

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 03804273.8

[51] Int. Cl.

C07D 251/48 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07C 279/26 (2006.01)

[45] 授权公告日 2009 年 5 月 27 日

[11] 授权公告号 CN 100491359C

[51] Int. Cl. (续)

A01N 43/68 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

C07D 495/04 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

C07D 413/12 (2006.01)

C07C 211/42 (2006.01)

C07D 471/04 (2006.01)

A01P 13/00 (2006.01)

A01P 21/00 (2006.01)

[22] 申请日 2003.2.6 [21] 申请号 03804273.8

[30] 优先权

[32] 2002.2.20 [33] DE [31] 10207037.7

[86] 国际申请 PCT/EP2003/001157 2003.2.6

[87] 国际公布 WO2003/070710 德 2003.8.28

[85] 进入国家阶段日期 2004.8.20

[73] 专利权人 拜尔作物科学股份公司

地址 德国蒙海姆

[72] 发明人 K·敏恩 H·阿伦斯

H·戴特里奇 L·韦尔姆斯

T·奥勒 H·比尔林格 H·曼恩

[56] 参考文献

US5527954 A 1996.6.18

US5250686 A 1993.10.5

CN1212687 A 1999.3.31

审查员 何小平

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利
商标事务所

代理人 吴亦华

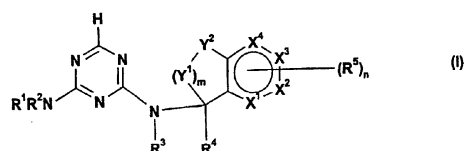
权利要求书 4 页 说明书 84 页

[54] 发明名称

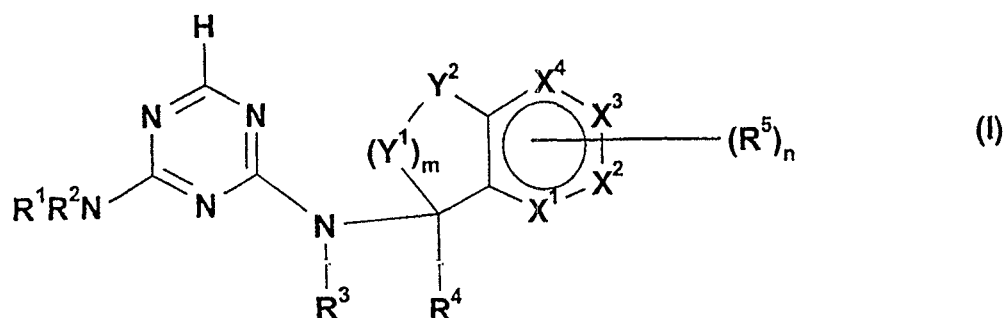
2-氨基-4-二环氨基-6H-1,3,5-三嗪,
其制备方法以及其作为除草剂和植物生长调
节剂的应用

[57] 摘要

式(I)化合物及其盐类: 其中 R^1 至 R^5 、 X^1 至 X^4 、 Y^1 、 Y^2 及 n 和 m 是如权利要求 1 的式(I)中所定义, 其适宜作为除草剂及植物生长调节剂使用, 并可以用权利要求 6 提出的方法在一些情况下经由新颖中间体(参考权利要求 11)制备。



1. 式 (I) 化合物或其盐类,



其中

R^1 及 R^2 彼此各自独立地为氢、或未经取代或经一或多个卤原子取代的选自甲酰基和 $[C_{1-6}$ 烷基] 羰基的有机酸的酰基,

R^3 是氢,

R^4 是氢,

R^5 彼此各自独立地为卤素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基,

X^1 、 X^2 、 X^3 及 X^4 彼此各自独立地为碳原子, 其经氢原子或一个如上定义的取代基 R^5 取代,

$(Y^1)_m$ 是选自亚甲基或亚乙基的二价基团, 其未经取代或经一个或多个 C_{1-4} 烷基取代,

Y^2 是亚甲基、氧原子、硫原子或直键, 和

n 是 0、1 或 2。

2. 根据权利要求 1 的化合物或其盐类, 其中 R^1 及 R^2 彼此各自独立地为氢原子。

3. 根据权利要求 1 或 2 的化合物或其盐类, 其中

R^5 彼此独立地为卤素或 C_{1-4} 烷基, 且
 n 是 0、1 或 2。

4. 根据权利要求 1 或 2 的化合物或其盐类, 其中
 $(Y^1)_m$ 是选自亚甲基或亚乙基的二价基团, 其未经取代或经一或多个
甲基取代, 且
 Y^2 是亚甲基、氧原子、硫原子或直键。

5. 根据权利要求 1 或 2 的化合物或其盐类, 其中
 R^1 是氢,
 R^2 是氢,
 R^3 是氢,
 R^4 是氢,
 R^5 彼此独立地是卤素或甲基,
 X^1 、 X^2 、 X^3 及 X^4 彼此各自独立地为碳原子, 其经氢原子或一个如上定
义的取代基 R^5 取代
 $(Y^1)_m$ 是选自亚甲基或亚乙基的二价基团, 其未经取代或经一个或多
个甲基取代, 且
 Y^2 是亚甲基、氧原子、硫原子或直键。

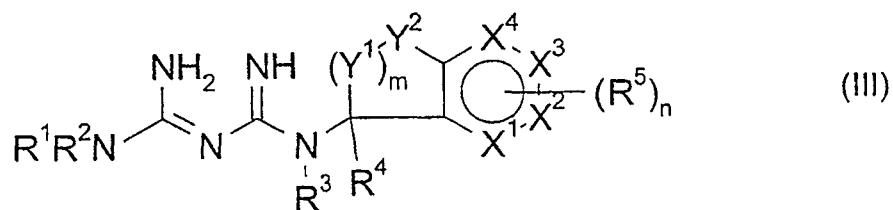
6. 一种制备如权利要求 1 至 5 中任一项所定义的式 (I) 化合物
及其盐类的方法, 其包含

a) 式 (II) 化合物



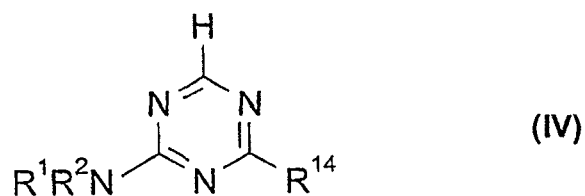
其中 R^{13} 是选自羧酸酯、羧酸原酯、酰氯、酰胺及酸酐的官能

基，与式 (III) 的双胍或其酸加成盐反应

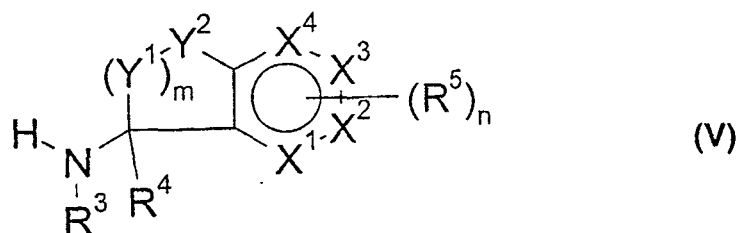


或

b) 式 (IV) 化合物

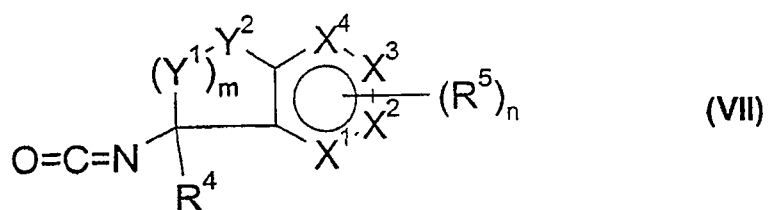
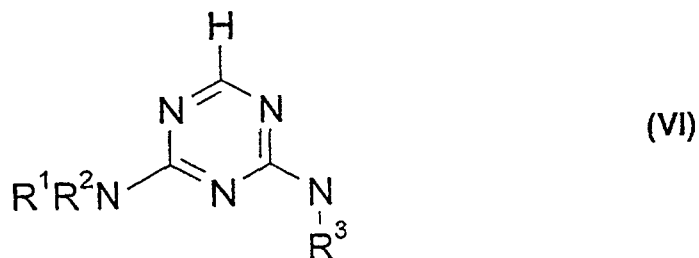


其中 R^{14} 是可交换基或离去基，与式 (V) 的胺或其酸加成盐反应



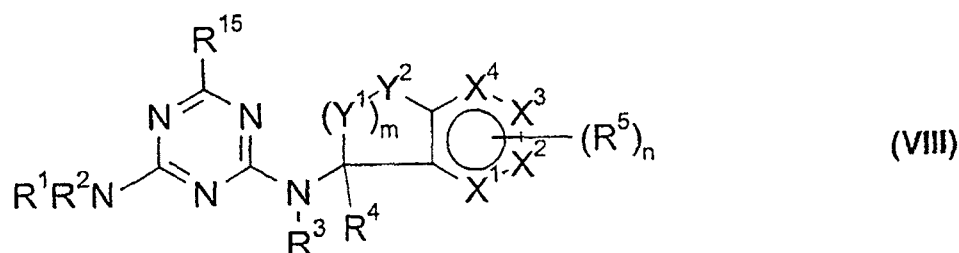
或

c) 式 (VI) 的二氨基-1, 3, 5-三嗪与式 (VII) 的异氰酸酯反应



或

d) 除去在结构 (VIII) 的三嗪中的基 R^{15} , 其是离去基或可除去的基团



其中在式 (II)、(III)、(IV)、(V)、(VI)、(VII) 和 (VIII), 基团 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 Y^1 和 Y^2 及符号 m 和 n 是如式 (I) 中的定义。

7. 一种除草剂或植物生长调节组合物, 其包含一或多种如权利要求 1 至 5 中任一项的式 (I) 化合物或其盐类及用于农作物保护的调配辅助剂。

8. 一种用于控制有害植物或调节植物生长的方法, 其包含以有效剂量的一或多种如权利要求 1 至 5 中任一项的式 (I) 化合物或其盐类喷洒在植物、植物种子或耕种区域上。

9. 根据权利要求 1 至 5 中任一项的式 (I) 化合物或其盐类作为除草剂或植物生长调节剂的用途。

10. 根据权利要求 9 的用途, 其特征在于, 式 (I) 的化合物或其盐类在经济作物或观赏性植物的培养中用于控制有害植物或调节生长。

2-氨基-4-二环氨基-6H-1, 3, 5-三嗪,
其制备方法以及其作为除草剂和植物生长调节剂的应用

技术领域

本发明涉及除草剂及植物生长调节剂的技术领域，特别是控制在经济植物中的阔叶杂草及禾本科杂草和一般性地控制植物的不希望的生长的除草剂。

背景技术

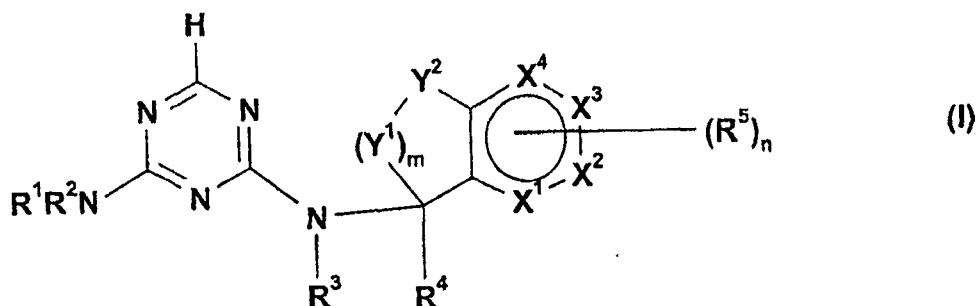
已知 2-氨基-4-环己氨基-6-全卤烷基-1, 3, 5-三嗪（参考例如 US-A-3816419 及 US-A-3932167）或 2-氨基-4-烷基氨基-6-全卤烷基-1, 3, 5-三嗪（WO-A-90 / 09378 (EP-A-411153)、WO-A-88 / 02368 (EP-A-283522)、WO-A-94 / 24086、EP-A-509544、EP-A-492,615），也已知 2-氨基-4-二环氨基-1, 3, 5-三嗪（WO97 / 31904 (DE-A-19607-450)、WO-A-97 / 19936）具有除草及植物生长调节特性。

但是，在以该类型的衍生物作为控制有害植物的选择性除草剂或的施用量或对经济植物产生不希望的损害。而且，由于所述活性化合物比较高的制造成本，故其在多种情况下的应用不合乎经济性。目前已惊讶地发现新颖的二环取代的 2, 4-二氨基-1, 3, 5-三嗪可以有利地作为除草剂及植物生长调节剂使用。除了其良好的活性分布及经济植物对其良好的耐受性之外，这类化合物的特征还在于低成本的制备工序和易获取的三嗪部份，因为本发明中所描述的物质，可以由不昂贵

且可轻易取得的前体制备三嗪，并可以免除使用昂贵的不易获得的中间体。

发明内容

本发明提供式 (I) 化合物及其盐类



其中

R^1 及 R^2 彼此各自独立地为氢、式 $NR'R''$ 的基团（其中 R' 及 R'' 彼此各自独立地为 H、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 链烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_3-C_6) 环烷基或 (C_5-C_6) 环烯基）、或为各具有 1 至 10 个碳原子的（非环或环）烃基或烃氧基（优选 1 至 6 个碳原子）、或为各具有 3 至 9 个环原子且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子的杂环基、杂环氧基、杂环硫基或杂环氨基（其中前述最后 6 个基团各自为未经取代或经取代的）、或具有 1 至 20 个碳原子的有机酸的酰基（优选 1 至 12 碳原子，特别是 1 至 8 个碳原子），或 R^1 及 R^2 与 NR^1R^2 基团的氮原子一起构成具 3 至 9 个环原子且 1 至 4 个杂环原子的饱和或不饱和非芳族杂环基团，其中除了所述氮原子之外，视需要存在的其它杂环原子选自 N、O 和 S，并且其是未经取代或经取代的，其中每一个包括取代基的含碳基团 R^1 及 R^2 具有 1 至 20 个碳原子，优选 1 至 12 个碳原子，特别是 1 至 10 个碳原子，

R^3 是氢、氨基、 (C_1-C_4) 烷氨基、二 (C_1-C_4) 烷氨基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_2-C_6) 链烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_5-C_6)

环烯基、苯基或杂环基（其中前述最后 10 个基团彼此独立地是未经取代或经取代的，以及包括取代基的各个基团具有 1 至 12 个碳原子，特别是 1 至 10 个碳原子）或式-B'-A'的酰基，其中

A' 是氢或具有 1 至 10 个碳原子的非环或环烷基，优选 1 至 6 个碳原子，并且其是未经取代或经取代的，且

B' 是式-CO-、-CO-O-、-CO-NR'-、-S(O)_p-或-S(O)_p-O-的二价基团，其中 p=0、1 或 2，且 R'是氢、具有 1 至 6 个碳原子的烷基、苯基、苄基、具有 3 至 6 个碳原子的环烷基或具有 1 至 6 个碳原子的烷酰基，

其中包括取代基的-B'-A'具有 1 至 12 个碳原子，优选 1 至 10 个碳原子，

R⁴是式-Z¹-R⁶的基团，其中 Z¹及 R⁶如后述的定义，

R⁵彼此各自独立地为卤素、氰基、异氰酸根、硝基、式-Z²-R⁷的基团（其中 Z²及 R⁷如后述的定义），或者两个毗邻的 R⁵基一起构成具有 4 至 6 个环原子的稠合环，该稠合环是碳环或包含 1 至 3 个选自 O、S 和 N 的杂环原子，并且其为未经取代的或经一或多个选自卤素、(C₁-C₄)烷基和氧基的基团取代，

R⁶、R⁷、R⁸及 R⁹彼此各自独立地为氢（除了如果 Z²是直键时，则 R⁷不是氢）、或具有 1 至 20 个碳原子（优选 1 至 10 个碳原子）的非环烷基、或环烷基（优选具有优选 3 至 8 个碳原子的单环烷基，特别是 3 至 6 个碳原子）、或具有优选 3 至 9 个环原子且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子的杂环基团，其中前述最后 3 个基团各自为未经取代或经取代的，并且包括取代基在内优选具有多达 30 个碳原子，特别是多达 20 个碳原子，

或 R⁸及 R⁹与碳原子一起构成一个 CR⁸R⁹基团（针对 Y¹或 Y²）或与来自两个 Y¹和 / 或 Y²基团的两个 R⁸或 R⁹基与 Y¹和 / 或 Y²基团的键接原子一起各为具有 3 至 8 个碳原子（特别是 3 至 6 个碳原子）的

碳环基团、或具有优选 3 至 9 个环原子且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子的杂环基团，其中前述最后 2 个基团各自为未经取代或经取代的，并且包括取代基在内优选具有多达 16 个碳原子，特别是多达 12 个碳原子，

X^1 、 X^2 、 X^3 及 X^4 彼此各自独立地为碳原子（其经一个氢原子或一个用于定义取代基 R^5 的基团取代），或氮原子，或两个毗邻的 X^1 、 X^2 、 X^3 及 X^4 符号在每一个情况下一起构成式 -O-、-S-、-NH- 或 -NR- 的二价基团，其中 R 如 R^3 的定义，并优选为氢或 (C_1 - C_6) 烷基，其先决条件是 X^1 、 X^2 、 X^3 及 X^4 基团与稠合环键接的 C_2 单元一起形成碳环或杂环芳族 5-或 6-元环，

$(Y^1)_m$ 是 m 个二价基团 Y^1 ，其中各自彼此独立的 Y^1 基团是式 -O-、-CO-、-C(=NR')-、-S(O)_q-、-NR'- 或 -N(O)- 的基团（其中 $q=0$ 、1 或 2 及 R' 如 R^3 的定义，且优选为氢、(C_1 - C_6) 烷基、苄基或苯基，特别是氢、(C_1 - C_4) 烷基或苯基）或式 CR^8R^9 的基团（其中 R^8 及 R^9 如上定义），且

Y^2 如 Y^1 定义的基团或直键，其中两个毗邻的符号对 Y^1 和 Y^1 基团或符号对 Y^1 和 Y^2 基团是不具有相同意义的杂原子基团，且其中 $(Y^1)_m$ 和 Y^2 基团与芳族环的键接的 C_2 单元及键接于 R^4 的碳原子一起形成稠合的碳环或杂环非芳族 4-至 8-元环，

Z^1 及 Z^2 基团彼此各自独立地为直键或式 -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'- 的二价基团，其中 $p=0$ 、1 或 2，且 R' 是氢、具有 1 至 6 个碳原子的烷基、苯基、苄基、(C_3 - C_6) 环烷基或具有 1 至 6 个碳原子的烷酰基，

m 是 0、1、2、3 或 4，特别是 1 或 2，及

n 是 0、1、2、3 或 4，特别是 0、1 或 2，尤其是 1 或 2。

通过将适宜的无机或有机酸（例如 HCl 、 HBr 、 H_2SO_4 或 HNO_3 ，还可以是草酸或磺酸）加成到碱性基团（例如氨基或烷氨基）上，可将式（I）化合物形成盐类。以去质子化形式存在的适宜的取代基（例如磺酸或羧酸）可与其可质子化的基团（如氨基）形成内盐类。以农业上适宜的阳离子置换在适宜的取代基（例如磺酸或羧酸）中的氢也可以形成盐类。所述盐类是例如金属盐类，特别是碱金属盐类或碱土金属盐类（特别是钠盐及钾盐）或还可以是铵盐类、具有有机胺的盐类或季（四级）铵盐类。

以下的定义适用于式（I）及所有以下的化学式中：

在二价基团中（如 B^* 、 Z^1 及 Z^2 ，其也可表示具有多个原子的桥键如 $-\text{CO}-\text{NR}'-$ ），以 $-\text{B}^*-\text{A}^*$ 或 $-\text{Z}^1-\text{R}^6$ 的书写形式的一个复合基团表示基团 $-\text{CO}-\text{NR}'-\text{A}^*$ 或 $-\text{CO}-\text{NR}'-\text{R}^6$ ，而非基团 $-\text{NR}'-\text{CO}-\text{A}^*$ 或 $-\text{NR}'-\text{CO}-\text{R}^6$ 。

在二价基团 $-(\text{Y}^1)_m-$ 中“键接”是如此定义的，即写于左侧的自由结合位置与经 R^4 取代的碳原子连接；相应地下一个 Y^1 基团左边的自由结合位置键接于第一个 Y^1 基团右边的自由键。

式 $-\text{S}(\text{O})_p-$ 的基团表示具有两个自由键的硫原子双重键接于 p 个氧原子，即如果 $p=0$ 、1 或 2 时，则分别是式 $-\text{S}-$ 、 $-\text{S}(=\text{O})-$ （或简写为 $-\text{SO}-$ ，亚硫酰基）或 $-\text{S}(=\text{O})_2-$ （或简写为 $-\text{SO}_2-$ ，磺酰基），而并非 $-\text{S}-\text{O}-$ （亚磺酰氧基）或 $-\text{SO}-\text{O}-$ （亚硫酰氧基）。

杂原子基团是具有一或多个原子及显著的官能化特征的基团，其包含一或多个与碳原子（杂原子）不相同的原子，但是也包括碳原子，在 Y^1 的情况下，所述基团是式 $-\text{O}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}')$ 、 $-\text{S}(\text{O})_q-$ 、 $-\text{NR}'-$ 或 $-\text{N}(\text{O})-$ 的基团，与式 CR^8R^9 的基团相反。

术语烷基、烷氧基、卤烷基、卤烷氧基、烷氨基和烷硫基以及相应的不饱和和/或经取代的基的术语，在每一个情况下既包括具有直链碳主链的所述基团也包括具有支链（非环）碳主链的所述基团。

“(C₁-C₄)烷基”的表达是具有 1 至 4 个碳原子的烷基的简写方式，即包括甲基、乙基、1-丙基、2-丙基、1-丁基、2-丁基、2-甲丙基或叔丁基。具有更宽的碳原子范围的常用烷基例如“(C₁-C₆)烷基”也相应地包括具有更多的碳原子数的直链或支链烷基，即根据实施例还有具有 5 及 6 个碳原子的烷基。

除非有特殊的指定，在烃基如烷基、链烯基和炔基，还有复合基的情况下，优选例如具有 1 至 6 个碳原子（特别是 1 至 4 个碳原子）或在不饱和基的情况下具有 2 至 6 个碳原子（特别是 2 至 4 个碳原子）的低碳主链。烷基（包括在复合基意义中的烷基，如烷氧基、卤烷基等）是例如甲基、乙基、正或异丙基、正、异、叔或 2-丁基、戊基、己基（如正己基、异己基及 1,3-二甲丁基）、庚基（如正庚基、1-甲己基及 1,4-二甲戊基）；链烯基及炔基具有对应于烷基的可能的不饱和基的意义，链烯基是例如乙烯基、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，优选烯丙基、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。

链烯基也特别包括具有一个以上的双键的直链或支链烃基，如 1,3-丁二烯及 1,4-戊二烯基，但也包括具有一或多个累积的双键的丙二烯基或累积多烯基，例如丙二烯基（1,2-丙二烯基）、1,2-丁二烯基及 1,2,3-戊三烯基。

炔基表示例如炔丙基、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、1-甲基丁-3-炔-1-基。炔基也特别包括具有一个以上的三键或另外具有一或多个三键及一或多个双键的直链或支链烃基，例如 1,3-丁三烯基或 3-戊烯-1-炔-1-基。

亚烷基（例如也在(C₁-C₁₀)亚烷基形式中）表示经由双键键接的直链或支链链烷的基，其中键接位置尚未确定。在支链链烷的情况下，自然只能是那些位置，即在其上可将两个氢原子以双键置换的位

置, 所述基团例如是 $=\text{CH}_2$ 、 $=\text{CH}-\text{CH}_3$ 、 $=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$ 、 $=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{C}_2\text{H}_5$ 或 $=\text{C}(\text{C}_2\text{H}_5)-\text{C}_2\text{H}_5$ 。

环烷基表示具有优选 3-8 个碳原子的碳环饱和环体系, 例如环丙基、环丁基、环戊基或环己基。在经取代的环烷基的情况下, 其包括具有取代基的环体系, 其中将取代基以双键与环烷基键结, 例如亚烷基如亚甲基。在经取代的环烷基的情况下, 还包括多环脂族体系, 例如二环[1.1.0]丁烷-1-基、二环[1.1.0]丁烷-2-基、二环[2.1.0]戊烷-1-基、二环[2.1.0]戊烷-2-基、二环[2.1.0]戊烷-5-基、金钢烷-1-基及金钢烷-2-基。

环烯基表示具有优选为 4-8 个碳原子的碳环非芳族、部份不饱和环体系, 例如 1-环丁烯基、2-环丁烯基、1-环戊烯基、2-环戊烯基、3-环戊烯基或 1-环己烯基、2-环己烯基、3-环己烯基、1,3-环己二烯基或 1,4-环己二烯基。在经取代的环烯基的情况下相应地适用上述对于经取代的环烷基的阐述。

卤素表示例如氟、氯、溴或碘。卤烷基、卤烯基及卤炔基表示经相同或不不同的卤素原子(优选选自氟、氯和溴, 特别是选自氟和氯)部份或完全取代的烷基、链烯基或炔基, 例如单卤烷基、全卤烷基、 CF_3 、 CHF_2 、 CH_2F 、 CF_3CF_2 、 CH_2FCHCl 、 CCl_3 、 CHCl_2 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$; 卤烷氧基表示例如 OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{O}$ 、 OCH_2CF_3 及 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$; 其以类似的方式适用于卤烯基及其它经卤素取代的基团。

芳基是单-、二-或多环芳族体系, 例如苯基、萘基、四氢萘基、茚基、2,3-二氢化茚基、戊搭烯基、茑基及类似物, 优选苯基。

杂环基团或环(杂环基)可以是饱和、不饱和或杂芳族的; 除非另有其它的定义, 其优选包括一或多个(特别是 1、2 或 3 个)在杂环环中的杂原子, 优选选自 N、O 和 S; 优选其表示具有 3 至 7 个环原子的脂族杂环基或具有 5 或 6 个环原子的杂芳族基。所述杂环基团可以是例如其中至少 1 个环包含一或多个杂原子的杂芳族基团或环(杂芳基), 例如单-、二-或多环芳族体系。其优选为包含 1 个选自

N、O 和 S 的杂原子的杂芳族环，例如吡啶基、吡咯基、噻吩基或呋喃基，进一步优选具有 2 或 3 个杂原子的对应的杂芳族环，例如嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、噻唑基、噻二唑基、噁唑基、异噁唑基、吡唑基、咪唑基及三唑基。更优选具有选自 N、O 和 S 的杂原子的部份或完全氢化的杂环基团，例如环氧乙烷基、氧杂环丁烷基、氧杂环戊烷基 (=四氢呋喃基)、噁烷基、吡咯啉基、吡咯烷基或哌啶基。

更优选其为具有 2 个选自 N、O 和 S 的杂原子的部份或完全氢化的杂环基团，例如哌嗪基、二氧杂环戊烷基、噁唑啉基、异噁唑啉基、噁唑烷基、异噁唑烷基及吗啉基。

用于经取代的杂环基团的取代基可以考虑下面所述的取代基，还有氧基。氧基也可以出现在那些其以不同氧化态存在的杂环原子上，例如在 N 及 S 的情况下。

优选杂环基的实例是具有 3 至 6 个来自吡啶基、噻吩基、呋喃基、吡咯基、环氧乙烷基、2-氧杂环丁烷基、3-氧杂环丁烷基、氧杂环戊烷基 (=四氢呋喃基)、吡咯烷基、哌啶基的环原子 (特别是环氧乙烷基、2-氧杂环丁烷基、3-氧杂环丁烷基或氧杂环戊烷基) 的杂环基团，或具有 2 或 3 个杂原子的杂环基团 (例如嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、噻吩基、噻唑基、噻二唑基、噁唑基、异噁唑基、吡唑基、三唑基、哌嗪基、二氧杂环戊烷基、噁唑啉基、异噁唑啉基、噁唑烷基、异噁唑烷基或吗啉基)。

如果主链结构以选自所列举的基 (=基团) 或基的一般定义的组“通过一或多个基”取代时，则其在每一个情况下包括通过多个相同和 / 或在结构上不相同的基的同时取代。

经取代的基 (如经取代的烷基、链烯基、炔基、芳基、苯基、苄基、杂环基及杂芳基) 表示例如自未取代的主链衍生的经取代的基，其中所述取代基是例如一或多个 (优选 1、2 或 3 个) 选自卤素、烷氧基、烷硫基、羟基、氨基、硝基、羧基、氰基、叠氮基、烷氧羰

基、烷羰基、甲酰基、氨基甲酰基、单-及二烷氨基羰基、经取代的氨基（如酰基氨基、单-及二烷基氨基）、烷亚硫酰基、烷磺酰基及也在环基团情况下的烷基、卤烷基、烷硫基烷基、烷氧基烷基、视需要取代的单-及二烷基氨基烷基及羟烷基的基；术语“经取代的基”（如经取代的烷基等）表示在所述的含饱和烃基作为取代基之外含包括对应的不饱和脂族及芳族基作为取代基，如未经取代或经取代的链烯基、炔基、烯氧基、炔氧基、苯基、苯氧基等。在环中具有脂族部份的经取代的环基团的情况下，其也包括具有经由双键键接于环的取代基的环体系，例如经由亚烷基（如亚甲基或亚乙基）取代的。

如果所述例举的取代基（“第一级取代基”）具有含烃部份，则视需要可将在所述含烃部份用例如用于定义第一级取代基的一种取代基进一步取代（“第二级取代基”）。对应地可能有多个取代基级。术语“取代基”优选只包含一或两个取代基级。

优选用于取代基级的取代基是例如：

氨基、羟基、卤素、硝基、氰基、巯基、羧基、酰胺、 SF_5 、氨基磺酰基、烷基、环烷基、链烯基、环烯基、炔基、单烷基氨基、二烷基氨基、N-烷酰基氨基、烷氧基、烯氧基、炔氧基、环烷氧基、环烯氧基、烷氧羰基、烯氧羰基、炔氧羰基、芳氧羰基、烷酰基、烯羰基、炔羰基、芳羰基、烷硫基、环烷硫基、烯硫基、环烯硫基、炔硫基、烷亚硫酰基、烷磺酰基、单烷基氨基磺酰基、二烷基氨基磺酰基、N-烷氨基羰基、N,N-二烷基氨基羰基、N-烷酰基氨基羰基、N-烷酰基-N-烷氨基羰基、芳基、芳氧基、苄基、苄氧基、苄硫基、芳硫基、芳氨基及苄氨基。

在具有碳原子的基中，采用那些具有1至6个碳原子的基，优选1至4个碳原子，特别是1或2个碳原子。通常优选选自卤素（例如氟及氯）、 $(\text{C}_1\text{--}\text{C}_4)$ 烷基（优选甲基或乙基）、 $(\text{C}_1\text{--}\text{C}_4)$ 卤烷基（优选三氟甲基）、 $(\text{C}_1\text{--}\text{C}_4)$ 烷氧基（优选甲氧基或乙氧基）、 $(\text{C}_1\text{--}\text{C}_4)$ 卤烷氧基、硝基及氰基的取代基。在此取代基特别优选为甲基、甲氧基、氟和氯。

经取代的氨基（如经单-或二取代的氨基）表示选自经取代的氨基的基，其例如经 1 或 2 个相同或不不同的选自烷基、烷氧基、酰基及芳基的基经 N-取代；优选单-及二烷氨基、单-及二芳氨基、酰基氨基、N-烷基-N-芳氨基、N-烷基-N-酰基氨基及 N-杂环；在此优选具有 1 至 4 个碳原子的烷基；芳基在此优选苯基或经取代的苯基；对于酰基在此适用于在下文中所述的定义，优选 (C₁-C₄) 烷酰基。相应地同样适用于经取代的羟氨基或胍基。

未经取代或经取代的苯基优选未经取代或经相同或不不同的选自卤素、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤烷基、(C₁-C₄) 卤烷氧基及硝基的基单-或多（优选最多经三取代）取代的苯基，例如邻-、间-及对-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、邻-、间-及对-甲氧基苯基。

酰基表示有机酸的基，其在形式上通过除去酸官能的羟基而产生，其中也可以将在酸中的有机基经由杂原子与酸官能键接。酰基实例是羧酸 HO-CO-R 的 -CO-R 基及自其衍生的酸（如硫代羧酸、未经取代或以 N-取代的亚氨基羧酸或碳酸单酯的基、以 N-取代的氨基甲酸、磺酸、亚磺酸、以 N-取代的磺酰胺酸、膦酸或次膦酸）的基，。

酰基表示例如甲酰基、烷羰基（如 [(C₁-C₄) 烷基] 羰基、苯羰基、烷氧羰基、苯氧羰基、苄氧羰基）、烷磺酰基、烷亚磺酰基、N-烷基-1-亚胺烷基及有机酸的其它基。在此可将在烷基或苯基部份中（例如在烷基部份中）的基分别进一步经一或多个选自卤素、烷氧基、苯基及苯氧基的基取代；在苯基部份中的取代基实例是已在上文一般性对于经取代的苯基所提及的取代基。

严格而言，酰基优选是指其酸基团直接与一个有机基的碳原子键接的有机酸的基，例如甲酰基、烷羰基（如乙酰基或 [(C₁-C₄) 烷基] 羰基、苯羰基）、烷磺酰基、烷亚磺酰基及有机酸的其它基。

式(I)化合物还包括所有互变异构体,其通过氢的移动与式(I)所示的化合物处于平衡。

本发明还提供所有式(I)所涵盖的立体异构体及其混合物。这样的式(I)化合物包括未在通式(I)中单独突出显示的一或多个不对称碳原子或双键。所述通过其特殊的空间形式定义的可能的立体异构体(如对映异构体、非对映异构体、Z及E异构体)全都被式(I)所涵盖,并可通过常规的方法从立体异构体的混合物中获得或还可以通过立体选择性反应与使用立体化学上纯的原料相结合的方式制备。相应地也适用于下文所述的其它通式。

例如在式(I)中使二环与二氨基三嗪的氨基键接的碳原子是手性中心,其可以R或S构象(Cahn-Ingold-Prelog命名法)存在。因此,本发明还特别提供具除草性的活性立体异构体,其涉及基于所述的手性中心而言在对映过量百分数(%ee = “enantiomeric excess”)方面纯化的或富集的异构体(在手性中心的情形下的对映异构体;或在有多个手性中心存在的情形下,则还有对映异构体/非对映异构体)。

主要出于较高的除草活性、较好的选择性和/或较好的可制备性的理由,根据本发明式(I)所述的化合物或其盐类是特别有益的,其中各个基具有已述或在下文所述的优越的意义,或特别是那些其中将已述或在下文所述的一或多种优越的意义组合的化合物或其盐类。

还优选根据本发明的通式(I)化合物及其盐类,其中一或多个基团、符号或 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 基、n及m如在下文进一步所述的特殊实施例之一中(具体实施例,在表中的实例)的定义,或根据对应于以实施例所述的定义的通用定义对其下定义(例如乙氧基属于烷氧基或优选(C₁-C₆)烷氧基等)。

在下文将根据本发明的式(I)化合物及其盐类简称为“根据本发明的化合物(I)”或更为简单地称为“化合物(I)”。

无关于来自 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 、 Y^2 、 n 及 m 的基和符号的个别的其它意义，包括对应于一般基团的下属意义和优选地一或多个所述基的优选意义的组合，相关基团具有下列优选意义的根据本发明的化合物 (I) 是特别有益的。

R^1 及 R^2 优选彼此各自独立地为氢、氨基、在每一个情况的烷基中具有 1 至 4 个碳原子的烷氨基或二烷氨基、或 (C_3-C_6) 环烷氨基、 (C_5-C_6) 环烯氨基、在每一种情况下具有 1 至 10 个碳原子 (优选 1 至 6 个碳原子) 的 (非环或环) 烃基或烃氧基、或在每一个情况下具有 3 至 9 个环原子 (优选 3 至 6 个环原子) 且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子的杂环基、杂环氧基、杂环硫基或杂环氨基 (其中前述最后 6 个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、氨羰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、 (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 (烷撑氧基)、羟基-聚 (烷撑氧基)、 (C_1-C_6) 烷硫基、单-及二- $[(C_1-C_6)$ 烷基] 氨基、 $[(C_1-C_6)$ 烷基] 羰基、 $[(C_2-C_6)$ 链烯基] 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、单-及二- $[(C_1-C_6)$ 烷基] 氨羰基、苯基、苯氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、苯羰基、苯氧羰基、杂环基、 (C_1-C_4) 烷磺酰基的基取代，并且在环基团情况下还有经 (C_1-C_4) 烷基取代的，

其中前述最后 24 个取代基各为未经取代或经一或多个来自卤素、CN、SCN、 NO_2 、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤烷氧基、甲酰基、 (C_1-C_4) 烷羰基、 $[(C_1-C_4)$ 卤烷基] 羰基、 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基] 羰基、 $[(C_1-C_4)$ 卤烷氧基] 羰基的基取代并且在环基团情况下还经来自 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 卤烷基的基取代)，

或来自甲酰基、氨羰基、单-或二- $[(C_1-C_4)$ 烷基] 氨羰基、 $[(C_1-C_6)$

烷基]羰基、[(C₂-C₆)链烯基]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)烷磺酰基的有机酸的酰基(其中前述最后9个基各自在脂族部份或在苯基环中未经取代或经一或多个来自卤素、CN、SCN、NO₂、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)卤烷氧基、视需要取代和优选未经取代的苯基的基取代,并且在环基团情况下还经来自(C₁-C₆)烷基和(C₁-C₆)卤烷基的基取代),

其中杂环基及包括在复合基中的杂环基在每一个情况下具有3至9个环原子(优选3至6个环原子)且1至3个选自N、O和S的杂环原子,除非有更详细的定义,或

R¹及R²与NR¹R²基团的氮原子一起构成具3至6个环原子且1至4个杂环原子的饱和或不饱和非芳族杂环基团,其中除了氮原子之外,视需要存在的其它杂环原子选自N、O和S,并且该基未经取代或经一或多个来自卤素、CN、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)卤烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)卤烷氧基、(C₁-C₄)烷氧羰基及氧基的基取代。

R¹及R²还优选彼此各自独立地为氢、氨基、单-或二-[(C₁-C₄)烷基]氨基、或(C₃-C₆)环烷氨基、(C₅-C₆)环烯氨基、在每一个情况下具有1至10个碳原子(优选1至6个碳原子)的(非环或环)烃基或烃氧基、或在每一个情况下具有3至9个环原子(优选3至6个环原子)且1至3个选自N、O和S的杂环原子的杂环基、杂环氧基、杂环硫基或杂环氨基(其中前述最后6个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、氧羰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₂-C₄)烯氧基、(C₂-C₄)炔氧基、(C₁-C₄)烷氧基-聚(烷撑氧基)、羟基-聚(烷撑氧基)、(C₁-C₄)烷硫基、单-及二-[(C₁-C₄)烷基]氨基、[(C₁-C₄)烷基]羰基、[(C₂-C₄)链烯基]羰基、[(C₂-C₄)炔基]羰基、

基、[(C₁-C₄)烷氧基]羰基、[(C₂-C₄)烯氧基]羰基、[(C₂-C₄)炔氧基]羰基、单-及二-[(C₁-C₄)烷基]氨基羰基、苯基、苯氧基、(C₃-C₆)环烷基、苯羰基、苯氧羰基、杂环基、(C₁-C₄)烷磺酰基的基取代,并且在环基团情况下还有经(C₁-C₄)烷基取代的,

其中前述最后 24 个各个取代基未经取代或经一或多个来自由卤素、CN、SCN、NO₂、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)卤烷氧基、甲酰基、(C₁-C₄)烷羰基、[(C₁-C₄)卤烷基]羰基、[(C₁-C₄)烷氧基]羰基、[(C₁-C₄)卤烷氧基]羰基,并且在环基团情况下还经来自(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)卤烷基的基取代),

或来自甲酰基、氨基羰基、单-或二-[(C₁-C₄)烷基]氨基羰基、[(C₁-C₄)烷基]羰基、[(C₂-C₄)链烯基]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)烷磺酰基的有机酸的酰基(其中前述最后 9 个基各自在脂族部份或在苯基环中未经取代或经一或多个来自卤素、CN、SCN、NO₂、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)卤烷氧基、视需要取代和优选未经取代的苯基的基取代,并且在环基团情况下还经来自(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)卤烷基的基取代),

其中杂环基及包括在复合基中的杂环基在每一个情况下具有 3 至 9 个环原子(优选 3 至 6 个环原子)且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子,除非有更详细的定义,或

R¹及 R²与 NR¹R²基团的氮原子一起构成具 3 至 6 个环原子且 1 至 4 个杂环原子(特别是 1 或 2 个杂环原子)的饱和或不饱和非芳族杂环基团,其中除了氮原子之外,视需要存在的其它杂环原子选自 N、O 和 S,并且该基未经取代或经一或多个来自卤素、CN、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)卤烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)烷氧羰基及氧基的基取代。

R^1 及 R^2 还优选彼此各自独立地为氢、氨基、在每一个情况下具有 1 至 4 个碳原子的烷氨基或二烷氨基、或 (C_3-C_6) 环烷氨基、 (C_5-C_6) 环烯氨基、在每一个情况下具有 1 至 10 个碳原子（优选 1 至 6 个碳原子）的（非环或环）烃基或烃氧基、或在每一个情况下具有 3 至 9 个环原子（优选 3 至 6 个环原子）且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子的杂环基、杂环氧基、杂环硫基或杂环氨基（其中前述最后 6 个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷氧基、羟基- (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基-聚（烷撑氧基）、羟基-聚（烷撑氧基）、 (C_1-C_4) 卤烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤烷硫基、单- (C_1-C_4) 烷氨基、二- (C_1-C_4) 烷氨基、 $[(C_1-C_4)$ 烷基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基]羰基、氨基羰基、单- (C_1-C_4) 烷氨基羰基、二- (C_1-C_4) 烷氨基羰基、苯基、苯氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、苯羰基、苯氧羰基、杂环基的基取代，其中前述最后 6 个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、CN、SCN、NO₂、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基和 (C_1-C_4) 卤烷氧基及 (C_1-C_4) 烷磺酰基和 (C_1-C_4) 卤烷磺酰基的基取代，并且在环基团情况下还经来自 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 卤烷基的基取代），

或来自甲酰基、 $[(C_1-C_4)$ 烷基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ 卤烷基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基]羰基、 $[(C_2-C_4)$ 链烯基]羰基、 $[(C_2-C_4)$ 卤烯基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ 卤烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基- (C_1-C_4) 烷氧基]羰基、 $[(C_2-C_4)$ 烯氧基]羰基、 $[(C_2-C_4)$ 卤烯氧基]羰基、 $[(C_2-C_4)$ 炔氧基]羰基、苯羰基及苄基羰基的有机酸的酰基（其中前述最后 2 个在苯基环中的各个基未经取代或经一或多个来自卤素、CN、SCN、NO₂、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基和 (C_1-C_4) 卤烷氧基、 (C_1-C_4) 烷磺酰基和 (C_1-C_4) 卤烷磺酰基及 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基- $(C_1-$

C₄) 烷氧基]磺酰基的基取代)，其中杂环基如在其他情况下的定义。

此外优选

R¹ 及 R² 彼此各自独立地为氢、氨基、甲酰基、(C₁-C₄) 烷基、氰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氨基、二-[(C₁-C₄) 烷基]氨基、(C₁-C₄) 卤烷基、单-、二-或多羟基-(C₁-C₄) 烷基、羟基-多[(C₂-C₄) 烷撑氧基]-(C₁-C₄) 烷基、单-、二-或多-(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-多[(C₂-C₄) 烷撑氧基]-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₆) 链烯基、(C₂-C₆) 卤烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 卤炔基、或氨基羰基、或

(C₁-C₄) 烷氨基-(C₁-C₄) 烷基、二-[(C₁-C₄) 烷基]氨基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氨基羰基、二(C₁-C₄) 烷氨基羰基、(C₁-C₅) 烷酰基、[(C₂-C₄) 链烯基]羰基、[(C₁-C₄) 烷氧基]羰基、(C₂-C₄) 烯氧基-羰基、氨基羰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氨基羰基-(C₁-C₄) 烷基、二-[(C₁-C₄) 烷基]氨基羰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧羰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₅) 烷酰基-(C₁-C₄) 烷基、[(C₂-C₄) 链烯基]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

(其中前述最后 16 个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、CN、(C₁-C₄) 烷氧基及(C₁-C₄) 卤烷氧基的基取代)、

或(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷氨基-(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、杂环基、杂环基-(C₁-C₄) 烷基、杂环氨基、杂环氧基或杂环硫基，

或前述最后 14 个基之一，在其非环部份中或优选在环部份中经一或多个来自卤素、硝基、氰基、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧基、

(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤烷基、(C₁-C₄) 烷氧基、甲酰基、(C₁-C₄) 烷羰基、(C₁-C₄) 烷氧羰基及 (C₁-C₄) 烷氧基的基取代, 其中在基中的杂环基在每一个情况下包括 3 至 9 个环原子且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子,

或

R¹ 及 R² 与 NR¹R² 基团的氮原子一起构成具有 3 至 6 个环原子且 1 或 2 个杂环原子的杂环基团, 其中除了氮原子之外, 视需要可以存在的其它杂环原子选自 N、O 和 S, 并且该基未经取代或经一或多个来自卤素、(C₁-C₄) 烷基及氧基的基取代。

此外还优选的是

R¹, R² 彼此各自独立地为氢、氨基、甲酰基、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氨基、二-[(C₁-C₄) 烷基]氨基、羟基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、卤代-(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₆) 链烯基、(C₂-C₆) 炔基、卤代-(C₂-C₆) 炔基、(C₁-C₄) 烷氨基-(C₁-C₄) 烷基、或苯基、苯氧基、苯羰基、苯羰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧羰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氨羰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷羰基、(C₁-C₄) 烷氧羰基、氨羰基、(C₁-C₄) 烷氨羰基或前述最后 10 个基之一, 在其非环部份中或优选在环部份中经一或多个来自卤素、硝基、氰基、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤烷基、甲酰基、(C₁-C₄) 烷羰基、(C₁-C₄) 烷氧羰基及 (C₁-C₄) 烷氧基的基取代, 其中在基中的杂环基在每一种情况下优选包括 3 至 7 个环原子且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子。

NR¹R² 基团特别优选

氨基、胍基、在烷基中具有 1 至 4 个碳原子的单-或二-烷氨基、(C₁-

C₅) 烷酰基氨基、N-(C₁-C₅) 烷酰基-N-(C₁-C₄) 烷氨基、[(C₁-C₄) 卤烷基] 羰氨基、N-[(C₁-C₄) 卤烷基] 羰基-N-(C₁-C₄) 烷氨基、[(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷羰基] 氨基、N-[(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷羰基]-N-[(C₁-C₄) 烷基] 氨基、苯氨基、苄氨基、苄氧基氨基、吗啉代、哌啶并、哌啶-1-氨基;

特别是氨基、胍基、甲氨基、乙氨基、二甲氨基、乙酰基氨基、丙酰基氨基、氯乙酰基氨基、(2-氯乙基) 羰氨基、三氟甲基羰氨基或三氯甲基羰氨基;

尤其是氨基。

特别有益的式(I) 化合物还有, 其中

R³ 是氢、氨基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₂-C₆) 链烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₅-C₆) 环烯基、苯基或杂环基(其中前述最后 8 个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷氧基、羟基-(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 烷氧基-聚(烷撑氧基)、羟基-聚(烷撑氧基)、(C₁-C₄) 卤烷氧基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤烷硫基、单-(C₁-C₄) 烷氨基、二-(C₁-C₄) 烷氨基、[(C₁-C₄) 烷基] 羰基、[(C₁-C₄) 烷氧基] 羰基、氨羰基、单-(C₁-C₄) 烷氨羰基、二-(C₁-C₄) 烷氨羰基、苯基、苯氧基、(C₃-C₆) 环烷基、苯羰基、苯氧羰基、杂环基的基取代, 其中前述最后 6 个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、CN、SCN、NO₂、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤烷基、(C₁-C₄) 烷氧基和(C₁-C₄) 卤烷氧基及(C₁-C₄) 烷磺酰基和(C₁-C₄) 卤烷磺酰基的基取代, 并且在环基团的情况下还经来自(C₁-C₄) 烷基和(C₁-C₄) 卤烷基的基取代),

或式-B'-A'的酰基, 其中

- A* 是氢或 (C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 链烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₅-C₆) 环烯基或苯基 (其中前述最后 6 个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤烷氧基、(C₁-C₄) 烷硫基、单-(C₁-C₄) 烷氨基、二-(C₁-C₄) 烷氨基、苯基及 (C₃-C₆) 环烷基的基取代, 其中前述最后 2 个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、CN、SCN、NO₂、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤烷基、(C₁-C₄) 烷氧基和 (C₁-C₄) 卤烷氧基的基取代, 并且在环基团的情况下还经来自 (C₁-C₄) 烷基和 (C₁-C₄) 卤烷基的基取代), 且
- B* 是式 -CO-、-CO-O-、-CO-NR'-、-S(O)_p- 或 -S(O)_p-O- 的二价基团, 其中 p=0、1 或 2, 且 R' 是氢、具有 1 至 6 个碳原子的烷基、苯基、苄基、具有 3 至 6 个碳原子的环烷基或具有 1 至 4 个碳原子的烷酰基,

其中包括取代基的 -B*-A* 具有 1 至 12 个碳原子, 优选 1 至 10 个碳原子, 并且杂环基一般如 R¹ 及 R² 的定义。

还优选

- R³ 为氢、氨基、甲酰基、(C₁-C₄) 烷基、氰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤烷基、单-、二-或多羟基-(C₁-C₄) 烷基、羟基-聚[(C₂-C₄) 烷撑氧基]-(C₁-C₄) 烷基、单-、二-或多-(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-聚[(C₂-C₄) 烷撑氧基]-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₆) 链烯基、(C₂-C₆) 卤烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 卤炔基、或氨羰基、或 (C₁-C₄) 烷氨基-(C₁-C₄) 烷基、二-[(C₁-C₄) 烷基]氨基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氨羰基、二(C₁-C₄) 烷氨羰基、(C₁-C₅) 烷酰基、[(C₂-C₄) 链烯基]羰基、[(C₁-C₄) 烷氧基]羰基、(C₂-C₄) 烯氧羰基、

氨羰基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷氨羰基-(C₁-C₄)烷基、二-[(C₁-C₄)烷基]氨羰基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷氧羰基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₅)烷酰基-(C₁-C₄)烷基、[(C₂-C₄)链烯基]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(其中前述最后16个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、CN、(C₁-C₄)烷氧基及(C₁-C₄)卤烷氧基的基取代),或

(C₃-C₆)环烷基、(C₃-C₆)环烷氨基-(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、杂环基、杂环基-(C₁-C₄)烷基或前述最后10个基之一,在其非环部份中或优选在环部份中经一或多个来自卤素、硝基、氰基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)卤烷基、(C₁-C₄)卤烷氧基、甲酰基、(C₁-C₄)烷羰基、(C₁-C₄)烷氧羰基及(C₁-C₄)烷氧基的基取代,其中在基中的杂环基在每一个情况下包括3至9个环原子且1至3个选自N、O和S的杂环原子。

在此式(I)的化合物优选,其中

R³ 为氢、(C₁-C₆)烷基、(C₃-C₆)环烷基或苯基(其中前述最后3个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、羟基、氨基、甲酰基、氰基、氰硫基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)卤烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、单-(C₁-C₄)烷氨基、二-(C₁-C₄)烷氨基及苯基的基取代,其未经取代或经一或多个来自卤素、NO₂、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)卤烷基、(C₁-C₄)烷氧基和(C₁-C₄)卤烷氧基的基取代,并且在环基团的情况下还经来自(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)卤烷基的基取代),

或式-B'-A'的酰基,其中

A' 是氢或(C₁-C₆)烷基或苯基(其中前述最后2个基团各自为未

经取代或经一或多个来自卤素、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤烷氧基、苯基及 (C_3-C_6) 环烷基的基取代，其中前述最后2个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基和 (C_1-C_4) 卤烷氧基的基取代，并且在环基团的情况下还经来自 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 卤烷基的基取代)，且

B^* 是式 $-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 的二价基团，其中 $p=0, 1$ 或 2 ，且 R' 是氢、具有1至4个碳原子的烷基，

其中包括取代基的 $-B^*-A^*$ 具有1至12个碳原子，优选1至10个碳原子。

优选的式 $-B^*-A^*$ 的酰基实例是

(C_1-C_5) 烷酰基、 $[(C_1-C_4)$ 卤烷基]羰基、 $[(C_2-C_4)$ 链烯基]羰基、 $[(C_2-C_4)$ 卤烯基]羰基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷羰基、 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ 卤烷氧基]羰基、 $[(C_2-C_4)$ 卤烯氧基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ 卤烷氧基]羰基、苯羰基、苯氧羰基、苄羰基或苄氧羰基（其中前述最后4个基团各自在苯基环中为未经取代或经一或多个来自卤素、 CN 、 SCN 、 NO_2 、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基和 (C_1-C_4) 卤烷氧基的基取代），或 (C_1-C_4) 烷磺酰基或 (C_1-C_4) 卤烷磺酰基。

特别优选地为

R^3 为氢、氨基、甲酰基、 (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、 (C_2-C_6) 链烯基、卤代- (C_2-C_6) 链烯基、 (C_2-C_6) 炔基或苯基、 (C_1-C_4) 烷羰基、 (C_1-C_4) 烷氧羰基、氨羰基、苯氧基- (C_1-C_4) 烷基、苯基- (C_1-C_4) 烷基或前述最后6个基之一，在其非环部份中或优选在环部份中经一或多个来自卤素、 (C_1-C_4) 烷基及 (C_1-C_4) 烷氧基的基取代；

特别是氢、甲基、乙基、乙酰基、甲氧基乙酰基、甲酰基、甲氧基甲基、甲氧基乙基、苄基、4-氯苄基、苯酰基、苯基或 4-氯苯基；

尤其是氢。

特别有益的式 (I) 的化合物是，其中

R^4 为式 $-Z^1-R^6$ 的基，其中 Z^1 及 R^6 如后述的定义，

R^5 彼此各自独立地为卤素、CN、SCN、NO₂、式 $-Z^2-R^7$ 的基（其中 Z^2 及 R^7 如后述的定义），或者两个毗邻的 R^5 基一起是具有 4 至 6 个环原子的稠合环，其是碳环或包含 1 至 3 个选自 O、S 和 N 的杂环原子，并且其未经取代或经一或多个来自卤素、(C₁-C₄) 烷基及氧基的基取代，且

R^6 及 R^7 、 R^8 、 R^9 彼此各自独立地为氢（除了如果 Z^2 是直键时，则 R^7 不是氢）、或具有 1 至 10 个碳原子的非环烷基（优选 (C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 链烯基或 (C₂-C₆) 炔基）、或具有 3 至 6 个碳原子的环烷基（优选 (C₃-C₆) 环烷基或 (C₅-C₆) 环烯基）、或杂环基团（其优选具有 3 至 6 个环原子且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子）（其中前述最后的各个含碳基未经取代或经一或多个来自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、氨羰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₂-C₆) 烯氧基、(C₂-C₆) 炔氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-聚（烷撑氧基）、羟基-聚（烷撑氧基）、(C₁-C₆) 烷硫基、单-及二-[(C₁-C₆) 烷基]氨基、[(C₁-C₆) 烷基]羰基、[(C₂-C₆) 链烯基]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、单-及二-[(C₁-C₆) 烷基]氨羰基、苯基、苯氧基、(C₃-C₆) 环烷基、苯羰基、苯氧羰基、杂环基、(C₁-C₄) 烷磺酰基的基取代，并且在环基团的情况下还有经 (C₁-C₄) 烷基取代的，

其中前述最后 24 个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、CN、SCN、NO₂、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)卤烷氧基、甲酰基、(C₁-C₄)烷羰基、[(C₁-C₄)卤烷基]羰基、[(C₁-C₄)烷氧基]羰基、[(C₁-C₄)卤烷氧基]羰基的基取代,并且在环基团的情况下还经来自(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)卤烷基的基取代),且优选

R⁶及 R⁷、R⁸、R⁹彼此各自独立地优选为氢(除了如果 Z²是直键时,则 R⁷不是氢)、或具有 1 至 10 个碳原子的非环烃基(优选(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)链烯基或(C₂-C₆)炔基)、或具有 3 至 6 个碳原子的环烃基(优选(C₃-C₆)环烷基或(C₅-C₆)环烯基)或杂环基团(其优选具有 3 至 6 个环原子且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子)(其中前述最后的各个含烃基未经取代或经一或多个来自卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、磺酰基、氰基、氰硫基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷氧基、羟基-(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)烷氧基-聚(烷撑氧基)、羟基-聚(烷撑氧基)、(C₁-C₄)卤烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)卤烷硫基、单-(C₁-C₄)烷氨基、二-(C₁-C₄)烷氨基、[(C₁-C₄)烷基]羰基、[(C₁-C₄)烷氧基]羰基、氨羰基、单-(C₁-C₄)烷氨羰基、二-(C₁-C₄)烷氨羰基、苯基、苯氧基、(C₃-C₆)环烷基、苯羰基、苯氧羰基、杂环基,其中前述最后 6 个基团各自为未经取代或经一或多个来自卤素、CN、SCN、NO₂、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)卤烷基、(C₁-C₄)烷氧基和(C₁-C₄)卤烷氧基的基取代、及(C₁-C₄)烷磺酰基和(C₁-C₄)卤烷磺酰基的基取代,并且在环基团的情况下还有经来自(C₁-C₄)烷基或(C₁-C₄)卤烷基取代的),

并且在每一个情况下

Z¹及 Z²基团彼此各自独立地为直键或式-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'-的二价基团,其中 p=0、1 或 2,及 R'是

氢、具有 1 至 6 个碳原子的烷基、苯基、苄基、具有 3 至 6 个碳原子的环烷基或具有 1 至 6 个碳原子的烷酰基, 及

Z^1 及 Z^2 基团彼此各自独立地优选为直键或式 -O-、-S-、-SO₂-、-CO-、-O-CO-、-CO-O-、-NR'-、-NR'-CO-、-CO-NR'-的二价基团, 其中 R' 是氢、(C₁-C₄) 烷基或具有 1 至 4 个碳原子的烷酰基,

其中在基中的杂环基在每一个情况下具有 3 至 9 个环原子 (优选 3 至 6 个环原子) 且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子。

进一步优选

R^4 为氢、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基、氰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 烷氨基、二-[(C₁-C₄) 烷基]氨基、卤代-(C₁-C₄) 烷基、羟基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、卤代-(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷硫基、卤代-(C₁-C₄) 烷硫基、(C₂-C₆) 链烯基、卤代-(C₂-C₆) 链烯基、(C₂-C₆) 炔基、卤代-(C₂-C₆) 炔基、(C₁-C₄) 烷氨基-(C₁-C₄) 烷基、二-[(C₁-C₄) 烷基]氨基-(C₁-C₄) 烷基、(C₃-C₉) 环烷氨基-(C₁-C₄) 烷基、(C₃-C₉) 环烷基、具有 3 至 6 个环成员的杂环基-(C₁-C₄) 烷基 (其中在前述最后 3 个基中的环基团未经取代或经一或多个 (优选多达 3 个) 来自 (C₁-C₄) 烷基、卤素及氰基的基取代) 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) 烷氨基羰基、(C₁-C₄) 烷氧羰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氨基羰基-(C₁-C₄) 烷基、苯氧基-(C₁-C₄) 烷基、苯基-(C₁-C₄) 烷基、杂环基、杂环氨基、杂环氧基、杂环硫基、(C₁-C₅) 烷酰基氨基、N-[(C₁-C₅) 烷酰基]-N-[(C₁-C₄) 烷基]氨基、[(C₂-C₄) 链烯基]羰氨基、[(C₂-C₄) 炔基]羰氨基、[(C₁-C₄) 烷氧基]羰氨基、[(C₂-C₄) 烯氧基]羰氨基、[(C₂-C₄) 炔氧基]羰氨基、苯羰氨基、苯氧羰氨基、(C₁-C₄) 烷磺酰基、(C₂-C₄) 烯磺酰基

或前述最后 27 个基之一，在其非环部份中或优选在环部份中经一或多个来自卤素、硝基、氰基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤烷氧基、甲酰基、 (C_1-C_4) 烷羰基、 (C_1-C_4) 烷氧羰基、 (C_1-C_4) 烷氧基且在环部份的情况下还经来自 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 卤烷基的基取代，

其中在基中的杂环基在每一个情况下具有 3 至 9 个环原子且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子。

更优选：

R^4 为氢、 (C_1-C_4) 烷基、氰基- (C_1-C_4) 烷基、卤代- (C_1-C_4) 烷基、羧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、卤代- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_6) 链烯基、卤代- (C_2-C_6) 链烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_1-C_4) 烷氨基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_9) 环烷氨基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_9) 环烷基、具有 3 至 9 个环成员的杂环基- (C_1-C_4) 烷基（其中在前述最后 3 个基中的环基团未经取代或经一或多个（优选多达 3 个）来自 (C_1-C_4) 烷基、卤素及氰基的基取代）或

苯基、苯氧基- (C_1-C_4) 烷基、苯基- (C_1-C_4) 烷基、杂环基或前述最后 4 个基之一，在其非环部份中或优选在环部份中经一或多个来自卤素、硝基、氰基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤烷氧基、 (C_1-C_4) 烷羰基、 (C_1-C_4) 烷氧羰基、 (C_1-C_4) 烷氧基且在环部份的情况下还经来自 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 卤烷基的基取代，

其中在基中的杂环基在每一个情况下包括 3 至 9 个环原子且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子；

特别是 R^4 =氢或 (C_1-C_4) 烷基。

此外特别有益的式 (I) 化合物是，其中

R^5 如果 $n=1$ ，以及如果 n 大于 1 时，则在每一个情况下的 R^5 是彼此

独立地为卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、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) 烷氨基、二- $[(C_1-C_4)$ 烷基]氨基、卤代- (C_1-C_4) 烷基、羟基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、卤代- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基、卤代- (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_2-C_6) 链烯基、卤代- (C_2-C_6) 链烯基、 (C_2-C_6) 炔基、卤代- (C_2-C_6) 炔基、 (C_1-C_4) 烷氨基- (C_1-C_4) 烷基、二- $[(C_1-C_4)$ 烷基]氨基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_9) 环烷氨基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_9) 环烷基、具有 3 至 6 个环成员的杂环基- (C_1-C_4) 烷基（其中在前述最后 3 个基中的环基团未经取代或经一或多个（优选多达 3 个）来自 (C_1-C_4) 烷基、卤素及氰基的基取代）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) 烷氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷氧羰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氨基羰基- (C_1-C_4) 烷基、苯氧基- (C_1-C_4) 烷基、苯基- (C_1-C_4) 烷基、杂环基、杂环氨基、杂环氧基、杂环硫基、 (C_1-C_5) 烷酰基氨基、N- $[(C_1-C_5)$ 烷酰基]-N- $[(C_1-C_4)$ 烷基]氨基、 $[(C_2-C_4)$ 链烯基]羰氨基、 $[(C_2-C_4)$ 炔基]羰氨基、 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基]羰氨基、 $[(C_2-C_4)$ 烯氧基]羰氨基、 $[(C_2-C_4)$ 炔氧基]羰氨基、苯羰氨基、苯氧羰氨基、 (C_1-C_4) 烷磺酰基、 (C_2-C_4) 烯磺酰基或前述最后 28 个基之一，在其非环部份中或优选在环部份中经一或多个来自卤素、硝基、氰基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷氧基、甲酰基、 (C_1-C_4) 烷羰基、 (C_1-C_4) 烷氧羰基、 (C_1-C_4) 烷氧基且在环部份的情况下还经来自 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷烷基的基取代，

其中在基中的杂环基在每一个情况下包括 3 至 9 个环原子且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子，

或者

两个毗邻的 R^5 基一起是具有 4 至 6 个环原子的稠合环，其是碳

环或包含 1 至 3 个选自 O、S 和 N 的杂环原子，且未经取代或经一或多个来自卤素、(C₁-C₄) 烷基及氧基的基取代。

进一步优选的是：

R⁵，如果 n=1，以及如果 n 大于 1 时，则在每一个情况下的 R⁵ 是以彼此独立地为卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、氨羰基、(C₁-C₄) 烷基、氰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 烷氨基、二-[(C₁-C₄) 烷基]氨基、卤代-(C₁-C₄) 烷基、羟基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、卤代-(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₂-C₆) 链烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₁-C₄) 烷氨基-(C₁-C₄) 烷基、二-[(C₁-C₄) 烷基]氨基-(C₁-C₄) 烷基、(C₃-C₉) 环烷氨基-(C₁-C₄) 烷基、(C₃-C₉) 环烷基、具有 3 至 9 个环成员的杂环基-(C₁-C₄) 烷基（其中在前述最后 3 个基中的环基团未经取代或经一或多个（优选多达 3 个）来自 (C₁-C₄) 烷基、卤素及氰基的基取代）或

苯基、苯氧基、苯羰基、苯羰氧基、苯羰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氧羰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷氨羰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷羰基、(C₁-C₄) 烷氧羰基、(C₁-C₄) 烷氨羰基、苯氧基-(C₁-C₄) 烷基、苯基-(C₁-C₄) 烷基、杂环基、杂环氨基、杂环氧基、杂环硫基、(C₁-C₅) 烷酰基氨基、N-[(C₁-C₅) 烷酰基]-N-[(C₁-C₄) 烷基]氨基、苯羰氨基、苯氧羰氨基、(C₁-C₄) 烷磺酰基、(C₂-C₄) 烯磺酰基或前述最后 22 个基之一，在其非环部份中或优选在环部份中经一或多个来自卤素、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) 烷氧基且在环部份的情况下还经来自 (C₁-C₄) 烷基和 (C₁-C₄) 卤烷基的基取代，

其中在基中的杂环基在每一个情况下包括 3 至 6 个环原子且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子，

或者

两个毗邻的 R^5 基一起是具有 4 至 6 个环原子的稠合环，其是碳环或包括 1 至 3 个选自 O、S 和 N 的杂环原子，且未经取代或经一或多个来自卤素、 (C_1-C_4) 烷基及氧基的基取代。

进一步优选的是：

R^5 如果 $n=1$ ，以及如果 n 大于 1 时，则在每一个情况下的 R^5 是以彼此独立地为卤素、羟基、氨基、硝基、甲酰基、氰基、羰基、 (C_1-C_4) 单烷羰基、 (C_1-C_4) 二烷羰基、 (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) 烷氨基、卤代- (C_1-C_4) 烷基、羟基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 链烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_1-C_4) 烷氨基- (C_1-C_4) 烷基、二- $[(C_1-C_4)$ 烷基]氨基- (C_1-C_4) 烷基、或 $[(C_1-C_4)$ 烷基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ 卤烷基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基]羰基、甲酰基氨基、 $[(C_1-C_4)$ 烷基]羰氨基、 $[(C_1-C_4)$ 卤烷基]羰氨基、

苯基、苯氧基、苯羰基、苯羰氨基、杂环基或前述最后 5 个基，在其非环部份中或优选在环部份中经一或多个来自卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤烷氧基及 (C_1-C_4) 烷硫基的基取代；

特别是 R^5 =卤素（优选 F、Cl 或 Br）、羟基、甲酰基、氰基、 (C_1-C_4) 烷基（例如甲基、乙基或异丙基）或 (C_1-C_4) 烷氧基（例如甲氧基、乙氧基或异丙氧基）、或 (C_1-C_4) 烷氨基、 (C_1-C_4) 卤烷基、 (C_2-C_4) 链烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 $[(C_1-C_4)$ 烷基]羰基（例如乙酰基）、 $[(C_1-C_4)$ 卤烷基]羰基（例如三氟乙酰基）、或甲酰基氨基、 $[(C_1-C_4)$ 烷基]羰氨基或苯酰基氨基。

R^6 及 R^7 特别优选对应于优选的 R^4 及 R^5 。

特别有益的式(I)化合物还有, 其中

R^8 及 R^9 彼此各自独立地为氢、甲酰基、羧基、氰基、氰硫基、氨基羰基、 (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) 烷氨基、二 $[(C_1-C_4)$ 烷基]氨基、卤代- (C_1-C_4) 烷基、羟基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、卤代- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基、卤代- (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_2-C_6) 链烯基、卤代- (C_2-C_6) 链烯基、 (C_2-C_6) 炔基、卤代- (C_2-C_6) 炔基、 (C_1-C_4) 烷氨基- (C_1-C_4) 烷基、二 $[(C_1-C_4)$ 烷基]氨基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_9) 环烷氨基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_9) 环烷基、具有 3 至 6 个环成员的杂环基- (C_1-C_4) 烷基(其中在前述最后 3 个基中的环基团未经取代或经一或多个(优选多达 3 个)来自 (C_1-C_4) 烷基、卤素及氰基的基取代)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) 烷氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷氧羰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氨基羰基- (C_1-C_4) 烷基、苯氧基- (C_1-C_4) 烷基、苯基- (C_1-C_4) 烷基、杂环基、杂环氨基、杂环氧基、杂环硫基、 (C_1-C_5) 烷酰基氨基、N- $[(C_1-C_5)$ 烷酰基]-N- $[(C_1-C_4)$ 烷基]氨基、 $[(C_2-C_4)$ 链烯基]羰氨基、 $[(C_2-C_4)$ 炔基]羰氨基、 $[(C_1-C_4)$ 烷氧基]羰氨基、 $[(C_2-C_4)$ 烯氧基]羰氨基、 $[(C_2-C_4)$ 炔氧基]羰氨基、苯羰氨基、苯氧羰氨基、 (C_1-C_4) 烷磺酰基、 (C_2-C_4) 烯磺酰基或

前述最后 27 个基之一, 在其非环部份中或优选在环部份中经一或多个来自卤素、硝基、氰基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤烷氧基、甲酰基、 (C_1-C_4) 烷羰基、 (C_1-C_4) 烷氧羰基、 (C_1-C_4) 烷氧基且在环部份的情况下还经来自 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 卤烷基的基取代,

其中在基中的杂环基在每一个情况下具有 3 至 9 个环原子且 1 至

3个选自 N、O 和 S 的杂环原子。

进一步优选 R^8 及 R^9 彼此各自独立地为氢、 (C_1-C_4) 烷基、氰基- (C_1-C_4) 烷基、卤代- (C_1-C_4) 烷基、羟基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、卤代- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_6) 链烯基、卤代- (C_2-C_6) 链烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_1-C_4) 烷氨基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_9) 环烷氨基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_9) 环烷基、具有 3 至 9 个环成员的杂环基- (C_1-C_4) 烷基（其中在前述最后 3 个基中的环基团未经取代或经一或多个（优选多达 3 个）来自 (C_1-C_4) 烷基、卤素及氰基的基取代）或苯基、苯氧基- (C_1-C_4) 烷基、苯基- (C_1-C_4) 烷基、杂环基或前述最后 4 个基之一，在其非环部份中或优选在环部份中经一或多个来自卤素、硝基、氰基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤烷氧基、 (C_1-C_4) 烷羰基、 (C_1-C_4) 烷氧羰基、 (C_1-C_4) 烷氧基且在环部份的情况下还经来自 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 卤烷基的基取代，

其中在基中的杂环基在每一个情况下包括 3 至 9 个环原子且 1 至 3 个选自 N、O 和 S 的杂环原子；

特别是 R^8 及 R^9 彼此独立地为氢或 (C_1-C_4) 烷基。

特别有益的式 (I) 化合物还有，其中

X^1 , X^2 , X^3 , X^4 彼此各自独立地为碳原子（所述碳原子经氢原子或一个经定义取代 R^5 的取代基）或氮原子或两个毗邻的 X^1 , X^2 , X^3 及 X^4 符号在每一个情况下一起是式 -O-、-S-、-NH- 或 -NR- 的二价基团，其中 R 如 R^3 的定义，并优选氢或 (C_1-C_4) 烷基，其先决条件是 X^1 , X^2 , X^3 及 X^4 基与稠合环的键接的 C_2 单元一起形成碳环或杂环芳族 5-或 6-元环，

$(Y^1)_m$ 是 m 个二价基团 Y^1 ，其中 Y^1 基团各自彼此独立地是式 -O-、-CO-、-C(=NR')-、-S(O)_q-、-NR'- 或 -N(O)- 的基（其中 $q=0, 1$ 或

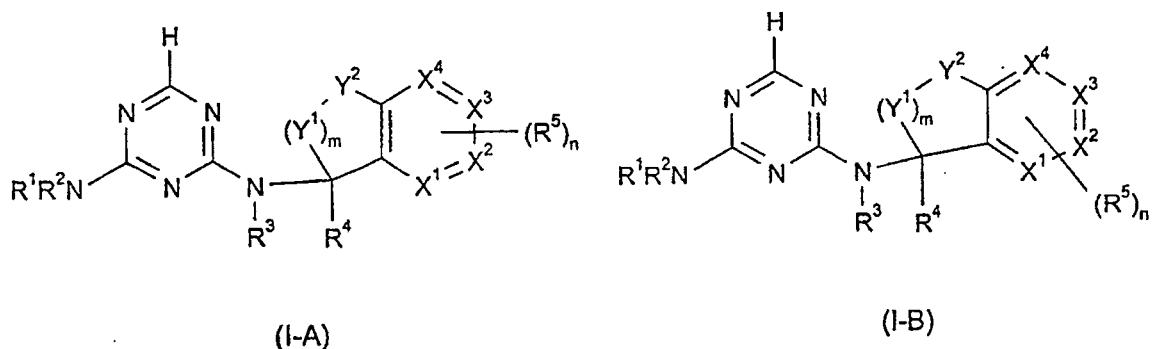
2 且 R^* 如 R^3 的定义, 并且优选氢、 (C_1-C_4) 烷基、苄基或苯基, 特别是氢、 (C_1-C_4) 烷基或苯基) 或已在以上定义的式 CR^8R^9 的基团, 且

Y^1 是优选式 CR^8R^9 的基团, 特别是 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, 特别是 $m=1$ 或 2, 且 $(Y^1)_m$ 优选 CH_2 、 CH_2CH_2 、 $CH_2CH_2CH_2$ 、 $CH(CH_3)$ 、 $CH(CH_3)CH_2$ 、 $CH_2CH(CH_3)$ 、 $CH(CH_3)_2CH_2$ 、 $CH(C_2H_5)CH_2$ 或 $CH_2CH(C_6H_5)$,

Y^2 如 Y^1 的定义或直键, 优选直键或式 $-O-$ 、 $-S-$ 、 CH_2 、 $CH(CH_3)$ 或 (C_1-C_4) 烷氨基的基团, 例如 $N(CH_3)$ 、 $N(C_2H_5)$ 、 $N(正-C_3H_7)$ 或 $N(异-C_3H_7)$ 或 $N(CH_2C_6H_5)$ 或 $N(C_6H_5)$,

其中两个毗邻的符号对 Y^1 和 Y^1 基团或符号对 Y^1 和 Y^2 基团是不具有相同意义的杂原子基团, 且其中 $(Y^1)_m$ 和 Y^2 基团与芳族环的键接的 C_2 单元及键接于 R^4 的碳原子一起形成稠合的碳环或杂环非芳族 4-至 8-元环。

如果一对毗邻的符号 X 一起是所提及的式 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NH-$ 或 $-NR-$ 的二价基团时, 则将在杂芳族基中的双键固定。在该情况下, 式 (I) 包含从属结构 (I-A) 及 (I-B):



作为在双环体系中的芳族碳环或杂环的基础例如考虑以下:

苯、吡啶、嘧啶、吡嗪、哒嗪、吡咯、吡唑、咪唑、呋喃、噻唑、噁

唑、异噁唑、噻吩、噻唑。

还优选式 (I) 化合物及其盐类, 其中来自 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 、 Y^2 、 n 及 m 组成的组的一或多个或全部基团和符号分别具有所述的优选的或特别优选的意义, 尤其是具有如下述表中的实例中的基团的意义。

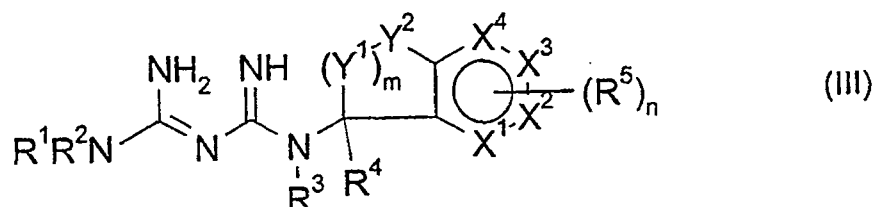
本发明还提供制备通式 (I) 化合物或其盐类的方法, 其特征在于,

a) 将式 (II) 化合物



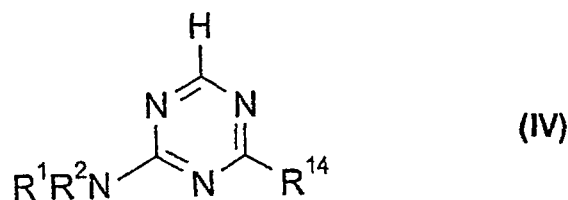
其中 R^{13} 是来自羧酸酯、羧酸原酯、酰氯、酰胺及碳酸酐的官能基团,

与式 (III) 的双胍或其酸加成盐反应



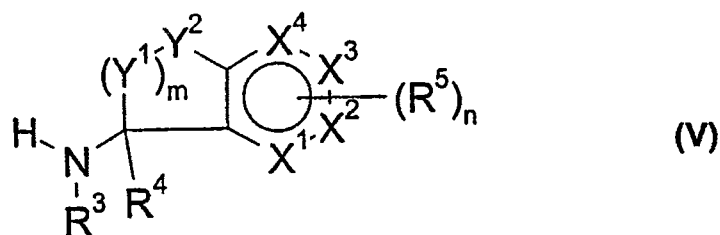
或

b) 将式 (IV) 化合物



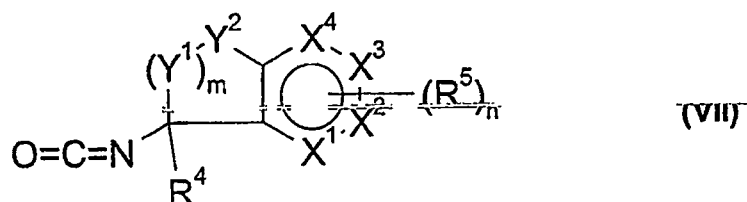
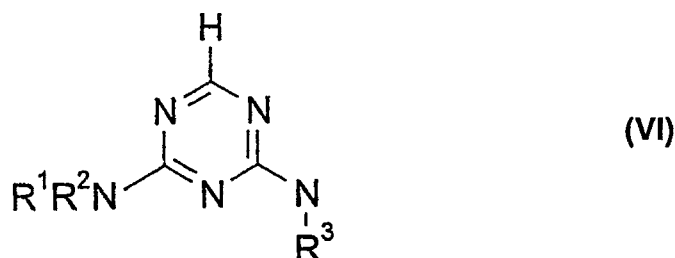
其中 R^{14} 是可交换基或离去基, 例如氯、三氯甲基、 (C_1-C_4) 烷磺酰基

和未经取代或经取代的苯基-(C₁-C₄)烷磺酰基或(C₁-C₄)烷苯基磺酰基, 与适宜的式(V)的胺或其酸加成盐反应



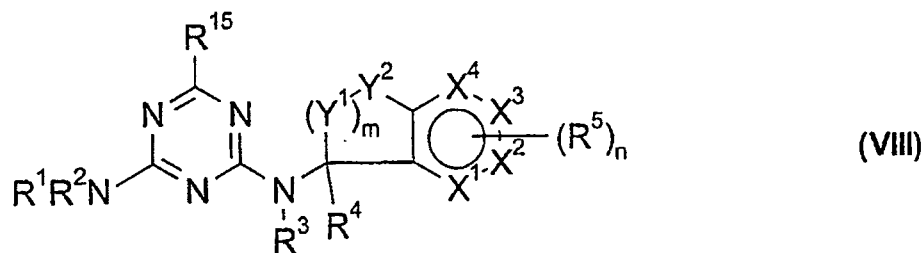
或

c) 将式(VI)的二氨基-1,3,5-三嗪与式(VII)的异氰酸酯反应



或

d) 使用适宜的方法除去在结构(VIII)的三嗪中的 R¹⁵基(其是离去基或可除去的基), 例如通过氢化作用可除去的基的氢化作用或通过离去基 R¹⁵(当 R¹⁵例如为氯或经硫键接的基团),



其中在式(II)、(III)、(IV)、(V)、(VI)、(VII)及

(VIII) 中的 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 Y^1 及 Y^2 基和符号 m 及 n 是如在式 (I) 中的定义。

在惰性有机溶剂中 (例如四氢呋喃 (THF)、二噁烷、乙腈、二甲基甲酰胺 (DMF)、甲醇及乙醇), 介于 -10°C 至溶剂沸点之间的温度下 (优选 20°C 至 60°C), 优选以碱催化的方式进行式 (II) 与式 (III) 化合物的反应; 如果使用式 (III) 的酸加成盐, 则通常借助碱将其原位释出所述化合物。适宜的碱或碱性催化剂是碱金属氢氧化物、碱金属氢化物、碱金属碳酸盐、碱金属烷醇化物、碱土金属氢氧化物、碱土金属氢化物、碱土金属碳酸盐或有机碱如三乙胺或 1,8-二氮杂二环 [5.4.0] 十一碳-7-烯 (DBU)。基于式 (III) 化合物在此使用例如从 0.1 至 5 摩尔当量的范围内的所述碱。相对于式 (III) 化合物可以使用例如等摩尔量或高达 10 摩尔当量的过量的式 (II) 化合物。类似的方法已知于文献 (参考: Shapiro, S. L.; Parrino, V. A.; Geiger, K.; Kobrin, S.; Freedman, L.; J Am Chem Soc, 1957, 79, 5664)。

在惰性有机溶剂中 (例如 THF、二噁烷、乙腈、DMF、甲醇及乙醇), 介于 -10°C 至所述溶剂或溶剂混合物的沸点之间的温度下 (优选 20°C 至 150°C , 特别是从 20°C 至 60°C , 只要以该温度开始反应), 优选以碱催化作用进行式 (IV) 与式 (V) 化合物的反应, 其中化合物 (V), 如果使用酸加成盐, 则视情况使用碱原位释出来。适宜的碱或碱性催化剂是碱金属氢氧化物、碱金属氢化物、碱金属碳酸盐、碱金属烷醇化物、碱土金属氢氧化物、碱土金属氢化物、碱土金属碳酸盐或有机碱如三乙胺或 1,8-二氮杂二环 [5.4.0] 十一碳-7-烯 (DBU)。基于式 (IV) 化合物在此使用例如从 1 至 3 摩尔当量的范围内的所述碱; 相对于式 (V) 化合物可以使用例如等摩尔量或高达 2 摩尔当量的过量的式 (IV) 化合物。类似的方法已知于文献 (参考 Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A. R. Katritzky,

C.W. Rees, Pergamon Press, Oxford, New York, 1984, Vol. 3; Part 2B; ISBN 0-08-030703-5, 482 页)。

在惰性有机溶剂中(例如四氢呋喃(THF)、二噁烷、乙腈、二甲基甲酰胺(DMF)),介于-10℃至溶剂沸点之间的温度下(优选 20℃至 60℃),优选以碱催化的方式进行式(VI)的二氨基-1,3,5-三嗪与式(VII)的异氰酸酯的反应。适宜的碱或碱性催化剂是碱金属氢氧化物、碱金属氢化物、碱金属碳酸盐、碱金属烷醇化物、碱土金属氢氧化物、碱土金属氢化物、碱土金属碳酸盐或有机碱如三乙胺或1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)。基于式(VI)化合物使用例如从 0.5 至 3 摩尔当量的范围内的所述碱。相对于式(VI)化合物可以使用例如等摩尔量或稍过量的式(VII)化合物。原则上用于非环及芳族衍生物的相应方法已知于文献(参考 B. Singh; Heterocycles, 1993, 34, 929-935 页)。

优选在惰性有机溶剂中(例如四氢呋喃(THF)、二噁烷、适宜的醇(如乙醇)、乙酸或其另外的混合物),介于-10℃至溶剂沸点之间的温度下(优选 20℃至 60℃),在适宜的氢化催化剂(如在适宜的载体(如活性炭)上的阮内镍或碱土金属催化剂如钯或铂)的辅助下通过视需要用酸催化的氢化作用除去式(VIII)的二氨基-1,3,5-三嗪的 R^{15} 基,其中在适宜于该目的装置中将氢引入反应混合物中或将反应混合物曝露于高压下的氢气中。相应的方法已知于文献(Hirt, R.; Nidecker, H.; Berchtold, R.; Helv. Chim. Acta.; 1950, 33, 1365)。

式(II)、(III)、(IV)、(V)、(VI)、(VII)及(VIII)的原料化合物是或市售商品,或可以类似于已知的文献方法制备。所述化合物可以例如用一种以下说明的方法制备。

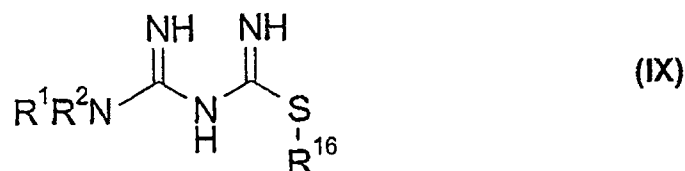
式(II)化合物可以视情况通过氰基胍与式(V)的胺或其盐类的反应制备。对此可以例如将两个组分在惰性溶剂中(如二氯苯)加热至 100 至 190℃,并接着将作为盐类析出的双胍通过抽滤作用分

离。相应的方法例如在 S. L. Shapiro, V.A. Parrino, L. Freedmann; JACS 81, (1959), 第 3728 页或 H.M. Eisa, A. S. Tantawy, M.M. EI-Kerdawy; Pharmazie 46, (1991), 第 182 页中有描述。该反应可以视需要通过加入金属盐类(如硫酸铜(II)、氯化锌(II)或氯化铁(III)催化(T. Suyama, T. Soga, K. Miauchi; NIPPON KAGAKU KAISHI (1989), (5), 第 884-887 页), 其中该反应可以一般在 50℃至所述溶剂的回流温度的范围内的较低温度下进行。该反应视情况可以在多种溶剂中进行, 如 THF、二噁烷、醇类或醚类。

对应于式(V)的胺可以例如通过可用对应的酮制得的对应肟的氢化作用制备。A.B. Sen, S.B. Singh; J. Ind. Chem. Soc.; 43 (1966), 第 521 页中描述有相应的方法, 其中利用钠转化为乙醇钠的反应作为氢来源。此外 Sarges 等人的 J. Med. Chem.; 16, (1973), 第 1003, 1008 页描述了将酮转化成肟及其钨催化剂氢化得到对应胺盐酸的方法。还有阮内镍的氢化作用(参考: D. Barbry, D. Couturier, N. Abdellatifi, D. Lesieur, C. Lespagnol; J. Heterocycl. Chem.; 28, (1991), 第 449 页)或用氢化硼-化合物的氢化作用(A.K. Gosh, S.P. McKee, W.M. Sanders; Tetrahedron Lett. 32, (1991), 第 711-714 页)和其它用于对应的二环衍生物的方法的描述, 并可用于合成对应于式(V)的胺。

例如可以如下制备式(IV)化合物或其直接的前体:

1. 通过式(II)化合物与式(IX)的醚基硫脲衍生物的反应

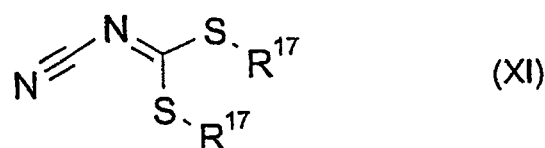


其中 R^{16} 是 (C_1-C_4) 烷基或苯基- (C_1-C_4) 烷基, 且 R^1 及 R^2 如在式(I)中的定义, 得到其中 $\text{R}^{14} = -\text{SR}^{16}$ 的式(IV)化合物。

2. 通过式 (X) 的脒或其酸加成盐



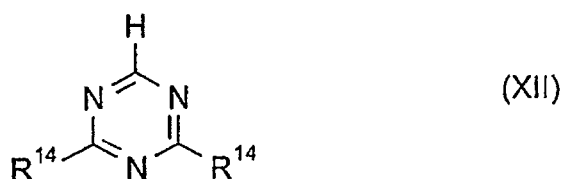
与式 (XI) 的 N-氰基二硫代亚氨基碳酸酯的反应,



其中 R^{17} 是 (C_1-C_4) 烷基或苯基- (C_1-C_4) 烷基, 得到其中 $\text{R}^{14}=\text{S}-\text{R}^{17}$ 的式 (IV) 化合物。

3. 通过碱金属二氰脒与前述的 (II) 的羧酸衍生物的反应, 得到其中 $\text{R}^{14}=\text{NH}_2$ 的式 (VI) 化合物。

视情况也有可能用类似于上述 1-3 所示的方法制备具有 2 个可交换基 R^{14} (参考式 (IV)) 的式 (XII) 中间体



所述可交换的基团先后用适宜的胺类或氨取代, 以便类似于常规已知的方法获得式 (I) 的化合物。也有可能对应地将市售的式 (XII) 化合物或依据其它方法可制备的式 (XII) 化合物改变。

视情况还可以将由类似于上述 1-3 所示的方法获得的式 (IV) 或 (XII) 中间体, 其中 R^{14} 是 (C_1-C_4) 烷硫基或苯基- (C_1-C_4) 烷硫基, 通过氯化或氧化作用分别转化成更具反应性的式 (IV) 及 (XII) 衍生

物。

在有机溶剂中（例如丙酮、THF、二噁烷、乙腈、DMF、甲醇、乙醇）， -10°C 至溶剂沸点的温度下（优选 0°C 至 20°C ），优选以碱催化的方式进行式（II）的羧酸衍生物与式（VIII）的醚基硫脲衍生物的反应。但是该反应也可以在水或与一或多种上述有机溶剂的水性溶剂混合物中进行。如果使用（VI）作为酸加成盐，则其可以视情况用碱原位释放出来。适宜的碱或碱性催化剂是碱金属氢氧化物、碱金属氢化物、碱金属碳酸盐、碱金属烷醇化物、碱土金属氢氧化物、碱土金属氢化物、碱土金属碳酸盐或有机碱如三乙胺或 1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯（DBU）。基于式（VIII）化合物使用从 1 至 10 摩尔当量的范围内的所述碱。式（II）化合物和式（III）化合物可以例如等摩尔量地使用或使用高达 2 摩尔当量的过量的式（II）化合物。类似的方法已知于文献（参考 H. Eilingsfeld, H. Scheuermann, Chem. Ber.; 1967, 100, 1874）。

在惰性有机溶剂中（例如乙腈、DMF、二甲基乙酰胺（DMA）、N-甲基吡咯烷酮（NMP）、甲醇及乙醇），从 -10°C 至溶剂沸点的温度下（优选 20°C 至 80°C ），优选以碱催化的方式进行式（IX）的脒与式（X）的 N-氰基二硫代亚氨基碳酸酯的反应。如果使用（VII）作为酸加成盐，则视情况可以将其用碱原位释放出来。适宜的碱或碱性催化剂是碱金属氢氧化物、碱金属氢化物、碱金属碳酸盐、碱金属烷醇化物、碱土金属氢氧化物、碱土金属氢化物、碱土金属碳酸盐或有机碱如三乙胺或 1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯（DBU）。基于式（X）化合物在此使用 1 至 3 摩尔当量的范围内的所述碱。通常可以使用与式（II）化合物等摩尔量或高达 2 摩尔当量的过量的式（IX）及（X）化合物。类似的方法已知于文献（参考 T.A. Riley, W.J. Henney, N.K. Dalley, B.E. Wilson, R.K. Robins; J. Heterocyclic Chem.; 1986, 23(6), 1706-1714）。

碱金属二氮脒与式（II）的羧酸衍生物（其中 R^{13} 是优选碳酰氯

或碳酰胺的官能基)的反应可以制备其中 R^{14} =氯的式 (XII) 中间体。例如在惰性有机溶剂中 (例如甲苯、氯苯或氯化烃), 在介于 -10°C 至溶剂沸点之间的温度下 (优选 20°C 至 80°C) 以酸催化作用进行反应组份的反应, 其中可将所形成的中间体使用适宜的氯化剂 (例如磷酰氯) 原位氯化。适宜的酸是例如氢卤酸 (如 HCl) 或另外的路易斯酸 (例如 AlCl_3 或 BF_3 (参考 US-A-5095113、DuPont 及其中所引用的文献))。

可将其中 $R^{14}=(\text{C}_1-\text{C}_4)$ 烷硫基或未经取代的苯基 (C_1-C_4) 烷硫基的式 (IV) 或 (XII) 中间体在惰性有机溶剂中 (例如甲苯、氯苯或氯化烃或其它) 中, 在介于 -40°C 至溶剂沸点之间的温度下 (优选 20°C 至 80°C) 以适宜的氯化剂 (例如氯单质或磷酰氯) 转化成更具反应性的式 (IV) 或 (X) 的氯三嗪, 其中 $R^{14}=\text{Cl}$ (参考 J.K. Chakrabarti, D.E. Tupper; Tetrahedron 1975, 31 (16), 1879-1882)。

可将其中 $R^{14}=(\text{C}_1-\text{C}_4)$ 烷硫基或未经取代或经取代的苯基 (C_1-C_4) 烷硫基或 (C_1-C_4) 烷苯硫基的式 (IV) 或 (XII) 中间体在适宜的溶剂中 (例如氯化烃、乙酸、水、醇、丙酮或其混合物) 在介于 0°C 至溶剂沸点之间的温度下 (优选 20°C 至 80°C) 使用适宜的氧化剂 (例如间-氯代过苯甲酸、过氧化氢、过氧单硫酸钾) 分别氧化 (参考: T. A. Riley, W. J. Henney, N. K. Dalley, B. E. Wilson, R. K. Robins; J. Heterocyclic Chem.; 1986, 23 (6), 1706-1714)。

在适宜的溶剂中 (例如 THF、二噁烷、醇、DMF 或乙腈或其混合物), 在介于 -10°C 至溶剂沸点之间的温度下 (优选 10°C 至 25°C), 以其中 R^{14} 是例如卤素、全卤甲基、 (C_1-C_4) 烷亚硫酰基、 (C_1-C_4) 烷磺酰基或其它文献已知的离去基团的式 (XII) 类似化合物中的可交换基的选择性亲核取代作用 (若适当时, 在碱性条件下) 也会获得式 (IV) 类似化合物。适宜的碱或碱性催化剂是碱金属氢氧化物、碱金属氢化物、碱金属碳酸盐、碱金属烷醇化物、碱土金属氢氧化物、碱土金属氢化物、碱土金属碳酸盐或有机碱如三乙胺或 1,8-二氮杂二

环[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)。使用基于式(XII)化合物在1至3摩尔当量的范围内的所述碱,通常使用等摩尔量或高达2摩尔当量的过量的亲核剂,并且视情况其本身也可以作为碱使用。类似的方法已知于文献(参考:V.I. Kaelarev, Dibi Ammar, A.F. Lunin; Ximinya Geterosikl. Soedin., 1985, N11, 1557-1563)。

可以额外地以并行的方式制备按照上述的方法可以合成的化合物(I)的集合,其可手动或半自动或全自动地进行。在此,将反应操作、产物或中间体的加工或纯化自动化是可能的。总而言之在此理解为相同于例如S. H. DeWitt in "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Band 1, Verlag Escom 1997, 69~77页所描述的方法。

一系列商购可得的装置,例如Stem Corporation公司, Woodrolfe Road, Tollesbury, Exxex, CM9 8SE England或H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Deutschland所提供的,可用于并行的反应操作和加工。式(I)化合物或在制备期间所获得的中间体的并行纯化此外还可使用层析装置,例如公司ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA的装置。所述的装置产生各工序步骤自动化的模式化程序方式,但手动操作必需在工序步骤之间进行。这可通过采用半整合或完全整合的自动化系统予以避免,其中所述的自动化模组通过例如自动机械操作。这种自动化系统可从例如Zymark Corporation公司, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, USA获得。

除了此处所描述之外,式(I)化合物可部分或完全通过固相支持的方法制备。针对此目的,合成的个别中间步骤或所有中间步骤,或适用于所述方法的合成均与合成树脂密切相关。该固相支持合成方法充分描述于专业文献中,例如Barry A. Bunin的"The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998。

固相支持合成法的应用可使一系列文献已知的方法手动或自动地进行。例如，使“茶包法”半自动化（Houghten, US 4,631,211; Houghten et al., Proc. Natl. Acad. Sci, 1985, 82, 5131-5135），其中采用购自 IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, USA 的产品。固相支持并行合成法的自动化能例如通过使用 Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, USA 或 MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Deutschland 的装置顺利地进行。

此处所述的制备方法提供以集合物质或库物质形式的式（I）化合物。本发明还提供包含至少两种式（I）化合物的库及其前体产物。

适宜于制备式（I）化合物的酸加成盐的酸是以下的酸类：氢卤酸（如氢氯酸或氢溴酸）、还有磷酸、硝酸、硫酸、单-或二-官能羧酸及羟基羧酸（如乙酸、马来酸、琥珀酸、富马酸、酒石酸、柠檬酸、水杨酸、山梨酸或乳酸），以及磺酸（如对-甲苯磺酸或 1,5-萘二磺酸）。式（I）的酸加成化合物可以依照常规的盐生成的方法以简单的方式获得，例如将式（I）化合物溶解在适宜的有机溶剂中（例如甲醇、丙酮、二氯甲烷或汽油）及在 0 至 100℃ 的温度下加入酸，并可将其以已知的方式分离（例如过滤），并且视需要通过用惰性有机溶剂清洗将其纯化。

优选在惰性极性溶剂中（例如水、甲醇或丙酮）及在 0 至 100℃ 的温度下制备式（I）化合物的碱加成盐类。适宜于制备根据本发明的盐类的碱是例如碱金属碳酸盐（如碳酸钾）、碱金属及碱土金属氢氧化物（例如 NaOH 或 KOH）、碱金属及碱土金属氢化物（例如 NaH）、碱金属及碱土金属烷醇化物（例如甲醇钠、叔丁醇钾）或氨或乙醇胺。

在上述的方法变化中称为“惰性溶剂”的溶剂是指，在每一种情况的反应条件下具有惰性的溶剂，而并非必须是指在任何反应条件下具有惰性。

本发明式(I)化合物及其盐类,对于宽谱的经济重要的单子叶和双子叶有害植物具有优越的除草活性。即使对于难以控制的由地下茎、根茎或其它多年生器官产生出的多年生杂草,也能被本发明的化合物良好地控制。就此而论,将物质以播种前、萌芽前或萌芽后的方法施用并不重要。

详细例举一些通过本发明的化合物可以得以控制的单-及双子叶杂草的代表,但是不限于所说明的特定物种。

在单子叶杂草方面,例如一年生的主要有剪股颖、看麦娘、Apera、燕麦草、Brachicaria、雀麦草、龙爪茅、马唐、稗草、荸荠、牛筋草、羊茅、飘拂草、鸭嘴草、黑麦草、雨久花、黍、雀稗、藎草、梯牧草、早熟禾、慈姑、蔗草、粟、密穗桔梗和莎草,及多年生的小麦草、狗牙根、白茅、高粱和多年生的莎草被有效地控制。

在双子叶杂草类实例中,作用谱扩大至如下的种类,例如一年生的猪殃殃、苘菜、婆婆纳、野芝麻、繁缕、苋、白芥、牵牛花、母菊、苘麻、黄花稔,及多年生的旋花、蓟、酸模、蒿。

此外对于双子叶杂草如豚草、春黄菊、飞廉、矢车菊、藜、蓟、旋花、曼陀罗、Emex、鼬瓣花、牛膝菊、独行草、母草、罂粟、马齿苋、蓼、毛茛、焊菜、节节菜、千里光、田菁、茄、苦苣菜、蒲公英、车轴草、荨麻、苍耳达到了除草作用。

本发明活性成份也能突出地控制发生于特定的稻米生长条件下的有害植物如例如慈姑、泽泻、荸荠、蔗草及莎草。

如果在发芽前将本发明的化合物施加于土壤表面,则完全防止杂草植物发芽,或杂草生长至子叶期就停止生长,最后在经过三至四周之后就完全死亡。

如果在芽后将所述活性物质施加至植物的绿色部分,同样在处理之后的极短时间内生长急剧停止,杂草植物停留在施药时的发育期,或在特定时间之后完全死亡,从而以这种方式在早期并且持续地消除

对作物有害的杂草竞争。

尽管本发明的化合物对于单子叶和双子叶杂草具有优越的除草活性，但具有经济重要意义的作物例如小麦、大麦、黑麦、稻、玉米、甜菜、甘蔗、棉花和大豆则完全不受损害，或仅有可忽略程度的损害。因此，本发明的化合物特别适用于在农作物上选择性地控制不需要的植物生长。

由于广效的抗不希望的植物生长，根据本发明的式(I)化合物或其盐类还可以用于树木、葡萄及核果作物的种植中。此外还可以应用于需要避免植物生长的工业区域、还有工业空地或例如马路或铁道。

此外，本发明物质对于作物具有优越的生长调节性。它们调节性地参与植物新陈代谢，因此可通过例如引发脱水及生长充实而有目标地影响植物成份并且促进收获。此外，也适用于一般性调节并且抑制不期望的植物生长，在该过程中不伤害该植物。由于可减少或完全预防作物倒伏，植物生长的抑制在许多单子叶及双子叶作物中扮演着重要的角色。

因为其除草和植物生长调节性质，所述活性物质也可以用于控制已知或发展中的转基因植物作物中的有害植物。转基因植物表现有特别优越的性质，例如对某些农药的抗性，尤其是特定除草剂、对植物病害或植物病害病原体，如某些昆虫或微生物如真菌、细菌或病毒的抗性。其它的特殊性质涉及例如收成产物的数量、质量、储藏性能、组分和特定成分。因此，转基因植物以经提高的淀粉含量或经改良的淀粉品质或那些具有不同的脂肪酸组分的收成产物而著称。

优选将本发明的式(I)化合物或其盐类用于具有经济重要性的转基因作物和观赏植物例如谷类如小麦、大麦、黑麦、燕麦、粟、稻、木薯和玉米，或其它作物甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、西红柿、豌豆和其它植物。

本发明的式(I)化合物作为除草剂优选用于对抗或通过基因工程改变为对抗除草剂毒性作用的经济作物中。

传统的培育比已知植物具有改良性质的新颖植物的方式包括例如经典的培育方法和突变种的制造。可替换的是,借助基因工程方法产生具有改良性质的新颖植物(参照例如 EP-A 0221 044、EP-A 0 131 624)。例如,下列的几项描述

- 用基因技术改变植物用于改良植物中合成的淀粉(例如 WO 92/11376、WO 92/14817 及 WO 91/19806),

- 对抗草铵膦型(比较例如 EP-A 0 242 236、EP-A 0 242 246)或草甘膦型(WO 92/00377)或磺酰脲型(EP-A 0 257 993、US-A 5013659)的特定除草剂的转基因作物植物。

- 具有产生苏云金芽孢杆菌毒素(Bt 毒素)能力的转基因作物,例如棉花,使该植物对抗特定害虫(EP-A0 142 924, EP-A0 193 259)。

- 具有改良脂肪酸组成的转基因作物(WO 91/13972)。

大量可制备具有改进性质的新颖转基因植物的分子生物技术基本上是已知的;参照例如, Sambrook 等, 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2nd ed. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; 或 Winnacker "Geneund Klone" [Genes and Clones], VCH Weinheim, 2nd edition 1996, 或 Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431)。

为了进行此类的遗传改造可以将核酸分子导入质粒中,其可通过 DNA 序列的重组令序列发生诱变或改变。使用上述提到的标准方法,可以例如调换碱基、部份序列去除或加入天然序列或合成序列。为了使 DNA 片段彼此连结可以将连接物或联结子与片段连结。

具有降低活性的植物细胞的基因产物可以例如通过下列方式制备:表达至少一种相应的反义 RNA,有义 RNA 达到协同抑制效果,或表

现至少一种相应的经构筑的核糖酶，其特异性切割上述提到的基因产物的转录本。

对此即可以使用一种 DNA 分子，其含有基因产物的全部的编码序列（包括可能存在的两侧翼序列），也可以使用一种 DNA 分子，其只含有部分的编码序列，该序列部份必须足够长以引起细胞的反义效果。也可以使用 DNA 序列，其具有与基因产物的编码序列高度的同源性，但不是完全地相同。

在植物中表达核酸分子时，经合成的蛋白质可定位于植物细胞的任意室腔内。然而，要达到定位于某一特定室腔，可以例如使编码区与确保特定室腔定位的 DNA 序列连结。此类序列是本领域技术人员所熟悉的（参见例如，Braun 等，EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter 等，Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald 等，Plant J. 1 (1991), 95-106）。

使用已知的技术可以使转基因植物细胞再生成整株植物。该转基因植物基本上可以是任意一种植物种类的植物，即包括单子叶植物又包括双子叶植物。

如此获得的转基因植物，通过同源的（=天然的）基因或基因序列的过度表达，遏抑或抑制，或通过异源的（=外来的）基因或基因序列的表达得到具有经改变的性质。

本发明的式（I）化合物可优选地用于对选自磺酰脲、草甘膦铵或草甘膦异丙铵及类似的活性物质的除草剂有抗性的转基因作物。

当本发明活性物质用于转基因作物时，除了在其它作物上可被观察到的抗有害植物的效果之外，经常对于个别转基因作物的应有具有特别效果，例如改变的或特别扩展的可被控制的杂草谱，改变的施用率（优选与转基因作物有抗性的除草剂有良好的可综合性），及对转基因植物的生长和产率上的影响。

因此本发明还提供一种本发明的式(I)化合物作为除草剂的用途,用于控制转基因作物中的有害植物。

本发明的化合物可以可湿性粉剂、乳油、可喷洒溶液、喷粉剂或颗粒剂。本发明因此还提供一种包含本发明的式(I)化合物的除草和植物生长调节组合物。

分别视其生物和/或物理化学参数而定可以各种方式配制本发明的式(I)化合物。适合的制剂是,例如可湿性粉剂(WP)、水溶性粉剂(SP)、水溶性浓缩物、乳油(EC)、乳液(EW)如水包油及油包水乳液、可喷洒溶液、悬浮浓缩物(SC)、油或水基的分散剂、油可溶混的溶液、胶囊悬浮液(CS)、粉剂(DP)、浸种组合物、播散及土壤施用粒剂、微粒形式的颗粒(GR)、喷洒颗粒、涂覆颗粒及吸附颗粒、水分散颗粒(WG)、水溶性颗粒(SG)、ULV制剂、微型胶囊类和蜡类。

所述各种制剂类型基本上是已知的,并例如在:Winnacker-Küchler,“Chemische Technologie(化学技术)”,第7册,C. Hauser Verlag München,第四版,1986;Wade van Falkenberg,“Pesticides Formulations(农药制剂)”,Marcel Dekker N. Y., 1973;K. Martens,“喷雾干燥手册(Spray Drying Handbook)”,第三版,1979,G. Goodwin Ltd. London中有描述。

所述必要的助剂,如惰性材料、表面活性剂、溶剂及其它的添加剂同样是已知的并例如在:Watkins,“Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carrier(杀虫粉尘稀释液和载体手册)”,第二版,Darland Books, Caldwell N. J.; H. v. Olphen,“Introduction to Clay Colloid Chemistry(粘土胶体化学入门)”,第二版,J. Wiley & Sons, N. Y.; Marsden,“Solvents Guide(溶剂指南)”,第二版,Interscience, N. Y. 1963; McCutcheon's,“Detergents

and Emulsifiers Annual” , MC Publ. Corp. , Ridgewood N.J. ; Sisley and Wood, “Encyclopedia of surface Active Agents (表面活性剂百科全书)” , Chem. Publ. Co. Inc. , N.Y. 1964; Schönfeldt, “Grenzflächenaktive Äthylenoxid- addukte (表面活性的环氧乙烷加成物)” , Wiss Verlagsgesell. , Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, “Chemische Technologie” , 第7册, C. Hauser Verlag München, 第四版, 1986中有描述。

以这些制剂为基础,以即刻可使用形式或者桶混合形式制备具有其它农药活性物质如除草剂、杀真菌剂、杀虫剂以及安全剂、肥料和/或生长调节剂的组合物。

可湿性粉剂是均匀分散在水中的制剂,其在活性物质以外除了稀释剂或惰性物质,还含有离子型和/或非离子型表面活性剂(润湿剂、分散剂),例如:聚氧乙基化的烷基酚类、聚乙氧基化的脂肪醇类或脂肪胺类、脂肪醇聚二醇醚硫酸酯、烷基磺酸酯类或烷基苯磺酸酯类、木质磺酸钠、2,2'-二萘甲烷-6,6'-二磺酸钠、二丁基萘磺酸钠或油酰甲基牛磺酸钠。制备可湿性粉剂时,除草活性物质在常用装置如锤磨机、鼓风磨机和喷气磨机中磨细,同时或随后与助剂混合。

乳油是通过将活性物质溶解在有机溶剂中,如丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或还有沸点较高的芳族或烃或添加一个或多个离子型和/或非离子型表面活性剂(乳化剂)的有机溶剂混合物。可以使用的乳化剂的实例是:烷基苯磺酸的钙盐(如十二烷基苯磺酸钙)或非离子型乳化剂,如脂肪酸聚乙二醇醚、烷基聚乙二醇醚、脂肪醇聚乙二醇醚、环氧丙烷-环氧乙烷-缩合产物、烷基聚醚、山梨糖醇酯例如山梨糖醇脂肪酸酯或聚氧乙烯山梨糖醇酯,例如聚氧乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯。

粉剂是将活性物质与磨成细粉状的固体物质加以磨碎而得,所述固体物质例如:滑石、天然粘土(如高岭土、膨润土和叶蜡石)或硅藻土。

悬浮液浓缩物可为水基或油基。例如，该制剂在添加或不添加上述其它剂型实例中的表面活性剂下，可通过利用商购可得常用球磨机湿磨制得。

乳液例如水包油乳液（EW）可以利用含水的有机溶剂，使用搅拌器、胶体研磨器和/或静态混合器，如果需要的话，可加入例如上述其它制剂类型实例中的表面活性剂。

粒剂的制备可以通过将活性物质喷洒在吸附性粒状的惰性物质上，或将活性物质浓缩物借助粘合剂（如聚乙烯醇，聚丙烯酸钠或矿物油）涂敷在载体（如砂、高岭土或粒状惰性物质）的表面上。适宜的活性物质也可以使用制造肥粒料常规方法并视需要与肥料的混合物一同粒化。

水分散性粒剂通常是利用常规方法如喷雾式干燥法、流体化床式制粒法、碟式制粒法、用高速搅拌器混合法混合和无固体惰性物质的挤压制备而成。

关于碟式、流化床、挤压机和喷撒颗粒剂的制备方法，参见下述工艺，例如“喷雾干燥手册”第3版，1979年，G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, “团聚作用”，化学和工程 1967, pages 147 et seq.; “Perry’s 化学工程师手册”，第5版，McGraw-Hill, New York 1973, 第8-57页。

对于更详细的作物保护剂制剂参见，例如 G.C. Klingman, “杂草控制科学”，John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 第81-96页和 J.D. Freyer, S.A. Evans, “杂草控制手册”，第5版，Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, 第101-103页。

该农业化学制剂通常含有 0.1~99 重量%，尤其是 0.1~95 重量%的式（I）活性物质。

就可湿性粉剂而言，活性物质的浓度约为 10~90 重量%，至 100 重量%的剩余部分由常规制剂组分构成。就乳油而言，活性物质的浓度可以例如是 1~90，优选 5~80 重量%。粉状制剂含有 1~30 重量%的活性物质，通常优选 5~20 重量%的活性物质，而可喷雾型溶液含有约 0.05~80 重量%，优选 2~50 重量%的活性物质。就水分散性粒剂而言，活性物质的含量部分取决于活性物质是否是液态或固态，所使用的粒化助剂、填料等。水分散性粒剂的活性物质含量介于 1~95 重量%之间，优选介于 10~80 重量%之间。

此外，所述的活性物质制剂可包含分别为常用的胶粘剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、防冻剂、溶剂、填料、载体、着色剂、消泡剂、蒸发抑制剂、pH 调节剂和粘度调节剂。

式 (I) 化合物或其盐类可以以其自身或以其制剂（调配物）的形式与其它杀虫有效的物质（如杀昆虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、除草剂、杀真菌剂、安全剂、肥料和/或生长调节剂）组合使用，例如以成品制剂或桶混合物的形式。

以混合制剂或桶混物形式与本发明活性物质组合的适宜活性物质例如可使用已知的活性物质，例如在 Weed Research 26, 441-445, (1986)，或 “The Pesticide Manual”，12th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc., of Chemistry, 2000/2001 及其中所列的文献所述。例如，作为可与式 (I) 的化合物组合的除草剂或植物生长调节剂例如考虑下述活性物质；所述化合物在下文中或者根据国际标准化组织 (ISO) 以“通用名”表示或化学名称且视需要与其常用编码一起表示：

乙草胺 (acetochlor)、三氟羧草醚 (acifluorfen) (-钠)、苯草醚 (aclonifen)、AKH 7088 (即 [[1-[5-[2-氯基-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-硝苯基]-2-甲氧基亚乙基]氨基]氧基]乙酸及其甲酯)、甲草

胺(alachlor)、禾草灭(-钠)(alloxydim)、莠灭净(ametryn)、呋喃丹(amidochlor)、酰嘧磺隆(amidosulfuron)、杀草强(amitrol)、AMS(即氨基磺酸酯)、莎稗磷(anilofos)、磺草灵(asulam)、莠去津(atrazine)、唑啶炔草(azafenidin)、四唑嘧磺隆(azimsulfurone)(DPX-A8947)、叠氮津(aziprotryn)、燕麦灵(barban)、BAS 516H(即5-氟-2-苯基-4H-3,1-苯并噁嗪-4-酮)、氟丁酰草胺(beflubutamid)、乙基草除灵(benazolin-ethyl)、氟草胺(benfluralin-methyl)、呋草黄(benfuresate)、苄嘧磺隆(bensulfuron)、地散磷(bensulide)、灭草松(bentazone)、benzobicyclon、吡草酮(benzofenap)、氟磺胺草(benzofluor)、乙基新燕灵(benzoylprop)、噻草隆(benzthiazuron)、双丙氨酰膦(bialaphos)、治草醚(bifenox)、双嘧苯甲酸(bispyribac)(-钠)、除草定(bromacil)、溴丁酰草胺(bromobutide)、杀草全(bromofenoxim)、溴苯腈(bromoxynil)、bromuron、特克草(buminafos)、羧草酮(busoxinone)、丁草胺(butachlor)、氟丙嘧草酯(butafenacil)、抑草膦(butamifos)、丁烯草胺(butenachlor)、草噻咪(buthidazole)、地乐胺(butralin)、丁氧环酮(butroxydim)、苏达灭(butylate)、唑酰草胺(Cafenstrole)(CH-900)、双酰草胺(Carbetamide)、唑酮草酯(Carfentrazone)(ICI-A0051)、酰肼草(Caloxymid)、CDA(即2-氯-N,N-二-2-丙烯基乙酰胺)、CDEC(即二乙基二硫代氨基甲酸2-氯烯丙酯)、氯硝醚(Chlomethoxyfen)、草灭平(Chloramben)、炔禾灵(Chlorazifop)、Chlormesulon(ICI-A0051)、氯溴隆(Chlorbromuron)、氯草灵(Chlorbufam)、伐草克(Chlorfenac)、氯甲丹(Chlorflurecol)、杀草敏(Chloridazon)、氯嘧黄隆(Chlorimuron-ethyl)、草枯醚(Chlornitrofen)、绿麦隆(Chlorotoluron)、枯草隆(Chloroxuron)、氯苯胺灵(Chlorpropham)、chloraulfuron; 敌草索(Chlorthal)、草克乐(Chlorthiamid)、绿麦隆(Chlortoluron)、环庚草醚

(Cinmethylin)、醚黄隆(Cinosulfuron)、烯草酮(Clethodim)、吡啶酮草酯(Cinidon)、环苯草酮(Clefoxydim)、炔草酯(Clodinafop)及其酯衍生物(例如炔草酯-炔丙基)、异噁草酮(Clomazone)、稗草胺(Clomeprop)、环己烯草酮(Cloproxydim)、Clopyrasulfuron-methyl、唑嘧磺胺盐(Cloransulam)、Cumyluron(JC 940)、草净津(Cyanazine)、草灭特(Cycloate)、环丙黄隆(Cyclosulfamuron)(AC 104)、噻草酮(Cycloxydim)、环莠隆(Cycluron)、氟氟草酯(Cyhalofop)及其酯衍生物(例如丁酯, DEH-112)、莎草快(Cyperquat)、环草津(Cyprazine)、环唑草胺(Cyprazole)、香草隆(daimuron)、2,4-D, 2,4-DB、2,4-DB、茅草枯(dalapon)、甜菜安(desmedipham)、敌草净(desmetryn)、燕麦敌(di-Allate)、麦草畏(dicamba)、敌草腈(dichlobenil)、2,4-滴丙酸(dichlorprop)、禾草灵(diclofop)及其酯类(如甲基禾草灵)、唑嘧磺胺(diclosulam)、安塔(diethatyl); 枯莠隆(difenoxuron)、野燕枯(difenzoquat)、吡氟酰草胺(diflufenican)、二氟吡隆(diflufenzopyr)、噁唑隆(dimefuron)、啉草丹(dimepiperate)、二甲草胺(dimethachlor); 异戊乙净(dimethametryn)、噻吩草胺(dimethenamid)(SAN-582H)、敌米达松(dimethazone)、Dimexyflam、噻节因(dimethipin)、dimetrasulfuron、敌乐胺(dinitramine)、地乐酚(dinoseb)、特乐酚(dipropetryn)、草乃敌(diquat)、杀草净(dinoterb)、敌草快(diphenamid)、氟硫草定(dithiopyr)、敌草隆(diuron)、DNOC、草止津(eglinazine)、EL 77(即 5-氟基-1-(1,1-二甲乙基)-N-甲基-1H-吡唑-4-碳酰胺)、草藻灭(endothal)、Epoprodan、EPTC、禾草畏(esprocarb)、丁氟消草(ethalfluralin)、胺苯黄隆(ethametsulfuron)、噻二唑隆(ethidimuron)、噻丁草(ethiozin)、乙炔草黄(ethofumesate)、乙氧嘧磺隆(ethoxysulfuron)、乙氧苯草胺(etobenzanid)(HW 52)、F5231(即 N-[2-氟-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-4,5-二氢-5-氧代-1H-四唑-1-基]苯基]乙烷磺酰胺、氟氟草醚(ethoxyfen)及其酯类(例如乙

酯, HN-252)、2,4,5-涕丙酸(fenoprop)、Fenoxan、噁唑禾草灵(fenoxaprop)及高噁唑禾草灵及其酯(例如高噁唑禾草灵乙酯和噁唑禾草灵乙酯)、Fenoxymid、四唑酰草胺(fentrazamide)、非草隆(fenuron)、甲基或异丙基或异丁基-L 氟燕灵(flamprop)、啶嘧黄隆(flazasulfuron)、Flaozulate、双氟磺草胺(florasulam)、吡氟禾草灵(fluzifop)和精吡氟禾草灵及其酯类(例如吡氟禾草灵丁酯和精吡氟禾草灵丁酯)、氟酮磺隆(flucarbazone)(-钠)、氟消草(fluchloralin)、氟唑啉草(flumetsulam)、Flumeturon、酰亚胺苯氧乙酸(flumiclorac)(-戊基)、氟噁嗪酮(flumioxazin)(S-482)、Flumipropyn、伏草隆(fluometuron)、Fluorochloridone、Fluorodifen、乙羧氟草醚(fluoroglyphosate)、胺草唑(flupoxam)(KNW-739)、Flupropacil(UBIC-4243)、氟啶黄隆(flupyr-sulfuron)(甲酯或-钠)、茚丁酯(flurenol)、氟草酮(fluridone)、氟咯草酮(flurochloridone)、氟草烟(fluroxypyr)(-甲酯)、Flurprimidol、吡草酮(flurtamone)、达草氟(fluthiacet)、Fluthiamide、氟黄胺草醚(fomesafen)、甲酰胺磺隆(foramsulfuron)、膦胺素(fosamine)、氟吡草醚(furyloxyfen)、草胺膦(glufosinate)(-铵)、草甘膦(glyphosate)(-异丙基铵)、氟硝磺酰胺(halosafen)、吡氟黄隆(halosulfuron)及其酯(例如甲酯, NC-319)、吡氟氟禾灵(haloxypyr)及其酯、吡氟氟禾灵-P(即精吡氟氟禾灵)及其酯、六嗪酮(hexazinone)、咪草酯(imazamethabenz)、灭草烟(imazapyr)、灭草啞(imazaquin)及盐类如铵盐、Imazamethapyr、甲氧咪草烟(imazamox)、甲基咪草烟(imazapic)、Imazethamethapyr、咪草烟(imazethapyr)、啉咪黄隆(imazosulfuron)、环氧酮草(indanofan)、碘甲磺隆钠盐(iodosulfuron-methyl sodium)、碘苯腈(ioxynil)、丁环隆(isocarbamid)、异乐灵(isopropalin)、异丙隆(isoproturon)、异噁隆(isouron)、异噁草胺(isoxaben)、Isoxachlortole、异噁氟草

(isoxaflutole)、噁草醚(isoxapyrifop)、卡草灵(Karbutilate)、乳氟禾草灵(lactofen)、环草定(Lenacil)、利谷隆(linuron)、2甲4氯(MCPA)、2甲4氯丁酸(MCPB)、2甲4氯丙酸(Mecoprop)、苯噻草胺(mefenacet)、氟草磺(mefluidid)、叠磺隆(mesosulfuron)、甲基磺草酮(mesotrione)、苯噻草(metamitron)、吡草胺(metazachlor)、噻唑隆(Metham)、威百亩(Methazole)、灭草定(Methazole)、去草酮(methoxyphenone)、苯丙隆(methyldymron)、色满隆(metabenzuron)、Methobenzuron、秀谷隆(Metobromuron)、异丙甲草胺(α -metolachlor)、唑草磺胺(metosulam)(XRD 511)、甲氧隆(metoxuron)、赛克津(Metribuzin)、甲黄隆(metsulfuron)、MH、草达灭(molinate); 杀草利(monalide)、单脲硫酸二氢酯(monocarbamide dihydrogensulfate)、绿谷隆(monolinuron)、灭草隆(Monuron)、MT 128(即 6-氯-N-(3-氯-2-丙烯基)-5-甲基-N-苯基-3-吡嗪胺)、MT 5950(即 N-[3-氯基-4-(1-甲基乙基)-苯基]-2-甲基戊酰胺)、萘草胺(naproanilide)、草萘胺(napropamide)、抑草止(Naptalam)、NC 310(即 4-(2,4-二氯苯甲酰基)-1-甲基-5-苄氧基吡唑)、草不隆(Neburon)、烟嘧黄隆(nicosulfuron)、nipyraclorfen、磺乐灵(Nitralin)、除草醚(nitrofen)、硝氟草醚(nitrofluorfen)、达草灭(Norfluazon)、坪草丹(Orbencarb)、黄草消(Oryzalin)、炔丙噁唑草(Oxadiargyl)(RP-020630)、噁草灵(Oxadiazon)、环丙氧黄隆(Oxasulfuron)、氯噁嗪草(Oxaziclomefone)、氟硝草醚(Oxyfluorfen)、对草快(Paraquat)、克草猛(Pebulate)、壬酸(Pelargonic acid)、胺硝草(pendimethalin)、戊噁唑草(pentoxazone)、氟草磺胺(perfluidone)、敌草克(phenisopham)、苯敌草(Phenmedipham)、毒莠定(Picloram)、氟吡草胺(picolinafen)、派草磷(piperophos)、Piributicarb、Pirifenop、丙草胺(pretilachlor)、氟嘧黄隆(primisulfuron)、丙苯磺隆

(procarbazon)-(钠)、环氰津 (procyazine)、氨基丙氟灵 (prodiamine)、卡乐施 (profluralin)、丙草止津 (proglinazine-ethyl)、扑灭通 (prometon)、扑草净 (prometryn)、毒草安 (propachlor)、敌稗 (propanil)、啶草酯 (propaquizafop) 及其酯、扑灭津 (Propazine)、苯胺灵 (Propham)、异丙草胺 (propisochlor)、拿草特 (propyzamide)、磺亚胺草 (prosulfalin)、苄草丹 (prosulfocarb)、氟丙黄隆 (prosulfuron) (CGA-152005)、广草胺 (prynachlor)、氟唑草酯 (pyraflufen)、吡唑特 (pyrazolinate)、杀草敏 (Pyrazon)、吡嘧黄隆 (pyrazosulfuron)、苄草唑 (pyrazoxyfen)、嘧苯草肟 (pyribenzoxim)、稗草畏 (pyributicarb)、Pyridafol、达草止 (pyridate)、肟啉草 (pyrimidobac)、嘧硫苯甲酸 (pyrithiobac) (-钠) (KIH-2031)、Pyroxofop 及其酯 (例如炔丙酯)、二氯喹啉酸 (quinclorac)、喹草酸 (quinmerac)、灭藻醌 (quinoclamine)、Quinofop 及其酯衍生物、喹禾灵 (quizalofop) 和精喹禾灵及其酯衍生物例如喹禾灵乙酯、精喹禾灵四氢糠基酯和精喹禾灵乙酯、Renriduro)、玉嘧黄隆 (rimsulfuron) (DPX-E9636)、S 275 (即 2-[4-氯-2-氟-5-(2-丙炔氧基)苯基]-4,5,6,7-四氢-2H-吡唑)、密草通 (secbumeton)、稀禾定 (sethoxydim)、环草隆 (siduron)、西玛津 (simazine)、西草净 (simetryn)、SN 106279 (即 2-[[7-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-萘基]氧基]丙酸及其甲酯)、磺草酮 (sulcotrione)、磺胺草唑 (sulfentrazon) (FMC-97285, F-6285)、Sulfazuron、嘧黄隆 (sulfometuron)、草甘膦 (sulfosate) (ICI-A0224)、磺基沙弗荣 (sulfosulfuron)、TCA、丙戊草胺 (tebutam) (GCP-5544)、丁唑隆 (tebuthiuron)、吡喃草酮 (tepraloxym)、特草定 (Terbacil)、芽根灵 (terbucarb)、猛杀草 (terbuchlor)、甲氧去草净 (Terbumeton)、特丁津 (Terbtylazine)、去草净 (Terbutryn)、TFH 450 (即 N,N-二乙基-3-[(2-乙基-6-甲基苯基)磺酰基]-1H-1,2,4-三唑-1-碳酰胺)、噻醚草胺 (thenylchlor) (NSK-

850)、Thiafluamide、赛唑隆(thiazafluron)、噻氟啶草(thiazopyr)(Mon-13200)、噻二唑胺(thidiazimin)(SN-24085)、噻黄隆(thifensulfuron)、杀草丹(thiobencarb)、丁草威(tiocarbazil)、肱草酮(tralkoxydim)、野麦畏(tri-allylate)、醚苯黄隆(triasulfuron)、苯氧丙胺津(triaziflam)、Triazofenamide、苯黄隆(tribenuron)、定草酯(triclopyr)、灭草环(tridiphane)、草达津(Trietazine)、氟乐灵(Trifluralin)、氟胺黄隆及酯(例如甲酯,DPX-66037)、三甲隆(trimeturon)、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、Tsitodef、灭草猛(Vernolate)、WL 110547(即5-苯氧基-1-[3-(三氟甲基)-苯基]-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。

特别感兴趣的是在经济植物及观赏植物种植中选择性控制有害植物。虽然根据本发明的化合物(I)已在多种农作物中展现非常好的充份选择性,但是原则上对于一些农作物并且主要是在与其它选择性较差除草剂混合的情况下在农作物植物上出现植物毒性。就此而言,特别有益的是根据本发明的化合物(I)的组合物,其包含化合物(I)或其与其它除草剂或杀虫剂及安全剂的组合物。所述以解毒有效量使用的安全剂减低所使用的除草剂/杀虫剂的植物毒性副作用,例如在重要的经济作物中,如谷类(如小麦、大麦、黑麦、燕麦、高粱及黍)、甜菜、甘蔗、油菜籽,棉花和大豆,优选谷类。

考虑下列的化合物作为安全剂的实例用于化合物(I)及其与其它杀虫剂的组合物:

a) 二氯苯基吡唑啉-3-羧酸型化合物,优选化合物如1-(2,4-二氯苯基)-5-(乙氧羰基)-5-甲基-2-吡唑啉-3-羧酸乙酯(S1-1) (“吡唑解草酯(mefenpyr)”), “The Pesticide Manual”, 第12版, 2000, Nr. 492, 594-595页)及相近的化合物,如WO 91/

07874 所述的化合物;

b) 二氯苯基吡唑羧酸衍生物, 优选化合物如 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-异丙基吡唑-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) 及相近的化合物, 如 EP-A-333 131 和 EP-A-269 806 所述的化合物;

c) 三唑羧酸型的化合物, 优选化合物如解草唑 (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) 及相近化合物 (参考 EP-A-174 562 和 EP-A-346 620);

d) 5-苄基-或 5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸型或 5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸型化合物, 优选化合物如 5-(2,4-二氯苄基)-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯 (S1-7) 或 5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯 (S1-8) 及相近化合物 (如在 WO 91/08202 所述的), 或 5,5-二苯基-2-异噁唑啉羧酸乙酯 (S1-9) (双苯噁唑酸 (isoxadifen)) 或 5,5-二苯基-2-异噁唑啉羧酸正丙酯 (S1-10) 或 5-(4-氟苄基)-5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯 (S1-11), 如德国专利申请案 (WO-A-95/07897) 所述的化合物;

e) 8-喹啉氧基乙酸型 (S2) 的化合物, 优选 (5-氯-8-喹啉氧基)-乙酸-(1-甲基己-1-基) 酯 (俗称为 “解毒喹 (Cloquintocet-mexyl)” (S2-1) (参考 “The Pesticide Manual”, 第 12 版, 2000, Nr.195, 195-196 页)、

(5-氯-8-喹啉氧基)-乙酸-(1,3-二甲基-丁-1-基) 酯 (S2-2)、

(5-氯-8-喹啉氧基)-乙酸-4-丙烯氧基丁酯 (S2-3)、

(5-氯-8-喹啉氧基)-乙酸-1-丙烯氧基丙-2-基酯 (S2-4)、

- (5-氯-8-喹啉氧基)-乙酸乙酯 (S2-5)、
(5-氯-8-喹啉氧基)-乙酸甲酯 (S2-6)、
(5-氯-8-喹啉氧基)-乙酸烯丙酯 (S2-7)、
(5-氯-8-喹啉氧基)-乙酸-2-(2-亚丙基-亚氮氧基)-1-乙酯
(S2-8)、
(5-氯-8-喹啉氧基)-乙酸-2-氧基-丙-1-基酯 (S2-9)

及相近化合物,如其在 EP-A-86 750, EP-A-94 349 和 EP-A-191 736 或 EP-A-0 492 366 所述的化合物;

f) (5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸型化合物,优选化合物如(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸二乙酯、(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸二烯丙酯、(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸甲乙酯及相近的化合物,如 EP-A-0 582 198 所述的化合物;

g) 苯氧基乙酸或苯氧基丙酸衍生物型或芳族羧酸型的活性物质,例如

2,4-二氯苯氧基乙酸(及其酯)(2,4-D)、

4-氯-2-甲基苯氧基丙酸酯(2甲4氯丙酸)、MCPA或3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸(及其酯)(麦草畏);

h) 嘧啶型的活性物质,其是在稻米中作为作用于土壤的安全剂使用的,例如

“解草啞(fenclorim)” (“The Pesticide Manual”, 第12版, 2000, Nr. 325, 386-387页)(=4,6-二氯-2-苯基嘧啶),其作为在种稻中的丙草胺(Pretilachlor)的安全剂而己知;

i) 二氯乙酰胺类型的活性物质,其通常作为萌芽前安全剂(土壤作用安全剂)使用,例如

“二氯丙烯胺(dichlormid)” (“The Pesticide Manual”, 第12版, 2000, Nr. 225, 270-271页)(=N,N-二烯丙基-2,2-二氯

乙酰胺)，

“R-29148” (=3-二氯乙酰基-2,2,5-三甲基-1,3-噁唑烷，取自 Stauffer 公司)，

“解草酮 (benoxacor)” (“The Pesticide Manual”，第 12 版，2000，Nr. 65，74-75 页) (=4-二氯乙酰基-3,4-二氢-3-甲基-2H-1,4-苯并噁嗪)，

“PPG-1292” (=取自 PPG 工业的 N-烯丙基-N-[(1,3-二氧杂环戊烷-2-基)甲基]二氯乙酰胺)，

“DK-24” (=取自 Sagro-Chem 公司的 N-烯丙基-N-[(丙烯基氨基)甲基]二氯乙酰胺)，

“AD-67” 或 “MON 4660” (=分别取自 Nitrokemia 或 Monsanto 公司的 3-二氯乙酰基-1-氧杂-3-氮杂-螺旋[4,5]癸烷)，

“Diclonon” 或 “BAS145138” 或 “LAB145138” (=取自 BASF 公司的 3-二氯乙酰基-2,5,5-三甲基-1,3-二氮杂双环[4.3.0]壬烷) 及

“Furilazol” 或 “MON 13900” (参考 “The Pesticide Manual”，第 12 版，2000，Nr. 401，482-483 页) (= (RS)-3-二氯乙酰基-5-(2-呋喃基)-2,2-二甲基噁唑烷)；

j) 二氯丙酮衍生物型的活性物质，例如

“MG 191” (CAS-注册编号 96420-72-3) (=取自 Nitrokemia 公司的 2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二氧杂环戊烷)，已知其是作为玉米的安全剂；

k) 氧基亚氨基化合物型的活性物质，已知其是作为拌种剂，例如

“解草腈 (Oxabetrinil)” (“The Pesticide Manual”，第 12 版，2000，Nr. 577，689 页) (= (Z)-1,3-二氧杂环戊烷-2-基甲氧基亚氨基 (苯基) 乙腈)，已知其用作为黍的抗异丙甲草胺损害的拌种安全剂，

“𧄸草安 (fluxofenim)” (“The Pesticide Manual” , 第 12 版, 2000, Nr. 389, 467-468 页) (=1-(4-氯苯基)-2,2,2-三氟基-1-乙酮-0-(1,3-二氧杂环戊烷-2-基甲基)𧄸), 已知其用作为黍的抗异丙甲草胺损害的拌种安全剂, 及

“解草胺腈 (Cyometrinil)” 或 “-CGA-43089” (“The Pesticide Manual” , 第 12 版, 2000, Nr. 974, 983 页) (= (Z)-氟基甲氧基亚氨基 (苯基) 乙腈), 已知其用作为黍的抗异丙甲草胺损害的拌种安全剂;

1) 噻唑羧酸酯型的活性物质, 已知其用作为拌种剂, 例如

“Flurazol” (“The Pesticide Manual” , 第 12 版, 2000, Nr. 376, 450-451 页) (=2-氯-4-三氟甲基-1,3-噻唑-5-羧酸苄酯), 已知其用作为黍的抗甲草胺和异丙甲草胺损害的拌种安全剂;;

m) 萘二羧酸衍生物型的活性物质, 已知其用作为拌种剂, 例如

“萘酸酐” (“The Pesticide Manual” , 第 12 版, 2000, Nr. 1249, 1009-1010 页) (=1,8-萘二酸酐), 已知其是作为玉米的抗硫代氨基甲酸酯除草剂损害的拌种安全剂。

n) 苯并二氢吡喃乙酸衍生物型的活性物质, 例如

“CL304415” (CAS-注册号 31541-57-8) (=取自美国氰胺公司的 2-(4-羧基-苯并二氢吡喃-4-基)-乙酸), 已知其是作为玉米的抗咪唑啉酮损害的安全剂;

o) 除了具有抗有害植物的除草作用之外, 还对于经济植物 (如稻米) 具有安全剂作用的活性物质, 例如

“𧄸草丹” 或 “MY-93” (“The Pesticide Manual” , 第 12 版, 2000, Nr. 251, 302-303 页) (=𧄸啉-1-硫代羧酸-S-1-甲基-1-苄乙酯), 已知其为用于稻米抗除草剂草达灭损害的安全剂,

“杀草隆” 或 “SK23” (“The Pesticide Manual” , 第 12 版,

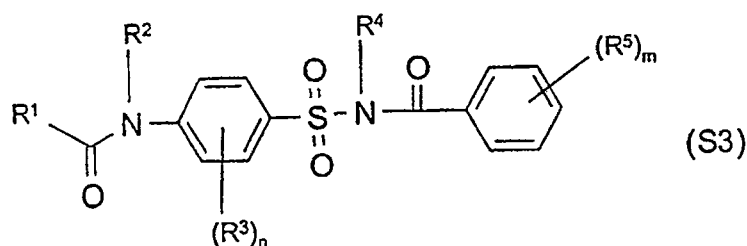
2000, Nr. 207, 247 页) (=1-(1-甲基-1-苯乙基)-3-对-甲苯脲), 已知其为用于稻米抗除草剂啶咪黄隆损害的安全剂,

“Cumyluron” = “JC-940” (=3-(2-氯苯基甲基)-1-(1-甲基-1-苯乙基)脲 (参考 JP-A-60087254), 已知其为用于稻米抗数种除草剂损害的安全剂,

“去草酮”或“NK049” (=3,3'-二甲基-4-甲氧基二苯甲酮), 已知其为用于稻米抗数种除草剂损害的安全剂,

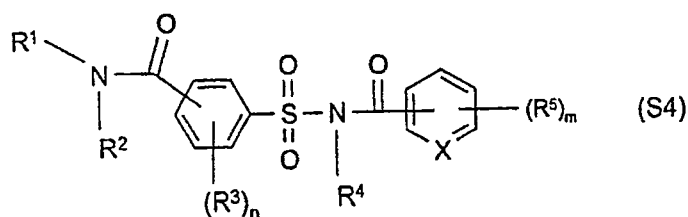
“CSB” (=1-溴-4-(氯甲基磺酰基)-苯) (CAS-注册编号-54091-06-4, 取自 Kumiai), 已知其为用于稻米抗数种除草剂损害的安全剂;

p) 式 (S3) 的 N-酰基磺酰胺类及其盐类



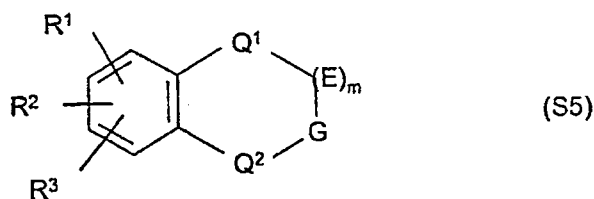
如其在 WO-A-97 / 45016 中所描述的;

q) 式 (S4) 的酰基胺磺酰基苯甲酰胺, 视情况也以盐的形式,



如其在国际申请案 PCT / EP98 / 06097 中所描述的; 及

r) 式 (S5) 的化合物,



如其在 WO-A-98 / 13 361 中所描述的;

包括立体异构体及在农业中常用的盐类。

在所述的安全剂的中，(S1-1)及(S1-9)和(S2-1)是特别有利的，尤其是(S1-1)及(S1-9)。

一些安全剂作为除草剂已知并扩展用途，由此其除了具有对于有害植物的除草作用之外，还同时具有对于经济植物的保护作用。

除草剂(混合物)对安全剂的重量比通常取决于除草剂的施用量及具体安全剂的功效，其可在较宽的范围内变化，例如在从200:1到1:200的范围内，优选100:1到1:100，特别是20:1到1:20。所述安全剂可以类似于化合物(I)或其混合物与更多的除草剂/杀虫剂配制，并作为成品制剂或桶混合物与除草剂一起提供和使用。在应用时，将商购常见形式存在的除草剂或除草剂安全剂调配物视需要以常规的方式稀释，例如，就可湿性粉剂、乳油、分散剂和水可分散性粒剂而言用水稀释。粉剂、土壤及播散施用粒剂以及可喷雾型溶液在使用前通常不再用惰性物质稀释。

式(I)化合物的施用量需根据外在条件如温度、湿度、所用除草剂的性质而变化。因此该施用量可大幅变化，例如，在0.001及10.0公斤/公顷之间或更多的活性物质，但优选介于0.005及5公斤/公顷之间，特别是在0.01至1公斤/公顷之间。

具体实施方式

A. 化学实施例

实施例 1

2-氨基-4-(5,7-二甲基-1,2,3,4-四氢萘-1-氨基)-1,3,5-三嗪

a) 将27.0克(0.13摩尔)1-氨基-5,7-二甲基-1,2,3,4-四氢萘盐酸与11.5克(0.13摩尔)氰基胍均匀化，并溶解在60毫升1,2-二氯苯中。将该混合物在140-160℃下加热150分钟，由此首先产生均匀的混合物，其后又再度脱离混合状态。在冷却及加入100毫升甲苯之后，可以抽滤获得40.0克(94%的理论值，具有大于90%的

纯度) 1-双胍基-5, 7-二甲基-1, 2, 3, 4-四氢萘盐酸, 熔点 215-216 °C。

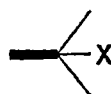
b) 在 1.01 克 (0.044 摩尔) 钠于 50 毫升甲醇中的甲醇化钠的溶液中加入 3.70 克 (0.013 摩尔) 1-双胍基-5, 7-二甲基-1, 2, 3, 4-四氢萘盐酸。随后加入 3.7 克 (0.03 摩尔) 甲酸乙酯, 在 25°C 下搅拌 15 小时。将水及二氯甲烷加入反应混合物中, 分离有机相并将水相用二氯甲烷萃取两次以上。在每一个情况下, 分离有机相并合并共同用硫酸钠干燥。将干燥剂滤除并将二氯甲烷相浓缩。使用乙酸乙酯作为移动相经硅胶柱色层分离获得 2.3 克 (62% 的理论值 90% 的纯度) N2-(5, 7-二甲基-1, 2, 3, 4-四氢-1-萘基)-1, 3, 5-三嗪-2, 4-二胺, 熔点 178-180°C。

以类似于以上的实例 1 的方式获得在表 1 及 2 中所说明的化合物。

在表中:

Nr.	= 实施例或实施例编号
m. p.	= 凝固点 (熔点) 以 °C 计
state	= 聚集状态或其它数据 (浓度等)
Me	= 甲基
Et	= 乙基
Pr	= 丙基
i-Pr	= 异丙基
X-i-Pr	= 经取代的异丙基

例如 F-i-Pr=氟基异丙基, 即下式的 $-\text{CF}(\text{CH}_3)_2$



c-Pr = 环丙基

1-Me-c-Pr = 1-甲基环丙基 =



t-Bu = 叔丁基

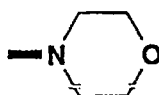
Ph = 苯基

Bz = 苄基

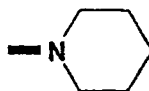
Ac = 乙酰基

Numbers = 在双环上的取代基前的第一个数值表示具有相同号码 n 的取代基 X^n 的位置

Morpholino = -吗啉 =



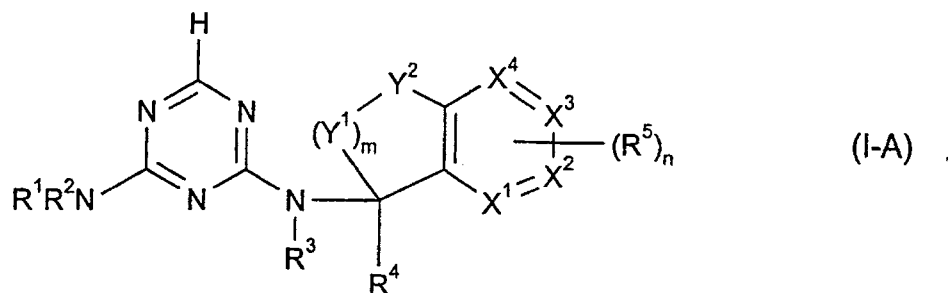
Piperidino = -哌啶 =



注明:

以实线表示在每一个情况下的基的连接位点。

表 1: 式 (1-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-	

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 -	-	固体泡沫
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 -	-	固体泡沫
33	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 3-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-	固体泡沫
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-	

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

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	吗啉代	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	NH 吡啶子基	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

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)
80	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 2-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-S-	
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	吗啉代	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	NH 哌啶子基	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-	

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)
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-
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	吗啉代	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	NH 吡啶子基	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	吗啉代	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-

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)
125	NHNNH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
126	NH 哌啶子基	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-O-	
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	吗啉代	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	NHNNH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-N- n-Pr-	
142	NH 哌啶子基	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 -	-	固体泡沫

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 R	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 %
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 哌啶子基	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 -	-	

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)
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 -	-
166	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -3	-CH ₂ -CH ₂ -	-
167	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-Et	-CH ₂ -CH ₂ -	-
168	NH ₂	H	H	-O-C=C-	3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
169	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Et	-CH ₂ -CH ₂ -	-
170	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
171	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
172	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 3-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
173	NH ₂	H	H	-N=C-C=C-	2-Me, 4-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
174	NH ₂	H	H	-N=C-C=C-	3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
175	NH ₂	H	H	-C=C-C=N-	1-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
176	NH ₂	Me	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
177	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Et, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
178	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	3-COOMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-
179	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-COOEt	-CH ₂ -CH ₂ -	-
180	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-CF ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	-
181	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-c-propyl	-CH ₂ -CH ₂ -	-
182	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-CClF ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	-
183	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1-Me, 2-Me, 3-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	-
184	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-CH ₂ -OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-
185	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	H	-CH ₂ -CH ₂ -	183-185

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 R	H	H	-C=C-C=C- H	-CH ₂ -CH ₂ -	-	149-151; opt. rot.: 93.3°, c=1, CHCl ₃ , 21°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 -	-	

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)
202	NH_2	H	H	$-\text{S}-\text{C}=\text{C}-$	H	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
203	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	H	$-\text{CH}_2-$	$-\text{O}-$	188-192
204	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-OH	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
205	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	3- $\text{CH}=\text{CH}_2$	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
206	NH_2	Bz	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	H	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
207	NH_2	H	Me	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	H	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
208	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	3- $\text{C}\equiv\text{CH}$	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
209	NH_2	Ph	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	H	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
210	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2- $\text{C}\equiv\text{CH}$	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
211	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2- $\text{CH}=\text{CH}_2$	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
212	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2- $\text{CH}=\text{CH}_2$	$-\text{CMeH}-\text{CH}_2-$	-	
213	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-I	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
214	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	3-I	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
215	NH_2	CHO	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	H	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
216	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-Br	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
217	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	3-Br	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
218	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-NHCHO	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
219	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-NHAc	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
220	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-NHCO-Ph	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
221	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-NHPh	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
222	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-Ph, 4-Me	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
223	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-O-Ph	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
224	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-OMe	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	
225	NH_2	H	H	$-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-$	2-OEt	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	-	

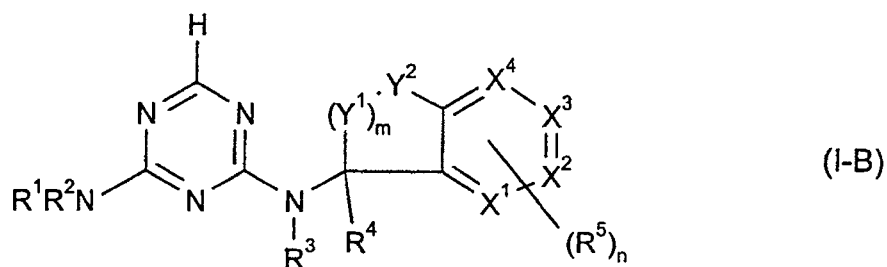
No.	NR ¹ R ²	R ³	R ⁴	-X ¹ =X ² -X ³ =X ⁴ - (R ⁵) _n	(Y ¹) _m	Y ²	State/m.p. (°C)
226	NH ₂	H	H	-C=C-C=C- 2-O-i-Pr	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
227	NH ₂	H	H	-C=C-C=C- 4-OMe	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
228	NH ₂	H	H	-C=C-C=C- 4-OEt	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
229	NH ₂	H	H	-C=C-C=C- 4-O-i-Pr	-CH ₂ -CH ₂ -	-	
230	NH ₂	H	H	-C=N-C=N H	-CH ₂ -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 -	-	

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)
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	
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	吗啉代	Bz	Me	-C=C-C=C-	1-Me, 4- OMe	CH ₂ -CHMe	NMe	
261	哌啶子基	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	

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)
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	
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 -	-	蜡状
286	NHC(=O)CH ₂ Cl	H	H	-C=C-C=C-	2-F,	-CHMe-CH ₂ -	-	蜡状
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 -	-	固体泡沫
291	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2-Me	-CH ₂ Et-CH ₂ -	-	固体泡沫
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 -	-	

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)
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 -	- 固体泡沫
297	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1,4-F	-CH ₂ -CH ₂ -	- 158-161
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 -	- 油
297	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	2,3,4-Me	-CHCH ₃ -	-CH ₂ - 固体泡沫
298	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	4-OMe	-CH ₂ -	-O- 固体泡沫
299	NH ₂	H	H	-C=C-C=C-	1,2-Me	-CH ₂ -CH ₂ -	- 油
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 - 固体泡沫

表 2: 式 (1-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	

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	

B. 制剂实施例

a) 粉剂的制备是将 10 重量份的式 (I) 化合物与 90 重量份的滑石 (作为惰性物质) 加以混合, 将该混合物在锤磨机中粉碎。

b) 在水中易于分散的可湿性粉剂的制备是将 25 重量份的式 (I) 化合物, 64 重量份的含高岭土的石英 (作为惰性物质), 10 重量份的木质磺酸钾和 1 重量份的油酰甲基牛磺酸钠 (作为润湿剂和分散剂) 加以混合, 将该混合物在栓型碟式磨粉机上研磨该混合物。

c) 在水中易于分散的分散性浓缩物的制备是将 20 重量份的式 (I) 化合物、6 重量份的烷基酚聚乙二醇醚 (®Triton X 207)、3 重量份的异十三烷醇聚乙二醇醚 (8 E0) 和 71 重量份的链烷烃矿物油 (沸点范围约 255 至 277℃以上) 加以混合, 并且在球磨机上研磨该混合物至小于 5 微米的细度。

d) 乳油是由下列物质组成: 15 重量份的式 (I) 化合物, 75 重量份的环己酮作为溶剂和 10 重量份的氧乙基化的壬酚作为乳化剂。

e) 水分散颗粒剂, 其利用下列方式制得: 将

75 重量份的式 (I) 化合物,

10 重量份的木质磺酸钙,

5 重量份的月桂硫酸钠,

3 重量份的聚乙烯醇和

7 重量份的高岭土

加以混合, 将该混合物在栓型碟式磨粉机中磨成细粉, 将粉末在流体化床中通过喷洒作为粒化液体的水以使之粒化。

f) 水分散颗粒剂, 其也可通过于胶体磨上将下列物质均质化且预先粉碎

25 重量份的式 (I) 化合物,

5 重量份的 2, 2'-二萘基甲烷-6, 6'-二磺酸钠,

2 重量份的油酰甲基牛磺酸钠,

1 重量份的聚乙烯醇,

17 重量份的碳酸钙和

50 重量%的水,

随后将该混合物在球磨机中磨成细粉, 在喷雾塔中利用单物质喷嘴将如此得到的悬浮体加以雾化和干燥。

C. 生物实施例

1. 在萌芽前的除草作用

将单子叶和双子叶杂草种子或地下茎放置于塑料盆中的砂壤土中并覆上土壤。随后在 600~800 公升水/公顷的施用量下, 将以可湿性粉剂或乳油形式配制的本发明的化合物, 以不同用量的水悬浮液或乳液形式施加至土壤表面。处理之后, 将盆放置于温室中并保持适于杂草的良好生长条件。在未处理的对照物萌芽之后, 以目测方式评价植物或芽的损害。试验结果显示根据本发明的化合物好的萌芽前除草活性以抵抗宽谱的禾本科杂草及阔叶杂草。例如在以萌芽前方法使用以每公顷计 0.5 公斤或更少的活性物质的施用量时, 则实施例编号 1、4、5、19、55、58、79、146、185、198、281、282、283、285、286、288、289、290、291、292 及 293 (参考表 1 及 2) 在该试验中显示非常好的抗有害植物的除草作用, 如抗欧白芥、红黄草 (*Chrysanthemum segetum*)、燕麦、繁缕、稗草、多花黑麦草、狗尾草、鹅绒草 (*Abutilon theophrasti*)、反枝苋 (*Amaranthus retroflexus*) 和黍。

2. 萌芽后除草作用

将单子叶和双子叶杂草种子或地下茎放置于塑料盆中的砂壤土中并覆上土壤, 并于温室中在良好的生长条件下培养。在播种三周之

后，在三叶阶段时处理测试植物。将配制成可湿性粉末或乳油的各种剂量的根据本发明的化合物以每公顷计 600 到 800 升水的施用量（经换算）喷雾在绿色的植物部份，将试验植物留置于理想的生长条件下的温室中约 3 到 4 个周之后，与未处理的对照物比较以目测方式评价制剂的效应。根据本发明的组合物也具有好的除萌芽后活性以抵抗宽谱的经济上重要的禾本科杂草及阔叶杂草。在以萌芽后方法使用以每公顷计 0.5 公斤或更少的活性物质的施用量时，则实施例编号 1、4、5、19、55、58、79、146、185、198、281、282、283、285、286、288、289、290、291、292 及 293（参考表 1 及 2）在该试验中例如具有非常好的抗有害植物的除草作用，如抗欧白芥、稗草、多花黑麦草、红黄草、狗尾草、鹅绒草、反枝苋、黍和燕麦。

3. 在稻米中的抗有害植物的作用

将在封闭的塑料盆中经移植和播种的稻米杂草及典型的稻米杂草（阔叶和禾本科杂草）在温室中及在稻田米的条件下（水的溢流量：2-3cm）生长，直到其长成三-叶阶段（稗（*Echinochloa*, 1.5-叶）为止。接着将其以根据本发明的化合物处理。就此目的而言，将调配的活性物质悬浮、溶解或乳化在水中，并以倾倒喷洒的方式将各种剂量喷洒试验植物的稻田水中。在以该方式完成处理之后，将试验植物放入在理想的生长条件下的温室中及在整个实验期间以此方式维持不变。

在喷洒之后约 3 周，以目测评价植物损害的方式评估该实验，与未处理的对照物比较，例如其中化合物编号 1、4、5、19、55、58、79、146、185、198、281、282、283、285、286、288、289、290、291、292 及 293（参考表 1 及 2）在该试验中例如具有非常好的抗有害植物的除草作用，所述有害植物是典型的稻米农作物的有害植物，例如莎草、稗草、牛毛毡及矮慈姑。

4. 经济植物耐受性

在进一步温室实验中，将相对大量的经济植物及杂草种子放入塑料盆的硅壤土中并以土壤覆盖。将部份种植盆立刻如第1段所述的方式处理，但是将其余的种植盆放入温室中，直到该等植物长出二至三片真叶为止，并将着将根据本发明的式(I)物质如第2段所述的方式以各种剂量喷洒。在喷洒之后4至5周及在温室中的静置时间，经由目测评价的方式发现根据本发明化合物即使在萌芽前及萌芽后以高施用量的活性化合物喷洒也不会损害双子叶农作物，例如大豆，棉花，油菜籽，甜菜及马铃薯。此外，部份物质也能保护禾本科农作物不受损害，例如大麦、小麦、裸麦、高粱，玉米或稻米。尤其是编号1、4、5、19、55、58、79、146、185、198、281、282、283、285、286、288、289、290、291、292及293(参考表1及2)的式(I)化合物在一些情况下展示出高选择性并因此适用于在农业作物中控制不希望的植物。