

發明專利說明書

200303170

(填寫本書件時請先行詳閱申請書後之申請須知，作※記號部分請勿填寫)

※申請案號：92103329

※IPC分類：

A01N 43/68
C07D 251/18※申請日期：92年02月18日

壹、發明名稱：

(中文) 2-胺基-4-二環胺基-6H-1,3,5-三吡，
彼之製備方法以及彼作為除草劑與植物生長調節劑
之應用

(英文) 2-Amino-4-bicycylamino-6H-1,3,5-triazines,
processes for their preparation and their use as
herbicides and plant growth regulators

貳、發明人(共7人)

發明人 1

姓 名：(中文) 克萊門·麥樂(英文) Minn, Klemens住居所地址：(中文) 德國賀特史曼羅樂史翠斯 6 1 號(英文) Rossertstraße 61, 65795 Hattersheim,
Germany參、申請人(共1人)

申請人 1

姓名或名稱：(中文) 拜耳農業科學股份有限公司(英文) Bayer CropScience GmbH住居所地址：(中文) 德國法蘭克福布林路五十號(或營業所) (英文) Bruningstrasse 50, D-65929 Frankfurt,
Germany國 籍：(中文) 德國 (英文) GERMANY代 表 人：(中文) 1.諾伯特·史溫克 2.漢斯·瑞培爾(英文) 1.Schwenk, Norbert 2.Rippel, Hans
Christoph

發明人 2

姓 名：(中文) 哈姆特·亞倫斯
(英文) Ahrens, Hartmut
住居所地址：(中文) 德國法蘭克福莫非德蘭街十九號
(英文) Morfelder Landstrasse 19, 60598
Frankfurt, Germany

發明人 3

姓 名：(中文) 漢斯喬格·戴特理奇
(英文) Dietrich, Hansjorg
住居所地址：(中文) 德國赫夫翰安史戴格斯克魯茲三B號
(英文) Am Stegskreuz 3B, 65719 Hofheim,
Germany

發明人 4

姓 名：(中文) 洛瑟·威姆
(英文) Willms, Lothar
住居所地址：(中文) 德國赫夫翰·康尼斯坦娜街五十號
(英文) Konigsteiner StraBe 50, 65719 Hofheim,
Germany

發明人 5

姓 名：(中文) 湯馬士·奧樂
(英文) Auler, Thomas
住居所地址：(中文) 德國凱白撒頓波那街十五號
(英文) Bonner Strasse 15, 65812 Bad Soden,
Germany

發明人 6

姓 名：(中文) 赫曼·畢玲加
(英文) Bieringer, Hermann
住居所地址：(中文) 德國艾普斯登·易奇恩路二十六號
(英文) Eichenweg 26, 65817 Eppstein, Germany

發明人 7

姓 名：(中文) 胡伯特·曼恩
(英文) Menne, Hubert
住居所地址：(中文) 德國霍夫漢艾爾頓貝克八號
(英文) Am Alten Bach 8a, 65719 Hofheim,
Germany

捌、聲明事項

■主張專利法第二十四條第一項優先權：

【格式請依：受理國家（地區）；日期；案號 順序註記】

1.德國 ; 2002/02/20 ; 102 07 037.7

(1)

玖、發明說明**【發明所屬之技術領域】**

本發明係關於除草劑及植物生長調節劑之技術領域，特別係控制在有用的植物之農作物中的闊葉雜草及禾本科雜草或一般不希望生長的植物之除草劑。

【先前技術】

已知 2-胺基-4-環己胺基-6-全鹵烷基-1,3,5-三吡啶（參考例如 US-A-3816419 及 US-A-3932167）或 2-胺基-4-烷胺基-6-全鹵烷基-1,3,5-三吡啶（WO-A-90/09378（EP-A-411153）、WO-1-88/02368（EP-A-283522）、WO-A-94/24086、EP-A-509544、EP-A-492,615）及也已知 2-胺基-4-二環胺基-1,3,5-三吡啶（WO97/31904（DE-A-19607-450）、WO-A-97/19936）具有除草及植物生長調節特性。

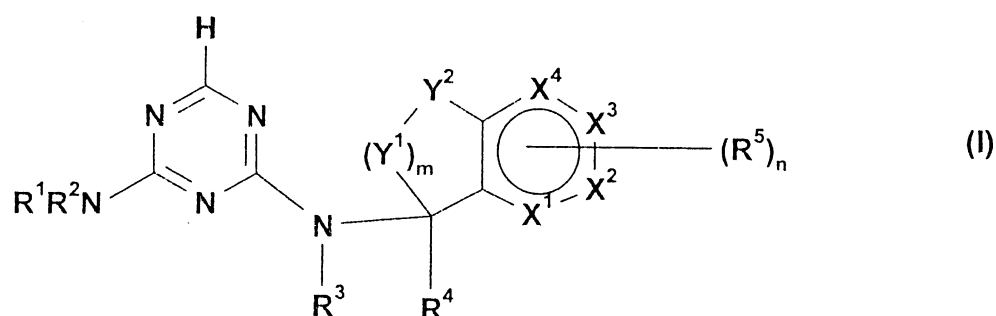
但是，在以該類型之衍生物作為控制有用的植物之選擇性除草劑或作為在各種有用的植物農作物中的植物生長調節劑使用時，時常需要使用過量的噴灑量或對農作植物有不希望的損害。而且，由於活性化合物比較高的製造成本，故彼在許多情況中的應用不合乎經濟性。目前已驚訝地發現可以有利的方式使用新穎二環取代之 2,4-二胺基-1,3,5-三吡啶作為除草劑及植物生長調節劑。除了好的活性分布及與農作植物的相容性之外，該種類的化合物係

(2)

以低成本製造方法及易取得三吡部份為特徵，因為在本文所述之物質情況中，可以不貴及可輕易取得的前驅體製備三吡，並可以免除使用不易獲得的貴中間物。

【發明內容】

本發明係提供式 (I) 化合物及其鹽類



其中

R^1 及 R^2 係彼此各自獨立為氫、式 $NR'R''$ 之基團（其中 R' 及 R'' 係彼此各自獨立為 H、 $(C_1 - C_6)$ 烷基、 $(C_2 - C_6)$ 烯基、 $(C_2 - C_6)$ 炔基、 $(C_3 - C_6)$ 環烷基或 $(C_5 - C_6)$ 環烯基）、或在每一個情況中具有 1 至 10 個碳原子之（無環或環系）烴基或烴氧基（以 1 至 6 個碳原子較佳）、或在每一個情況中具有 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子之雜環基、雜環氧基、雜環硫基或雜環胺基（其中前述最後 6 個各個基未經取代或經取代）、或具有 1 至 20 個碳原子之有機酸的鹽基（以 1 至 12 個原子較佳，特別係 1 至 8 個碳原子），或以 R^1 及 R^2 與 NR^1R^2 基團之氮原子一起係具有 3 至 9 個環原子及 1 至 4 個雜環原子之飽和或不飽和非芳族雜環系基，其中除了氮原子之外的更多視需要存在之雜環原子係選自 N、O 及

(3)

S，其未經取代或經取代，其中每一個包括取代基之含碳基 R^1 及 R^2 具有 1 至 20 個碳原子，以 1 至 12 個碳原子較佳，特別係 1 至 10 個碳原子，

R^3 係氫、胺基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺基、二 $(C_1 - C_4)$ 烷胺基、 $(C_1 - C_6)$ 烷基、 $(C_1 - C_6)$ 烷氧基、 $(C_2 - C_6)$ 烯基、 $(C_2 - C_6)$ 炔基、 $(C_3 - C_6)$ 環烷基、 $(C_5 - C_6)$ 環烯基、苯基或雜環系基（其中前述最後 10 個彼此獨立的各個基未經取代或經取代，以及在討論中的包括取代基之基具有 1 至 12 個碳原子，特別係 1 至 10 個碳原子）或式 $-B^*-A^*$ 之鹽基，其中

A^* 係氫或具有 1 至 10 個碳原子之非環系或環系烴基，以 1 至 6 個碳原子較佳，其未經取代或經取代，

B^* 係式 $-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-CO-NR'-$ 、 $-S(O)_p-$ 或 $-S(O)_p-O-$ 之二價基團，其中 $p=0$ 、1 或 2，及 R' 係氫、具有 1 至 6 個碳原子之烷基、苯基、苯甲基、具有 3 至 6 個碳原子之環烷基或具有 1 至 6 個碳原子之烷鹽基，

其中包括取代基之 $-B^*-A^*$ 具有 1 至 12 個碳原子，以 1 至 10 個碳原子較佳，

R^4 係式 $-Z^1-R^6$ 之基團，其中 Z^1 及 R^6 係如以下之定義，

R^5 係彼此各自獨立為鹵素、氰基、異氰鹽基、硝基、式 $-Z^2-R^7$ 之基團（其中 Z^2 及 R^7 係如以下之定義），或者兩個毗鄰之 R^5 基一起係具有 4 至 6 個環原子之稠合

(4)

環，其係碳環系或包括 1 至 3 個來自 O、S 及 N 之雜環原子，以及其未經取代或以一或多個來自鹵素、(C₁ - C₄) 烷基及酮基之基取代，

R⁶、R⁷、R⁸ 及 R⁹ 係彼此各自獨立為氫（除了如果 Z² 係直鍵時，則 R⁷ 不是氫）、或具有 1 至 20 個碳原子（以 1 至 10 個碳原子較佳）之非環系烴基、或環系烴基（以單環系烴基較佳，具有 3 至 8 個碳原子較佳，特別係 3 至 6 個碳原子）、或雜環系基（以具有 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子較佳），其中前述最後 3 個各個基未經取代或經取代，以及包括取代基的該 3 個基以具有多達 30 個碳原子較佳，特別係多達 20 個碳原子，

或以 R⁸ 及 R⁹ 與 CR⁸R⁹ 基團之碳原子（針對 Y¹ 或 Y²）或以來自兩個 Y¹ 及／或 Y² 基團的兩個 R⁸ 或 R⁹ 基與 Y¹ 及／或 Y² 基團的附著原子一起在每一個情況中係具有 3 至 8 個碳原子（特別係 3 至 6 個碳原子）之碳環系基、或雜環系基（以具有 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子較佳），其中前述最後 2 個各個基未經取代或經取代，以及包括取代基的該 2 個基以具有多達 16 個碳原子較佳，特別係多達 12 個碳原子，

X¹、X²、X³ 及 X⁴ 係彼此各自獨立為碳原子（將其以氫原子或其中一個以上定義之取代基 R⁵ 取代）或氮原子，或兩個毗鄰之 X¹、X²、X³ 及 X⁴ 符號在每一個情況中一起係式 - O - 、 - S - 、 - NH - 或 - NR - 之二價基團，其

(5)

中 R 係如 R^3 之定義，及以氫或 $(C_1 - C_6)$ 烷基較佳，其先決條件係 X^1 、 X^2 、 X^3 及 X^4 基與稠合環附著之 C_2 單元一起形成碳環系或雜環系芳族 5- 或 6- 員環，

$(Y^1)_m$ 係 m 個二價基團 Y^1 ，其中各自彼此獨立的 Y^1 基團係式 $-O-$ 、 $-CO-$ 、 $-C(=NR^*)-$ 、 $-S(O)_q-$ 、 $-NR^*-$ 或 $-N(O)-$ 之基團（其中 $q=0$ 、1 或 2 及 R^* 係如 R^3 之定義，及以氫、 $(C_1 - C_6)$ 烷基、苯甲基或苯基較佳，特別係氫、 $(C_1 - C_6)$ 烷基或苯基）或式 CR^8R^9 之基團（其中 R^8 及 R^9 係如以上之定義），及

Y^2 係如 Y^1 定義之基團或直鍵，其中兩個毗鄰的符號對 Y^1 及 Y^1 基團或符號對 Y^1 及 Y^2 基團係不具有相同意義之雜原子的基團，及其中 $(Y^1)_m$ 及 Y^2 基團與芳族環附著之 C_2 單元及附著於 R^4 之碳原子一起形成稠合之碳環系或雜環系非芳族 4- 至 8- 員環，

Z^1 及 Z^2 基團係彼此各自獨立為直鍵或式 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-NR'-$ 、 $-O-NR'-$ 、 $-NR'-O-$ 、 $-NR'-CO-$ 、 $-CO-NR'-$ 之二價基團，其中 $p=0$ 、1 或 2，及 R' 係氫、具有 1 至 6 個碳原子之烷基、苯基、苯甲基、 $(C_3 - C_6)$ 環烷基或具有 1 至 6 個碳原子之烷醯基，

m 係 0、1、2、3 或 4，特別係 1 或 2，及

n 係 0、1、2、3 或 4，特別係 0、1 或 2，尤其係 1

(6)

或 2。

以適合的無機或有機酸（如例如 HCl 、 HBr 、 H_2SO_4 或 HNO_3 ），但是也以草酸或磺酸加入鹼性基（如例如胺基或烷胺基），可將式（I）化合物形成鹽類。以去質子化形式存在的適合的取代基（如例如磺酸或羧酸）可與可將彼之部份質子化之基團形成內鹽類。以農業上適合的陽離子置換在適合的取代基中的氫（如例如磺酸或羧酸）也可以形成鹽類。這些鹽類係例如金屬鹽類，特別係鹼金屬鹽類或鹼土金屬鹽類（特別係鈉鹽及鉀鹽）或其它的銨鹽類、具有有機胺之鹽類或四級銨鹽類。

在式（I）及所有以下的化學式中，以下的定義適用於：

在二價基團中，如 B^* 、 Z^1 及 Z^2 ，也可將彼以具有許多原子之橋表現，如 $-\text{CO}-\text{NR}'-$ ，以 $-\text{B}^*-\text{A}^*$ 或 $-\text{Z}^1-\text{R}^6$ 記號所組成的基分別表示基團 $-\text{CO}-\text{NR}'-\text{A}^*$ 及 $-\text{CO}-\text{NR}'-\text{R}^6$ ，並不分別係基團 $-\text{NR}'-\text{CO}-\text{A}^*$ 及 $-\text{NR}'-\text{CO}-\text{R}^6$ 。

在二價基團 $-(\text{Y}^1)_m-$ 中，以使得左邊的自由結合位置附著於以 R^4 取代之碳原子定義附著作用；對應於將在下一個 Y^1 基團左邊的自由結合位置附著於第一個 Y^1 基團右邊的自由鍵。

以式 $-\text{S}(\text{O})_p-$ 之基團表示具有兩個自由鍵及以雙重附著於 p 個氧原子之硫原子，即如果 $p=0$ 、1 或 2 時，則分別係式 $-\text{S}-$ 、 $-\text{S}(=\text{O})-$ （或短鍵 $-\text{SO}-$ ，亞硫

(7)

醯基) 及 $-S(=O)_2-$ (或短鏈 $-SO_2-$, 磺醯基), 並也不另外係 $-S-O-$ (亞磺醯氧基) 或 $-SO-O-$ (亞硫醯氧基)。

雜原子基團係具有一或多個原子及顯著的官能化特徵之基團, 其包含一或多個與碳原子 (雜原子) 不相同的原子, 但是也包括碳原子, 在 Y^1 的情況中, 這些係式 $-O-$ 、 $-CO-$ 、 $-C(=NR^*)-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-NR^*-$ 及 $-N(O)-$ 之基團, 但不是式 CR^8R^9 之基團。

烷基、烷氧基、鹵烷基、鹵烷氧基、烷胺基及烷硫基術語及對應於不飽和及/或經取代之基的術語在每一個情況中包含具有直鏈碳基之相關的基及那些具有支鏈 (非環系) 碳骨架之基。

“(C₁–C₄) 烷基”術語係具有 1 至 4 個碳原子之低碳烷基, 即包括甲基、乙基、1–丙基、2–丙基、1–丁基、2–丁基、2–甲丙基及特丁基。具有比所述更寬的碳原子範圍之通用烷基 (例如, “(C₁–C₆) 烷基”) 也對應包含具有更多的碳原子數之直鏈或支鏈烷基, 即在實例中也係具有 5 及 6 個碳原子之烷基。

除非有特殊的指定, 在烴基中 (如烷基、烯基及炔基) 及也在複合基中, 以低碳骨架烷基較佳, 例如, 那些具有 1 至 6 個碳原子, 特別係 1 至 4 個碳原子, 以及在具有 2 至 6 個碳原子之不飽和基之情況中的骨架。烷基 (包括在複合基意義中的烷基, 如烷氧基、鹵烷基等) 係例如甲

(8)

基、乙基、正或異丙基、正、異、特或 2-丁基、戊基、己基（如正己基、異己基及 1,3-二甲丁基）、庚基（如正庚基、1-甲己基及 1,4-二甲戊基）；烯基及炔基具有對應於烷基的可能的不飽和基之意義，烯基係例如乙烯基、烯丙基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、2-丁烯基、戊烯基、2-甲基戊烯基或己烯基，以烯丙基、1-甲基丙-2-烯-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、1-甲基丁-3-烯-1-基或 1-甲基丁-2-烯-1-基較佳。

烯基也特別包括具有一個以上的雙鍵之直鏈或支鏈烴基，如 1,3-丁二烯及 1,4-戊二烯基，但也包括具有一或多個累積的雙鍵之丙二烯基或枯烯基，如例如丙二烯基（1,2-丙二烯基）、1,2-丁二烯基及 1,2,3-戊二烯基。

炔基係例如炔丙基、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、1-甲基丁-3-炔-1-基。炔基也特別包括具有一個以上的參鍵或另外具有一或多個參鍵及一或多個雙鍵之直鏈或支鏈烴基，如例如 1,3-丁三烯或 3-戊烯-1-炔-1-基。

以烷叉（例如，也在（ $C_1 - C_{10}$ ）烷叉形式中）表示經由雙鍵附著之直鏈或支鏈鏈烷之基，其中尚未將結合位置固定。在支鏈鏈烷的情況中，自然唯一可能的位置係那些其中可將兩個氫原子以雙鍵置換的位置，可能的基係例如 $=CH_2$ 、 $=CH-CH_3$ 、 $=C(CH_3)-CH_3$ 、 $=C(CH_3)-C_2H_5$ 或 $=C(C_2H_5)-C_2H_5$ 。

(9)

環烷基係具有較佳的 3－8 個碳原子之碳環系飽和環系統，例如，環丙基、環丁基、環戊基或環己基。在經取代之環烷基的情況中，其包括具有取代基之環系統，其中將取代基以雙鍵與環烷基鍵結，例如，烷叉基，如甲叉。在經取代之環烷基的情況中，其可以包括多環脂肪族系統，如例如二環[1.1.0]丁－1－基、二環[1.1.0]丁－2－基、二環[2.1.0]庚－1－基、二環[2.1.0]庚－2－基、二環[2.1.0]庚－5－基、金鋼烷－1－基及金鋼烷－2－基。

環烯基係具有較佳為 4－8 個碳原子之碳環系非芳族部份不飽和環系統，例如，1－環丁烯基、2－環丁烯基、1－環戊烯基、2－環戊烯基、3－環戊烯基、或 1－環己烯基、2－環己烯基、3－環己烯基、1,3－環己二烯基或 1,4－環己二烯基。以類似於所謂的經取代之環烷基的方式適用於在經取代之環烯基之情況中。

鹵素係例如氟、氯、溴或碘。鹵烷基、鹵烯基及鹵炔基係部份或完全以相同或不相同的鹵素原子（以選自氟、氯及溴較佳，特別係選自氟及氯）分別取代之烷基、烯基及炔基，例如，單鹵烷基、全鹵烷基、 CF_3 、 CHF_2 、 CH_2F 、 CF_3CF_2 、 CH_2FCHCl 、 CCl_3 、 CHCl_2 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ；鹵烷氧基係例如 OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{O}$ 、 OCH_2CF_3 及 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ；其以類似的方式適用於鹵烯基及其它以鹵素取代之基。

芳基係單一、二－或多環芳族系統，例如，苯基、萘基、四氫萘基、蒽基、蒽滿基、戊塔烯基、芴基及類似物

(10)

，以苯基較佳。

雜環系基或環（雜環基）可以是飽和、不飽和或雜芳族，除非有其它另外的定義，以包括一或多個在雜環系環中的雜原子（特別是 1、2 或 3 個）較佳，以來自 N、O 及 S 較佳，以具有 3 至 7 個環原子之脂肪族雜環基或具有 5 或 6 個環系統之雜芳族基較佳。雜環系基可以是例如其中至少 1 個環包括一或多個雜原子之雜芳族基或環（雜芳基），如例如單一、二或多環系芳族系統。以包括 1 個選自 N、O 及 S 之雜原子之雜芳族環較佳，例如，吡啶基、吡咯基、噻吩基或呋喃基，以具有 2 或 3 個雜原子之對應雜芳族環更佳，例如，嘧啶基、噻嗪基、吡嗪基、三吡嗪基、噻唑基、噻二唑基、噁唑基、異噁唑基、吡唑基、咪唑基及三唑基。以具有來自 N、O 及 S 之雜原子的部份或完全氫化之雜環系基更佳，例如，環氧乙烷基、噁環丁烷基、噁茂烷基（=四氫呋喃基）、噁烷基、吡咯啉基、吡咯烷基或哌啶基。

以具有 2 個來自 N、O 及 S 之雜原子的部份或完全氫化之雜環系基更佳，例如，哌嗪基、二噁茂烷基、噁唑啉基、異噁唑啉基、噁唑烷基、異噁唑烷基及嗎啉基。

經取代之雜環系基可能的取代基係以下進一步所述之取代基及也另外係酮基。酮基也可以出現在那些其中可能有各種氧化數之雜環原子上，例如，在 N 及 S 的情況中。

較佳的雜環基實例係具有 3 至 6 個來自吡啶基、噻吩

(11)

基、呋喃基、吡咯基、環氧乙烷基、2-噁環丁烷基、3-噁環丁烷基、噁茂烷基 (=四氫呋喃基)、吡咯烷基、哌啶基之環原子 (特別係環氧乙烷基、2-噁環丁烷基、3-噁環丁烷基、噁茂烷基) 的雜環系基或具有 2 或 3 個雜原子之雜環系基 (例如, 嘧啶基、噻吩基、吡嗪基、三吡嗪基、噻嗪基、噻唑基、噻二唑基、噁唑基、異噁唑基、吡唑基、三唑基、哌嗪基、二噁茂烷基、噁唑啉基、異噁唑啉基、噁唑烷基、異噁唑烷基或嗎啉基)。

如果將母體結構以來自基 (=基團) 名單或一般定義之基的“一或多個基”取代時, 則其包括在每一個情況中以許多相同及 / 或在結構上不相同的基同時的取代作用。

經取代之基 (如經取代之烷基、烯基、炔基、芳基、苯基、苯甲基、雜環基及雜芳基) 係例如自未取代之母體結構衍生的經取代之基, 取代基係例如一或多個 (以 1、2 或 3 個) 選自鹵素、烷氧基、烷硫基、羥基、胺基、硝基、羧基、氰基、疊氮基、烷氧羰基、烷羰基、甲醯基、胺甲醯基、單一及二烷胺羰基、經取代之胺基 (如醯基胺基、單一及二烷胺基)、烷亞硫醯基、烷磺醯基及也在環系基情況中的烷基、鹵烷基、烷硫基烷基、烷氧基烷基、視需要取代之單一及二烷胺基烷基及羥烷基之基; “經取代之基”術語 (如經取代之烷基等) 包括以除了所述之含飽和羥基之外作為取代基之對應不飽和脂肪族及芳族基, 如未經取代或經取代之烯基、炔基、烯氧基、炔氧基、苯基、苯氧基等。在環中具有脂肪族部份的經取代之環系基

(12)

的情況中，其也包括具有經由雙鍵附著於環的取代基之環系系統，例如，那些以烷叉基（如甲叉或乙叉）取代之系統。

如果以實例方式所述之取代基（“第一級取代基”）包括含烴部份時，則若適當時可將在這些含烴部份之中的該取代基（“第二級取代基”）以例如第一級取代基定義的其中一種取代基進一步取代。可能有更多的對應取代基級。“取代基”術語以只包含一或兩種取代基級較佳。

較佳的取代基級之取代基係例如：

胺基、羥基、鹵素、硝基、氰基、巰基、羧基、碳化醯胺、 SF_5 、胺磺醯基、烷基、環烷基、烯基、環烯基、炔基、單烷基胺基、二烷基胺基、N-烷基醯基胺基、烷氧基、烯氧基、炔氧基、環烷氧基、環烯氧基、烷氧羰基、烯氧羰基、炔氧羰基、芳氧羰基、烷醯基、烯羰基、炔羰基、芳羰基、烷硫基、環烷硫基、烯硫基、環烯硫基、炔硫基、烷亞硫醯基、烷磺醯基、單烷基胺基磺醯基、二烷基胺基磺醯基、N-烷基胺羰基、N,N-二烷基胺羰基、N-烷基醯基胺羰基、N-烷基醯基-N-烷基胺羰基、芳基、芳氧基、苯甲基、苯甲氧基、苯甲硫基、芳硫基、芳胺基及苯甲胺基。

在具有碳原子之基中，採用那些具有 1 至 6 個碳原子之基，以 1 至 4 個碳原子較佳，特別係 1 或 2 個碳原子。通常採用選自鹵素（例如，氟及氯）、（ $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ）烷基（以甲基或乙基較佳）、（ $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ）鹵烷基（以三氟甲基較佳）、（ $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ）烷氧基（以甲氧基或乙氧基較佳）、（

(13)

$C_1 - C_4$) 鹵烷氧基、硝基及氰基之取代基。本文特別採用甲基、甲氧基、氟及氯取代基。

經取代之胺基（如經單一或二取代之胺基）係來自經取代之胺基群組之基，將其以例如相同或不相同的 1 或 2 個選自烷基、烷氧基、醯基及芳基之基經 N-取代，以單一及二烷胺基、單一及二芳胺基、醯基胺基、N-烷基-N-芳胺基、N-烷基-N-醯基胺基較佳及也以 N-雜環較佳；在本文採用具有 1 至 4 個碳原子之烷基；芳基係以苯基或經取代之苯基較佳；適用於以下進一步定義之醯基係以 ($C_1 - C_4$) 烷醯基較佳。其同樣適用於經取代之羥胺基或肼基。

未經取代或經取代之苯基係以未經取代或以選自鹵素、($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷氧基、($C_1 - C_4$) 鹵烷基、($C_1 - C_4$) 鹵烷氧基及硝基之相同或不不同的基經單一或多取代（以最多經三取代較佳）之苯基較佳，例如，鄰-、間-及對-甲苯基、二甲基苯基、2-、3-及 4-氯苯基、2-、3-及 4-三氟甲基-及三氯甲基苯基、2,4-、3,5-、2,5-及 2,3-二氯苯基、鄰-、間-及對-甲氧基苯基。

醯基係有機酸之基，其係在形式上以除去酸官能的羥基所形成的，其中也將在酸中的有機基經由雜原子與酸官能附著。醯基實例係羧酸 $HO-CO-R$ 之 $-CO-R$ 基及其衍生之酸的基，如硫代羧酸、未經取代或以 N-取代之亞胺基羧酸或碳酸單酯之基、以 N-取代之胺基甲酸、磺

(14)

酸、亞硫醯酸、以 N- 取代之磺醯胺酸、膦酸或次膦酸。

醯基係例如甲醯基、烷羰基（如 [(C₁ - C₄) 烷基] 羰基、苯羰基、烷氧羰基、苯氧羰基、苯甲氧羰基）、烷磺醯基、烷亞硫醯基、N- 烷基 - 1- 亞胺烷基及有機酸的其它基。可將在烷基或苯基部份中（例如，在烷基部份中）的基在每一種情況中進一步以一或多個選自鹵素、烷氧基、苯基及苯氧基之基取代；在苯基部份中的取代基實例係已在以上以經取代之苯基進一步概括所述之取代基。

更嚴格而言的醯基係以醯基較佳，即其中將酸基與有機基之碳原子直接附著之有機酸的基，例如，甲醯基、烷羰基（如乙醯基或 [(C₁ - C₄) 烷基] 羰基、苯羰基）、烷磺醯基、烷亞硫醯基及有機酸的其它基。

式 (I) 化合物也包含所有以氫漂移之互變體，其與稱為式 (I) 之化合物互相平衡。

本發明也提供所有以式 (I) 包含之立體異構物及其混合物。這些式 (I) 化合物包括未特別以通式 (I) 所述之一或多個不對稱碳原子或另外的碳鍵。以式 (I) 包含以彼等特殊之立體形式定義之全部可能的立體異構物（如對映異構物、非對映異構物、Z 及 E 異構物），並可自立體異構物的混合物以照例的方法獲得或另外以使用具立體化學性的純原料組合立體選擇性反應的方式製備。其同樣適用於以下所述之其它通式。

在式 (I) 中使例如二環與二胺基三吡之胺基附著的碳原子係對掌性中心，其可以 R 或 S 組態 (Cahn - Ingold

(15)

— Prelong 命名) 存在。因此，本發明也特別提供具除草性之活性立體異構物，其係關於所述之對掌性中心而言的純化異構物或富集關於對映異構過量 (%ee) 之異構物（在一個對掌性中心情況中的對映異構物；或另外如果有許多對掌性中心的存在時，則其係對映異構物／非對映異構物）。

特別就更好的除草活性、更好的選擇性及／或更容易製備的理由而言，所述之新穎式 (I) 化合物或彼特別有利的鹽類係那些其中各個基具有已述或在以下所述之其中一種較佳的意義之化合物或彼之鹽類，或特別係那些其中將已述及或在以下所述之一或多種較佳的意義組合之化合物或彼鹽類。

也採用根據本發明的通式 (I) 化合物及彼之鹽類，其中一或多個基、基團或符號 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 Y^1 、 Y^2 、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 Y^1 、 Y^2 、 n 及 m 係如在以下進一步所述之其中一個特殊實例中（實用性實例，在表中的實例）之定義，或根據對應於以實例方式所述之定義的通用定義對彼等下定義（例如，乙氧基屬於烷氧基或以 (C_1 - C_6) 烷氧基等較佳）。

在以下也將根據本發明的式 (I) 化合物及彼之鹽類總稱為“根據本發明的化合物 (I)”或甚至總稱為“化合物 (I)”。

撇開來自包括對應於副屬意義之通式基及適宜與較佳的一或多種這些基之意義組合的基團 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、

(16)

R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 Y^1 、 Y^2 、 n 及 m 之基及符號的個別其它的意義不論，根據本發明特別有利的化合物 (I) 係那些其中在討論中的基具有下列較佳意義之化合物。

R^1 及 R^2 係以彼此各自獨立為氫、胺基、在每一個情況的烷基中具有 1 至 4 個碳原子之烷胺基或二烷胺基、或 ($C_3 - C_6$) 環烷胺基、($C_5 - C_6$) 環烯胺基、在每一種情況中具有 1 至 10 個碳原子之 (非環或環系) 烴基或烴氧基 (以 1 至 6 個碳原子較佳)、或在每一個情況中具有 3 至 9 個環原子 (以 3 至 6 個環原子較佳) 及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子之雜環基、雜環氧基、雜環硫基或雜環胺基 (其中前述最後 6 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、烴基、胺基、硝基、甲醯基、胺羰基、羧基、磺醯基、氰基、硫代氰醯基、($C_1 - C_6$) 烷氧基、($C_2 - C_6$) 烯氧基、($C_2 - C_6$) 炔氧基、($C_1 - C_6$) 烷氧基 - 聚 (伸烷氧基)、烴基 - 聚 (伸烷氧基)、($C_1 - C_6$) 烷硫基、單 - 及二 - [$(C_1 - C_6)$ 烷基]胺基、[($C_1 - C_6$) 烷基]羰基、[($C_2 - C_6$) 烯基]羰基、[($C_2 - C_6$) 炔基]羰基、[($C_1 - C_6$) 烷氧基]羰基、[($C_2 - C_6$) 烯氧基]羰基、[($C_2 - C_6$) 炔氧基]羰基、單 - 及二 - [$(C_1 - C_6)$ 烷基]胺羰基、苯基、苯氧基、($C_3 - C_6$) 環烷基、苯羰基、苯氧羰基、雜環基、($C_1 - C_4$) 烷磺醯基及在環系基情況中也以來自 ($C_1 - C_4$) 烷基之基取代，

其中前述最後 24 個各個取代基未經取代或以一或多

(17)

個來自鹵素、CN、SCN、NO₂、(C₁—C₄) 烷氧基、(C₁—C₄) 烷硫基、(C₁—C₄) 鹵烷氧基、甲醯基、(C₁—C₄) 烷羰基、[(C₁—C₄) 鹵烷基]羰基、[(C₁—C₄) 烷氧基]羰基、[(C₁—C₄) 鹵烷氧基]羰基及在環系基情況中也以來自(C₁—C₄) 烷基和(C₁—C₄) 鹵烷基之基取代)，

或來自甲醯基、胺羰基、單—及二—[(C₁—C₄) 烷基]胺羰基、[(C₁—C₆) 烷基]羰基、[(C₂—C₆) 烯基]羰基、[(C₂—C₆) 炔基]羰基、[(C₁—C₆) 烷氧基]羰基、[(C₂—C₆) 烯氧基]羰基、苯羰基、(C₁—C₆) 烷磺醯基之有機酸之醯基（其中前述最後 9 個在脂肪族部份或在苯基環中的各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、SCN、NO₂、(C₁—C₄) 烷氧基、(C₁—C₄) 鹵烷氧基、視需要取代和未經取代（較佳）之苯基及在環系基情況中也以來自(C₁—C₆) 烷基和(C₁—C₆) 鹵烷基之基取代）較佳，

其中雜環基及包括在複合基中的雜環基在每一個情況中具有 3 至 9 個環原子（以 3 至 6 個環原子較佳）及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子，除非有更詳細的定義，或

以 R¹ 及 R² 與 NR¹R² 基團之氮原子一起係具有 3 至 6 個環原子及 1 至 4 個雜環原子之飽和或不飽和非芳族雜環系基，其中除了氮原子之外的更多視需要存在的雜環原子係選自 N、O 及 S，該基未經取代或以一或多個來自鹵素

(18)

、CN、(C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 鹵烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 鹵烷氧基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基及酮基之基取代。

R¹ 及 R² 係以彼此各自獨立為氫、胺基、單 - 或二 - [(C₁ - C₄) 烷基]胺基、或 (C₃ - C₆) 環烷胺基、(C₅ - C₆) 環烯胺基、在每一個情況中具有 1 至 10 個碳原子之 (非環或環系) 烴基或烴氧基 (以 1 至 6 個碳原子較佳)、或在每一個情況中具有 3 至 9 個環原子 (以 3 至 6 個環原子較佳) 及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子之雜環基、雜環氧基、雜環硫基或雜環胺基 (其中前述最後 6 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、烴基、胺基、硝基、甲醯基、胺羰基、羧基、磺醯基、氰基、硫代氰醯基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₂ - C₄) 烯氧基、(C₂ - C₄) 炔氧基、(C₁ - C₄) 烷氧基 - 聚 (伸烷氧基)、烴基 - 聚 (伸烷氧基)、(C₁ - C₄) 烷硫基、單 - 及二 - [(C₁ - C₄) 烷基]胺基、[(C₁ - C₄) 烷基]羰基、[(C₂ - C₄) 烯基]羰基、[(C₂ - C₄) 炔基]羰基、[(C₁ - C₄) 烷氧基]羰基、[(C₂ - C₄) 烯氧基]羰基、[(C₂ - C₄) 炔氧基]羰基、單 - 及二 - [(C₁ - C₄) 烷基]胺羰基、苯基、苯氧基、(C₃ - C₆) 環烷基、苯羰基、苯氧羰基、雜環基、(C₁ - C₄) 烷磺醯基及在環系基情況中也來自 (C₁ - C₄) 烷基之基取代，

其中前述最後 24 個各個取代基未經取代或以一或多個來自由鹵素、CN、SCN、NO₂、(C₁ - C₄) 烷氧基、(

(19)

$C_1 - C_4$) 鹵烷氧基、甲醯基、($C_1 - C_4$) 烷羰基、[($C_1 - C_4$) 鹵烷基]羰基、[($C_1 - C_4$) 烷氧基]羰基、[($C_1 - C_4$) 鹵烷氧基]羰基及在環系基情況中也以來自($C_1 - C_4$) 烷基和($C_1 - C_4$) 鹵烷基之基取代)，

或來自甲醯基、胺羰基、單-或二-[($C_1 - C_4$) 烷基]胺羰基、[($C_1 - C_4$) 烷基]羰基、[($C_2 - C_4$) 烯基]羰基、[($C_2 - C_4$) 炔基]羰基、[($C_1 - C_4$) 烷氧基]羰基、[($C_2 - C_4$) 烯氧基]羰基、苯羰基、($C_1 - C_4$) 烷磺醯基之有機酸之醯基(其中前述最後9個在脂肪族部份或在苯基環中的各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、SCN、NO₂、($C_1 - C_4$) 烷氧基、($C_1 - C_4$) 鹵烷氧基、視需要取代和未經取代(較佳)之苯基及在環系基情況中也以來自($C_1 - C_4$) 烷基和($C_1 - C_4$) 鹵烷基之基取代)更佳，

其中雜環基及包括在複合基中的雜環基在每一個情況中具有3至9個環原子(以3至6個環原子較佳)及1至3個來自N、O及S之雜環原子，除非有更詳細的定義，或

以 R^1 及 R^2 與 NR^1R^2 基團之氮原子一起係具有3至6個環原子及1至4個雜環原子(特別係1或2個雜環原子)之飽和或不飽和非芳族雜環系基，其中除了氮原子之外的更多視需要存在的雜環原子係選自N、O及S，並該基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 鹵烷基、($C_1 - C_4$) 烷氧基、($C_1 - C_4$) 烷

(20)

氧羰基及酮基之基取代。

R^1 及 R^2 係以彼此各自獨立為氫、胺基、在每一個情況的烷基中具有 1 至 4 個碳原子之烷胺基或二烷胺基、或 $(C_3 - C_6)$ 環烷胺基、 $(C_5 - C_6)$ 環烯胺基、在每一個情況中具有 1 至 10 個碳原子之（非環或環系）烴基或烴氧基（以 1 至 6 個碳原子較佳）、或在每一個情況中具有 3 至 9 個環原子（以 3 至 6 個環原子較佳）及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子之雜環基、雜環氧基、雜環硫基或雜環胺基（其中前述最後 6 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、烴基、胺基、硝基、甲醯基、羧基、磺醯基、氰基、硫代氰醯基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基 - $(C_1 - C_4)$ 烷氧基、烴基 - $(C_1 - C_4)$ 烷氧基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基 - 聚（伸烷氧基）、烴基 - 聚（伸烷氧基）、 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷氧基、 $(C_1 - C_4)$ 烷硫基、 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷硫基、單 - $(C_1 - C_4)$ 烷胺基、二 - $(C_1 - C_4)$ 烷胺基、 $[(C_1 - C_4)$ 烷基]羰基、 $[(C_1 - C_4)$ 烷氧基]羰基、胺羰基、單 - $(C_1 - C_4)$ 烷胺羰基、二 - $(C_1 - C_4)$ 烷胺羰基、苯基、苯氧基、 $(C_3 - C_6)$ 環烷基、苯羰基、苯氧羰基、雜環基之基取代，其中前述最後 6 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、SCN、NO₂、 $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基和 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷氧基及 $(C_1 - C_4)$ 烷磺醯基和 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷磺醯基，及在環系基情況中也以來自 $(C_1 - C_4)$ 烷基和 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷基之基取代），

(21)

或來自甲醯基、[(C₁ - C₄) 烷基] 羰基、[(C₁ - C₄) 鹵烷基] 羰基、[(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基] 羰基、[(C₂ - C₄) 烯基] 羰基、[(C₂ - C₄) 鹵烯基] 羰基、[(C₁ - C₄) 烷氧基] 羰基、[(C₁ - C₄) 鹵烷氧基] 羰基、[(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷氧基] 羰基、[(C₂ - C₄) 烯氧基] 羰基、[(C₂ - C₄) 鹵烯氧基] 羰基、[(C₂ - C₄) 炔氧基] 羰基、苯羰基及苯甲基羰基之有機酸之醯基（其中前述最後 2 個在苯基環中的各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、SCN、NO₂、(C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 鹵烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷硫基和 (C₁ - C₄) 鹵烷氧基、(C₁ - C₄) 烷磺醯基和 (C₁ - C₄) 鹵烷磺醯基及 [(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷氧基] 磺醯基之基取代）還更佳，其中雜環基係如其它另外之定義。

而且，

R¹ 及 R² 係以彼此各自獨立為氫、胺基、甲醯基、(C₁ - C₄) 烷基、氰基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷胺基、二 - [(C₁ - C₄) 烷基] 胺基、(C₁ - C₄) 鹵烷基、單 - 、二 - 或多羥基 - (C₁ - C₄) 烷基、羥基 - 多 [(C₂ - C₄) 伸烷氧基] - (C₁ - C₄) 烷基、單 - 、二 - 或多 (C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基 - 多 [(C₂ - C₄) 伸烷氧基] - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 鹵烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₂ - C₆) 烯基、(C₂ - C₆) 鹵烯基、(C₂ - C₆) 炔基、(C₂ - C₆) 鹵炔基、或胺羰基

(22)

、或 (C₁ - C₄) 烷基胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、二 - [(C₁ - C₄) 烷基]胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷基羰基、二 (C₁ - C₄) 烷基羰基、(C₁ - C₅) 烷醯基、[(C₂ - C₄) 烯基]羰基、[(C₁ - C₄) 烷氧基]羰基、[(C₂ - C₄) 烯氧基]羰基、胺羰基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷基胺羰基 - (C₁ - C₄) 烷基、二 - [(C₁ - C₄) 烷基]胺羰基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₅) 烷醯基 - (C₁ - C₄) 烷基、[(C₂ - C₄) 烯基]羰基 - (C₁ - C₄) 烷基、[(C₁ - C₄) 烷氧基]羰基 - (C₁ - C₄) 烷基或 (C₂ - C₄) 烯氧羰基 - (C₁ - C₄) 烷基

(其中前述最後 16 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、(C₁ - C₄) 烷氧基及 (C₁ - C₄) 鹵烷氧基之基取代)、

或 (C₃ - C₆) 環烷基、(C₃ - C₆) 環烷基胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、苯基、苯氧基、苯羰基、苯氧羰基、苯羰基 - (C₁ - C₄) 烷基、苯氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、苯基 - (C₁ - C₄) 烷基、雜環基、雜環基 - (C₁ - C₄) 烷基、雜環胺基、雜環氧基或雜環硫基，或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、(C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷硫基、(C₁ - C₄) 鹵烷基、(C₁ - C₄) 鹵烷氧基、甲醯基、(C₁ - C₄) 烷基羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基及 (C₁ - C₄) 烷氧基之基取代在非環系部份中或在環系部份中(較佳)的前述最後 14 個基的其中之一較佳，其中在基中的

(23)

雜環基在每一個情況中包括 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子，

或以 R^1 及 R^2 與 NR^1R^2 基團之氮原子一起係具有 3 至 6 個環原子及 1 或 2 個雜環原子之雜環系基，其中除了氮原子之外的更多視需要可以存在的雜環原子係選自 N、O 及 S，該基未經取代或以一或多個來自鹵素、 $(C_1 - C_4)$ 烷基及酮基之基取代。

而且，

R^1 ， R^2 係以彼此各自獨立為氫、胺基、甲醯基、 $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺基、二- $[(C_1 - C_4)$ 烷基]胺基、羥基- $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基- $(C_1 - C_4)$ 烷基、鹵基- $(C_1 - C_4)$ 烷氧基- $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_2 - C_6)$ 烯基、 $(C_2 - C_6)$ 炔基、鹵基- $(C_2 - C_6)$ 炔基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺基- $(C_1 - C_4)$ 烷基、或苯基、苯氧基、苯羰基、苯羰基- $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧羰基- $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺羰基- $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧羰基、胺羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺羰基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基、 $(C_1 - C_4)$ 烷硫基、 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷基、甲醯基、 $(C_1 - C_4)$ 烷羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧羰基及 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基之基取代在非環系部份中或在環系部份中（較佳）的前述最後 10 個基的其中之一較佳，其中在基中的雜環基在每一種情況中以包括 3 至 7 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S

(24)

之雜環原子較佳。

NR^1R^2 基團係以胺基、胥基、在烷基中具有 1 至 4 個碳原子之單－或二－烷胺基、 (C_1-C_5) 烷醯基胺基、 $\text{N}-(\text{C}_1-\text{C}_5)$ 烷醯基－ $\text{N}-(\text{C}_1-\text{C}_4)$ 烷胺基、 $[(\text{C}_1-\text{C}_4)$ 鹵烷基]羰胺基、 $\text{N}-[(\text{C}_1-\text{C}_4)$ 鹵烷基]羰基－ $\text{N}-(\text{C}_1-\text{C}_4)$ 烷胺基、 $[(\text{C}_1-\text{C}_4)$ 烷氧基－ (C_1-C_4) 烷羰基]胺基、 $\text{N}-[(\text{C}_1-\text{C}_4)$ 烷氧基－ (C_1-C_4) 烷羰基]－ $\text{N}-[(\text{C}_1-\text{C}_4)$ 烷基]胺基、苯胺基、苯甲胺基、苯醯基胺基、嗎啉代、哌啶並、哌啶－1－胺基特別佳；

特別係胺基、胥基、甲胺基、乙胺基、二甲胺基、乙醯基胺基、丙醯基胺基、氯乙醯基胺基、 $(2-\text{氯乙基})$ 羰胺基、三氟甲基羰胺基或三氯甲基羰胺基；

尤其是胺基。

以其中

R^3 係氫、胺基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_3-C_6) 環烷基、 (C_5-C_6) 環烯基、苯基或雜環基（其中前述最後 8 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵基、羥基、胺基、硝基、甲醯基、羧基、氰基、硫代氰醯基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基－ (C_1-C_4) 烷氧基、羥基－ (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基－聚（伸烷氧基）、羥基－聚（伸烷氧基）、 (C_1-C_4) 鹵烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 鹵烷硫基、單－ (C_1-C_4) 烷胺基、二－ (C_1-C_4) 烷胺基、 $[(\text{C}_1-\text{C}_4)$ 烷基]羰基、 $[($

(25)

$C_1 - C_4$) 烷氧基] 羰基、胺羰基、單 - ($C_1 - C_4$) 烷胺羰基、二 - ($C_1 - C_4$) 烷胺羰基、苯基、苯氧基、($C_3 - C_6$) 環烷基、苯羰基、苯氧羰基、雜環基之基取代，其中前述最後 6 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵基、CN、SCN、 NO_2 、($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 鹵烷基、($C_1 - C_4$) 烷氧基和 ($C_1 - C_4$) 鹵烷氧基及 ($C_1 - C_4$) 烷磺醯基和 ($C_1 - C_4$) 鹵烷磺醯基，及在環系基的情況中也以 ($C_1 - C_4$) 烷基和 ($C_1 - C_4$) 鹵烷基之基取代)，

或式 - $B^* - A^*$ 之醯基，其中

A^* 係氫或 ($C_1 - C_6$) 烷基、($C_2 - C_6$) 烯基、($C_2 - C_6$) 炔基、($C_3 - C_6$) 環烷基、($C_5 - C_6$) 環烯基或苯基 (其中前述最後 6 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵基、羥基、胺基、硝基、甲醯基、羧基、硫代氰醯基、($C_1 - C_4$) 烷氧基、($C_1 - C_4$) 鹵烷氧基、($C_1 - C_4$) 烷硫基、單 - ($C_1 - C_4$) 烷胺基、二 - ($C_1 - C_4$) 烷胺基、苯基及 ($C_3 - C_6$) 環烷基之基取代，其中前述最後 2 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵基、CN、SCN、 NO_2 、($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 鹵烷基、($C_1 - C_4$) 烷氧基和 ($C_1 - C_4$) 鹵烷氧基，及在環系基的情況中也以 ($C_1 - C_4$) 烷基和 ($C_1 - C_4$) 鹵烷基之基取代)，及

B^* 係式 - $CO -$ 、- $CO - O -$ 、- $CO - NR' -$ 、- $S(O)_p -$ 或 - $S(O)_p - O -$ 之二價基團，其中 $p=0, 1$ 或 2，及 R' 係氫、具有 1 至 6 個碳原子之烷基、苯基、苯甲基、具有 3 至 6 個碳原子之環烷基或具有 1 至 4 個碳原

(26)

子之烷醯基，

其中包括取代基之 $-B^*-A^*$ 具有 1 至 12 個碳原子，以 1 至 10 個碳原子較佳，以及雜環基係如 R^1 及 R^2 之一般定義

之化合物 (I) 也特別有利。

R^3 也係以氫、胺基、甲醯基、 (C_1-C_4) 烷基、氰基 $-(C_1-C_4)$ 烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、單-、二-或多羥基 $-(C_1-C_4)$ 烷基、羥基-聚 $[(C_2-C_4)$ 伸烷氧基] $-(C_1-C_4)$ 烷基、單-、二-或多 (C_1-C_4) 烷氧基 $-(C_1-C_4)$ 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基-聚 $[(C_2-C_4)$ 伸烷氧基] $-(C_1-C_4)$ 烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷氧基 $-(C_1-C_4)$ 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 鹵烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_2-C_6) 鹵炔基、或胺羰基、或 (C_1-C_4) 烷胺基 $-(C_1-C_4)$ 烷基、二- $[(C_1-C_4)$ 烷基]胺基 $-(C_1-C_4)$ 烷基、 (C_1-C_4) 烷胺羰基、二 (C_1-C_4) 烷胺羰基、 (C_1-C_5) 烷醯基、 $[(C_2-C_4)$ 烯基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基]羰基、 (C_2-C_4) 烯氧羰基、胺羰基 $-(C_1-C_4)$ 烷基、 (C_1-C_4) 烷胺羰基 $-(C_1-C_4)$ 烷基、二- $[(C_1-C_4)$ 烷基]胺羰基 $-(C_1-C_4)$ 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧羰基 $-(C_1-C_4)$ 烷基、 (C_1-C_5) 烷醯基 $-(C_1-C_4)$ 烷基、 $[(C_2-C_4)$ 烯基]羰基 $-(C_1-C_4)$ 烷基、 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基]羰基 $-(C_1-C_4)$ 烷基或 (C_2-C_4) 烯氧羰基 $-(C_1-C_4)$ 烷基 (其中前述最後 16 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、 $(C_1$

(27)

— C₄) 烷氧基及 (C₁—C₄) 鹵烷氧基之基取代)

或 (C₃—C₆) 環烷基、(C₃—C₆) 環烷胺基—(C₁—C₄) 烷基、苯基、苯羰基、苯氧羰基、苯羰基—(C₁—C₄) 烷基、苯氧基—(C₁—C₄) 烷基、苯基—(C₁—C₄) 烷基、雜環基、雜環基—(C₁—C₄) 烷基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、(C₁—C₄) 烷基、(C₁—C₄) 烷氧基、(C₁—C₄) 烷硫基、(C₁—C₄) 鹵烷基、(C₁—C₄) 鹵烷氧基、甲醯基、(C₁—C₄) 烷羰基、(C₁—C₄) 烷氧羰基及 (C₁—C₄) 烷氧基之基取代在非環系部份中或在環系部份中(較佳)的前述最後 10 個基的其中之一較佳，其中在基中的雜環基在每一個情況中包括 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子。

在此採用其中

R³ 係氫、(C₁—C₆) 烷基、(C₃—C₆) 環烷基或苯基(其中前述最後 3 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、羥基、胺基、硝基、甲醯基、氰基、硫代氰醯基、(C₁—C₄) 烷氧基、(C₁—C₄) 烷氧基、(C₁—C₄) 烷硫基、單—(C₁—C₄) 烷胺基、二—(C₁—C₄) 烷胺基及苯基之基取代，該取代基未經取代，或以一或多個來自鹵素、NO₂、(C₁—C₄) 烷基、(C₁—C₄) 鹵烷基、(C₁—C₄) 烷氧基和 (C₁—C₄) 鹵烷氧基，及在環系基的情況中也以 (C₁—C₄) 烷基和 (C₁—C₄) 鹵烷基之基取代)，

或式 —B*—A* 之醯基，其中

A* 係氫或 (C₁—C₆) 烷基或苯基(其中前述最後 2

(28)

個各個基未經取代或以一或多個來自鹵基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 鹵烷氧基、苯基及 (C₃ - C₆) 環烷基之基取代，其中前述最後 2 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、(C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 鹵烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基和 (C₁ - C₄) 鹵烷氧基，及在環系基的情況中也係 (C₁ - C₄) 烷基及 (C₁ - C₄) 鹵烷基之基取代)，及

B* 係式 - CO - 、 - CO - O - 、 - S (O)_p - 之二價基團，其中 p=0、1 或 2，及 R' 係氫、具有 1 至 4 個碳原子之烷基，

其中包括取代基之 - B* - A* 具有 1 至 12 個碳原子，以 1 至 10 個碳原子較佳。

較佳的式 - B* - A* 之醯基實例係

(C₁ - C₅) 烷醯基、[(C₁ - C₄) 鹵烷基]羰基、[(C₂ - C₄) 烯基]羰基、[(C₂ - C₄) 鹵烯基]羰基、(C₁ - C₄) 烷胺基 - (C₁ - C₄) 烷羰基、[(C₁ - C₄) 烷氧基]羰基、[(C₁ - C₄) 鹵烷氧基]羰基、[(C₂ - C₄) 鹵烯氧基]羰基、[(C₁ - C₄) 鹵烷氧基]羰基、苯羰基、苯氧羰基、苯甲羰基或苯甲氧羰基，其中在苯基環中的前述最後 4 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、SCN、NO₂、(C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 鹵烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基和 (C₁ - C₄) 鹵烷氧基、或 (C₁ - C₄) 烷磺醯基或 (C₁ - C₄) 鹵烷磺醯基之基取代。

R³ 係以氫、胺基、甲醯基、(C₁ - C₄) 烷基、氰基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基

(29)

、(C₂ - C₆) 烯基、鹵基 - (C₂ - C₆) 烯基、(C₂ - C₆) 炔基或苯基、(C₁ - C₄) 烷羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基、胺羰基、苯氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、苯基 - (C₁ - C₄) 烷基或以一或多個來自鹵素、(C₁ - C₄) 烷基及 (C₁ - C₄) 烷氧基之基取代在非環系部份中或在環系部份中(較佳)的前述最後 6 個基的其中之一特別佳；

特別是氫、甲基、乙基、乙醯基、甲氧基乙醯基、甲醯基、甲氧基甲基、甲氧基乙基、苯甲基、4-氯苯甲基、苯醯基、甲基或 4-氯苯基；

尤其是氫。

也以其中

R⁴ 係式 - Z¹ - R⁶ 之基，其中 Z¹ 及 R⁶ 係如以下之定義，

R⁵ 係彼此各自獨立為鹵素、CN、SCN、NO₂、式 - Z² - R⁷ 之基(其中 Z² 及 R⁷ 係如以下之定義)，或者兩個毗鄰之 R⁵ 基一起係具有 4 至 6 個環原子之稠合環，其係碳環系或包括 1 至 3 個來自 O、S 及 N 之雜環原子，及其未經取代或以一或多個來自鹵素、(C₁ - C₄) 烷基及酮基之基取代，及

R⁶ 及 R⁷、R⁸、R⁹ 係彼此各自獨立為氫(除了如果 Z² 係直鍵時，則 R⁷ 不是氫)、或具有 1 至 10 個碳原子之非環系烴基(以 (C₁ - C₄) 烷基、(C₂ - C₆) 烯基或 (C₂ - C₆) 炔基較佳)、或具有 3 至 6 個碳原子之環系烴基(以 (C₃ - C₆) 環烷基或 (C₅ - C₆) 環烷基較佳)、或雜環系

(30)

基（其以具有 3 至 6 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子較佳）（其中前述最後的各個含碳基未經取代或以一或多個來自鹵素、羥基、胺基、硝基、甲醯基、胺羰基、羧基、磺醯基、氰基、硫代氰醯基、（C₁—C₆）烷氧基、（C₂—C₆）烯氧基、（C₂—C₆）炔氧基、（C₁—C₆）烷氧基—聚（伸烷氧基）、羥基—聚（伸烷氧基）、（C₁—C₆）烷硫基、單—及二—[（C₁—C₆）烷基]胺基、[（C₁—C₆）烷基]羰基、[（C₂—C₆）烯基]羰基、[（C₂—C₆）炔基]羰基、[（C₁—C₆）烷氧基]羰基、[（C₂—C₆）烯氧基]羰基、[（C₂—C₆）炔氧基]羰基、單—及二—[（C₁—C₆）烷基]胺羰基、苯基、苯氧基、（C₃—C₆）環烷基、苯羰基、苯氧羰基、雜環基、（C₁—C₄）烷磺醯基，及在環系基的情況中也以來自（C₁—C₄）烷基之基取代，

其中前述最後 24 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵基、CN、SCN、NO₂、（C₁—C₄）烷氧基、（C₁—C₄）烷硫基、（C₁—C₄）鹵烷氧基、甲醯基、（C₁—C₄）烷羰基、[（C₁—C₄）鹵烷基]羰基、[（C₁—C₄）烷氧基]羰基、[（C₁—C₄）鹵烷氧基]羰基，及在環系基的情況中也以來自（C₁—C₄）烷基和（C₁—C₄）鹵烷基之基取代），及

R⁶ 及 R⁷、R⁸、R⁹ 係以彼此各自獨立為氫（除了如果 Z² 係直鍵時，則 R⁷ 不是氫）、或具有 1 至 10 個碳原子之非環系烴基（以（C₁—C₄）烷基、（C₂—C₆）烯基或（C₂—C₆）炔基較佳）、或具有 3 至 6 個碳原子之環系烴基（

(31)

以 (C₃ - C₆) 環烷基或 (C₅ - C₆) 環烷基較佳) 或雜環系基 (其以具有 3 至 6 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子較佳) 較佳 (其中前述最後的各個含烴基未經取代或以一或多個來自鹵素、羥基、胺基、硝基、甲醯基、羧基、磺醯基、氰基、硫代氰醯基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷氧基、羥基 - (C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷氧基 - 聚(伸烷氧基)、羥基 - 聚(伸烷氧基)、(C₁ - C₄) 鹵烷氧基、(C₁ - C₄) 烷硫基、(C₁ - C₄) 鹵烷硫基、單 - (C₁ - C₄) 烷胺基、二 - (C₁ - C₄) 烷胺基、[(C₁ - C₄) 烷基]羰基、[(C₁ - C₄) 烷氧基]羰基、胺羰基、單 - (C₁ - C₄) 烷胺羰基、二 - (C₁ - C₆) 烷胺羰基、苯基、苯氧基、(C₃ - C₆) 環烷基、苯羰基、苯氧羰基、雜環基，其中前述最後 6 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵基、CN、SCN、NO₂、(C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 鹵烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基和 (C₁ - C₄) 鹵烷氧基、及 (C₁ - C₄) 烷磺醯基和 (C₁ - C₄) 鹵烷磺醯基，及在環系基的情況中也以來自 (C₁ - C₄) 烷基和 (C₁ - C₄) 鹵烷基之基取代)，

及在每一個情況中的 Z¹ 及 Z² 基團係彼此各自獨立為直鍵或式 - O - 、 - S(O)_p - 、 - S(O)_p - O - 、 - O - S(O)_p - 、 - CO - 、 - O - CO - 、 - CO - O - 、 - NR' - 、 - O - NR' - 、 - NR' - O - 、 - NR' - CO - 、 - CO - NR' - 之二價基團，其中 p=0、1 或 2，及 R' 係氫、具有 1 至 6 個碳原子之烷基、苯基、苯甲基、具有 3 至

(32)

6 個碳原子之環烷基或具有 1 至 6 個碳原子之烷醯基，及

Z^1 及 Z^2 基團係以彼此各自獨立為直鍵或式 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-NR'-$ 、 $-O-NR'-$ 、 $-NR'-CO-$ 、 $-CO-NR'-$ 之二價基團較佳，其中 R' 係氫、 (C_1-C_4) 烷基或具有 1 至 4 個碳原子之烷醯基，

其中在基中的雜環基在每一個情況中具有 3 至 9 個環原子（以 3 至 6 個較佳）及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子

之化合物（I）特別有利。

而且，

R^4 係以氫、甲醯基、羧基、氰基、硫代氰醯基、胺羰基、 (C_1-C_4) 烷基、氰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷基胺基、二- $[(C_1-C_4)$ 烷基]胺基、鹵基- (C_1-C_4) 烷基、羥基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、鹵基- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基、鹵基- (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_2-C_6) 烯基、鹵基- (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基、鹵基- (C_2-C_6) 炔基、 (C_1-C_4) 烷基胺基- (C_1-C_4) 烷基、二- $[(C_1-C_4)$ 烷基]胺基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_9) 環烷基胺基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_9) 環烷基、具有 3 至 6 個環元件之雜環基- (C_1-C_4) 烷基（其中在前述最後 3 個基中的環系基未經取代或以一或多個（以多達 3 個較佳）來自 (C_1-C_4) 烷

(33)

基、鹵素及氰基之基取代)或苯基、苯氧基、苯羰基、苯羰基-(C₁-C₄)烷基、苯氧羰基、(C₁-C₄)烷羰基、(C₁-C₄)烷氧羰基、(C₁-C₄)烷胺羰基、(C₁-C₄)烷氧羰基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷胺羰基-(C₁-C₄)烷基、苯氧基-(C₁-C₄)烷基、苯基-(C₁-C₄)烷基、雜環基、雜環胺基、雜環氧基、雜環硫基、(C₁-C₅)烷醯基胺基、N-[(C₁-C₅)烷醯基]-N-[(C₁-C₄)烷基]胺基、[(C₂-C₄)烯基]羰胺基、[(C₂-C₄)炔基]羰胺基、[(C₁-C₄)烷氧基]羰胺基、[(C₂-C₄)烯氧基]羰胺基、[(C₂-C₄)炔氧基]羰胺基、苯羰胺基、苯氧羰胺基、(C₁-C₄)烷磺醯基、(C₂-C₄)烯磺醯基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、甲醯基、(C₁-C₄)烷羰基、(C₁-C₄)烷氧羰基、(C₁-C₄)烷氧基及在環系部份的情況中也以來自(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)鹵烷基之基取代在非環系部份中或在環系部份中(較佳)的前述最後27個基的其中之一較佳,

其中在基中的雜環基在每一個情況中具有3至9個環原子及1至3個來自N、O及S之雜環原子。

而且,

R⁴係以氫、(C₁-C₄)烷基、氰基-(C₁-C₄)烷基、鹵基-(C₁-C₄)烷基、羥基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、鹵基-(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₆)烯基、鹵基-(C₂-

(34)

C₆) 烯基、(C₂ - C₆) 炔基、(C₁ - C₄) 烷基胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₃ - C₉) 環烷基胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₃ - C₉) 環烷基、具有 3 至 9 個環元件之雜環基 - (C₁ - C₄) 烷基 (其中在前述最後 3 個基中的環系基未經取代或以一或多個 (以多達 3 個較佳) 來自 (C₁ - C₄) 烷基、鹵素及氰基之基取代) 或苯基、苯氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、苯基 - (C₁ - C₄) 烷基、雜環基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷硫基、(C₁ - C₄) 鹵烷氧基、(C₁ - C₄) 烷羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基、(C₁ - C₄) 烷氧基及在環系部份的情況中也以來自 (C₁ - C₄) 烷基和 (C₁ - C₄) 鹵烷基之基取代在非環系部份中或在環系部份中 (較佳) 的前述最後 4 個基的其中之一較佳，

其中在基中的雜環基在每一個情況中包括 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子；

特別係 R⁴=氫或 (C₁ - C₄) 烷基。

而且，以其中

R⁵，如果 n=1 及如果 n 大於 1 時，則在每一個情況中的 R⁵ 係彼此獨立為鹵素、羥基、胺基、硝基、甲醯基、羧基、氰基、硫代氰醯基、胺羰基、(C₁ - C₄) 烷基、氰基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷基胺基、二 - [(C₁ - C₄) 烷基]胺基、鹵基 - (C₁ - C₄) 烷基、羥基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、鹵基 - (C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、

(35)

($C_1 - C_4$) 烷硫基、鹵基 - ($C_1 - C_4$) 烷硫基、($C_2 - C_6$) 烯基、鹵基 - ($C_2 - C_6$) 烯基、($C_2 - C_6$) 炔基、鹵基 - ($C_2 - C_6$) 炔基、($C_1 - C_4$) 烷基胺基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、二 - [$(C_1 - C_4)$ 烷基]胺基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_3 - C_9$) 環烷胺基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_3 - C_9$) 環烷基、具有 3 至 6 個環元件之雜環基 - ($C_1 - C_4$) 烷基 (其中在前述最後 3 個基中的環系基未經取代或以一或多個 (以多達 3 個較佳) 來自 ($C_1 - C_4$) 烷基、鹵素及氰基之基取代) 或苯基、苯氧基、苯羰基、苯羰氧基、苯羰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、苯氧羰基、($C_1 - C_4$) 烷羰基、($C_1 - C_4$) 烷氧羰基、($C_1 - C_4$) 烷胺羰基、($C_1 - C_4$) 烷氧羰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷胺羰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、苯氧基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、苯基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、雜環基、雜環胺基、雜環氧基、雜環硫基、($C_1 - C_5$) 烷醯基胺基、N - [$(C_1 - C_5)$ 烷醯基] - N - [$(C_1 - C_4)$ 烷基]胺基、[($C_2 - C_4$) 烯基]羰胺基、[($C_2 - C_4$) 炔基]羰胺基、[($C_1 - C_4$) 烷氧基]羰胺基、[($C_2 - C_4$) 烯氧基]羰胺基、[($C_2 - C_4$) 炔氧基]羰胺基、苯羰胺基、苯氧羰胺基、($C_1 - C_4$) 烷磺醯基、($C_2 - C_4$) 烯磺醯基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、($C_1 - C_4$) 烷氧基、($C_1 - C_4$) 烷硫基、($C_1 - C_4$) 鹵烷氧基、甲醯基、($C_1 - C_4$) 烷羰基、($C_1 - C_4$) 烷氧羰基、($C_1 - C_4$) 烷氧基及在環系部份的情況中也以來自 ($C_1 - C_4$) 烷基和 ($C_1 - C_4$) 鹵烷基之基取代在非環系部份中或在環系部份中 (較佳) 的前述

(36)

最後 28 個基的其中之一，

其中在基中的雜環基在每一個情況中包括 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子，

或者兩個毗鄰之 R^5 基一起係具有 4 至 6 個環原子之稠合環，其係碳環或包括 1 至 3 個來自 O、S 及 N 之雜環原子，及其未經取代或以一或多個來自鹵素、 $(C_1 - C_4)$ 烷基及酮基之基取代，

之化合物 (I) 特別有利。

而且，

R^5 ，如果 $n=1$ 及如果 n 大於 1 時，則在每一個情況中的 R^5 係以彼此獨立為鹵素、羥基、胺基、硝基、甲醯基、羧基、氰基、硫代氰醯基、胺羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷基、氰基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺基、二 - $[(C_1 - C_4)$ 烷基]胺基、鹵基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、羥基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、鹵基 - $(C_1 - C_4)$ 烷氧基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷硫基、 $(C_2 - C_6)$ 烯基、 $(C_2 - C_6)$ 炔基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、二 - $[(C_1 - C_4)$ 烷基]胺基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_3 - C_9)$ 環烷胺基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_3 - C_9)$ 環烷基、具有 3 至 9 個環元件之雜環基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基（其中在前述最後 3 個基中的環系基未經取代或以一或多個（以多達 3 個較佳）來自 $(C_1 - C_4)$ 烷基、鹵素及氰基之基取代）或苯基、苯氧基、苯羰基、苯羰氧基、苯羰基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 -$

(37)

C₄) 烷氧羰基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷胺羰基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基、(C₁ - C₄) 烷胺羰基、苯氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、苯基 - (C₁ - C₄) 烷基、雜環基、雜環胺基、雜環氧基、雜環硫基、(C₁ - C₅) 烷醯基胺基、N - [(C₁ - C₅) 烷醯基] - N - [(C₁ - C₄) 烷基]胺基、苯胺基、苯氧胺基、(C₁ - C₄) 烷磺醯基、(C₂ - C₄) 烯磺醯基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷硫基、(C₁ - C₄) 烷羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基、(C₁ - C₄) 烷氧基及在環系部份的情況中也以來自(C₁ - C₄) 烷基和(C₁ - C₄) 鹵烷基之基取代在非環系部份中或在環系部份中(較佳)的前述最後 22 個基的其中之一較佳，

其中在基中的雜環基在每一個情況中包括 3 至 6 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子，

或者兩個毗鄰之 R⁵ 基一起係具有 4 至 6 個環原子之稠合環，其係碳環或包括 1 至 3 個來自 O、S 及 N 之雜環原子，及其未經取代或以一或多個來自鹵素、(C₁ - C₄) 烷基及酮基之基取代。

而且，

R⁵，如果 n=1 及如果 n 大於 1 時，則在每一個情況中的 R⁵ 係以彼此獨立為鹵素、羥基、胺基、硝基、甲醯基、氰基、胺羰基、(C₁ - C₄) 單烷胺羰基、(C₁ - C₄) 二烷胺羰基、(C₁ - C₄) 烷基、氰基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷胺基、鹵基 - (C₁ - C₄)

(38)

烷基、羥基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₂ - C₄) 烯基、(C₂ - C₄) 炔基、(C₁ - C₄) 烷基胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、二 - [(C₁ - C₄) 烷基]胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、或 [(C₁ - C₄) 烷基]羰基、[(C₁ - C₄) 鹵烷基]羰基、[(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基]羰基、甲醯基胺基、[(C₁ - C₄) 烷基]羰胺基、[(C₁ - C₄) 鹵烷基]羰胺基、苯基、苯氧基、苯羰基、苯羰胺基、雜環基或以一或多個來自鹵素、(C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 鹵烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 鹵烷氧基及 (C₁ - C₄) 烷硫基之基取代的前述最後 5 個基的其中之一較佳，

特別係 R⁵ = 鹵素 (以 F、Cl 或 Br 較佳)、羥基、甲醯基、氰基、(C₁ - C₄) 烷基 (例如，甲基、乙基或異丙基) 或 (C₁ - C₄) 烷氧基 (例如，甲氧基、乙氧基或異丙氧基)、或 (C₁ - C₄) 烷基胺基、(C₁ - C₄) 鹵烷基、(C₂ - C₄) 烯基、(C₂ - C₄) 炔基、[(C₁ - C₄) 烷基]羰基 (例如，乙醯基)、[(C₁ - C₄) 鹵烷基]羰基 (例如，三氟乙醯基)、或甲醯基胺基、[(C₁ - C₄) 烷基]羰胺基或苯醯基胺基。

R⁶ 及 R⁷ 特別佳的意義對應來自於較佳的 R⁴ 及 R⁵ 之意義。

也以其中

R⁸ 及 R⁹ 係彼此各自獨立為氫、甲醯基、羧基、氰基、硫代氰醯基、胺羰基、(C₁ - C₄) 烷基、氰基 - (C₁ -

(39)

C_4) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷氧基、($C_1 - C_4$) 烷基胺基、二[
 ($C_1 - C_4$) 烷基]胺基、鹵基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、羥基 -
 ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷氧基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、
 鹵基 - ($C_1 - C_4$) 烷氧基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$)
 烷硫基、鹵基 - ($C_1 - C_4$) 烷硫基、($C_2 - C_6$) 烯基、鹵
 基 - ($C_2 - C_6$) 烯基、($C_2 - C_6$) 炔基、鹵基 - ($C_2 - C_6$)
) 炔基、($C_1 - C_4$) 烷基胺基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、二[(C_1
 - C_4) 烷基]胺基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_3 - C_9$) 環烷胺
 基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_3 - C_9$) 環烷基、具有 3 至 6 個
 環元件之雜環基 - ($C_1 - C_4$) 烷基 (其中在前述最後 3 個
 基中的環系基未經取代或以一或多個 (以多達 3 個較佳)
 來自 ($C_1 - C_4$) 烷基、鹵素及氰基之基取代) 或苯基、苯
 氧基、苯羰基、苯羰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、苯氧羰基、($C_1 - C_4$) 烷羰基、($C_1 - C_4$) 烷氧羰基、($C_1 - C_4$) 烷胺
 羰基、($C_1 - C_4$) 烷氧羰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$)
) 烷胺羰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、苯氧基 - ($C_1 - C_4$) 烷基
 、苯基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、雜環基、雜環胺基、雜環氧基
 、雜環硫基、($C_1 - C_5$) 烷醯基胺基、N - [($C_1 - C_5$) 烷
 醯基] - N - [($C_1 - C_4$) 烷基]胺基、[($C_2 - C_4$) 烯基]羰
 胺基、[($C_2 - C_4$) 炔基]羰胺基、[($C_1 - C_4$) 烷氧基]羰
 胺基、[($C_2 - C_4$) 烯氧基]羰胺基、[($C_2 - C_4$) 炔氧基]
 羰胺基、苯羰胺基、苯氧羰胺基、($C_1 - C_4$) 烷磺醯基、
 ($C_2 - C_4$) 烯磺醯基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基
 、($C_1 - C_4$) 烷氧基、($C_1 - C_4$) 烷硫基、($C_1 - C_4$) 鹵

(40)

烷氧基、甲醯基、(C₁ - C₄) 烷羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基、(C₁ - C₄) 烷氧基及在環系部份的情況中也以來自 (C₁ - C₄) 烷基和 (C₁ - C₄) 鹵烷基之基取代在非環系部份中或在環系部份中 (較佳) 的前述最後 27 個基的其中之一，

其中在基中的雜環基在每一個情況中具有 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子

之化合物 (I) 特別有利。

而且，

R⁸ 及 R⁹ 係以彼此各自獨立為氫、(C₁ - C₄) 烷基、氰基 - (C₁ - C₄) 烷基、鹵基 - (C₁ - C₄) 烷基、羥基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、鹵基 - (C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₂ - C₆) 烯基、鹵基 - (C₂ - C₆) 烯基、(C₂ - C₆) 炔基、(C₁ - C₄) 烷胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₃ - C₉) 環烷胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₃ - C₉) 環烷基、具有 3 至 9 個環元件之雜環基 - (C₁ - C₄) 烷基 (其中在前述最後 3 個基中的環系基未經取代或以一或多個 (以多達 3 個較佳) 來自 (C₁ - C₄) 烷基、鹵素及氰基之基取代) 或苯基、苯氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、苯基 - (C₁ - C₄) 烷基、雜環基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷硫基、(C₁ - C₄) 鹵烷氧基、(C₁ - C₄) 烷羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基、(C₁ - C₄) 烷氧基及在環系部份的情況中也以來自 (C₁ - C₄) 烷基和 (C₁ - C₄) 鹵烷基之

(41)

基取代在非環系部份中或在環系部份中（較佳）的前述最後 4 個基的其中之一較佳，

其中在基中的雜環基在每一個情況中包括 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子，

特別係 R^8 及 R^9 係彼此獨立為氫或（ $C_1 - C_4$ ）烷基。

以其中

X^1 ， X^2 ， X^3 ， X^4 係彼此各自獨立為碳原子（將其以氫原子或其中一個以上定義之取代基 R^5 取代）或氮原子，或兩個毗鄰之 X^1 ， X^2 ， X^3 及 X^4 符號在每一個情況中一起係式 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NH-$ 或 $-NR-$ 之二價基團，其中 R 係如 R^3 之定義，並以氫或（ $C_1 - C_4$ ）烷基較佳，其先決條件係 X^1 ， X^2 ， X^3 及 X^4 基與稠合環附著之 C_2 單元一起形成碳環系或雜環系芳族 5- 或 6- 員環，

$(Y^1)_m$ 係 m 個二價基團 Y^1 ，其中各自彼此獨立的 Y^1 基團係式 $-O-$ 、 $-CO-$ 、 $-C(=NR^*)-$ 、 $-S(O)_q-$ 、 $-NR^*-$ 或 $-N(O)-$ 之基（其中 $q=0$ 、1 或 2 及 R^* 係如 R^3 之定義，並以氫、（ $C_1 - C_4$ ）烷基、苯甲基或苯基較佳，特別係氫、（ $C_1 - C_4$ ）烷基或苯基）或已在以上定義之式 CR^8R^9 之基團，及

Y^1 係以式 CR^8R^9 之基團較佳，特別係 CH_2 、 $CH(CH_3)$ 、 $CH(C_2H_5)$ 、 $CH(CH_3)_2$ 或 $CH(C_6H_5)$ 及 $m=0$ 、1、2 或 3，特別係 $m=1$ 或 2，及

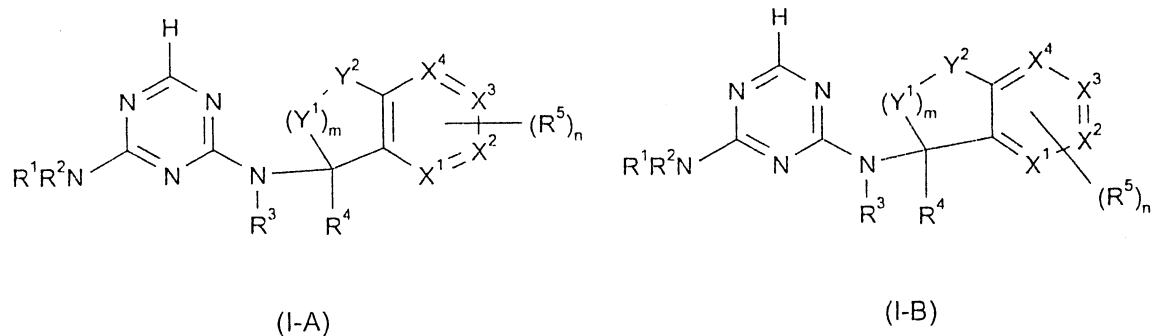
$(Y^1)_m$ 係以 CH_2 、 CH_2CH_2 、 $CH_2CH_2CH_2$ 、 $CH(CH_3)$ 、 $CH(CH_3)CH_2$ 、 $CH_2CH(CH_3)$ 、 $CH(CH_3)_2CH_2$ 、

(42)

$\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{CH}_2$ 或 $\text{CH}_2\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)$ 較佳，

Y^2 係如 Y^1 之定義或直鍵，以直鍵或式 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 CH_2 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)$ 或 (C_1-C_4) 烷胺基之基團較佳，例如， $\text{N}(\text{CH}_3)$ 、 $\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)$ 、 $\text{N}(\text{n}-\text{C}_3\text{H}_7)$ 或 $\text{N}(\text{i}-\text{C}_3\text{H}_7)$ 或 $\text{N}(\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5)$ 或 $\text{N}(\text{C}_6\text{H}_5)$ ，其中兩個毗鄰的符號對 Y^1 及 Y^1 基團或符號對 Y^1 及 Y^2 基團係不具有相同意義之雜原子之基團，以及其中 $(\text{Y}^1)_m$ 及 Y^2 基團與芳族環附著之 C_2 單元及附著於 R^4 之碳原子一起形成稠合之碳環系或雜環系非芳族 4-至 8-員環之化合物 (I) 也特別有利。

如果一對毗鄰的符號 X 一起係所提及之式 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{NH}-$ 或 $-\text{NR}-$ 之二價基團時，則將在雜芳族基中的雙鍵固定。在該情況中，式 (I) 包含副結構 (I-A) 及 (I-B)：



適合於在雙環系統中的芳族碳環系或雜環系環的鹼係例如以下：

苯、吡啶、嘧啶、吡嗪、噻吩、吡唑、咪唑、呋喃、噻唑、噁唑、異噁唑、噻吩、噻唑。

也採用其中一或多個或全部來自 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、

(43)

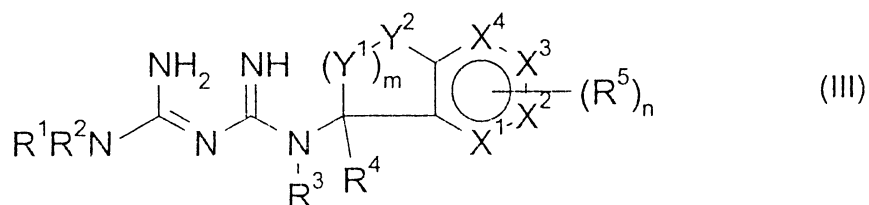
R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 Y^1 、 Y^2 、 n 及 m 之基及符號在每一個情況中具有其中一種上述較佳或特殊意義（也特別具有在以下更多的表中之基或實例中存在的意義）之式（I）化合物及彼之鹽類。

本發明也提供製備通式（I）化合物或彼之鹽類的方法，其包含

將式（I）化合物

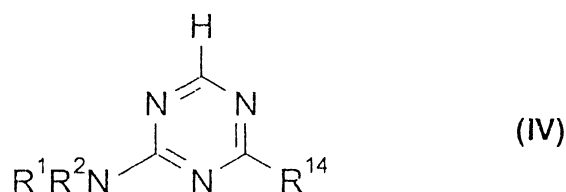


（其中 R^{13} 係來自羧酸酯、羧酸原酯、羧醯氯、羧醯胺及羧酸酐之官能基）與式（III）之二胍或其酸加成鹽反應



或

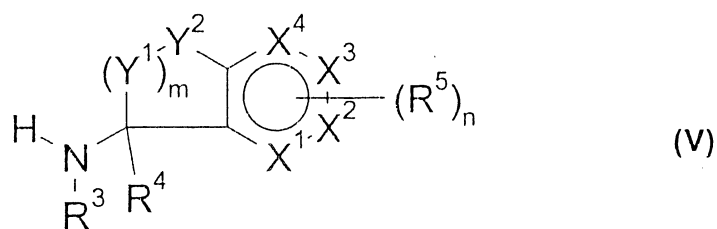
將式（IV）化合物



（其中 R^{14} 係可交換基或離棄基，例如，氯、三氯甲基、 $(C_1 - C_4)$ 烷磺醯基或未經取代或經取代之苯基 - $(C_1 - C_4)$ 烷磺醯基或 $(C_1 - C_4)$ 烷苯基磺醯基）與適合的

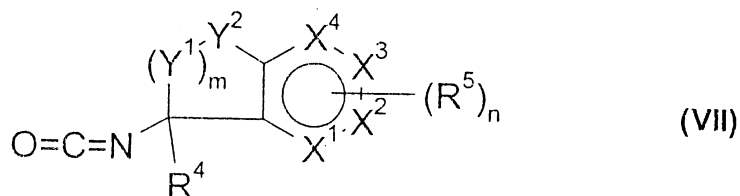
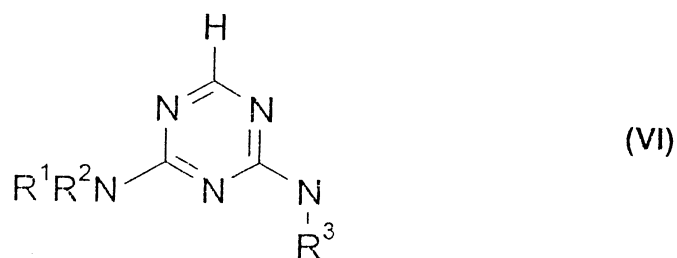
(44)

式 (V) 之胺或其酸加成鹽反應



或

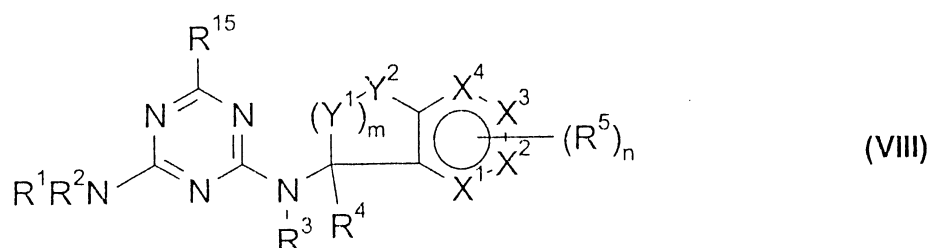
將式 (VI) 之二胺基 - 1,3,5 - 三吡與式 (VII) 之異氰酸酯反應



或

使用適合的方法除去在結構 (VIII) 之三吡中的 R^{15} 基 (其係離棄基或可除去之基), 如例如以氫化作用可除去基之氫化作用, 或以用於如果其係例如經由硫附著之氮或基之離棄基 R^{15} 的氫化作用,

(45)



其中在式 (II)、(III)、(IV)、(V)、(VI)、(VII) 及 (VIII) 中的 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 Y^1 及 Y^2 基和符號 m 及 n 係如在式 (I) 中的定義。

以在惰性有機溶劑中（如例如四氫呋喃（THF）、二噁烷、乙腈、二甲基甲醯胺（DMF）、甲醇及乙醇）及在介於 -10°C 至溶劑沸點之間的溫度下（以從 20°C 至 60°C 較佳）以鹼催化的方式進行式 (II) 與式 (III) 化合物的反應較佳，如果使用式 (III) 之酸加成鹽之時，則通常藉由鹼的輔助當場釋出這些化合物。適合的鹼或鹼性觸媒係鹼金屬氫氧化物、鹼金屬氫化物、鹼金屬碳酸鹽、鹼金屬烷醇酸鹽、鹼土金屬氫氧化物、鹼土金屬氫化物、鹼土金屬碳酸鹽或有機鹼，如三乙胺 1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一碳-7-烯（DBU）。使用例如以式 (III) 化合物為基礎計在從 0.1 至 5 莫耳當量之範圍內的討論中的鹼。可以使用例如以式 (III) 化合物為基礎計等莫耳量或超過高達 10 莫耳當量之式 (II) 化合物。自文獻已知類似的方法（比較：Shapiro, S. L.; Parrino, V. A.; Geiger, K.; Kobrin, S.; Freedman, L.; J Am Chem Soc, 1957, 79, 5664）。

(46)

以在惰性有機溶劑中（如例如 THF、二噁烷、乙腈、DMF、甲醇及乙醇）及在介於 -10°C 至討論中的溶劑或溶劑混合沸點之間的溫度下（以從 20°C 至 150°C 較佳，特別係從 20°C 至 60°C ，如果以該溫度開始反應時）以鹼催化作用進行式（IV）與式（V）化合物的反應較佳，如果使用酸加成鹽時，則若適當時以使用鹼會當場釋出化合物（V）。適合的鹼或鹼性觸媒係鹼金屬氫氧化物、鹼金屬氫化物、鹼金屬碳酸鹽、鹼金屬烷醇酸鹽、鹼土金屬氫氧化物、鹼土金屬氫化物、鹼土金屬碳酸鹽或有機鹼，如三乙胺 1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一碳-7-烯（DBU）。通常使用例如以式（IV）化合物為基礎計在從 1 至 3 莫耳當量之範圍內的討論中的鹼；可以使用例如與式（V）化合物等莫耳量或超過高達 2 莫耳當量之式（IV）化合物。自文獻已知類似的方法（參考第 3 冊第 2 部之 *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky, C. W. Rees, Pergamon Press, Oxford, New York, 1984; ISBN 0-08-030703-5 第 482 頁）。

以在惰性有機溶劑中（如例如四氫呋喃（THF）、二噁烷、乙腈、二甲基甲醯胺（DMF））及在介於 -10°C 至溶劑沸點之間的溫度下（以從 20°C 至 60°C 較佳）以鹼催化的方式進行式（VI）之二胺基-1,3,5-三吡與式（VII）之異氰酸酯的反應較佳。適合的鹼或鹼性觸媒係鹼金屬氫氧化物、鹼金屬氫化物、鹼金屬碳酸鹽、鹼金屬烷醇酸鹽、鹼土金屬氫氧化物、鹼土金屬氫化物、鹼土金屬碳酸

(47)

鹽或有機鹼，如三乙胺 1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一碳-7-烯 (DBU)。使用例如以式 (VI) 化合物為基礎計在從 0.5 至 3 莫耳當量之範圍內的討論中的鹼。可以使用例如以式 (VI) 化合物為基礎計等莫耳量或稍過量之式 (VII) 化合物。原則上自文獻已知用於非環系及芳族衍生物之對應方法 (參考 B. Singh; *Heterocycles*, 1993, 34 第 929 - 935 頁)。

較佳的是在惰性有機溶劑中 (如例如四氫呋喃 (THF)、二噁烷、適合的醇 (如乙醇)、醋酸或彼另外的混合物) 及在介於 -10°C 至溶劑沸點之間的溫度下 (以從 20°C 至 60°C 較佳) 以適合的氫化觸媒輔助之視需要以酸催化之氫化作用除去式 (VIII) 之二胺基-1,3,5-三吡的 R^{15} 基較佳，其中將在適合於該目的之裝置中的氫引入反應混合物中或將反應混合物曝露於在上升壓力下的氫氣中。自文獻已知對應方法 (Hirt, R.; Nidecker, H.; Berchtold, R.; *Helv. Chim. Acta.*; 1950, 33, 1365)。

式 (II)、(III)、(IV)、(V)、(VI)、(VII) 及 (VIII) 之原料係或市售商品，或可以類似於已知的文獻方法製備。可以例如其中一種以下說明的方法製備化合物。

若適當時，以氰基胍與式 (V) 之胺或其鹽類的反應可以製備式 (II) 化合物。最後有可能例如將兩個在惰性溶劑中 (如二氯苯) 的組份加熱至 100 至 190°C ，並接著將所得二胍以抽氣的過濾作用分離成鹽類。在例如 S. L.

(48)

Shapiro, V. A. Parrino, L. Freedmann; JACS 81, (1959) 第 3728 頁或 H. M. Eisa, A. S. Tantawy, M. M. EI-Kerdawy; Pharmazie 46, (1991) 第 182 頁中說明對應方法。若適當時，以加入金屬鹽類（如硫酸銅（II）、氯化鋅（II）或氯化鐵（III）可以催化反應（T. Suyama, T. Soga, K. Miauchi; NIPPON KAGAKU KAISHI (1989), (5) 第 884-887 頁），以及在大部份的情況中，接著可在從 50℃ 至討論中的溶劑回流溫度之範圍內的較低溫下進行反應。若適當時，也可以在許多溶劑中進行反應，如 THF、二噁烷、醇類或醚類。

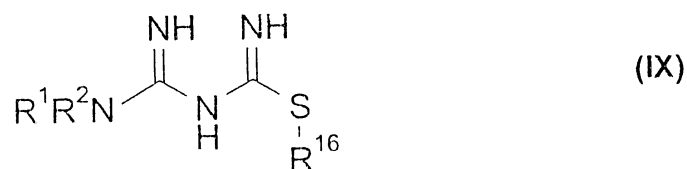
以例如以對應酮可製得的對應肱之氫化作用也可以製備對應於式（V）之胺。A. B. Sen, S. B. Singh; J. Ind. Chem. Soc.; 43 (1966) 第 521 頁說明對應方法，其中利用以鈉成爲乙醇鈉之轉化作用作爲氫來源。而且，Sarges 等人之 J. Med. Chem.; 16, (1973) 第 1003, 1008 頁說明將酮轉化成肱之方法，接著以鈀觸媒氫化，以得到對應胺鹽酸。也曾說明以雷氏（Raney）鎳之氫化作用（參考：D. Barbry, D. Couturier, N. Abdellatifi, D. Lesieur, C. Lespagnol; J. Heterocycl. Chem.; 28, (1991) 第 449 頁）或以硼氫化鹽化合物之氫化作用（A. K. Gosh, S. P. McKee, W. M. Sanders; Tetrahedron Lett. 32, (1991) 第 711-714 頁）用於對應二環系衍生物，並可用於合成式（V）化合物。

例如，可以如下製備式（IV）化合物或其直接的前驅

(49)

體：

1. 以式 (II) 化合物與式 (IX) 之脒基硫脒反應

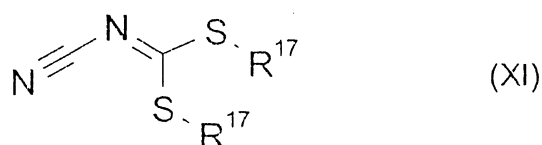


(其中 R^5 係 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ 烷基或苯基 - $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ 烷基, R^1 及 R^2 係如在式 (I) 中之定義), 以得到其中 $\text{R}^{14} = -\text{SR}^{16}$ 之式 (IV) 化合物。

2. 以式 (X) 之脒或其酸加成鹽



與式 (XI) 之 N-氰基二硫代亞胺基碳酸酯

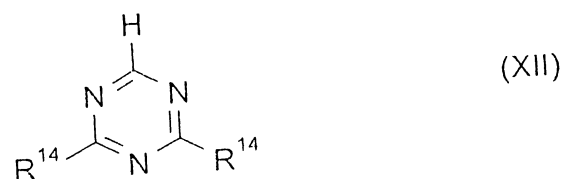


(其中 R^{17} 係 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ 烷基或苯基 - $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ 烷基) 反應, 以得到其中 $\text{R}^{14} = -\text{S}-\text{R}^{17}$ 之式 (IV) 化合物。

3. 以鹼金屬二胺脒與前述之 (II) 之羧酸衍生物反應, 以得到其中 $\text{R}^{14} = \text{NH}_2$ 之式 (VI) 化合物。

若適當時, 也有可能以類似於以上以 1-3 陳列的方法製備具有 2 個可交換基 R^{14} (參考式 (IV)) 之式 (XII) 中間物

(50)



及以類似於通用的已知方法以連續適合的胺或氮取代可交換基，以得到式（I）化合物。也有可能修改市售的式（XII）化合物或可以其它對應方式的方法製備的式（XII）化合物。若適當時，可將以類似於以上以 1-3 陳列的方法獲得的式（IV）或（XII）中間物（其中 R^{14} 係（ C_1-C_4 ）烷硫基或苯基-（ C_1-C_4 ）烷硫基）以氯化或氧化作用分別轉化成更具反應性之式（IV）及（XII）衍生物。

以在有機溶劑中（如例如丙酮、THF、二噁烷、乙腈、DMF、甲醇、乙醇）及在從 -10°C 至溶劑沸點之溫度下（以從 0°C 至 20°C 較佳）以鹼催化的方式進行式（II）之羧酸衍生物與式（VIII）之脒基硫脲衍生物的反應較佳。但是也可以在包括一或多種上述有機溶劑之水或水性溶劑混合物中進行反應。如果使用成為酸加成鹽之（VI）時，則若適當時以使用鹼可以當場釋出（VI）。適合的鹼或鹼性觸媒係鹼金屬氫氧化物、鹼金屬氫化物、鹼金屬碳酸鹽、鹼金屬烷醇酸鹽、鹼土金屬氫氧化物、鹼土金屬氫化物、鹼土金屬碳酸鹽或有機鹼，如三乙胺 1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一碳-7-烯（DBU）。使用以式（VIII）化合物為基礎計在從 1 至 10 莫耳當量之範圍內的討論中的鹼。通常可以使用與式（II）化合物等莫耳量或超過高達 2

(51)

莫耳當量之式 (II) 及 (VIII) 化合物。自文獻已知類似的方法 (參考 H. Eilingsfeld, H. Scheuermann, Chem. Ber.; 1967, 100, 1874)。

以在惰性有機溶劑中 (如例如乙腈、DMF、二甲基乙醯胺 (DMA)、N-甲基環吡啶酮 (NMP)、甲醇及乙醇) 及在從 -10°C 至溶劑沸點之溫度下 (以從 20°C 至 80°C 較佳) 以鹼催化的方式進行式 (IX) 之與式 (X) 之 N-氰基二硫代亞胺基碳酸酯的反應較佳。如果使用成為酸加成鹽之 (VII) 時, 則若適當時以使用鹼可以當場釋出 (VII)。適合的鹼或鹼性觸媒係鹼金屬氫氧化物、鹼金屬氫化物、鹼金屬碳酸鹽、鹼金屬烷醇酸鹽、鹼土金屬氫氧化物、鹼土金屬氫化物、鹼土金屬碳酸鹽或有機鹼, 如三乙胺 1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一碳-7-烯 (DBU)。使用以式 (X) 化合物為基礎計在從 1 至 3 莫耳當量之範圍內的討論中的鹼。通常可以使用式 (II) 化合物等莫耳量或超過高達 2 莫耳當量之式 (IX) 及 (X) 化合物。自文獻已知類似的方法 (參考 T. A. Riley, W. J. Henney, N. K. Dalley, B. E. Wilson, R. K. Robins; J. Heterocyclic Chem.; 1986, 23 (6), 1706-1714)。

以鹼金屬二胺腈與式 (II) 之羧酸衍生物 (其中 R^{13} 係以羧基或羧基胺之官能基較佳) 的反應可以製備其中 $\text{R}^{14}=\text{CN}$ 之式 (XII) 中間物。例如, 在惰性有機溶劑中 (如例如甲苯、氯苯或氯化烴) 及在介於 -10°C 至溶劑沸點之間的溫度下 (以從 20°C 至 80°C 較佳) 以酸催化作用進

(52)

行反應組份的反應，其中可將所形成之中間物使用適合的氯化劑（如例如磷醯氯）當場氯化。適合的酸係例如氫鹵酸（如 HCl）或另外的路易士酸（如例如 AlCl₃ 或 BF₃（參考 US-A-5095113、DuPont 及本文引用的文獻）。

可將其中 R¹⁴ = (C₁ - C₄) 烷巯基或未經取代之苯基 (C₁ - C₄) 烷巯基之式 (IV) 或 (XII) 中間物在惰性有機溶劑中（如例如甲苯、氯苯或氯化烴）或另外的溶劑中及在介於 -40°C 至溶劑沸點之間的溫度下（以從 20°C 至 80°C 較佳）以適合的氯化劑（如例如元素氯或磷醯氯）分別轉化成更具反應性之式 (IV) 或 (X) 之氯三吡，其中 R¹⁴ = Cl（參考 J. K. Chakrabarti, D. E. Tupper; Tetrahedron 1975, 31 (16), 1879 - 1882）。

可將其中 R¹⁴ = (C₁ - C₄) 烷巯基或未經取代或經取代之苯基 (C₁ - C₄) 烷巯基或 (C₁ - C₄) 烷苯硫基之式 (IV) 或 (XII) 中間物在適合的溶劑中（如例如氯化烴、醋酸、水、醇、丙酮或其混合物）及在介於 0°C 至溶劑沸點之間的溫度下（以從 20°C 至 80°C 較佳）使用適合的氧化劑（如例如間-氯基過苯甲酸、過氧化氫、過氧單硫酸鉀）分別氧化（參考：T. A. Riley, W. J. Henney, N. K. Dalley, B. E. Wilson, R. K. Robins; J. Heterocyclic Chem.; 1986, 23 (6), 1706 - 1714）。

在適合的溶劑中（如例如 THF、二噁烷、醇、DMF 或乙腈或其混合物）及在介於 -10°C 至溶劑沸點之間的溫度下（以從 10°C 至 25°C 較佳）以其中 R¹⁴ 係例如鹵素、

(53)

全鹵甲基、(C₁ - C₄) 烷亞硫醯基、(C₁ - C₄) 烷磺醯基或其它文獻已知的離棄基之式 (XII) 化合物中的可交換基之選擇性親核取代作用 (若適當時，在鹼性條件下) 也會獲得式 (IV) 化合物。適合的鹼或鹼性觸媒係鹼金屬氫氧化物、鹼金屬氫化物、鹼金屬碳酸鹽、鹼金屬烷醇酸鹽、鹼土金屬氫氧化物、鹼土金屬氫化物、鹼土金屬碳酸鹽或有機鹼，如三乙胺 1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一碳-7-烯 (DBU)。使用以式 (XII) 化合物為基礎計在從 1 至 3 莫耳當量之範圍內的討論中的鹼，通常使用等莫耳量或超過高達 2 莫耳當量之親核劑，若適當時，也可以使用其作為鹼。自文獻已知類似的方法 (參考：V. I. Kaelarev, Dibi Ammar, A. F. Lunin; Ximinya Geterosikl. Soedin., 1985, N11, 1557 - 1563)。

可以並行的方式另外製備可以上述的方法合成的化合物 (I) 收集物，其可以手動，部份自動或完全自動的方式完成。就此而論，有可能使反應步驟、產物或中間物的整理或純化作用自動化。總而言之，以 Escom 在 1997 年發行 S. H. DeWitt 的第 1 冊 "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis" 第 69 至 77 頁中說明的步驟瞭解其意義。

為了以並行的方式進行反應及整理，故可以使用一系列取自例如 Stem 公司 (Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE 英國) 或 H+P Labortechnik GmbH (

(54)

Bruckmannring 28, 85764 Oberschleibheim 德國) 之市售裝置。爲了進行在製備期間獲得的化合物 (I) 或中間物並行的純化作用, 故取用例如色層分離設備 (例如, ISCO 公司 (4700 Superior Street, Lincoln, NE68504 美國))。所說明的設備有可能將步驟組合, 其中將各個步驟自動化, 但是在步驟之間必須以手動操作用。這可以使用部份或完全整合的自動系統先發制人, 其中以例如機械人操作在討論中的自動組合。可自例如 Zymark 公司 (Zymark Center, Hopkinton, MA 01748 美國) 獲得這些自動系統。除了上述的方法之外, 以固相支撐法可以完全或部份製備化合物 (I)。最後將合成或配合討論中的步驟合成的各個中間物或全部的中間物與合成樹脂結合。在專家的文獻中廣泛地說明以固相支撐之合成法, 例如: Academic Press 在 1998 年發行 Barry A. Bunin 之 "The Combinatorial Index"。以固相支撐之合成法之應用允許一系列自文獻已知依次可以手動式或自動化方式進行的模式。例如, 以 IRORI (11140 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037 美國) 的產物可使 "茶包法" (Houghten, US 4,631, 211; Houghten 等人之 Proc. Natl. Acad. Sci., 1985, 82, 5131-5135) 部份自動化。可以使用 Argonaut Technologies 公司 (887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070 美國) 或 MultiSyn Tech GmbH (Wullener Feld 4, 58454 Witten 德國) 之設備將以固相支撐之並行合成作用成功地自動化。

(55)

以根據本文前述之製備方法產生收集物或匯集物形式之化合物 (I)。因此，本發明的目的也係化合物 (I) 之匯集物，其包括至少兩種化合物 (I) 及彼之前驅體。

適合於製備式 (I) 化合物之酸加成鹽的酸係以下的酸類：不僅是氫鹵酸（如氫氯酸或氫溴酸）、還是磷酸、硝酸、硫酸、單－或二－官能羧酸及羥基羧酸（如醋酸、馬來酸、琥珀酸、富馬酸、酒石酸、檸檬酸、水楊酸、山梨酸或乳酸），並也是磺酸（如對－甲苯磺酸或 1,5－萘二磺酸。以簡單的方式，使用形成鹽類的照例的方法可以獲得式 (I) 之酸加成化合物，例如，將式 (I) 化合物溶解在適合的有機溶劑中（如例如甲醇、丙酮、二氯甲烷或石油醚）及在從 0 至 100℃ 之溫度下加入酸，並可將彼以已知的方式分離（例如，以過濾作用），及若適當時，將彼以惰性有機溶劑清洗的方式純化。

以在惰性極性溶劑中（如例如水、甲醇或丙酮）及在從 0 至 100℃ 之溫度下製備式 (I) 化合物之鹼加成鹽類較佳。適合於製備根據本發明的鹽類之鹼係例如鹼金屬碳酸鹽（如碳酸鉀）、鹼金屬及鹼土金屬氫氧化物（例如，NaOH 或 KOH）、鹼金屬及鹼土金屬氫化物（例如，NaH）、鹼金屬及鹼土金屬烷醇酸鹽（例如，甲醇鈉、特丁醇鉀）或氨或乙醇胺。

在以上的變化法中稱為“惰性溶劑”的溶劑係在每一種情況中的溶劑，其在討論中的反應條件下具有惰性，但是在任何反應條件下不必具有惰性。

(56)

根據本發明的式 (I) 化合物及彼之鹽類具有極佳的除草活性，以抵抗在經濟上重要的單一及雙子葉有害植物的廣效性。活性物質也對自根莖、樹根或其它多年生有機體長出及不易控制的多年生雜草具有效的作用。就此而論，不論物質係在播種之前、萌芽前或萌芽後噴灑，這不重要。特別可以實例說明可以根據本發明的化合物控制的一些單一及雙子葉雜草系植物實例，但是不限於所說明的特定物種。

在單子葉雜草物種之中，以活性物質對其具有效作用的那些雜草係例如

一年生種類之中的翦股穎屬、看麥娘、*apera*、燕麥屬、*brachicaria*、雀麥屬、龍爪茅、馬唐屬、野稗、荸薺屬、牛筋草、羊茅屬、飄浮草屬、鴨嘴草、黑麥草屬、鴨舌草、鋪地黍、雀稗屬、喜濕藷草、貓尾草屬、早熟禾屬、慈姑屬、蘆草屬、非洲狗尾草、尖瓣花及莎草屬，以及在多年生種類之中的鵝觀草屬、狗牙根屬、白茅、高粱及莎草屬物種。

在雙子葉雜草物種的實例中，廣效性作用擴及以下的物種，如例如：

一年生豬殃殃屬、莖菜、水苦蕒、寶蓋草、繁縷屬、莧屬、白芥、蔦蘿屬、甘菊、磨盤草及金午時花，以及在多年生雜草的實例中，彼係旋花屬、薊屬、酸模屬及艾草。

也在雙子葉有害植物的實例中達到除草作用，如豬草

(57)

屬、洋甘菊、飛廉屬、矢車菊、薊屬、旋花屬、曼陀羅、刺酸模屬、鼬瓣花屬、小米菊屬、獨行菜屬、母草屬、罌粟屬、portlaca、蓼屬、毛茛屬、山芥菜、水豬母乳屬、seneceio、田菁、茄屬、苦苣菜屬、蒲公英屬、三葉草、蕁麻屬及蒼耳屬。

以根據本發明的活性物質顯然也對在特殊的稻米（如慈姑屬、澤瀉屬、荸薺屬、蔗草屬及莎草屬）培育條件下生長的有害植物有很好的控制。

如果將根據本發明的化合物在發芽之前噴灑在土壤上，則完全控制雜草幼苗或冒出或雜草生長，直到彼等長到子葉階段為止，但是彼等的生長終止，並在經過 3 至 4 週之後，最後完全死亡。

在將活性物質在萌後噴灑在植物的綠色部份時，則在處理之後以非常短的時間同樣使生長明顯終止，在噴灑時的雜草植物仍維持在生長階段或在特定的時間完全死亡，所以該方式會在非常早期的階段及持續的方式完全消除對農作植物有害的雜草。

雖然根據本發明的化合物具有極佳的抗單一及雙子葉雜草之除草活性，但是對經濟上重要的農作物之農作植物（如例如小麥、大麥、黑麥、稻米、玉米、甜菜、甘蔗、棉及黃豆）只受到不明顯程度或完全不受傷害。就這些理由而言，本發明的化合物非常適合選擇控制對在農業上有用的植物立場而言不希望的植物生長。

由於廣效的抗無用性蔬菜活性，故可在樹架、葡萄種

(58)

植及核果生長農作物中使用式 (I) 化合物或彼之鹽類。也有可能應用於避免植物生長的工業用地、非工業區域或例如馬路或鐵道。

此外，根據本發明的物質在植物中具有顯著的生長調節特性。彼等以調節方式參與植物代謝作用，並因此可以標的方式用於影響植物成份及加速收成，如例如以引發乾燥及妨礙生長。而且，彼等也適合以概括控制及抑制不希望的植物生長，但是不會殺死植物。抑制植物生長在許多單子葉及雙子葉農作物中扮演重要的角色，因為彼因此可以完全減少或避免農作物傾倒。

爲了彼等的除草及植物生長調節特性，故可以使用活性物質控制在已知的基因改造植物或尚未發展的基因改造植物之農作物中有害的植物。通常以特別有利的特性區別轉基因植物，例如，以抵抗特定的殺蟲劑（尤其係特定的除草劑）、抵抗植物疾病或植物疾病的病原（如特定的昆蟲或微有機體，如霉菌、細菌或病毒）。其它特別的特性係關於例如關於收成物的量、品質、貯存能力、組成物及特殊的成份。因此，已知具有增加澱粉含量或其中改變澱粉品質或那些具有不同的收成物脂肪組成物的轉基因植物。

較佳的是在經濟上重要的有用及觀賞性植物的轉基因農作物中使用根據本發明的式 (I) 化合物或彼之鹽類，例如，穀類（如小麥、大麥、黑麥、燕麥、高粱及玉蜀黍）、稻米、樹薯、及玉米或甜菜、棉花、黃豆、油菜籽、

(59)

馬鈴薯、蕃茄、豌豆及其它類型的植物之替代農作物。

較佳的是可將式 (I) 化合物作為在有用的植物農作物中的除草劑使用，以抵抗或以重組方法抵抗除草劑的植物毒性效應。

以生產在特徵上與現有的植物比較已改造之新穎植物的傳統方式包含例如傳統的繁殖方法及突變種的產生。另一選擇係使用重組步驟可以生產具有經改造特徵之新穎植物（參考例如 EP - A - 0221044，EP - 0131624）。例如，已說明了許多情況

— 以改造在植物中的合成澱粉為目的之農作植物的重組改造作用（例如，WO 92 / 11376，WO 92 / 14827，WO 91 / 19806），

抵抗特定的固殺草（glufosinate）類型（參考例如 EP - A - 0242236，EP - A - 242246）或嘉磷塞（glyphosate）類型（WO 92 / 00377）或磺酰素類型（EP - A - 0257994，US - A - 5013659）除草劑之轉基因農作植物，

具有產生使植物抵抗特定害蟲之蘇力菌毒素（Bt 毒素）的能力之轉基因農作植物，例如，棉（EP - A - 0142924，EP - 1 - 0193259），

具有經改造之脂肪酸組成物之轉基因農作植物（WO 91 / 13972）。

原則上已知許多可用於生產具有改造特性之新穎轉基因植物之分子生物技術，參考例如 Sambrook 等人在 1989

(60)

年第 2 版之 *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY 或 Winnacker 在 1996 年第 2 版之 “Gene und Klone” [Genes and Clones], VCH Weinheim 或 Christou 之 “Trends in Plant Science” 1 (1996) 423 – 431。

關於該類型的重組處理方式，可將核酸分子引入質粒體中，其允許以 DNA 序列的重組方式生成突變或序列改造。以上述的標準步驟的輔助有可能例如進行鹼交換，以除去副序列或加入天然或合成序列。可將接合物或連結物附著於片段，使 DNA 片段互相連接。例如，以表現至少一種對應之反義 RNA（有意義 RNA）可以產生具有基因產物活性減低之植物細胞，以達到至少一種尤其會裂解上述基因產物之轉錄本的結構相似之酵素性核酸的共同壓抑效應或表現。

就此而論，一方面有可能使用包含基因產物完整的編碼序列（包括可以存在的側接序列）之 DNA 分子及也包含只包含部份編碼序列（其中這些部份必須足夠長，以引起在細胞中的反義效應）之 DNA 分子。也有可能使用與基因產物的編碼序列具有高度同系性（但不完全相同）的 DNA 序列。

當核酸分子表現在植物中時，則可將合成之蛋白質定位在任何預期的植物細胞室內。但是，為了達到在特定的細胞室內的定位作用，故有可能例如連結編碼區域與確定在特定的細胞室內定位之 DNA 序列。熟悉本技藝的人已

(61)

知該型式的序列（參考例如 Braun 等人之 EMBO J. 11 （1992），3219－3227；Wolter 等人之 Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 （1988），846－850；Sonnewal 等人之 Plant J. 1 （1991），95－106）。

可將轉基因植物細胞根據已知的技術再生，以得到完整的植物。原則上轉基因植物可以是任何預期的植物種類之植物，即單子葉及雙子葉植物。因此可獲得特性已改造之轉基因植物，其係同系（=天然）基因或基因序列的過度表現、壓抑或抑制或不同（=來源）基因或基因序列的表現結果。

較佳的是可在會抵抗磺醯素類、咪唑啉酮、固殺草或草甘膦異丙胺鹽及類似的活性物質之除草劑的轉基因農作物中使用根據本發明的化合物（I）。

在轉基因農作物中使用根據本發明的活性物質時，除了抵抗在其它農作物中發現的有害植物的效應之外，常會出現尤其適用於特殊的轉基因農作物之效應，例如，可控制改造之雜草或尤其廣效性拓寬之雜草，變更可用於噴灑之噴灑量，較佳的是與抗轉基因農作物之除草劑有好的組合能力及轉基因農作物的生長和產量效應。

本發明因此也關於根據本發明的化合物（I）作為控制在轉基因植物中有害植物之除草劑的應用。

可以使用具有可濕性粉劑、可乳化濃縮物、噴灑液、散劑或顆粒形式之照例用製劑的根據本發明的化合物。本發明因此也關於包括式（I）化合物之除草劑及植物生長

(62)

調節組成物。

可以各種方式調配式 (I) 化合物，其係憑預指定之什麼生物及／或化學物理參數而定。適合的調配物可能實例係：可濕性粉劑 (WP)、水溶性粉劑 (EW)、水溶性濃縮物、可乳化濃縮物 (EC)、乳液 (EW) (如水包油型及油包水型乳液)、噴灑液、懸浮濃縮物 (SC)、以油或水為主之分散液、油溶性溶液、膠囊濃縮液 (CS)、散劑 (DP)、敷裹劑、撒播及土壤應用之顆粒、微粒形式之顆粒 (GR)、噴霧顆粒、塗佈性顆粒及吸收性顆粒形式之顆粒 (GR)、水分散性顆粒 (WG)、水溶性顆粒 (SG)、ULV 調配物、微膠囊及蠟。原則上已知這些各個調配物，並在例如：Winnacker-Kuchler 之第 7 冊 “Chemische Technologie” [Chemical Technology]; C. Hauser Verlag Munich 在 1986 年第 4 版之 Wade van Valkenburg, “Pesticide Formulations”, Marcel Dekker, N. Y., 1973; K. Martens 在 1979 年第 3 版之 “Spray Drying” Handbook, G. Goodwin Ltd. London 中說明。

也已知有必要的調配輔助劑，如脥性物質、界面活性劑、溶劑及其它添加劑，並在例如：Watkins 之第 2 版 “Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers”, Darland Books, Caldwell N. J.; H. V. Olphen 之第 2 版 “Introduction to Clay Colloid Chemistry”, J. Wiley & Sons, N. Y.; C. Marsden 之第 2 版 “Solvents Guide”, Interscience, N. Y. 1963; McCutcheon's 之 “Detergents and

(63)

Emulsifiers Annual”, MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley and Wood 之 “Encyclopedia of Surface Active Agents”, Chem. Publ. Co., N. Y. 1964; Schonfeldt, “Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte” [Surface – Active Ethylene Oxide Adducts], Wiss. Verlagsgesell. Stuttgart 1976; Winnacker – Kuchlery 在 1986 年第 4 版之第 7 冊之 “Chemische Technologie” [Chemical Technology], C. Hauser Verlag Munich。

也可以這些調配物為基礎調配與其它的殺蟲活性物質（如例如殺蟲劑、殺蟎劑、殺霉菌）及也與除草劑安全劑、肥料及／或生長調節劑之組合物，例如，具有最終的調配物形式或調配成筒裝混合物。

可濕性粉劑係均勻分散在水中的製品，除了活性化合物之外及除了稀釋劑或惰性物質之外，其也包括離子及／或非離子型界面活性劑（濕潤劑，分散劑），例如，聚乙氧基化烷基酚、聚乙氧基化脂肪醇、聚乙氧基化脂肪胺、脂肪醇聚乙二醇醚硫酸鹽、鏈烷磺酸鹽、烷基苯磺酸鹽、木質硫酸鈉、2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸鈉、二丁基萘磺酸鈉或另一選擇之油醯基甲基酒石酸鈉。為了製備可濕性粉劑，故將除草活性物質以例如慣用的設備磨細，如以粉碎機、鼓風研磨機及噴氣研磨機，並同時或接著與調配輔助劑混合。

將活性物質溶解在加入一或多種離子及／或非離子型界面活性劑（乳化劑）之有機溶劑中（例如，丁醇、環己

(64)

酮、二甲基甲醯胺、二甲苯或者相對高沸點芳族或烴或有機溶劑)，以製備可乳化濃縮物。可以使用的乳化劑實例係：烷芳基磺酸鈣鹽（如十二烷基苯磺酸鈣）或非離子乳化劑（如脂肪酸聚乙二醇醚、烷芳基聚乙二醇醚、脂肪醇聚乙二醇醚、環氧丙烷－環氧乙烷濃縮產物、烷基聚醚、花椒聚糖酯（如例如花椒聚糖脂肪酸酯）或聚氧乙烯花椒聚糖酯（如例如聚氧乙烯花椒聚糖脂肪酸酯）。將活性物質與細碎的固體物質（例如，滑石粉、天然黏土（如高嶺土、膨潤土及葉臘石）或矽藻土研磨，以獲得散劑。

懸浮濃縮物可以水或油為主。以例如市售的珠磨機裝置濕研磨及若適當時加入界面活性劑（如已在例如以上其它的調配物形式之情況中說明之試劑）可以製備該濃縮物。

以例如使用水性有機溶劑及若適當時加入界面活性劑（如已在例如以上其它的調配物形式之案例中說明之試劑）以攪拌機、膠磨機及／或靜態混合機裝置可以製備乳液（例如，水包油型乳液（EW））。

或以活性物質噴霧在吸收性粒化惰性物質上，或將活性物質濃縮物以結合劑方式（例如，聚乙烯醇、聚丙烯酸鈉或另外的礦物油）噴灑在載體表面（如沙、高嶺土或粒化惰性物質）上，可以製備顆粒。也可將適合的物質以照例用於製備肥料顆粒的方式粒化，若必要時，成為與肥料的混合物。通常以照例的方法製備水分散性顆粒，如噴霧乾燥、流化床粒化、盤式粒化、使用高速混合機混合及擠

(65)

壓無固體惰性物質。參考例如第 3 版 “Spray – Drying Handbook”, 1979, G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning 之 “Agglomeration” Chemical and Engineering 1967 (第 147 頁) ; 第 5 版 “Perry’s Chemical Engineer’s Handbook”, McGraw – Hill, New York 1973, 第 8 – 57 頁中說明關於盤式、流化床、擠壓器及噴霧顆粒之準備方法。

參考例如 G. C. Klingman 之 “Weed Control as Science”, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961 (第 81 – 96 頁) 及 J. D. Freyer, S. A. Evans 之第 5 版 “Weed Control Handbook”, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968 (第 101 – 103 頁) 關於更詳細的植物保護物之調配物的說明。

通常農業化學製劑包括 0.1 至 99 重量 % 之式 (I) 活性物質，特別係 0.1 至 95 重量 %。在可濕性粉劑中的活性物質濃縮物具有例如約 10 至 90 重量 %，成為 100 重量 % 的其餘物質係由照例的調配物成份所組成的。在可乳化濃縮物之情況中的活性物質濃縮物可以具有約 1 至 90 重量 %，以 5 至 80 % 較佳。以散劑形式的調配物包括 1 至 30 重量 % 之活性物質，經常以 5 至 20 重量 % 之活性物質較佳，噴霧溶液包括約 0.05 至 80 重量 % 之活性物質，以 2 至 50 重量 % 較佳。在水分散性顆粒之情況中的活性物質含量部份係憑活性化合物是否係液體或固體及使用的粒化輔助劑、填充劑等而定。在水分散性顆粒之情況中的活性物質

(66)

含量係例如介於 1 至 95 重量%，以介於 10 至 80 重量%之間較佳。

此外，所說明之活性物質調配物視需要包括在每一個情況中照例的結合劑、濕潤劑、分散劑、乳化劑、穿透劑、保存劑、抗冷凍劑、溶劑、填充劑、載體、著色劑、防起泡劑、蒸發抑制劑及 pH 和黏度調節劑。可以使用原樣子之式 (I) 化合物或彼之鹽類或使用彼與其它的殺蟲活性物質（如例如殺蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、除草劑、殺霉菌、除草劑安全劑、肥料及／或生長調節劑）成為組合物之製劑形式，例如，成為預混合物或筒裝混合物。

可在混合調配物或筒裝混合物中與根據本發明的活性物質使用的共同組份係例如在例如 Weed Research 26, 441 – 445 (1986) 或第 12 版 “The Pesticide Manual”, The British Crop Protection Council and Royal Soc. of Chemistry, 2000 / 2001 及本文引用的文獻中說明的已知的活性組份。可與式 (I) 化合物組合的已知的除草劑或植物生長調節劑係例如以下的活性物質，以下的化合物係以或根據國際標準組織 (International Organization for Standardization) (ISO) 常用的名稱或使用化學名稱命名的，若適當時，與照例的編號一起命名：

乙草胺 (acetochlor)、三氟羧草醚 (— 鈉) (acifluorfen)、苯草醚 (aclonifen)、AKH 7088 (即 [[1 – [5 – [2 – 氨基 – 4 – (三氟甲基) 苯氧基] – 2 – 硝苯基] – 2 – 甲氧基乙叉] 胺基] 氧基] 醋酸及其甲酯)、拉草 (

(67)

alachlor) 、 枯 殺 達 (- 鈉) (alloxymid) 、 草 殺 淨 (ametryn) 、 阿 米 豆 可 樂 (amidochlor) 、 磺 胺 磺 隆 (amidosulfuron) 、 阿 米 托 (amitrol) 、 AMS (即 胺 基 磺 酸 銨) 、 莎 稗 磷 (anilofos) 、 亞 速 爛 (asulam) 、 草 脫 淨 (atrazine) 、 草 芬 定 (azafenidin) 、 阿 日 姆 沙 風 (azimsulfurone) (DPX - A8947) 、 阿 日 波 退 恩 (aziprotryn) 、 巴 拉 刈 (barban) 、 BAS 516H (即 5 - 氟 基 - 2 - 苯 基 - 4H - 3,1 - 苯 並 噁 吡 - 4 - 酮) 、 畢 氟 布 它 密 德 (beflubutamid) 、 乙 基 草 除 靈 (benazolin) 、 倍 尼 芬 (benfluralin) 、 班 氟 沙 特 (benfuresate) 、 甲 基 免 速 隆 (bensulfuron) 、 地 散 磷 (bensulide) 、 滅 草 松 (bentazone) 、 班 柔 畢 塞 隆 (benzobicyclon) 、 班 柔 分 奈 普 (benzofenap) 、 班 柔 氟 陸 爾 (benzofluor) 、 乙 基 新 燕 靈 (benzoylprop) 、 噁 草 隆 (benzthiazuron) 、 畢 拉 草 (bialaphos) 、 必 芬 諾 (bifenox) 、 雙 草 醚 (- 鈉) (bispyribac) 、 克 草 (bromacil) 、 溴 丁 草 胺 (bromobutide) 、 溴 分 諾 希 姆 (bromofenoxim) 、 溴 苯 亞 硝 酸 鹽 (bromoxynil) 、 博 牧 若 (bromuron) 、 布 密 那 福 斯 (buminafos) 、 布 索 希 酮 (busoxinone) 、 丁 基 拉 草 (butachlor) 、 布 它 分 奈 希 爾 (butafenacil) 、 布 它 密 服 斯 (butamifos) 、 布 它 奈 可 樂 (butenachlor) 、 布 噁 唑 (buthidazole) 、 丁 樂 靈 (butralin) 、 布 托 西 定 (butroxydim) 、 丁 草 特 (butylate) 、 凱 分 司 托 爾 (cafenstrole) (CH - 900) 、 雙 醯 草 胺 (carbetamide) 、

(68)

乙基克繁草 (carfentrazone) (ICI-A0051)、卡羅西定 (caloxydim)、CDAA (即 2-氨基-N,N-二-2-丙烯基乙醯胺)、CDEC (即 2-氨基丙烯基二乙基二硫代胺基甲酸酯)、甲氧基護谷 (chlomethoxyfen)、克洛本 (chloramben)、丁基克洛辛福斯 (chlorazifop)、克洛密素隆 (chlormesulon) (ICI-A0051)、氯溴隆 (chlorbromuron)、氯草靈 (chlorbufam)、克洛分奈克 (chlorfenac)、甲基氯苄素 (chlorflurecol)、克洛達柔 (chloridazon)、氯嘧磺隆 (chlorimuron-ethyl)、全滅草 (chlornitrofen)、綠麥隆 (chlorotoluron)、枯草隆 (chloroxuron)、氯苯胺靈 (chlorpropham)、綠磺隆 (chlorsulfuron)、二甲基氯酞酸 (chlorthal)、草克樂 (chlorthiamid)、綠麥隆 (chlortoluron)、環庚草醚 (cinmethylin)、西速隆 (cinosulfuron)、剋草同 (clethodim)、甲基西尼洞 (cinidon)、可雷福西定 (clefoxydim)、可洛丁那福普 (clodinafop) 及其酯衍生物 (例如, 炔丙基-可洛丁那福普)、異惡草酮 (Clomazone)、克普草 (clomeprop)、可洛波西丁 (cloproxydim)、畢克草 (clopyralid)、甲基可洛比拉蘇氟若 (clopyrasulfuron)、甲基可洛拉蘇蘭 (cloransulam)、庫密路若 (cumyluron) (JC 940)、氰乃淨 (cyanazine)、環草特 (cycloate)、環丙嘧磺隆 (cyclosulfamuron) (AC 104)、環殺草 (cycloxydim)、環莠隆 (cycluron)、賽伏草 (cyhalofop) 及其酯衍生物

(69)

(例如, 丁基酯, DEH-112)、賽普奎特 (cyperquat)、環草淨 (cyprazine)、賽普唑 (cyprozole)、殺草隆 (daimuron)、2,4-D, 2,4-DB、2,4-DB, 得拉本 (dalapon)、甜菜安 (desmedipham)、狄斯密退恩 (desmetryn)、燕麥敵 (di-allate)、殺草畏 (dicamba)、二氯苯晴 (dichlobenil)、滴丙酸 (dichlorprop)、禾草靈 (diclofop) 及其酯類 (如甲基禾草靈)、雙氯磺草胺 (diclosulam)、乙基雙艾殺提 (diethatyl)、狄分諾斯若 (difenoxuron)、野燕枯 (difenzoquat)、吡吡草胺 (diflufenican)、狄氟陸分柔皮 (diflufenzopyr)、惡唑隆 (dimefuron)、嘓草丹 (dimepiperate)、狄麥賽可樂 (dimethachlor)、狄麥賽密退恩 (dimethametryn)、汰草滅 (dimethenamid) (SAN-582H)、狄麥賽容 (dimethazonee)、狄密西福蘭姆 (dimexyflam)、穫萎得 (dimethipin)、狄密退蘇福若 (dimetrasulfuron)、撻乃安 (dinitramine)、達諾殺 (dinoseb)、狄諾特伯 (dinoterb)、大芬滅 (diphenamid)、異丙淨 (dipropetryn)、敵草快 (diquat)、汰硫草 (dithiopyr)、達有龍 (diuron)、DNOC、乙基艾葛林秦 (eglinazine)、EL 77 (即 5-氰基-1-(1,1-二甲乙基)-N-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺)、草多索 (endothal)、艾波普丹 (epoprodan)、EPTC、抑死夫 (esprocarb)、伊賽氟拉林 (ethalfluralin)、甲基胺苯黃隆 (ethametsulfuron)、賽唑隆 (ethidimuron)、伊賽爾辛 (

(70)

ethiozin) 、 益 覆 滅 (ethofumesate) 、 亞 速 隆 (ethoxysulfuron) 、 伊 托 班 尙 尼 德 (etobenzanid) (HW 52) 、 F5231 (即 N - [2 - 氯 基 - 4 - 氟 基 - 5 - [4 - (3 - 氟 丙 基) - 4,5 - 二 氫 - 5 - 酮 基 - 1H - 四 唑 - 1 - 基] 苯 基] 乙 烷 磺 醯 胺 、 伊 舍 西 分 (ethoxyfen) 及 其 酯 類 (例 如 , 乙 基 酯 , HN - 252) 、 涕 丙 酸 (fenoprop) 、 分 諾 山 (fenoxan) 、 芬 殺 草 (fenoxaprop) 和 芬 殺 草 - P 及 彼 之 鹽 類 (例 如 , 乙 基 芬 殺 草 - P 及 乙 基 芬 殺 草) 、 分 諾 西 定 (fenoxymid) 、 四 唑 草 胺 (fentrazamide) 、 去 草 隆 (fenuron) 、 甲 基 或 異 丙 基 或 異 丁 基 - L 氟 燕 靈 (flamprop) 、 伏 速 隆 (flazasulfuron) 、 氟 洛 入 利 特 (floazulate) 、 麥 喜 爲 (florasulam) 、 伏 寄 普 (fluazifop) 和 伏 寄 普 - P 及 彼 之 酯 類 (例 如 丁 基 伏 寄 普 及 丁 基 伏 寄 普 - P) 、 夫 路 卡 巴 諾 (flucarbazone) (- 鈉) 、 氟 消 草 (fluchloralin) 、 氟 滅 索 命 (flumetsulam) 、 氟 滅 他 隆 (flumeturon) 、 氟 米 克 拉 (flumiclorac) (- 戊 基) 、 氟 米 沙 立 (flumioxazin) (S - 482) 、 氟 米 羅 必 (flumipropyn) 、 氟 內 他 隆 (fluorneturon) 、 氟 氯 碘 酮 (fluorochloridone) 、 氟 地 芬 (fluorodifen) 、 乙 基 氟 羅 格 賴 可 芬 (fluoroglycofen) 、 弗 拉 頗 沙 (flupoxam) (KNW - 739) 、 弗 拉 頗 帕 地 (flupropadi) (UB1C - 4243) 、 甲 基 弗 拉 必 殺 福 隆 (flupyrsulfuron) (或 - 鈉) , 丁 基 氟 瑞 諾 (flurenol) 、 氟 立 得 酮 (fluridone) 、 氟 氯 得 酮 (flurochloridone) 、 甲 基 氟 氯 比 (fluroxypyr) 、

(71)

氟嘧多 (flurprimidol)、氟托酮 (flurtemone)、甲基
 氟賽斯特 (fluthiacet)、氟賽醯胺 (fluthiamide)、福美
 沙芬 (fomesafen)、福拉殺福隆 (foramsulfuron)、福
 殺胺 (fosamine)、福立羅芬 (furyloxyfen)、格路福西
 內 (glufosinate) (—鉍)、格立福沙特 (glyphosate)
 (—異丙基鉍)、鹵沙芬 (halosafen)、甲基鹵殺福隆
 (halosulfuron) 及其酯 (例如甲酯, NC-319)、鹵斯弗
 (haloxyfop) 及其酯; 鹵斯弗-P (=R-鹵斯弗) 及其酯、
 環己基二甲胺基甲基三嗪二酮 (hexazinone)、甲基碼扎
 沙苯 (imazamethabenz)、嗎紫比 (imazapyr)、嗎紫奎
 (imazaquin) 及鹽 (如鉍鹽)、嗎紫美沙比
 (imazamethapyr)、嗎紫莫 (imazamox)、嗎紫比克
 (imazapic)、嗎茲紫美紫比 (imazethamethapyr)、嗎茲
 紫比 (imazethapyr)、嗎殺福隆 (imazosulfuron)、印
 得諾非 (indanofan)、碘甲磺隆鈉鹽 (iodosulfuron-
 methyl sodium)、碘苯亞硝酸鹽 (ioxynil)、異卡醯胺
 (isocarbamid)、異樂靈 (isopropalin)、異丙土隆
 (isoproturon)、依索隆 (isouron)、依索苯 (isoxaben)
 、依索氯托 (isoxachlortole)、依索沙福托
 (isoxaflutole)、依索比立福 (isoxapyrifop)、卡靈草、
 累托芬 (lactofen)、環草定、利倫 (linuron)、MCPA、
 MCPB、甲氯丙酸、美芬司特 (mefenacet)、氟草磺
 (mefluidid)、甲基美索殺福隆 (mesosulfuron)、美索三
 酮 (mesotrione)、滅得群 (metamitron)、美他佐克羅

(72)

(metazachlor) 、啞隆、威百畝、滅草定、甲氧基酚酮 (methoxyphenone) 、甲基代隆 (methyldymron) 、美他苯隆 (metabenzuron) 、美索苯隆 (methobenzuron) 、秀谷隆、(α -) 美托克羅 (metolachlor) 、美托沙泣 (metosulam) (XRD 511) 、美托斯隆 (metoxuron) 、賽克津、甲基美殺福隆 (metsulfuron) 、MH、莫立那特 (molinate) 、莫那立得 (monalide) 、單尿素二氫硫酸酯 (monocarbamide dihydrogensulfate) 、莫若林那隆 (monolinuron) 、滅草隆、MT 128 (即 6- 氯基 - N- (3- 氯基 - 2- 丙烯基) - 5- 甲基 - N- 苯基 - 3- 噻噲胺) 、MT 5950 (即 N- [3- 氯基 - 4- (1- 甲基乙基) - 苯基] - 2- 甲基戊胺) 、那普苯胺 (naproanilide) 、那普醯胺 (napropamide) 、抑草生、NC 310 (即 4- (2,4- 二氯苯甲醯基) - 1- 甲基 - 5- 苯甲氧基吡啶) 、草不隆、尼可殺福隆 (nicosulfuron) 、尼比拉西芬 (nipyraclifen) 、磺樂靈、除草醚 (nitrofen) 、硝基弗芬 (nitrofluorfen) 、達草滅、奧貝卡 (orbencarb) 、黃草消 (oryzalin) 、奧沙地奇 (oxadiargyl) (RP - 020630) 、惡草靈 (oxadiazon) 、氧殺福隆 (oxasulfuron) 、奧沙立克美弗 (oxaziclomefone) 、奧氟芬 (oxyfluorfen) 、對草快、克草猛、壬酸、培那西林 (pendimethalin) 、噴托啞 (pentoxazone) 、氟草磺胺 (perfluidone) 、非尼索發 (phenisopham) 、苯敵草、毒莠定、比可林那芬 (picolinafen) 、派羅福 (piperophos

(73)

) 、 比 利 布 替 卡 (piributicarb) 、 丁 基 比 立 芬 諾 (pirifenop) 、 普 立 拉 克 (pretilachlor) 、 撲 滅 磺 甲 酯 (primisulfuron) 、 普 羅 卡 巴 酮 (procarbazon) — (鈉) 、 普 羅 西 井 (procyazine) 、 普 魯 二 胺 (prodiamine) 、 撲 氟 拉 林 (profluralin) 、 乙 基 普 羅 格 立 井 (proglinazine) 、 撲 滅 通 、 撲 草 淨 、 毒 草 安 、 敵 稗 、 西 帕 奎 (propaquizafop) 及 其 酯 、 撲 滅 津 、 苯 胺 靈 、 普 羅 比 索 克 (propisochlor) 、 氯 甲 丙 炔 基 苯 甲 醯 胺 (propyzamide) 、 撲 殺 發 林 (prosulfalin) 、 撲 沙 福 卡 (prosulfocarb) 、 撲 沙 殺 福 隆 (prosulfuron) (CGA-152005) 、 普 立 那 克 羅 (prynachlor) 、 乙 基 比 拉 福 拉 芬 (pyraflufen) 、 吡 啶 林 特 (pyrazolate) 、 殺 草 敏 、 乙 基 必 拉 若 殺 福 隆 (pyrazosulfuron) 、 比 拉 若 西 芬 (pyrazoxyfen) 、 比 立 貝 若 西 (pyribenzoxim) 、 比 立 布 替 卡 (pyributicarb) 、 比 立 達 弗 (pyridafol) 、 比 達 特 (pyridate) 、 甲 基 比 立 米 巴 克 (pyrimidobac) 、 比 立 塞 巴 克 (pyriothobac) (— 鈉) (KIH-2031) 、 比 羅 斯 弗 (pyroxyfop) 及 其 酯 (例 如 炔 丙 酯) 、 昆 多 拉 克 (quindorac) 、 昆 美 拉 克 (quinmerac) 、 奎 諾 克 胺 (quinochloramine) 、 奎 諾 弗 (quinoxifop) 及 其 酯 衍 生 物 、 奎 拉 弗 (quizalofop) 和 奎 拉 弗 — P 及 彼 之 酯 衍 生 物 (例 如 , 乙 基 奎 拉 托 弗 (quizalofop) 、 丁 基 — 及 乙 基 — 奎 拉 托 弗 P 、 瑞 立 達 隆 (renniduron) 、 力 殺 福 隆 (rimsulfuron) (DPX-E9636) 、 S 275 (即 2-[4-氯基-2-氟基-5-(2-丙炔氧

(74)

基) 苯基]-4,5,6,7-四氫-2H-咪唑)、塞克布美酮 (secbuneton)、稀禾定 (sethoxydim)、環草隆 (siduron)、西瑪三秦 (simazine)、西草淨 (simetryn)、SN 106279 (即 2-[[7-[2-氨基-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-萘基]氧基]丙酸及其甲酯)、硫可三酮 (sulcotrione)、沙芬曲諾 (sulfentrazon) (FMC-97285, F-6285)、沙發拉隆 (sulfazuron)、甲基殺福美隆 (sulfometuron)、沙弗司特 (sulfosate) (ICI-A0224)、殺福沙代隆 (sulfosulfuron)、TCA、替布他 (tebutam) (GCP-5544)、替布塞隆 (tebuthiuron)、提普拉斯地 (tepraloxym) 、特草定、特布卡 (terbucarb)、特布克羅 (terbuchlor)、甲氧去草淨、特丁津、去草淨、TFH 450 (即 N,N-二乙基-3-[(2-乙基-6-甲基苯基)磺基]-1H-1,2,4-三唑-1-羧酰胺)、西尼克羅 (thenylchlor) (NSK-850)、塞福路酰胺 (thiafluamide)、塞殺福隆 (thiazafluron)、塞諾比 (thiazopyr) (Mon-13200)、塞地吡立米 (thidiazimin) (SN-24085)、甲基塞吩殺福隆 (thifensulfuron)、塞歐苯卡 (thiobencarb)、替歐卡巴力 (tiocarbamil)、曲考昔地 (tralkoxydim)、野麥畏 (triallate)、三阿蘇殺福隆 (triasulfuron)、曲吡立福拉 (triaziflam)、曲吡諾芬酰胺 (triazofenamide)、甲基三苯那隆 (tribenuron)、定草酯 (triclopyr)、曲地吩 (tridiphan) 、草達津、氟樂靈、三氟殺福隆 (triflusulfuron) 及其

(75)

酯（例如，甲基酯，DPX-66037）、曲美他隆（trimeturon）、曲托殺福隆（tritosulfuron）、替斯托的弗（tsitodef）、滅草猛、WL 110547（即 5-苯氧基-1-[3-苯基-3-1H-（三氟甲基）-1H-四唑]、UBH-509、D-489、LS 82-556、KPP-300、NC-324、NC-330、KH-218、DPX-N8189、SC-0774、DOWCO-535、DK-8910、V-53482、PP-600、MBH-001、KIH-9201、ET-751、KIH-6127 及 KIH-2023。

以選擇控制之有害性植物對有用的植物及觀賞物之農作物特別有利。雖然根據本發明的化合物（I）已在許多農作物中展現非常好的充份選擇性，但是原則上有可能以植物毒性徵候群發生在一些農作物的耕作植物上，尤其也在與選擇性較低的其他除草劑之混合物的案例中。就此而論，根據本發明特別有利的化合物（I）之組合物係那些包括化合物（I）或彼與其他除草劑或殺蟲劑及安全劑之組合物。以作為解毒藥的這種劑量使用的安全劑減低所使用之除草劑／殺蟲劑之植物毒性副作用，例如，在重要的經濟農作物中，如穀類（如小麥、大麥、黑麥、燕麥、高粱及玉蜀黍）、甜菜、甘蔗、油菜籽，棉花和大豆，以穀類較佳。

下列的化合物類別係適合於化合物（I）及彼與更多殺蟲劑之組合物的安全劑實例：

a) 二氯苯基吡啶啉-3-羧酸類型之化合物，如 1-（2,4-二氯苯基）-5-（乙氧羰基）-5-甲基-2-吡

(76)

唑啉 - 3 - 羧酸乙酯 (S1 - 1) (“二乙基美芬必 (mefenpyr) ”) , “The Pesticide Manual”, 第 12 版 , 2000, No. 492, pp.594 - 595) 及如 WO 91 / 07874 所述之相關化合物之類的化合物較佳 ;

b) 二氯苯基吡唑羧酸衍生物 , 如 1 - (2,4 - 二氯苯基) - 5 - 甲基吡唑 - 3 - 羧酸乙酯 (S1 - 2) , 1 - (2,4 - 二氯苯基) - 5 - 異丙基吡唑 - 3 - 羧酸乙酯 (S1 - 3) , 1 - (2,4 - 二氯苯基) - 5 - (1,1 - 二甲乙基) 吡唑 - 3 - 羧酸乙酯 (S1 - 4) , 1 - (2,4 - 二氯苯基) - 5 - 苯基吡唑 - 3 - 羧酸乙酯 (S1 - 5) 及如 EP - A - 333 131 和 EP - A - 269 806 所述之相關化合物之類的化合物較佳 ;

c) 三唑羧酸類型之化合物 , 如芬克羅拉唑 (fenchlorazole) (及其乙酯) (即 1 - (2,4 - 二氯苯基) - 5 - 三氯甲基 - (1H) - 1,2,4 - 三唑 - 3 - 羧酸乙酯 (S1 - 6) 及相關化合物 (參考 EP - A - 174 562 和 EP - A - 346 620) 之類的化合物較佳 ;

d) 5 - 苯甲基 - 或 5 - 苯基 - 2 - 異噁唑啉 - 3 - 羧酸類型或 5,5 - 二苯基 - 2 - 異噁唑啉 - 3 - 羧酸類型之化合物 , 如 5 - (2,4 - 二氯苯基) - 2 - 異噁唑啉 - 3 - 羧酸乙酯 (S1 - 7) 或 5 - 苯基 - 2 - 異噁唑啉 - 3 - 羧酸乙酯 (S1 - 8) 及如在 WO 91 / 08202 所述之相關化合物 , 或 5,5 - 二苯基 - 2 - 異噁唑啉羧酸乙酯 (S1 - 9) (乙基伊索地芬 (isoxadifen)) 或 5,5 - 二苯基 - 2 - 異噁唑啉羧酸正丙酯 (S1 - 10) 或 5 - (4 - 氟苯基) - 5 - 苯基 - 2

(77)

— 異噁唑啉 - 3 - 羧酸乙酯 (S1 - 11) (如德國專利申請案 (WO - A - 95 / 07897) 所述) 之類的化合物較佳 ;

e) 8 - 喹啉氧基醋酸類型 (2S) 之化合物 , 以 (5 - 氯基 - 8 - 喹啉氧基) 醋酸 1 - 甲基己 - 1 - 酯 (常稱為 “ 康奎寧 (cloquintocet - mexyl) ” (S2 - 1) (參考 “The Pesticide Manual”, 第 12 版 , 2000, No.195, pp.264 - 264)

、

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧基) 醋酸 1,3 - 二甲基丁 - 1 - 酯 (S2 - 2) 、

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧基) 醋酸 4 - 丙烯氧基丁酯 (S2 - 3) 、

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧基) 醋酸 1 - 丙烯氧基丙 - 2 - 酯 (S2 - 4) 、

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧基) 醋酸乙酯 (S2 - 5) 、

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧基) 醋酸甲酯 (S2 - 6) 、

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧基) 醋酸烯丙酯 (S2 - 7) 、

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧基) 醋酸 2 - (2 - 丙叉亞胺氧基) - 1 - 乙酯 (S2 - 8) 、

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧基) 醋酸 2 - 氧基丙 - 1 - 酯 (S2 - 9)

及如 EP - A - 86 750 , EP - A - 94 349 和 EP - A - 191 736 或 EP - A - 0 492 366 所述之相關化合物較佳 ;

f) (5 - 氯基 - 8 - 喹啉氧基) 丙二酸類型之化合物

(78)

，以如（5-氯基-8-喹啉氧基）丙二酸二乙酯、（5-氯基-8-喹啉氧基）丙二酸二烯丙酯、（5-氯基-8-喹啉氧基）丙二酸甲乙酯及如 EP-A-0 582 198 所述之相關化合物之類的化合物較佳；

g) 苯氧基醋酸或苯氧基丙酸衍生物類型或芳族羧酸類型之活性物質，如例如，

2,4-二氯苯氧基醋酸（及其酯）（2,4-D）、

4-氯基-2-甲基丙氧基丙酸酯（甲氯丙酸）、
MCPA 或

3,6-二氯基-2-甲氧基苯甲酸（及其酯）（殺草畏）；

h) 嘧啶類型之活性物質，其係在稻米中作為土壤作用安全劑使用，如例如，

“芬克羅力（fencloirim）”（“The Pesticide Manual”，第 12 版，2000，No.325，pp.386-387）（=4,6-二氯基-2-苯基嘧啶），也已知以其作為在種稻中的普立拉克之安全劑；

i) 二氯乙醯胺類型之活性物質，通常以其作為萌芽前安全劑（土壤作用安全劑）使用，例如，

“地克羅米（dichlormid）”（“The Pesticide Manual”，第 12 版，2000，No.225，pp.270-271）（=N,N-二烯丙基-2,2-二氯乙醯胺），

“R-29148”（=3-二氯乙醯基-2,2,5-三甲基-1,3-噁唑啉，取自 Stauffer），

(79)

“苯諾殺克 (benoxacor)” (“The Pesticide Manual”, 第 12 版, 2000, No.65, pp.74-75) (=4-二氯乙醯基-3,4-二氫-3-甲基-2H-1,4-苯並噁吡),

“PPG-1292” (=取自 PPG 工業之 N-烯丙基-N-[(1,3-二噁茂烷-2-基)甲基]二氯乙醯胺),

“DK-24” (=取自 Sagro-Chem 之 N-烯丙基-N-[(丙烯基胺羰基)甲基]二氯乙醯胺),

“AD-67”或“MON 4660” (=分別取自 Nitrokemia 或 Monsanto 之 3-二氯乙醯基-1-氧雜-3-氮雜螺旋[4,5]癸烷),

“地克羅諾 (diclonon)”或“BAS145138”或“LAB145138” (=取自 BASF 之 3-二氯乙醯基-2,5,5-三甲基-1,3-二氮雜雙環[4.3.0]壬烷) 及

“福力拉若 (furilazol)”或“MON 13900” (參考“The Pesticide Manual”, 第 12 版, 2000, No.401, pp.482-483) (= (RS)-3-二氯乙醯基-5-(2-呋喃基)-2,2-二甲基噁唑啉);

j) 二氯丙酮衍生物類型之活性物質, 如例如,

“MG 191” (CAS-註冊編號.96420-72-3) (=取自 Nitrokemia 之 2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二噁茂烷), 已知其係作為玉米之安全劑;

k) 氧基亞胺基化合物類型之活性物質, 已知其係作為種子處理產物, 如例如,

“噁貝替尼 (oxabetilnil)” (“The Pesticide Manual”,

(80)

第 12 版，2000，No.577，pp.689）（=（Z）-1,3-二噁茂烷-2-基甲氧基亞胺基（苯基）乙腈），已知其係作為高粱及玉黍蜀之抗美托克羅損害之種子處理安全劑，

“福拉噁芬尼（fluxofenim）”（“The Pesticide Manual”，第 12 版，2000，No.389，pp.467-468）（=1-（4-氯苯基）-2,2,2-三氟基-1-乙酮 O-（1,3-二噁茂烷-2-基甲基）腈），已知其係作為高粱及玉黍蜀之抗美托克羅損害之種子披護安全劑及

“西美去尼（cyometrinil）”或“-CGA-43089”（“The Pesticide Manual”，第 12 版，2000，No.974，pp.983）（=（Z）-氰基甲氧基亞胺基（苯基）乙腈），已知其係作為高粱及玉黍蜀之抗美托克羅損害之種子處理安全劑；

1) 噁唑羧酸酯類型之活性物質，已知其係作為種子處理產物，如例如，

“福拉諾（flurazol）”（“The Pesticide Manual”，第 12 版，2000，No.376，pp.450-451）（=2-氯基-4-三氟甲基-1,3-噁唑-5-羧酸苯甲酯），已知其係作為高粱及玉黍蜀之抗拉草及美托克羅損害之種子處理全全劑；

m) 萘二羧酸衍生物類型之活性物質，已知其係作為種子處理產物，如例如，

“萘酸酐”（“The Pesticide Manual”，第 12 版，2000，No.1249，pp.1009-1010）（=1,8-萘二羧酸酐），已知其係作為玉米的抗硫代胺基甲酸酯除草劑損害之種子處理安全劑。

(81)

n) 色滿醋酸衍生物類型之活性物質，如例如，

“CL304415” (CAS-註冊號 31541-57-8) (=取自美國氰胺的 2-(4-羧基色滿-4-基)醋酸)，已知其係作為玉米之抗咪唑啉酮損害之安全劑；

o) 除了抗有害植物之除草作用之外，也在相關農作植物中(如稻米)展現安全劑作用之活性物質，如例如，

“哌草丹”或“MY-93”(“The Pesticide Manual”,第12版, 2000, No.251, pp.302-303) (=S-1-甲基-1-苯乙基哌啶-1-硫代羧酸酯)，已知其係作為稻米抗除草劑莫立那特損害之安全劑，

“殺草隆”或“SK23”(“The Pesticide Manual”,第12版, 2000, No.207, pp.247) (=1-(1-甲基-1-苯乙基)-3-對-甲苯尿素)，已知其係作為稻米抗除草劑嗎殺福隆損害之安全劑，

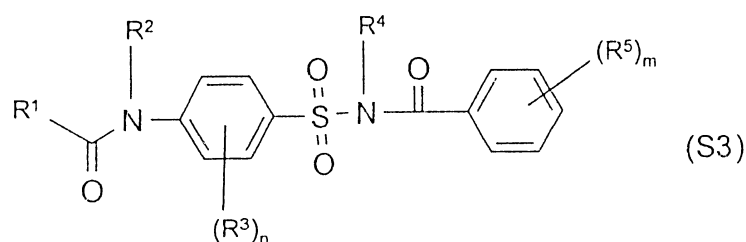
“庫密路若”=“JC-940”(=3-(2-氯苯基甲基)-1-(1-甲基-1-苯乙基)尿素(參考 JP-A-60087254))，已知其係作為稻米抗數種除草劑損害之安全劑，

“甲氧基酚酮”或“NK049”(=3,3'-二甲基-4-甲氧基二苯甲酮)，已知其係作為稻米抗數種除草劑損害之安全劑，

“CSB”(=1-溴-4-(氯甲基磺醯基)苯)(CAS-註冊編號-54091-06-4, 取自 Kumiai)，已知其係作為稻米抗數種除草劑損害之安全劑；

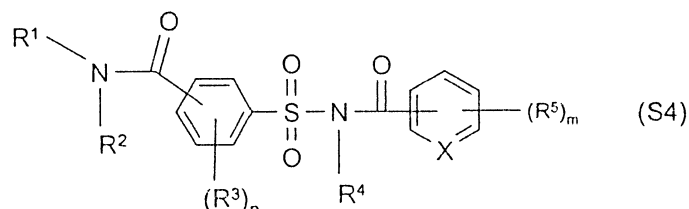
(82)

p) 式 (S3) 之 N-醯基磺醯胺類及彼之鹽類

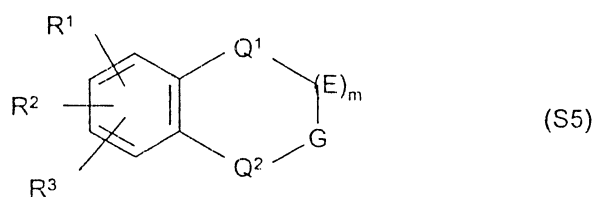


如 WO-A-97/45016 的說明；

q) 式 (S4) 之醯基胺磺醯基苯醯胺，若適當時，也具有鹽形式，



如國際申請案第 PCT/EP98/06097 號的說明；及式 (S5) 之化合物，



如 WO-A-98/13361 的說明；

包括在農業中照例的立體異構物及鹽類。

在所述之安全劑之中，以那些 (S1-1) 及 (S1-9) 和 (S2-1) 特別有利，特別係 (S1-1) 及 (S1-9)。

已知以一些安全劑作為除草劑，除了關於有害植物的殺草作用之外，同時顯示關於農作植物的保護作用。

(83)

除草劑（混合物）對安全劑的重量比通常憑除草劑的噴灑量及討論中安全劑功效而定；其可在寬限度內改變，例如在從 200:1 到 1:200 之範圍內，以從 100:1 到 1:100 較佳，特別係 20:1 到 1:20。可將安全劑與更多的除草劑／殺蟲劑以類似於化合物（I）或彼之混合物的方式調配，並提供及作為與除草劑一起預拌或筒裝混合物使用。若適當時，將以照例的商品形式存在的除草劑或除草劑安全劑調配物以照例的方式稀釋，以供使用，例如，在可濕性粉劑、可乳化濃縮物、分散液及水分散性顆粒之情況中使用水。散劑、土壤用顆粒、散佈用顆粒及噴霧溶液經常不在使用之前以其他惰性物質進一步稀釋。

式（I）化合物所需之噴灑量特別隨外在條件而改變，如溫度，濕氣及所使用之除草劑類型。其可在寬限度內改變，例如，在介於 0.001 至 10.0 公斤／公頃之間或更多的活性物質，但是以介於 0.005 至 5 公斤／公頃之間較佳，特別係介於 0.01 至 3 公斤／公頃之間。

【實施方式】

A. 化學實例

實例 1

2-胺基-4-(5,7-二甲基-1,2,3,4-四氫萘-1-胺基)-1,3,5-三吡

a) 將 27.0 公克 (0.13 毫莫耳) 1-胺基-5,7-二甲

(84)

基 - 1,2,3,4 - 四氫萘鹽酸與 11.5 公克 (0.13 毫莫耳) 氰基胍均勻化，並溶解在 60 毫升 1,2 - 二氯苯中。將該混合物在 140 - 160℃ 下加熱 150 分鐘，開始得到均勻的混合物，但是該混合物經一段時間會再分離。在冷卻及加入 100 毫升甲苯之後，以抽氣過濾有可能獲得 40.0 公克 (94% 之純度大於 90% 的理論值) 1 - 二胍基 - 5,7 - 二甲基 - 1,2,3,4 - 四氫萘鹽酸，熔點 215 - 216℃。

b) 將 3.70 公克 (0.013 毫莫耳) 1 - 二胍基 - 5,7 - 二甲基 - 1,2,3,4 - 四氫萘鹽加入在 50 毫升甲醇中的 1.01 公克 (0.044 毫莫耳) 鈉之溶液中。接著加入 3.7 公克 (0.03 毫莫耳) 甲酸乙酯，並將混合物在 25℃ 下攪拌 15 小時。將水及二氯甲烷加入反應混合物中，將有機相分離及將水相以二氯甲烷萃取兩次以上。在每一個情況中，將有機相分離及將合併的有機相以硫酸鈉乾燥。將乾燥劑過濾及將二氯甲烷相濃縮。以使用醋酸乙酯移動相之矽膠管柱色層分離法的分離作用得到 2.3 公克 (62% 之 90% 純度的理論值) N2 - (5,7 - 二甲基 - 1,2,3,4 - 四氫 - 1 - 萘基) - 1,3,5 - 三吡 - 2,4 - 二胺，熔點 178 - 180℃。

以類似於以上的實例 1 的方式獲得在表 1 及 2 中所說明的化合物。

在表中：

No. = 實例或實例編號

m.p. = 以℃計之溫度

state = 凝聚狀態或其它資料 (稠度等)

(85)

Me = 甲基

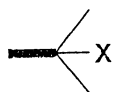
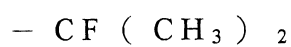
Et = 乙基

Pr = 丙基

i-Pr = 異丙基

X-i-Pr = 經取代之異丙基

例如，F-I-Pr=氟基異丙基，即下式之



c-Pr = 環丙基

1-Me-c-Pr = 1-甲基環丙基 =

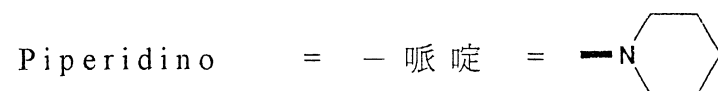
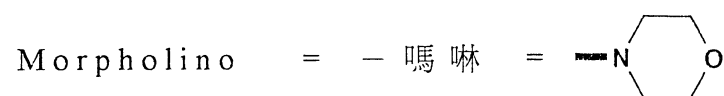
t-Bu = 特丁基

Ph = 苯基

Bz = 苯甲基

Ac = 乙醯基

Numbers = 在雙環上的第一個取代基表示具有相同號碼 n 之取代基 Xⁿ 之位置

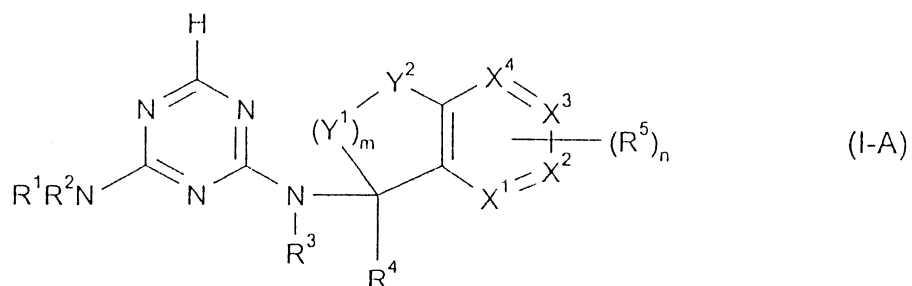


註明：

以實線表示在每一個情況中的基附著點。

(86)

表 1: 式 (I-A) 化合物



No.	NR¹R²	R³	R⁴	-X¹=X²-X³=X⁴-	(R⁵) _n	(Y¹) _m	Y²	State/m.p. (°C)
1	NH₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH₂-CH₂-	-CH₂-	178-180
2	NH₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CMeH-CH₂-	-CH₂-	
3	NH₂	H	H	-C=C-S-	2-Me	-CH₂-CH₂-	-CH₂-	
4	NH₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH₂-CH₂-	-O-	119-121
5	NH₂	H	H	-C=C-C=C-	4-Me	-CH₂-CH₂-	-O-	106-108
6	NH₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Me	-CH₂-CH₂-	-O-	
7	NH₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH₂-CH₂-	-NMe-	
8	NH₂	H	H	-C=C-C=C-	4-Me	-CH₂-CH₂-	-NMe-	
9	NHC(=O)-CH₂- CH₂-Cl	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH₂-CH₂-	-NMe-	
10	NHC(=O)-CH₂- CH₂-Cl	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH₂-CH₂-	-C(=O)-	
11	NH₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH₂-CH₂-	C(=O)-	
12	NHC(=O)-CH₂- OCH₃	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH₂-CH₂-	C(=O)-	
13	NHC(=O)-CH₂- OCH₃	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH₂-CH₂-	CHOH	
14	NH₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH₂-CH₂-	CHOH	
15	NHC(=O)-CH₃	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH₂-CH₂-	CHOH	
16	NH₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 2-Me, 4-Me	-CH₂-CH₂-	-CH₂-	

(87)

No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ -	(R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
17	NHC(=O)-CH ₃	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 2-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-CH ₂ -	
18	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-CH ₂ -	
19	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-CH ₂ -	208 - 211
20	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-F, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-CH ₂ -	
21	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-Cl, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-CH ₂ -	
22	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Et	-CH ₂ -CH ₂ -	-CH ₂ -	
23	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Et, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-CH ₂ -	
24	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-(1'-fluoro)- Et, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-CH ₂ -	
25	NHMe	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-CH ₂ -	
26	NMe ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-CH ₂ -	
27	NMe(CO)Me	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-CH ₂ -	
28	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-F, 4-Me	-CMeH-CH ₂ -	-CH ₂ -	
29	NMeH	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CMeH-CH ₂ -	-CH ₂ -	
30	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	solid foam
31	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
32	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	solid foam
33	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 3-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	solid foam
34	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
35	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-Me, 4-Me	-CH ₂ -	-O-	
36	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Me	-CH ₂ -	-O-	
37	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -	-O-	
38	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CH ₂ -	-O-	184-190
39	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CH ₂ -	-NMe-	

(88)

No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ -	(R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
40	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -	-NMe-	
41	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 2-Me	-CH ₂ -	-NMe-	
42	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 3- OMe 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-NMe-	
43	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 2-Me	-CH ₂ -	- CHMe-	
44	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CH ₂ -	- CHMe-	
45	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-Me	-CH ₂ -	- CHMe-	
46	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-Me, 4-Me	-CH ₂ -	- CHMe-	
47	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -	- CHMe-	
48	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CHMe-	- CHMe-	
49	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CHMe-	- CHMe-	
50	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Me	-CHMe-	- CHMe-	
51	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Et	-CHMe-	- CHMe-	
52	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Et	-CHMe-	- CHMe-	
53	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-(1'-fluoro)- Et	-CHMe-	-CH ₂ -	
54	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-(1'-fluoro)- Et	-CHMe-	-CH ₂ -	
55	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CHMe-	-CH ₂ -	
56	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-F	-CHMe-	-CH ₂ -	
57	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Cl	-CHMe-	-CH ₂ -	
58	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-Cl	-CHMe-	-CH ₂ -	177 - 179

(89)								
No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ -	(R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
59	NMe ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CHMe-	-CH ₂ -	
60	NHC(=O)Me	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CHMe-	-CH ₂ -	
61	NMeC(=O)Me	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CHMe-	-CH ₂ -	
62	NHC(=O)CH ₂ - OMe	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CHMe-	-CH ₂ -	
63	NHC(=O)CF ₃	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CHMe-	-CH ₂ -	
64	NHC(=O)CH ₂ - CH ₂ -Cl	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CHMe-	-CH ₂ -	
65	NHC(=O)CH=C H ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CHMe-	-CH ₂ -	
66	NHC(=O)Ph	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CHMe-	-CH ₂ -	
67	NHC(=O)Me	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CH ₂ -	-CH ₂ -	
68	NMeC(=O)Me	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CH ₂ -	-CH ₂ -	
69	NHC(=O)CH ₂ - OMe	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CH ₂ -	-CH ₂ -	
70	NHC(=O)CF ₃	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CH ₂ -	-CH ₂ -	
71	NHC(=O)CH ₂ - CH ₂ -Cl	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CH ₂ -	-CH ₂ -	
72	NHC(=O)CH=C H ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CH ₂ -	-CH ₂ -	
73	NHC(=O)Ph	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CH ₂ -	-CH ₂ -	
74	NMe ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CH ₂ -	-CH ₂ -	
75	Morpholino	H	H	-C=C-C=C-	3-F	-CH ₂ -	-CH ₂ -	
76	NHAc	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-S-	
77	NHNH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-S-	
78	NHpiperidino	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-S-	
79	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-S-	114 - 116
80	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 2-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-S-	

(90)

No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ - (R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
81	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1Me, 3-Me	-CH ₂ -CHMe-	-S-
82	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -	-S-
83	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CMeH-CH ₂ -	-S-
84	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	4-Me	-CH ₂ -CHPh-	-S-
85	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Me	-CH ₂ -CMe ₂ -	-S-
86	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-F, 3-F	-CH ₂ -	-S-
87	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-Me	-CH ₂ -	-S-
88	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Me	-CH ₂ -	-S-
89	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Cl	-CH ₂ -	-S-
90	NMe ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -	-S-
91	Morpholino	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-SO ₂ -
92	NHAc	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -	-S-
93	NHNH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -	-S-
94	NHPiperidino	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -	-S-
95	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -	-S-
96	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-F	-CH ₂ -	-S-
97	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1Me, 3-OMe	-CH ₂ -	-S-
98	NMe ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -	-O-
99	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CMeH-CH ₂ -	-O-
100	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	4-Me	-CH ₂ -CHPh-	-O-
101	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Me	-CH ₂ -CMe ₂ -	-O-
102	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-F, 3-F	-CH ₂ -	-O-
103	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -	-O-
104	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Me	-CH ₂ -	-CO-

(91)

No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ -	(R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
105	NHMe	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -	-O-	
106	NMe ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -	-O-	
107	Morpholino	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
108	NHAc	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -	-O-	
109	NHNH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -	-O-	
110	NHPiperidino	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -	-O-	
111	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CMeH-	-O-	
112	NH ₂	Me	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -	-O-	
113	NH ₂	H	Me	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -	-O-	
114	NH ₂	H	Me	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
115	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 2- OMe, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
116	NHMe	H	H	-C=C-C=C-	4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
117	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 2-OEt, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
118	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-F, 3-F	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
119	NH ₂	H	-CH ₂ - OMe	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
120	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-OEt, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
121	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
122	NMe ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
123	Morpholino	Me	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
124	NHAc	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
125	NHNH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
126	NHPiperidino	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	

(92)

No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ -	(R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
127	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 3-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
128	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
129	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1Me, 3-Me	-CH ₂ -CHMe-	-O-	
130	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-NH-	
131	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-NMe-	
132	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-NH-	
133	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-NAc-	
134	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-F, 3-F	-CH ₂ -CH ₂ -	-NBz-	
135	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-NH-	
136	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-N(=O)-	
137	NH ₂	H	H	-C=N-C=N-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-NH-	
138	NMe ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-NPh-	
139	Morpholino	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-NEt-	
140	NHAc	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-N-i-Pr-	
141	NHNH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-N- n-Pr-	
142	NHPiperidino	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-NH-	
143	NH ₂	H	H	-S-C=C-	4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-NH-	
144	NH ₂	H	H	-C=C-S-	1-Me,	-CH ₂ -CH ₂ -	-NH-	
145	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1Me, 3-Me	-CH ₂ -CHMe-	-NPh-	
146	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	solid foam
146- R	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	141-143; opt. rot.: 93.1°, c=1, CHCl ₃ , 22°C; EE: 95.7 %

(93)

No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ -	(R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
146-	NH ₂ S	H	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	141-143; opt. rot.: - 94.4°, c=1, CHCl ₃ , 22°C; EE: 90.2 %
147	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Et	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
148	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-i-Pr	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
149	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-OMe, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
150	NH-Piperidino	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
151	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Ph	-CH ₂ -	-O-	
152	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-F, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
153	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Ph	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
154	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 3-Cl, 4-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
155	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
156	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-F	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
157	NH ₂	Me	Me	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
158	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Et, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
159	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-i-Pr, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
160	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CMeH-CH ₂ -	-	127-129
161	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
162	NHC(=O)-CH ₂ - CH ₂ -Cl	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
163	NH ₂	Ac	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
164	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 3-F	-CH ₂ -CH ₂ -	-	108-115
165	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Cl, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	

(94)

No.	NR^1R^2	R^3	R^4	$-\text{X}^1=\text{X}^2-\text{X}^3=\text{X}^4-$	$(\text{R}^5)_n$	$(\text{Y}^1)_m$	Y^2	State/m.p. (°C)
166	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2- CH_2-CH_2- CH_2-3	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
167	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	3-Et	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
168	NH_2	H	H	$-\text{O}-\text{C}=\text{C}-$	3-Me	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
169	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	1-Me, 3-Et	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
170	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	1-Me, 3-Me	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
171	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-Me, 4-Me	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
172	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	1-Me, 3-Me, 4-Me	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
173	NH_2	H	H	$-\text{N}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-Me, 4-Me	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
174	NH_2	H	H	$-\text{N}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	3-Me	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
175	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{N}-$	1-Me, 3-Me	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
176	NH_2	Me	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-Me	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
177	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-Et, 3-Me	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
178	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	3-COOMe	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
179	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-COOEt	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
180	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2- CF_3	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
181	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-c-propyl	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
182	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2- CClF_3	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
183	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	1-Me, 2-Me, 3-Me	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
184	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2- CH_2-OMe	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
185	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	H	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	183-185
185- R	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	H	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	149-151; opt. rot.: 93.3°, c=1, CHCl_3 , 21°C;

(95)

No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ -	(R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
185-	NH ₂ S	H	H	-C=C-C=C-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	149-151; opt. rot.: -84.6°, c=1, CHCl ₃ , 21°C;
186	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Ac	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
187	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Ac, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
188	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-CN	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
189	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Ph	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
190	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-(2-thienyl)	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
191	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	4-Ph	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
192	NHPh	H	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
193	NH ₂	Ph	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
194	NH ₂	C(=O)- CH ₂ - OMe	H	-C=C-C=C-	1-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
195	NHBz	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
196	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 2-F, 4- Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
197	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-F, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	122-123
198	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	H	-CHMe-CH ₂ -	-	103-105
199	NH ₂	CH ₂ - OMe	H	-C=C-C=C-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
200	NH ₂	CH ₂ - CH ₂ - OMe	H	-C=C-C=C-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
201	NH ₂	Ac	H	-C=C-C=C-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
202	NH ₂	H	H	-S-C=C-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
203	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	H	-CH ₂ -	-O-	188-192
204	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-OH	-CH ₂ -CH ₂ -	-	

(96)

No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ -	(R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
205	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-CH=CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
206	NH ₂	Bz	H	-C=C-C=C-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
207	NH ₂	H	Me	-C=C-C=C-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
208	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-C≡CH	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
209	NH ₂	Ph	H	-C=C-C=C-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
210	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-C≡CH	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
211	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-CH=CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
212	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-CH=CH ₂	-CMeH-CH ₂ -	-	
213	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-I	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
214	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-I	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
215	NH ₂	CHO	H	-C=C-C=C-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
216	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Br	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
217	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-Br	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
218	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-NHCHO	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
219	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-NHAc	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
220	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-NHCO-Ph	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
221	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-NHPh	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
222	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Ph, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
223	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-O-Ph	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
224	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
225	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-OEt	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
226	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-O-i-Pr	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
227	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	4-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
228	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	4-OEt	-CH ₂ -CH ₂ -	-	

(97)

No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ -	(R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
229	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	4-O-i-Pr	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
230	NH ₂	H	H	-C=N-C=N	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
231	NH ₂	H	H	-N=C-N=C-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
232	NH ₂	H	H	-C=N-N=C-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
233	NH ₂	H	H	-N=C-C=N-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
234	NH ₂	H	H	-N=C-N=C-	2-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
235	NH ₂	H	H	-N=C-N=C-	2-CF ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
236	NH ₂	H	H	-N=C-N=C-	2-(1-fluoro)- Et	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
237	NH ₂	H	H	-N=C-N=C-	2-(1-fluoro)- i-Pr	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
238	NH ₂	H	H	-N=C-N=C-	4-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
239	NH ₂	H	H	-N=C-N=C-	2-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
240	NH ₂	H	H	-N=C-N=C-	2Me, 4-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
241	NH ₂	H	H	-N=C-N=C-	2-OMe, 4- OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
242	NHAc	H	H	-N=C-N=C-	2-OMe, 4- OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
243	NHAc	H	H	-N=C-C=C-	2-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
244	NH ₂	H	H	-N=C-C=C-	2-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
245	NH ₂	H	H	-N=C-C=C-	4-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
246	NH ₂	H	H	-C=C-C=N-	2-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
247	NH ₂	H	H	-C=C-C=N-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
248	NH ₂	CHO	H	-C=C-C=N-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
249	NH ₂	H	-CH ₂ - OMe	-C=C-C=C-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
250	NH ₂	H	Me	-C=C-C=C-	H	CH ₂	O	

(98)

No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ -	(R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
251	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	H	CH ₂	NMe	
252	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-Me	CH ₂	O	
253	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 4-F	CHMeCH ₂		
254	NH ₂	Me	COO-Me	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Cl	CH ₂ CPhH	O	
255	NH ₂	Me	CN	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	CH ₂	CH ₂	
256	NH ₂	Ac	Ac	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	CH ₂	CH ₂	
257	NH ₂	CHO	Me	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	CH ₂	CH ₂	
258	NMe ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	CH ₂	CH ₂	
259	NHCHO	CH ₂ O-Me	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-CF ₃	CH ₂	-	
260	Morpholino	Bz	Me	-C=C-C=C-	1-Me, 4-OMe	CH ₂ -CHMe	NMe	
261	Piperidino	H	H	-C=C-C=C-	3-OMe	CH ₂ -CH ₂	CHMe	
262	NHAc	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	CH ₂ -CHPh	-	
263	NHNH ₂	Me	H	-C=C-C=C-	3-Me, 4-Me	CH ₂ -CHMe	S	
264	NEt ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-Me, 4-Et	CHMe-CH ₂	S	
265	NHPh	H	H	-C=C-C=C-	2-Ac, 4-Me	CH ₂ -CH ₂	S	
266	NHBz	H	H	-C=C-C=C-	3-OPh	CH ₂ -CH ₂	S	
267	NHCOPh	H	H	-C=C-C=C-	3-OCOPh	CH ₂ -CH ₂	O	
268	NH ₂	4-Cl-Bz	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	CH ₂ -CH ₂	O	
269	NH ₂	H	Me	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	CH ₂ -CH ₂	S	
270	NH ₂	H	Et	-C=C-C=C-	2-Me, 4-OEt	CH ₂ -CH ₂	S	
271	NH ₂	H	H	-C=C-C=N-	2-Me	CH ₂ -CH ₂	S	
272	NH ₂	H	H	-C=C-C=N-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
273	NHMe	H	H	-N=C-N-	3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	

(99)

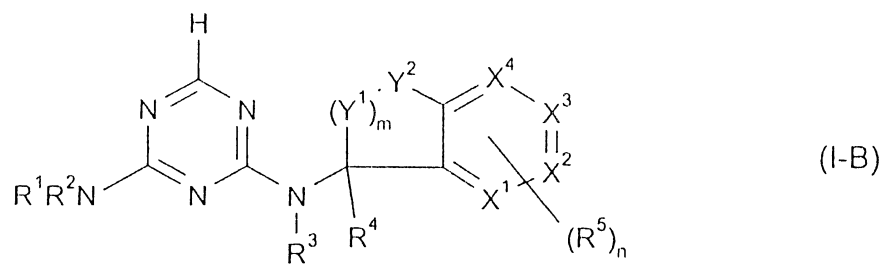
No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ - (R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
274	NHMe	H	H	-N=C-N-	2-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂
275	NH ₂	H	H	-N=C-N-	3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂
276	NH ₂	H	H	-N=C-N-	2-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂
277	NHMe	H	H	-N=C-N-	3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
278	NHMe	H	H	-N=C-N-	2-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
279	NH ₂	H	H	-N=C-N-	3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
280	NH ₂	H	H	-N=C-N-	2-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
281	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me,	-CHMe-CH ₂ -	- 198-200
282	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-F,	-CHMe-CH ₂ -	- 95-97
283	NHAc	H	H	-C=C-C=C-	2-F,	-CHMe-CH ₂ -	- 175-177
284	NHC(=O)CCl ₃	H	H	-C=C-C=C-	2-F,	-CHMe-CH ₂ -	-
285	NHC(=O)CF ₃	H	H	-C=C-C=C-	2-F,	-CHMe-CH ₂ -	- waxlike
286	NHC(=O)CH ₂ Cl	H	H	-C=C-C=C-	2-F,	-CHMe-CH ₂ -	- waxlike
287	NHC(=O)C ₂ H ₅	H	H	-C=C-C=C-	2-F,	-CHMe-CH ₂ -	-
288	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-F, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	O 96-99
289	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-F,	-CH ₂ -CH ₂ -	O 92-94
290	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me	-CHMe-CH ₂ -	- solid foam
291	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CHEt-CH ₂ -	- solid foam
292	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CMe ₂ -CH ₂ -	- 186-188
293	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 3-Me	-CHMe-CH ₂ -	- 155-160
294	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	4-Me	-CHMe-CH ₂ -	-
295	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂	O
296	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1,2-Me, 4-F	-CH ₂ -CH ₂ -	- 211 - 212
297	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1,4-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	- 210
297	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	- solid foam
297	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1,4-F	-CH ₂ -CH ₂ -	- 158-161

(100)

No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ - (R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
197	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-F, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	- 194-204
297	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2,3-F	-CH ₂ -CH ₂ -	- oil
297	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2,3,4-Me	-CHCH ₃ -	-CH ₂ - solid foam
298	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	4-OMe	-CH ₂ -	-O- solid foam
299	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1,2-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	- oil
300	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-Me, 4-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	- 217 - 218
301	NHC(=O)CH ₃	H	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O- 186-188
302	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O- 102-104
303	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	4-Me	-CHCH ₃ -	-CH ₂ - solid foam

(101)

表 2: 式 (I-B) 化合物



No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	=X ¹ -X ² =X ³ -X ⁴ =	(R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State / m.p. (°C)
B-1	NH ₂	H	H	=N-S-C=	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
B-2	NH ₂	H	H	=N-S-C=	4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
B-3	NH ₂	H	H	=N-S-C=	4-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
B-4	NH ₂	H	H	=N-O-C=	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
B-5	NH ₂	H	H	=N-O-C=	4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
B-6	NH ₂	H	H	=N-O-C=	4-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
B-7	NH ₂	H	H	=C-O-N=	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
B-8	NH ₂	H	H	=C-O-N=	2-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
B-9	NH ₂	H	H	=C-O-N=	2-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
B-10	NH ₂	H	H	=N-O-N=	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
B-11	NH ₂	H	H	=N-S-N=	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
B-12	NHMe	H	H	=N-S-C=	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
B-13	NH ₂	H	H	=N-S-C=	H	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	
B-14	NH ₂	H	H	=N-S-C=	4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	
B-15	NH ₂	H	H	=N-S-C=	4-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	
B-16	NH ₂	H	H	=N-O-C=	H	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	
B-17	NH ₂	H	H	=N-O-C=	4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	

(102)

No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	=X ¹ -X ² =X ³ -X ⁴ =	(R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State / m.p. (°C)
B-18	NH ₂	H	H	=N-O-C=	4-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	
B-19	NH ₂	H	H	=C-O-N=	H	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	
B-20	NH ₂	H	H	=C-O-N=	2-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	
B-21	NH ₂	H	H	=C-O-N=	2-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	
B-22	NH ₂	H	H	=N-O-N=	H	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	
B-23	NH ₂	H	H	=N-S-N=	H	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	
B-24	NHMe	H	H	=N-S-C=	H	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	

(103)

B. 調配實例

a) 散劑係藉由將 10 重量之份式 (I) 化合物與作為惰性物之 90 重量之滑石粉混合，以及在鏈磨機中粉碎混合物而獲得。

b) 可輕易分散在水中的可濕性粉末係藉由將 25 重量份之式 (I) 化合物、作為惰性物質之 64 重量份之含高嶺土之石英、10 重量份之木質素磺酸鉀及作為濕潤劑之 1 重量份之油烯基甲基牛磺酸鈉與分散劑混合，以及將混合物在固定型圓盤研磨機中研磨而獲得。

c) 可輕易分散在水中的分散液濃縮物係藉由將 20 重量份之式 (I) 化合物與 6 重量份之烷基酚聚乙二醇醚 (®Triton X 207)、3 重量份異十三醇聚乙二醇醚 (8EO) 及 71 重量份的石蠟礦物油 (例如，約 255 至超過 277°C 之沸騰範圍) 混合，以及將混合物在研磨球磨機中研磨成小於 5 微米細度而獲得。

d) 可乳化濃縮物係從 15 重量份之式 (I) 化合物，作為溶劑之 75 重量之環己酮及作為乳化劑之 10 重量份之氧乙基化壬酚而獲得。

e) 水分散性顆粒係藉將

75 重量份之式 (I) 化合物，

10 “ 木質素磺酸鹽鈣，

5 “ 肉桂基硫酸鈉，

3 “ 聚乙烯醇與

7 “ 高嶺土，

(104)

混合，將混合物在固定型圓盤研磨機研磨，以及將在流化床中的粉末噴霧在作為成粒液體之水上而而獲得。

f) 水分散性顆粒也藉由將

25 重量份之式 (I) 化合物，

5 “ 2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸鹽，

2 “ 油烯基甲基牛磺酸鈉，

1 重量份之聚乙烯醇，

17 重量份之碳酸鈣與

50 “ 水，

在膠體研磨機中均質化及預粉碎，接著將混合物在珠磨機中研磨，以及將所得懸浮液在噴霧塔以單一物質噴嘴裝置霧化及乾燥而獲得。

C. 生物實例

1. 萌芽前除草作用

將單子葉和雙子葉雜草植物之種子或塊莖片放置在塑膠盆的矽壤土中和以土壤覆蓋。接著將調配成可濕性粉末或乳化濃縮物形式之根據本發明的化合物以 600 到 800 公升水／公頃之噴灑量（轉化）噴灑成為不同劑量之水懸浮液或乳液至土壤覆蓋的表面上。

在處理之後，將盆子放入溫室內且維持在適合雜草生長的良好條件下。在未處理的控制品萌芽之後，以目測方式評等植物或芽之損害。試驗結果顯示根據本發明的化合物具有好的除萌芽前活性，以抵抗禾本科雜草及闊葉雜草

(105)

之廣效性。例如，在以萌芽前方法使用以每公頃計 0.5 公斤或更少的活性物之噴灑量時，則實例編號 1、4、5、19、55、58、79、146、185、198、281、282、283、285、286、288、289、290、291、292 及 293（參考表 1 及 2）在該試驗中顯示非常好的抗有害植物之除草作用，如抗歐白芥、紅黃草、燕麥、繁縷、台灣野稗、多花黑麥草、狗尾草屬、鵝絨草、反枝莧及黍稷。

2. 萌芽後除草作用

將單子葉和雙子葉雜草植物之種子或塊莖片放置在塑膠盆的砂壤土中，以土壤覆蓋及在良好的生長條件下的溫室中生長。在播種三週之後，在三葉階段時處理測試植物。將調配成可濕性粉末或乳液濃縮物的各種劑量之根據本發明的化合物以每公頃計 600 到 800 升水之噴灑量（轉換）噴霧在綠色的植物部分，並將試驗植物留置於在最適宜的生長條件下的溫室中約 3 到 4 個週之後，以目測方式評等製劑的效應，與未處理之控制物比較。根據本發明的組成物也具有好的除萌芽後活性，以抵抗在經濟上重要的禾本科雜草及闊葉雜草之廣效性。在以萌芽後方法使用以每公頃計 0.5 公斤或更少的活性物之噴灑量時，則實例編號 1、4、5、19、55、58、79、146、185、198、281、282、283、285、286、288、289、290、291、292 及 293（參考表 1 及 2）在該試驗中例如具有非常好的抗有害植物之除草作用，如抗歐白芥、台灣野稗、多花黑麥草、紅黃草、

(106)

狗尾草屬、鵝絨草、反枝莧、黍稷及燕麥。

3. 在稻米中的抗有害植物之作用

將在封閉的塑膠盆中經移植和播種的稻米雜草及典型的稻米雜草（闊葉和禾本科雜草）在溫室中及在稻田米的條件下（水之溢流量：2－3公分）生長，直到彼長成三－葉階段（稗（*Echinochloa*，1.5－葉）爲止。接著將彼以根據本發明的化合物處理。就此目的而言，將調配的活性物懸浮，溶解或乳化在水中，並以傾倒噴灑的方式將各種劑量噴灑試驗植物的稻田水中。在以該方式完成處理之後，將試驗植物放入最適宜的生長條件下的溫室中及在整個實驗期以此方式維持不變。

在噴灑之後約3週，以目測評等植物損害的方式評估該實驗，與未處理的控制物比較，例如，其中化合物編號1、4、5、19、55、58、79、146、185、198、281、282、283、285、286、288、289、290、291、292及293（參考表1及2）在該試驗中例如具有非常好的抗有害植物之除草作用，彼等係典型的稻米農作物的有害植物，例如，莎草屬，台灣野稗、牛毛氈及矮慈姑。

4. 農作植物耐受性

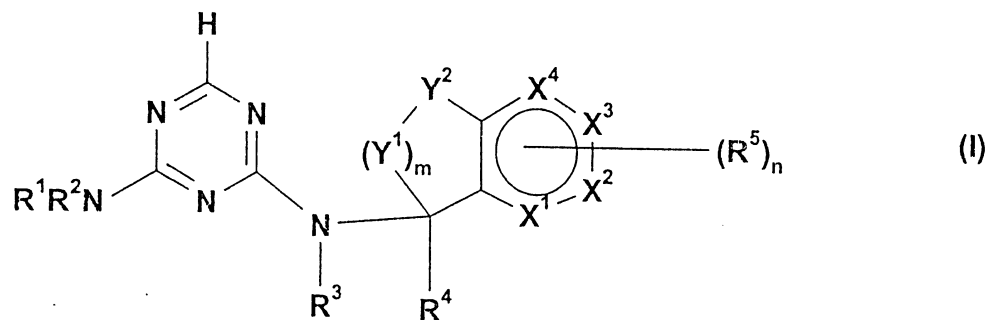
在進一步溫室實驗中，將相對大量的農作植物及雜草種子放入塑膠盆的矽壤土中和以土壤覆蓋。將部份盆子立刻如第1段所述之方式處理，但是將其餘的盆子放入溫室

(107)

中，直到該等植物長出二至三片真實的葉子為止，並將著將根據本發明的式（I）物質如第 2 段所述之方式以各種劑量噴灑。在噴灑之後 4 至 5 週及在溫室中的靜置時間，經由目測評等的方式發現根據本發明化合物會保留使雙子葉農作物不受損害，例如，大豆，棉花，油菜籽，甜菜及馬鈴薯，甚至在萌芽前及萌芽後以高噴灑量之活性化合物噴灑時。此外，部份物質也會保留使禾本科農作物不受損害，例如，大麥，小麥，裸麥，高粱，玉蜀黍或米。尤其係編號 1、4、5、19、55、58、79、146、185、198、281、282、283、285、286、288、289、290、291、292 及 293（參考表 1 及 2）之式（I）化合物在一些情況中展示出高選擇性及因此適合於在農業作物中控制不希望的植物。

肆、中文發明摘要

發明名稱：2-胺基-4-二環胺基-6H-1,3,5-三
 嘧啶，彼之製備方法以及彼作為除草劑與植
 物生長調節劑之應用
 一種式 (I) 化合物及其鹽類



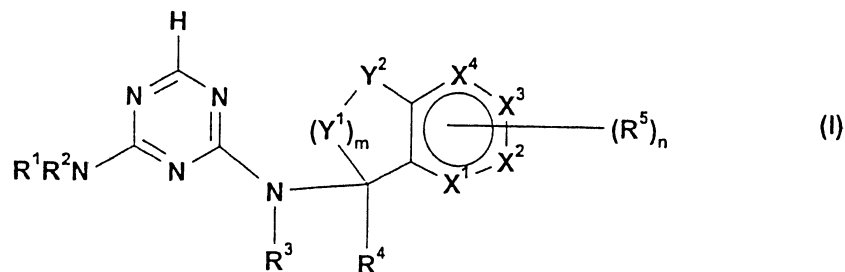
(其中 R^1 至 R^5 、 X^1 至 X^4 、 Y^1 、 Y^2 及 n 和 m 係如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 中的定義) 適合作為除草劑及植物生長調節劑使用，並可以申請專利範圍第 6 項提出之方法在一些情況中經由新穎中間物 (參考申請專利範圍第 11 項) 製備。

伍、英文發明摘要

發明名稱：

2-Amino-4-bicycylamino-6H-1,3,5-triazines, processes for their preparation and their use as herbicides and plant growth regulators.

The compounds of the formula (I) and salts thereof



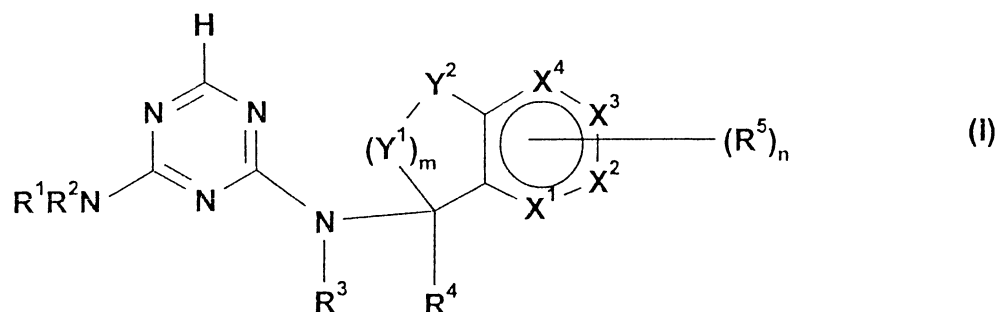
in which

R^1 to R^5 , X^1 to X^4 , Y^1 , Y^2 and n and m are as defined in formula (I) according to claim 1 are suitable for use as herbicides and plant growth regulators and can be prepared by the process claimed in claim 6, via in some cases novel intermediates (see claim 11).

(1)

拾、申請專利範圍

1. 一種式 (I) 化合物或其鹽，



其中

R^1 及 R^2 係彼此各自獨立為氫、式 $NR'R''$ 之基團（其中 R' 及 R'' 係彼此各自獨立為 H 、 $(C_1 - C_6)$ 烷基、 $(C_2 - C_6)$ 烯基、 $(C_2 - C_6)$ 炔基、 $(C_3 - C_6)$ 環烷基或 $(C_5 - C_6)$ 環烯基）、或在每一個情況中具有 1 至 10 個碳原子之烴基或烴氧基、或在每一個情況中具有 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N 、 O 及 S 之雜環原子之雜環基、雜環氧基、雜環硫基或雜環胺基（其中前述最後 6 個各個基未經取代或經取代）、或具有 1 至 20 個碳原子之有機酸的醯基，或

以 R^1 及 R^2 與 NR^1R^2 基團之氮原子一起係具有 3 至 9 個環原子及 1 至 4 個雜環原子之飽和或不飽和非芳族雜環系基，其中除了氮原子之外的更多視需要存在之雜環原子係選自 N 、 O 及 S ，該基未經取代或經取代，其中每一個包括取代基之含碳基 R^1 及 R^2 具有 1 至 20 個碳原子，

R^3 係氫、胺基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺基、二 $(C_1 - C_4)$ 烷胺基、 $(C_1 - C_6)$ 烷基、 $(C_1 - C_6)$ 烷氧基、 $(C_2 - C_6)$

(2)

) 烯基、(C₂ - C₆) 炔基、(C₃ - C₆) 環烷基、(C₅ - C₆) 環烯基、苯基或雜環系基(其中前述最後 10 個彼此獨立的各個基未經取代或經取代, 以及在討論中的包括取代基之基具有 1 至 12 個碳原子)

或式 - B* - A* 之鹽基, 其中

A* 係氫或具有 1 至 10 個碳原子之非環系或環系烴基, 其未經取代或經取代, 及

B* 係式 - CO - 、 - CO - O - 、 - CO - NR' - 、 - S(O)_p - 或 - S(O)_p - O - 之二價基團, 其中 p=0、1 或 2, 及 R' 係氫、具有 1 至 6 個碳原子之烷基、苯基、苯甲基、具有 3 至 6 個碳原子之環烷基或具有 1 至 6 個碳原子之烷鹽基,

其中包括取代基之 - B* - A* 具有 1 至 12 個碳原子,

R⁴ 係式 - Z¹ - R⁶ 之基, 其中 Z¹ 及 R⁶ 係如以下之定義,

R⁵ 係彼此各自獨立為鹵素、氰基、異氰鹽基、硝基、式 - Z² - R⁷ 之基(其中 Z² 及 R⁷ 係如以下之定義), 或者兩個毗鄰之 R⁵ 基一起係具有 4 至 6 個環原子之稠合環, 其係碳環系或包括 1 至 3 個來自 O、S 及 N 之雜環原子, 及其未經取代或以一或多個來自鹵素、(C₁ - C₄) 烷基及酮基之基取代,

R⁶、R⁷、R⁸ 及 R⁹ 係彼此各自獨立為氫(除了如果 Z² 係直鍵時, 則 R⁷ 不是氫)、或具有 1 至 20 個碳原子之非環系烴基、或環系烴基或雜環系基, 其中前述最後 3 個各

(3)

個基未經取代或經取代，

或以 R^8 及 R^9 與 CR^8R^9 基團之碳原子（針對 Y^1 或 Y^2 ）或以來自兩個 Y^1 及／或 Y^2 基團的兩個 R^8 或 R^9 基與 Y^1 及／或 Y^2 基團之附著原子一起在每一個情況中係具有 3 至 8 個碳原子之碳環系基，其中前述最後 2 個各個基未經取代或經取代，

X^1 、 X^2 、 X^3 及 X^4 係彼此各自獨立為碳原子（將其以氫原子或其中一個以上定義之取代基 R^5 取代）或氮原子，或兩個毗鄰之 X^1 、 X^2 、 X^3 及 X^4 符號在每一個情況中一起係式 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NH-$ 或 $-NR-$ 之二價基團，其中 R 係如 R^3 之定義，其先決條件係 X^1 、 X^2 、 X^3 及 X^4 基與稠合環附著之 C_2 單元一起形成碳環系或雜環系芳族 5- 或 6- 員環，

$(Y^1)_m$ 係 m 個二價基團 Y^1 ，其中各自彼此獨立的 Y^1 基團係式 $-O-$ 、 $-CO-$ 、 $-C(=NR^*)-$ 、 $-S(O)_q-$ 、 $-NR^*-$ 或 $-N(O)-$ 之基團（其中 $q=0$ 、1 或 2 及 R^* 係如 R^3 之定義）或式 CR^8R^9 之基團（其中 R^8 及 R^9 係如以上之定義），及

Y^2 係如 Y^1 定義之基團或直鍵，其中兩個毗鄰的符號對 Y^1 及 Y^1 基團或符號對 Y^1 及 Y^2 基團係不具有相同意義之雜原子的基團，及其中 $(Y^1)_m$ 及 Y^2 基團與芳族環附著之 C_2 單元及附著於 R^4 之碳原子一起形成稠合之碳環系或雜環系非芳族 4- 至 8- 員環，

Z^1 及 Z^2 基團係彼此各自獨立為直鍵或式 $-O-$ 、

(4)

$-S(O)_p-$ 、 $-S(O)_p-O-$ 、 $-O-S(O)_p-$ 、
 $-CO-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-NR'-$ 、
 $-O-NR'-$ 、 $-NR'-O-$ 、 $-NR'-CO-$ 、 $-CO-NR'-$
 之二價基團，其中 $p=0$ 、 1 或 2 ，及 R' 係氫、具有 1 至
 6 個碳原子之烷基、苯基、苯甲基、 (C_3-C_6) 環烷基或
 具有 1 至 6 個碳原子之烷醯基，

m 係 0 、 1 、 2 、 3 或 4 ，及

n 係 0 、 1 、 2 、 3 或 4 。

2. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物或其鹽，其中

R^1 及 R^2 係以彼此各自獨立為氫、胺基、在每一個情
 況的烷基中具有 1 至 4 個碳原子之烷胺基或二烷胺基、或
 (C_3-C_6) 環烷胺基、 (C_5-C_6) 環烯胺基、在每一種情
 況中具有 1 至 10 個碳原子之烴基或烴氧基、或在每一個
 情況中具有 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N 、 O 及 S 之
 雜環原子之雜環基、雜環氧基、雜環硫基或雜環胺基（其
 中前述最後 6 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、
 羥基、胺基、硝基、甲醯基、胺羰基、羧基、磺醯基、氰
 基、硫代氰醯基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_2-C_6) 烯氧基
 、 (C_2-C_6) 炔氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基－聚（伸烷氧基
 ）、羥基－聚（伸烷氧基）、 (C_1-C_6) 烷硫基、單－及
 二－ $[(C_1-C_6)$ 烷基]胺基、 $[(C_1-C_6)$ 烷基]羰基、 $[(C_2-C_6)$ 烯基]羰基、 $[(C_2-C_6)$ 炔基]羰基、 $[(C_1-C_6)$
) 烷氧基]羰基、 $[(C_2-C_6)$ 烯氧基]羰基、 $[(C_2-C_6)$
 炔氧基]羰基、單－及二－ $[(C_1-C_6)$ 烷基]胺羰基、苯

(5)

基、苯氧基、(C₃ - C₆)環烷基、苯羰基、苯氧羰基、雜環基、(C₁ - C₄)烷磺醯基及在環系基情況中也以(C₁ - C₄)烷基之基取代，

其中前述最後 24 個各個取代基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、SCN、NO₂、(C₁ - C₄)烷氧基、(C₁ - C₄)烷硫基、(C₁ - C₄)鹵烷氧基、甲醯基、(C₁ - C₄)烷羰基、[(C₁ - C₄)鹵烷基]羰基、[(C₁ - C₄)烷氧基]羰基、[(C₁ - C₄)鹵烷氧基]羰基及在環系基情況中也以(C₁ - C₄)烷基和(C₁ - C₄)鹵烷基之基取代)，

或來自甲醯基、胺羰基、單 - 及二 - [(C₁ - C₄)烷基]胺羰基、[(C₁ - C₆)烷基]羰基、[(C₂ - C₆)烯基]羰基、[(C₂ - C₆)炔基]羰基、[(C₁ - C₆)烷氧基]羰基、[(C₂ - C₆)烯氧基]羰基、苯羰基、(C₁ - C₆)烷磺醯基之有機酸之醯基（其中前述最後 9 個在脂肪族部份或在苯基環中的各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、SCN、NO₂、(C₁ - C₄)烷氧基、(C₁ - C₄)鹵烷氧基、視需要取代和未經取代之苯基及在環系基情況中也以(C₁ - C₆)烷基和(C₁ - C₆)鹵烷基之基取代)，或

以 R¹ 及 R² 與 NR¹R² 基團之氮原子一起係具有 3 至 6 個環原子及 1 至 4 個雜環原子之飽和或不飽和非芳族雜環系基，其中除了氮原子之外的更多視需要存在的雜環原子係選自 N、O 及 S，及該基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、(C₁ - C₄)烷基、(C₁ - C₄)鹵烷基、(C₁ - C₄)烷氧基、(C₁ - C₄)鹵烷氧基、(C₁ - C₄)烷氧羰基

(6)

及酮基之基取代，

R^3 係氫、胺基、 $(C_1 - C_6)$ 烷基、 $(C_1 - C_6)$ 烷氧基、 $(C_2 - C_6)$ 烯基、 $(C_2 - C_6)$ 炔基、 $(C_3 - C_6)$ 環烷基、 $(C_5 - C_6)$ 環烯基、苯基或雜環基（其中前述最後 8 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵基、羥基、胺基、硝基、甲醯基、羧基、氰基、硫代氰醯基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基－ $(C_1 - C_4)$ 烷氧基、羥基－ $(C_1 - C_4)$ 烷氧基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基－聚（伸烷氧基）、羥基－聚（伸烷氧基）、 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷氧基、 $(C_1 - C_4)$ 烷硫基、 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷硫基、單－ $(C_1 - C_4)$ 烷胺基、二－ $(C_1 - C_4)$ 烷胺基、 $[(C_1 - C_4)$ 烷基]羰基、 $[(C_1 - C_4)$ 烷氧基]羰基、胺羰基、單－ $(C_1 - C_4)$ 烷胺羰基、二－ $(C_1 - C_4)$ 烷胺羰基、苯基、苯氧基、 $(C_3 - C_6)$ 環烷基、苯羰基、苯氧羰基、雜環基之基取代，其中前述最後 6 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵基、CN、SCN、 NO_2 、 $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基和 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷氧基及 $(C_1 - C_4)$ 烷磺醯基和 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷磺醯基，及在環系基的情況中也以 $(C_1 - C_4)$ 烷基和 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷基之基取代），

或式－ $B^* - A^*$ 之醯基，其中

A^* 係氫或 $(C_1 - C_6)$ 烷基、 $(C_2 - C_6)$ 烯基、 $(C_2 - C_6)$ 炔基、 $(C_3 - C_6)$ 環烷基、 $(C_5 - C_6)$ 環烯基或苯基（其中前述最後 6 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵基、羥基、胺基、硝基、甲醯基、羧基、硫代氰醯基、

(7)

($C_1 - C_4$) 烷氧基、($C_1 - C_4$) 鹵烷氧基、($C_1 - C_4$) 烷硫基、單 - ($C_1 - C_4$) 烷胺基、二 - ($C_1 - C_4$) 烷胺基、苯基及 ($C_3 - C_6$) 環烷基之基取代，其中前述最後 2 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、SCN、 NO_2 、($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 鹵烷基、($C_1 - C_4$) 烷氧基和 ($C_1 - C_4$) 鹵烷氧基，及在環系基的情況中也以 ($C_1 - C_4$) 烷基和 ($C_1 - C_4$) 鹵烷基之基取代)，及

B^* 係式 $-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-CO-NR'-$ 、 $-S(O)_p-$ 或 $-S(O)_p-O-$ 之二價基團，其中 $p=0$ 、1 或 2，及 R' 係氫、具有 1 至 6 個碳原子之烷基、苯基、苯甲基、具有 3 至 6 個碳原子之環烷基或具有 1 至 4 個碳原子之烷醯基，

其中包括取代基之 $-B^*-A^*$ 具有 1 至 12 個碳原子，

R^4 係式 $-Z^1-R^6$ 之基，其中 Z^1 及 R^6 係如以下之定義，

R^5 係彼此各自獨立為鹵素、CN、SCN、 NO_2 、式 $-Z^2-R^7$ 之基（其中 Z^2 及 R^7 係如以下之定義），或者兩個毗鄰之 R^5 基一起係具有 4 至 6 個環原子之稠合環，其係碳環系或包括 1 至 3 個來自 O、S 及 N 之雜環原子，及其未經取代或以一或多個來自鹵素、($C_1 - C_4$) 烷基及酮基之基取代，及

R^6 及 R^7 、 R^8 、 R^9 係彼此各自獨立為氫（除了如果 Z^2 係直鍵時，則 R^7 不是氫）、或具有 1 至 10 個碳原子之非環系烴基、或具有 3 至 6 個碳原子之環系烴基、或雜環系

(8)

基（其中前述最後的 3 個各個含碳基未經取代或以一或多個來自鹵素、羥基、胺基、硝基、甲醯基、胺羰基、羧基、磺醯基、氰基、硫代氰醯基、 $(C_1 - C_6)$ 烷氧基、 $(C_2 - C_6)$ 烯氧基、 $(C_2 - C_6)$ 炔氧基、 $(C_1 - C_6)$ 烷氧基－聚（伸烷氧基）、羥基－聚（伸烷氧基）、 $(C_1 - C_6)$ 烷硫基、單－及二－ $[(C_1 - C_6)$ 烷基]胺基、 $[(C_1 - C_6)$ 烷基]羰基、 $[(C_2 - C_6)$ 烯基]羰基、 $[(C_2 - C_6)$ 炔基]羰基、 $[(C_1 - C_6)$ 烷氧基]羰基、 $[(C_2 - C_6)$ 烯氧基]羰基、 $[(C_2 - C_6)$ 炔氧基]羰基、單－及二－ $[(C_1 - C_6)$ 烷基]胺羰基、苯基、苯氧基、 $(C_3 - C_6)$ 環烷基、苯羰基、苯氧羰基、雜環基、 $(C_1 - C_4)$ 烷磺醯基，及在環系基的情況中也以 $(C_1 - C_4)$ 烷基之基取代，

其中前述最後 24 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵基、CN、SCN、NO₂、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基、 $(C_1 - C_4)$ 烷硫基、 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷氧基、甲醯基、 $(C_1 - C_4)$ 烷羰基、 $[(C_1 - C_4)$ 鹵烷基]羰基、 $[(C_1 - C_4)$ 烷氧基]羰基、 $[(C_1 - C_4)$ 鹵烷氧基]羰基，及在環系基的情況中也以 $(C_1 - C_4)$ 烷基和 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷基之基取代），

X^1 、 X^2 、 X^3 及 X^4 係彼此各自獨立為碳原子（將其以氫原子或其中一個以上定義之取代基 R^5 取代）或氮原子，或兩個毗鄰之 X^1 、 X^2 、 X^3 及 X^4 符號在每一個情況中一起係式 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NH-$ 或 $-NR-$ 之二價基團，其中 R 係如 R^3 之定義，其先決條件係 X^1 、 X^2 、 X^3 及 X^4 基與稠合環附著之 C_2 單元一起形成碳環系或雜環系芳族 5

(9)

— 或 6—員環，

(Y^1)_m 係 m 個二價基團 Y^1 ，其中各自彼此獨立的 Y^1 基團係式 —O—、—CO—、—C(=NR*)—、—S(O)_q—、—NR*— 或 —N(O)— 之基團（其中 q=0、1 或 2 及 R*係如 R³之定義）或式 CR⁸R⁹之基團，

Y^2 係如 Y^1 定義之基團或直鍵，其中兩個毗鄰的符號對 Y^1 及 Y^1 基團或符號對 Y^1 及 Y^2 基團係不具有相同意義之雜原子的基團，及其中 (Y^1)_m 及 Y^2 基團與芳族環附著之 C₂ 單元及附著於 R⁴ 之碳原子一起形成稠合之碳環系或雜環系非芳族 4—至 8—員環，及

Z^1 及 Z^2 基團係彼此各自獨立為直鍵或式 —O—、—S(O)_p—、—S(O)_p—O—、—O—S(O)_p—、—CO—、—O—CO—、—CO—O—、—NR'—、—O—NR'—、—NR'—O—、—NR'—CO—、—CO—NR'— 之二價基團，其中 p=0、1 或 2，及 R'係氫、具有 1 至 6 個碳原子之烷基、苯基、苯甲基、(C₃—C₆) 環烷基或具有 1 至 6 個碳原子之烷醯基，

其中包括在稠合基中的雜環基（除非有其它另外的定義）在每一個情況中具有 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子。

3. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物或其鹽，其中

R¹ 及 R² 係彼此各自獨立為氫、胺基、單—或二—[(C₁—C₄) 烷基]胺基、或 (C₃—C₆) 環烷胺基、(C₅—C₆) 環烯胺基、在每一種情況中具有 1 至 10 個碳原子之烴

(10)

基或烴氧基、或在每一個情況中具有 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子之雜環基、雜環氧基、雜環硫基或雜環胺基（其中前述最後 6 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、羥基、胺基、硝基、甲醯基、胺羰基、羧基、磺醯基、氰基、硫代氰醯基、（C₁—C₄）烷氧基、（C₂—C₄）烯氧基、（C₂—C₄）炔氧基、（C₁—C₄）烷氧基—聚（伸烷氧基）、羥基—聚（伸烷氧基）、（C₁—C₄）烷硫基、單—及二—[（C₁—C₄）烷基]胺基、[（C₁—C₄）烷基]羰基、[（C₂—C₄）烯基]羰基、[（C₂—C₄）炔基]羰基、[（C₁—C₄）烷氧基]羰基、[（C₂—C₄）烯氧基]羰基、[（C₂—C₄）炔氧基]羰基、單—及二—[（C₁—C₄）烷基]胺羰基、苯基、苯氧基、（C₃—C₆）環烷基、苯羰基、苯氧羰基、雜環基、（C₁—C₄）烷磺醯基及在環系基情況中也以（C₁—C₄）烷基之基取代，

其中前述最後 24 個各個取代基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、SCN、NO₂、（C₁—C₄）烷氧基、（C₁—C₄）鹵烷氧基、甲醯基、（C₁—C₄）烷羰基、[（C₁—C₄）鹵烷基]羰基、[（C₁—C₄）烷氧基]羰基、[（C₁—C₄）鹵烷氧基]羰基及在環系基情況中也以（C₁—C₄）烷基和（C₁—C₄）鹵烷基之基取代），

或來自甲醯基、胺羰基、單—及二—[（C₁—C₄）烷基]胺羰基、[（C₁—C₄）烷基]羰基、[（C₂—C₄）烯基]羰基、[（C₂—C₄）炔基]羰基、[（C₁—C₄）烷氧基]羰基、[（C₂—C₄）烯氧基]羰基、苯羰基、（C₁—C₄）烷磺醯基

(11)

之有機酸之醯基（其中前述最後 9 個在脂肪族部份或在苯基環中的各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、SCN、NO₂、（C₁—C₄）烷氧基、（C₁—C₄）鹵烷氧基、視需要取代和未經取代之苯基及在環系基情況中也以（C₁—C₄）烷基和（C₁—C₄）鹵烷基之基取代），或

以 R¹ 及 R² 與 NR¹R² 基團之氮原子一起係具有 3 至 6 個環原子及 1 至 4 個雜環原子之飽和或不飽和非芳族雜環系基，其中除了氮原子之外的更多視需要存在的雜環原子係選自 N、O 及 S，及該基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、（C₁—C₄）烷基、（C₁—C₄）鹵烷基、（C₁—C₄）烷氧基、（C₁—C₄）鹵烷氧基、（C₁—C₄）烷氧羰基及酮基之基取代，

R³ 係氫、胺基、甲醯基、（C₁—C₄）烷基、氰基—（C₁—C₄）烷基、（C₁—C₄）鹵烷基、單—、二—或多羥基—（C₁—C₄）烷基、羥基—聚[（C₂—C₄）伸烷氧基]—（C₁—C₄）烷基、單—、二—或多（C₁—C₄）烷氧基—（C₁—C₄）烷基、（C₁—C₄）烷氧基—聚[（C₂—C₄）伸烷氧基]—（C₁—C₄）烷基、（C₁—C₄）鹵烷氧基—（C₁—C₄）烷基、（C₂—C₆）烯基、（C₂—C₆）鹵烯基、（C₂—C₆）炔基、（C₂—C₆）鹵炔基、或胺羰基、或（C₁—C₄）烷胺基—（C₁—C₄）烷基、二[（C₁—C₄）烷基]胺基—（C₁—C₄）烷基、（C₁—C₄）烷胺羰基、二（C₁—C₄）烷胺羰基、（C₁—C₅）烷醯基、[（C₂—C₄）烯基]羰基、[（C₁—C₄）烷氧基]羰基、（C₂—C₄）烯氧羰基、胺羰基—

(12)

($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷胺羰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、二[($C_1 - C_4$) 烷基]胺羰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷氧羰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_5$) 烷醯基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、[($C_2 - C_4$) 烯基]羰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、[($C_1 - C_4$) 烷氧基]羰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基或($C_2 - C_4$) 烯氧羰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基(其中前述最後 16 個各個基未經取代或以一或多個來自鹵素、CN、($C_1 - C_4$) 烷氧基及($C_1 - C_4$) 鹵烷氧基之基取代)

或($C_3 - C_6$) 環烷基、($C_3 - C_6$) 環烷胺基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、苯基、苯羰基、苯氧羰基、苯羰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、苯氧基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、苯基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、雜環基、雜環基 - ($C_1 - C_4$) 烷基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷氧基、($C_1 - C_4$) 烷硫基、($C_1 - C_4$) 鹵烷基、($C_1 - C_4$) 鹵烷氧基、甲醯基、($C_1 - C_4$) 烷羰基、($C_1 - C_4$) 烷氧羰基及($C_1 - C_4$) 烷氧基之基取代在非環系部份中或在環系部份中的前述最後 10 個基的其中之一，

R^4 係氫、甲醯基、羧基、氰基、硫代氰醯基、胺羰基、($C_1 - C_4$) 烷基、氰基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷氧基、($C_1 - C_4$) 烷胺基、二 - [($C_1 - C_4$) 烷基]胺基、鹵基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、羥基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷氧基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、鹵基 - ($C_1 - C_4$) 烷氧基 - ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷硫基、鹵基 - ($C_1 - C_4$) 烷硫基、($C_2 - C_6$) 烯基、鹵基 - ($C_2 - C_6$) 烯基

(13)

、 $(C_2 - C_6)$ 炔基、鹵基 - $(C_2 - C_6)$ 炔基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、二 - $[(C_1 - C_4)$ 烷基]胺基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_3 - C_9)$ 環烷胺基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_3 - C_9)$ 環烷基、具有 3 至 6 個環元件之雜環基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基（其中在前述最後 3 個基中的環系基未經取代或以一或多個來自 $(C_1 - C_4)$ 烷基、鹵素及氰基之基取代）或苯基、苯氧基、苯羰基、苯羰基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、苯氧羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧羰基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺羰基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、苯氧基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、苯基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、雜環基、雜環胺基、雜環氧基、雜環硫基、 $(C_1 - C_5)$ 烷醯基胺基、N - $[(C_1 - C_5)$ 烷醯基] - N - $[(C_1 - C_4)$ 烷基]胺基、 $[(C_2 - C_4)$ 烯基]羰胺基、 $[(C_2 - C_4)$ 炔基]羰胺基、 $[(C_1 - C_4)$ 烷氧基]羰胺基、 $[(C_2 - C_4)$ 烯氧基]羰胺基、 $[(C_2 - C_4)$ 炔氧基]羰胺基、苯羰胺基、苯氧羰胺基、 $(C_1 - C_4)$ 烷磺醯基、 $(C_2 - C_4)$ 烯磺醯基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基、 $(C_1 - C_4)$ 烷硫基、 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷氧基、甲醯基、 $(C_1 - C_4)$ 烷羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基及在環系部份的情況中也以 $(C_1 - C_4)$ 烷基和 $(C_1 - C_4)$ 鹵烷基之基取代在非環系部份中或在環系部份中的前述最後 27 個基的其中之一，

R^5 ，如果 $n=1$ 及如果 n 大於 1 時，則在每一個情況中

(14)

的 R^5 係彼此獨立為鹵素、羥基、胺基、硝基、甲醯基、羧基、氰基、硫代氰醯基、胺羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷基、氰基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺基、二 - $[(C_1 - C_4)$ 烷基]胺基、鹵基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、羥基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、鹵基 - $(C_1 - C_4)$ 烷氧基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷硫基、鹵基 - $(C_1 - C_4)$ 烷硫基、 $(C_2 - C_6)$ 烯基、鹵基 - $(C_2 - C_6)$ 烯基、 $(C_2 - C_6)$ 炔基、鹵基 - $(C_2 - C_6)$ 炔基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、二 - $[(C_1 - C_4)$ 烷基]胺基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_3 - C_9)$ 環烷胺基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_3 - C_9)$ 環烷基、具有 3 至 6 個環元件之雜環基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基（其中在前述最後 3 個基中的環系基未經取代或以一或多個來自 $(C_1 - C_4)$ 烷基、鹵素及氰基之基取代）或苯基、苯氧基、苯羰基、苯羰氧基、苯羰基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、苯氧羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺羰基、 $(C_1 - C_4)$ 烷氧羰基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、 $(C_1 - C_4)$ 烷胺羰基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、苯氧基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、苯基 - $(C_1 - C_4)$ 烷基、雜環基、雜環胺基、雜環氧基、雜環硫基、 $(C_1 - C_5)$ 烷醯基胺基、 $N - [(C_1 - C_5)$ 烷醯基] - $N - [(C_1 - C_4)$ 烷基]胺基、 $[(C_2 - C_4)$ 烯基]羰胺基、 $[(C_2 - C_4)$ 炔基]羰胺基、 $[(C_1 - C_4)$ 烷氧基]羰胺基、 $[(C_2 - C_4)$ 烯氧基]羰胺基、 $[(C_2 - C_4)$ 炔氧基]羰胺基、苯羰胺基、苯氧羰胺基、 $(C_1 - C_4)$ 烷磺醯

(15)

基、(C₂ - C₄) 烯磺醯基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷硫基、(C₁ - C₄) 鹵烷氧基、甲醯基、(C₁ - C₄) 烷羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基、(C₁ - C₄) 烷氧基及在環系部份的情況中也以 (C₁ - C₄) 烷基和 (C₁ - C₄) 鹵烷基之基取代在非環系部份中或在環系部份中的前述最後 28 個基的其中之一，

其中在基中的雜環基在每一個情況中包括 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子，

或者兩個毗鄰之 R⁵ 基一起係具有 4 至 6 個環原子之稠合環，其係碳環系或包括來自 O、S 及 N 之雜環原子，及其未經取代或以一或多個來自鹵素、(C₁ - C₄) 烷基及酮基之基取代，

R⁸ 及 R⁹ 係彼此各自獨立為氫、甲醯基、羧基、氰基、硫代氰醯基、胺羰基、(C₁ - C₄) 烷基、氰基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷胺基、二[(C₁ - C₄) 烷基]胺基、鹵基 - (C₁ - C₄) 烷基、羥基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、鹵基 - (C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷硫基、鹵基 - (C₁ - C₄) 烷硫基、(C₂ - C₆) 烯基、鹵基 - (C₂ - C₆) 烯基、(C₂ - C₆) 炔基、鹵基 - (C₂ - C₆) 炔基、(C₁ - C₄) 烷胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、二[(C₁ - C₄) 烷基]胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₃ - C₉) 環烷胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₃ - C₉) 環烷基、具有 3 至 6 個環元件之雜環基 - (C₁ - C₄) 烷基（其中在前述最後 3 個

(16)

基中的環系基未經取代或以一或多個來自 (C₁ - C₄) 烷基、鹵素及氰基之基取代) 或苯基、苯氧基、苯羰基、苯羰基 - (C₁ - C₄) 烷基、苯氧羰基、(C₁ - C₄) 烷羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基、(C₁ - C₄) 烷胺羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷胺羰基 - (C₁ - C₄) 烷基、苯氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、苯基 - (C₁ - C₄) 烷基、雜環基、雜環胺基、雜環氧基、雜環硫基、(C₁ - C₅) 烷醯基胺基、N - [(C₁ - C₅) 烷醯基] - N - [(C₁ - C₄) 烷基]胺基、[(C₂ - C₄) 烯基]羰胺基、[(C₂ - C₄) 炔基]羰胺基、[(C₁ - C₄) 烷氧基]羰胺基、[(C₂ - C₄) 烯氧基]羰胺基、[(C₂ - C₄) 炔氧基]羰胺基、苯羰胺基、苯氧羰胺基、(C₁ - C₄) 烷磺醯基、(C₂ - C₄) 烯磺醯基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷硫基、(C₁ - C₄) 鹵烷氧基、甲醯基、(C₁ - C₄) 烷羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基、(C₁ - C₄) 烷氧基及在環系部份的情況中也以 (C₁ - C₄) 烷基和 (C₁ - C₄) 鹵烷基之基取代在非環系部份中或在環系部份中的前述最後 27 個基的其中之一，

X¹、X²、X³ 及 X⁴ 係彼此各自獨立為碳原子 (將其以氫原子或其中一個以上定義之取代基 R⁵ 取代) 或氮原子，或兩個毗鄰之 X¹、X²、X³ 及 X⁴ 符號在每一個情況中一起係式 - O - 、 - S - 、 - NH - 或 - NR - 之二價基團，其中 R 係如 R³ 之定義，其先決條件係 X¹、X²、X³ 及 X⁴ 基與稠合環附著之 C₂ 單元一起形成碳環系或雜環系芳族 5

(17)

— 或 6— 員環，

(Y^1)_m 係 m 個二價基團 Y^1 ，其中各自彼此獨立的 Y^1 基團係式 $-O-$ 、 $-CO-$ 、 $-C(=NR^*)-$ 、 $-S(O)_q-$ 、 $-NR^*-$ 或 $-N(O)-$ 之基團（其中 $q=0$ 、1 或 2 及 R^* 係如 R^3 之定義）或式 CR^8R^9 之基團，

Y^2 係如 Y^1 定義之基團或直鍵，其中兩個毗鄰的符號對 Y^1 及 Y^1 基團或符號對 Y^1 及 Y^2 基團係不具有相同意義之雜原子的基團，及其中 (Y^1)_m 及 Y^2 基團與芳族環附著之 C_2 單元及附著於 R^4 之碳原子一起形成稠合之碳環系或雜環系非芳族 4— 至 8— 員環，及

其中包括在稠合基中的雜環基（除非有其它另外的定義）在每一個情況中具有 3 至 9 個環原子及 1 至 3 個來自 N、O 及 S 之雜環原子。

4. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物或其鹽，其中

R^1 ， R^2 係彼此各自獨立為氫、胺基、甲醯基、($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷胺基、二-[($C_1 - C_4$) 烷基] 胺基、羥基- ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷氧基- ($C_1 - C_4$) 烷基、鹵基- ($C_1 - C_4$) 烷氧基- ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_2 - C_6$) 烯基、($C_2 - C_6$) 炔基、鹵基- ($C_2 - C_6$) 炔基、($C_1 - C_4$) 烷胺基- ($C_1 - C_4$) 烷基、或苯基、苯氧基、苯羰基、苯羰基- ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷氧羰基- ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷胺羰基- ($C_1 - C_4$) 烷基、($C_1 - C_4$) 烷羰基、($C_1 - C_4$) 烷氧羰基、胺羰基、($C_1 - C_4$) 烷胺羰基或以一或多個來自鹵素、硝基

(18)

、氰基、(C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷硫基、(C₁ - C₄) 鹵烷基、甲醯基、(C₁ - C₄) 烷羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基及(C₁ - C₄) 烷氧基之基取代在非環系部份中或在環系部份中的前述最後 10 個基的其中之一，

R³ 係氫、胺基、甲醯基、(C₁ - C₄) 烷基、氰基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₂ - C₆) 烯基、鹵基 - (C₂ - C₆) 烯基、(C₂ - C₆) 炔基或苯基、(C₁ - C₄) 烷羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基、胺羰基、苯氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、苯基 - (C₁ - C₄) 烷基或以一或多個來自鹵素、(C₁ - C₄) 烷基及(C₁ - C₄) 烷氧基之基取代在非環系部份中或在環系部份中的前述最後 6 個基的其中之一，

R⁴ 係以氫、(C₁ - C₄) 烷基、氰基 - (C₁ - C₄) 烷基、鹵基 - (C₁ - C₄) 烷基、羥基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、鹵基 - (C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₂ - C₆) 烯基、鹵基 - (C₂ - C₆) 烯基、(C₂ - C₆) 炔基、(C₁ - C₄) 烷胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₃ - C₉) 環烷胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₃ - C₉) 環烷基、具有 3 至 9 個環元件之雜環基 - (C₁ - C₄) 烷基(其中在前述最後 3 個基中的環系基未經取代或以一或多個來自(C₁ - C₄) 烷基、鹵素及氰基之基取代)或苯基、苯氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、苯基 - (C₁ - C₄) 烷基、雜環基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、(C₁ - C₄)

(19)

) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷硫基、(C₁ - C₄) 鹵烷氧基、(C₁ - C₄) 烷羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基、(C₁ - C₄) 烷氧基及在環系部份的情況中也以(C₁ - C₄) 烷基和(C₁ - C₄) 鹵烷基之基取代在非環系部份中或在環系部份中的前述最後 4 個基的其中之一，

R⁵，如果 n=1 及如果 n 大於 1 時，則在每一個情況中的 R⁵ 係彼此獨立為鹵素、羥基、胺基、硝基、甲醯基、氰基、胺羰基、(C₁ - C₄) 單烷胺羰基、(C₁ - C₄) 二烷胺羰基、(C₁ - C₄) 烷基、氰基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷胺基、鹵基 - (C₁ - C₄) 烷基、羥基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₂ - C₄) 烯基、(C₂ - C₄) 炔基、(C₁ - C₄) 烷胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、二[(C₁ - C₄) 烷基]胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、或[(C₁ - C₄) 烷基]羰基、[(C₁ - C₄) 鹵烷基]羰基、[(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基]羰基、甲醯基胺基、[(C₁ - C₄) 烷基]羰胺基、[(C₁ - C₄) 鹵烷基]羰胺基、苯基、苯氧基、苯羰基、苯羰胺基、雜環基或以一或多個來自鹵素、(C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 鹵烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 鹵烷氧基及(C₁ - C₄) 烷硫基之基取代的前述最後 5 個基的其中之一，

R⁸ 及 R⁹ 係彼此各自獨立為氫、(C₁ - C₄) 烷基、氰基 - (C₁ - C₄) 烷基、鹵基 - (C₁ - C₄) 烷基、羥基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、鹵

(20)

基 - (C₁ - C₄) 烷氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₂ - C₆) 烯基、鹵基 - (C₂ - C₆) 烯基、(C₂ - C₆) 炔基、(C₁ - C₄) 烷胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₃ - C₉) 環烷胺基 - (C₁ - C₄) 烷基、(C₃ - C₉) 環烷基、具有 3 至 9 個環元件之雜環基 - (C₁ - C₄) 烷基 (其中在前述最後 3 個基中的環系基未經取代或以一或多個來自 (C₁ - C₄) 烷基、鹵素及氰基之基取代) 或苯基、苯氧基 - (C₁ - C₄) 烷基、苯基 - (C₁ - C₄) 烷基、雜環基或以一或多個來自鹵素、硝基、氰基、(C₁ - C₄) 烷氧基、(C₁ - C₄) 烷硫基、(C₁ - C₄) 鹵烷氧基、(C₁ - C₄) 烷羰基、(C₁ - C₄) 烷氧羰基、(C₁ - C₄) 烷氧基及在環系部份的情況中也以 (C₁ - C₄) 烷基和 (C₁ - C₄) 鹵烷基之基取代在非環系部份中或在環系部份中的前述最後 4 個基的其中之一。

5. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物或其鹽，其中 X¹、X²、X³ 及 X⁴ 係彼此各自獨立為碳原子 (將其以氫原子或其中一個以上定義之取代基 R⁵ 取代) 或氮原子，或兩個毗鄰之 X¹、X²、X³ 及 X⁴ 符號在每一個情況中一起係式 - O - 、 - S - 、 - NH - 或 - NR - 之二價基團，其中 R 係氫或 (C₁ - C₄) 烷基，其先決條件係 X¹、X²、X³ 及 X⁴ 基與稠合環附著之 C₂ 單元一起形成碳環系或雜環系芳族 5 - 或 6 - 員環，

(Y¹)_m 係 m 個二價基團 Y¹，其中各自彼此獨立的 Y¹ 基團係式 CH₂、CH (CH₃)、CH (C₂H₅)、CH (CH₃)₂ 或 CH (C₆H₅) 之基團，及 m=0、1、2 或 3，

(21)

及

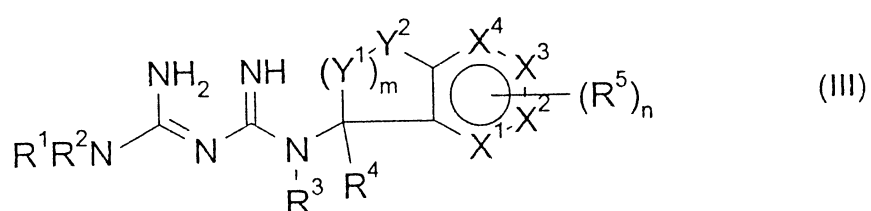
Y^2 係直鍵或式 $-O-$ 、 $-S-$ 、 CH_2 、 $CH(CH_3)$ 或 ($C_1 - C_4$) 烷胺基之基團，其中兩個毗鄰的符號對 Y^1 及 Y^1 基團或符號對 Y^1 及 Y^2 基團係不具有相同意義之雜原子之基團，以及其中 $(Y^1)_m$ 及 Y^2 基團與芳族環附著之 C_2 單元及附著於 R^4 之碳原子一起形成稠合之碳環系或雜環系非芳族 4- 至 8- 員環。

6. 一種製備如申請專利範圍第 1 至 5 項中任一項之式 (I) 化合物及其鹽類之方法，其包含

a) 以式 (II) 化合物

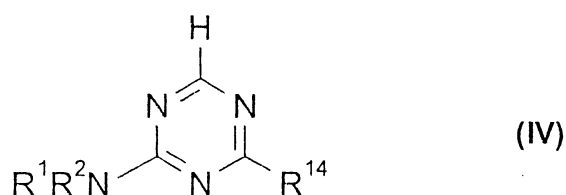


(其中 R^{13} 係來自羧酸酯、羧酸原酯、羧醯氨、羧醯胺及羧酸酐之官能基) 與式 (III) 之二胍或其酸加成鹽反應



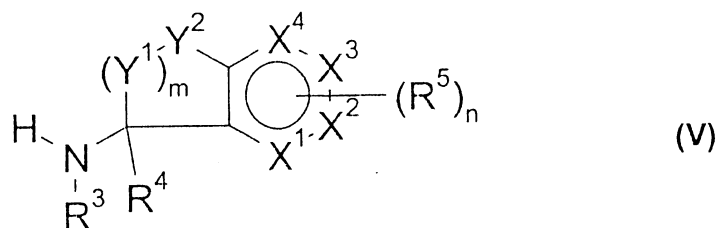
或

b) 以式 (IV) 化合物



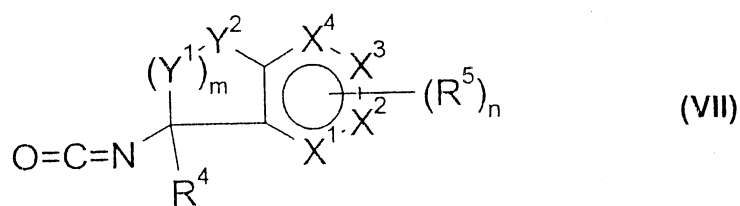
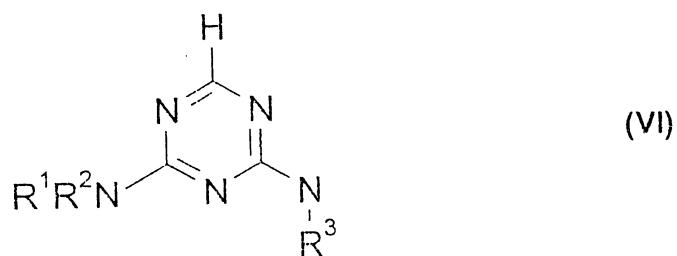
(22)

(其中 R^{14} 係可交換基或離棄基) 與式 (V) 之胺或其酸加成鹽反應



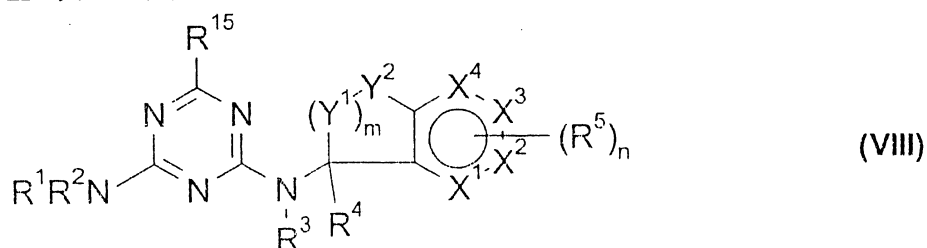
或

c) 以式 (VI) 之二胺基 - 1,3,5 - 三吡與式 (VII) 之異氰酸酯反應



或

d) 除去在結構 (VIII) 中的基 R^{15} , 其係可除去之離棄基或基團



(23)

其中在式 (II) 、 (III) 、 (IV) 、 (V) 、 (VI) 、 (VII) 和 (VIII) 及基 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 Y^1 和 Y^2 及符號 m 和 n 係如式 (I) 中之定義。

7. 一種除草劑或植物生長調節組成物，其包含一或多種如申請專利範圍第 1 至 5 項中任一項之式 (I) 化合物或其鹽類及在農作物保護作用中所使用之調配輔助劑。

8. 一種用於控制有害植物或調節植物生長之方法，其包含以有效劑量之一或多種如申請專利範圍第 1 至 5 項中任一項之式 (I) 化合物或其鹽類噴灑在植物、植物種子或耕種區域上。

9. 根據申請專利範圍第 8 項之方法，其中以式 (I) 化合物或其鹽類用於控制在有用的農作物中或觀賞性植物中的有害植物或調節生長。

10. 一種式 (III) 、 (V) 、 (VII) 或 (VIII) 化合物，如申請專利範圍第 6 項之定義。

陸、(一)、本案指定代表圖為：第 無 圖
 (二)、本代表圖之元件代表符號簡單說明：

無

柒、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

