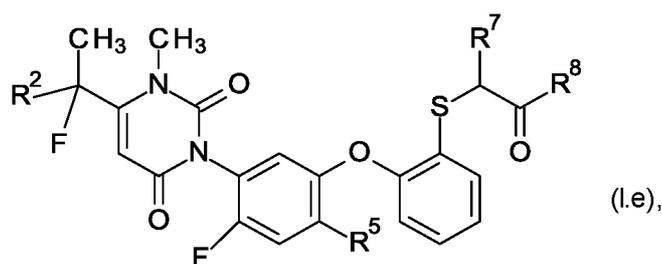


Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I.d), особенно предпочтительны фенилурацилы формул (I.d.1) - (I.d.168), более

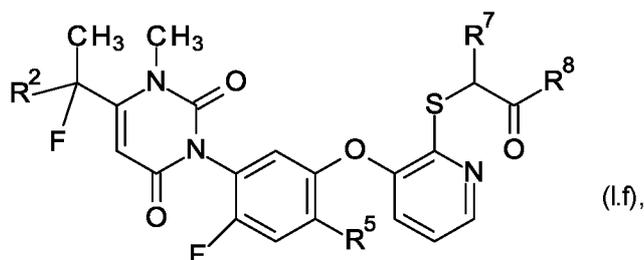
предпочтительно (I.d.1) - (I.d.144), которые отличаются от соответствующих фенилурацилов формул (I.a.1) - (I.a.168), предпочтительно (I.a.1) - (I.a.144), только тем, что X представляет собой S и Z представляет собой N:



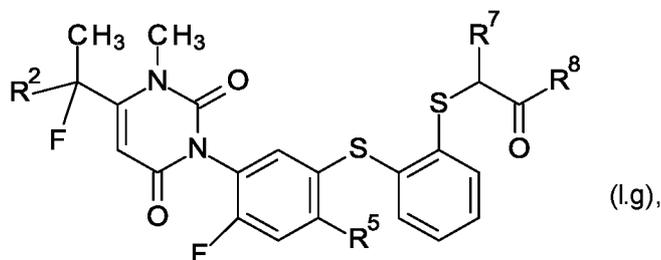
5 Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I.e), особенно предпочтительны фенилурацилы формул (I.e.1) - (I.e.168), более предпочтительно (I.e.1) - (I.e.144), которые отличаются от соответствующих фенилурацилов формул (I.a.1) - (I.a.168), предпочтительно (I.a.1) - (I.a.144),  
10 только тем, что Q представляет собой S:



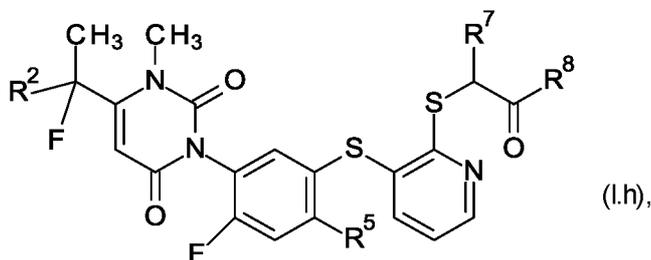
15 Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I.f), особенно предпочтительны фенилурацилы формул (I.f.1) - (I.f.168), более предпочтительно (I.f.1) - (I.f.144), которые отличаются от соответствующих фенилурацилов формул (I.a.1) - (I.a.168), предпочтительно (I.a.1) - (I.a.144), только тем, что Q представляет собой S и Z представляет собой N:



Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I.g),  
особенно предпочтительны фенилурацилы формул (I.g.1) - (I.g.168), более  
предпочтительно (I.g.1) - (I.g.144), которые отличаются от соответствующих  
фенилурацилов формул (I.a.1) - (I.a.168), предпочтительно (I.a.1) - (I.a.144),  
5 только тем, что X и Q представляют собой S:



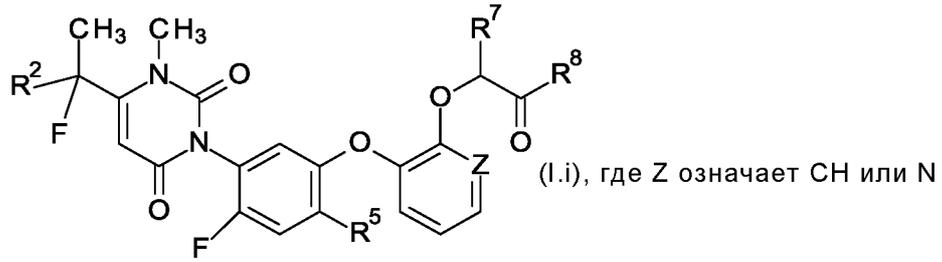
Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I.h),  
особенно предпочтительны фенилурацилы формул (I.h.1) - (I.h.168), более  
10 предпочтительно (I.h.1) - (I.h.144), которые отличаются от соответствующих  
фенилурацилов формул (I.a.1) - (I.a.168), предпочтительно (I.a.1) - (I.a.144),  
только тем, что X и Q представляют собой S и Z представляет собой N:



15 Также предпочтительными являются фенилурацилы формулы (I.i), в  
которой Z представляет собой CH или N, то есть являясь фенилурацилами  
формул (I.a) и (I.b), как определено выше,

особенно предпочтительны фенилурацилы формул (I.i.1) - (I.i.168), где Z  
представляет собой CH или N, i то есть являясь фенилурацилами формул (I.a.1) -  
20 (I.a.168) и (I.b.1) - (I.b.144), как определено выше;

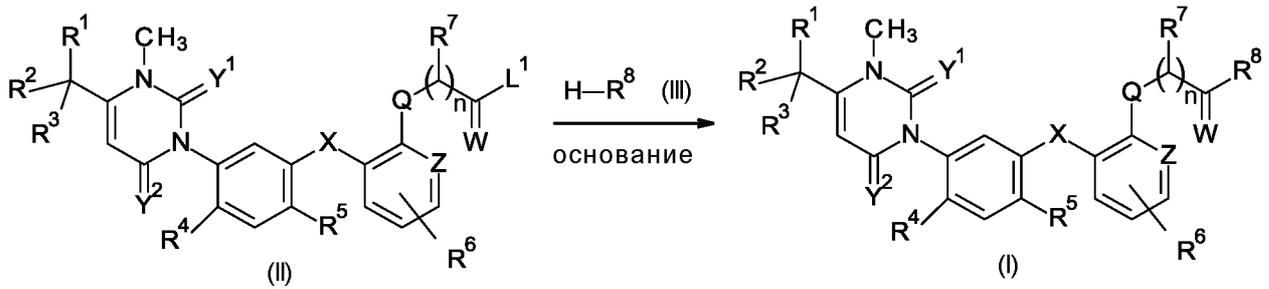
более предпочтительными являются фенилурацилы формул (I.i.1) - (I.i.144),  
где Z представляет собой CH или N, то есть являясь фенилурацилами формул  
(I.a.1) - (I.a.144) и (I.b.1) - (I.b.144), как определено выше:



Фенилурацилы формулы (I) в соответствии с изобретением могут быть  
получены с помощью стандартных способов органической химии, например,  
5 посредством следующих способов:

Способ А)

Урацилпиридины формулы (I) получают из галогенангидридов формулы  
(II) путем реакции с соединениями формулы (III) в присутствии основания:



10

В галогенангиридах формулы (II)  $L^1$  представляет собой галоген;  
предпочтительным является F, Cl или Br; особенно предпочтительным является  
F или Cl, более предпочтительным является Cl.

15 Вместо галогенангидридов формулы (II) также можно использовать  
соответствующую кислоту (например, галогенангидрид формулы (II), где  $L^1$   
представляет собой OH в сочетании с активирующим реагентом, таким как  
карбонилдиимдазол, N,N'-дициклогексилкарбодиимид (DCC), 1-этил-3-(3-  
диметиламинопропил)карбодиимид (EDC) или хлорид N-метил-2-  
20 хлорпиридиния. Условия реакции являются такими же, как описано для  
галогенангидридов формулы (II).

Соединения (III) можно использовать также в виде их солей, в частности  
солей натрия и калия, причем в этом случае присутствие основания не является  
необходимым.

Реакцию галогенангидридов (II) с соединениями (III) обычно проводят от 0 °С до температуры кипения реакционной смеси, предпочтительно от 0 °С до 100 °С, особенно предпочтительно от 0 °С до 40 °С, в инертном органическом растворителе в присутствии основания.

5 Реакцию в принципе можно проводить в веществе. Однако предпочтение отдают реакции галогенангидридов (II) с соединениями (III) в органическом растворителе. В принципе пригодны все растворители, которые способны растворять галогенангидриды (II) и соединения (III) по меньшей мере частично, а предпочтительно полностью в условиях реакции.

10 Примерами подходящих растворителей являются алифатические углеводороды, такие как пентан, гексан, циклогексан, нитрометан и смеси C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>-алканов; ароматические углеводороды, такие как бензол, хлорбензол, толуол, крезолы, *o*-, *m*- и *p*-ксилолы; галогенированные углеводороды, такие как дихлорметан, 1,2-дихлорэтан, хлороформ, четыреххлористый углерод и  
15 хлорбензол; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, *трет*-бутилметилвый эфир (ТВМЕ), диоксан, анизол и тетрагидрофуран (ТГФ); сложные эфиры, такие как этилацетат и бутилацетат; нитрилы, такие как ацетонитрил и пропионитрил; кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, диэтилкетон, *трет*-бутилметилкетон, циклогексанон; диполярные апротонные  
20 растворители, такие как сульфолан, диметилсульфоксид, N,N-диметилформамид (DMF), N,N-диметилацетамид (DMAC), 1,3-диметил-2-имидазолидинон (DMI), N,N'-диметилпропиленмочевина (DMPU), диметилсульфоксид (ДМСО) и 1-метил-2-пирролидинон (NMP).

25 Предпочтительными растворителями являются галогенированные углеводороды, простые эфиры и диполярные апротонные растворители, как указано выше.

Также возможно использовать смеси упомянутых растворителей.

Примеры подходящих оснований включают металлосодержащие основания и азотсодержащие основания.

30 Примерами подходящих металлосодержащих оснований являются неорганические соединения, такие как оксиды щелочных и щелочноземельных металлов, а также оксиды других металлов, такие как оксид лития, оксид натрия, оксид калия, оксид магния, оксид кальция и оксид магния, оксид железа, оксид серебра; гидриды щелочных и щелочноземельных металлов, такие как гидрид

лития, гидрид натрия, гидрид калия и гидрид кальция; карбонаты щелочных и щелочноземельных металлов, такие как карбонат лития, карбонат натрия, карбонат калия, карбонат магния и карбонат кальция; гидрокарбонаты (бикарбонаты) щелочных металлов, такие как гидрокарбонат лития, гидрокарбонат натрия, гидрокарбонат калия; фосфаты щелочных и щелочноземельных металлов, такие как фосфат калия, фосфат кальция; и, кроме того, органические основания, такие как третичные амины, такие как триметиламин, триэтиламин, диизопропилэтиламин, трибутиламин и N-метилпиперидин, пиридин, замещенные пиридины, такие как коллидин, лутидин, N-метилморфолин и 4-диметиламинопиридин, а также бициклические амины.

Примерами подходящих азотсодержащих оснований являются C1-C6-алкиламин, предпочтительно триалкиламин, например, триэтиламин, триметиламин, N-этилдиизопропиламин; пиридин, лутидин, коллидин, 4-(диметиламино)пиридин (DMAP), имидазол, 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ен (DBU) или 1,5-диазабицикло[4.3.0]нон-5-ен (DBN).

Предпочтительными основаниями являются карбонаты щелочных и щелочноземельных металлов и азотсодержащие основания, как определено выше; особенно предпочтительны триэтиламин, пиридин или карбонат натрия.

Термин «основание», используемый в настоящей заявке, также включает в себя смеси двух или более, предпочтительно двух из вышеуказанных соединений. Особое предпочтение отдают использованию одного основания.

Основания обычно используют в избытке, более предпочтительно от 1 до 3 эквивалентов в пересчете на галогенангидриды (II), и их также можно использовать в качестве растворителя. Однако их также можно использовать в каталитических количествах.

Для реакции галогенангидриды (II), соединения (III) и основание могут быть приведены в контакт любым способом, известным *per se*.

Соответственно, партнеры по реакции и основание можно вводить в реакционный сосуд и подвергать реакции отдельно, одновременно или последовательно.

Реагенты обычно используют в эквимольных количествах. Может быть выгодно использовать один из реагентов в избытке, например, с целью завершения реакции другого реагента.

Реакцию можно проводить при атмосферном давлении, пониженном давлении или при повышенном давлении, при необходимости в инертном газе, непрерывно или порциями.

5 Окончание реакции может легко определить квалифицированный специалист с помощью обычных методов.

Реакционные смеси обрабатывают обычным способом, например, путем смешивания с водой, разделения фаз и, при необходимости, хроматографической очистки сырого продукта.

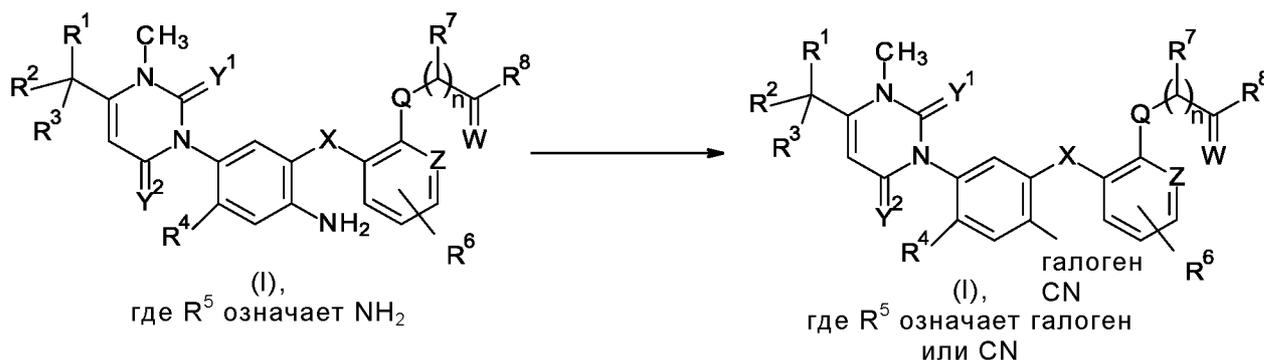
10 Часть промежуточных и конечных продуктов получают в виде вязких масел, которые можно очистить или освободить от летучих компонентов при пониженном давлении и при умеренно повышенной температуре.

Если промежуточные соединения и конечные продукты получают в твердом виде, то очистку можно также проводить перекристаллизацией или расщеплением.

15 Соединения формулы (III) являются коммерчески доступными.

Способ В)

20 В качестве альтернативы фенилурацилы формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой галоген или CN также можно получить реакцией фенилурацилов формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой NH<sub>2</sub>, с диазотирующим агентом, необязательно в присутствии солей меди:



25 Галогенирование фенилурацилов формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой NH<sub>2</sub>, осуществляют путем диазотирования алкилнитритом (например, изоамилнитритом, *трет*-бутилнитритом или NaNO<sub>2</sub>) с последующей обработкой медью (I) и/или галогенидом меди (II) (например, CuCl, CuCl<sub>2</sub>, CuBr, CuBr<sub>2</sub> или CuCN) в растворителе, таком как ацетонитрил при температуре в диапазоне от

0 °С до температуры кипения с обратным холодильником растворителя с получением соответствующих фенилурацилов формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой галоген, такой как хлорид или бромид, или CN (например, WO 2011/137088).

5 Эта реакция известна как реакция «Зандмейера» (см., например, L. Kürti, B. Czako Strategic Applications of Named Reactions in Organic Synthesis, Elsevier: San Diego, 2005, сс. 394-395).

Для получения фенилурацилов формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой йод, соли меди не требуются.

10 Можно использовать приведенные ниже условия реакции, добавляя после диазотирования вместо соли меди соль йода, такую как йодид калия.

Для получения фенилурацилов формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой фтор, можно использовать тетрафторборатные соли соединения диазония. Их получают добавлением тетрафторбората водорода во время диазотирования.

15 Последующее термическое или фотолитическое разложение приводит к получению соответствующих соединений фтора (Langlois, B. In Introduction of Fluorine via Diazonium Compounds (Fluorodediazoniatio); Baasner, B., Hagemann, H., Tatlow, J. C., Eds.; Houben-Weyl, Methods of Organic Chemistry; Thieme: Stuttgart, 1999; т. E10a, Organo-Fluorine Compounds, сс. 686-740).

20 Реакцию фенилурацилов формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой NH<sub>2</sub>, с диазотирующим агентом и необязательно солями меди обычно проводят от 0 °С до температуры кипения реакционной смеси, предпочтительно от 0 °С до 100 °С, особенно предпочтительно от 0 °С до 40 °С в инертном растворителе.

25 Реакцию в принципе можно проводить в веществе. Однако предпочтение отдают взаимодействию фенилурацила формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой NH<sub>2</sub>, с солями меди и диазотирующим агентом в органическом растворителе.

В принципе пригодны все растворители, которые способны растворять соединения формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой NH<sub>2</sub>, соли меди и агент диазотирования, по меньшей мере частично, а предпочтительно полностью в  
30 условиях реакции.

Примерами подходящих растворителей являются алифатические углеводороды, такие как пентан, гексан, циклогексан, нитрометан и смеси C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>-алканов; ароматические углеводороды, такие как бензол, хлорбензол, толуол, крезолы, *o*-, *m*- и *p*-ксилолы; галогенированные углеводороды, такие как

дихлорметан, 1,2-дихлорэтан, хлороформ, четыреххлористый углерод и хлорбензол; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, *трет*-бутилметиловый эфир (ТВМЕ), диоксан, анизол и тетрагидрофуран (THF); сложные эфиры, такие как этилацетат и бутилацетат; нитрилы, такие как ацетонитрил и пропионитрил; кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, диэтилкетон, *трет*-бутилметилкетон, циклогексанон; диполярные апротонные растворители, такие как сульфолан, диметилсульфоксид, N,N-диметилформамид (DMF), N,N-диметилацетамид (DMAC), 1,3-диметил-2-имидазолидинон (DMI), N,N'-диметилпропиленмочевина (DMPU), диметилсульфоксид (ДМСО) и 1-метил-2-пирролидинон (NMP) и полярные протонные растворители, такие как вода.

Предпочтительными растворителями являются нитрилы или полярные протонные растворители, как указано выше.

Также возможно использовать смеси упомянутых растворителей.

Соли меди обычно используют в избытке, более предпочтительно от 1 до 3 эквивалентов, в пересчете на фенилурацил формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой NH<sub>2</sub>.

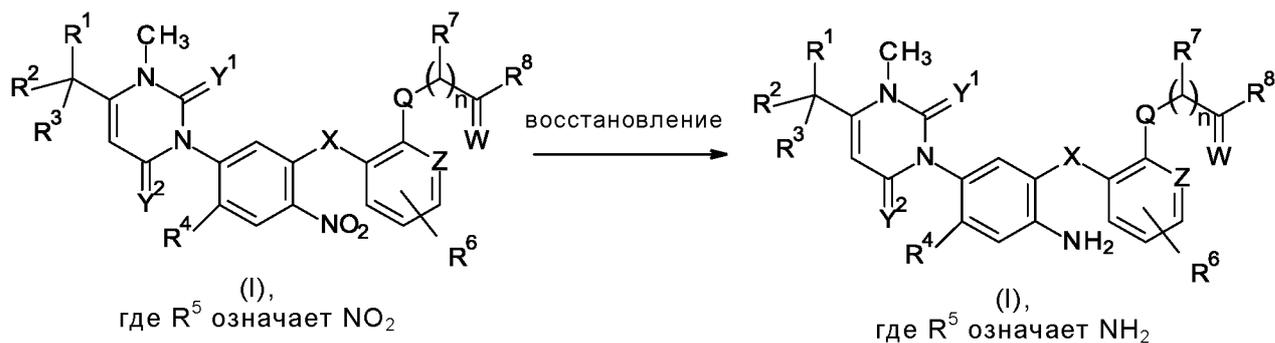
Агент диазотирования обычно используют в избытке, более предпочтительно от 1 до 3 эквивалентов, в пересчете на соединения формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой NH<sub>2</sub>.

Для реакции фенилурацилы формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой NH<sub>2</sub>, соли меди и агент диазотирования могут быть приведены в контакт любым способом, известным *per se*.

Реакцию можно проводить при атмосферном давлении, пониженном давлении или при повышенном давлении, при необходимости в инертном газе, непрерывно или порциями.

Соли меди и диазотирующие агенты являются коммерчески доступными.

Фенилурацилы формулы (I), в которой R<sup>5</sup> представляет собой NH<sub>2</sub>, могут быть получены из фенилурацилов формулы (I), в которой R<sup>5</sup> представляет собой NO<sub>2</sub>:



Восстановления нитрогруппы можно добиться обработкой железного порошка в уксусной кислоте при температуре от 0 °С до 100 °С. Альтернативно, восстановление можно проводить каталитическим гидрированием в газобразном водороде при давлении от 70 до 700 кПа, предпочтительно от 270 до 350 кПа, в присутствии металлического катализатора, такого как палладий, нанесенного на инертный носитель, такой как активированный уголь, в массовом соотношении металла к носителю от 5 до 20 %, суспендированного в растворителе, таком как этанол, при температуре окружающей среды (см., например, WO 2011/137088).

Реакцию фенилурацилов формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой NO<sub>2</sub>, с восстановителем обычно проводят от 0 °С до температуры кипения реакционной смеси, предпочтительно от 20 °С до температуры кипения реакционной смеси в инертном растворителе. Реакцию в принципе можно проводить в веществе.

Однако предпочтение отдают взаимодействию соединений формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой NO<sub>2</sub>, с восстановителем в органическом растворителе. В принципе пригодны все растворители, которые способны растворять соединения формулы (I), где R<sup>5</sup> представляет собой NO<sub>2</sub>, по меньшей мере частично, а предпочтительно полностью в условиях реакции.

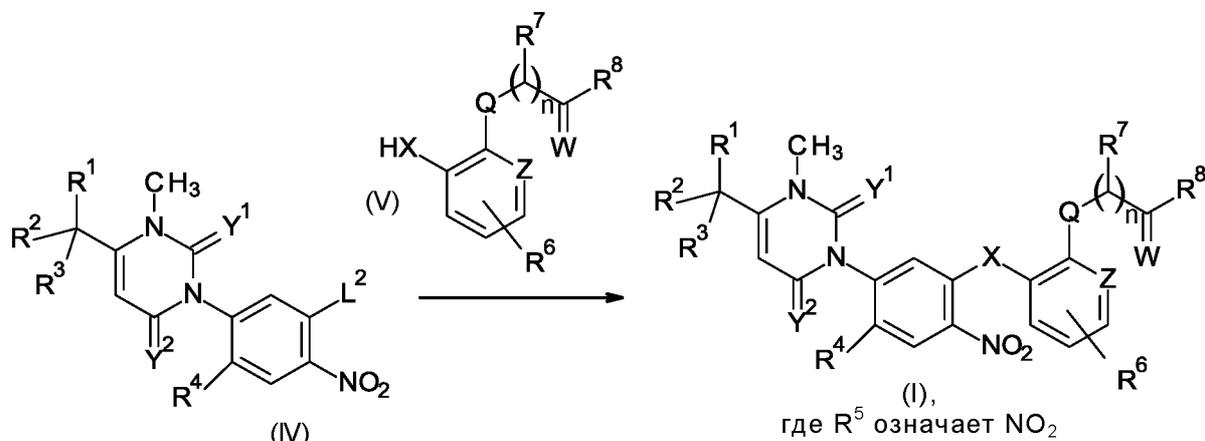
Примерами подходящих растворителей являются спирты, такие как этанол.

Восстановители обычно используют в избытке, более предпочтительно от 1 до 6 эквивалентов в расчете на нитросоединения.

Реакцию можно проводить при атмосферном давлении, пониженном давлении или при повышенном давлении, при необходимости в инертном газе, непрерывно или порциями.

Восстановители являются коммерчески доступными.

Фенилурацилы формулы (I), где  $R^5$  представляет собой  $NO_2$  можно получить реакцией урацилов формулы (IV) с соединениями формулы (V) в присутствии основания:



5

В урацилах формулы (IV),  $L^2$  представляет собой уходящую группу, такую как галоген,  $C_1$ - $C_6$ -алкилсульфонат или арилсульфонат; предпочтительно F,  $C_1$ - $C_6$ -алкилсульфонат или арилсульфонат; особенно предпочтительными являются F, мезилат или тозилат.

10 Реакцию урацилов формулы (IV) с соединениями формулы (V) в присутствии основания обычно проводят от  $0\text{ }^\circ\text{C}$  до температуры кипения реакционной смеси, предпочтительно от  $20\text{ }^\circ\text{C}$  до  $100\text{ }^\circ\text{C}$ .

15 Реакцию в принципе можно проводить в веществе. Однако предпочтение отдают реакции урацилов формулы (IV) с соединениями формулы (V) в органическом растворителе. В принципе пригодны все растворители, которые способны растворять урацилы формулы (IV) и соединения формулы (V) по меньшей мере частично и предпочтительно полностью в условиях реакции.

20 Примерами подходящих растворителей являются алифатические углеводороды, такие как пентан, гексан, циклогексан, нитрометан и смеси  $C_5$ - $C_8$ -алканов, ароматические углеводороды, такие как бензол, хлорбензол, толуол, крезолы, *o*-, *m*- и *p*-ксилолы; галогенированные углеводороды, такие как дихлорметан, 1,2-дихлорэтан, хлороформ, четыреххлористый углерод и хлорбензол; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, *трет*-бутилметилвый эфир (ТВМЕ), диоксан, анизол и тетрагидрофуран  
 25 (ТГФ); сложные эфиры, такие как этилацетат и бутилацетат; нитрилы, такие как ацетонитрил и пропионитрил; кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон,

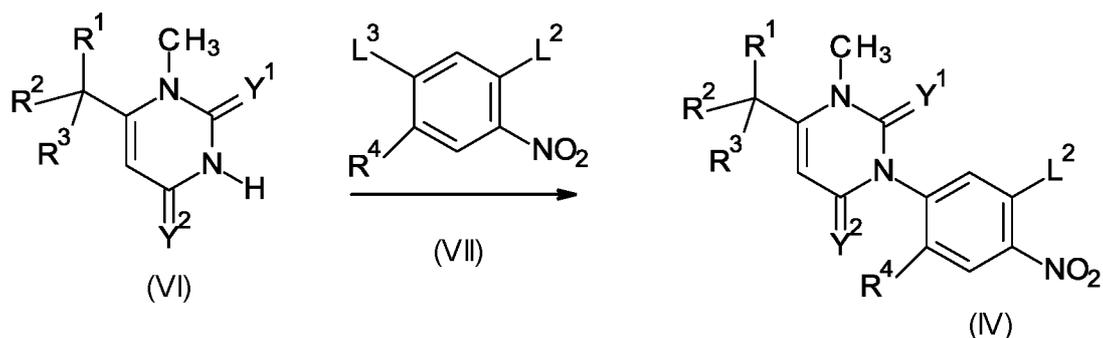
диэтилкетон, *трет*-бутилметилкетон, циклогексанон; диполярные апротонные растворители, такие как сульфолан, диметилсульфоксид, N,N-диметилформамид (DMF), N,N-диметилацетамид (DMAC), 1,3-диметил-2-имидазолидинон (DMI), N,N'-диметилпропиленмочевина (DMPU), диметилсульфоксид (ДМСО) и 1-метил-2-пирролидинон (NMP).

Предпочтительными растворителями являются простые эфиры, нитрилы и диполярные апротонные растворители, как указано выше.

Примерами подходящих металлсодержащих оснований являются неорганические соединения, такие как гидроксиды щелочных и щелочноземельных металлов, а также гидроксиды других металлов, такие как гидроксид лития, гидроксид натрия, гидроксид калия, гидроксид магния, гидроксид кальция и гидроксид алюминия; оксиды щелочных и щелочноземельных металлов и оксиды других металлов, такие как оксид лития, оксид натрия, оксид калия, оксид магния, оксид кальция и оксид магния, оксид железа, оксид серебра; Гидриды щелочных и щелочноземельных металлов, такие как гидрид лития, гидрид натрия, гидрид калия и гидрид кальция, амиды щелочных металлов, такие как амид лития, амид натрия и амид калия, карбонаты щелочных и щелочноземельных металлов, такие как карбонат лития, карбонат натрия, карбонат калия, карбонат магния, карбонат цезия и карбонат кальция, а также гидрокарбонаты (бикарбонаты) щелочных металлов, такие как гидрокарбонат лития, гидрокарбонат натрия, гидрокарбонат калия; фосфаты щелочных и щелочноземельных металлов, такие как фосфат калия, фосфат кальция; органические соединения металлов, предпочтительно алкилы щелочных металлов, такие как метиллитий, бутиллитий и фениллитий, галогениды алкилмагния, такие как хлорид метилмагния, а также алкоксиды щелочных и щелочноземельных металлов, такие как метоксид натрия, этоксид натрия, этоксид калия, *трет*-бутоксид калия, *трет*-пентоксид калия и диметоксимагний.

Соединения формулы (V) известны из литературных источников и/или являются коммерчески доступными.

Урацилы формулы (IV) могут быть получены реакцией урацилов формулы (VI) с соединениями формулы (VII) в присутствии основания:



В соединениях формулы (VII),  $L^2$  представляет собой уходящую группу, такую как галоген,  $C_1$ - $C_6$ -алкилсульфонат или арилсульфонат; предпочтительно F,  $C_1$ - $C_6$ -алкилсульфонат или арилсульфонат; в особенности предпочтительны F, мезилат или тозилат.

В соединениях формулы (VII),  $L^3$  представляет собой уходящую группу, такую как F,  $C_1$ - $C_6$ -алкилсульфонат или арилсульфонат; предпочтительно F, мезилат или тозилат.

10 Реакцию урацилов формулы (VI) с соединениями формулы (VII) в присутствии основания обычно осуществляют от  $0\text{ }^\circ\text{C}$  до температуры кипения реакционной смеси, предпочтительно от  $20\text{ }^\circ\text{C}$  до  $100\text{ }^\circ\text{C}$ .

15 Реакцию в принципе можно проводить в веществе. Однако предпочтение отдают реакции урацилов формулы (VI) с соединениями формулы (VII) в органическом растворителе.

В принципе пригодны все растворители, способные растворять урацилы формулы (VI) и соединения формулы (VII) по меньшей мере частично и предпочтительно полностью в условиях реакции.

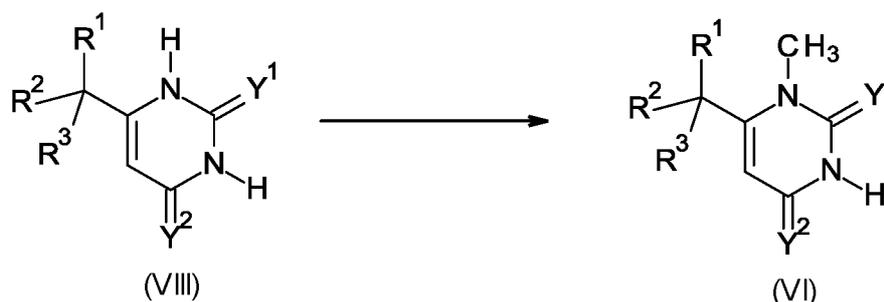
20 Примерами подходящих растворителей являются диполярные апротонные растворители, такие как сульфолан, диметилсульфоксид, N,N-диметилформамид (DMF), N,N-диметилацетамид (DMAC), 1,3-диметил-2-имидазолидинон (DMI), N,N'-диметилпропиленмочевина (DMPU), диметилсульфоксид (ДМСО) и 1-метил-2-пирролидинон (NMP).

25 Примерами подходящих металлсодержащих оснований являются неорганические соединения, такие как гидроксиды щелочных и щелочноземельных металлов, а также гидроксиды других металлов, такие как гидроксид лития, гидроксид натрия, гидроксид калия, гидроксид магния, гидроксид кальция и гидроксид алюминия; оксиды щелочных и

щелочноземельных металлов и оксиды других металлов, такие как оксид лития, оксид натрия, оксид калия, оксид магния, оксид кальция и оксид магния, оксид железа, оксид серебра; Гидриды щелочных и щелочноземельных металлов, такие как гидрид лития, гидрид натрия, гидрид калия и гидрид кальция, амиды щелочных металлов, такие как амид лития, амид натрия и амид калия, карбонаты щелочных и щелочноземельных металлов, такие как карбонат лития, карбонат натрия, карбонат калия, карбонат магния, карбонат цезия и карбонат кальция, а также гидрокарбонаты (бикарбонаты) щелочных металлов, такие как гидрокарбонат лития, гидрокарбонат натрия, гидрокарбонат калия; фосфаты щелочных и щелочноземельных металлов, такие как фосфат калия, фосфат кальция; органические соединения металлов, предпочтительно алкилы щелочных металлов, такие как метиллитий, бутиллитий и фениллитий, галогениды алкилмагния, такие как хлорид метилмагния, а также алкоксиды щелочных и щелочноземельных металлов, такие как метоксид натрия, этоксид натрия, этоксид калия, *трет*-бутоксид калия, *трет*-пентоксид калия и диметоксимагний.

Соединения формулы (VII) известны из литературных источников и/или являются коммерчески доступными.

Урацилы формулы (VI) могут быть получены из NH-урацилов формулы (VIII) с использованием реагентов метилирования, таких как метилиодид, метилсульфаты или метилсульфонаты, например,  $\text{CF}_3\text{SO}_3\text{CH}_3$ , в присутствии основания:



Реакцию в принципе можно проводить в веществе. Однако предпочтение отдают реакции урацилов формулы (VIII) в органическом растворителе.

В принципе пригодны все растворители, которые способны растворять урацилы формулы (VIII) по меньшей мере частично и предпочтительно полностью в условиях реакции.

Примерами подходящих растворителей являются простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, *трет*-бутилметиловый эфир (ТВМЕ), диоксан, анизол и тетрагидрофуран (ТГФ), сложные эфиры, такие как этилацетат и бутилацетат; нитрилы, такие как ацетонитрил и пропионитрил, а также

5 диполярные апротонные растворители, такие как сульфолан, диметилсульфоксид, N,N-диметилформамид (ДМФ), N,N-диметилацетамид (DMAC), 1,3-диметил-2-имидазолидинон (DMI), N,N'-диметилпропиленмочевина (ДМПУ), диметилсульфоксид (ДМСО) и 1-метил-2-пирролидинон (NMP).

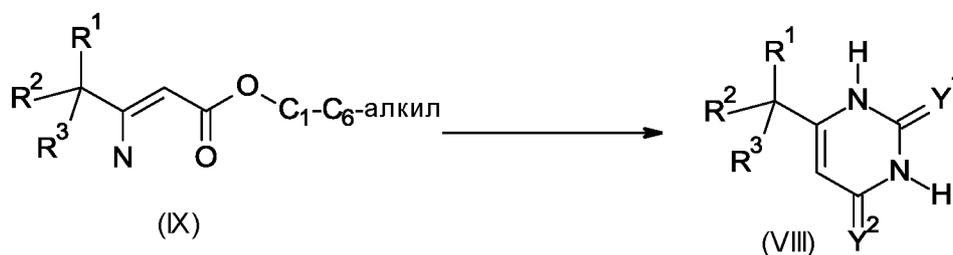
Примерами подходящих металлосодержащих оснований являются гидриды

10 щелочных и щелочноземельных металлов, такие как гидрид лития, гидрид натрия, гидрид калия и гидрид кальция, амиды щелочных металлов, такие как амид лития, амид натрия и амид калия, карбонаты щелочных и щелочноземельных металлов, такие как карбонат лития, карбонат натрия, карбонат калия, карбонат магния, карбонат цезия и карбонат кальция, а также

15 гидрокарбонаты (бикарбонаты) щелочных металлов, такие как гидрокарбонат лития, гидрокарбонат натрия, гидрокарбонат калия; фосфаты щелочных и щелочноземельных металлов, такие как фосфат калия, фосфат кальция; органические соединения металлов, предпочтительно алкилы щелочных металлов, такие как метиллитий, бутиллитий и фениллитий, галогениды алкилмагния, такие как метил хлорид метилмагния, а также алкоксиды

20 щелочных и щелочноземельных металлов, такие как *трет*-бутоксид калия.

NH-Урацилы формулы (VIII) могут быть получены из аминокротонатов формулы (IX) с использованием изоцианатных солей, таких как KNCО:



25 Реакцию в принципе можно проводить в веществе. Однако предпочтение отдают реакциям в органическом растворителе.

В принципе пригодны все растворители, способные растворять аминокротонат формулы (IX) и соль изоцианата по меньшей мере частично и

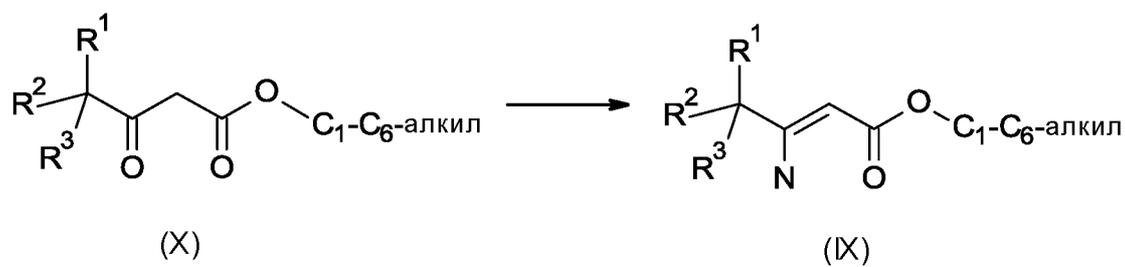
30 предпочтительно полностью в условиях реакции.

Примерами подходящих растворителей являются простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, *трет*-бутилметиловый эфир.

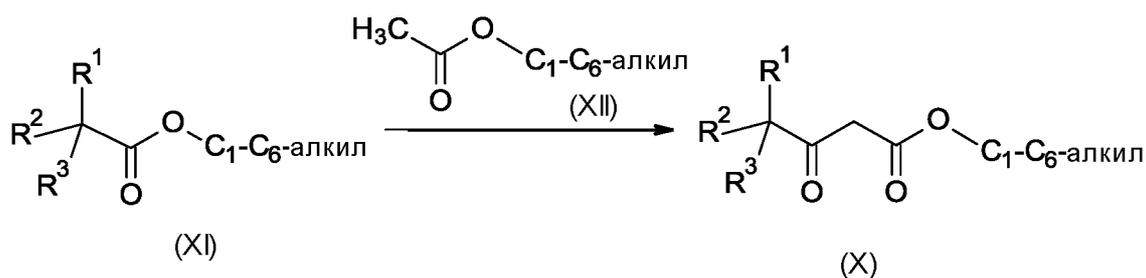
(ТВМЕ), диоксан, анизол и тетрагидрофуран (ТНФ), сложные эфиры, такие как этилацетат и бутилацетат; нитрилы, такие как ацетонитрил и пропионитрил, а

5 также диполярные апротонные растворители, такие как сульфолан, диметилсульфоксид, N,N-диметилформамид (DMF), N,N-диметилацетамид (DMAC), 1,3-диметил-2-имидазолидинон (DMI), N,N'-диметилпропиленмочевина (DMPU), диметилсульфоксид (ДМСО) и 1-метил-2-пирролидинон (NMP).

10 Аминокротонаты формулы (IX) можно получить из бета-кетозэфиров формулы (X), как описано в литературных источниках (см., например, US 2003/0216594):



15 Бета-кето-эфиры формулы (X) можно получить реакцией сложных эфиров формулы (XI) с эфиром уксусной кислоты формулы (XII) в присутствии основания:



20 Реакцию в принципе можно проводить в веществе. Однако предпочтение отдают реакции в органическом растворителе.

В принципе пригодны все растворители, способные растворять сложные эфиры формулы (XI) по меньшей мере частично и предпочтительно полностью в условиях реакции.

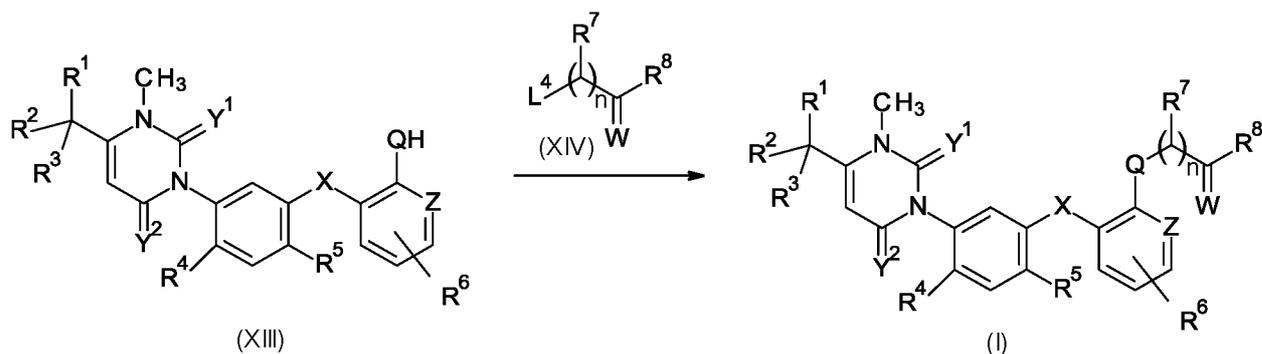
Примерами подходящих растворителей являются простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, *трет.*-бутил-метиловый эфир (ТВМЕ), диоксан, анизол и тетрагидрофуран (ТНФ), сложные эфиры, такие как этилацетат и бутилацетат; нитрилы, такие как ацетонитрил и пропионитрил, а также дипольярные апротонные растворители, такие как сульфолан, диметилсульфоксид, N,N-диметилформамид (DMF), N,N-диметилацетамид (DMAС), 1,3-диметил-2-имидазолидинон (DMI), N,N'-диметилпропиленмочевина (DMPU), диметилсульфоксид (ДМСО) и 1-метил-2-пирролидинон (NMP).

10           Примерами подходящих металлосодержащих оснований являются гидриды щелочных и щелочноземельных металлов, такие как гидрид лития, гидрид натрия, гидрид калия и гидрид кальция, амиды щелочных металлов, такие как амид лития, амид натрия и амид калия, карбонаты щелочных и щелочноземельных металлов, такие как карбонат лития, карбонат натрия, карбонат калия, карбонат магния, карбонат цезия и карбонат кальция, а также гидрокарбонаты (бикарбонаты) щелочных металлов, такие как гидрокарбонат лития, гидрокарбонат натрия, гидрокарбонат калия; фосфаты щелочных и щелочноземельных металлов, такие как фосфат калия, фосфат кальция; органические соединения металлов, предпочтительно алкилы щелочных металлов, такие как метиллитий, бутиллитий и фениллитий, галогениды алкилмагния, такие как метил хлорид метилмагния, а также алкоксиды щелочных и щелочноземельных металлов, такие как *трет.*-бутоксид калия.

Соединения формулы (XI) и (XII) известны из литературных источников и/или являются коммерчески доступными.

25           Способ С)

Фенилурацилы формулы (I) также можно получить реакцией соединений формулы (XIII) с алкилирующими агентами формулы (XIV) в присутствии основания по аналогии с известными способами (например, WO 11/137088):



В алкилирующих агентах формулы (XIV),  $L^4$  представляет собой уходящую группу, такую как галоген,  $C_1$ - $C_6$ -алкил-сульфонат или арилсульфонат;

5 предпочтительно Cl или Br.

Реакцию в принципе можно проводить в веществе. Однако предпочтение отдают взаимодействию соединений формулы (XIII) с алкилирующими агентами формулы (XIV) в органическом растворителе.

В принципе пригодны все растворители, которые способны растворять соединения формулы (XIII) и алкилирующие агенты формулы (XIV) по меньшей мере частично и предпочтительно полностью в условиях реакции.

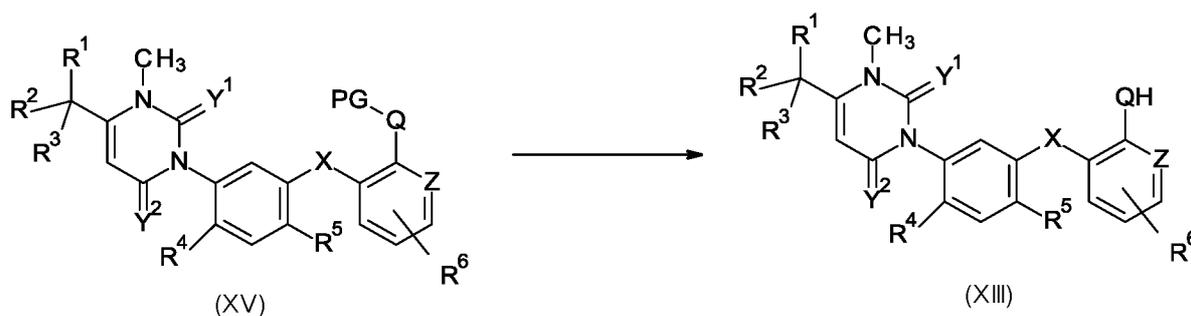
Примерами подходящих растворителей являются простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, *tert*-бутил-метилловый эфир (ТВМЕ), диоксан, анизол и тетрагидрофуран (THF), сложные эфиры, такие как этилацетат и бутилацетат; нитрилы, такие как ацетонитрил и пропионитрил, а также диполярные апротонные растворители, такие как сульфолан, диметилсульфоксид, N,N-диметилформамид (DMF), N,N-диметил-ацетамид (DMAC), 1,3-диметил-2-имидазолидинон (DMI), N,N'-диметилпропиленмочевина (DMPU), диметилсульфоксид (ДМСО) и 1-метил-2-пирролидинон (NMP).

Примерами подходящих металлсодержащих оснований являются неорганические соединения, такие как гидроксиды щелочных и щелочноземельных металлов, а также гидроксиды других металлов, такие как гидроксид лития, гидроксид натрия, гидроксид калия, гидроксид магния, гидроксид кальция и гидроксид алюминия; оксиды щелочных и щелочноземельных металлов и оксиды других металлов, такие как оксид лития, оксид натрия, оксид калия, оксид магния, оксид кальция и оксид магния, оксид железа, оксид серебра; Гидриды щелочных и щелочноземельных металлов, такие

как гидрид лития, гидрид натрия, гидрид калия и гидрид кальция, амиды щелочных металлов, такие как амид лития, амид натрия и амид калия, карбонаты щелочных и щелочноземельных металлов, такие как карбонат лития, карбонат натрия, карбонат калия, карбонат магния, карбонат цезия и карбонат кальция, а также гидрокарбонаты (бикарбонаты) щелочных металлов, такие как гидрокарбонат лития, гидрокарбонат натрия, гидрокарбонат калия; фосфаты щелочных и щелочноземельных металлов, такие как фосфат калия, фосфат кальция; органические соединения металлов, предпочтительно алкилы щелочных металлов, такие как метиллитий, бутиллитий и фениллитий, галогениды алкилмагния, такие как хлорид метилмагния, а также алкоксиды щелочных и щелочноземельных металлов, такие как метоксид натрия, этоксид натрия, этоксид калия, *трет*-бутоксид калия, *трет*-пентоксид калия и диметоксимагний; и кроме того, органические основания, такие как третичные амины, такие как триметиламин, триэтиламин, диизопропилэтиламин и N-метилпиперидин, пиридин, замещенные пиридины, такие как коллидин, лутидин, N-метилморфолин и 4-диметиламинопиридин, а также бициклические амины.

Алкилирующие агенты формулы (XIV) коммерчески доступны или могут быть получены известными способами (например, Lowell, Andrew N. и соавт., Tetrahedron, 6(30), 5573-5582, 2010; WO 11/137088).

Соединения формулы (XIII) можно получить следующим образом:



В соединениях формулы (XV) «PG» представляет собой защитную группу, выбранную из группы, включающей в себя C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-цианоалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилтио-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, (три-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)силил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, (три-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)силил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкилокси-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкенил, тетрагидропиранил, (три-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)силил, [(дифенил)(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-

алкил)]силлил, формил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил-карбонил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил-О-карбонил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкенил-Окарбонил, [(дифенил)(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил)]силлил- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, фенил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, фенилтио-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, фенилкарбонил, где каждое фенильное кольцо может быть замещено одним-тремя заместителями, выбранными из группы, включающей в себя галоген, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил и C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси.

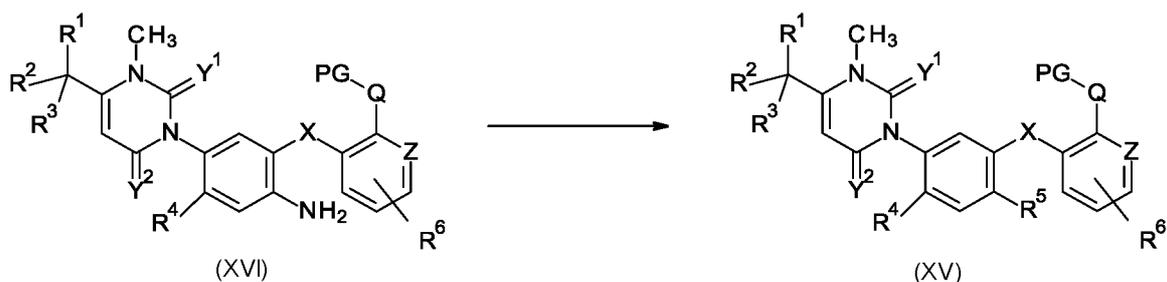
Предпочтительно PG представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, (три-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)силлил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкенил, тетрагидропиранил, (три-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил)силлил, [(дифенил)(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил)]силлил или фенил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил.

Например, соединения формулы (XIII) могут быть получены путем обработки соединений формулы (XV), где «PG» представляет собой метил, трибромидом бора в растворителе, таком как дихлорметан, ацетонитрил или 1,4-диоксан, или без растворителя при температуре от 0 °С до 150 °С.

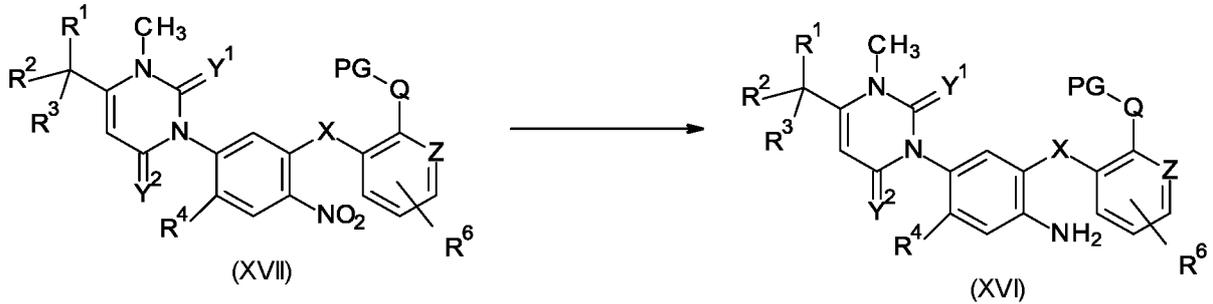
Альтернативно, соединения формулы (XIII) могут быть получены путем снятия защиты с соединений формулы (XV), где «PG» представляет собой бензильную группу, путем каталитического гидрирования в атмосфере газообразного водорода при давлении от 70 до 700 кПа, предпочтительно от 270 до 350 кПа, в присутствии металлического катализатора, такого как палладий, нанесенного на инертный носитель, такой как активированный уголь, в массовом соотношении металла к носителю от 5 до 20 %, суспендированного в растворителе, таком как этанол, при температуре окружающей среды.

Способ, использование и выбор защитных групп будут очевидны специалисту в области химического синтеза (см., например, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 4-е изд.; Wiley: New York, 2007).

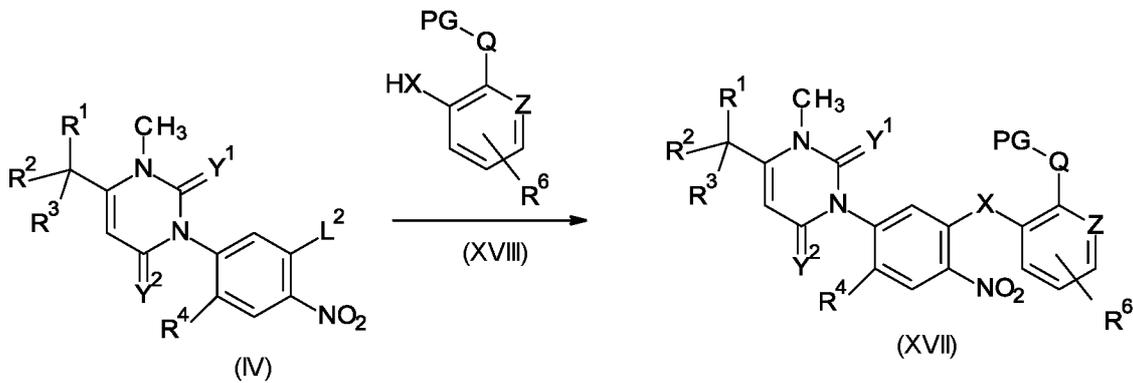
Соединения формулы (XV) могут быть получены из аминсоединений формулы (XVI) с использованием реакции «Зандмейера», как описано в способе В:



Аминосоединения формулы (XVI) можно получить из нитросоединений формулы (XVII) используя условия восстановления, как описано в способе В:



5 Нитросоединения формулы (XVII) можно получить из урацилов формулы (IV) в присутствии основания с использованием соединений формулы (XVIII), как описано в способе В:



10 Соединения формулы (XVIII) известны из литературных источников и/или являются коммерчески доступными.

Для расширения спектра действия и достижения синергических эффектов фенилурацилы формулы (I) можно смешивать со многими представителями других групп гербицидных или регулирующих рост активных ингредиентов и затем применять одновременно. Подходящими компонентами для комбинаций являются, например, гербициды из классов ацетамидов, амидов, арилоксифеноксипропионатов, бензамидов, бензофурана, бензойных кислот, бензотиадиазинонов, бипиридила, карбаматов, хлорацетамидов, хлоркарбоновых кислот, циклогександионов, динитроанилинов, динитрофенола, дифенилового эфира, глицинов, имидазолиноны, изоксазолов, изоксазолидинонов, нитрилов, N-фенилфталимидов, оксадиазолов, оксазолидиндионов, оксиацетамидов, феноксикарбоновых кислот,

15  
20

фенилкарбаматов, фенилпиразолов, фенилпиразолинов, фенилпиридазинов, фосфиновых кислот, фосфоамидатов, фосфородитиоатов, фталаматов, пиразолов, пиридазинонов, пиридинов, пиридинкарбоновых кислот, пиридинкарбоксамидов, пиримидиндионов, пиримидинил(тио)бензоатов, хинолинкарбоновых кислот, семикарбазонов, сульфоаминокарбонилтриазинонов, сульфонилмочевин, тетразолинонов, тиadiaзолов, тиокарбаматов, триазинов, триазинонов, триазолов, триазинонов, триазолокарбоксамидов, триазолопиримидинов, трикетонов, урацилов, мочевины.

5  
10  
15  
Кроме того, может быть выгодно применять фенилурацилы формулы (I) отдельно или в сочетании с другими гербицидами или же в виде смеси с другими средствами защиты растений, например, вместе со средствами для борьбы с вредителями или фитопатогенными грибами или бактериями. Также представляет интерес совместимость с растворами минеральных солей, которые используют для лечения дефицита питательных веществ и микроэлементов. Также могут быть добавлены другие добавки, такие как нефитотоксичные масла и масляные концентраты.

Изобретение также относится к составам, содержащим по меньшей мере вспомогательное вещество и по меньшей мере один фенилурацил формулы (I) в соответствии с изобретением.

20  
25  
30  
Состав содержит пестицидно эффективное количество фенилурацила формулы (I). Термин «эффективное количество» обозначает количество комбинации или фенилурацилов формулы (I), которого достаточно для борьбы с нежелательной растительностью, особенно для борьбы с нежелательной растительностью в сельскохозяйственных культурах (т.е. культурных растениях) и которое не причиняет существенного вреда обработанным сельскохозяйственным растениям. Такое количество может варьироваться в широком диапазоне и зависит от различных факторов, таких как нежелательная растительность, с которой необходимо бороться, обработанные сельскохозяйственные растения или материал, климатические условия и конкретный используемый фенилурацил формулы (I).

Фенилурацилы формулы (I), их соли, амиды, сложные эфиры или тиоэфиры могут быть преобразованы в составы обычного типа, например, растворы, эмульсии, суспензии, тонкие порошки, порошки, пасты, гранулы, спрессованные продукты, капсулы и их смеси. Примерами типов составов являются суспензии

(например, SC, OD, FS), эмульгируемые концентраты (например, EC), эмульсии (например, EW, EO, ES, ME), капсулы (например, CS, ZC), пасты, пастилки, смачиваемые порошки или тонкие порошки (например, WP, SP, WS, DP, DS), спрессованные продукты (например, BR, TB, DT), гранулы (например, WG, SG, GR, FG, GG, MG), инсектицидные изделия (например, LN), а также гелевые составы для обработки материалов для размножения растений, таких как семена (например, GF). Эти и другие типы составов определены в «Catalogue of pesticide formulation types and international coding system», Technical Monograph № 2, 6-е изд. май 2008, CropLife International.

10 Составы готовят известным способом, например, описанным у Mollet and Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; или Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, London, 2005.

15 Пригодными вспомогательными веществами являются растворители, жидкие носители, твердые носители или наполнители, поверхностно-активные вещества, диспергаторы, эмульгаторы, смачивающие агенты, адъюванты, солюбилизаторы, вещества, способствующие проникновению, защитные коллоиды, вещества улучшающие адгезию, загустители, увлажнители, репелленты, аттрактанты, стимуляторы поедания, улучшающие совместимость агенты, бактерициды, антифризы, антивспениватели, красители, вещества для повышения клейкости и связующие вещества.

20 Пригодными растворителями и жидкими носителями являются вода и органические растворители, такие как фракции минеральных масел от средней до высокой точек кипения, такие как керосин, дизельное масло; масла 25 растительного или животного происхождения, алифатические, циклические и ароматические углеводороды, например, толуол, парафин, тетрагидронафталин, алкилированные нафталины; спирты, например, этанол, пропанол, бутанол, бензиловый спирт, циклогексанол; гликоли; ДМСО; кетоны, например, циклогексанон; сложные эфиры, например, лактаты, карбонаты, сложные эфиры 30 жирной кислоты, гамма-бутиролактон; жирные кислоты; фосфонаты; амины; амиды, например, N-метилпирролидон, диметиламиды жирных кислот; и их смеси.

Пригодные твердые носители или наполнители представляют собой минеральные земли, например, силикаты, силикагели, тальк, каолины,

известняк, известь, мел, глины, доломит, диатомовую землю, бентонит, сульфат кальция, сульфат магния, оксид магния; полисахаридные порошки, например, целлюлозу, крахмал; удобрения, например, сульфат аммония, фосфат аммония, нитрат аммония, мочевины; продукты растительного происхождения, такие как  
5 мука зерновых культур, мука древесной коры, древесная мука, мука ореховой скорлупы и их смеси.

Пригодными поверхностно-активными веществами являются поверхностно-активные соединения, такие как анионные, катионные, неионогенные и амфотерные поверхностно-активные вещества, блок-полимеры,  
10 полиэлектролиты и их смеси. Такие поверхностно-активные вещества можно применять в качестве эмульгатора, диспергатора, солюбилизатора, смачивающего агента, вещества, способствующего проникновению, защитного коллоида или адъюванта. Примеры поверхностно-активных веществ приведены в McCutcheon's, том 1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen  
15 Rock, США, 2008 (Международное изд. или Североамериканское изд.).

Пригодными анионными поверхностно-активными веществами являются щелочные, щелочноземельные или аммониевые соли сульфонатов, сульфатов, фосфатов, карбоксилатов и их смеси. Примерами сульфонатов являются алкиларилсульфонаты, дифенилсульфонаты, альфа-олефиновые сульфонаты,  
20 лигнинсульфонаты, сульфонаты кислот жирного ряда и масел, сульфонаты этоксилированных алкилфенолов, сульфонаты алкоксилированных арилфенолов, сульфонаты конденсированных нафталинов, сульфонаты додецил- и тридецилбензолов, сульфонаты нафталинов и алкилнафталинов, сульфосукцинаты или сульфосукцинаматы. Примерами сульфатов являются  
25 сульфаты жирных кислот и масел, этоксилированных алкилфенолов, спиртов, этоксилированных спиртов или сложных эфиров жирных кислот. Примерами фосфатов являются сложные эфиры фосфатов. Примерами карбоксилатов являются алкилкарбоксилаты и этоксилаты карбоксилированных спиртов или алкилфенолов.

30 Пригодными неионогенными поверхностно-активными веществами являются алкоксилаты, N-замещенные амиды кислот жирного ряда, аминоксиды, сложные эфиры, поверхностно-активные вещества на основе сахара, полимерные поверхностно-активные вещества и их смеси. Примерами алкоксилатов являются соединения, такие как спирты, алкилфенолы, амины, амиды, арилфенолы,

жирные кислоты или эфиры жирных кислот, которые были алкоксилированы посредством от 1 до 50 эквивалентов. Для алкоксилирования можно использовать этиленоксид и/или пропиленоксид, предпочтительно этиленоксид. Примерами N-замещенных амидов кислот жирного ряда являются глюкоамиды кислот жирного ряда или алканоламиды кислот жирного ряда. Примерами сложных эфиров являются эфиры кислот жирного ряда, сложные эфиры глицерина или моноглицериды. Примерами поверхностно-активных веществ на основе сахара являются сорбитаны, сложные эфиры сахарозы и глюкозы или алкилполиглюкозиды. Примеры полимерных поверхностно-активных веществ являются гомо- или сополимеры винилпирролидона, виниловые спирты или винилацетат.

Пригодными катионными поверхностно-активными веществами являются четвертичные поверхностно-активные вещества, например, четвертичные аммониевые соединения с одной или двумя гидрофобными группами или соли длинноцепочечных первичных аминов. Пригодными амфотерными поверхностно-активными веществами являются алкилбетаины и имидазолины. Пригодными блок-полимерами являются блок-полимеры типа А-В или А-В-А, содержащие блоки из полиэтиленоксида и полипропиленоксида или типа А-В-С, содержащие алканол, полиэтиленоксид и полипропиленоксид. Пригодными полиэлектролитами являются поликислоты или полиоснования. Примерами поликислот являются щелочные соли полиакриловой кислоты или поликислотные гребенчатые полимеры. Примерами полиоснований являются поливиниламины или полиэтиленамины.

Пригодными адьювантами являются соединения, которые сами по себе обладают весьма незначительной или даже не обладают пестицидной активностью, и которые улучшают биологическую эффективность фенилурацилов формулы (I) в отношении мишени. Примерами являются поверхностно-активные вещества, минеральные или растительные масла и другие вспомогательные вещества. Дополнительные примеры приведены у Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, глава 5.

Пригодные загустители представляют собой полисахариды (например, ксантановая смола, карбоксиметилцеллюлоза), неорганические глины

(органически модифицированные или немодифицированные), поликарбоксилаты и силикаты.

Пригодные бактерициды представляют собой бронопол и производные изотиазолинона, такие как алкилизотиазолиноны и бензизотиазолиноны.

5 Пригодные антифризы представляют собой этиленгликоль, пропиленгликоль, мочевины и глицерин.

Пригодные антивспениватели представляют собой силиконы, длинноцепочечные спирты и соли кислот жирного ряда.

10 Пригодные красители (например, красного, синего или зеленого цвета) представляют собой пигменты с низкой растворимостью в воде и водорастворимые красители. Примерами являются неорганические красители (например, оксид железа, оксид титана, гексацианоферрат железа) и органические красители (например, ализариновые, азокрасители и фталоцианиновые красители).

15 Пригодными веществами для повышения клейкости или связующими веществами являются поливинилпирролидоны, поливинилацетаты, поливиниловые спирты, полиакрилаты, биологические или синтетические воски и простые эфиры целлюлозы.

Примерами типов составов и их получения являются:

20 i) Водорастворимые концентраты (SL, LS)

10 - 60 мас. % фенилурацила формулы (I) в соответствии с изобретением и 5 - 15 мас. % смачивающего агента (например, алкоксилатов спирта) растворяют в воде и/или в водорастворимом растворителе (например, спиртах) до 100 мас. %. При разбавлении с водой активное вещество растворяется.

25 ii) Диспергируемые концентраты (DC)

5 - 25 мас. % фенилурацила формулы (I) в соответствии с изобретением и 1-10 мас. % диспергатора (например, поливинилпирролидона) растворяют в органическом растворителе (например, циклогексанон) до 100 мас. %. При разбавлении с водой образуется дисперсия.

30 iii) Эмульгируемые концентраты (EC)

15 - 70 мас. % фенилурацила формулы (I) в соответствии с изобретением и 5-10 мас. % эмульгаторов (например, додецилбензолсульфонат кальция и этоксилат касторового масла) растворяют в нерастворимом в воде органическом

растворителе (например, ароматический углеводород) до 100 мас. %. При разбавлении с водой образуется эмульсия.

iv) Эмульсии (EW, EO, ES)

5 5 - 40 мас. % фенилурацила формулы (I) в соответствии с изобретением и 1-  
10 мас. % эмульгаторов (например, додецилбензолсульфонат кальция и  
этоксилат касторового масла) растворяют в 20 - 40 мас. % нерастворимого в воде  
органического растворителя (например, ароматический углеводород). Эту смесь  
добавляют в воду до 100 мас. % с помощью эмульгирующего устройства и  
доводят до гомогенной эмульсии. При разбавлении с водой образуется эмульсия.

10 v) Суспензии (SC, OD, FS)

В шаровой мельнице с мешалкой 20 - 60 мас. % фенилурацила формулы (I)  
в соответствии с изобретением измельчают с добавлением 2 - 10 мас. %  
диспергаторов и смачивающих агентов (например, лигносульфоната натрия и  
этоксилата спирта), 0,1 - 2 мас. % загустителя (например, ксантановая смола) и  
15 воды до 100 мас. % до получения тонкой суспензии активного вещества. При  
разбавлении с водой образуется стабильная суспензия активного вещества. Для  
композиции FS типа добавляют до 40 мас. % связывающего вещества (например,  
поливиниловый спирт).

vi) Диспергируемые в воде и водорастворимые гранулы (WG, SG)

20 50-80 мас. % фенилурацила формулы (I) в соответствии с изобретением  
тонко измельчают при добавлении диспергаторов и смачивающих агентов  
(например, лигносульфоната натрия и этоксилата спирта) до 100 мас. % и  
посредством технических устройств (например, экструзионного устройства,  
распылительной башни, псевдооживленного слоя) получают диспергируемые в  
25 воде или водорастворимые гранулы. При разбавлении с водой образуется  
стабильная дисперсия или раствор активного вещества.

vii) Диспергируемые в воде и водорастворимые порошки (WP, SP, WS)

30 50-80 мас. % фенилурацила формулы (I) в соответствии с изобретением  
перемалывают в роторно-статорной мельнице при добавлении 1 - 5 мас. %  
диспергаторов (например, лигносульфоната натрия), 1 - 3 мас. % смачивающих  
агентов (например, этоксилат спирта) и твердого носителя (например,  
силикагель) до 100 мас. %. При разбавлении с водой образуется стабильная  
дисперсия или раствор активного вещества.

viii) Гель (GW, GF)

В шаровой мельнице с мешалкой 5 - 25 мас. % фенилурацила формулы (I) в соответствии с изобретением при добавлении 3 - 10 мас. % диспергаторов (например, лигносульфоната натрия), 1 - 5 мас. % загустителя (например, карбоксиметилцеллюлозы) и воды до 100 мас. % измельчают до тонкой суспензии активного вещества. При разбавлении с водой образуется стабильная суспензия активного веществ.

iv) Микроэмульсия (ME)

5 - 20 мас. % фенилурацила формулы (I) в соответствии с изобретением добавляют до 5 - 30 мас. % смеси органических растворителей (например, диметиламид жирной кислоты и циклогексанон), 10 - 25 мас. % смеси поверхностно-активных веществ (например, этоксилат спирта и этоксилат арилфенола), и воды до 100 %. Эту смесь перемешивают в течение 1 ч., чтобы самопроизвольно получить термодинамически устойчивую микроэмульсию.

iv) Микрокапсулы (CS)

Масляную фазу, содержащую 5 - 50 мас. % фенилурацила формулы (I) в соответствии с изобретением, 0 - 40 мас. % нерастворимого в воде органического растворителя (например, ароматический углеводород), 2 - 15 мас. % акриловых мономеров (например, метилметакрилат, метакриловая кислота и ди- или триакрилат) диспергируют в водном растворе защитного коллоида (например, поливинилового спирта). Радикальная полимеризация, инициированная радикальным инициатором, приводит к образованию поли(мет)акрилатных микрокапсул. Альтернативно, масляную фазу, содержащую 5 - 50 мас. % фенилурацила формулы (I) в соответствии с изобретением, 0 - 40 мас. % нерастворимого в воде органического растворителя (например, ароматический углеводород) и изоцианатный мономер (например, дифенилметан-4,4'-диизоцианат) диспергируют в водном растворе защитного коллоида (например, поливинилового спирта). Добавление полиамина (например, гексаметилендиамина) приводит к образованию полимочевинных микрокапсул. Количество мономеров до 1 - 10 мас. %. Мас. % относится к общей CS композиции.

ix) Тонкие порошки (DP, DS)

1-10 мас. % фенилурацила формулы (I) в соответствии с изобретением тонко измельчают и тщательно перемешивают с твердым носителем (например, тонкодисперсный каолин) до 100 мас. %.

х) Гранулы (GR, FG)

0,5 - 30 мас. % фенилурацила формулы (I) в соответствии с изобретением тонко измельчают и связывают с твердым носителем (например, силикат) до 100 мас. %. Грануляция достигается путем экструзии, распылительной сушки или псевдооживленного слоя.

xi) Жидкости сверхмалого объема (UL)

1 - 50 мас. % фенилурацила формулы (I) в соответствии с изобретением растворяют в органическом растворителе (например, ароматический углеводород) до 100 мас. %.

10 Типы составов i) - xi) при необходимости могут содержать другие вспомогательные вещества, такие как 0,1 - 1 мас. % бактерицидов, 5 - 15 мас. % антифризов, 0,1 - 1 мас. % антивспенивателей и 0,1 - 1 мас. % красителей.

Составы, как правило, содержат от 0,01 и 95 %, предпочтительно от 0,1 до 90 %, и, в частности, от 0,5 до 75 %, по массе фенилурацила формулы (I).

15 Фенилурацилы формулы (I) используют с чистотой от 90 % до 100 %, предпочтительно от 95 % до 100 % (по спектру ЯМР).

С целью обработки материалов для размножения растений, особенно семян, обычно применяют растворы для обработки семян (LS), суспензии (SE), жидкие концентраты (FS), порошки для сухой обработки (DS), диспергируемые в воде порошки для суспензионной обработки (WS), растворимые в воде порошки (SS), эмульсии (ES), эмульгируемые концентраты (EC) и гели (GF).  
20 Рассматриваемые составы после от двух- до десятикратного разбавления, дают концентрации активного вещества от 0,01 до 60 мас. %, предпочтительно от 0,1 до 40 мас. % в готовых к применению препаратах.

25 Способы применения фенилурацилов формулы (I), их составов на материал для размножения растений, в особенности семена, включают в себя протравливание, покрытие, дражирование, опудривание, замачивание и внесение в борозду материала для размножения. Предпочтительно фенилурацилы формулы (I), соответственно их составы наносят на материал для размножения растений таким способом, что не вызывается прорастание, например, путем протравливания семян, дражирования, покрытия и опудривания.

30 К фенилурацилам формулы (I), содержащим их составам в виде премиксов или при необходимости только непосредственно перед применением (смесь в баке) могут быть добавлены различные типы масел, смачивающие средства,

адьюванты, удобрения или питательные микроэлементы и другие пестициды (например, гербициды, инсектициды, фунгициды, регуляторы роста, сафенеры),. Такие средства могут быть смешаны с составами в соответствии с изобретением в массовом соотношении от 1:100 до 100:1, предпочтительно 1:10 до 10:1.

5           Как правило, пользователь применяет фенилурацилы формулы (I) в соответствии с изобретением, содержащие их составы из устройства предварительного дозирования, ранцевого опрыскивателя, бака для опрыскивания, самолета для опрыскивания или оросительной системы. Обычно состав разбавляют водой, буфером и/или другими вспомогательными  
10           веществами до желаемой концентрации применения, и таким образом получают готовую к применению жидкость для опрыскивания или состав в соответствии с изобретением. Обычно применяют от 20 до 2000 литров, предпочтительно от 50 до 400 литров готовой к применению жидкости для опрыскивания на гектар сельскохозяйственных угодий.

15           В соответствии с одним вариантом осуществления или отдельные компоненты состава в соответствии с изобретением, или частично предварительно смешанные компоненты, например, компоненты, содержащие фенилурацилы формулы (I), могут быть смешаны пользователем в баке для опрыскивания и при необходимости могут быть добавлены дополнительные  
20           вспомогательные вещества и добавки.

          В другом варианте осуществления отдельные компоненты состава в соответствии с изобретением, такие как части набора или части двойной или тройной смеси могут быть смешаны пользователем самостоятельно в баке для опрыскивания и, кроме того, при необходимости, могут быть добавлены другие  
25           вспомогательные вещества.

          В другом варианте осуществления или отдельные компоненты состава в соответствии с изобретением или частично предварительно смешанные компоненты, например, компоненты, содержащие фенилурацилы формулы (I), могут быть применены совместно (например, после смеси в баке) или  
30           последовательно.

          Фенилурацилы формулы (I) пригодны в качестве гербицидов. Они пригодны как таковые или в виде соответствующего состава.

          Фенилурацилы формулы (I) очень эффективно борются с нежелательной растительностью на несельскохозяйственных участках, особенно при высоких

дозах внесения. Они действуют против широколиственных сорняков и злаковых сорняков в таких культурах, как пшеница, рис, кукуруза, соя и хлопчатник, не нанося значительного ущерба культурным растениям. Этот эффект в основном наблюдается при низких нормах применения.

5           Фенилурацилы формулы (I) обладают выдающейся гербицидной активностью против нежелательной растительности, т.е. против широкого спектра экономически важных вредных однодольных и двудольных сорняков.

10           Ниже приведены некоторые представители однодольных и двудольных сорняков, с которыми можно вести борьбу с помощью фенилурацилов формулы (I), без ограничения перечисления определенными видами.

Предпочтительно фенилурацилы формулы (I) используют для борьбы с однодольными сорняками.

15           Примеры однодольных сорняков, на которые эффективно действуют фенилурацилы формулы (I), выбраны из рода *Hordeum* spp., *Echinochloa* spp., *Poa* spp., *Bromus* spp., *Digitaria* spp., *Eriochloa* spp., *Setaria* spp., *Pennisetum* spp., *Eleusine* spp., *Eragrostis* spp., *Panicum* spp., *Lolium* spp., *Brachiaria* spp., *Leptochloa* spp., *Avena* spp., *Cyperus* spp., *Axonopris* spp., *Sorghum* spp. и *Melinus* spp.

20           Предпочтительные примеры однодольных сорняков, на которые эффективно действуют фенилурацилы формулы (I) выбраны из видов *Hordeum murinum*, *Echinochloa crus-galli*, *Poa annua*, *Bromus rubens* L., *Bromus rigidus*, *Bromus secalinus* L., *Digitaria sanguinalis*, *Digitaria insularis*, *Eriochloa gracilis*, *Setaria faberi*, *Setaria viridis*, *Pennisetum glaucum*, *Eleusine indica*, *Eragrostis pectinacea*, *Panicum miliaceum*, *Lolium multiflorum*, *Brachiaria platyphylla*, *Leptochloa fusca*, *Avena fatua*, *Cyperus compressus*, *Cyperus esculentes*, *Axonopris*  
25 *offinis*, *Sorghum halapense* и *Melinus repens*.

Особенно предпочтительные примеры однодольных сорняков, на которые эффективно действуют фенилурацилы формулы (I) выбраны из видов *Echinochloa* spp., *Digitaria* spp., *Setaria* spp., *Eleusine* spp. и *Brachiarium* spp.

30           Также предпочтительно фенилурацилы формулы (I) применяют для борьбы с двудольными сорняками.

Примеры двудольных сорняков, на которые эффективно действуют фенилурацилы формулы (I), выбраны из рода *Amaranthus* spp., *Erigeron* spp., *Conyza* spp., *Polygonum* spp., *Medicago* spp., *Mollugo* spp., *Cyclosperrum* spp., *Stellaria* spp., *Gnaphalium* spp., *Taraxacum* spp., *Oenothera* spp., *Amsinckia* spp.,

Erodium spp., Erigeron spp., Senecio spp., Lamium spp., Kochia spp., Chenopodium spp., Lactuca spp., Malva spp., Ipomoea spp., Brassica spp., Sinapis spp., Urtica spp., Sida spp, Portulaca spp., Richardia spp., Ambrosia spp., Calandrinia spp., Sisymbrium spp., Sesbania spp., Capsella spp., Sonchus spp., Euphorbia spp., Helianthus spp.,  
5 Coronopus spp., Salsola spp., Abutilon spp., Vicia spp., Epilobium spp., Cardamine spp., Picris spp., Trifolium spp., Galinsoga spp., Epimedium spp., Marchantia spp., Solanum spp., Oxalis spp., Metricaria spp., Plantago spp., Tribulus spp., Cenchrus spp. Bidens spp., Veronica spp. и Hypochaeris spp.

Предпочтительные примеры двудольных сорняков, на которые эффективно  
10 действуют фенилурацилы формулы (I), выбраны из рода *Amaranthus spinosus*, *Polygonum convolvulus*, *Medicago polymorpha*, *Mollugo verticillata*, *Cyclosporum leptophyllum*, *Stellaria media*, *Gnaphalium purpureum*, *Taraxacum officinale*, *Oenothera laciniata*, *Amsinckia intermedia*, *Erodium cicutarium*, *Erodium moschatum*, *Erigeron bonariensis* (*Conyza bonariensis*), *Senecio vulgaris*, *Lamium amplexicaule*,  
15 *Erigeron canadensis*, *Polygonum aviculare*, *Kochia scoparia*, *Chenopodium album*, *Lactuca serriola*, *Malva parviflora*, *Malva neglecta*, *Ipomoea hederacea*, *Ipomoea lacunose*, *Brassica nigra*, *Sinapis arvensis*, *Urtica dioica*, *Amaranthus blitoides*, *Amaranthus retroflexus*, *Amaranthus hybridus*, *Amaranthus lividus*, *Sida spinosa*, *Portulaca oleracea*, *Richardia scabra*, *Ambrosia artemisiifolia*,  
20 *Calandrinia caulescens*, *Sisymbrium irio*, *Sesbania exaltata*, *Capsella bursa-pastoris*, *Sonchus oleraceus*, *Euphorbia maculate*, *Helianthus annuus*, *Coronopus didymus*, *Salsola tragus*, *Abutilon theophrasti*, *Vicia benghalensis* L., *Epilobium paniculatum*, *Cardamine* spp, *Picris echioides*, *Trifolium* spp., *Galinsoga* spp., *Epimedium* spp., *Marchantia* spp., *Solanum* spp., *Oxalis* spp., *Metricaria matricarioides*, *Plantago* spp.,  
25 *Tribulus terrestris*, *Salsola kali*, *Cenchrus* spp., *Bidens bipinnata*, *Veronica* spp. и *Hypochaeris radicata*.

В особенности предпочтительные примеры двудольных сорняков, на которые эффективно действуют фенилурацилы формулы (I) выбраны из видов *Amaranthus* spp., *Erigeron* spp., *Conyza* spp., *Kochia* spp. и *Abutilon* spp.

30 Фенилурацилы формулы (I) или содержащие их составы наносят на растения главным образом путем опрыскивания листьев. При этом нанесение может быть осуществлено с использованием, например, воды в качестве носителя обычными методами опрыскивания с использованием количества распыляемого раствора примерно от 100 до 1000 л/га (например, от 300 до 400

л/га). Фенилурацилы формулы (I) или содержащие их составы также можно наносить методом с малым объемом или сверхмалым объемом или в форме микрогранул.

5 Применение фенилурацилов формулы (I) или содержащих их составов можно осуществлять до, во время и/или после, предпочтительно во время и/или после появления нежелательной растительности.

Применение фенилурацилов формулы (I) или составов можно проводить до или во время посева.

10 Фенилурацилы формулы (I) или содержащие их составы могут быть применены путем довсходовой, послевсходовой обработки или вместе с посевным материалом культурного растения. Также существует возможность применять фенилурацилы формулы (I) или содержащие их составы путем

15 внесения посевного материала культурного растения, предварительно обработанного фенилурацилами формулы (I) или содержащими их составами. Если активные ингредиенты хуже переносятся некоторыми сельскохозяйственными культурами, то можно использовать методы нанесения, при которых комбинации распыляют с помощью опрыскивающего оборудования таким образом, что по мере возможности, они не вступают в контакт с листьями чувствительных культурных растений, в то время как активные вещества

20 попадают на листья растущих под ними нежелательных растений или на непокрытые поверхности почвы (метод направленного опрыскивания, ленточного опрыскивания).

В другом варианте осуществления фенилурацилы формулы (I) или содержащие их составы можно использовать путем обработки посевного

25 материала. Обработка посевного материала включает в себя, по сути, все известные специалисту в данной области технические приемы (протравливание семян, покрытие семян, опыливание семян, вымачивание семян, покрытие семян пленкой, многослойное покрытие семян, покрытие семян коркой, просачивание семян и дражирование семян) на основе фенилурацилов формулы (I) или

30 приготовленных из них составов. При этом комбинации можно применять разбавленными или неразбавленными.

Понятие «посевной материал» охватывает семена всех типов, такие как, например, зерна, семена, плоды, клубни, саженцы и аналогичные формы. При этом предпочтительно понятие описывает зерна и семена. Применяемый

посевной материал может быть посевным материалом указанных выше полезных культур, а также посевной материал трансгенных растений или же растений, полученных благодаря обычным методам выращивания.

5 При применении для защиты растений количества вносимых активных веществ, т.е. фенилурацилов формулы (I) без вспомогательных веществ для составов, в зависимости от желаемого эффекта составляют от 0,001 до 2 кг на га, предпочтительно от 0,002 до 1 кг на га, более предпочтительно от 0,005 до 0,5 кг на га и, в частности, от 0,01 до 0,2 кг на га.

10 В другом варианте осуществления изобретения норма внесения фенилурацилов формулы (I) составляет от 0,001 до 3 кг/га, предпочтительно от 0,005 до 2,5 кг/га и в частности от 0,01 до 2 кг/га активного вещества (а.в.).

15 В другом предпочтительном варианте осуществления изобретения нормы внесения фенилурацилов формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением (общее количество фенилурацилов формулы (I)) составляет от 0,1 г/га до 3000 г/га, предпочтительно от 10 г/га до 1000 г/га, в зависимости от цели борьбы, времени года, целевых растений и стадии роста.

20 В другом предпочтительном варианте осуществления изобретения нормы внесения фенилурацилов формулы (I) находятся в диапазоне от 0,1 г/га до 5000 г/га и предпочтительно в диапазоне от 1 г/га до 2500 г/га или от 5 г/га до 2000 г/га.

В другом предпочтительном варианте осуществления изобретения нормы внесения фенилурацилов формулы (I) составляют от 0,1 до 1000 г/га, предпочтительно от 1 до 750 г/га, более предпочтительно от 5 до 500 г/га.

25 При обработке материалов для размножения растений, таких как семена, например, опудриванием, покрытием или замачиванием семян обычно требуются количества активного вещества от 0,1 до 1000 г, предпочтительно от 1 до 1000 г, более предпочтительно от 1 до 100 г и наиболее предпочтительно от 5 до 100 г, на 100 килограмм материала для размножения растений (предпочтительно семян).

30 В другом варианте осуществления изобретения для обработки посевного материала количество применяемых активных веществ, т.е. фенилурацилов формулы (I) обычно составляет от 0,001 до 10 кг на 100 кг посевного материала.

Если применяют для защиты материалов или хранящихся продуктов, то количество используемого активного вещества зависит от вида области

применения и от желаемого эффекта. Обычно количества, применяемые для защиты материалов, составляют, например, от 0,001 г до 2 кг, предпочтительно от 0,005 г до 1 кг, активного вещества на метр кубический обрабатываемого материала.

5 В зависимости от рассматриваемого способа применения фенилурацилы формулы (I) или содержащие их составы могут быть дополнительно использованы на других культурных растениях для уничтожения нежелательной растительности.

10 В соответствии с изобретением все упомянутые в настоящей заявке сельскохозяйственные растения (культурные растения) включают все виды, подвиды, варианты и/или гибриды, которые принадлежат соответствующим культурным растениям, включая, помимо прочего, озимые и яровые сорта, в частности в зерновых, таких как пшеница и ячмень, а также в рапсе, например, озимая пшеница, яровая пшеница, озимый ячмень и т. д.

15 Например, кукуруза также известна как индийская кукуруза или маис (*Zea mays*), которая включает в себя все виды кукурузы, такие как полевая кукуруза и сладкая кукуруза. В соответствии с изобретением включены все подвиды и/или сорта маиса или кукурузы, в частности, мучная кукуруза (*Zea mays* var. *amylacea*), попкорн (*Zea mays* var. *everta*), зубчатая кукуруза (*Zea mays* var. *indentata*), кремневая кукуруза (*Zea mays* var. *indurata*), сладкая кукуруза (*Zea mays* var. *saccharata* и var. *rugosa*), восковая кукуруза (*Zea mays* var. *ceratina*), амиломаис (сорта *Zea mays* с высоким содержанием амилозы), стручки кукурузы или дикая кукуруза (*Zea mays* var. *tunicata*) и полосатая кукуруза (*Zea mays* var. *japonica*).

25 Кроме того, большинство сортов соевых бобов можно разделить на индетерминантный и детерминантный тип роста, тогда как *Glycine soja*, дикий прародитель сои, является индетерминантным (PNAS 2010, 107 (19) 8563-856). Индетерминантный тип роста (группа спелости, от MG 00 до MG 4,9) характеризуется продолжением вегетативного роста после начала цветения, тогда как детерминантные сорта соевых бобов (MG 5 - MG 8) обычно заканчивают большую часть своего вегетативного роста к началу цветения. В соответствии с изобретением включены все сорта или разновидности соевых бобов, в частности, индетерминантные и детерминантные сорта или разновидности.

Примерами подходящих сельскохозяйственных культур являются следующие:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Avena sativa, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Brassica oleracea, Brassica nigra, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pistacia vera, Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Prunus armeniaca, Prunus cerasus, Prunus dulcis и Prunus domestica, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Sinapis alba, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticale, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera и Zea mays.

Предпочтительными сельскохозяйственными культурами являются Arachis hypogaea, Beta vulgaris spec. altissima, Brassica napus var. napus, Brassica oleracea, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cynodon dactylon, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hordeum vulgare, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Medicago sativa, Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Pistacia vera, Pisum sativum, Prunus dulcis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Triticale, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera и Zea mays.

В особенности предпочтительными сельскохозяйственными культурами являются культуры зерновых, кукурузы, соевых бобов, риса, рапса, хлопчатника, картофеля, арахиса или многолетних растений.

Фенилурацилы формулы (I) в соответствии с изобретением или содержащие их составы также могут быть использованы в сельскохозяйственных культурах, которые были модифицированы путем мутагенеза или генной инженерии, чтобы придать растению новый признак или изменить уже существующий признак.

5 Используемый в настоящей заявке термин «сельскохозяйственные растения» включает в себя также (культурные) растения, которые были модифицированы путем мутагенеза или генной инженерии с целью придания растению нового признака или модификации уже имеющегося признака.

10 Мутагенез включает в себя методы случайного мутагенеза с использованием рентгеновских лучей или мутагенных химических веществ, а также методы направленного мутагенеза для создания мутаций в определенном локусе генома растения. В методах направленного мутагенеза часто используют олигонуклеотиды или белки, такие как CRISPR/Cas, нуклеазы с цинковыми пальцами, TALEN или мегануклеазы для достижения целевого эффекта.

15 В генной инженерии обычно используют методы рекомбинантной ДНК для создания модификаций в геноме растений, которые в естественных условиях не могут быть легко получены путем скрещивания, мутагенеза или естественной рекомбинации. Как правило, один или несколько генов интегрируются в геном растения, чтобы добавить признак или улучшить признак. В уровне техники эти интегрированные гены также называют трансгенами, при этом растения, содержащие такие трансгены, называют трансгенными растениями. Процесс трансформации растений обычно приводит к нескольким трансформационным событиям, которые отличаются геномным локусом, в который был интегрирован трансген. Растения, содержащие конкретный трансген в определенном геномном локусе, обычно описаны как включающие в себя конкретное «событие», которое известно под конкретным названием события. Признаки, которые были введены в растения или модифицированы, включают в себя, в частности, устойчивость к гербицидам, устойчивость к насекомым, повышенную урожайность и устойчивость к абиотическим условиям, таким как засуха.

30 Устойчивость к гербицидам была создана с помощью мутагенеза и генной инженерии. Растения, которым с помощью обычных методов мутагенеза и селекции придали устойчивость к гербицидам-ингибиторам ацетолактатсинтазы (ALS), относятся сорта растений, коммерчески доступные под названием

Clearfield®. Однако большинство признаков устойчивости к гербицидам были созданы с помощью трансгенов.

Была создана гербицидная устойчивость к глифосату, глюфосинату, 2,4-D, дикамба, оксиниловым гербицидам, таким как бромоксинил и иоксинил, гербицидам сульфонилмочевины, гербицидам-ингибиторам ALS и ингибиторам 4-гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD), таким как изоксафлутол и мезотрион.

Трансгены, которые были использованы для обеспечения признаков устойчивости к гербицидам, включают в себя: для устойчивости к глифосату: *cp4 epsps*, *epsps grg23ace5*, *mepsps*, *2mepsps*, *gat4601*, *gat4621* и *goxv247*, для устойчивости к глюфосинату: *pat* и *bar*, для устойчивости к 2,4-D: *aad-1* и *aad-12*, для устойчивости к дикамба: *dmo*, для устойчивости к оксиниловым гербицидам: *bxn*, для устойчивости к гербицидам сульфонилмочевины: *zm-hra*, *csr1-2*, *gm-hra*, *S4-HrA*, для устойчивости к гербицидам-ингибиторам ALS: *csr1-2*, для устойчивости к гербицидам-ингибиторам HPPD: *hppdPF*, *W336* и *avhppd-03*.

События трансгенной кукурузы, содержащие гены устойчивости к гербицидам, включают в себя, но не исключая других, *DAS40278*, *MON801*, *MON802*, *MON809*, *MON810*, *MON832*, *MON87411*, *MON87419*, *MON87427*, *MON88017*, *MON89034*, *NK603*, *GA21*, *MZHG0JG*, *HCEM485*, *VCO-Ø1981-5*, *676*, *678*, *680*, *33121*, *4114*, *59122*, *98140*, *Bt10*, *Bt176*, *CBH-351*, *DBT418*, *DLL25*, *MS3*, *MS6*, *MZIR098*, *T25*, *TC1507* и *TC6275*.

События трансгенных соевых бобов, содержащие гены устойчивости к гербицидам, включают в себя, но не исключая других, *GTS 40-3-2*, *MON87705*, *MON87708*, *MON87712*, *MON87769*, *MON89788*, *A2704-12*, *A2704-21*, *A5547-127*, *A5547-35*, *DP356043*, *DAS44406-6*, *DAS68416-4*, *DAS-81419-2*, *GU262*, *SYHTØH2*, *W62*, *W98*, *FG72* и *CV127*.

События трансгенного хлопчатника, содержащие гены устойчивости к гербицидам, включают в себя, но не исключая других, *19-51a*, *31707*, *42317*, *81910*, *281-24-236*, *3006-210-23*, *BXN10211*, *BXN10215*, *BXN10222*, *BXN10224*, *MON1445*, *MON1698*, *MON88701*, *MON88913*, *GHB119*, *GHB614*, *LLCotton25*, *T303-3* и *T304-40*.

События трансгенной канолы, содержащие гены устойчивости к гербицидам, представляют собой, например, но не исключая других, *MON88302*,

HCR-1, HCN10, HCN28, HCN92, MS1, MS8, PHY14, PHY23, PHY35, PHY36, RF1, RF2 и RF3.

Устойчивость к насекомым в основном была создана путем переноса бактериальных генов инсектицидных белков растениям. Трансгенами, обеспечивающими устойчивость к насекомым, являются гены токсинов *Bacillus* spp. и их синтетические варианты, такие как *cry1A*, *cry1Ab*, *cry1Ab-Ac*, *cry1Ac*, *cry1A.105*, *cry1F*, *cry1Fa2*, *cry2Ab2*, *cry2Ae*, *mcry3A*, *escry3.1Ab*, *cry3Bb1*, *cry34Ab1*, *cry35Ab1*, *cry9C*, *vip3A(a)*, *vip3Aa20*. Тем не менее, гены растительного происхождения также были перенесены на другие растения. В частности, гены, кодирующие ингибиторы протеаз, такие как *CpTI* и *pinII*. В другом подходе используют трансгены для производства двухцепочечной РНК в растениях для нацеливания и подавления генов насекомых. Примером для такого трансгена является *dvsnf7*.

События трансгенной кукурузы, содержащие гены инсектицидных белков или двухцепочечной РНК включают в себя, но не исключая других, *Bt10*, *Bt11*, *Bt176*, *MON801*, *MON802*, *MON809*, *MON810*, *MON863*, *MON87411*, *MON88017*, *MON89034*, *33121*, *4114*, *5307*, *59122*, *TC1507*, *TC6275*, *CBH-351*, *MIR162*, *DBT418* и *MZIR098*.

События трансгенных соевых бобов, содержащие гены инсектицидных белков, включают в себя, но не исключая других, *MON87701*, *MON87751* и *DAS-81419*.

События трансгенного хлопчатника, содержащие гены инсектицидных белков, включают в себя, но не исключая других, *SGK321*, *MON531*, *MON757*, *MON1076*, *MON15985*, *31707*, *31803*, *31807*, *31808*, *42317*, *BNLA-601*, *Event1*, *COT67B*, *COT102*, *T303-3*, *T304-40*, *GFM Cry1A*, *GK12*, *MLS 9124*, *281-24-236*, *3006-210-23*, *GHB119* и *SGK321*.

Увеличение урожайности было достигнуто за счет увеличения биомассы початков с использованием трансгена *athb17*, присутствующего в событии кукурузы *MON87403*, или за счет усиления фотосинтеза с использованием трансгена *bbx32*, присутствующего в событии сои *MON87712*.

Культурные растения с модифицированным содержанием масла были созданы с использованием трансгенов: *gm-fad2-1*, *Pj.D6D*, *Nc.Fad3*, *fad2-1A* и *fatb1-A*. Событиями соевых бобов, содержащих по меньшей мере один из этих генов, являются: *260-05*, *MON87705* и *MON87769*.

Устойчивость к абиотическим условиям, в частности, устойчивость к засухе, была создана с использованием трансгена *cspB*, входящего в состав события кукурузы MON87460, и с помощью трансгена *Nahb-4*, входящего в состав события сои IND-00410-5.

5           Признаки часто сочетают путем комбинирования генов в трансформационном событии или путем комбинирования различных событий в процессе разведения. Предпочтительной комбинацией признаков является гербицидная устойчивость к разным группам гербицидов, устойчивость к различным видам насекомых, в частности, устойчивость к чешуекрылым и жесткокрылым насекомым, гербицидная устойчивость с одним или несколькими типами устойчивости к насекомым, гербицидная устойчивость вместе с повышенным урожаем, а также комбинация гербицидной устойчивости и устойчивости к абиотическим условиям.

15           Растения, обладающие сингулярными или пирамидированными друг на друга признаками, а также гены и события, обеспечивающие эти признаки, хорошо известны в данной области. Например, подробная информация о мутагенизированных или интегрированных генах и соответствующих событиях доступна на веб-сайтах организаций «International Service for the Acquisition of Agri-biotech Applications (ISAAA)» (<http://www.isaaa.org/gmapprovaldatabase>) и «Center for Environmental Risk Assessment (CERA)» (<http://ceragmc.org/GMCropDatabase>), а также в патентных заявках, таких как EP 3028573 и WO 2017/011288.

25           Применение соединений формулы (I) или содержащих их составов или комбинаций в соответствии с изобретением на сельскохозяйственных растениях может приводить к эффектам, специфичным для культурного растения, содержащего определенный ген или событие. Эти эффекты могут включать в себя изменения в поведении роста или изменение устойчивости к факторам биотического или абиотического стресса. Такие эффекты могут, в частности, включать в себя повышенную урожайность, повышенную устойчивость или толерантность к насекомым, нематодам, грибковым, бактериальным, микоплазменным, вирусным или виroidным патогенам, а также раннюю силу, раннее или замедленное созревание, устойчивость к холоду или жаре, а также измененный спектр или содержание аминокислот или жирных кислот.

Кроме того, также охвачены растения, которые благодаря применению технологий рекомбинантной ДНК содержат измененное количество содержащихся веществ или новых веществ, в особенности, для улучшения выработки сырьевого материала, например, картофель, который вырабатывает повышенные количества амилопектина (например, картофель Amflora®, BASF SE, Германия).

Кроме того, было обнаружено, что фенилурацилы формулы (I) в соответствии с изобретением или содержащие их составы также пригодны для дефолиации и/или десикации частей сельскохозяйственных растений, таких как хлопчатник, картофель, масличный рапс, подсолнечник, соевые бобы или конские бобы, в частности хлопчатник. В этом отношении были найдены составы для десикации и/или дефолиации сельскохозяйственных растений, способы получения этих составов и способы десикации и/или дефолиации растений с применением фенилурацилов формулы (I).

В качестве десикантов фенилурацилы формулы (I) пригодны, в частности, для десикации надземных частей сельскохозяйственных растений, таких как картофель, масличный рапс, подсолнечник и соевые бобы, а также зерновые культуры. Это способствует полностью механизированному сбору урожая этих важных сельскохозяйственных растений.

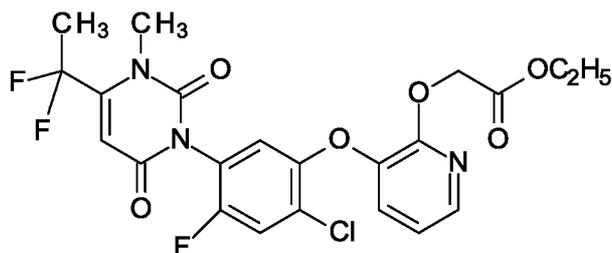
Экономический интерес также представляет облегчение сбора урожая, которое становится возможным за счет сосредоточения в течение определенного периода времени раскрытия, или снижения прикрепления к дереву цитрусовых плодов, оливок, а также других видов и сортов семечковых плодов, косточковых плодов и орехов. Тот же самый механизм, то есть ускорение развития отделяющей ткани между плодовой частью или листовой частью и стеблевой частью растений также имеет значение для контролируемой дефолиации полезных растений, в частности хлопчатника.

Более того, сокращение временного интервала, в течение которого созревают отдельные растения хлопчатника, приводит к повышению качества волокна после уборки урожая.

А Примеры получения

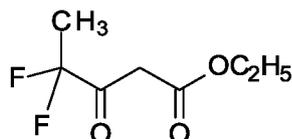
Пример 1.1:

Этил 2-[[[3-[2-хлор-5-[4-(1,1-дифторэтил)-3-метил-2,6-диоксо-пиримидин-1-ил]-4-фтор-фенокси]-2-пиридил]окси]ацетат



Пример 1.1 - стадия 1:

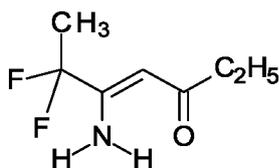
Этил-4,4-дифтор-3-оксо-пентаноат



- 5 К раствору коммерчески доступного этил-2,2-дифторпропаноата (CAS 28781-85-3; 114 г, 826,1 ммоль) в тетрагидрофуране (THF) добавляли этилацетат (87,6 г, 991,3 ммоль) при 15 °С, затем добавляли NaH (39,7 г, 991,3 ммоль) при 0 °С. Смесь перемешивали при 15 °С в течение 16 ч. Смесь выливали в воду, экстрагировали с помощью этилацетата, органические слои промывали
- 10 рассолом, сушили над Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, фильтровали и концентрировали с получением этил 4,4-дифтор-3-оксо-пентаноата (140 г, неочищенный) в виде коричневого масла, которое использовали непосредственно в следующей стадии.

Пример 1.1 - стадия 2:

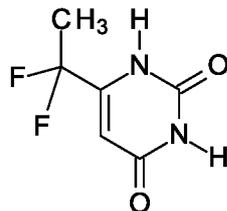
Этил (Z)-3-амино-4,4-дифтор-пент-2-еноат



- 15 К раствору этил 4,4-дифтор-3-оксо-пентаноата (140 г, 778 ммоль) в этаноле и H<sub>2</sub>O добавляли ацетат аммония (180 г, 2333 ммоль) при 15 °С и перемешивали при 90 °С в течение 16 ч. Смесь выливали в воду и экстрагировали с помощью этилацетата. Органические слои промывали рассолом, сушили и
- 20 концентрировали с получением этил (Z)-3-амино-4,4-дифтор-пент-2-еноата (120 г, неочищенный) в виде коричневого масла, которое использовали непосредственно в следующей стадии.

Пример 1.1 - стадия 3:

6-(1,1-Дифторэтил)-1H-пиримидин-2,4-дион

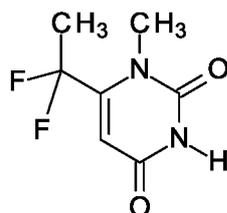


К раствору этил (Z)-3-амино-4,4-дифтор-пент-2-еноата (30 г, 167,6 ммоль) в  
5 диметилформамиде (DMF), добавляли KNCO (203,6 г, 2514 ммоль) и  
перемешивали при 140 °С в течение 96 ч. Смесь концентрировали для удаления  
DMF, неочищенный продукт растирали посредством метил-*трет*-бутилового  
эфира (МТБЕ), фильтровали, затем выливали в воду, водную фазу доводили до  
рН < 1, фильтровали и водную фазу экстрагировали с помощью этилацетата.  
10 Органические слои промывали рассолом, сушили над Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, фильтровали и  
концентрировали с получением 6-(1,1-дифторэтил)-1H-пиримидин-2,4-диона (17  
г, 57,6 %) в виде твердого вещества коричневого цвета.

<sup>1</sup>H ЯМР (400 МГц, ДМСО): δ част. на млн. = 11.42 (s, 1H), 11.37 (s, 1H),  
5.71 (s, 1H), 1.94 (t, 3H)

15 Пример 1.1 - стадия 4:

6-(1,1-Дифторэтил)-1-метил-пиримидин-2,4-дион

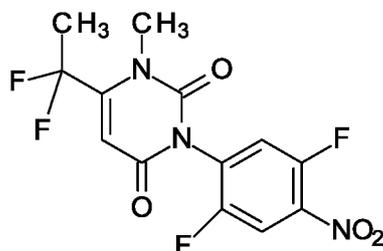


К раствору 6-(1,1-дифторэтил)-1H-пиримидин-2,4-диона (17 г, 96,6 ммоль)  
в THF добавляли *трет*-бутанолат калия (t-BuOK) (13 г, 115,9 ммоль) и  
20 CF<sub>3</sub>SO<sub>3</sub>CH<sub>3</sub> (19,3 г, 115,9 ммоль) медленно при 0 °С под N<sub>2</sub>. Затем смесь  
перемешивали при 15 °С в течение 4 ч. Смесь концентрировали для удаления  
THF, неочищенный продукт выливали в воду (500 мл), водную фазу доводили до  
рН=7, экстрагировали с помощью этилацетата, органические слои промывали  
рассолом, сушили над Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, фильтровали и концентрировали с получением 6-  
25 (1,1-дифторэтил)-1-метил-пиримидин-2,4-диона (13 г, неочищенный) в виде

желтого твердого вещества, которое использовали непосредственно на следующей стадии.

Пример 1.1 - стадия 5:

5 6-(1,1-Дифторэтил)-3-(2,5-дифтор-4-нитро-фенил)-1-метил-пиримидин-2,4-дион

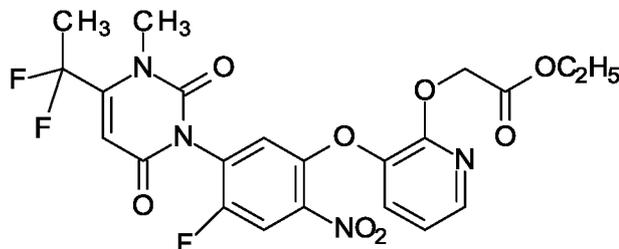


К смеси 6-(1,1-дифторэтил)-1-метил-пиримидин-2,4-диона (3,5 г, 18,4 ммоль) в DMF (40 мл) добавляли 1,2,4-трифтор-5-нитро-бензол (3,9 г, 22 ммоль) и Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (7,7 г, 22 ммоль) при 20 °С. Смесь перемешивали при 80 °С в течение 10 16 ч. под N<sub>2</sub>. Смесь выливали в воду и экстрагировали с помощью этилацетата. Органический слой промывали рассолом, сушили над Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, концентрировали и очищали с помощью колоночной хроматографии (этилацетат в петролейном эфире; увеличение доли этилацетата от 0 % до 100 %) с получением 6-(1,1-дифторэтил)-3-(2,5-дифтор-4-нитро-фенил)-1-метил-пиримидин-2,4-диона (4,7 г, 15 73,6 %).

<sup>1</sup>H ЯМР (CDCl<sub>3</sub> 400 МГц): δ част. на млн. = 7.99 (dd, 1H), 7.32 (dd, 1H), 6.18 (s, 1H), 3.60 (s, 3H), 2.08 (t, 3H)

Пример 1.1 - стадия 6:

20 Этил 2-[[3-[5-[4-(1,1-дифторэтил)-3-метил-2,6-диоксо-пиримидин-1-ил]-4-фтор-2-нитро-фенокси]-2-пиридил]окси]ацетат

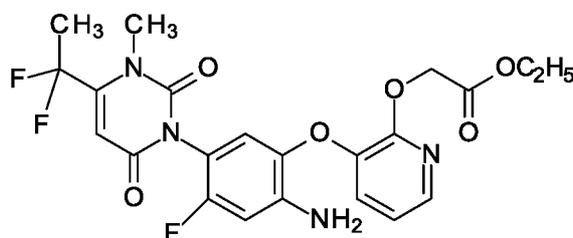


К раствору 6-(1,1-дифторэтил)-3-(2,5-дифтор-4-нитро-фенил)-1-метил-пиримидин-2,4-диона (3,47 г, 10 моль) в DMF, добавляли этил 2-[(3-гидрокси-2-пиридил)окси]ацетат (3 г, 15 моль) и  $K_2CO_3$  (2,76 г, 20 моль). Полученную смесь перемешивали при 15 °С в течение 12 ч. Смесь выливали в воду и

5 экстрагировали с помощью этилацетата. Органические слои промывали рассолом, сушили над  $Na_2SO_4$ , фильтровали и концентрировали с получением неочищенного этил 2-[[3-[5-[4-(1,1-дифторэтил)-3-метил-2,6-диоксо-пиримидин-1-ил]-4-фтор-2-нитро-фенокси]-2-пиридил]окси]ацетата (5,2 г, неочищенный), который использовали непосредственно на следующей стадии.

10 Пример 1.1 - стадия 7:

Этил 2-[[3-[2-амино-5-[4-(1,1-дифторэтил)-3-метил-2,6-диоксо-пиримидин-1-ил]-4-фтор-фенокси]-2-пиридил]окси]ацетат

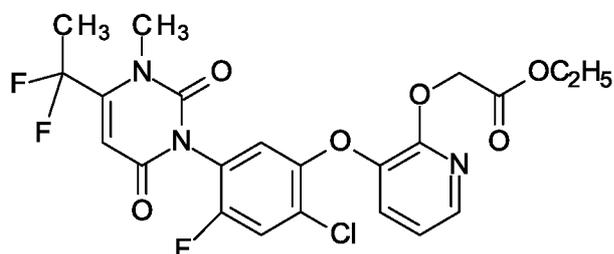


15 К раствору этил 2-[[3-[5-[4-(1,1-дифторэтил)-3-метил-2,6-диоксо-пиримидин-1-ил]-4-фтор-2-нитро-фенокси]-2-пиридил]окси]ацетата (5,2 г, 10 ммоль) в 40 мл этанола добавляли  $H_2O$ , Fe (2,8 г, 50 ммоль) и  $NH_4Cl$  (2,7 г, 50 ммоль) при 15 °С. Смесь перемешивали при 80 °С в течение 1 ч. Затем смесь фильтровали, концентрировали и очищали с помощью колоночной хроматографии с получением этил 2-[[3-[2-амино-5-[4-(1,1-дифторэтил)-3-метил-2,6-диоксо-пиримидин-1-ил]-4-фтор-фенокси]-2-пиридил]окси]ацетата (4 г, 80 %) в виде желтого масла, которое использовали непосредственно на следующей стадии.

20

Пример 1.1 - стадия 8:

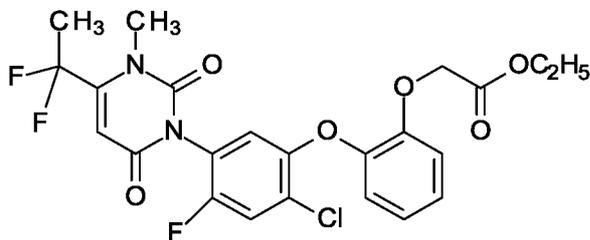
Этил 2-[[3-[2-хлор-5-[4-(1,1-дифторэтил)-3-метил-2,6-диоксо-пиримидин-1-ил]-4-фтор-фенокси]-2-пиридил]окси]ацетат



- 5 К смеси этил-2-[[3-[2-амино-5-[4-(1,1-дифторэтил)-3-метил-2,6-диоксо-пиримидин-1-ил]-4-фтор-фенокси]-2-пиридил]окси]ацетата (4 г, 8 ммоль) в ацетонитриле добавляли  $\text{CuCl}$  (4 г, 40 ммоль),  $\text{CuCl}_2$  (5,4 г, 40 ммоль) и *трет*-бутилнитрил (4 г, 40 ммоль) при 15 °С. Смесь перемешивали при 15 °С в течение 30 мин. Смесь выливали в воду и экстрагировали с помощью этилацетата.
- 10 Органический слой промывали рассолом, сушили над безводным  $\text{Na}_2\text{SO}_4$ , концентрировали и очищали с помощью препаративной ВЕЖХ (ацетонитрил- $\text{H}_2\text{O}$  с трифторуксусной кислотой) с получением этил 2-[[3-[2-хлор-5-[4-(1,1-дифторэтил)-3-метил-2,6-диоксо-пиримидин-1-ил]-4-фтор-фенокси]-2-пиридил]окси]ацетата (2,2 г, 53,6 %) в виде твердого вещества желтого цвета.
- 15  $^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$  400 МГц):  $\delta$  част. на млн. = 7.91 (dd, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.29 (dd, 1H), 6.98 - 6.85 (m, 2H), 6.09 (s, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.18 (q, 2H), 3.54 (s, 3H), 2.03 (t, 3H), 1.25 (t, 3H).

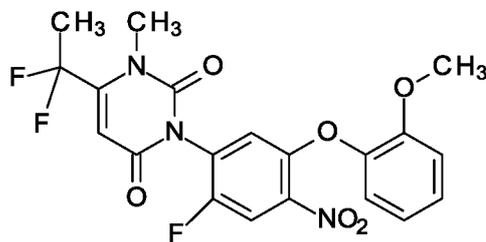
Пример 1.2:

20 Этил 2-[[3-[2-хлор-5-[4-(1,1-дифторэтил)-3-метил-2,6-диоксо-пиримидин-1-ил]-4-фтор-фенокси]-2-фенокси]ацетат



Пример 1.2 - стадия 1:

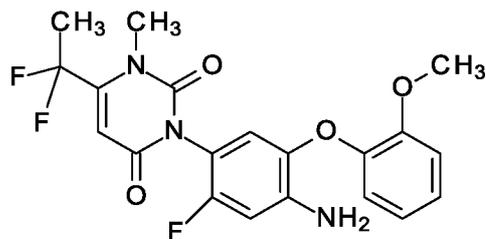
6-(1,1-дифторэтил)-3-[2-фтор-5-(2-метоксифенокси)-4-нитро-фенил]-1-метил-пиримидин-2,4-дион



5 К раствору 6-(1,1-дифторэтил)-3-(2,5-дифтор-4-нитро-фенил)-1-метил-пиримидин-2,4-диона (3,47 г, 10 ммоль, см. Пример 1 - стадия 5) в 50 мл ацетонитрила добавляли 2-метоксифенол (1,4 г, 11 ммоль) и  $K_2CO_3$  (6,5 г, 20 ммоль). Полученную смесь перемешивали при 20 °С в течение 16 часов. Смесь выливали в воду, экстрагировали этилацетатом, органические слои промывали  
10 рассолом, сушили над  $Na_2SO_4$ , фильтровали и концентрировали с получением 6-(1,1-дифторэтил)-3-[2-фтор-5-(2-метоксифенокси)-4-нитро-фенил]-1-метил-пиримидин-2,4-диона (10 г, неочищенный), который использовали непосредственно на следующей стадии.

Пример 1.2 - стадия 2:

15 3-[4-Амино-2-фтор-5-(2-метоксифенокси)фенил]-6-(1,1-дифторэтил)-1-метил-пиримидин-2,4-дион

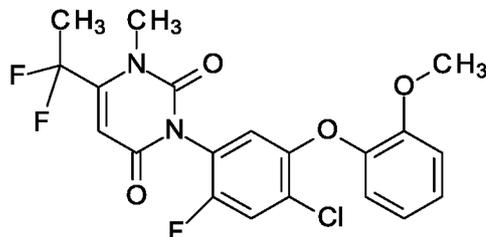


К раствору 6-(1,1-дифторэтил)-3-[2-фтор-5-(2-метоксифенокси)-4-нитро-фенил]-1-метил-пиримидин-2,4-диона (10 г, 22 ммоль) в 80 мл этанола  
20 добавляли воду, Fe (6,21 г, 111 ммоль) и  $NH_4Cl$  (5,9 г, 111 ммоль) при 15 °С. Смесь перемешивали при 80 °С в течение 1 часа, фильтровали, концентрировали и очищали с помощью колоночной хроматографии (этилацетат в петролейном эфире; увеличение части этилацетата от 0 % до 100 %) с получением 3-[4-амино-2-фтор-5-(2-метоксифенокси)фенил]-6-(1,1-дифторэтил)-1-метил-пиримидин-2,4-  
25 диона (7 г, 75 %) в виде твердого вещества желтого цвета.

$^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$ , 400 МГц):  $\delta$  част. на млн. = 7.16 - 6.85 (m, 4H), 6.69 - 6.51 (m, 2H), 6.08 (s, 1H), 4.20 (br s, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 2.01 (t, 3H)

Пример 1.2 - стадия 3:

5 3-[4-Хлор-2-фтор-5-(2-метоксифенокси)фенил]-6-(1,1-дифторэтил)-1-метил-пиримидин-2,4-дион

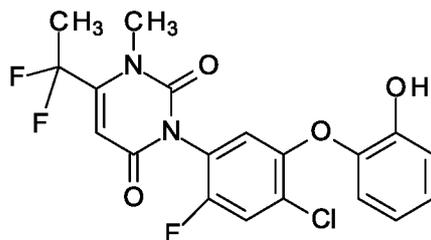


К смеси 3-[4-амино-2-фтор-5-(2-метоксифенокси)фенил]-6-(1,1-дифторэтил)-1-метил-пиримидин-2,4-диона (7 г, 16,6 ммоль) в ацетонитриле добавляли  $\text{CuCl}$  (8,3 г, 83 ммоль),  $\text{CuCl}_2$  (11,2 г, 83 ммоль) и *трет*-бутилнитрил (8,3 г, 83 ммоль) при 15 °С. Смесь перемешивали при 15 °С в течение 30 мин. и затем выливали в воду и экстрагировали с помощью этилацетата. Органический слой промывали рассолом, сушили над безводным  $\text{Na}_2\text{SO}_4$ , концентрировали и очищали с помощью колоночной хроматографии (этилацетат в петролейном эфире; увеличение части этилацетата от 0 % до 15 %) с получением 3-[4-хлор-2-фтор-5-(2-метоксифенокси)фенил]-6-(1,1-дифторэтил)-1-метил-пиримидин-2,4-диона (7,2 г, неочищенный).

20  $^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$ , 400 МГц):  $\delta$  част. на млн. = 7.36 (d,  $J=8.9$  Гц, 1H), 7.21 - 7.12 (m, 1H), 7.07 - 6.89 (m, 3H), 6.63 (d,  $J=6.6$  Гц, 1H), 6.09 (s, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 2.01 (t, 3H)

Пример 1.2 - стадия 4:

3-[4-Хлор-2-фтор-5-(2-гидроксифенокси)фенил]-6-(1,1-дифторэтил)-1-метил-пиримидин-2,4-дион

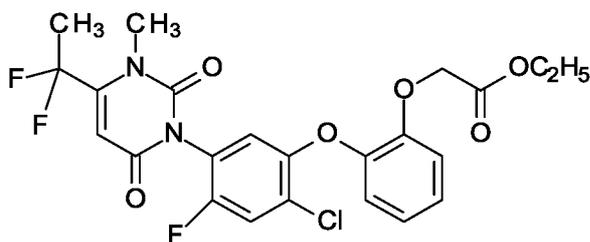


25 К смеси 3-[4-хлор-2-фтор-5-(2-метоксифенокси)фенил]-6-(1,1-дифторэтил)-1-метил-пиримидин-2,4-диона (7,2 г, 16,4 ммоль) в дихлорметане добавляли

ВВr<sub>3</sub> (8,2 г, 32,7 ммоль) при 0 °С. Смесь перемешивали при 20 °С в течение 1 часа, затем выливали в воду и экстрагировали дихлорметаном. Органический слой промывали рассолом, сушили над безводным Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> и концентрировали с получением 3-[4-хлор-2-фтор-5-(2-гидроксифенокси)фенил]-6-(1,1-дифторэтил)-1-метил-пиримидин-2,4-диона (6 г, 86 %), который использовали непосредственно на следующей стадии.

Пример 1.2 - стадия 5:

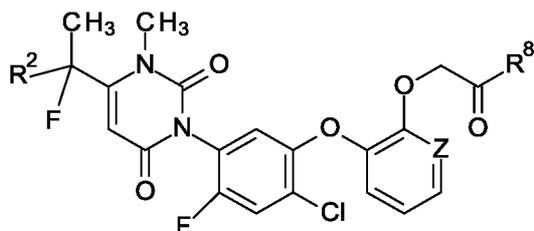
Этил 2-[[3-[2-хлор-5-[4-(1,1-дифторэтил)-3-метил-2,6-диоксо-пиримидин-1-ил]-4-фтор-фенокси]-2-фенокси]ацетат



К смеси 3-[4-хлор-2-фтор-5-(2-гидроксифенокси)фенил]-6-(1,1-дифторэтил)-1-метил-пиримидин-2,4-диона (6 г, 14,08 ммоль) в ацетонитриле добавляли K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (3,9 г, 28,2 ммоль) и этил 2-бромацетат (3,53 г, 21,1 ммоль) при 20 °С. Смесь перемешивали при 20 °С в течение 16 часов, затем выливали в воду и экстрагировали с помощью этилацетата. Органический слой промывали рассолом, сушили над безводным Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, концентрировали и очищали с помощью колоночной хроматографии (этилацетат в петролейном эфире; увеличение части этилацетата от 0 % до 15 %) с получением этил-2-[[3-[2-хлор-5-[4-(1,1-дифторэтил)-3-метил-2,6-диоксо-пиримидин-1-ил]-4-фтор-фенокси]-2-фенокси]ацетата (4,09 г, 56,7 %).

<sup>1</sup>H ЯМР (CDCl<sub>3</sub> 400 МГц): δ част. на млн. = 7.36 (d, J=8.9 Гц, 1H), 7.15 - 7.09 (m, 1H), 7.08 - 7.03 (m, 1H), 7.02 - 6.96 (m, 1H), 6.93 (d, J=8.1 Гц, 1H), 6.77 (d, J=6.6 Гц, 1H), 6.08 (s, 1H), 4.65 (s, 2H), 4.21 (q, J=7.1 Гц, 2H), 3.53 (s, 3H), 2.01 (t, J=18.8 Гц, 3H), 1.26 (t, J=7.1 Гц, 3H)

Соединения, перечисленные ниже в таблицах 1 и 2, можно получить аналогично указанному выше примеру.

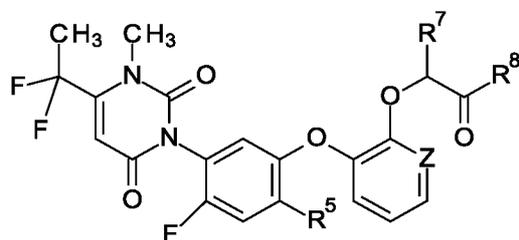


(I), где  
 $R^1$  означает  $CH_3$ ,  $R^3$  и  $R^4$  означают F,  
 $R^5$  означает Cl,  $R^6$  и  $R^7$  означают H,  $n = 1$ ,  
 $Q, W, X, Y^1$  и  $Y^2$  означают O

Таблица 1

№	$R^2$	$R^8$	Z	m/z [M+H]	Ву [мин]
1.1	F	$OC_2H_5$	N	514	1.238
1.2	F	$OC_2H_5$	CH	513	1.257
1.3	F	OH	CH	485	1.095
1.4	F	OH	N	486	1.063
1.5	H	$OC_2H_5$	CH	517*	1.196
1.6	F	$OC_2H_4OCH_3$	N	544	1.179
1.7	F	OCH <sub>2</sub> -2-тетрагидрофуранил	N	570	1.214
1.8	F	OCH <sub>2</sub> CN	N	525	1.162

5 \*m/z [M+Na]



(I), где  
 $R^1$  означает  $CH_3$ ,  $R^3$  и  $R^4$  означают F,  
 $R^6$  означает H,  $n$  означает 1,  
 $Q, W, X, Y^1$  и  $Y^2$  означают O

Таблица 2

№	$R^5$	$R^7$	$R^8$	Z	m/z [M+H]	Ву [мин]
2.1	Cl	$OCH_3$	$OCH_3$	CH	529	1.221
2.2	Br	$OCH_3$	$OCH_3$	CH	573	1.229
2.3	Br	H	OH	N	530	1.071
2.4	Br	H	$OC_2H_5$	N	558	1.236
2.5	Br	H	$OC_2H_4OCH_3$	N	588	1.190
2.6	Br	H	OCH <sub>2</sub> -2-тетрагидрофуранил	N	614	1.225

## В Примеры применения

Гербицидная активность фенилурацилов формулы (I) была показана с помощью следующих экспериментов в теплице:

5 В качестве контейнеров для культивирования использовали пластиковые цветочные горшки, содержащие суглинистый песок с приблизительно 3,0 % гумуса в качестве субстрата. Семена исследуемых растений высевали отдельно для каждого вида.

10 Для довсходовой обработки активные вещества, суспендированные или эмульгированные в воде, вносили непосредственно после посева с помощью мелкораспределяющих форсунок. Контейнеры осторожно орошали, чтобы стимулировать прорастание и рост, а затем накрывали прозрачными пластиковыми колпаками до тех пор, пока испытуемые растения не укоренились. Такое покрытие вызывало равномерное прорастание испытуемых растений, если только активные вещества не нарушали его.

15 Для послевсходовой обработки испытуемые растения сначала выращивали до высоты от 3 до 15 см, в зависимости от места произрастания растения, и только затем обрабатывали активными веществами, которые были суспендированы или эмульгированы в воде. Для этого испытуемые растения или высевали непосредственно и выращивали в одних и тех же емкостях, или  
20 сначала выращивали отдельно в виде рассады и за несколько дней до обработки пересаживали в контейнеры для испытаний.

В зависимости от вида испытуемые растения содержали при 10 – 25 °C или 20 – 35 °C, соответственно.

25 Испытательный период длился от 2 до 3 недель. В течение этого времени за испытуемыми растениями ухаживали и оценивали их реакцию на отдельные обработки.

30 Оценивание проводили по шкале от 0 до 100. 100 означает отсутствие всходов испытуемых растений или полное разрушение по меньшей мере надземных частей, а 0 означает отсутствие повреждений или нормальное течение роста. Хорошая гербицидная активность дается при значениях по меньшей мере 70, а очень хорошая гербицидная активность дается при значениях по меньшей мере 85.

Испытуемые растения, использованные в тепличных экспериментах, принадлежали к следующим видам:

Код Bayer	Научное название
AMARE	<i>Amaranthus retroflexus</i>
CHEAL	<i>Chenopodium album</i>
ERICA	<i>Erigeron canadensis</i>
POLCO	<i>Polygonum convolvulus</i>
SETFA	<i>Setaria faberi</i>
SETVI	<i>Setaria viridis</i>
TRCIN	<i>Digitaria insularis</i>

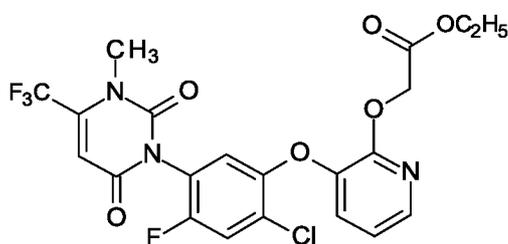
5 При норме внесения 16 г/га соединения (примеры) 1.1, 1.2 и 1.3 применяемой послевсходовым способом, показали очень хорошую гербицидную активность против AMARE, CHEAL, POLCO и SETVI.

При норме внесения 16 г/га соединения (примеры) 1.6, 1.7, 2.5 и 2.6 применяемой довсходовым способом, показали очень хорошую гербицидную активность против AMARE, POLCO и SETVI.

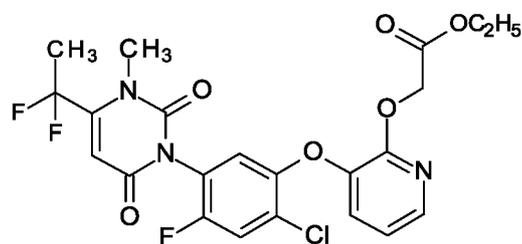
10 При норме внесения 16 г/га соединения (примеры) 1.8, 2.3 и 2.4 применяемой довсходовым способом, показали очень хорошую гербицидную активность против AMARE и SETVI.

15 При норме внесения 16 г/га соединения (примеры) 2.1 и 2.2 применяемой довсходовым способом, показали очень хорошую гербицидную активность против AMARE, CHEAL, POLCO и SETVI.

Таблицы 3, 4 и 5: Сравнение гербицидной активности соединения I-2-8, известного из EP 1 122 244 (8-е соединение Таблицы 2 стр. 75) и примера 1.1 в соответствии с настоящим изобретением:



соединение I-2-8  
известное из EP 1 122 244



пример 1.1  
по настоящему изобретению

Таблица 3 (послевсходовый; теплица)

Соединение	соед. I-2-8 (EP 1 122 244)	пример 1.1
норма внесения [г/га]	4	4
повреждения		
нежелательные растения		
ERICA	65	100
SETFA	90	95
TRCIN	90	100

Таблица 4 (послевсходовый; теплица)

Соединение	соед. I-2-8 (EP 1 122 244)	пример 1.1
норма внесения [г/га]	2	2
повреждения		
нежелательные растения		
SETFA	85	90
TRCIN	90	95

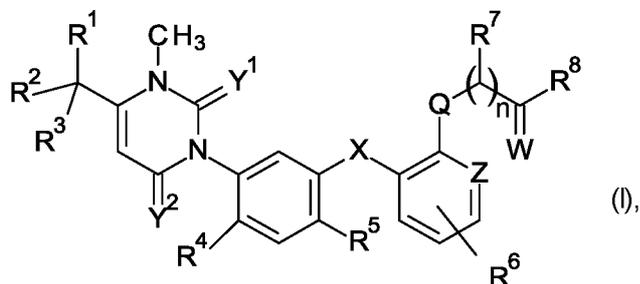
5                    Таблица 5 (послевсходовый; теплица)

Соединение	соед. I-2-8 (EP 1 122 244)	пример 1.1
норма внесения [г/га]	1	1
повреждения		
нежелательные растения		
SETFA	70	80

10                    Замена одного атома фтора у заместителя, присоединенного в 4-положении урацилового кольца (известного из литературных источников), на метильную группу в соответствии с изобретением приводит к лучшей гербицидной активности не только при более высоких, но и при меньших нормах внесения по сравнению с результатами, достигаемыми с помощью соединения I-2-8, известного из EP 1 122 244

ПЕРВОНАЧАЛЬНАЯ ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Фенилурацилы формулы (I)



5 где заместители имеют следующие значения:

$R^1$   $CH_3$ ;

$R^2$  водород, галоген,  $C_1$ - $C_4$ -алкил,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкил,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси или  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси;

10  $R^3$  водород, галоген,  $C_1$ - $C_4$ -алкил,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкил,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси или  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси;

$R^4$  H или галоген;

$R^5$  галоген, CN,  $NH_2$ ,  $NO_2$ ;

$R^6$  H, галоген,  $C_1$ - $C_3$ -алкил,  $C_1$ - $C_3$ -алкокси;

$R^7$  H,  $C_1$ - $C_3$ -алкил,  $C_1$ - $C_3$ -алкокси;

15  $R^8$   $OR^9$ ,  $SR^9$ ,  $NR^{10}R^{11}$ ,  $NR^9OR^9$ ,  $NR^9S(O)_2R^{10}$  или  $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ , где

20  $R^9$  представляет собой водород,  $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -алкенил,  $C_3$ - $C_6$ -алкинил,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкил,  $C_3$ - $C_6$ -галогеналкенил,  $C_3$ - $C_6$ -галогеналкинил,  $C_1$ - $C_6$ -цианоалкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил, ди( $C_1$ - $C_6$ -алкокси) $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -алкенилокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -галогеналкенилокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -алкенилокси- $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкилтио- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкилсульфинил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкилсульфонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкилкарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -алкоксикарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкоксикарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -алкенилоксикарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -алкинилоксикарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил, амино, ( $C_1$ - $C_6$ -алкил)амино, ди( $C_1$ - $C_6$ -алкил)амино, ( $C_1$ - $C_6$ -алкилкарбонил)амино, амино- $C_1$ - $C_6$ -алкил, ( $C_1$ - $C_6$ -алкил)амино- $C_1$ - $C_6$ -алкил, ди( $C_1$ - $C_6$ -алкил)амино- $C_1$ - $C_6$ -алкил, аминокарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил, ( $C_1$ - $C_6$ -алкил)аминокарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил, ди( $C_1$ - $C_6$ -алкил)аминокарбонил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,

$-N=CR^{12}R^{13}$ , где  $R^{12}$  и  $R^{13}$  независимо друг от друга представляют собой H,  $C_1$ - $C_4$ -алкил или фенил;

$C_3$ - $C_6$ -циклоалкил,  $C_3$ - $C_6$ -циклоалкил- $C_1$ - $C_6$ -алкил,  $C_3$ - $C_6$ -гетероцикл,  $C_3$ - $C_6$ -гетероцикл- $C_1$ - $C_6$ -алкил, фенил, фенил- $C_1$ - $C_4$ -алкил или 5- или 6-членный гетероарил,

где каждое циклоалкильное, гетероциклическое, фенильное или гетероарильное кольцо может быть замещено одним-четырьмя заместителями, выбранными из  $R^{14}$  или 3-7-членного карбоцикла,

причем карбоцикл дополнительно к атомам углерода необязательно имеет один или два члена кольца, выбранных из группы, состоящей из

$-N(R^{12})-$ ,  $-N=N-$ ,  $-C(=O)-$ ,  $-O-$  и  $-S-$  и

при этом карбоцикл необязательно замещен одним-четырьмя заместителями, выбранными из  $R^{14}$ ;

где  $R^{14}$  представляет собой галоген,  $NO_2$ , CN,  $C_1$ - $C_4$ -алкил,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкил,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси или  $C_1$ - $C_4$ -алкоксикарбонил;

$R^{10}$ ,  $R^{11}$  независимо друг от друга представляют собой  $R^9$ , или вместе образуют 3-7-членный карбоцикл,

причем карбоцикл дополнительно к атомам углерода необязательно имеет один или два члена кольца, выбранных из группы, состоящей из  $-N(R^{12})-$ ,  $-N=N-$ ,  $-C(=O)-$ ,  $-O-$  и  $-S-$ , и

при этом карбоцикл необязательно замещен одним-четырьмя заместителями, выбранными из  $R^{14}$ ;

n от 1 до 3;

Q, W, X,  $Y^1$ ,  $Y^2$  независимо друг от друга означают O или S;

Z CH или N;

включая их приемлемые в сельском хозяйстве соли, амиды, сложные эфиры или тиоэфиры, при условии, что соединения формулы (I) имеют карбоксильную группу.

2. Фенилурацилы формулы (I) по п. 1, где  $R^2$  и  $R^3$  представляют собой F.

3. Фенилурацилы формулы (I) по п. 1 или 2, где  $R^7$  представляет собой H,  $CH_3$  или  $OCH_3$ .

4. Фенилурацилы формулы (I) по п. 1 или 2, где  $R^7$  представляет собой  $C_1$ - $C_3$ -алкокси.

5. Фенилурацилы формулы (I) по любому из пп. 1 - 4, где  $R^8$  представляет собой  $OR^9$ , где  $R^9$  представляет собой водород или  $C_1$ - $C_6$ -алкил.

6. Фенилурацилы формулы (I) по любому из пп. 1 - 5, где n означает 1.

7. Фенилурацилы формулы (I) по любому из пп. 1 - 6, где Q, W и X представляют собой O.

8. Фенилурацилы формулы (I) по любому из пп. 1 - 7, где Z представляет собой СН.

9. Фенилурацилы формулы (I) по любому из пп. 1 - 7, где Z представляет собой N.

10. Гербицидная композиция, содержащая гербицидно активное количество по меньшей мере одного фенилурацила формулы (I) по п. 1 и по меньшей мере один инертный жидкий и/или твердый носитель и, при необходимости, по меньшей мере одно поверхностно-активное вещество.

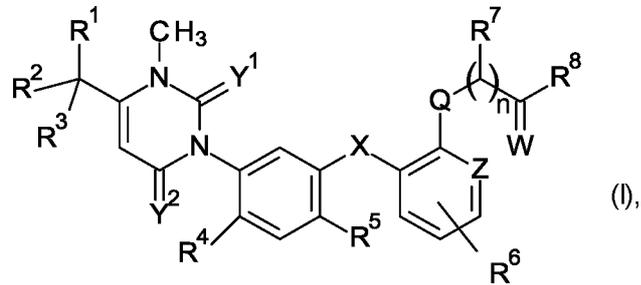
11. Способ получения гербицидно-активных композиций, включающий в себя смешивание гербицидно-активного количества по меньшей мере одного фенилурацила формулы (I) по п. 1 и по меньшей мере одного инертного жидкого и/или твердого носителя и, при желании, по меньшей мере одного поверхностно-активного вещества.

12. Способ борьбы с нежелательной растительностью, включающий в себя воздействие гербицидно активное количества по меньшей мере одного фенилурацила формулы (I) по п. 1 на растения, их окружающую среду или на семена.

13. Применение фенилурацилов формулы (I) по п. 1 в качестве гербицидов.

ИЗМЕНЕННАЯ ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Фенилурацилы формулы (I)



5 где заместители имеют следующие значения:

R<sup>1</sup> CH<sub>3</sub>;

R<sup>2</sup> галоген;

R<sup>3</sup> галоген;

R<sup>4</sup> галоген;

10 R<sup>5</sup> галоген;

R<sup>6</sup> H;

R<sup>7</sup> H или C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкокси;

R<sup>8</sup> OR<sup>9</sup>, где

R<sup>9</sup> представляет собой водород или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил,

15 n 1;

Q, W, X, Y<sup>1</sup>, Y<sup>2</sup> O;

Z CH или N;

включая их приемлемые в сельском хозяйстве соли, сложные эфиры, выбранные из группы, включающей в себя 1-метилгексильный, гептиловый, 20 октиловый, 2-этилгексильный, 2-метоксиэтиловый, 2-этоксиэтиловый, 2-бутоксипропиловый и 3-бутоксипропиловый эфиры или C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкилтио эфиры, при условии, что соединения формулы (I) имеют карбоксильную группу.

25 2. Фенилурацилы формулы (I) по п. 1 где R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> представляют собой F.

3. Фенилурацилы формулы (I) по п. 1 или 2, где R<sup>4</sup> представляет собой F.

4. Фенилурацилы формулы (I) по любому из пп. от 1 до 3, где  $R^5$  представляет собой Cl или Br.
5. Фенилурацилы формулы (I) по любому из пп. 1 - 4, где  $R^7$  представляет собой H или  $OCH_3$ .
6. Фенилурацилы формулы (I) по любому из пп. 1 - 4, где  $R^7$  представляет собой  $C_1$ - $C_3$ -алкокси.
10. 7. Фенилурацилы формулы (I) по любому из пп. 1 - 6, где  $R^9$  представляет собой водород,  $CH_3$  или  $C_2H_5$ .
15. 8. Фенилурацилы формулы (I) по любому из пп. 1 - 7, где Z представляет собой SH.
9. Фенилурацилы формулы (I) по любому из пп. 1 - 7, где Z представляет собой N.
20. 10. Гербицидная композиция, содержащая гербицидно активное количество по меньшей мере одного фенилурацила формулы (I) по п. 1 и по меньшей мере один инертный жидкий и/или твердый носитель и, при необходимости, по меньшей мере одно поверхностно-активное вещество.
25. 11. Способ получения гербицидно активных композиций, включающий в себя смешивание гербицидно активного количества по меньшей мере одного фенилурацила формулы (I) по п. 1 и по меньшей мере одного инертного жидкого и/или твердого носителя и, при желании, по меньшей мере одного поверхностно-активного вещества.
30. 12. Способ борьбы с нежелательной растительностью, включающий в себя воздействие гербицидно активного количества по меньшей мере одного фенилурацила формулы (I) по п. 1 на растения, их окружающую среду или на семена.

13. Применение фенилурацилов формулы (I) по п. 1 в качестве гербицидов.