

Изобретение относится к новому производному урацила, обладающему гербицидным действием.

Огромное разнообразие гербицидов было получено и использовалось на практике для защиты важных сельскохозяйственных культур, таких как рис, соя, пшеница, кукуруза, хлопок, свекла и др., от сорняков для увеличения продуктивности этих сельскохозяйственных культур. В соответствии с местами применения, гербициды можно грубо классифицировать на следующие три этапа: гербициды для суготольных полей; гербициды для рисовых полей и гербициды для непахотных земель. Каждый вид гербицидов далее может быть подразделен на подклассы, в соответствии со способом применения, такие как гербициды, вводимые в почву, предсходные гербициды и послесходные гербициды (для обработки листьев).

С увеличением в последние годы населения во всем мире, нельзя отрицать тот факт, что продуктивность главных сельскохозяйственных культур оказывает серьезное влияние на экономику производства продуктов питания каждой страны, и, таким образом, увеличение продуктивности главных сельскохозяйственных культур в настоящее время является делом первостепенной важности. Людям, занимающимся сельским хозяйством, по-прежнему необходимы гербициды, которые способны экономично и эффективно уничтожать или подавлять рост сорняков и которые не причиняют вреда выращиваемым сельскохозяйственным культурам.

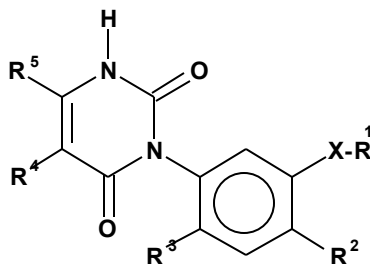
Гербициды должны удовлетворять следующим требованиям: высокий гербицидный эффект при применении небольших количеств; непродолжительное остаточное действие (химикаты, сохраняющие свое действие в почве в течение длительного времени, причиняют вред последующим культурным растениям; быстрое уничтожение сорняков после применения гербицида (обеспечение возможности посева и пересадки последующих сельскохозяйственных культур в течение короткого времени после применения химикатов); наименьшее число обработок гербицидом; широкий диапазон сорняков, уничтожаемых или подавляемых одним гербицидом (желательно, чтобы с помощью применения одного из гербицидов могли уничтожаться или подавляться различные сорняки, такие как широколистные сорняки, травянистые сорняки и многолетние сорняки); разнообразный способ обработки (гербицидный эффект усиливается, если гербицид может применяться различными способами, такими как обработка почвы, листьев и др.); не причинение вреда культурным растениям (на возделываемых полях, где произрастают культурные растения и сорняки, желательно, чтобы с помощью гербицида уничтожались только сорняки).

Тем не менее, все еще не получены гербициды, которые могли бы удовлетворять всем вышеуказанным требованиям.

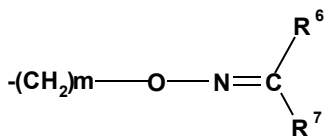
Известно, что некоторые соединения производных урацила обладают гербицидным действием. Например, в справочнике по пестицидам "Pesticide Manual: изд. 8-е, с. 89, опубли. Британским Советом по защите сельскохозяйственных культур. The British Crop Protection Council, 1987, описывается бромацил как один из гербицидов, имеющих урацильную структуру.

Известны также следующие гетероциклические производные, которые могут служить в качестве активного ингредиента для гербицидов.

(1) 3-арилурацил-алкиловые, алкениловые и алкиниленоловые простые эфиры, представленные следующей общей формулой:



где R<sup>1</sup> - (1-8) C-алкил, (2-6) C-алкенил, (2-6) C-алкинил, (2-8) C-алкоксиалкил или:



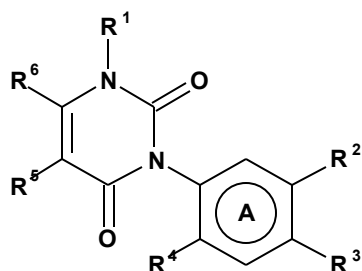
R<sup>2</sup> - галоген или циано;

R<sup>3</sup> - водород или галоген;

R<sup>4</sup> - водород, фтор или (1-4) C-алкил;

R<sup>5</sup> - (1-4) C-алкил, (1-4) C-галоидалкил, или R<sup>4</sup> и R<sup>5</sup> могут вместе представлять три- или тетраметилен (в котором R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> независимо представляют (1-4) C-алкил и m представляет 1 или 2) и X - O, C(=O), C(=O)-C(=O) (патент Японии (Кокаи) № 63-107967).

(2) Соединения, представленные следующей формулой:



где  $R^1$  - водород, (1-4) С-алкил, (1-4) С-галогид-алкил формил или (2-6) С-алканонил;

$R^2$  - простой эфир или остаток, содержащий (тио)карбонилокси или сульфонилокси, причем этот остаток непосредственно связан с бензольным ядром А через атом кислорода;

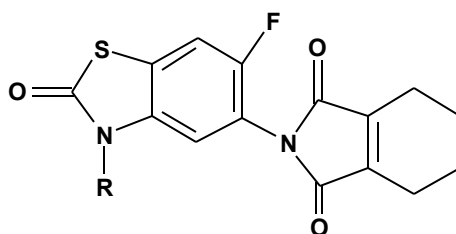
$R^3$  - галоген или циано;

$R^4$  - водород или галоген;

$R^5$  - водород, галоген или (1-4) С-алкил;

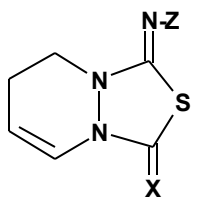
$R^6$  - (1-4)С-алкил или (1-4)С-галогидалкил, или  $R^5$  и  $R^6$  могут вместе представлять три- или тетраметилен и соли соединений указанной формулы, в которой  $R^1$  - водород, (патент Японии (Кокаи) № 63-41466).

(3) Бензотиазолоновые производные, представленные общей формулой:

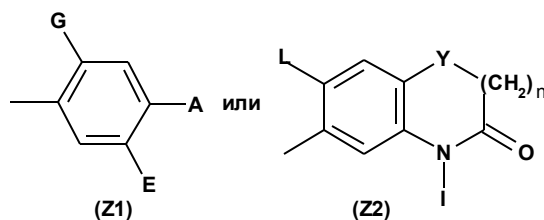


где R - водород, низший алкил, низший алкенил, низший алкинил, низший галоидалкил и низший галоидалкенил, низший галоидалкинил, низший алкокси-низший алкил, низший алкокси-низший алкокси-низший алкил, циннамил или низший цианоалкил (патент Японии № 62-155276).

(4) Конденсированные гетероциклические про-изводные, представленные общей формулой:



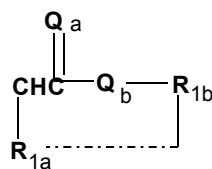
где X - атом кислорода или серы и Z представляет:



в которой G - атом водорода или галогена;

A - атом галогена или нитро, (NO);

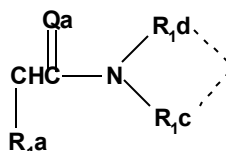
E - атом водорода, атом галогена, C=N, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, OH, SH, OR<sub>1</sub>, где R<sub>1</sub> - (1-5)С-алкил, (3-6)С-циклоалкил, (3-6)С-циклоалкил-(1-2)С-алкинил, (2-4)С-алкенил, (3-4)С-алкинил.



в которой Q<sub>a</sub> и Q<sub>b</sub> - независимо друг от друга атом кислорода или атом серы;

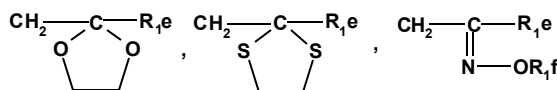
R<sub>1a</sub> - атом водорода или (1-3)С-алкил;

R<sub>1b</sub> - атом водорода, (1-5)С-алкил, (2-5)С-алкенил, (3-5)С-алкинил, (2-3)С-галоидалкил, (1-2)С-алкокси-(1-2)С-алкил, (3-4)С-циклоалкил-(1-2)С-алкил, (3-6)С-циклоалкил, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>-(1-3)С-алкил или CH(CH<sub>3</sub>)-CO<sub>2</sub>-(1-2)С-алкил, или R<sub>1a</sub> и R<sub>1b</sub> вместе образуют 4-6-членное кольцо лактона, составленное метиленовой цепью; группу:



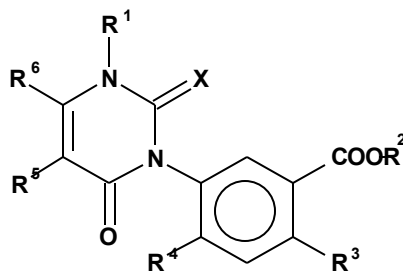
в которой R<sub>1a</sub> и Q<sub>a</sub> имеют те же значения, что определены выше, и R<sub>1c</sub> и R<sub>1d</sub> представляют, независимо друг от друга, атом водорода, (1-5)С-алкил, (2-5)С-алкенил, (3-5)С-алкинил, (2-5)С-галоидалкил, (3-6)С-циклоалкил или (3-6)С-циклоалкил-(1-2)С-алкил, или R<sub>1d</sub> и R<sub>1c</sub> вместе образуют 5-7-членное кольцо, составленное метиленовой цепью;

CH<sub>2</sub>C=N, тетрагидропиранил, тетрагидротио-пиранил, CH<sub>2</sub>COR<sub>1e</sub>:



в которых R<sub>1e</sub> - (1-3)С-алкил, R<sub>2f</sub> - атом водорода, (1-3)С-алкил, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>-(1-3)С-алкил или COCH<sub>3</sub>, или (1-2)С-алкокси-(1-2)С-алкил; SR<sub>3</sub>, в которой R<sub>3</sub> имеет те же значения, что и R<sub>1</sub>, описанный выше; CO<sub>2</sub>R<sub>5</sub>, в которой R<sub>5</sub> - атом водорода, (1-5)С-алкил, (3-6)С-циклоалкил или (3-6)С-циклоалкил-(1-2)С-алкил; NHR<sub>6</sub>, в которой R<sub>6</sub> - (1-5)С-алкил, (3-6)С-циклоалкил, (3-6)С-циклоалкил-(1-2)С-алкил, (2-4)С-алкенил или (3-4)С-алкинил; или CH=NOR<sub>7</sub>, в которой R<sub>7</sub> - атом водорода, (1-5)С-алкил, (3-6)С-циклоалкил, (3-6)С-циклоалкил-(1-2)С-алкил, (2-4)С-алкенил или (3-4)С-алкинил; L-атом водорода или галогена; Y - атом кислорода или атом серы; n - 0 или 1 и J - атом водорода, атом галогена, (1-5)С-алкил, (3-6)С-циклоалкил, (3-6)С-циклоалкил-(1-2)С-алкил, (2-4)С-алкенил, (3-5)С-алкинил, (1-5)С-галоидалкил, (3-4)С-галоид-алкенил, (3-4)С-галоидалкинил, (1-2)С-алкокси-(1-2)С-алкил; CH<sub>2</sub>C=N, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>R<sub>8</sub>, где R<sub>8</sub> - атом водорода, (1-5)С-алкил, (3-6)С-циклоалкил или (3-6)С-циклоалкил-(1-2)С-алкил; или CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>R<sub>9</sub>, где R<sub>9</sub> - атом водорода, (1-5)С-алкил, (3-6)С-циклоалкил или (3-6)С-циклоалкил-(1-2)С-алкил (патент Японии (Кокаи) № 1-250388).

(5) Соединения, представленные следующей формулой:



где R<sup>1</sup> - водород, (1-4)С-алкил, (2-4)С-алкенил, (2-4)С-алкинил, (2-6)С-алкоксиалкил, формил, (2-6)С-алканойл или (2-6)С-алкоксикарбонил;

R<sup>2</sup> - водород, (1-6)С-алкил, (2-4)С-алкенил, (2-4)С-алкинил или (2-6)С-алкоксиалкил;

R<sup>3</sup> - галоген или нитро;

R<sup>4</sup> - водород или галоген;

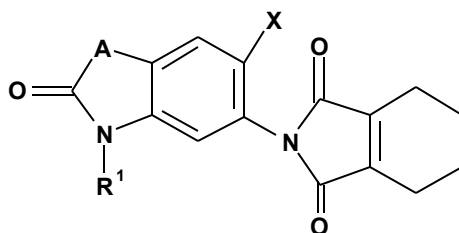
R<sup>5</sup> - водород, галоген, (1-4)С-алкил, хлорметил, бромметил, гидроксиметил, (1-5)С-алкокси-метил, (1-5)С-алкилтиометил, циано, нитро или тиоцианато;

R<sup>6</sup> - водород, (1-4)С-алкил или (1-4)С-фтор-алкил, или R<sup>5</sup> и R<sup>6</sup> вместе представляют три- или тетраметилен, в котором одна из указанных метиленовых групп может быть замещена кислородом или серой, или эти группы могут быть замещены (1-3)С-алкилом;

X - кислород или сера, в которых (1), когда R<sup>5</sup> - фтор, R<sup>6</sup> - (1-4)С-алкил или (1-4)С-фторалкил, и (n),

когда  $R^5$  - циано,  $R^6$  - водород или (1-4)С-алкил, и X представляет кислород, и соли соединений указанной формулы, где  $R^1$  и/или  $R^2$  представляет водород (патент Японии (Кокаи) № 61-221178).

(6) Тетрагидрофталимидные производные, представленные следующей формулой:



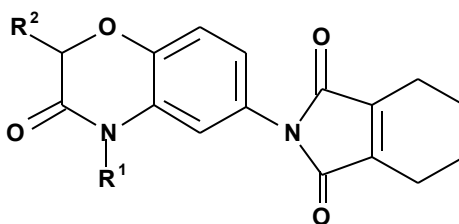
где  $R^1$  - (1-5)С-алкил, (3-5)С-алкенил, (3-5)С-ал-кинил или (1-3)С-алкоксиметил, X - водород, фтор или хлор, и A представляет собой группу формулы:



в которой  $R^2$  - водород или метил;

$R^3$  - водород или метил, и атом азота присоединен к бензольному кольцу (патент Японии (Кокаи) № 61-85385).

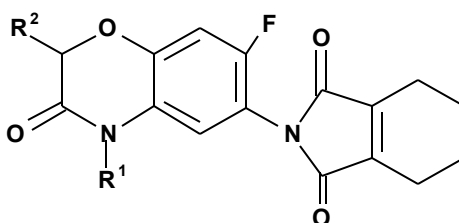
(7) Тетрагидрофталимидные производные, представленные следующей формулой:



где  $R^1$  - алкил, алкенил, алкинил, алкоксиалкил или алкоксиалкоксиалкил;

$R^2$  - водород или метил (патент Японии (Кокаи) № 61-30586).

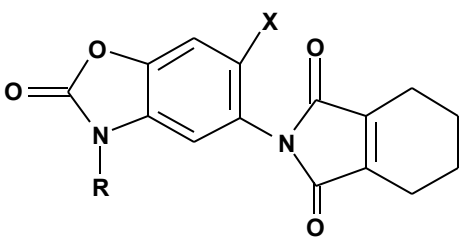
(8) Тетрагидрофталимидные производные, представленные следующей формулой:



где  $R^1$  - алкил, алкенил, алкинил, алкоксиалкил или алкоксиалкоксиалкил;

$R^2$  - водород или метил (патент Японии (Кокаи) № 61-76476).

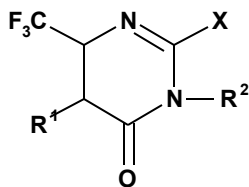
(9) Тетрагидрофталимидные производные, представленные следующей формулой:



где R - (1-5)С-алкил, (3-5)С-алкенил, (3-5)С-алки-нил или (1-3)С-алкоксиметил, X - водород или фтор (патент Японии (Кокаи) № 61-43188).

(10) Гербицидные соединения, имеющие общую формулу:

35550

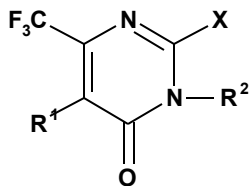


где X - водород или гидроксид;

R<sup>1</sup> - водород или галоген;

R<sup>2</sup> - алкил, циклоалкил, фенил, алкенил и замещенные производные указанных выше соединений (патент США № 3981715).

(11) Гербицидные соединения, имеющие общую формулу:

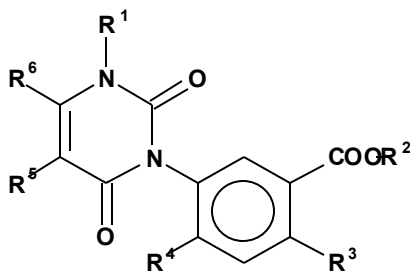


где X - водород или гидроксид;

R<sup>1</sup> - водород или галоген;

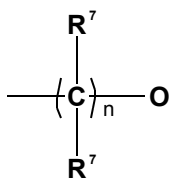
R<sup>2</sup> - алкил, циклоалкил, фенил, алкенил и замещенные производные этих соединений (патент США № 3869457).

(12) Соединения формулы;



где R<sup>1</sup> - водород, (1-4)C-алкил, (3-4)C-алкенил, (3-4)C-алкинил или (1-4)C-галогидалкил;

R<sup>2</sup> - представляет:



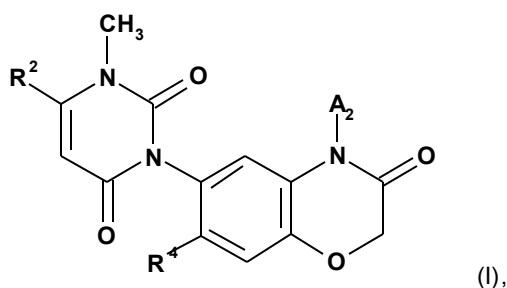
или, когда R<sup>1</sup> - галогидалкил, водород, (1-8)C-алкил, (2-8)C-алкенил, (2-8)C-алкинил или (2-8)C-алкоксиалкил, R<sup>3</sup> - галоген или циано;

R<sup>4</sup> - водород, или галоген и R<sup>5</sup> - водород, фтор или (1-4)C-галогидалкил, а также их энольные простые эфиры или соли (WO 88/10254).

Возникла настоятельная потребность в разработке гербицида, который может удовлетворять упомянутым выше требованиям (1) - (7), а именно,- гербицида, который проявляет избирательное действие, не причиняя вреда культурным растениям, обнаруживает превосходное гербицидное действие при низкой дозе в отношении широкого разнообразия сорняков, а также способен проявлять желаемый эффект как при обработке почвы, так и при обработке листьев.

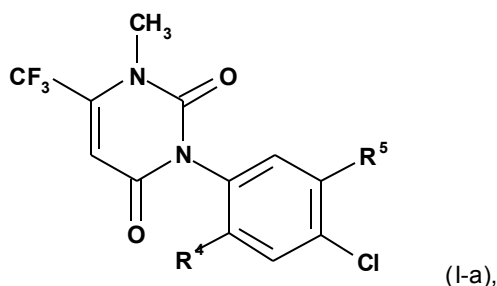
В результате исследований настоящих изобретателей было обнаружено, что производные урацила, имеющие галогидалкильную группу в 6-положении и фенильную группу в 3-положении, которая имеет особый заместитель, представленные общей формулой (1), обладают способностью проникающего передвижения в растениях и очень высокой гербицидной активностью и, по сравнению с обычными гербицидными соединениями, указанные производные урацила могут применяться для обработки как почвы, так и листьев, и оказывают при этом быстрое и высокоэффективное гербицидное действие даже при очень низких дозах против широкого разнообразия сорняков, включая многолетние сорняки, обладают свойством остаточного эффекта в течение приемлемого периода времени.

Согласно первому аспекту изобретения, предусматривается производное урацила, представленное формулой I:



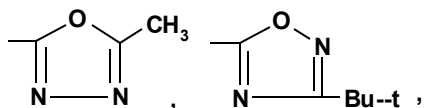
в которой  $R^2$  - трифторметил или пентафтор-метил;  $R^4$  - водород или фтор;  $A_2$  - водород, метил, этил, пропил, аллил, пропарил, 1-метилпро-парил, цианометил, метоксиметил, бензил, ортометилбензил, параметилбензил, или пиколлил.

Согласно второму аспекту изобретения, предусматривается производное урацила, выраженной формулой I-a:



в которой  $R^4$  - водород, фтор или хлор;

$R^5$  - представляет группы \$\$\$:



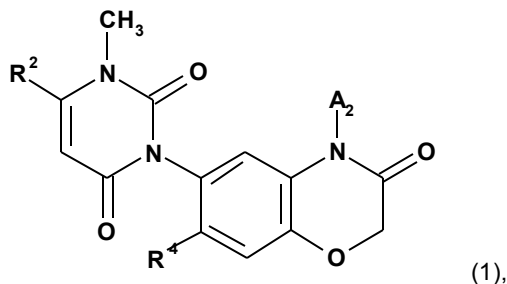
где  $R^{24}$  - метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, 3-хлорпропил или 2,2,2-трифторэтил;

$R^{25}$  - водород, метил, этил или метилсульфонил.

Производные урацила по настоящему изобретению, представленные формулами I и I-a, обладают признаками новизны.

В соответствии с целями настоящего изобретения, из производных урацила, выраженных формулами I и I-a, предпочтение отдается соединениям следующих формул (1), (2), (3) и (4).

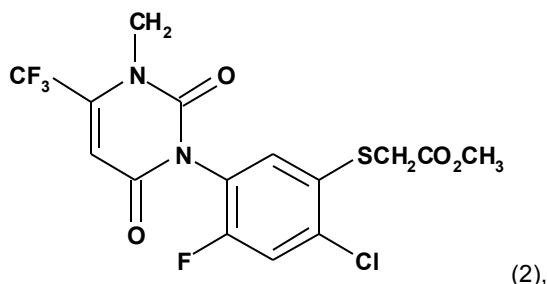
1) Производные урацила, выраженные формулой (1):



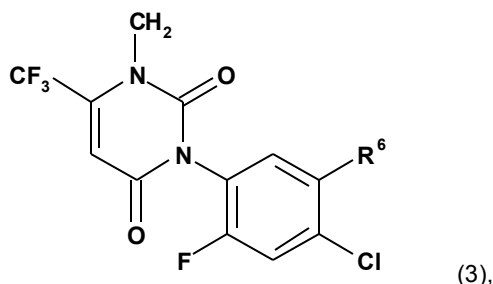
в которой  $R^2$  - трифторметил или пентафторэтил;  $R^4$  - водород или фтор;  $A_2$  - водород, метил, этил, пропил, аллил, пропарил, 1-метилпропарил, цианометил, метоксиметил, бензил, ортометилбензил,

параметилбензил или пиколил.

2) Производные урацила, выраженные формулой (2):



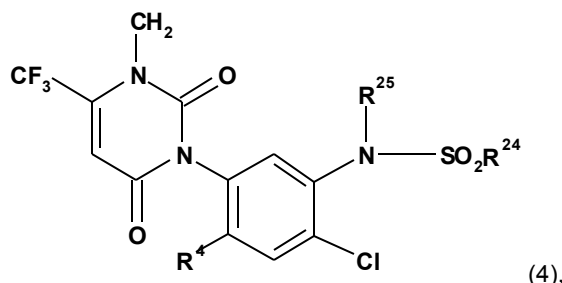
3) Производные урацила, выраженные формулой (3):



в которой R<sup>6</sup> представляет



4) Производные урацила, выраженные формулой (4):



в которой R<sup>4</sup> - водород, фтор или хлор; R<sup>24</sup> - метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, 3-хлор-пропил или 2,2,2-трифторэтил; R<sup>25</sup> - водород, метил, этил или метилсульфонил.

Производные урацила по настоящему изобретению можно синтезировать, в соответствии со схемами реакции, приведенными на фиг. 1-7.

(1) В схеме 1 фенил-изо(тио)цианат (VI) подвергается взаимодействию со сложным бета-аминоакриловым эфиром (V) с образованием на первой стадии производного урацила (1') и, после выделения указанного производного или без его выделения, 1-положение урацильного кольца алкилируется, что позволяет получить производное урацила формулы (1) на второй стадии.

Реакция первой стадии.

Обычно фенил-изо(тио)цианат (VI) используется в количестве 0,5-1,5 эквивалента, предпочтительно 0,9-1,1 эквивалента по отношению к сложному бета-аминоакриловому эфиру (V).

Реакция может протекать без растворителя, но обычно используется растворитель для ускорения реакции. В качестве примеров растворителей, используемых для данной цели в реакции, могут быть названы алифатические углеводороды, такие как гексан, гептан, лигроин и петролейный эфир; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и хлорбензол; галоидированные углеводороды, такие как хлороформ и метилхлорид; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан и тетрагидрофуран; кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон; нитрилы, такие как ацетонитрил и изобутиронитрил; третичные амины, такие как пиридин, и N,N-ди-этиланилин; амиды кислот, такие как формамид, N,N-диметилформамид и N-метилпирролидон; серосодержащие соединения, такие как

диметилсульфоксид и сульфолан; вода и их смеси. Среди них предпочитают алифатические углеводороды, амиды кислот, серосодержащие соединения и их смеси.

Реакция может протекать без основания, но обычно используется основание в количестве от 0,5 до 10 эквивалентов, предпочтительно 1,0-2,0 эквивалента по отношению к сложному бета-ами-ноакриловому эфиру (V). В качестве основания могут использоваться, например, органические основания, содержащие азот, такие как пиридин, триэтиламин и 1,4-диазабицикло-2,2,2-октан; неорганические основания, такие как гидрид натрия, гидрид калия, гидроокись натрия, гидроокись калия, карбонат натрия и карбонат калия, и алкоголяты металлов, такие как метилат натрия, этилат натрия и трет-бутилат калия. Среди них предпочитают гидрид натрия, гидроокись натрия и гидроокись калия.

Температура реакции составляет обычно 40-200°C, предпочтительно от комнатной температуры до температуры дефлегмации реакционной смеси.

Время реакции составляет обычно от 10 мин до 72 ч, предпочтительно 30 мин - 24 ч.

После окончания реакции производное (1') может быть выделено с помощью подкисления продукта реакции минеральной кислотой, такой как соляная кислота, или органической кислотой, такой как уксусная кислота, трифторуксусная кислота, п-толуолсульфонокислота или аналогичные.

Реакция второй стадии.

На второй стадии реакции производное (1') алкилируется с использованием алкилирующего агента в количестве от 1,0 до 10 эквивалентов, предпочтительно 1,0-5,0 эквивалентов по отношению к производному (1'). В качестве алкилирующего агента могут использоваться, например, алкилсерные кислоты, такие как диметилсерная кислота и диэтилсерная кислота, и алкилгалогениды, такие как метилхлорид, этилхлорид, метилбромид, этилбромид, метилиодид и этилиодид.

Реакция может протекать без растворителя, но обычно для ускорения реакции используется растворитель. В качестве примеров растворителей, используемых для названной цели в описанной выше реакции, могут быть названы алифатические углеводороды, такие как гексан, гептан, лигроин и петролейный эфир; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и хлорбензол; галогенированные углеводороды, такие как хлороформ и метиленхлорид; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан и тетрагидрофуран; кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон; нитрилы, такие как ацетонитрил и изобутиронитрил; третичные амины, такие как пиридин и N,N-диэтиланилин; амиды кислот, такие как формамид, N,N-диметилформид и N-метил-пирролидон; серосодержащие соединения, такие как диметилсульфоксид и сульфолан; вода и их смеси. Среди указанных растворителей предпочитают алифатические углеводороды, амиды кислот, серосодержащие соединения и их смеси.

В указанной выше реакции обычно используется основание в количестве от 1,0 до 10 эквивалентов, предпочтительно 1,0-2,0 эквивалента по отношению к производному (1'). В качестве основания могут использоваться органические основания, содержащие азот, такие как пиридин, триэтиламин и 1,4-диазабицикло-2,2,2-октан и неорганические основания, такие как гидрид натрия, гидрид калия, гидроокись натрия, гидроокись калия, карбонат натрия и карбонат калия. Среди них предпочитают такие неорганические основания, как гидрид натрия и карбонат калия.

Температура реакции составляет обычно 0-150°C, предпочтительно от комнатной температуры до температуры дефлегмации реакционной смеси.

Время реакции обычно составляет 10 мин - 96 ч, предпочтительно от 30 минут до 48 часов.

(2) В соответствии со схемой 2, N-фенил карбамат (VII) подвергается взаимодействию со сложным бета-аминоакриловым эфиром (V) с образованием на первой стадии производного урацила (1') и, после выделения производного (1') или без его выделения, 1-положение урацильного кольца алкилируется, что позволяет получить про-изводное урацила формулы (1) на второй стадии.

Реакция первой стадии.

N-фенилкарбамат (VII) обычно используется в количестве 0,5-1,5 эквивалента, предпочтительно 0,9-1,1 эквивалента по отношению к сложному бета-аминоакриловому эфиру (V).

Обычно требуется, чтобы в реакции присутствовал растворитель. В качестве растворителя могут использоваться, например, алифатические углеводороды, такие как гептан, лигроин и петролейный эфир; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и хлорбензол; галогенированные углеводороды, такие как хлороформ и метиленхлорид; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан и тетрагидрофуран; кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон; нитрилы, такие как ацетонитрил и изобутиронитрил; третичные амины, такие как пиридин и N,N-ди-этиланилин; амиды кислот, такие как формамид, N,N-диметилформамид и N-метилпирролидон; серосодержащие соединения, такие как диметилсульфоксид или сульфолан; спирты, такие как метанол, этанол, пропанол и бутанол; вода и их смеси. Среди них предпочитают алифатические углеводороды, амиды кислот, серосодержащие соединения и их смеси.

В описанной выше реакции обычно используется основание в количестве 0,5-10 эквивалента, предпочтительно 1,0 - 2,0 эквивалента по отношению к сложному бета-аминоакриловому эфиру (V). Основания, используемые в указанной выше реакции, включают неорганические основания, такие как гидрид натрия, гидрид калия, гидроокись натрия, гидроокись калия, карбонат натрия и карбонат калия; алкоголяты металлов, такие как метилат натрия, этилат натрия и третбутилат калия, и алкилмеркаптиты металлов, такие как метилмеркаптит натрия и этилмеркаптит натрия. Среди них предпочитают неорганические основания, такие как гидрид натрия и алкоголяты металлов, такие как метилат натрия.

Реакция осуществляется при температуре обычно до 0-200°C, предпочтительно от комнатной температуры до температуры дефлегмации реакционной смеси.



Время реакции обычно составляет 10 мин - 72 ч, предпочтительно 30 мин - 2 ч.

После завершения реакции производное (1') может выделяться из реакционной смеси путем подкисления минеральной кислотой, такой как соляная кислота, или органической кислотой, такой как уксусная, трифторуксусная кислота и паратолуолсульфоновая кислота.

Реакция второй стадии.

Алкилирование производного (1') может проводиться в тех же условиях реакции, что и на второй стадии процесса схемы 1.

(3) В схеме 3 фенил-изо(тио)цианат (VI) подвергается взаимодействию с N-замещенным бета-аминоакриловым сложным эфиром (VIII), что позволяет получить производное урацила формулы (1) в результате осуществления одной стадии. Можно применять те же самые условия реакции, что используются в процессе по схеме 1.

(4) По схеме 4 N-фенил (карбамат (VII)) подвергается взаимодействию N-замещенным бета-аминоакриловым сложным эфиром (VIII), что позволяет получить производное урацила формулы (1) на протяжении одной стадии. Реакция может проводиться в тех же условиях реакции, что используются в процессе по схеме 2.

(5) В схеме 5 фенилизонит (VI-a) подвергается взаимодействию с бета-аминоакриловым сложным эфиром (V-a), в результате чего образуется производное урацила (1'-a) на первой стадии, и после выделения указанного производного (1'-a) или без его выделения 1-положение урацильного кольца метилируется, что ведет к образованию производного урацила формулы (1-a) на второй стадии.

Реакция первой стадии.

Обычно фенилизонит (VI-a) используется в количестве 0,5-1,5 эквивалента, предпочтительно 0,8-1,2 эквивалента по отношению к бета-амино-акриловому сложному эфиру (V-a).

Реакция может протекать без растворителя, но обычно для ускорения реакции используется растворитель. В качестве примеров растворителей, используемых для указанной цели в реакции, могут быть названы алифатические углеводороды, такие как гексан, гептан, лигроин и петролейный эфир; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и хлорбензол; галогенированные углеводороды, такие как хлороформ и метилхлорид; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан и тетрагидрофуран; кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон; нитрилы, такие как ацетонитрил и изобутиронитрил; третичные амины, такие как пиридин и N,N-диэтиланилин; амиды кислот, такие как N,N-диметилацетамид, N,N-диметилформамид и N-метилпирролидон; серосодержащие соединения, такие как диметилсульфоксид и сульфолан, вода и смеси этих растворителей. Среди них предпочтительнее алифатические углеводороды, ароматические углеводороды, амиды кислот и серосодержащие соединения и их смеси.

Реакция может протекать без основания, но обычно используется основание в количестве 0,5-10 эквивалентов, предпочтительно от 1,0 до 3,0 эквивалентов по отношению к сложному бета-аминоакриловому эфиру (V-a). В качестве основания могут использоваться например, органические основания, содержащие азот, такие как пиридин, триэтиламин, N,N-диметиланилин, N,N-диэтиланилин, 4-(N,N-диметиламино)пиридин и 1,4-ди-азабицикло-(2,2,2)гектан; неорганические основания, такие как гидрид натрия, гидрид калия, гидроокись натрия, Гидроокись калия, карбонат натрия и карбонат калия, и алколяты металлов, такие как метилат натрия, этилат натрия и трет-бутилат калия. Среди них предпочтительнее гидрид натрия, гидроокись натрия и гидроокись калия.

Температура реакции составляет обычно от -70 до 200°C, предпочтительно от -30°C до температуры дефлегмации реакционной смеси.

Время реакции обычно составляет 5 мин - 72 ч, предпочтительно 10 мин - 12 ч.

После завершения реакции производное (1'-a) может выделяться путем подкисления продукта реакции минеральной кислотой, такой как соляная кислота, или органической кислотой, такой как уксусная, трифторуксусная кислота, паратолуолсульфоновая кислота или аналогичные кислоты.

Реакция второй стадии.

На второй стадии реакции производное (1'-a) метилируется с использованием метилирующего агента в количестве от 0,5 до 10 эквивалентов, предпочтительно 0,8-5,0 эквивалента, по отношению к производному (1'-a). В качестве метилирующего агента может использоваться, например, диметилсерная кислота и метилгалогениды, такие как метилхлорид, метилбромид и метилиодид.

Реакция может протекать без растворителя, но для ускорения реакции обычно используется растворитель. В качестве примеров растворителей, используемых в указанной выше реакции для данной цели, могут быть названы алифатические углеводороды, такие как гексан, гептан, лигроин и петролейный эфир; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и хлорбензол; галогенированные углеводороды, такие как хлороформ и метилхлорид; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан и тетрагидрофуран; кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон; нитрилы, такие как ацетонитрил и изобутиронитрил; третичные амины, такие как пиридин и N,N-ди-этиланилин; амиды кислот, такие как N,N-дими-тилацетамид, N,N-диметилформамид и N-метил-пирролидон; серосодержащие соединения, такие как диметилсульфоксид и сульфолан; вода и их смеси. Среди них предпочтительнее алифатические углеводороды, ароматические углеводороды, простые эфиры, кетоны, нитрилы, амиды кислот, серосодержащие соединения и их смеси.

В указанной выше реакции обычно используется основание в количестве от 0,5 до 10 эквивалентов, предпочтительно от 0,8 до 3,0 эквивалентов по отношению к производному (1'-a). В качестве основания могут использоваться органические основания, содержащие азот, такие как пиридин, триэтиламин, N,N-

диметиланилин, N,N-диэтил-анилин, 4-(N,N-диметиламино)пиридин и 1,4-диа-забицикло(2,2,2)октан, и неорганические основания, такие как гидрид натрия, гидрид калия, гидроокись натрия, гидроокись калия, карбонат натрия и карбонат калия. Среди них предпочитают такие неорганические основания, как гидрид натрия и карбонат калия.

Температура	реакции	обычно	составляет	от
-30 до 150°C, предпочтительно от -10°C до температуры дефлегмации			реакционной смеси.	

Время	реакции	составляет	обычно	10	мин	-
96 ч, предпочтительно 30 мин – 48 ч.						

(6) Согласно схеме 6, N-фенилкарбамат (VII-a) подвергается взаимодействию со сложным бета-аминоакриловым эфиром (V-a), в результате чего образуется производное урацила (1'-a) на первой стадии, и после выделения производного (1'-a) или без выделения его, на второй стадии 1-по-ложение урацильного кольца, указанного производного метилируется, в результате чего образуется производное урацила (1-a).

Реакция первой стадии.

Обычно N-фенилкарбамат (VII-a) используется в количестве 0,5-1,5 эквивалента, предпочтительно 0,8-1,2 эквивалента по отношению к бета-аминоакриловому эфиру (V-a).

Обычно требуется, чтобы в реакции присутствовал растворитель. В качестве растворителей могут использоваться, например, алифатические углеводороды, такие как гексан, гептан, лигроин и петролейный эфир, ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и хлорбензол; галоидированные углеводороды, такие как хлороформ и метилхлорид; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан и тетрагидрофуран; кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон; нитрилы, такие как ацетонитрил и изобутиронитрил; третичные амины, такие как пиридин и N,N-ди-этиланилин; амиды кислот, такие как N,N-диме-тилацетамид, N,N-диметилформамид и N-метил-пирролидон; серосодержащие соединения, такие как диметилсульфоксид и сульфолан; спирты, такие как метанол, этанол, пропанол и бутанол; вода и их смеси. Среди них предпочитают алифатические углеводороды, ароматические углеводороды, амиды кислот, серосодержащие соединения и их смеси.

В указанной выше реакции обычно используется основание в количестве 0,5-10 эквивалентов, предпочтительно 1,0-3,0 эквивалента по отношению к бета-аминоакриловому эфиру (V-a).

Основания, используемые в указанной выше реакции, включают органические основания, содержащие азот, такие как пиридин, триэтиламин, N,N-диметиланилин, N,N-диэтиланилин, 4-(N,N-ди-метиламино)пиридин и 1,4-диазабицикло-(2,2,2)ок-тан; неорганические основания, такие как гидрид натрия, гидрид калия, гидроокись натрия, гидроокись калия, карбонат натрия и карбонат калия; алкоголяты металлов, такие как метилат натрия, этилат натрия и трет-бутилат калия, и алкилмеркаптиты металлов, такие как метилмеркаптит натрия и этилмеркаптит натрия.

Среди них предпочитают неорганические основания, такие как гидрид натрия и алкоголяты металлов, такие как метилат натрия.

Реакция осуществляется при температуре обычно 0-200°C, предпочтительно от комнатной температуры до температуры дефлегмации реакционной смеси.

Время	реакции	составляет	обычно	10	мин	-
24 ч, предпочтительно 30 мин - 24 ч.						

После завершения реакции производное (1'-a) может выделяться из реакционной смеси путем подкисления ее минеральной кислотой, такой как соляная кислота, или органической кислотой, такой как уксусная кислота, трифторуксусная кислота и паратолуолсульфоновая кислота.

Реакция второй стадии.

Метилирование производного (1'-a) может проводиться при тех же самых условиях реакции, что и во второй стадии процесса по схеме 5.

(7) В соответствии со схемой 7, фенилизо-цианат (VI-a) подвергается взаимодействию с N-метил-аминоакриловым эфиром (VIII-a), что позволяет получить производное урацила формулы (1-a) на протяжении одной стадии. Можно применять такие же условия реакции, какие используются, согласно схеме 5.

(8) По схеме 8, N-фенилкарбамат (VII-a) подвергается взаимодействию с N-метил-бета-амино-акриловым сложным эфиром (VIII-a), что позволяет получить производное урацила формулы (1-a) при осуществлении одной стадии. Реакция может проводиться в таких же условиях, какие используются, согласно схеме 6.

(9) По схеме 9, сульфонилгалогенид (X-a) или сульфоновый ангидрид (X-b) подвергается взаимодействию с аминированным соединением (IX), что позволяет получить производное урацила формулы (1-a) при осуществлении одной стадии.

Обычно сульфонилгалогенид (X-a) или сульфоновый ангидрид (X-b) используется в количестве 0,3-10 эквивалентов, предпочтительно 0,5-2,0 эквивалента по отношению к аминированному соединению (IX).

Реакция может протекать без растворителей, но обычно для ускорения реакции используется растворитель. В качестве примеров растворителей, используемых в реакции для данной цели, могут быть названы алифатические углеводороды, такие как гексан, гептан, лигроин и петролейный эфир; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и хлорбензол; галоидированные углеводороды, такие как хлороформ и метилхлорид; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан и тетрагидрофуран; кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон; нитрилы, такие как ацетонитрил и изобутиронитрил; третичные амины, такие как пиридин и N,N-диэтил-анилин; амиды кислот, такие как N,N-диметил-ацетамид, N,N-диметилформамид и N-метилпир-ролидон; серосодержащие соединения, такие как

диметилсульфоксид и сульфолан, и их смеси.

Реакция может протекать без основания, но обычно используется основание в количестве от 0,3 до 10 эквивалентов по отношению к аминированному соединению (IX). Также в качестве растворителя может использоваться основание, взятое в большом избытке. В качестве основания могут использоваться, например, органические основания, содержащие азот, такие как пиридин, триэтиламин, N,N-диметиланилин, N,N-диэтиланилин, 4-(N,N-диметиламино)пиридин и 1,4-дизабицикло(2,2,2)октан; неорганические основания, такие как гидрид натрия, гидрид калия, гидроокись натрия, гидроокись калия, карбонат натрия и карбонат калия, и алкоголяты металлов, такие как метилат натрия, этилат натрия и трет-бутилат калия. Среди них предпочитают органические основания, содержащие азот, и неорганические основания.

Температура	реакции	обычно	составляет	от
-30 до 160°C	предпочтительно от -10 до 130°C.			
Время	реакции	составляет	обычно	10 мин
48 ч, предпочтительно 30 мин	- 24 ч.			

(10) Согласно схеме 10, аминированное соединение (IX) подвергается взаимодействию с ацилирующим агентом, в результате чего образуется ацилированное аминоксоединение (IX-a) на первой стадии; после выделения ацилированного аминоксоединения (IX-a) или без его выделения, ацилированное аминоксоединение (IX-a) сульфонируется с образованием на второй стадии N-ацилсульфамолированного соединения (IX-b); после выделения N-ацилсульфамолированного соединения (IX-b) или без его выделения, N-ацил-сульфамолированное соединение (IX-b) на третьей стадии деацилируется, что позволяет получить производное урацила формулы (1-a).

Реакция первой стадии.

Обычно ацилирующий агент используется в количестве 0,5-5,0 эквивалентов, предпочтительно 0,8-2,0 эквивалента по отношению к аминированному соединению (IX). В качестве ацилирующего агента можно использовать ацетилхлорид, бензоилхлорид, уксусный ангидрид и муравьиную кислоту, предпочтается уксусный ангидрид.

Реакция может протекать без растворителя, но обычно используется растворитель для ускорения реакции. В качестве примеров растворителей, используемых в реакции для данной цели, могут быть названы алифатические углеводороды, такие как гексан, гептан, лигроин и петролейный эфир; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и хлорбензол; галоидированные углеводороды, такие как хлороформ и метилхлорид; третичные амины, такие как пиридин и N,N-диэтиланилин; амиды кислот, такие как N,N-диметилацетамид, N,N-диметилформамид и N-метилпирролидон; серосодержащие соединения, такие как диметилсульфоксид и сульфолан; органические кислоты, такие как муравьиная кислота, уксусная кислота и масляная кислота, и их смеси. Среди них предпочитают алифатические углеводороды, ароматические углеводороды, галоидированные углеводороды и органические кислоты.

Реакция может осуществляться без основания, но обычно основание используется в количестве 0,5-5,0 эквивалентов, предпочтительно 0,8-2,0 эквивалента по отношению к аминированному соединению (IX). В качестве основания могут использоваться, например, органические основания, содержащие азот, такие как пиридин, триэтил-амин, N,N-диметиланилин, N,N-диэтиланилин, 4-(N,N-диметиламино)-пиридин и 1,4-дизабицикло-(2,2,2)октан; неорганические основания, такие как гидрид натрия, гидрид калия, гидроокись натрия, гидроокись калия, карбонат натрия и карбонат калия, и соли уксусной кислоты, такие как ацетат натрия и ацетат калия.

Температура	реакции	составляет	обычно	от
-30 до 200°C,	предпочтительно 0-130°C.			
Время	реакции	составляет	обычно	10 мин
24 ч, предпочтительно 30 мин	- 6 ч.			

Реакция второй стадии.

На второй стадии реакции ацилированное аминоксоединение (IX-a) сульфонируется с использованием сульфонирующего агента в количестве 0,5-5,0 эквивалентов, предпочтительно 0,8-2,0 эквивалента, по отношению к ацилированному аминоксоединению (IX-a). В качестве сульфонирующего агента могут использоваться, например, сульфонилгалогенид, представленный формулой Hal-SO<sub>2</sub>R<sup>24</sup> (X-a) и сульфоновый ангидрид, представленный формулой R<sup>24</sup>O<sub>2</sub>-O-SO<sub>2</sub>R<sup>24</sup> (X-b).

Реакция может протекать без растворителя, но обычно для ускорения реакции используется растворитель. В качестве примеров растворителей, используемых в указанной выше реакции для данной цели, могут быть названы алифатические углеводороды, такие как гексан, гептан, лигроин и петролейный эфир; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и хлорбензол; галоидированные углеводороды, такие как хлороформ и метилхлорид; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан и тетрагидрофуран; кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон; нитрилы, такие как ацетонитрил и изобутиронитрил; третичные амины, такие как пиридин и N,N-ди-этиланилин; амиды кислот, такие как N,N-диметилацетамид, N,N-диметилформамид и N-метил-пирролидон, серосодержащие соединения, такие как диметилсульфоксид и сульфолан и их смеси.

В указанной выше реакции обычно используется основание в количестве 0,5-5,0 эквивалентов, предпочтительно 0,8-2,0 эквивалента по отношению к ацилированному аминоксоединению (IX-a). В качестве основания могут использоваться органические основания, содержащие азот, такие как пиридин, триэтиламин, N,N-диметиланилин, N,N-ди-этиланилин, 4-(N,N-диметиламино)пиридин и 1,4-дизабицикло-

(2,2,2)октан; неорганические основания, такие как гидрид натрия, карбонат калия и карбонат натрия, и алкоголяты металлов, такие как метилат натрия, этилат натрия и трет-бутилат калия. Среди них предпочитается органические основания, содержащие азот, и неорганические основания.

Температура	реакции	составляет	обычно	от
-30 до 160°C,	предпочтительно от -10 до 130°C.			

Время	реакции	обычно	составляет	30	мин	-
48 ч,	предпочтительно 1 - 12 ч.					

Реакция третьей стадии.

Обычно вода, щелочи или кислоты используются в количестве 0,5-3,0 эквивалента, предпочтительно 0,8-2,0 эквивалента по отношению к N-ацилсульфамидоилированному соединению (IX-b).

В качестве примеров щелочей могут быть названы неорганические основания, такие как гидрид натрия, гидрид калия, гидроокись натрия, гидроокись калия, карбонат натрия и карбонат калия, алкоголяты металлов, такие как метилат натрия, этилат натрия и трет-бутилат калия. Среди них предпочитается неорганические основания.

В качестве примеров кислот могут быть названы неорганические кислоты, такие как соляная кислота и серная кислота, и органические кислоты, такие как уксусная кислота и трифторуксусная кислота.

Реакция может протекать без растворителя, но обычно растворитель используется для ускорения реакции. В качестве растворителей могут использоваться, например, алифатические углеводороды, такие как гексан, гептан, лигроин и петролейный эфир; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и хлорбензол; галогенированные углеводороды, такие как хлороформ и метилхлорид; спирты, такие как метанол и этанол; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан и тетрагидрофуран; кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон; нитрилы, такие как ацетонитрил и изобутиронитрил; третичные амины, такие как пиридин, триэтиламин, N,N-диметиланилин и N,N-диэтиланилин; амиды кислот, такие как N,N-диметилацетамид, N,N-диметилформамид и N-метилпирролидон; органические кислоты, такие как муравьиная кислота, уксусная и масляная кислота; вода и их смеси. Среди них предпочитается спирты, простые эфиры, кетоны, третичные амины, амиды кислот, органические кислоты и вода.

Реакция осуществляется при температуре обычно от -30 до 130°C, предпочтительно от -10 до 100°C.

Время реакции обычно составляет 10 - 48 ч, предпочтительно 30 мин - 24 ч.

(11) Согласно схеме 11, аминированное соединение IX сульфонируется, в результате чего образуется дисульфониламинированное соединение (IX-c) на первой стадии, а после выделения дисульфониламинированного соединения (IX-c) или без его выделения дисульфониламинированное соединение (IX-c) подвергается гидролизу с образованием производного урацила формулы (1-a) на второй стадии.

Реакция первой стадии.

Обычно сульфонилогалогенид (X-a) или, сульфоновый ангидрид (X-b) используется в количестве 1,0-20 эквивалентов, предпочтительно 2,0-5,0 эквивалентов по отношению к аминированному соединению (IX).

Реакция может протекать без растворителя, но обычно растворитель используется для ускорения реакции. В качестве примеров растворителей, используемых в реакции для указанной цели, могут быть названы алифатические углеводороды, такие как гексан, гептан, лигроин и петролейный эфир; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и хлорбензол, галоидированные углеводороды, такие как хлороформ и метилхлорид; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан и тетрагидрофуран; кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон; нитрилы, такие как ацетонитрил и изобутиронитрил; третичные амины, такие как пиридин и N,N-диэтиланилин; амиды кислот, такие как диметилацетамид, N,N-диметилформамид и N-метилпирролидон; серосодержащие соединения, такие как диметилсульфоксид и сульфолан, и их смеси.

Реакция может протекать без основания, но обычно основание используется в количестве 1,0-10 эквивалентов, предпочтительно 2,0-3,0 эквивалента по отношению к аминированному соединению (IX). В качестве основания могут использоваться, например, органические основания, содержащие азот, такие как пиридин, триэтиламин, N,N-диметиланилин, N,N-диэтиланилин, 4-(N,N-ди-метиламино)пиридин и 1,4-дизабицикло-(2,2,2)октан; неорганические основания, такие как гидрид натрия, гидрид калия, гидроокись натрия, гидроокись калия, карбонат натрия и карбонат калия, и алкоголяты металлов, такие как метилат натрия, этилат натрия и трет-бутилат калия. Среди них предпочитается органические основания, содержащие азот, и неорганические основания.

Реакция осуществляется при температуре обычно от -30 до 160°C, предпочтительно от -10 до 130°C.

Время	реакции	составляет	обычно	30	мин	-
60 ч,	предпочтительно 1-30 ч.					

Реакция второй стадии.

Вода, щелочи или кислоты используются в количестве 0,5-3,0 эквивалентов, предпочтительно от 0,8 до 2,0 эквивалентов по отношению к дисульфониламинированному соединению (IX-c) с целью его гидролиза.

В качестве примеров щелочей могут быть названы неорганические основания, такие как гидрид натрия, гидрид калия, гидроокись натрия, гидроокись калия, карбонат натрия и карбонат калия, и алкоголяты металлов, такие как метилат натрия, метилат калия и трет-бутилат калия. Среди них предпочитается неорганические соединения.

В качестве примеров кислот могут быть названы неорганические кислоты, такие как соляная кислота и серная кислота, и органические кислоты, такие как уксусная кислота и трифторуксусная кислота.

Реакция может протекать без растворителя, но обычно для ускорения реакции используется

растворитель. В качестве примеров растворителей, используемых в реакции для данной цели, могут быть названы алифатические углеводороды, такие как гексан, гептан, лигроин и петролейный эфир; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и хлорбензол; галоидированные углеводороды, такие как хлороформ и метиленхлорид; спирты, такие как метанол и этанол; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан и тетрагидрофуран; кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон; нитрилы, такие как ацетонитрил и изобутиронитрил; третичные амины, такие как пиридин, триметиламин, N,N-диметиланилин, N,N-диэтиланилин, 4-(N,N-диметилами-но)-пиридин и 1,4-дизабицикло(2,2,2)октан; амиды кислот, такие как N,N-диметилацетамид, N,N-диметилформамид и N-метилпирролидон; органические кислоты, такие как муравьиная кислота, уксусная кислота и масляная кислота; вода и их смеси. Среди них предпочтитаются спирты, простые эфиры, кетоны, третичные амины, амиды кислот, органические кислоты и вода.

Реакция осуществляется при температуре обычно от -30 до 160°C, предпочтительно от -10 до 130°C.

Время реакции обычно составляет 5 мин – 48 ч, предпочтительно 30 мин - 24 ч.

Производные урацила, по настоящему изобретению, могут применяться в качестве гербицидов для суходольных полей, рисовых полей и непахотных земель путем обработки почвы или обработки листы. Они показывают также высокую гербицидную активность при низких дозах против, например, сорняков, произрастающих на пахотных землях, например, широколистных сорняков семейства Solanaceae, таких как *Solanum nigrum* и *Datura stramonium*, сорняков семейства Malvaceae, таких, как *Abutilon theophrasti* и *Sida spinosa*, сорняков Convolvulaceae, таких как *Spomea* spp., или *Spomea purpurea*, *Calystegia* spp., сорняков семейства Amaranghaceae, таких как *Amarantus li-vidis* и *Amatanthus retriflexus*, сорняков Compositae, таких как *Xanthium pensylvanicum*, *Ambrosia artemisiaefolia*, *Hellanthus annuus*, *Galinsoga*, *Cirsium arvense*, *Senecio vulgaris*, *Erigeron annuus* и *Bidens pilosa*, сорняков Cruciferae, таких как *Rorippa indica*, *Sinapis arvensis* и *Capsella Bursapastoris*, сорняков Polygonaceae, таких как *Polygonum Blume* и *Polygonum convolvulus*, сорняков семейства Portulacaceae, таких как *Portulaca oleracea*, семейства Chenopodiaceae, таких как *Chenopodium album*, *ficifolium* и *Kahias corymbosa*, семейства Caryophyllaceae, таких как *Stellaria media*, семейства Scrophulariaceae, таких как *Veronica persica*, сорняков семейства Commelinaceae, таких как *Commelina communis*, сорняков Labiales, таких как *Lamium amplexicaule* и *Lamium purpureum*, сорняков Euphorbiaceae, таких как *Euphorbia supina* и *Euphorbia maculata*, сорняков Rubiaceae, таких как *Galium spurium*, *Gabium aparine* и *Rubiacane*, сорняков Violaceae, таких как *Viola arvensis*, и сорняков Leguminosae, таких как *Sesbania exaltata* и *Cassia obtusifolia*; сорняков семейства Gramineae, таких как *Sorghum bicolor*, *Panicum dichotomiflorum*, *Sorghum halepense*, *Echinochloa crus-galli*; *Digitaria adscendens*, *Avena fatua*, *Eleusine indica*, *Setaria viridis* и *Alopecurus aequalis*, сорняков Cyperaceae, таких как *Cyperus rotundus* и *Cyperus esculentus*; и сорняков рисовых чеков; семейства Alismaceae, таких как *Alisma canaliculatum*, *Sagittaria trifolia* и *Sagittaria pygmaea* семейства Cyperaceae, таких как *Cyperus difformis*; *Cyperus Serotinus*, *Scirpus juncoides* и *Eleocharis kuragawai*, сорняков Iridaceae, таких как *Lindernia pumila*, сорняков семейства Potentillaceae, таких как *Monochoria vaginalis*, сорняков Lythraceae, таких как *Rorippa indica* и сорняков Gramineae, таких как *Echinochloa Gramineae*, таких как *Echinochloa crus-galli*. Производные урацила, по настоящему изобретению, не причиняют вреда таким важным культурам, как пшеница, кукуруза, ячмень, соя, рис. В частности, поскольку производные урацила (1-а), по настоящему изобретению, не обнаруживают фитотоксичности в отношении сои при обработке почвы и при заделке в почву, а также проявляют высокую гербицидную активность при очень низких дозах против сорняков *Abutilon theophrasti*; *Xanthium pensylvanicum*, *Spomea* spp., *Spomea purpurea*, *Calystegia* spp., *Amaranthus retriflexus*, *Polygonum Blume*, *Polygonum convolvulus*, *Portulaca oleracea*, *Chenopodium album*, *Datura Stramonium*, *Ambrosia artemisiaefolia*, *Bidens pilosa*, *Sida spinosa*, *Sesbania exaltata* и *Solanum nigrum*, производные урацила (1-а), согласно настоящему изобретению, являются очень полезными в качестве активного ингредиента гербицидной композиции.

Кроме того, производные урацила, по настоящему изобретению, также полезны в качестве дефолианта.

При использовании соединений, по настоящему изобретению, в качестве гербицидов они обычно смешиваются с носителем, например, с твердым носителем, таким как глина, тальк, бентонит, диатомовая земля, и белый уголь (тонкодисперсный порошок двуокиси кремния), или с жидким носителем, таким как вода, спирты (изопропанол, бутанол, бензиловый спирт, фурфурол и др.), ароматические углеводороды (толуол, ксилол и др.), простые эфиры (анизол и др.), кетоны (циклогексанон, изофорон и др.), сложные эфиры (бутилацетат и др.), амиды кислот (N-метилпирролидон и др.) и галоидированные углеводороды (хлорбензол и др.). Если необходимо, к ним могут добавляться подходящие вспомогательные добавки, такие как поверхностно-активные вещества, эмульгаторы, диспергаторы, агенты, облегчающие проникновение, агенты, повышающие смачивающую способность, загустители, агенты, снижающие температуру замерзания, агенты, предотвращающие коагуляцию, стабилизаторы и аналогичные агенты, при этом указанные соединения могут предлагаться для практического использования в виде разнообразных готовых форм, таких как жидкие составы, эмульгируемый концентрат, смачиваемый порошок, сухой текучий препарат, текучие составы, dustы и гранулы.

В гербицидной композиции, по настоящему изобретению, количество активного ингредиента - производного урацила, по настоящему изобретению, составляет от 1 до 90 мас.ч, а количество приемлемого в гербицидном отношении носителя или разбавителя составляет 10-99,9 мас.ч. в расчете на 100 мас.ч. гербицидной композиции.

Более конкретно предпочтительные количества компонентов в композиции (в расчете на

100 мас.ч гербицидной композиции) производного урацила, по настоящему изобретению, в каждом составе представлены ниже.

Смачиваемый порошок	мас.ч
Производные урацила, по настоящему изобретению	5-80
Твердый носитель	10-85
Поверхностно-активное вещество	1-10
Другой носитель (например, агент, предотвращающий коагуляцию и др.)	1-5
Эмульгируемый концентрат	мас.ч
Производное урацила, по настоящему изобретению	1~30
Жидкий носитель	30~95
Поверхностно-активное вещество	5~15
Текущий состав	мас.ч
Производное урацила, по настоящему изобретению	5~70
Жидкий носитель	15~65
Поверхностно-активное вещество	5~12
Другой носитель (например, агент, снижающий температуру замерзания, загуститель и др.)	5~30

Продолжение

Гранулированный смачиваемый порошок (сухой текучий состав)	мас.ч
Производное урацила, по настоящему изобретению	20~90
Твердый носитель	10~60
Поверхностно-активное вещество	1~20
Гранулы	мас.ч.
Производное урацила, по настоящему изобретению	0,1~10
Твердый носитель	90~99,99
Другой носитель	1~5

Соединения настоящего изобретения могут смешиваться, если необходимо, с другими видами гербицидов, различными видами инсектицидов, фунгицидов, агентов, регулирующих рост растений, синергистами и аналогичными веществами в ходе получения или во время применения состава.

В качестве гербицидов, которые могут смешиваться с соединениями по настоящему изобретению при их использовании, могут быть упомянуты, например, соединения, описанные в справочнике *Fam chemical Handbook*, 1990).

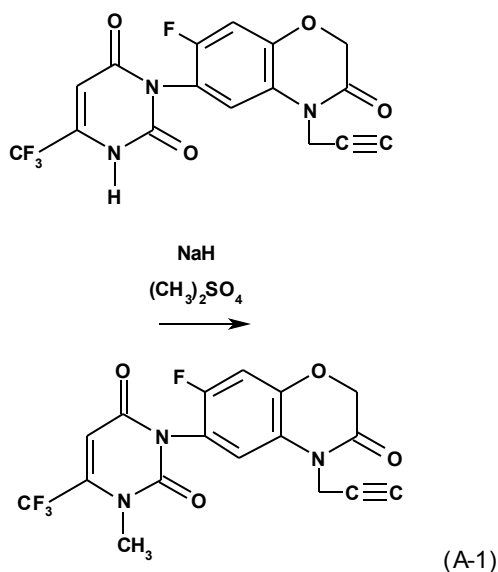
В случае применения соединения настоящего изобретения по отношению к сое, в качестве примеров предпочтительных соединений, которые могут смешиваться с соединением по настоящему изобретению, могут быть названы трифлуралин, пендиметалин, алахлор, метолахлор, метрибузин, линурон, хлоримурон, этил, имазахин, тмазета-пир, диносеб, бифенокс и кломазон.

Норма расхода соединения настоящего изобретения изменяется в зависимости от места применения, времени применения, способа применения, вида обрабатываемой культуры и др., но обычно соединение, по настоящему изобретению, применяется в количестве примерно 0,0001-10 кг/га, предпочтительно 0,001-5 кг/га при расчете в виде количества активного ингредиента.

Производные урацила, по настоящему изобретению, проявляют высокую активность передвижения в растениях и очень высокую гербицидную активность при очень низких дозах, не обнаруживая никакой фитотоксичности в отношении сои и могут применяться путем обработки почвы, заделки в почву против широкого разнообразия сорняков.

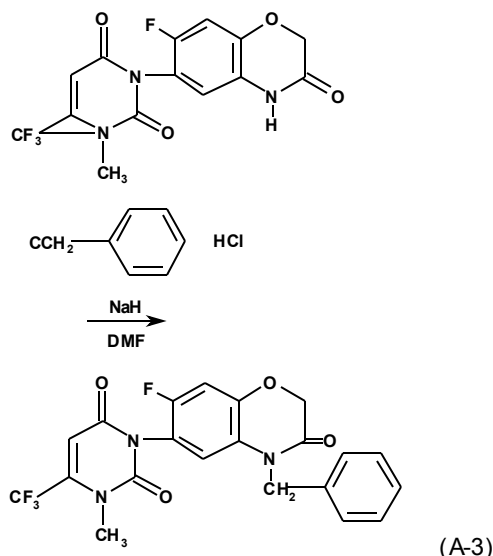
Настоящее изобретение более детально рассматривается в следующих примерах.

Пример А-1. Синтез 3-(7-фтор-3-оксо-4-пропаргил-2Н-1,4-бензоксазин-6-ил)-1-метил-6-трифторметил-2,4(1Н,3Н)-пиримидиндиона (соединение А-1).



0,18 г 3-(7-фтор-3-оксо-4-пропаргил-2Н-1,4-бензоксазин-6-ил)-6-трифторметил-2,4(1Н,3Н)-пиримидиндиона добавляли при комнатной температуре в раствор диметилформамида (2 мл) с субсидированными в нем 0,02 г гидрида натрия (чистота: 55%). После выстаивания в течение 20 мин в раствор добавляли 0,09 г диметилсерной кислоты, и раствор перемешивали в течение ночи. Затем диметилформамид отгоняли и остаток экстрагировали этилацетатом при добавлении воды. Экстракт промывали насыщенным водным раствором хлористого натрия и сушили над безводным сульфатом натрия, а затем отгоняли этилацетат, в результате чего был получен неочищенный продукт. Данный сырой продукт очищали с помощью препаративной тонкослойной хроматографии с использованием смеси гексана и этилацетата (3:1) в качестве проявляющего растворителя, что позволило получить 0,15 г целевого соединения в виде бесцветного вязкого масла. Будучи оставленным в указанном состоянии, оно затвердевало.

Пример А-2. Синтез 3-[7-фтор-3-оксо-4-(2-пи-ридилметил)-2Н-1,4-бензоксазин-6-ил]-1-метил-6-трифторметил-2,4(1Н,3Н)-пиримидиндиона (соединение А-3).

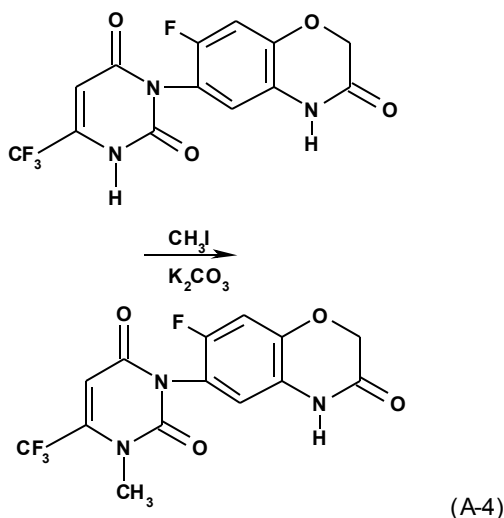


0,20 г 3-(7-фтор-3-оксо-2Н-1,4-бензоксазин-6-ил)-1-метил-6-трифторметил-2,4(1Н,3Н)-пиримидиндиона добавляли при комнатной температуре к раствору N,N-диметилформамида (5 мл) с суспендированными в нем 0,05 г гидрида натрия (чистота: 55%). После выстаивания в течение 20 мин к раствору добавляли 0,09 г хлоргидрата 2-хлор-метилпиридина и раствор перемешивали в течение 4 ч.

Затем N,N-диметилформамид отгоняли и остаток экстрагировали этилацетатом при добавлении воды. Экстракт промывали насыщенным водным раствором хлористого натрия и сушили над безводным сульфатом натрия, а затем этилацетат отгоняли с образованием неочищенного продукта. Данный продукт очищали с помощью препаративной тонкослойной хроматографии с использованием смеси гексана и этилацетата (2:3) в качестве проявляющего растворителя, в результате чего было получено 0,09 г

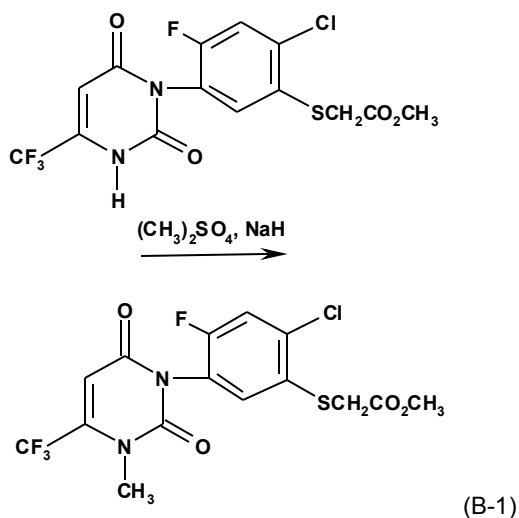
целевого соединения в виде бледно-желтых кристаллов.

Пример А-3. Синтез 3-(7-фтор-3-оксо-2Н-1,4-бензоксазин-6-ил)-1-метил-6-трифторметил-2,4-(1Н,3Н)-пиримидиндиона (соединение А-4).



0,85 г 3-(7-фтор-3-оксо-2Н-1,4-бензоксазин-6-ил)-6-трифторметил-2,4-(1Н,3Н)-пиримидиндиона растворяли в 8,5 мл N,N-диметилформамида. Затем добавляли 0,17 г безводного карбоната калия и 0,15 мл метилиодида и смешанный раствор перемешивали в течение 4 ч. После завершения реакции N,N-диметилформамид отгоняли и остаток экстрагировали этилацетатом при добавлении воды. Экстракт промывали насыщенным водным раствором хлористого натрия и сушили над безводным сульфатом натрия, а затем этилацетат отгоняли с образованием неочищенного продукта. Данный продукт очищали с помощью хроматографии на колонке с использованием хлороформа в качестве проявляющего растворителя, что позволило получить 0,53 г целевого соединения в виде бледно-желтых кристаллов.

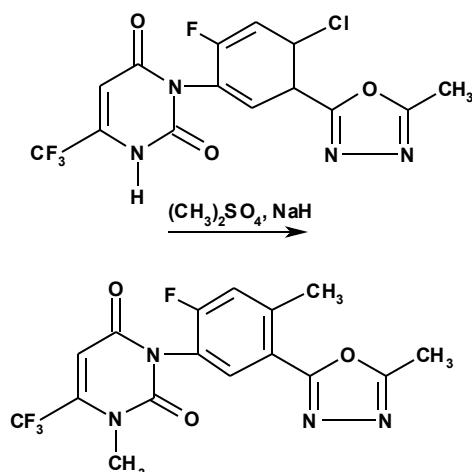
Пример В-1. Синтез 3-(4-хлор-2-фтор-5-метокси-карбонилметилтиофенил)-1-метил-6-трифторметил-2,4-(1Н,3Н)-пиримидиндиона (соединение В-1).



К-суспензии 0,16 г гидрида натрия (чистота - 55%) в 5 мл диметилформамида при комнатной температуре по каплям добавляли раствор 1,5 г 3-(4-хлор-2-фтор-5-метокси-карбонилметилтиофенил)-6-трифторметил-2,4-(1Н,3Н)-пиримидиндиона в 10 мл диметилформамида. После того, как выделение водорода прекращалось, добавляли 0,59 г диметилсерной кислоты и полученный раствор перемешивали при комнатной температуре в течение 3 ч. Реакционную смесь выливали в 300 мл воды и дважды экстрагировали этилацетатом. Экстракт промывали насыщенным водным раствором хлористого натрия и сушили над безводным сульфатом натрия, а затем этилацетат отгоняли с образованием неочищенного продукта. Полученный продукт очищали с помощью препаративной тонкослойной хроматографии (проявляющий растворитель: CHCl<sub>3</sub>), а затем с помощью высокоэффективной препаративной жидкостной хроматографии способности (элюент: CHCN/H<sub>2</sub>O (5:1)), в результате чего получено 0,1 г целевого соединения в виде вязкого масла.

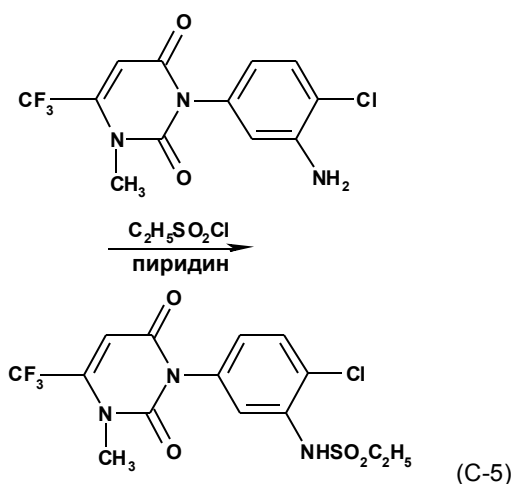
Пример С-1. Синтез 3-[4-хлор-2-фтор-5-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)фенил]-1-метил-6-трифторметил-2,4-(1Н,3Н)-пиримидиндион (соединение С-1).





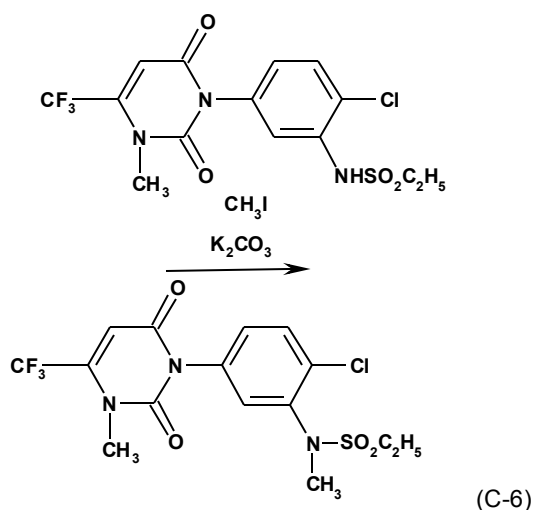
К суспензии 0,31 г гидрида натрия (масло, чи-стота - 55%) в 13 мл диметилформамида добавляли по каплям при 25°C раствор 2,5 г 3-(4-хлор-2-фтор-5-)5-метил- 1,3,4 -оксадиазол-2-ил(фенил)-6-трифторметил-2,4-(1Н,3Н)-пиримидиндиона в 2 мл N,N-диметилформамида. После того, как выделение водорода прекращалось, добавляли 1,02 г ди-метилсерной кислоты на протяжении 15 мин. Смес-шанный раствор перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч. и экстрагировали этил-ацетатом при добавлении воды. Экстракт сушили над безводным сульфатом натрия. Затем раство-ритель отгоняли и остаток очищали с помощью высокоэффективной жидкостной хроматографии с использованием смеси ацетонитрила и воды (5:1) в качестве элюента, в результате чего было получено 0,78 г целевого соединения.

Пример С-2. Синтез 3-(4-хлор-3-этансульфо-ниламинофенил)-1-метил-6-трифторметил-2,4(1Н, 3Н)-пиримидиндиона (соединение С-5).



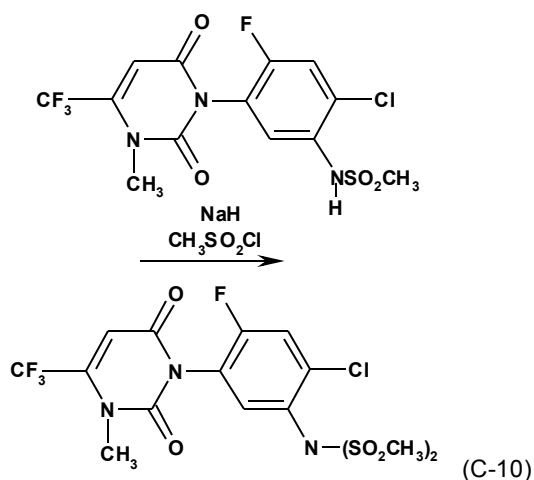
0,50 г 3-3-амино-4-хлорфенил-(1-метил-6-три-фторметил)-2,4(1Н,3Н)-пиримидиндиона растворяли в 5 мл пиридина. К полученному раствору по каплям добавляли 0,16 мл этансульфонилхлорида при температуре не выше чем 5°C, и смешанный раствор перемешивали в течение 2 ч. После того, как реакция завершилась, пиридин отгоняли и остаток растворяли в этилацетате. Раствор промывали водой, разбавленной соляной кислотой и насыщенным водным раствором хлористого натрия, и сушили над безводным сульфатом натрия, а затем этилацетат отгоняли, в результате чего получали неочищенный продукт. Полученный продукт промывали диизопропиловым эфиром с образованием 0,37 г целевого продукта в виде светло-коричневых кристаллов.

Пример С-3. Синтез 3-[4-хлор - 3 - (N-метил)-этансульфониламинофенил]-1-метил -6- трифтор-метил-2,4(1Н,3Н)-пиримидиндиона (соединение С-6).



0,25 г 3-(4-хлор - 3 - этансульфониламинофе-нил)-1-метил-6-трифторметил -2,4(1Н,3Н)-пиримидиндиона растворяли в 3 мл диметилформамида. К полученному раствору добавляли 0,17 г безводного карбоната калия и 0,08 мл йодистого метила, и смешанный раствор перемешивали на протяжении ночи при комнатной температуре. После того, как отгоняли диметилформамид, остаток растворяли в этилацетате. Полученный раствор промывали водой и насыщенным водным раствором хлористого натрия и сушили над безводным сульфатом натрия. Затем этилацетат отгоняли с образованием неочищенного продукта. Полученный продукт очищали с помощью препаративной тонкослойной хроматографии (проявляющий растворитель - смесь гексана и этилацетата 3:2), в результате чего получали 0,18 г целевого соединения в виде белых кристаллов.

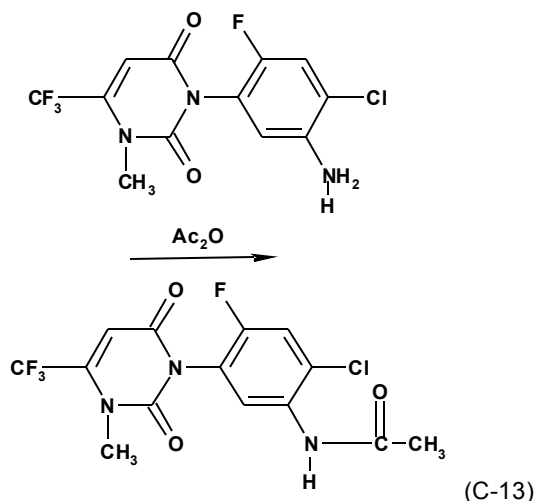
Пример С-4. Синтез 3-[4-хлор-2-фтор-5-бис-(метансульфонил)аминофенил] - 1 - метил-6-трифторметил-2,4(1Н,3Н)-пиримидиндиона (соединение С-10).



К суспензии 0,05 г гидрида натрия (чистота 60%) и 5 мл тетрагидрофурана при температуре 0°C добавляли 0,5 г 3-(4-хлор-2-(фтор-5-метан-сульфониламинофенил)-1-метил-6-трифторметил-2,4(1Н,3Н)-пиримидиндиона. Затем к полученной суспензии по каплям добавляли 0,11 мл метан-сульфонилхлорида. После перемешивания в течение 7 ч. реакционную смесь выливали в смесь воды со льдом и экстрагировали этилацетатом. Экстракт этилацетатного слоя промывали насыщенным водным раствором хлористого натрия и сушили над безводным сульфатом натрия. Затем этилацетат отгоняли с образованием неочищенного продукта. Полученный продукт промывали диэтиловым эфиром с образованием 0,50 г целевого продукта в виде белых кристаллов.

Пример С-5. Синтез 3-(4-хлор-2-фтор-5-изопропилсульфонил-аминофенил)-1-метил-6-три-фторметил-2,4-(1Н,3Н)-пиримидиндиона (соединение С-13).

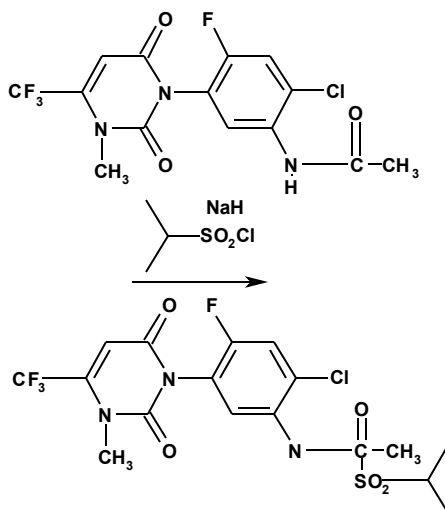
35550



2,00 г 3-(5-амино-4-хлор-2-фторфенил)-1-метил-6-трифторметил - 2,4(1Н,3Н)-пиримидиндиона растворяли в 5 мл бензола. К полученному раствору добавляли 0,61 мл уксусного ангидрида, и полученный раствор нагревали с обратным холодильником в течение 1 ч. После отгонки бензола полученный неочищенный продукт промывали гексаном с образованием 3-(5-ацетиламино-4-хлор-2-фторфенил) - 1 - метил-6-трифторметил-2,4(1Н, 3Н)-пиримидиндиона в виде белых кристаллов.

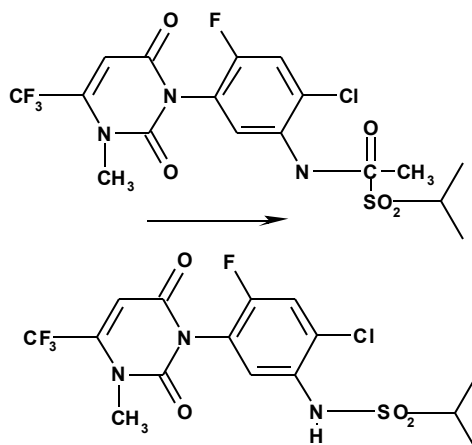
Т.пл.: 263-266°C.

$^1\text{H-NMR}$  ( $d_6$ -ДМСО)  $\delta$  (ч/млн): 2,15. (3Н, с.); 3,47 (3Н, с.); 6,54 (1Н, с.): 7,7 (1Н, д.,  $J = 9$  Гц), 7,90 (1Н, д.,  $J = 8$  Гц), 9,56(1Н, широкий синглет).



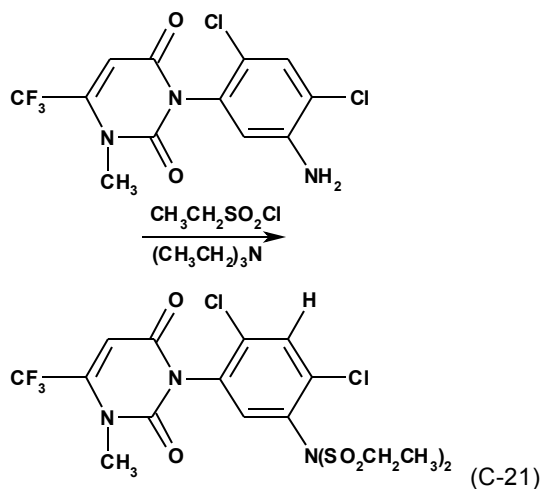
К суспензии 0,11 г гидрида натрия (масло, чистота - 60%) в 10 мл тетрагидрофурана добавляли. 1,00 г полученного 3-(5-ацетиламино-4-хлор-2-фторфенил)-1-метил - 6 - трифторметил 2,4(1Н, 3Н)-пиримидиндиона при температуре 0°C, а за-тем по каплям к полученной суспензии добавляли 0,30 мл изопропилсульфонилхлорида. После перемешивания в течение 2 ч реакционную смесь выливали в смесь воды со льдом и экстрагировали этилацетатом. Экстракт этилацетатного слоя промывали насыщенным водным раствором хлористого натрия и сушили над безводным сульфатом натрия. Затем этилацетат отгоняли с образованием неочищенного продукта. Полученный продукт очищали с помощью препаративной тонкослойной хроматографии (проявляющий растворитель: смесь гексана и этилацетата = 2/1), в результате чего было получено 0,54 г 3-[4-хлор-2-фтор -5- (N-ацетил)изопропилсульфониламинофенил]-1-метил-6-трифторметил-2,4-(1Н,3Н)-пирими-диндиона в виде бесцветного вязкого масла.

Спектр  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ч/млн): 1,45 (6Н, д.,  $J = 7$  Гц), 1,97 (3Н,с.), 3,47 (3Н,с.), 4,10 (1Н, четвертичный кватет,  $J = 7$  Гц), 6,23 (1Н,с.), 7,29 (1Н,д.,  $J = 7$  Гц), 7,36 (1Н, д.,  $J = 9$  Гц).



0,47 г полученного 3-[4-хлор-2-фтор-5-(N-аце-тил)изопропилсульфониламинофенил] -1-метил-6-трифторметил -2,4(1Н,3Н)- пиримидиндиона растворяли в 5 мл тетрагидрофурана. К полученному раствору добавляли 0,04 г гидроокиси натрия и 0,06 мл воды, после чего смешанный раствор перемешивали в течение 4 ч. После завершения реакции реакционную смесь выливали в разбавленную соляную кислоту и экстрагировали этилацетатом. Экстракт этилацетатного слоя промывали водой и насыщенным водным раствором хлористого натрия, а затем сушили над безводным сульфатом натрия. После этого, отгоняли этилацетат с образованием неочищенного продукта. Полученный продукт очищали при помощи препаративной тонкослойной хроматографии (проявляющий растворитель: смесь гексана и этилацетата = 3/1), в результате чего было получено 0,29 г целевого соединения в виде бесцветного вязкого масла.

Пример С-9. Синтез 3-(2,4-дихлор-5-этансуль-фониламинофенил)1 -метил- 6-трифторметил-2,4-(1Н,3Н)-пиримидиндиона (соединение С-21).

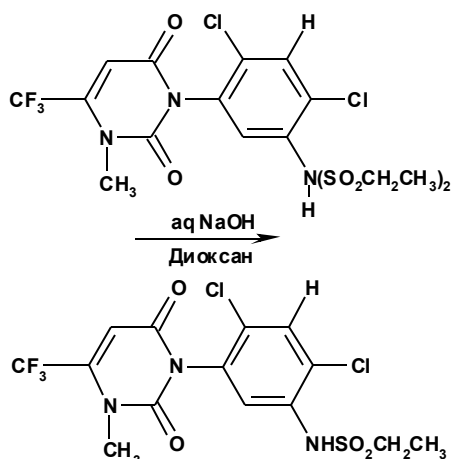


К смеси 1,00 г 3-(5-амино-2,4-дихлорфенил)-1-метил-6- трифторметил-2,4(1Н,3Н)-пиримидиндиона, 0,60 г триэтиламина и 10 мл дихлорметана при температуре не выше 5°С добавляли 0,56 г этансульфонилхорида. Полученную смесь перемешивали в течение ночи. После двукратной промывки реакционной смеси водой эту смесь промывали насыщенным водным раствором хлористого натрия и сушили над безводным сульфатом натрия. Дихлорметан отгоняли с образованием неочищенного продукта. Полученный продукт промывали диизопропиловым эфиром, в результате чего, было получено 1,40 г 3-[5-бис(этансульфонил)-амино-2,4-дихлорфенил]-1-метил - 6 - трифторметил-2,4(1Н,3Н)-пиримидиндиона в виде светло-же-лтых кристаллов.

Температура плавления: 221 ~ 223°С.

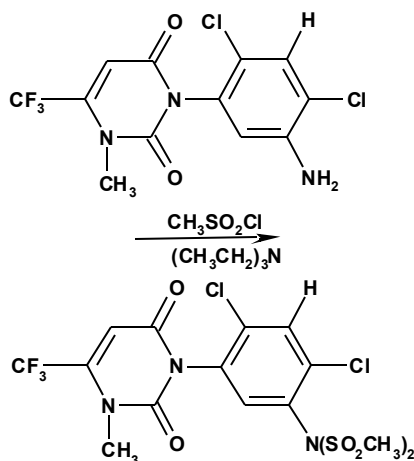
Спектр <sup>1</sup>H-ЯМР (d<sub>6</sub>-DMCO) δ (ч/млн): 1,48 (6Н, т., J = 7 Гц), 3,49 (3Н, с.), 3,61 (4Н, х., J = 7 Гц), 6,27 (1Н, с.), 7,56 (1Н, с.), 7,67 (1Н, с.).

35550



В 8 мл диоксана растворяли 0,80 г полученного 3-[5-бис(этансульфонил)амино-2,4-дихлорфенил]-1-метил-6-трифторметил-2,4(1H,3H)-пиримидиндиона и к полученному раствору добавляли 0,12 г гидроксида натрия (93%) и 2 мл воды. После перемешивания смешанного раствора в течение 4 ч. к нему добавляли разбавленную соляную кислоту с целью подкисления полученного раствора. Реакционную смесь экстрагировали этилацетатом. Полученный экстракт этилацетатного слоя промывали водой и насыщенным водным раствором хлористого натрия и сушили над безводным сульфатом натрия. Затем этилацетат отгоняли с образованием неочищенного продукта. Полученный продукт очищали с помощью препаративной тонкослойной хроматографии (проявляющий растворитель - смесь гексана и этилацетата = 3/2), в результате чего было получено 0,46 г целевого продукта в виде белых кристаллов.

Справочный пример. Синтез 3 - [5 - бис(метан-сульфонил)амино - 2,4 - дихлорфенил]-1-метил-6-трифторметил - 2,4(1H,3H)-пиримидиндиона (промежуточный продукт).



К смеси 1,00 г 3-(5-амино-2,4-дихлорфенил)-1-метил-6-трифторметил-2,4(1H,3H)-пиримидиндиона, 0,60 г триэтиламина и 10 мл дихлорметана при температуре не выше 5°C добавляли 0,46 г метансульфонилхлорида. Полученную смесь перемешивали в течение ночи. После двукратной промывки реакционной смеси водой эту смесь промывали насыщенным водным раствором хлористого натрия и сушили над безводным сульфатом натрия. Дихлорметан отгоняли с образованием неочищенного продукта. Полученный продукт промывали диизопропиловым эфиром, в результате чего было получено 1,40 г целевого продукта в виде белых кристаллов.

Температура плавления: не ниже 300°C.

Спектр  $^1\text{H}$ -ЯМР ( $d_6$ -ДМСО)  $\delta$  (ч/млн): 3,50 (6H, с.); 4,20 (3H, с.); 6,35 (1H, с.); 7,55 (1H, с.); 7,65 (1H, с.).

Производные урацила, по настоящему изобретению, синтезированные в соответствии с указанными выше примерами, и на основании методик, описанных в приведенных выше примерах или схемах, показаны в табл. 1-3, а физические свойства этих соединений - в табл. 4-6. Производные урацила, которые могут быть получены в соответствии с настоящим изобретением, не ограничиваются соединениями, показанными в табл. 1-6.

Ниже показаны примеры готовых составов, в которых используются соединения по настоящему изобретению.

Пример состава 1. Смачиваемый порошок, мас.ч.:

Смачиваемый порошок	Мас.ч
Соединение А-1, по настоящему изобретению	50
Циклит PFP (глина каолинового типа, производимая фирмой Циклит индастриз Ко., Лтд.)	43
Сорпол 5050 (анионное поверхностно-активное вещество, производимое фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	2
Рунокс 1000 С (анионное поверхностно-активное вещество, производимое фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	3
Карплекс 80, вещество, понижающее температуру замерзания (белый уголь, производимый фирмой Сионоги Фармасьютикал Ко., Лтд.)	2

Указанные выше вещества равномерно смешивают и измельчают с образованием смачиваемого порошка.

Пример состава 2. Эмульгируемый концентрат, мас.ч.:

Эмульгируемый концентрат	Мас.ч
Соединение А-1, по настоящему изобретению	3
Ксилон	76
Изофорон	15
Сорпол 3005 Х (смесь неионного ПАВ и анионного ПАВ, производимая фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	6

Указанные выше вещества равномерно смешиваются с образованием эмульгируемого концентрата.

Пример состава 3. Текучий препарат, мас.ч.:

Текучий препарат	Мас.ч
Соединение А-1, по настоящему изобретению	35
Агризол S-711 (неионное ПАВ, производимое фирмой Као Корпорейшн)	8
Рунокс 1000 С (анионное ПАВ, производимое фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	0,5
1%-ный водный раствор Родопола (загуститель, производимый фирмой Ро-Пуленк)	20
Этиленгликоль (вещество, понижающее температуру замерзания)	8
Вода	28,5

Указанные выше вещества однородно смешиваются для получения текучего препарата.

Пример состава 4. Гранулированный смачиваемый порошок (сухой текучий препарат), мас.ч.:

Гранулированный смачиваемый порошок (сухой текучий препарат)	Мас.ч
Соединение А-1 по настоящему изобретению	75
Изобам 1 (анионное ПАВ, производимое фирмой Курарей Изопрен Кемикал Ко.,	10

Лтд.)	
Ванилекс П (анионное ПАВ, производимое фирмой Сане Кокусаку Палп К.К.)	5
Карплекс 80 (белый уголь, производимый фирмой Сионоги фармацевтикал Ко.,Лтд)	10

Указанные выше вещества однородно смешивают и измельчают с образованием сухого текучего препарата.

Пример состава 5. Смачиваемый порошок, мас.ч.:

Смачиваемый порошок	Мас.ч
Соединение В-1, по настоящему изобретению	50
Циклит RFP (глина каолинового типа, производимая фирмой Циклит Инд., Ко., Лтд.)	43
Сорпол 5050 (анионное ПАВ, производимое фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	2
Рунокс 1000 С (анионное ПАВ, производимое фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	3
Карплекс 80 (антифриз, белый уголь, производимый фирмой Сионоги фарм. Ко., Лтд.)	2

Вышеуказанные вещества однородно смешиваются и размалываются с образованием смачиваемого порошка.

Пример состава 6. Эмульгируемый концентрат, мас.ч.:

Эмульгируемый концентрат	Мас.ч
Соединение В-1, по настоящему изобретению	3
Ксилол	76
Изофорон	15
Сорпол 3005 Х (смесь неионного ПАВ и анионного ПАВ, производимая фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	6

Указанные выше вещества однородно смешиваются с образованием эмульгируемого концентрата.

Пример состава 7. Текучий препарат, мас.ч.:

Текучий препарат	Мас.ч
Соединение В-1. по настоящему изобретению	35
Агризол S-711 (неионное ПАВ, производимое фирмой Као Корп.)	8
Рунокс 1000 С (анионное ПАВ, производимое фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	0,5
1-%-ный водный раствор Родопола (загуститель, производимый фирмой Рон-Пуленк)	20
Этиленгликоль (вещество, понижающее температуру замерзания)	8
<b>Вода</b>	<b>28,5</b>

Вышеуказанные вещества однородно смешивают с образованием текучего препарата.

Пример состава 8. Гранулы, мас.ч.:

Гранулы	Мас.ч
Соединение В-1, по настоящему изобретению	0,1
Бентонит	55,0
Тальк	44,9

Указанные выше вещества однородно смешивают и измельчают, затем разминают при

перемешивании с добавлением незначительного количества воды, гранулируют с помощью экструзионного гранулятора и сушат с образованием гранул.

Пример состава 9. Гранулированный смачиваемый порошок (сухой текучий препарат), мас.ч.:

Гранулированный смачиваемый порошок (сухой текучий препарат)	Мас.ч
Соединение В-1, по настоящему изобретению	75
Изобам 1 (анионное ПАВ, производимое фирмой Курарей Изопрен Кемикал Ко., Лтд)	10
Ванилехс П (анионное ПАВ, производимое фирмой Сане Кокусаку Палп. К.К.	5
Карплекс 80 (белый уголь, производимый фирмой Сионоги Фарм. Ко., Лтд.)	10

Указанные выше вещества однородно смешивают и измельчают с образованием сухого текучего препарата.

Пример состава 10. Смачиваемый порошок, мас.ч.:

Смачиваемый порошок	Мас.ч
Соединение С-1, по настоящему изобретению	50
Циклит PFP (глина каолинового типа, производимая фирмой Циклит. Индастриз, Ко., Лтд.)	43
Сорпол 5050 (анионное ПАВ, производимое фирмой Тоху Кемикал Кл., Лтд.)	2
Рунокс 1000 С (анионное ПАВ, производимое фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	3
Карплекс 80, вещество, понижающее температуру замерзания (белый уголь, производимый фирмой Сионоги Фарм. Ко., Лтд.)	2

Указанные выше вещества однородно смешивают и измельчают с образованием смачиваемого порошка.

Пример состава 11. Эмульгируемый концентрат, мас.ч.:

Эмульгируемый концентрат	Мас.ч
Соединение С-1, по настоящему изобретению	3
Ксилол	76
Изофорон	15
Сорпол 3005 Х (смесь неионного ПАВ и анионного ПАВ, производимая фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	6

Вышеуказанные вещества равномерно смешивают для получения эмульгируемого концентрата.

Пример состава 12. Текучий препарат, мас.ч.:

Текучий препарат	Мас.ч
Соединение С-1, по настоящему изобретению	35
Агризол Г -711 (неионное ПАВ, производимое фирмой Као Корп.)	8
Рунокс 1000 С (анионное ПАВ, производимое фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	0,5
1%-ный водный раствор (загуститель, производимый фирмой Рон-Пуленк)	20
Этиленгликоль (вещество, понижающее температуру замерзания)	8



Вода	28,5
------	------

Вышеуказанные вещества равномерно смешивают для получения текучего препарата.  
Пример состава 13. Гранулы, мас.ч.:

Гранулы	Мас.ч
Соединение С-1, настоящего изобретения	0,1
Бентонит	55
Тальк	44,9

Указанные выше вещества равномерно смешивают и измельчают, затем разминают при перемешивании и добавлении небольшого количества воды, гранулируют с помощью экструзионного гранулятора и сушат с образованием гранул.

Пример состава 14. Гранулированный смачиваемый порошок (сухой текучий препарат), мас.ч.:

Гранулированный смачиваемый порошок (сухой текучий препарат)	Мас.ч
Соединение С-1, по настоящему изобретению	75
Изобам 1 (анионное ПАВ, производимое фирмой Курарей Изопрен Кемикал, Ко., Лтд.)	10
Ванилекс N (анионное ПАВ, производимое фирмой Сане Кокусаку Палп К. К.)	5
Карплекс 80 (белый уголь, производимый фирмой Сионоги Фарм. Ко., Лтд.)	10

Указанные выше вещества равномерно смешивают и измельчают с образованием сухого текучего препарата.

Пример состава 15. Смачиваемый порошок, мас.ч.:

Смачиваемый порошок	Мас.ч
Соединение С-7, по настоящему изобретению	50
Циклит RFP (глина каолинового типа, производимая фирмой Циклит Индастриз, Ко., Лтд.)	43
Сорпол 5050 (анионное ПАВ, производимое фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	2
Рунокс 1000 С (анионное ПАВ, производимое фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	3
Карплекс 80 (антифриз, белый уголь, производимый фирмой Сионоги Фарм. Ко., Лтд.)	2

Вещества, указанные выше, равномерно смешивают и измельчают с образованием смачиваемого порошка.

Пример состава 16. Эмульгированный концен-трат, мас.ч.:

Эмульгированный концентрат	Мас.ч
Соединение С-7, по настоящему изобретению	3
Ксилол	76
Изофорон	15
Сорпол 3005 Х (смесь неионного ПАВ и анионного ПАВ, производимая фирмой Тохо Кемикал Ко., Лтд.)	6

Указанные выше вещества равномерно смешивают с образованием эмульгируемого концентрата.

Пример состава 17. Текучий препарат, мас.ч.:

Текучий препарат	Мас.ч
Соединение С-7, по настоящему изобретению	35
Агризол S-711 (неионное ПАВ, производимое фирмой Као Корп.)	8
Рунокс 1000 С (анионное ПАВ, производимое фирмой Тохо Кемикал Ко.,Лтд)	0,5
1%-ный водный раствор Родопола (загуститель, производимый фирмой Рон-Пу ленк)	20
Этиленгликоль (вещество, понижающее температуру замерзания)	8
Вода	28,5

Вышеуказанные вещества равномерно смешивают с образованием текучего препарата.

Пример состава 18. Гранулы, мас.ч.:

Гранулы	Мас.ч
Соединение С-7, по настоящему изобретению	0,1
Бентонит	55,0
Тальк	44,9

Указанные выше вещества смешивают до однородного состояния и измельчают, затем разминают при перемешивании с добавлением небольшого количества воды, гранулируют с помощью экструзионного гранулятора и сушат с образованием гранул.

Пример состава 19. Гранулированный смачиваемый порошок (сухой текучий препарат), мас.ч.:

Гранулированный смачиваемый порошок (сухой текучий препарат)	Мас.ч
Соединение С-7 по настоящему изобретению	75
Изобам 1 (анионное поверхностно-активное вещество, производимое фирмой Курарей Изопрел Кемикал Ко., Лтд.)	10
Лтд.) Ванилекс N (анионное ПАВ, производимое фирмой Сене Кокусаку Палп К.К.)	5
Карплекс 80 (белый уголь, производимый фирмой Сионоги Фарм. Ко., Лтд.)	10

Указанные выше вещества равномерно смешивают и измельчают с образованием сухого сыпучего препарата.

Пример состава 20. Смачиваемый порошок, мас.ч.:

Смачиваемый порошок	Мас.ч
Соединение С-11 по настоящему изобретению	50
Циклит RFP (глина каолинового типа, производимая фирмой Циклит Индастриз Ко., Лтд.)	43
Сорпол 5050 (анионное ПАВ, производимое фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	2
Рунокс 1000 С (анионное ПАВ, производимое фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	3
Карплекс 80 (антифриз, белый уголь, производимый фирмой Сионоги Фарм. Ко., Лтд.)	2

Указанные выше вещества равномерно смешивают и измельчают с образованием сухого текучего препарата.

Пример состава 21, Эмульгируемый концентрат, мас.ч.

Эмульгируемый концентрат	Мас.ч
Соединение С-11, по настоящему изобретению	3
Ксилол	76
Изофорон	15
Сорпол 3005 X (смесь неионного ПАВ и анионного ПАВ, производимая фирмой Тоху Кемикал Ко., Лтд.)	6

Указанные выше вещества смешивают равномерно с образованием эмульгируемого концентрата.

Пример состава 22 препаративной формы. Текучий препарат, мас.ч.:

Текучий препарат	Мас.ч
Соединение С-11, настоящего изобретения	35

Агризол S-711 (неионное ПАВ, производимое фирмой Као Корп.)	8
Рунокс 1000 С (анионное ПАВ, производимое фирмой Тоху Кемихал Ко., Лтд.)	0,5
1 %-ный водный раствор Родопола (загуститель, производимый фирмой Рон-Пуленк)	20
Этиленгликоль (вещество, понижающее температуру замерзания)	8
Вода	28,5

Указанные выше вещества равномерно смешивают с образованием текучего препарата.

Пример состава 23. Гранулы, мас.ч.:

Гранулы	Мас.ч
Соединение С-11, по настоящему изобретению	0,1
Бентонит	55,0
Тальк	44,9

Указанные выше вещества равномерно смешивают и размельчают, затем разминают при перемешивании с добавлением небольшого количества воды, гранулируют с помощью экструзионного гранулятора и сушат с образованием гранул.

Пример состава 24. Гранулированный смачиваемый порошок (сухой текучий препарат), мас.ч.:

Гранулированный смачиваемый порошок (сухой текучий препарат)	Мас.ч
Соединение С-11, по настоящему изобретению	75
Изобам 1 (анионное ПАВ, производимое фирмой Курарей Изопрен Кемикал Ко., Лтд.)	10
Ванилекс N (анионное ПАВ, производимое фирмой Сане Кокусаку Палп К.К.)	5
Корплекс 80 (белый уголь, производимый фирмой Сионоги Фарм. Ко., Лтд.)	10

Вышеуказанные вещества смешивают равномерно и измельчают с образованием сухого текучего препарата.

При практическом использовании описанных выше смачиваемого порошка, эмульгируемого концентрата, текучего препарата и гранулированного смачиваемого порошка их разбавляют в 50-1000 раз водой, а затем применяют таким образом, чтобы активный ингредиент поставлялся в дозе 0,0001-10 кг/га.

Полезность соединений, по настоящему изобретению, в качестве активных ингредиентов гербицидов будет ясно видна из результатов примеров испытаний, описанных ниже.

Пример 1 испытания. Испытание на гербицидное действие при обработке почвы.

Стерилизованную делювиальную почву помещали в пластиковый ящик размером 15 x 22 x 6 см. Затем в ящик высевали в виде смеси семена ежовника *Echinochloa crusgalli*, росички кровяной *Digitaria adscendens*, ооки однолетней *Cyperus microiria*, паслена черного *Solanum nigrum*, галисоги волосистой *Galinsoga ciliate*, жерушника индийского *Rorippa Indica*, риса *Oriza sativa*, кукурузы *Zea mays*, пшеницы *Triticum aestivum*, сои *Glycine max* и хлопка *Cossipium herbaceum* и покрывали слоем почвы толщиной примерно 1 см, а затем испытываемый жидкий гербицид распыляли равномерно по поверхности почвы с помощью небольшого опрыскивателя так, чтобы активный ингредиент применялся при заданной норме расхода. Каждый испытываемый жидкий гербицид приготавливали путем разбавления водой состава, полученного, согласно соответствующим примерам, составом, описанным выше. Через три недели после применения (опрыскивания) испытываемого жидкого гербицида проверяли их гербицидное действие на указанные различные виды сорняков и сельскохозяйственных культур и оценивали в соответствии со следующей стандартной шкалой оценок. Результаты показаны в табл. 7-11.

Стандартная шкала оценок: 5 - степень подавления роста составляет более 90% (растения почти полностью увядали); 4 - степень подавления роста - 70-90%; 3 - степень подавления роста составляет 40-70%; 2 - степень подавления роста составляет 20-40%; 1 - степень подавления роста составляет менее 5% (почти не эффективен).

Степень подавления роста определялась по следующей формуле, после измерения веса наземной

части растения на обработанном участке и веса на необработанном участке:

$$\text{Степень подавления роста} = \frac{\text{Вес наземной части растения на обработанном участке}}{(1 - \text{вес наземной части растения}) \times 100 \text{ на необработанном участке}}$$

Пример 2 испытания. Испытание на гербицидное действие при обработке листьев.

В пластиковый ящик размером 15 x 22 x 6 см, содержащий стерилизованную делювиальную почву, высевали пятнами семена ежовника *Echinochloa crusgalli*, росички кровяной *Digitaria adscendens*, осоки однолетней *Cyperus microiria*, паслена черного *Solanum nigrum*, галинсоги волосистой *Galinsoga ciliata*, жерушника индийского *Rorippa Indica*, риса *Oryza sativa*, сои *Glycine max*, пшеницы *Triticum aestivum*, кукурузы *Zea mays*, хлопка *Cossipium herbackum* и сахарной свеклы *Beta vulgaris*, и покрывали почвой на толщину примерно 1 см. Когда растения вырастали до стадии 2-3 листьев, испытываемый жидкий гербицид равномерно распыляли на листву растений так, чтобы активный ингредиент применялся с заданной нормой расхода.

Каждый испытываемый жидкий гербицид приготавливали путем разбавления водой состава, полученного, согласно соответствующим примерам, составов, описанным выше, и распыляли на всю листву сорняков с помощью небольшого опрыскивателя. Через четыре недели после опрыскивания испытываемым жидким гербицидом проверяли его гербицидное действие на указанные виды сорняков и полезных растений и оценивали по той же шкале оценок, что использовалась в примере испытания 1. Результаты показаны в табл. 12-16.

Пример 3 испытания. Испытание на гербицидное действие на орошаемом поле.

Аллювиальную почву помещали в горшки Вагнера площадью 1/5000 ар, а затем в них наливали воду для разжижения почвы и образования миниатюрных моделей, напоминающих заливное рисовое поле со слоем воды выше почвы глубиной 2 см. Затем в указанные горшки высевали смесь семян ежовника *Echinochloa crusgalli*, монохории *Monochoria vaginalis*, роталы индийской *Rotala Indica* и камыша озерного *Scirpus juncoides*. В слой почвы помещали также клубни осоки многолетней *Cyperus serotinus* и стрелолиста *Sagittaria pyraea*, а затем пересаживали рассаду риса в стадии 2,5 листьев. Горшки помещали в теплицу с температурой 25-30°C для обеспечения нормального роста растений. На 2-й день после посева разбавленный жидкий гербицид, подвергаемый испытанию, добавляли каплями на поверхность воды в каждый горшок с помощью измерительной пипетки так, чтобы соединение применялось в заданном количестве. Через три недели после применения жидкого гербицида проверяли его гербицидное действие на рис и указанные виды сорняков и оценивали по той же стандартной шкале оценок, что использовалась в примере испытания 1. Результаты показаны в табл. 17.

Подчеркнутые символы в табл. 7-16 обозначают следующее:

- N: ежовник (*Echinochloa crusgalli*);
- M: росичка кровяная (*Digitaria adscendens*);
- K: осока однолетняя (*Cyperus microiria*);
- H: паслен черный (*Solanum nigrum*);
- D: галинсога волосистая (*Galinsoga ciliata*);
- I: жерушник индийский (*Rorippa Indica*);
- R: рис (*Oryza sativa*);
- T: кукуруза (*Zea mays*);
- W: пшеница (*Triticum aestivum*);
- S: соя (*Glycine max*);
- C: хлопок (*Cossipium herbaceum*);
- B: сахарная свекла (*Reta vulgaris*).

В качестве контрольного соединения использовался бромацил, имеющий следующую структуру:

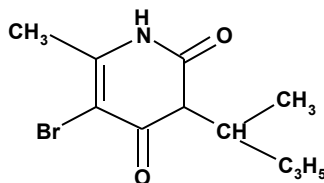
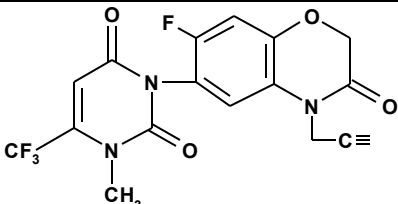
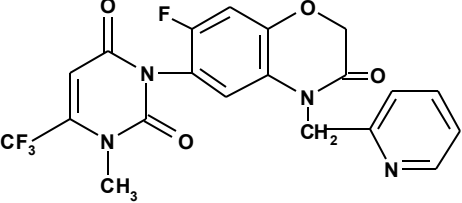
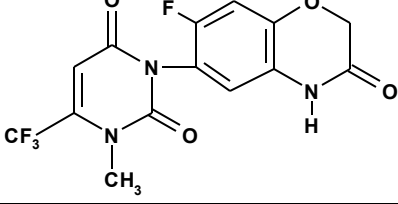
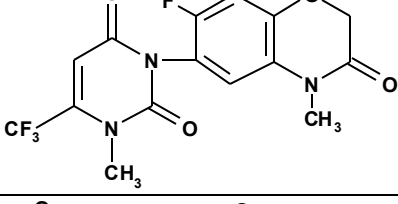
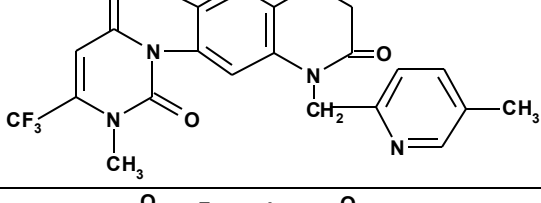
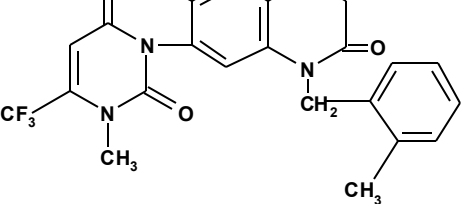
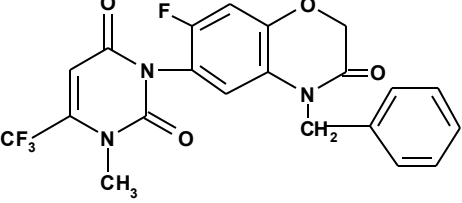
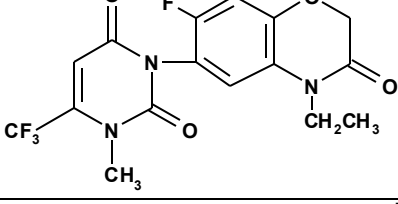


Таблица 1

Соединение	Структурная формула
------------	---------------------

A-1	
A-3	
A-4	
A-6	
A-8	
A-10	
A-12	
A-14	

Продолжение таблицы 1

Соединение	Структурная формула
------------	---------------------

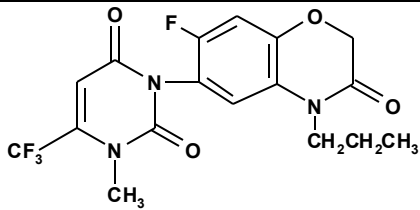
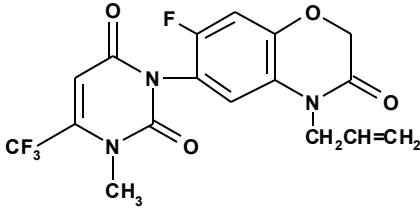
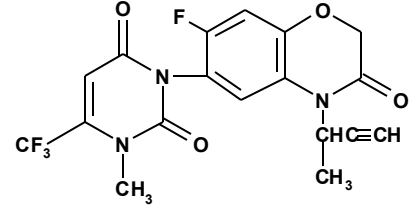
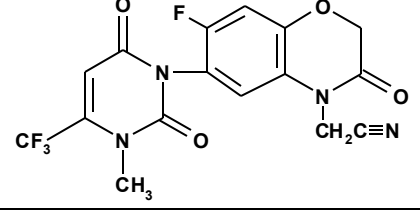
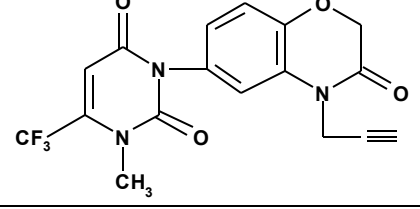
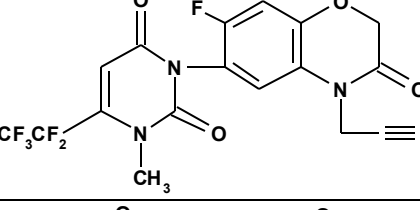
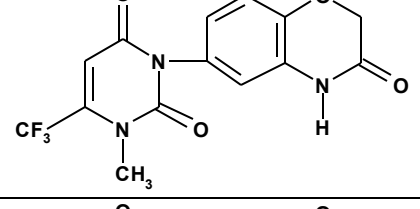
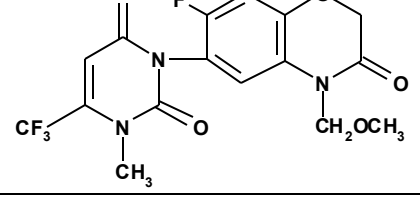
A-16	
A-20	
A-22	
A-24	
A-31	
A-32	
A-34	
A-26	

Таблица 2

Соединение	Структурная формула
B-1	

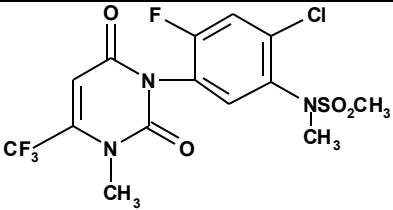
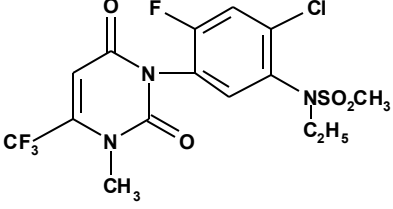
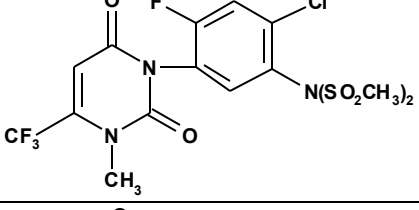
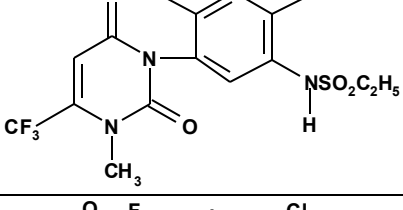
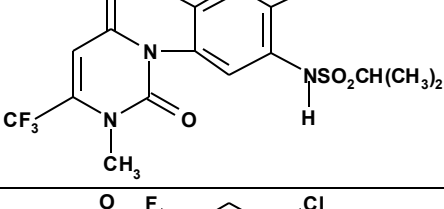
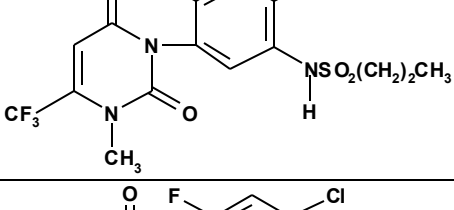
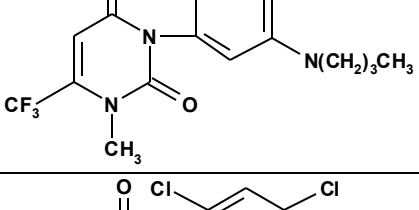
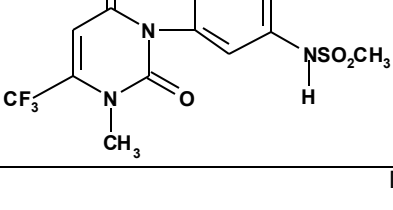
Таблица 3

Соединение	Структурная формула
C-1	
C-3	
C-4	
C-5	
C-6	
C-7	

Продолжение таблицы 3

Соединение	Структурная формула
------------	---------------------



C-8	
C-9	
C-10	
C-11	
C-13	
C-15	
C-16	
C-20	

Продолжение таблицы 3

Соединение	Структурная формула
------------	---------------------

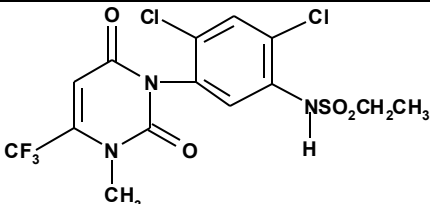
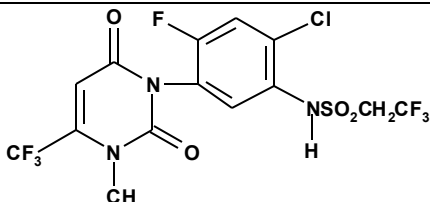
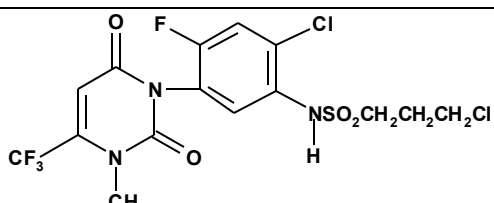
C-21	 <chem>CC1=C(C(F)(F)F)NC(=O)N(C1=O)c2cc(Cl)cc(Cl)c2NS(=O)(=O)CC</chem>
C-22	 <chem>CC1=C(C(F)(F)F)NC(=O)N(C1=O)c2cc(F)cc(Cl)c2NS(=O)(=O)CC(F)(F)F</chem>
C-23	 <chem>CC1=C(C(F)(F)F)NC(=O)N(C1=O)c2cc(F)cc(Cl)c2NS(=O)(=O)CCCCl</chem>

Таблица 4

Соединение	Спектр $^1\text{H}$ -ЯМР $\delta$ (ч./млн) (растворитель)	Физические свойства
A-1	2,31 (1 H, t, J = 2 Гц), 3,60 (3H, s), 4,69 (2H, d, J = 2 Гц), 4,73 (2H, s), 6,43 (1H, s), 7,01 (1H, d, J = 10 Гц), 7,15 (1H, d, J = 7 Гц) [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 158-160°C
A-3	3,50 (3H, s), 4,72 (2H, s), 5,18 (2H, d, J = 4 Гц), 6,28 (1H, s), 6,85 (1H, d, J = 10 Гц), 7,10 (1 H, d, J = 8 Гц), 7,02-7,41 (2H, m), 7,47-7,80 (1H, m), 8,36-8,60 (1H, m) [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 161-163°C
A-4	3,51 (3H, s), 4,54 (2H, s), 6,32 (1H, s), 6,66 (1H, d, J = 8 Гц), 6,80 (1H, d, J = 10 Гц), 9,58 (1H, br, s) [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 99-105°C
A-6	3,28 (3H, s), 3,54 (3H, s), 4,63 (2H, s), 6,35 (1H, s), 6,83 (1H, d, J = 8 Гц), 6,86 (1H, d, J = 10 Гц) [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 147-152°C
A-8	2,25 (3H, s), 3,96 (3H, br, s), 4,67 (2H, s), 5,01 (2H, s), 6,22 (1H, s), 6,65-7,23 (3H, m), 7,02(4H, s) [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 245-247°C
A-10	2,33 (3H, s), 3,42 (3H, s), 4,71 (2H, s), 4,98 (2H, s), 6,21 (1H, s), 6,51 (1H, br, d, J = 2 Гц), 6,61-7,24 (6H, t) [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 199-201°C
A-12	3,41 (3H, br, s), 4,66 (2H, s), 5,01 (2H, br, s), 6,29 (1H, s), 6,79 (1H, d, J = 7 Гц), 6,91 (1H, d, J = 10 Гц), 7,13 (5H, br, s) [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 85-89°C
A-14	1,04 (3H, t, J = 7 Гц), 3,32 (3H, br, s), 3,70 (2H, q, J = 7 Гц), 4,38 (2H, s), 6,08 (1H, s), 6,52 (1H, d, J = 7 Гц), 6,58 (1H, J = 10 Гц) [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 168-170°C
A-16	0,92 (3H, t, J = 7 Гц), 1,65 (2H, tg, J = 7 Гц), 3,50 (3H, s), 3,78 (2H, br, t, J = 7 Гц), 4,57 (2H, s), 6,25 (1H, s), 6,72 (1H, d, J = 7 Гц), 6,79 (1H, d, J = 10 Гц), [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 60-62°C
A-20	3,49 (3H, br, s), 4,28-4,57 (2H, m), 4,60 (2H, s), 4,88-5,37 (2H, m), 5,45-5,73 (1H, m), 6,24 (1H, s), 6,69 (1H, d, J = 7 Гц), 6,78 (1H, d, J = 10 Гц), [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 113-114°C
A-22	1,63 (3H, d, J = 7 Гц), 2,49 (1H, d, J = 2 Гц), 3,58 (3H, s), 4,62 (2H, s), 5,99 (1H, bq, J = 7,2 Гц), 6,34 (1H, s), 6,88 (1H, d, J = 10 Гц), 7,47 (1H, d, J = 7 Гц), [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 155-158°C
A-24	3,54 (3H, s), 7,43 (4H, s), 6,36 (1H, s), 6,95 (1H, d, J = 8 Гц), 6,97 (1H, d, J = 10 Гц) [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 194-196°C
A-26	3,34 (3H, s), 3,52 (3H, br, s), 4,63 (2H, s), 5,20 (2H, s), 6,27 (1H, s), 6,80 (1H, d, J = 10 Гц), 7,10 (1H, d, J = 8 Гц) [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 96-100°C
A-31	2,23 (1H, t, J = 2 Гц), 3,50 (3H, br, s), 4,56 (2H, d, J = 2 Гц), 4,58 (2H, s), 6,28 (1H, s), 6,15 - 7,15 (3H, t), [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 207-210°C
A-32	2,24 (1H, t, J = 2 Гц), 3,50 (3H, br, s), 4,57 (1H, d, J = 2 Гц), 4,59 (2H, s), 6,18 (1H, s), 6,75 (1H, d, J = 10 Гц), 6,90 (1H, d, J = 7 Гц), [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 190-192°C
A-34	*3,50 (3H, br, s), 4,48 (2H, s), 6,26 (1H, s), 6,40 ~ 7,05 (3H, m), 8,85 (1H, br, s), [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл. 257~259°C

\* т.пл. - температура плавления

Таблица 5

Соединение	Спектр $^1\text{H}$ -ЯМР $\delta$ (ч./млн) (растворитель)	Физические свойства
В-1	3,48 (3H, s), 3,59 (2H, s), 3,61 (3H, s), 6,22 (1H, s), 7,21 (1H, d, J = 9 Гц), 7,29 (1H, d, J = 7 Гц) [CDCl <sub>3</sub> ]	Масло

Таблица 6

Соединение	Спектр $^1\text{H}$ -ЯМР $\delta$ (ч./млн) (растворитель)	Физические свойства
C-1	2,57 (3H, s), 3,49 (3H, s), 6,25 (1H, s), 7,36 (1H, d, J = 9 Гц), 7,84 (1H, d, J = 7 Гц), [d <sub>6</sub> -DMSO]	т.пл.: 65 - 69°C
C-3	1,39 (9H, s), 3,50 (3H, br s), 6,25 (1H, s), 7,32 (1H, d, J = 9 Гц), 7,94 (1H, d, J = 7 Гц), [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл.: 135 - 139°C
C-4	2,94 (3H, s), 3,45 (3H, s), 6,21 (1H, s), 6,63~7,00 (1H, m) 7,07 ~ 7,59 (3H, m), [d <sub>6</sub> -DMSO]	т.пл.: 174 ~ 177°C
C-5	1,33(3H,t, J = 7 Гц), 3,12(2H,q,J = 7 Гц), 3,52 (3H, s), 6,25 (1H, s), 6,71 ~ 7,17 (2H, т), 7,26~7,64 (2H, т), [d <sub>6</sub> -DMSO]	т. п л.: 177 ~ 180°C
C-6	1,40 (3H, t, J = 7 Гц), 3,11 (2H, q, J = 7 Гц), 3,28 (3H, s), 3,49 (3H, s), 6,33 (1H, s), 7,03~7,63(3H,m), [d <sub>6</sub> -DMSO]	т.пл.: 157 ~ 158°C
C-7	2,95 (3H,s), 3,43 (3H,s), 6,29 (1H, s), 7,39 (1H,d,J = 9 Гц), 7,44 (1H,d, J = 7 Гц), 9,28 (1H, br,s), [d <sub>6</sub> -DMSO]	т.пл.: 168 ~ 171°C
C-8	3,01 (3H, s), 3,19 (3H, s), 3,46 (3H, s), 6,39 (1H, s), 7,46 (1H, d, J = 9 Гц), 7,56 (1H, d, J = 7 Гц), [d <sub>6</sub> -DMSO]	т.пл.: 198 ~ 201°C
C-9	1,09 (3H, t, J = 7 Гц), 3,24 (3H,s), 3,47 (3H, s), 3,60 (2H, q, J = 7 Гц), 6,33 (1H,s), 7,50 (1H,d,J= 9 Гц), 7,55 (1H,d, J = 7 Гц), [d <sub>6</sub> -DMSO]	т.пл.: 254~257°C
C-10	3,54 (6H,s), 4,22 (3H, s), 6,481 (1H, s), 7,79 (1H, d, J = 9 Гц), 7,98 (1H, d, J = 7 Гц), [d <sub>6</sub> -DMSO]	т.пл.: 282 ~ 285°C
C-11	1,32 (3H, t, J = 7 Гц), 3,06 (2H, q, J = 7 Гц), 3,43 (3H, s), 6,23 (1H, s), 7,29 (1H, d, J = 9 Гц), 7,41 (1H, J = 7 Гц), 9,11 (1H,br,s), [d <sub>6</sub> -DMSO]	т.пл.: 165 ~ 167°C
C-13	1,34 (6H, d, J = 7 Гц), 3,22 (1H, qq, J = 7 Гц), 3,48 (3H, s), 6,22 (1H, s), 6,90 (1H, br s), 7,17(1H, d, J = 9 Гц), 7,56(1H, d, J = 7 Гц) [CDCl <sub>3</sub> ]	вязкое масло
C-15	1,00 (3H,t,J = 7 Гц), 1,25~2,19 (2H, m), 2,80~3,28 (2H, m), 3,54 (3H, s), 6,35 (1H,s), 7,16 (1H, br s), 7,40 (1H, d, J = 9 Гц), 7,70 (1H,d, J = 7 Гц) [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл.: 113 ~ 115°C
C-16	0,70 ~2,19 (7H, m), 2,88~3,24 (2H,m), 3,49 (3H,s), 6,22 (1H, s), 6,91 (1H, br s), 7,20 (1H, d, J = 8 Гц), 7,50 (1H, d, J = 7 Гц), [COCl <sub>3</sub> ]	т.пл.: 115 ~117°C
C-20	3,06 (3H,s), 3,50 (3H,s), 6,42 (1H, s), 7,62 (1H,s), 7,74(1H,s), 10,00 (br, s), [d <sub>6</sub> -DMSO]	т.пл.: 172 ~ 173°C
C-21	1,31 (3H, t, J = 7 Гц), 3,10 (2H, q, J = 7 Гц), 3,52 (3H, s), 6,34 (1H,s), 7,21 (1H, s), 7,59 (1H,s), 7,66 (1H,s) [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл.: 152,5~153,5°C
C-22	3,46 (3H, s), 3,94 (2H,q, J = 9 Гц), 5,15 (1H,br,s), 6,23 (1H,s), 7,25 (1H, d, J = 9 Гц), 7,40 (1H,d,J = 7 Гц) [CDCl <sub>3</sub> ]	т.пл.: 181 ~ 184°C
C-23	2,05-2,45 (2H, m), 3,21 (2H,t, J = 8 Гц), 3,47 (3H,s), 3,61 (2H,t, J = 8 Гц), 6,32 (1H,s), 7,35 (1H,d, J = 8 Гц), 7,36 (1H,br s), 7,60 (1H,d, J = 7 Гц), [CDCl <sub>3</sub> ]	стеклование

Таблица 7

Соединение	Норма внесения, г/га	N	M	K	H	D	I
A-1	10	5	5	5	5	5	5
	20	5	5	5	5	5	5
	40	5	5	5	5	5	5

Таблица 8

Соединение	Норма внесения, г/га	N	M	K	H	D	I	R	T	W	S	C
A-3	10	5	5	5	5	5	.5	2	1	1	0	1
	20	5	5	5	5	5	5	4	3	2	0	2
	40	5	5	5	5	5	.5	5	5	5	0	4
A-4	10	5	5	5	5	5	5	0	1	0	2	2
	20	5	5	5	5	5	5	1	2	1	3	3
	40	5	5	5	5	5	5	3	4	3	4	4
A-6	10	5	5	5	5	5	5	3	3	1	1	1
	20	5	5	5	5	5	5	4	4	2	2	2
	40	5	5	5	5	5	5	5	5	4'	3	4
A-8	40	3	5	5	5	5	5	1	0	0	0	0
	80	4	5	5	5	5	5	2	1	1	0	0
	160	5	5	5	5	5	5	0	3	2	1	2
A-10	40	2	2	4	5	2	5	0	1	0	0	0
	80	3	4	5	5	4	5	1	2	1	1	1
	160	3	5	5	5	5	5	2	4	3	2	4
A-12	10	3	3	5	5	4	5	3	3	2	0	1
	20	4	4	5	5	5	5	4	4	3	1	2
	40	5	5	5	5	5'	5	5	5	4	2	4
A-14	10	5	5	5	5	5	5	5	5	5	2	4
	20	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5
	40	5	5	5'	5	5	5	5	5	5	4	5
A-16	10	5	5	5	5	5	5	5	5	5	2	5
	20	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5
	40	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5
A-20	10	5	5	5	5	5	5	2	3	2	1	2
	20	5	5	5	5	5	5	3	4	3	2	3
	40	5	5	5	5	5	5	4	5	4	3	4
A-22	10	5	5	5	5	5	5	3	5	5	0	3
	20	5	5	5	5	5	5	4	5	5	1	4
	40	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5
A-24	10	5	2	5	5	5	5	1	0	0	0	0
	20	5	4	5	5	5	5	2	1	0	1	1
	40	5	5	5	5	5	5	4	4	2	3	4
A-26	10	5	5	5	5	5	5	5	4	4	4	4
	20	5	5	5	5	.5	5	5	5	5	5	5
	40	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
A-31	10	5	4	5	5	5	5	5	3	3	2	4
	20	5	5	5	5	5	5	5	4	4	3	5
	40	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5
A-32	10	5	5	3	5	5	5-	2	4	1	0	2
	20	5	5	4	5	5	5	3	5	2	1	4
	40	5	5	5	5	5	5	4	5	5	2	5
A-34	10	1	1	5	2	5	5	0	0	0	0	0
	20	3	3	5	4	5	5	1	0	0	0	0
	40	5	5	5	5	5	5	3	1	1	1	1

Таблица 9

Соединение	Норма внесения, г/га	N	M	K	H	D	I	R	T	W	S	C	B
B-10	10	5	5	5	5	5	5	0	0	0	0	2	4
	20	.5	5	5	5	5	5	1	1	0	0	3	5
	40	5	5	5	5	5	5	2	2	1	1	4	5

Таблица 10

Соединение	Норма внесения, г/га	N	M	K	H	D	I
C-1	10	4	4	5	5	5	5
	20	5	5	5	5	5	5
	40	5	5	5	5	5	5
Сравнительное соединение	40	2	0	2	4	5	4

Таблица 11

Соединение	Норма внесения, г/га	N	M	K	H	D	I	R	T	W	S	C
C-3	10	5	5	5	5	5	5	0	1	0	0	0
	20	5	5	5	5	5	5	0	2	1	0	0
	40	5	5	5	5	5	5	1	3	2	0	0
C-4	10	0	0	2	4	5	5	0	0	0	0	0
	20	1	1	3	5	5	5	0	0	0	0	0
	40	2	2	4	5	5	5	0	0	0	0	1
C-5	10	0	0	2	3	5	5	0	0	0	0	0
	20	1	1	3	4	5	5	0	0	0	0	0
	40	2	2	4	5	5	5	0	0	0	0	1
C-6	40	2	1	4	4	5	5	0	0	0	1	1
C-7	10	5	5	5	5	5	5	4	0	0	0	1
	20	5	5	5	5	5	5	5	1	0	0	2
	40	5	5	5	5	5	5	5	2	1	0	5
C-8	10	0	0	5	5	5	5	0	0	0	2	4
	20	2	2	5	5	5	5	1	1	0	3	5
	40	4	4	5	5	5	5	2	3	1	3	5
C-9	10	2	3	5	5	5	5	0	0	0	0	3
	20	3	4	5	5	5	5	1	1	0	1	4
	40	4	5	5	5	5	5	2	2	1	2	5
C-10	10	2	4	5	5	5	5	0	0	0	0	3
	20	4	5	5	5	5	5	2	1	0	1	3
	40	5	5	5	5	5	5	4	2	2	2	4
C-11	10	5	3	5	5	5	5	0	0	0	0	2
	20	5	4	5	5	5	5	1	0	0	0	4
	40	5	5	5	5	5	5	3	0	0	0	5
C-13	10	4	4	5	5	5	5	1	1	0	0	4
	20	5	5	5	5	5	5	2	2	0	0	5
	40	5	5	5	5	5	5	4	3	1	0	5
C-15	10	3	2	5	5	5	5	1	0	0	0	4
	20	4	4	5	5	5	5	2	1	0	0	5
	40	5	5	5	5	5	5	4	2	1	0	5
C-16	10	3	4	5	5	5	5	0	-	0	0	2
	20	4	5	5	5	5	5	1	1	0	0	3
	40	5	5	5	5	5	5	2	2	1	0	4
C-20	20	5	.5	5	5	5	5	4	0	0	0	1
	40	5	5	5	5	5	5	5	1	0	0	2
	80	5	5	5	5	5	5	5	2	1	0	5

Продолжение таблицы 11

Соединение	Норма внесения, г/га	N	M	K	H	D	I	R	T	W	S	C
C-21	20	5	3	5	5	5	5	0	0	0	0	2
	40	5	4	5	5	5	5	1	0	0	0	4
	80	5	5	5	5	5	5	3	0	0	0	5
C-22	10	4	4	5	5	5	5	1	1	0	0	3
	20	5	5	5	5	5	5	2	2	0	0	4
	40	5	5	5	5	5	5	4	3	1	0	5
C-23	10	4	4	5	5	5	5	0	0	0	0	3
	20	5	5	5	5	5	5	2	1	0	0	4
	40	5	5	5	5	5	5	3	3	1	0	5

Таблица 12

Соединение	Норма внесения, г/га	N	M	K	H	D	I
A-1	10	5	5	5	5	5	5
	20	5	5	5	5	5	5
	40	5	5	5	5	5	5

Таблица 13

Соединение	Норма внесения, г/га	N	M	K	H	D	I	R	T	W	S	C	B
A-3	10	5	3	5	5	5	5	4	4	2	4	4	5
	20	5	4	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
	40	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
A-4	10	3	4	5	5	5	5	4	2	2	5	5	5
	20	4	5	5	5	5	5	5	3	3	5	5	5
	40	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	5	5
A-6	10	2	2	5	5	5	5	3	2	2	4	5	5
	20	4	4	5	5	5	5	4	3	2	5	5	5
	40	5	5	5	5	5	5	5	4	3	5	5	5
A-8	40	0	2	5	5	5	5	0	1	0	2	1	1
	80	1	2	5	5	5	5	0	2	1	2	2	2
	160	2	3	5	5	5	5	1	3	2	3	3	2
A-10	40	2	1	5	5	3	2	1	1	2	2	5	2
	80	3	2	5	5	4	4	2	2	3	3	5	3
	160	5	3	5	5	5	5	4	4	4	4	5	3
A-12	10	4	3	5	5	5	5	2	3	2	3	5	4
	20	5	4	5	5	5	5	3	4	3	4	5	5
	40	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	5	5
A-14	10	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
	20	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
	40	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
A-16	10	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
	20	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
	40	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
A-20	10	3	2	3	5	5	4	4	3	3	3	5	3
	20	4	3	4	5	5	5	5	4	4	4	5	4
	40	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
A-22	10	3	3	3	5	5	4	5	4	5	5	5	3
	20	4	4	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4
	40	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
A-24	10	1	1	2	5	5	5	3	2	0	3	5	4
	20	2	2	4	5	5	5	4	3	1	4	5	5
	40	4	5	5	5	5	5	4	4	2	5	5	5

Продолжение таблицы 13

Соединение	Норма внесения, г/га	N	M	K	H	D	I	R	T	W	S	C	B
A-26	10	5	5	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5
	20	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
	40	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
A-31	10	5	5	5	5	5	5	4	4	4	4	5	5
	20	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
	40	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5

Таблица 14

Соединение	Норма внесения, г/га	N	M	K	H	D	I	R	T	W	S	C	B
B-1	10	5	5	5	5	5	5	2	1	0	1	5	5
	20	5	5	5	5	5	5	3	2	1	2	5	5
	40	5	5	5	5	5	5	4	3	2	3	5	5

Таблица15

Соединение	Норма внесения, г/га	N	M	K	H	D	I
C-1	10	4	5	5	5	5	5
	20	5	5	5	5	5	5
	40	5	5	5	5	5	5
Соединение сравнения	40	0	0	1	4	2	3

Таблица 16

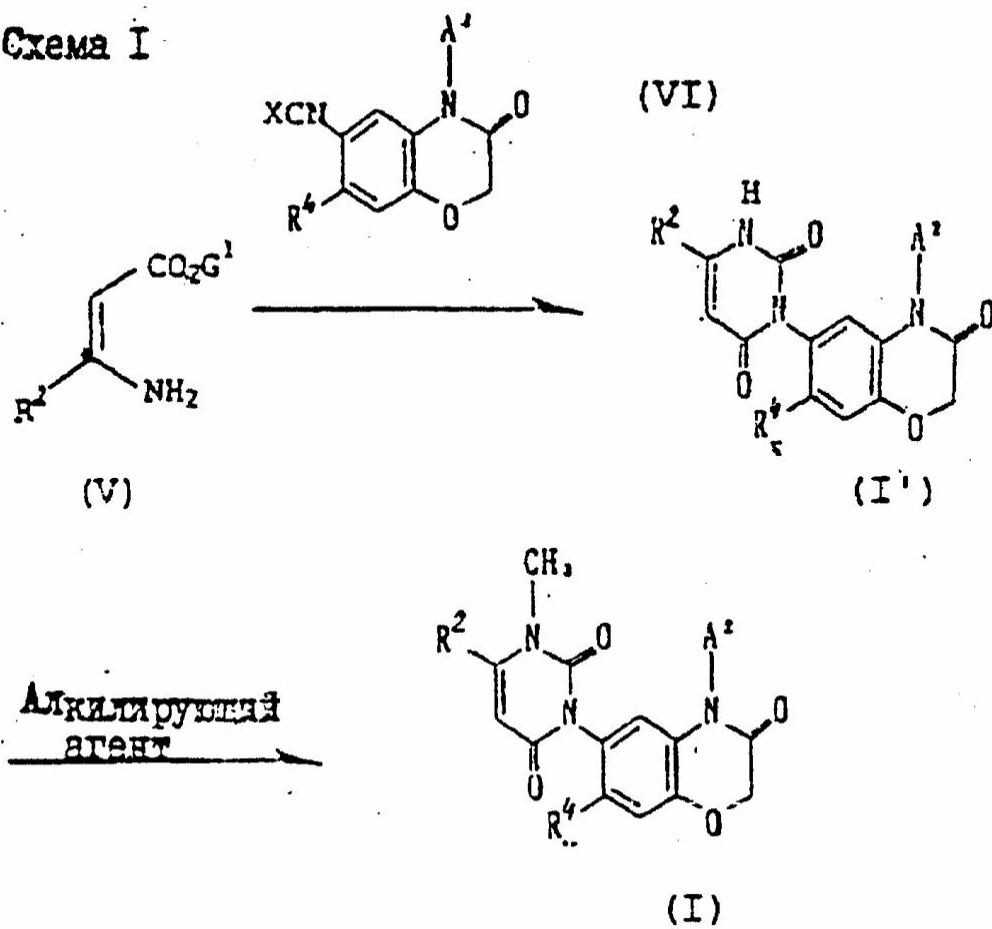
Соединение	Норма внесения, г/га	N	M	K	H	D	I	R	T	W	S	C	B
C-3	10	2	1	5	5	5	5	0	2	0	5	5	5
	20	4	2	5	5	5	5	1	3	1	5	5	5
	40	5	3	5	5	5	5	3	3	2	5	5	5
C-4	10	0	0	0	4	4	4	0	0	0	0	3	3
	20	0	0	1	5	5	5	0	0	0	0	4	4
	40	1	1	2	5	5	5	1	1	0	1	5	5
C-6	40	2	1	1	5	5	5	2	1	1	4	5	5
C-7	10	1	1	5	5	5	5	2	0	0	2	5	5
	20	2	2	5	5	5	5	3	1	0	3	5	5
	40	4	3	5	5	5	5	4	3	1	3	5	5
C-8	10	1	1	2	5	5	5	1	1	0	0	4	5
	20	2	2	4	5	5	5	3	3	1	1	5	5
	40	2	5	5	5	5	5	4	4	2	2	5	5
C-9	10	1	0	3	5	5	5	0	0	0	2	3	4
	20	2	1	4	5	5	5	0	1	0	3	4	5
	40	3	2	5	5	5	5	2	3	2	4	5	5
C-10	10	1	0	2	5	5	5	0	0	0	2	4	4
	20	2	1	4	5	5	5	1	1	0	3	5	5
	40	3	2	5	5	5	5	2	2	1	3	5	5
C-11	10	1	1	4	5	5	5	2	0	0	1	5	4
	20	2	2	5	5	5	5	2	0	0	2	5	5
	40	3	2	5	5	5	5	3	1	1	3	5	5

Таблица 17



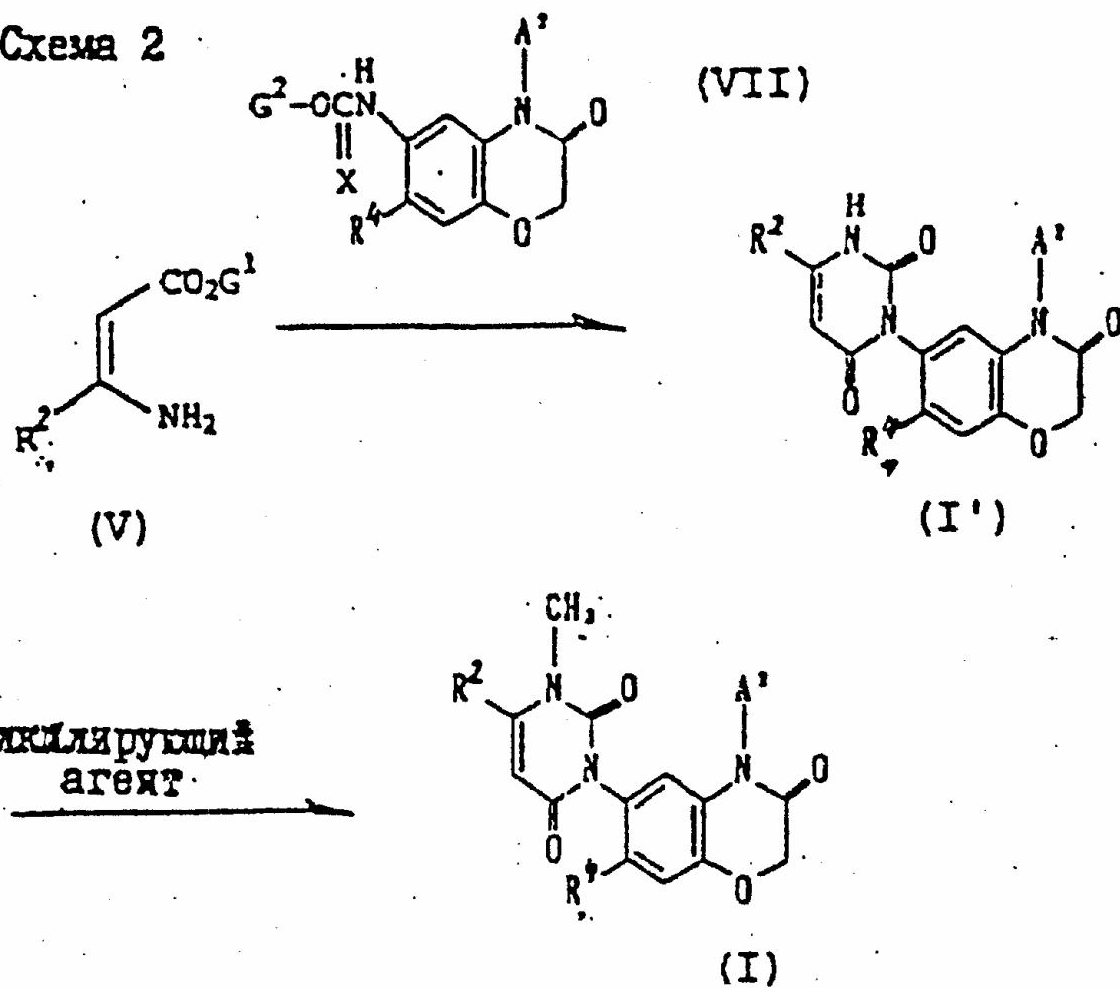
Соединение	Норма внесения, г/га	Ежевник	Камыш озерный	Монохория	Ротала индийская	Осока многолетняя	Стрелолист	Рассадный рис
A-1	2	4	4	5	5	5	5	0
	4	5	5	5	5	5	5	0
	8	5	5	5	5	5	5	0
C-3	5	5	4	5	5	2	4	0
	10	5	5	5	5	3	5	0
	20	5	5	5	5	4	5	0

Схема I

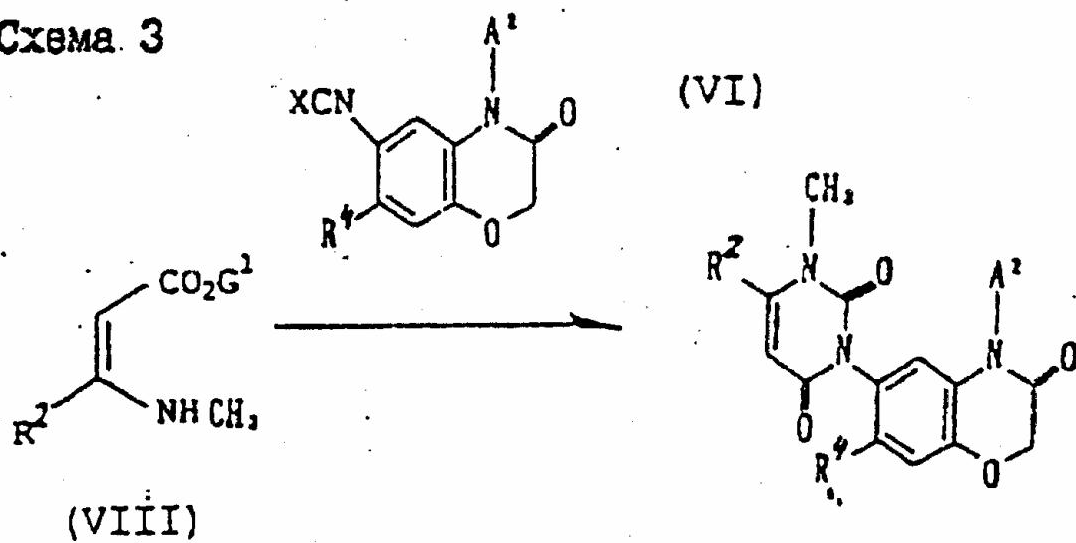


Фиг.1

## Схема 2

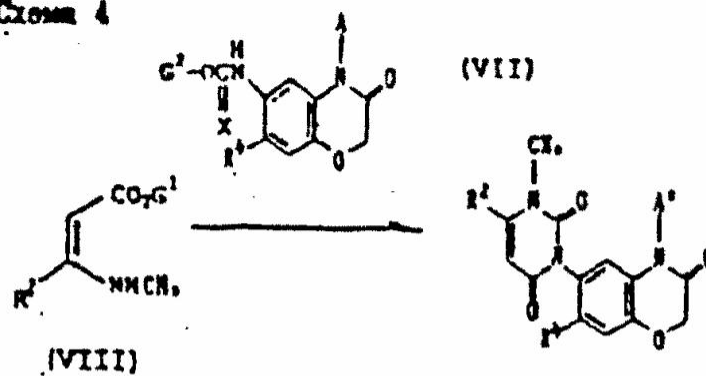


## Схема 3



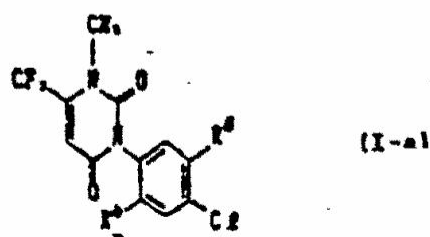
Фиг.2

Схема 4



Производные уреа, выражение

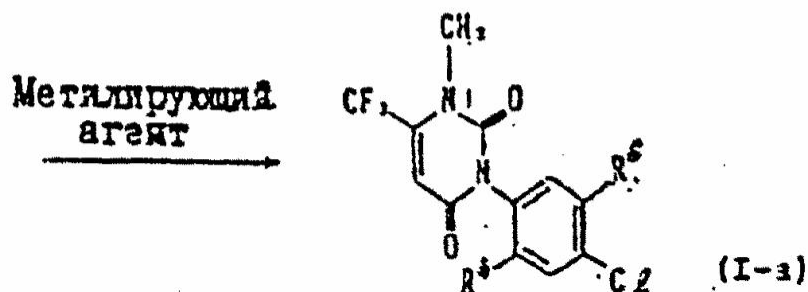
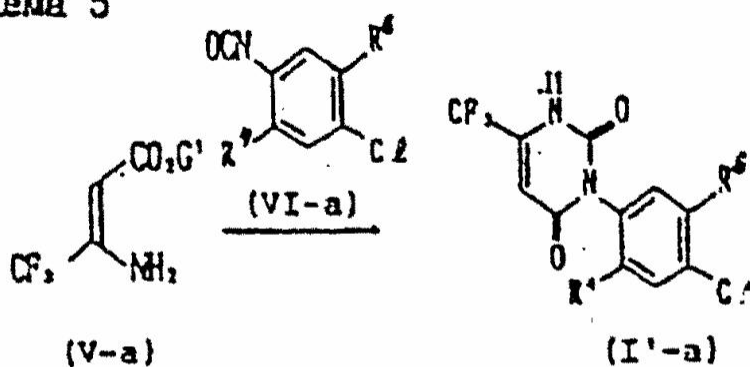
формулы 1-а :



можно синтезировать в соответствии со

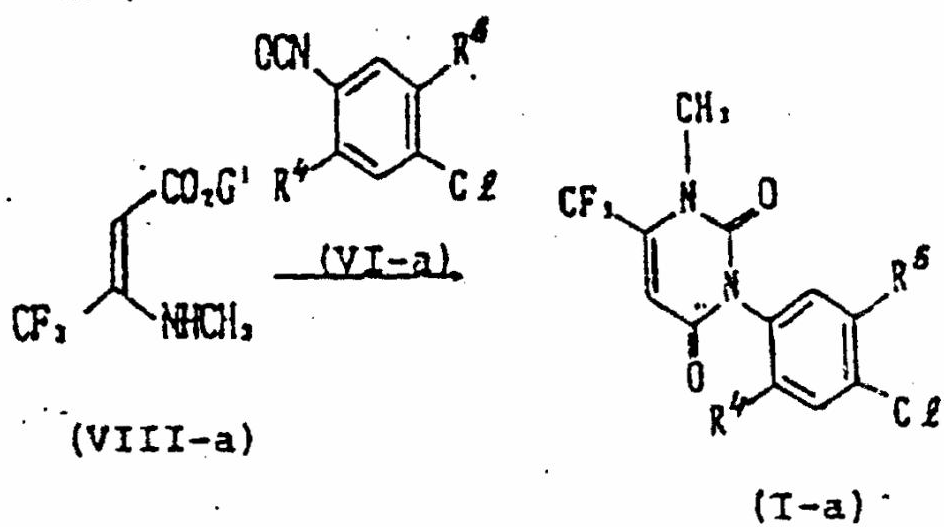
схемами 5-11.

Схема 5

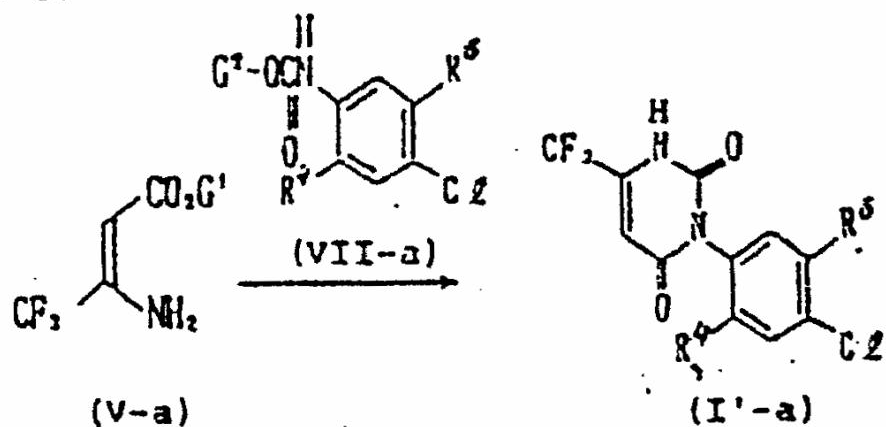


Фиг.3

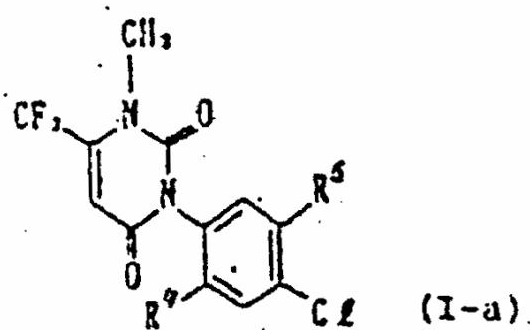
## Схема 7



## Схема 6.

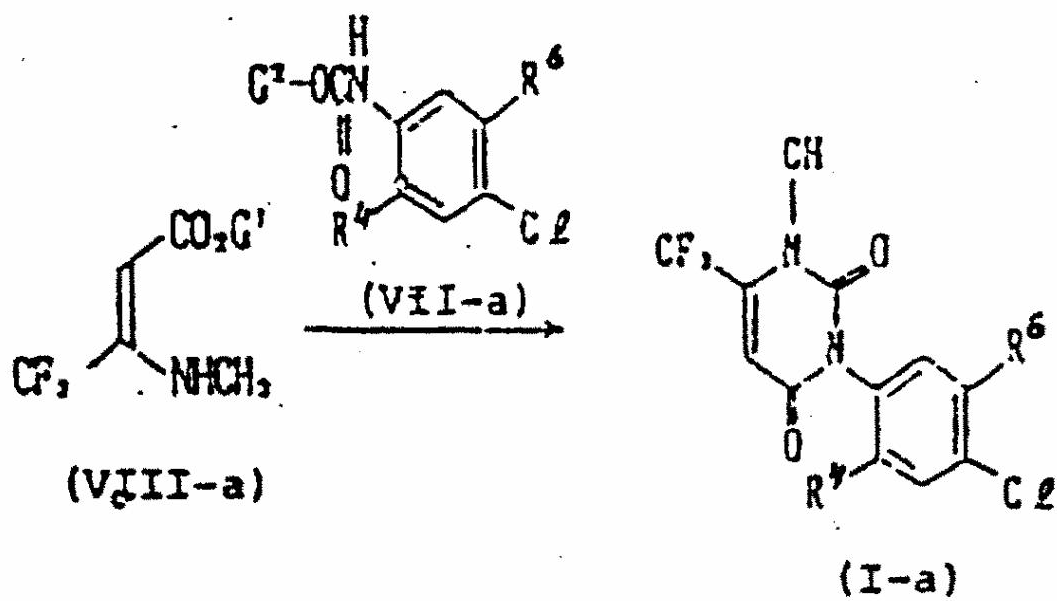


Метилирующий  
агент



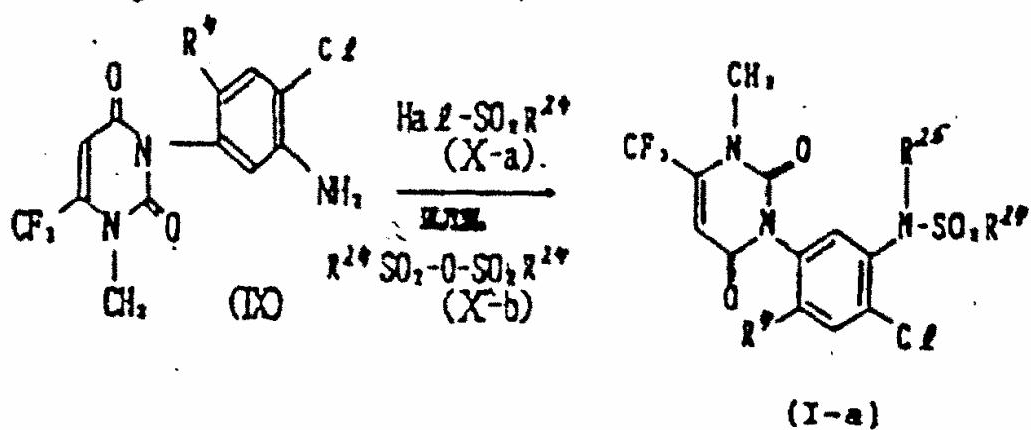
Фиг.4

## Схема 8

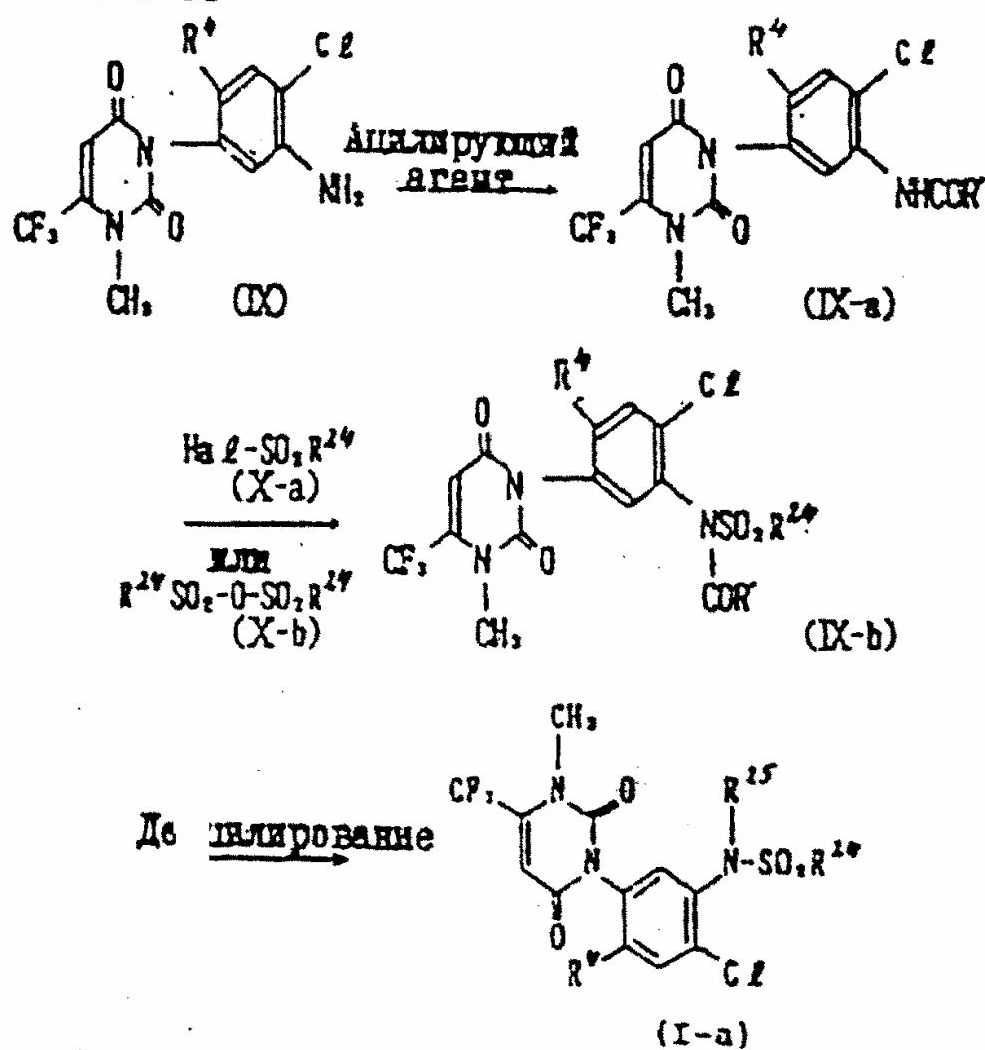


Фиг.5

## Схема 9

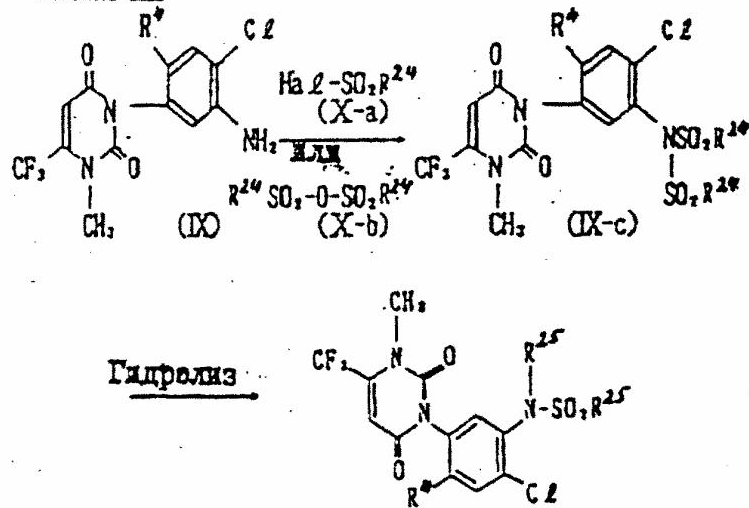


## Схема 10



Фиг.6

Схема II



в которых  $G^I$  -  $\text{C}_{1-4}$ -алкил;  $G^2$  -  $\text{C}_{1-4}$ -алкил или фенил;  $R^I$  - водород,  $\text{C}_{1-4}$ -алкил или фенил и Hal - галоген.

Фиг.7