

300469

公告本

申請日期	80-11-09
案號	80108852
類別	C07D <sup>239/28, 239/34, 239/52</sup> , A01N <sup>43/54</sup> A4 C4

(以上各欄由本局填註)

(80108852)

發明專利說明書  
新 型

一、發明名稱 創作	中文	經取代嘧啶基醯胺脒
	英文	Substituted pyrimidylamide oximes
二、發明人 創作	姓名	1. 克羅夫 (Rolf Kirsten) 2. 溫海爾 (Hilmar Wolf) 3. 哈格德 (Gerd HahnBler) 4. 丹漢茲 (Heinz-Wilhelm Dehne) 5. 杜坦恩 (Stefan Dutzmann)
	籍貫 (國籍)	1.-5. 德國
	住、居所	1.-5. 德國利佛可生城拜耳工業區 D-5090 德商拜耳廠股份有限公司 D-5090 Leverkusen, Bayerwerk, Germany Bayer Aktiengesellschaft
三、申請人	姓名 (名稱)	德商拜耳廠股份有限公司 Bayer Aktiengesellschaft
	籍貫 (國籍)	德國
	住、居所 (事務所)	德國利佛可生城拜耳工業區 D-5090 D-5090 Leverkusen-Bayerwerk, Federal Republic of Germany
	代表人 姓名	葛哈特 (Gerhard Muller) 白羅夫 (Rolf Braun)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

經濟部中央標準局印製

## 五、發明說明 (1)

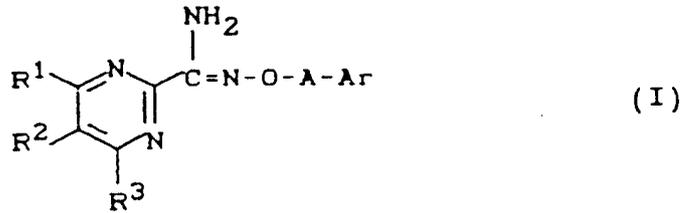
本發明係關於新穎之經取代嘧啶基醯胺肪，其製法與製法中之新穎中間體及其作為農藥，特別是殺真菌劑，之用途。

自文獻(參考，Ann. Chim. (巴黎)5(1960)，351-379-述於化學摘要56(1962)，5961-5962)中得嘧啶-2-醯胺肪為已知。然而，並未揭示有關此化合物之生物性質。

某些殺真菌的活性肪例如， $\alpha$ -(4-甲基苯磺醯基)-0-(4-甲基-苯磺醯基-胺羰基)-2,6-二氯-苯醛肪及 $\alpha$ -(4-甲基苯磺醯基)-0-(4-甲基-苯基胺羰基)-2,6-二氯-苯醛肪(詳，EP-A 205,076)， $\alpha$ -(4-氯-苯磺醯基)-0-環己基胺羰基-2,6-二氯-苯醛肪(詳，EP-A 281,901)， $\alpha$ -(4-氯-苯磺醯基)-0-乙氧基羰基-吡啶-3-醛肪及 $\alpha$ -(4-甲基-苯磺醯基)-0-乙氧基羰基-6-甲基-吡啶-2-醛肪(詳，EP-A 236,897)以及 $\alpha$ -(4-甲基-苯磺醯基)-6-甲基-吡啶-2-醛肪， $\alpha$ -(4-氯-苯磺醯基)-吡啶-4-醛肪和 $\alpha$ -苯磺醯基-6-甲基吡啶-2-醛肪(詳，EP-A 236,919)皆為已知。然而，這些化合物之作用於低量應用時並不完全令人滿意。

新穎之通式(I)之經取代嘧啶基醯胺肪

## 五、發明說明 (2)



其中，

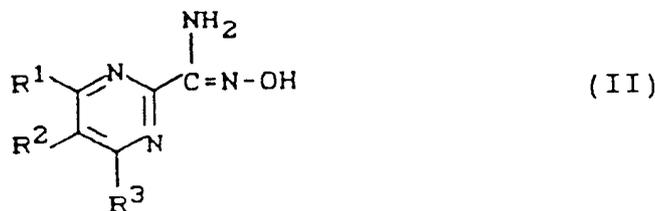
$R^1$ ， $R^2$ ， $R^3$  為相同或不同且代表氫，鹵素，烷基，鹵代烷基，  
 烷氧基烷基，烷氧基，鹵代烷氧基，烷氧基烷氧基，烷硫  
 基，烷基胺基或二烷基胺基，亦可為這些基中二者  
 $R^1$  及  $R^2$  或  $R^2$  及  $R^3$  一起代表烷二基，

A 代表烷二基且

Ar 代表分別經選擇取代之芳基或雜芳基，

現已被發現。

再者，已發現新穎之式 (I) 化合物可由通式 (II) 之  
 嘧啶基醯胺肟而製得



其中

$R^1$ ， $R^2$ ， $R^3$  為相同或不同且代表氫，鹵素，烷基，鹵代烷基，烷氧基



## 五、發明說明 (4)

基)-吡啶-4-醛肟和 $\alpha$ -苯磺醯基-6-甲基吡啶-2-醛肟(詳, EP-A 236,919)。

較佳之取代基將被說明於下列原文: 於通式中之烷基, 其本身或於化合物基如, 烷氧基, 烷硫基或烷基胺基, 分別代表較佳為1至6, 特別為1至4個碳原子之直鏈或支鏈烷基。下列可由實例中提及: 甲基, 乙基, 正-及異-丙基, 正-, 異-, 另-及特-丁基。

於通式中之鹵代烷基, 於自身或化合物基中如, 鹵化烷氧基, 分別代表直鏈或支鏈鹵代烷基, 較佳為1至6個碳原子及1至13個鹵原子, 較佳為氟或氯原子, 特別是1至4個碳原子及1至9個鹵原子。下列可由實例中提及: 氟甲基, 氯甲基, 二氟甲基, 二氯甲基, 三氟甲基, 三氯甲基, 氟氯甲基, 氯二氟甲基, 氯二氯甲基, 氟乙基, 二氟乙基, 三氟乙基, 四氟乙基, 氯乙基, 二氯乙基, 三氯乙基, 氯氯乙基, 氯二氯乙基, 氯三氯乙基, 氟丙基, 氯丙基, 氟丁基及氯丁基。

於通式中之烷二基分別代表直鏈或支鏈之烷二基, 較佳為1至5, 特別為1至4, 個碳原子。下列可由實例中提及: 甲-1,1-二基(亞甲基), 乙-1,1-二基(亞乙基), 乙-1,2-二基(二亞甲基), 丙-1,1-二基(亞丙基), 丙-1,2-二基, 丙-1,3-二基及丁-1,4-二基。

於通式中之鹵素代表氟, 氯, 溴或碘, 較佳為氟,

## 五、發明說明 (5)

氣或溴，特別是氟或氯。

於通式中之芳基代表苯或萘基，特別是苯基。

於通式中之雜芳基較佳為代表5-節或6-節，經選擇的苯並-稠和之具至多3個氮原子之芳香族雜環，及/或，經選擇之氧或硫原子，特別是呋喃基，噻吩基，吡咯基，吡啶基，咪啶基，三啶基，噁啶基，苯並噁啶基，異噁啶基，噻啶基，苯並三啶基，噁二啶基，噻二啶基，吡啶基，噻啶基及三嗪基。

芳基取代基及雜芳基取代基可較佳地選自包含鹵素，氟基，羧基，硝基，苯基，分別為較佳具至多4個碳原子之直鏈或支鏈之烷基，烷氧基，烷硫基或烷氧羰基，較佳具3或4個碳原子之烷二基，較佳具1或2個碳原子之亞烷二氧基，分別為較佳具分別至多4個碳原子及較佳具至多9個鹵原子之直鏈或支鏈之鹵代烷基，鹵代烷氧基或鹵代烷硫基，較佳具1或2個碳原子及較佳具至多4個鹵原子之鹵代亞烷二氧基，或選擇地含有上述芳基取代基及雜芳基取代基之苯氧基。特別地，芳基取代基及雜芳基取代基其可選自包含氟、氯、溴、氟基、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、三氟甲基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、亞甲二氧基、伸乙二氧基、二氟亞甲二氧基、三氟伸乙二氧基、四氟伸乙二氧基、氯三氟伸乙二氧基者，或

## 五、發明說明 ( 6 )

選擇地含有上述芳基取代基及雜芳基取代基之苯氧基。

式 (I) 提供了本發明經取代之噁啶基醯胺脞之一般定義。較佳之式 (I) 化合物為其中

$R^1$  代表氫、鹵素、 $C_1-C_4$ -烷基， $C_1-C_4$ -鹵代烷基， $C_1-C_2$ -烷氧基  $C_1-C_2$ -烷基， $C_1-C_4$ -烷氧基， $C_1-C_4$ -鹵代烷氧基， $C_1-C_2$ -烷氧基  $C_1-C_2$ -烷氧基， $C_1-C_4$ -烷胺基或二- $(C_1-C_2$ -烷基)-胺基，

$R^2$  代表氫，鹵素， $C_1-C_4$ -烷基， $C_1-C_4$ -鹵代烷基或  $C_1-C_4$ -烷氧基，或與  $R^1$  或  $R^3$  一起代表三亞甲基或四亞甲基，

$R^3$  代表氫，鹵素， $C_1-C_4$ -烷基， $C_1-C_4$ -鹵代烷基或  $C_1-C_4$ -鹵代烷氧基，

A 代表  $C_1-C_5$ -烷二基及

Ar 代表分別經選擇取代之苯基或萘基，或代表經選擇取代及/或經選擇苯並-稠合之具至多3個氮原子及/或，選擇地，一個氧或硫原子之5-節或6-節雜環，其取代基較佳為選自包括鹵素，氰基，羧基，硝基，苯基，分別為具有至多4個碳原子之直鏈或支鏈之烷基，烷氧基，烷硫基或烷氧基羰基，具3或4個碳原子之烷二基，具1或2個碳原子之亞烷二氧基，分別具有至多4個碳原子及至多9個鹵原子之直鏈或支鏈之鹵代烷基，鹵代烷氧基或鹵代烷硫基，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

## 五、發明說明 (7)

具1或2個碳原子及至多4個鹵原子之鹵代亞烴二氧基，或苯氧基，其可經選擇地含有上述芳基及雜芳基之取代基。

特別佳之式(I)化合物為，其中

R<sup>1</sup> 代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基，三氟甲基，氯甲基，甲氧基甲基，甲氧基，乙氧基，二氟甲氧基，2,2,2-三氟乙氧基，2-甲氧基-乙氧基，甲硫基，甲胺基，乙胺基或二甲基胺基，

R<sup>2</sup> 代表氫，氟，氯，溴，甲基，三氟甲基或甲氧基，

R<sup>3</sup> 代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基，丙基，三氟甲基，氯甲基，甲氧基，乙氧基或二氟甲氧基，

A 代表甲-1,1-二基(亞甲基)，乙-1,1-二基(亞乙基)或乙-1,2-二基(二亞甲基)，及

Ar 代表分別經選擇取代之苯基，萘基，呋喃基，噻吩基，吡咯基，吡啶基，咪啶基，三唑基，噁唑基，苯並噁唑基，異噁唑基，噻唑基，苯並三唑基，噁二唑基，噻二唑基，吡啶基，嘧啶基或三嗪基，其取代基可選自，特別是包括氟，氯，溴，氟基，苯基，甲基，乙基，甲氧基，乙氧基，甲硫基，乙硫基，甲氧基羰基，乙氧基羰基，三氟甲基，三氟甲氧基，三氟甲硫基，亞甲二氧基，伸乙二氧基，二氟亞甲二氧基，三氟亞甲二氧基，四氟伸乙二氧基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

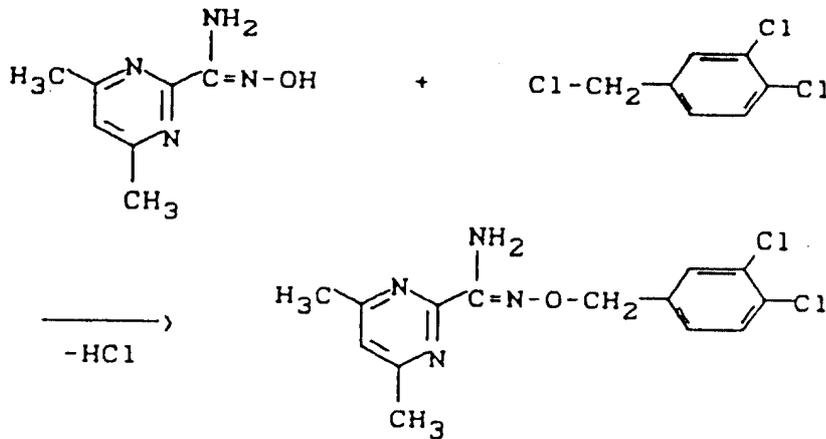
裝  
訂  
線

五、發明說明 (8)

， 氣三氫伸乙二氧基， 或選擇地含有上述芳基及雜芳基之取代基之苯氧基。

芳基及/或雜芳基可較佳地被分別相同或不同之取代基單至五取代， 特別是單至四取代及更特別是單至三取代。

若， 例如， 以 4,6-二甲基一嘧啶-2-脲肟及 3,4-二氯-苄基氯做為起始物質， 則根據本發明於製備方法中之反應過程可由以下來表示：



根據本發明製備式 (I) 化合物之方法中， 式 (II) 提供嘧啶醯胺脲肟之一般定義做為起始物質。

於式 (II) 中，  $R^1$ 、 $R^2$  及  $R^3$  較佳或特別佳地具有根據

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....  
裝.....訂.....線.....

## 五、發明說明 (9)

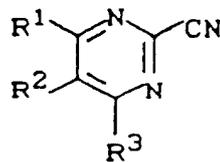
本發明上述所定義式 (I) 化合物中  $R^1$  ,  $R^2$  及  $R^3$  為較佳或特別佳之定義。

以下述及者可做為式 (II) 之起始物質之例：

嘧啶-2-脲肪，4-甲基-，5-甲基-，4,5-二甲基-，4,6-二甲基-，4,5,6-三甲基-，4-甲氧基-，5-甲氧基-，4-甲氧基-6-甲基-，4-甲氧基-5-甲基-，5-甲氧基-4-甲基-，4,6-二甲氧基-，4-甲氧基-6-乙基-，4-乙氧基-6-甲基-，4-甲氧基-6-三氟甲基-，4,6-二乙氧基-及雙-4,6-二氟甲氧基-嘧啶-2-脲肪。

除了嘧啶-2-脲肪 (嘧啶-2-醯胺脲，-(II)， $R^1 = R^2 = R^3 = H$ -詳，Ann. Chim.(巴黎)5 (1960), 351-379) 外，式 (II) 起始物質為新穎並為本發明之一部分。

新穎之式 (II) 嘧啶醯胺脲之獲得係由通式 (IV) 之氰基嘧啶



(IV)

其中，

$R^1$  ,  $R^2$  及  $R^3$  具上述定義，

與脛基胺或其加合物，如，脛基氯化銨，若適當於酸接

## 五、發明說明 (10)

受劑，如碳酸鈉，存在下，及若適當於稀釋劑，如乙醇及水存在下，於溫度介於20℃及100℃間，加以反應。

於式(IV)， $R^1$ ， $R^2$ 及 $R^3$ 較佳或特別佳地具有根據本發明上述所定義式(I)化合物中 $R^1$ ， $R^2$ 及 $R^3$ 為較佳或特別佳之定義。

以下述及者為式(IV)化合物之例：

4,5-二甲基-，4,6-二甲基-，4,5,6-三甲基-，4-甲氧基-，5-甲氧基-，4-甲氧基-6-甲基-，4-甲氧基-5-甲基-，5-甲氧基-4-甲基-，4,6-二甲氧基-，4-甲氧基-6-乙基-，4-乙氧基-6-甲基-，4-甲氧基-6-三氟甲基-，4,6-二乙氧基-及雙-4,6-二氟甲氧基-嘧啶-2-脒。

式(IV)之氟基嘧啶為已知及/或可藉已知方法製備(詳，Beilstein E III/IV，卷25，783-791，Monatshefte Chemie 87 (1956)，526-546；Chem. Pharm. Bull. 6 (1958)，633-638)。

根據本發明製備或(I)化合物之方法中，式(III)提供一烷化劑之一般定義並進一步做為起始物質。

於式(III)，A及Ar較佳或特別佳地具有根據本發明上述所定義式(I)化合物中A及Ar為較佳或特別佳之定義；X代表氟、氯、溴或碘，較佳為氯為溴。

可提及之式(III)起始物質之例為：

## 五、發明說明 (11)

苄基氣，1-苄基-及2-苄基-乙基氣，2-氟-，3-氟，4-氟-，2,4-二氟，2,6-二氟-及3,4-二氟-苄基氣，2-氯-，3-氯-，4-氯-，2,4-二氯-，2,6-二氯-及3,4-二氯苄基氣，2-溴-，3-溴-及4-溴-苄基氣，4-氧基，苄基氣，2-甲基-，3-甲基-，4-甲基，2,3-二甲基-，2,4-二甲基-，2,6-二甲基-，2,5-二甲基-，3,4-二甲基-及2,4,6-三甲基-苄基氣，2-甲氧基-，3-甲氧基-，4-甲氧基-及3,4-二甲氧基-苄基氣，3-甲氧基羰基-及4-甲氧基羰基-苄基氣，2-三氟甲基-，3-三氟甲基-及4-三氟甲基-苄基氣，4-三氟甲氧基-及4-三氟甲硫基-苄基氣，3,4-亞甲二氧基苄基氣，4-苯氧基-及3-苯氧基-苄基氣，1-氯甲基-及2-氯甲基-萘，以及相應之溴烷化合物。

式(III)之起始物質為合成中之已知化學品。

根據本發明製備新穎之式(I)化合物的方法較佳為使用稀釋劑進行。適合之稀釋劑為所有之惰性有機溶劑、這些較佳者包括脂族及芳香族；經選擇被鹵化之烴類，如，戊烷，己烷，庚烷，環己烷，石油醚，汽油，石油英，苯，甲苯，二甲苯，二氯甲烷，二氯乙烷，氯仿，四氯化碳，氯化苯及鄰-二氯苯；醚，如二乙醚及二丁醚，乙二醇二甲醚及二乙二醇二甲醚，四氫呋喃及二噁烷，酮，如丙酮，甲乙酮，甲基異丙酮及甲基異丁酮；

## 五、發明說明 (12)

酯，如乙酸甲酯及乙酸乙酯；腈，如乙腈及丙腈；醯胺，如二甲基甲醯胺，二甲基乙醯胺及N-甲基-吡咯烷酮以及二甲基亞砷，四亞甲基砷及六甲基磷三醯胺。

可用於本發明方法中之酸接受劑為所有習知可用於此類反應之酸-結合劑。下列較為適合：鹼金屬氫化物及鹼土金屬氫化物，如氫化鋰，氫化鈉，氫化鉀及氫化鈣；鹼金屬氫氧化物及鹼土金屬氫氧化物，如氫氧化鋰，氫氧化鈉，氫氧化鉀及氫氧化鈣；鹼金屬碳酸鹽，鹼金屬碳酸氫鹽，鹼土金屬碳酸鹽及鹼土金屬碳酸氫鹽，如碳酸鈉，碳酸鉀，碳酸氫鈉及碳酸氫鉀，以及碳酸鈣，鹼金屬醋酸鹽，如醋酸鈉及醋酸鉀，鹼金屬醇鹽，如甲醇鈉，乙醇鈉，丙醇鈉，異丙醇鈉，丁醇鈉，異丁醇鈉，特-丁醇鈉，甲醇鉀，乙醇鉀，丙醇鉀，異丙醇鉀，丁醇鉀，異丁醇鉀及特-丁醇鉀；再者鹼性之氮化物，如三甲基胺，三乙基胺，三丙基胺，三丁基胺，二異丁基胺，二環己基胺，乙基二異丙基胺，乙基二環己基胺，N,N-二甲基苄基胺，N,N-二甲基-苯胺，吡啶，2-甲基-3-甲基-，-4-甲基-，2,4-二甲基-，2,6-二甲基-，2-乙基，4-乙基-及5-乙基-2-甲基-吡啶，1,5-二氮雙環-[4,3,0]-壬-5-稀(DBN)，1,8-二氮雙環-[5.4.0]-十一-7烯(DBU)及1,4-二氮雙環-[2,2,2]-辛烷(DABCO)。

## 五、發明說明 (13)

進行本發明之方法時，反應溫度可於一實質範圍內變化。一般而言，本方法係於溫度介於0℃及150℃間，較佳為於溫度20至120℃間，加以進行。

根據本發明之方法一般係於常壓下進行。然而，其亦可於增壓或減壓下進行之。

進行本發明之方法時，分別所需起始物質之量通常使用大約等莫耳量。然而，兩份之一亦分別可以較過量使用。一般來說，反應係於一酸接受劑存在下於適當之稀釋劑中進行，且反應混合物於特定所需之溫度下攪拌幾小時。本發明之進行係分別以習知方法加以實施。

根據本發明之活性化合物表現有效的生物作用並能實際地用來對抗有害生物。此活性化合物較佳為用於植物保護劑，特別是作為殺真菌劑。

用於植物保護方面之殺真菌劑係用以抵抗根腫菌綱，卵菌綱，壺菌綱，接合菌綱，子囊菌綱，擔子菌綱及半知菌綱。

用於植物保護方面之殺菌劑係用以抵抗假單胞菌、根瘤菌、腸桿菌、棒桿菌及鏈黴菌。

以下提及某些屬於前列各類真菌及細菌之病因性微生物作為例子，但並非用以限制：

黃單胞菌屬，例如，野油菜黃單胞菌及水稻黃單胞菌；假單胞菌屬，例如，流淚假單胞菌及丁香假單胞菌

## 五、發明說明 (14)

；腐黴屬，例如，終極腐黴；疫黴，例如，致病疫黴；假霜黴屬，例如，葎草假霜黴或古巴假霜黴，單軸黴屬，例如，葡萄生單軸黴；霜黴屬，例如，碗豆霜黴或芸苔霜黴，白粉菌屬，例如，禾白粉菌；單絲殼屬，例如，蒼耳單絲殼；叉絲單囊殼屬，例如，白叉絲單囊殼；黑星菌屬，例如，蘋果黑星菌，核腔菌屬，例如，圓核腔菌或麥類核腔菌(分生孢子型式:Drechslera, syn:長蠕孢屬)；旋孢腔菌屬，例如，禾旋孢腔菌(分生孢子型式:Drechslera, syn:長蠕孢屬)；單胞銹菌屬，例如，疣頭單胞銹菌；柄銹菌屬，例如，隱匿柄銹菌；腥黑粉菌屬，例如，小麥網腥黑粉菌；黑粉菌屬，例如，裸黑粉菌或燕麥散黑粉菌；薄膜革菌屬，例如，佐佐木薄膜革菌；Pyricularia屬，例如，稻熱病菌；鐮孢黴屬，例如，大刀鐮孢黴；葡萄孢屬，例如，灰葡萄孢，殼針孢屬，例如，穎枯殼針孢；小球腔菌屬，例如，穎枯小球腔菌，尾孢屬，例如，雙灰尾孢，鏈格孢屬，例如，芸苔鏈格孢；小假尾孢屬，例如，Pseudocercospora herpotrichoidea。

本活性化合物於用以抵抗植物疾病所需濃度下對植物之良好忍受性使其可治療植物體之地面以上部位，植物繁殖地下莖與種子，以及土壤。

特別地，根據本發明之式(I)化合物具有有效的保護

## 五、發明說明 (15)

作用對抗黑星菌屬，例如對抗蘋果上之蘋果黑星菌，對抗旋孢腔菌屬，例如對抗大麥上之禾旋孢腔菌，及對抗核腔菌屬，例如對抗大麥上之圓核腔菌。一有效作用亦可由對抗稻上之稻熱病菌而觀察得到。

對於某些範圍，其它真菌植物之有害生物，例如，於穀物上之禾白粉菌、雪腐鏟孢及穎枯殼針孢，以及動物之有害生物，例如昆蟲及酵母菌，亦可被式(I)化合物加以抵抗。

視其個別物理及/或化學性質而定，本活性化合物可轉變成習知配方例，如溶液，乳濁液，懸浮液，粉末，泡沫，糊劑，粒劑，濕劑，於聚合物質及於用於種子之塗覆組成物中之極細膠囊，以及ULV冷霧配方。

這些配方係依已知方式加以製造，例如，混合活性化合物與填充劑，即液態溶劑，壓力下之液化氣體，及/或固態載劑，選擇地使用界面活性劑，即乳化劑及/或分散劑，及/或泡沫形成劑。於使用水作為填充劑時，亦可使用，例如，有機溶劑作為輔助溶劑。適當之液態溶劑主要有：芳族類，如二甲苯，甲苯或烷基萘，氯化芳族類或氯化脂族烴，如氯苯，氯乙烯或二氯甲烷，脂族烴，如環己烷或石蠟，如礦物油餾份，醇類，如丁醇或乙二醇以及其醚與酯類，酮類，如丙酮，甲乙酮，甲基異丁基酮或環己酮，強極性溶劑，如二甲基甲醯胺及二

## 五、發明說明 (18)

甲基亞碲，以及水。液化氣體填充劑或載劑意指於常溫常壓下為氣態之液體，例如，氣溶膠推進劑，如鹵化烴以及丁烷，丙烷，氮及二氧化碳。適當之固態載劑有：例如，地表天然礦物，如高嶺土，黏土，滑石，白堊，石英，美國活性白土，蒙特土或矽藻土，及地表合成礦物，如高度分散之矽石，礬土及矽酸鹽。用於粒劑之適當固態載劑有：例如，壓碎及分割之天然礦物，如方解石，大理石，浮石，海泡石，及白雲石，以及無機與有機粉之合成顆粒，和有機物質如木屑，椰子殼，玉米穗軸及菸草莖之顆粒。適當之乳化及/或泡沫形成劑有：例如，非離子性及陰離子性乳化劑，如聚氧化乙烯-脂肪酸酯，聚氧化乙烯脂肪醇醚，如烷基芳基聚乙二醇醚，烷基磺酸酯，烷基硫酸酯，芳基磺酸酯以及白朮水解產物。適當之分散劑有：例如，木質素亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。

可於配方中使用黏著劑，如羧甲基纖維素及天然與合成之粉狀粒狀或格子狀聚合物，如阿拉伯膠，聚乙烯醇及聚乙烯乙酸酯，以及天然磷脂，如腦磷脂與卵磷脂，及合成磷脂。其他添加劑可為礦物及植物油。

可使用著色劑，例如無機色料，如氧化鐵，氧化鈦及普魯士藍，及有機染料，如茜素染料，偶氮染料及金屬酞花青染料，以及使用痕量營養素，如鐵，錳，硼，銅

## 五、發明說明 (7)

， 銻 ， 鉬 及 鋅 鹽 。

配方一般含有0.1至95重量百分比活性化合物，較佳為0.5至90%。

根據本發明活性化合物可以與其他已知活性化合物(如殺真菌劑，殺昆蟲劑，殺蟎劑及除草劑)混合物，及以與肥料及生長調節劑之混合物存在於配方中。

本活性化合物可如此直接使用或以其配方型式或製自這些配方之使用型式(如立即用溶液，懸浮液，可濕粉末，糊劑，可溶粉末，屑末及粒劑)加以使用。它們係依習知方式，例如，經水灑，漬灑，噴霧，撒佈，粉撒，泡沫施加，掠拭等，加以施用。亦可經超低體積方法施用本活性化合物或將活性化合物配方或活性化合物本身注入土壤中。亦可處理植物之種子。

於處理植物體部份時，活性化合物於使用型式中之濃度可於大範圍內變動，一般，係介於1至0.0001重量百分比，較佳為0.5至0.001重量百分比之間。

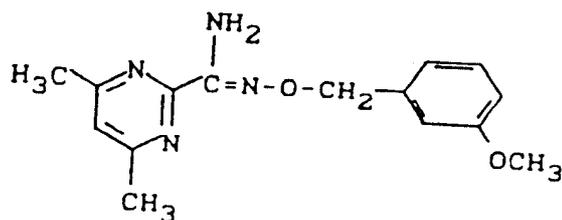
於處理種子時，活性化合物之量一般需為每公斤種子0.001至50克，較佳為0.01至10克。

為處理土壤，於作用地點需0.00001至0.1重量百分比，較佳為0.0001至0.02重量百分比之活性化合物濃度。

.....  
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....  
裝.....訂.....線.....

## 五、發明說明 (18)

製備實例實例 1:

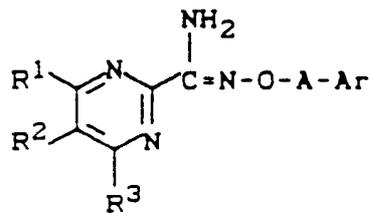
將 2.5 克 (15 毫莫耳) 之 4,6-二甲基-嘧啶-2-脲肟，  
2.82 克 (15 毫莫耳) 之 3-甲氧基-苄基氣，2.07 克 (15 毫莫  
耳) 之碳酸鉀及 50 毫升的乙腈混合物加以攪拌並緩和地  
回流 14 小時。接著將混合物冷卻至室溫並過濾，且於一  
真空水幫浦下濃縮濾液。以石油醚攪拌殘留物進行再結  
晶，並以空吸過濾分離出結晶產物。

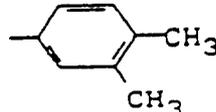
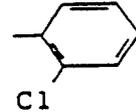
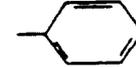
得到熔點 83℃ 之 3.7 克 (理論上之 86%) 之鄰-(3-甲氧  
基-苄基)-4,6-二甲基-嘧啶-2-脲肟。

其它式 (I) 化合物之實例可依類似實例 1 及本發明製  
法之一般敘述來製備，其列於下表 I

## 五、發明說明 (19)

表 1: 式 (I) 化合物之實例

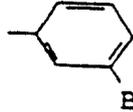
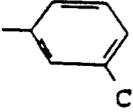
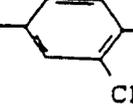
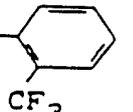


實例 號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	Ar	物理數據
2	H	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub>		熔點: 138° C
3	H	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub>		熔點: 121° C
4	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點: 152° C
6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	$\begin{array}{c} \text{CH} \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$		熔點: 115° C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·

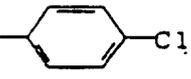
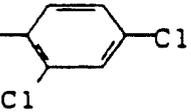
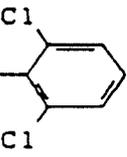
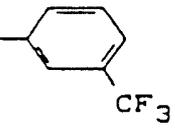
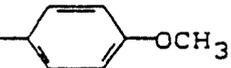
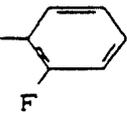
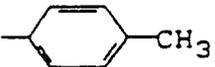
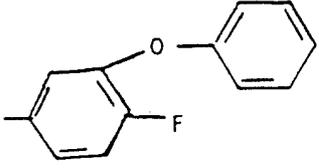
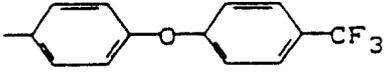
## 五、發明說明 (20)

實例 號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	Ar	物理數據
7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點： 93° C
8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點： 94° C
9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點： 103° C
10	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點： 143° C
11	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點： 111° C
12	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點： 114° C
13	OCH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
14	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		熔點： 105° C
15	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點： 112° C
16	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,30*

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

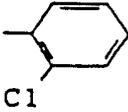
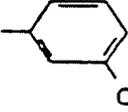
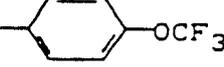
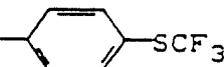
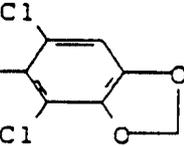
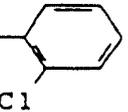
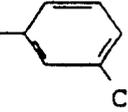
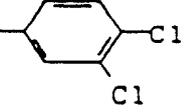
五、發明說明 (21)

實例號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	Ar	物理數據
17	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
18	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點: 121° C
19	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
20	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,35*
21	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,29*
22	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點: 122° C
23	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點: 59° C
24	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,26*
25	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,21*
26	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,30*

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

五、發明說明 (22)

實例號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	Ar	物理數據
27	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點 : 101° C
28	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點 : 77° C
29	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,29*)
30	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,34*)
31	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點 : 127° C
32	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,28*)
33	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,40*)
34	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,24*)
35	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點 : 81° C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

五、發明說明 (23)

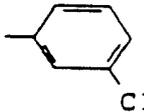
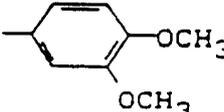
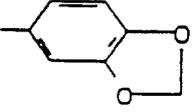
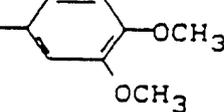
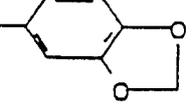
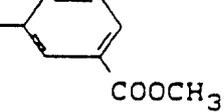
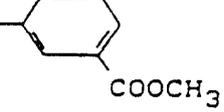
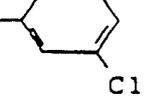
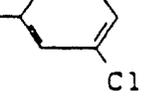
實例號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	Ar	物理數據
36	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點： 85° C
37	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		: 87° C
38	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
39	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
40	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
41	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
42	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		熔點： 110° C
43	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		熔點： 135° C
44	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點： 128° C
45	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		(油)

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝  
訂  
線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

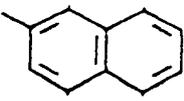
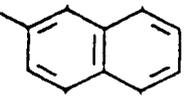
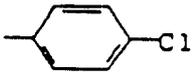
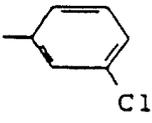
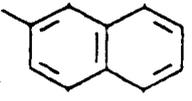
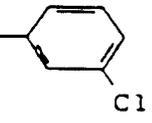
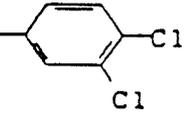
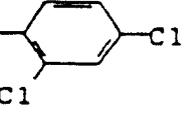
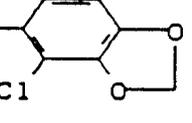
## 五、發明說明 (24)

實例 號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	Ar	物理數據
46	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5, 23*
47	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
48	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
49	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
50	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
51	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
52	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
53	OCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
54	OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5, 25*

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

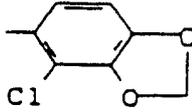
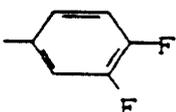
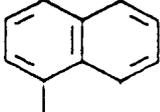
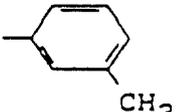
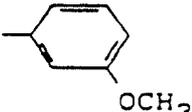
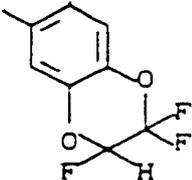
五、發明說明 (25)

實例號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	Ar	物理數據
55	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,46*
56	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,44*
57	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點: 101° C
58	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點: 89° C
59	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點: 95° C
60	OCH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
61	OCH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
62	OCH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
63	OCH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
64	OCH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

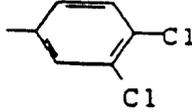
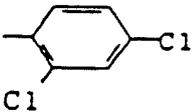
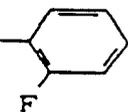
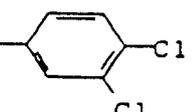
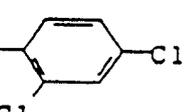
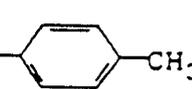
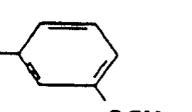
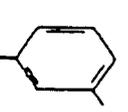
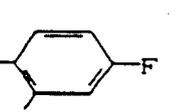
五、發明說明 (26)

實例 號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	Ar	物理數據
65	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
66	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
67	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
68	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點 : 89° C
69	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,25*
70	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
71	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
72	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
73	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

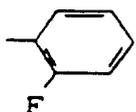
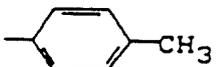
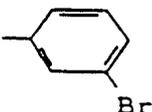
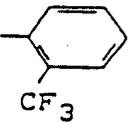
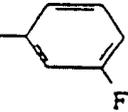
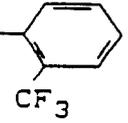
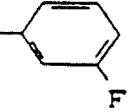
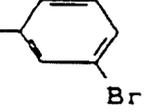
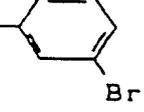
五、發明說明 (27)

實例 號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	Ar	物理數據
74	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
75	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
76	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
77	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5, 20*
78	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點: 127° C
79	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
80	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
81	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
82	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

## 五、發明說明(28)

實例號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	Ar	物理數據
83	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點： 98° C
84	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,16*
85	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
86	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
87	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點： 69° C
88	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點： 81° C
89	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,27*
90	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		δ = 5,23*
91	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)

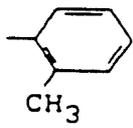
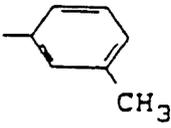
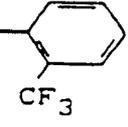
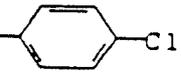
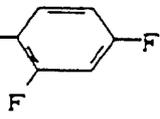
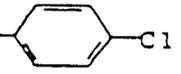
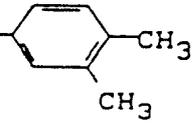
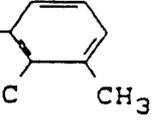
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(29)

實例號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	Ar	物理數據
92	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點：143° C
93	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
94	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
95	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH   CH <sub>3</sub>		(油)
96	OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -		CH <sub>2</sub>		(油)
97	H	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(油)
98	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
99	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
100	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點：76° C
101	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)

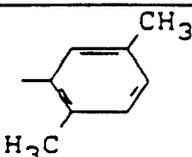
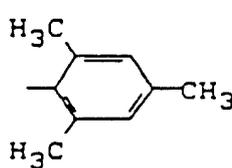
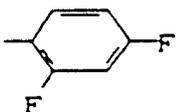
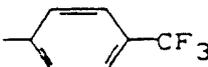
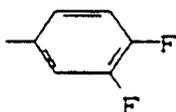
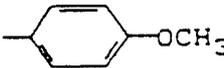
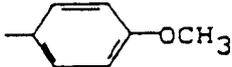
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(30)

實例號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	Ar	物理數據
102	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點：128° C
103	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
104	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
105	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點：123° C
106	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
107	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
108	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
109	OCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>		(油)
110	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點：96° C
111	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點：135° C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

200469

專利申請案第80108852號

(民國 81 年 12 月 29 日送呈) - 附件(三)

A 6  
B 6

81年12月29日 修正  
補充

五、發明說明 (21)

實例號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	Ar	物理數據
112	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
113	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點 : 139°C
114	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點 : 151°C
115	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點 : 96°C
116	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		(油)
117	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點 : 121°C
118	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點 : 131°C
119	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點 : 101°C
120	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		熔點 : 132°C

\*) <sup>1</sup>H-NMR: A=CH<sub>2</sub> 之 δ 0JBM (ppm) (CDCl<sub>3</sub> 中)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

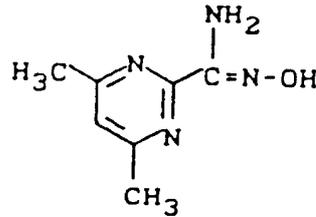
.....裝.....訂.....線.....

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

## 五、發明說明 (2)

## 式 (II) 之起始物質

## 實例 (II-1):



將 6.95 克 (0.1 莫耳) 之 羥基胺鹽酸鹽 溶於 100 毫升乙醇中。然後加入 10.6 克 (0.1 莫耳) 碳酸鈉之 20 毫升水溶液，續加入 13.3 克 (0.1 莫耳) 之 4,6-二甲基嘓啶-2-脲。回流溶液 14 小時，冷卻並濃縮之。將殘留物置於 200 毫升二氯甲烷中吸收水份，以些許水洗滌二氯甲烷水溶液，以硫酸鈉加以乾燥，過濾並濃縮。

得到結晶殘留物 10.5 克 (63% 之理論值) 之 4,6-二甲基-嘓啶-2-脲，熔點 209°C。

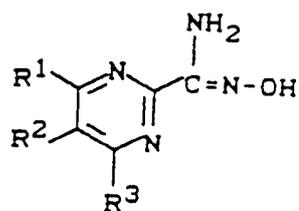
式 (II) 之化合物之其它實例可依類似實例 (II-1) 加以製備並列於下表 2。

.....  
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....  
裝.....訂.....線.....

## 五、發明說明 (33)

表 2: 式 (II) 化合物之實例



實例 號碼	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物理數據
II-2	CH <sub>3</sub>	H	H	熔點 : 212° C
II-3	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
II-4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	熔點 : 260° C
II-5	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
II-6	OCH <sub>3</sub>	H	H	
II-7	OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -		
II-8	H	OCH <sub>3</sub>	H	熔點 : 205° C
II-9	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	熔點 : 184° C

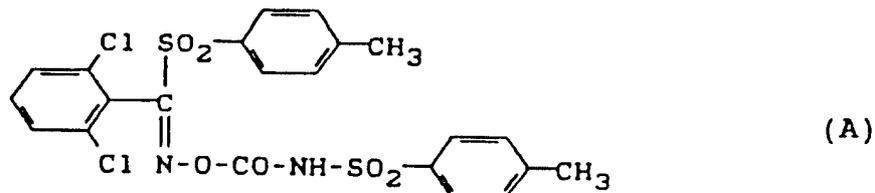
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 . . . 訂 . . . 線 . . .

## 五、發明說明 (34)

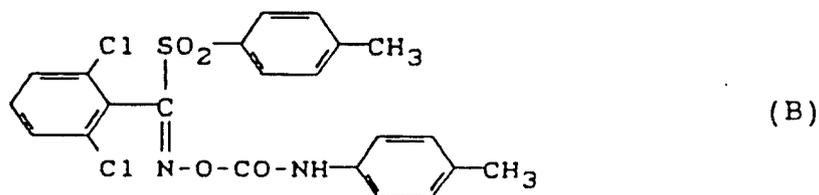
## 用途實例：

以下用途實例中，下列之化合物係作為比較物質：



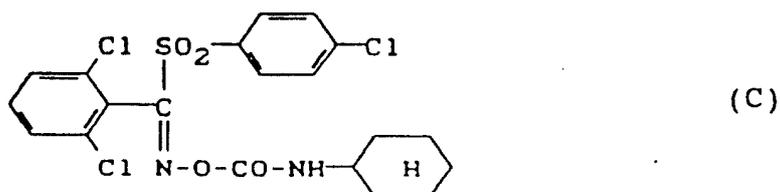
$\alpha$ -(4-甲基-苯基磺醯基)-0-(4-甲基-苯基磺醯基胺羰基)-2,6-二氯-苯醛肟

(揭示於 EP-A 205,076, 實例 1)；



$\alpha$ -(4-甲基-苯基磺醯基)-0-(4-甲基-苯基胺羰基)-2,6-二氯-苯醛肟

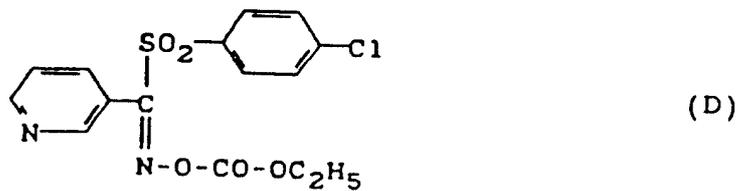
(揭示於 EP-A 205,076, 實例 16)；



## 五、發明說明 (35)

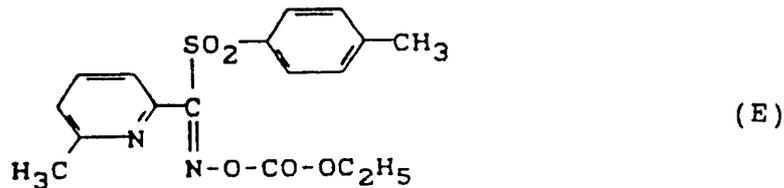
$\alpha$  - (4-氯-苯基磺醯基)-0-環己基胺羰基-2,6-二氯-苯  
 醛肟

(揭示於 EP-A 281,909, 實例 60);



$\alpha$  - (4-氯-苯基磺醯基)-0-乙氧羰基-吡啶-3-醛肟

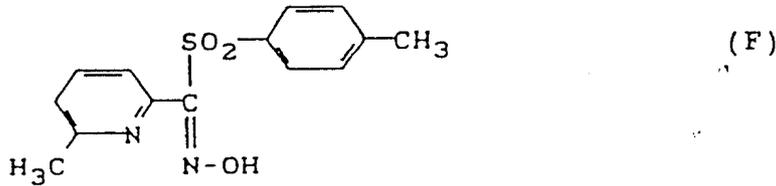
(揭示於 EP-A 236,897, 實例 5);



$\alpha$  - (4-甲基-苯基磺醯基)-0-乙氧羰基-6-甲基吡啶-2-  
 醛肟

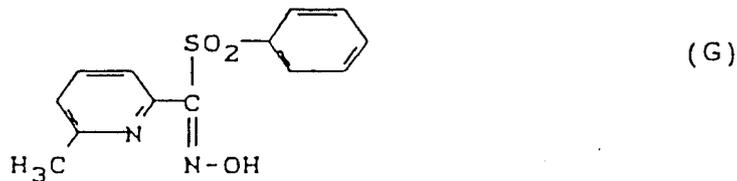
(揭示於 EP-A 236,897, 實例 10);

五、發明說明 ( )



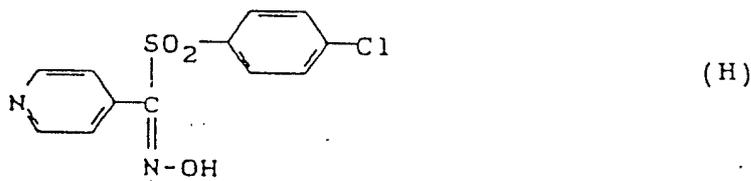
α-(4-甲基-苯基磺醯基)-6-甲基-吡啶-2-醛肟

(揭示於 EP-A-236,919, 實例 10);



α-苯基磺醯基-6-甲基-吡啶-2-醛肟

(揭示於 EP-A 236,919, 實例 11);



α-(4-氯-苯基磺醯基)-吡啶-4-醛肟

(揭示於 EP-A 236,919, 實例 3)。

實例 A

Pyricularia 試驗 (稻作) / 保護性

溶劑: 12.5 重量份 丙酮

乳化劑: 0.3 重量份 烷芳基聚乙醇醚

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明。(一)

為製備活性化合物之適當製劑，將1重量份活性化合物與所述量溶劑混合，並以水及所述量乳化劑稀釋濃縮液至所需濃度。

為測試保護活性，將幼小植物噴以活性化合物製劑直至濕。當噴塗層乾燥時，將稻熱病菌之含水孢子懸浮液培植於植物上。然後將植物置於25℃及100%相對大氣濕度之溫室中。

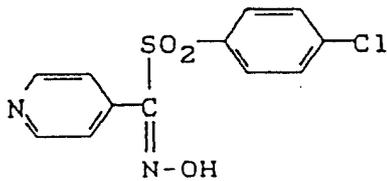
於接種後4天評估疾病的擴散。  
該等活性化合物、活性化合物的濃度和其結果可從下表得知：

表 A

Pyricularia 試驗(稻作)/保護性

活性化合物	在噴霧液中活性化合物的重量百分率濃度	相對於未處理控制組的活性程度百分比
-------	--------------------	-------------------

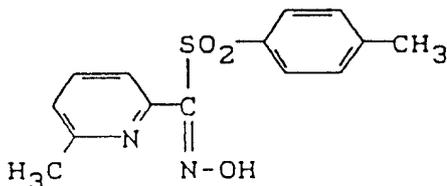
揭示於 EP-OS 0,236,919 :



(H)

0,025

50.



(F)

0,025

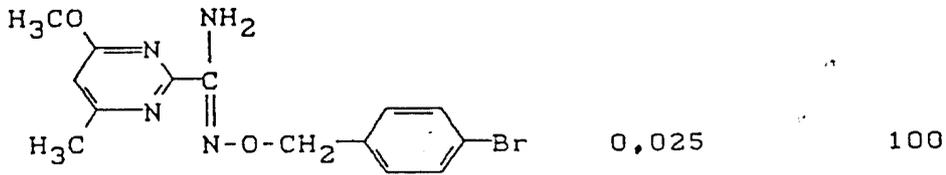
50

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

五、發明說明 ( )

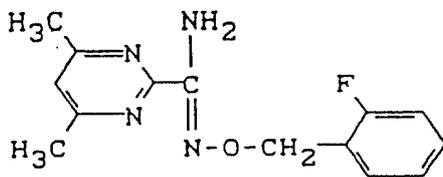
根據本發明：



(12)

0,025

100



(22)

0,025

100

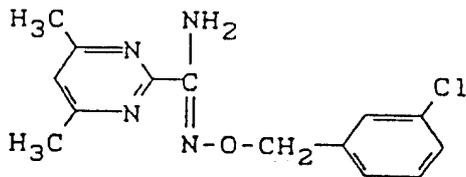
表 A (續)

Pyricularia 試驗(稻作) / 保護性

活性化合物

在噴霧液中活性化合物的重量百分率濃度

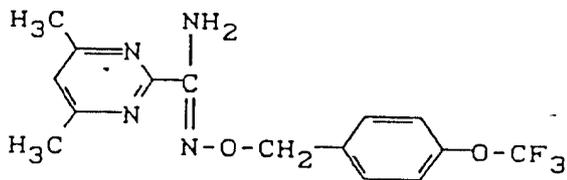
相對於未處理控制組的活性程度百分比



(28)

0,025

100

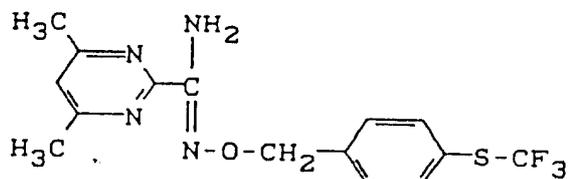


(29)

0,025

100

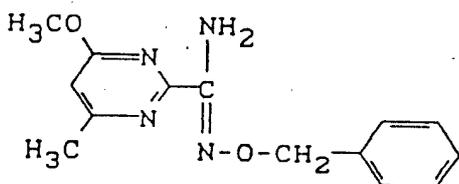
五、發明說明。( )



(30)

0.025

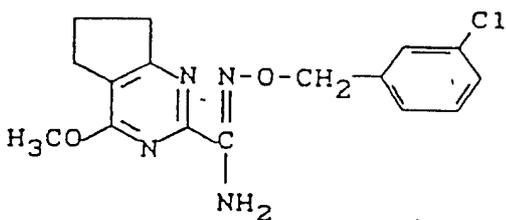
100



(32)

0.025

100



(54)

0.025

100

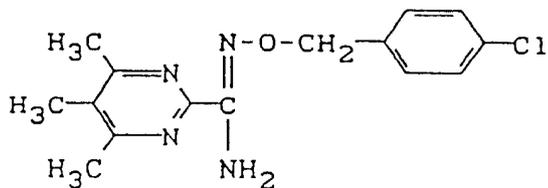
表 A (續)

Pyricularia 試驗(稻作) / 保護性

活性化合物

在噴霧液中活性化合物的重量百分率濃度

相對於未處理控制組的活性程度百分比

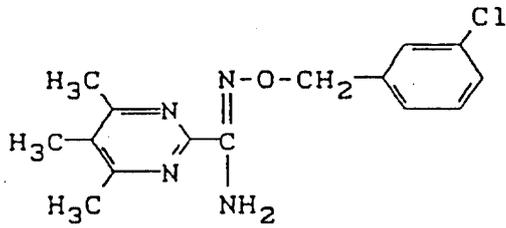


(57)

0.025

100

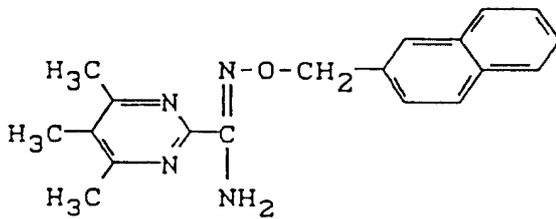
五、發明說明。( )



(58)

0,025

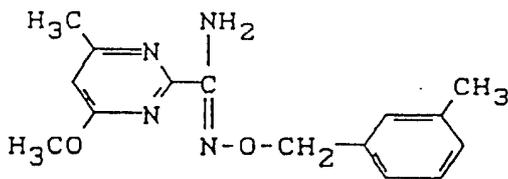
100



(59)

0,025

100



(69)

0,025

100

表 A (續)

Pyricularia 試驗(稻作) / 保護性

活性化合物

在噴霧液中活性化合物的重量百分率濃度

相對於未處理控制組的活性程度百分比

(112)

0,025

100

(116)

0,025

90

(117)

0,025

90

(118)

0,025

90

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明。( )

實例 B

黑星菌試驗(蘋果)/保護性

溶劑:4.7重量份丙酮

乳化劑:0.3重量份烷芳基聚乙二醇醚

為製備活性化合物，將1重量份活性化合物與所述  
 量溶劑及乳化劑混合，並用水稀釋濃縮液至所需濃度。

為測試保護活性，將幼小植物噴以活性化合物製劑  
 直至滴濕。於噴塗層乾燥後，將蘋果茄致原有機體(蘋  
 果黑星菌)之含水分孢子懸浮液培植於植物上然後將  
 植物放於20℃及100%相對大氣濕度之培育室中1天。

然後將植物置於20℃及70%相對大氣濕度之溫室中。  
 於接種後12天進行評估。

該等活性化合物、活性化合物的濃度和其結果可從下表得知：

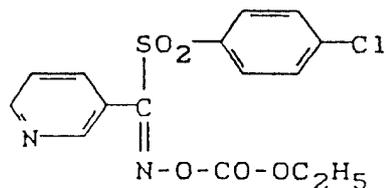
表 B

黑星菌試驗(蘋果)/保護性

活性化合物

在活性化合物濃度  
 為10ppm時，相對於  
 未處理控制組的活  
 性程度百分比

揭示於 EP-OS 0,236,897 :



(D)

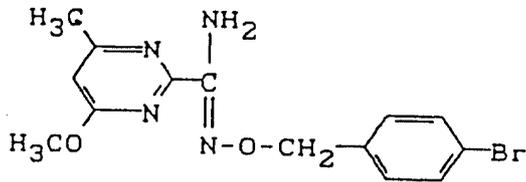
14

(請先閱讀背而之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

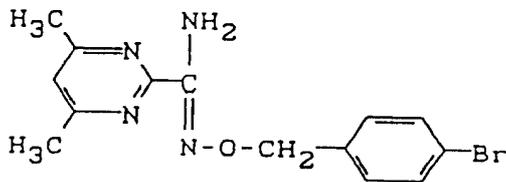
五、發明說明。( )

根據本發明：



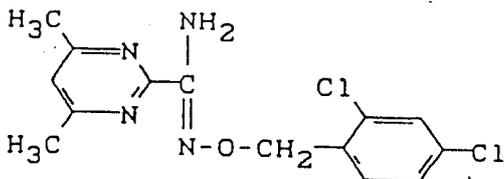
(12)

79



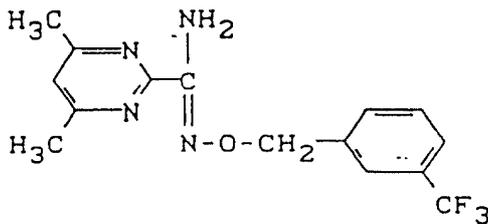
(15)

94



(18)

86



(20)

74

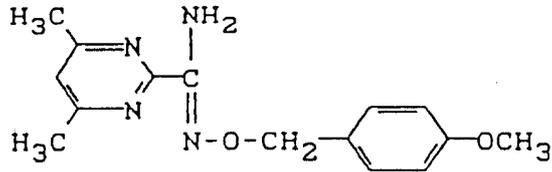
表 B (續)

黑星菌試驗(蘋果) / 保護性

活性化合物

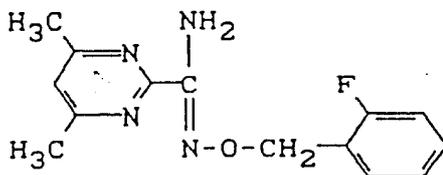
在活性化合物濃度  
為10ppm時，相對於  
未處理控制組的活  
性程度百分比

五、發明說明 ( )



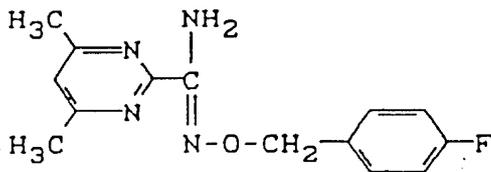
(21)

87



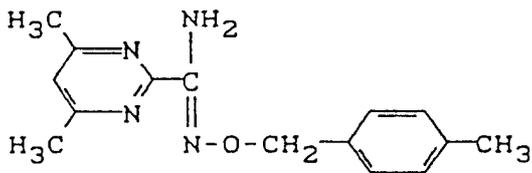
(22)

89



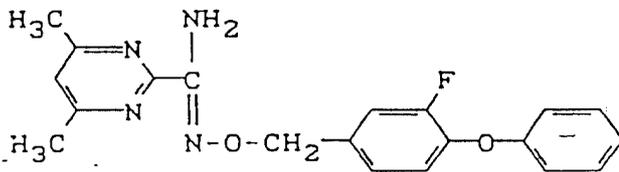
(23)

89



(24)

93



(25)

91

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

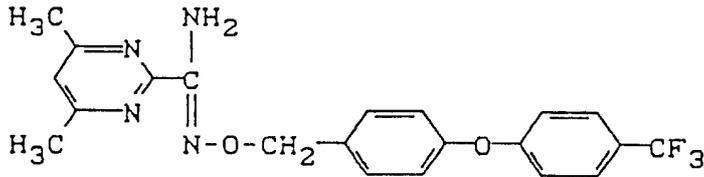
五、發明說明 ( )

表 B (續)

黑星菌試驗 (蘋果) / 保護性

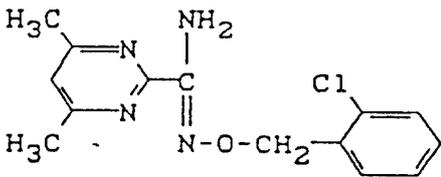
活性化合物

在活性化合物濃度  
為 10ppm 時，相對於  
未處理控制組的活  
性程度百分比



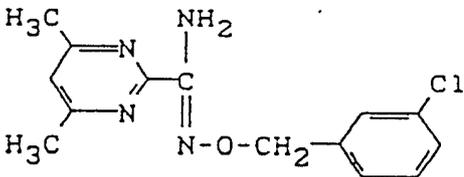
(26)

87



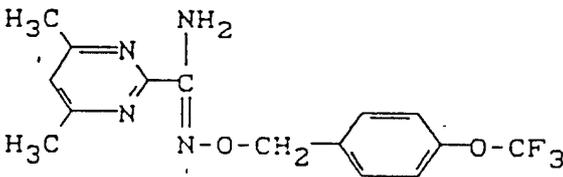
(27)

93



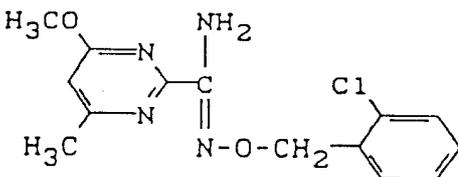
(28)

94



(29)

91



(33)

74

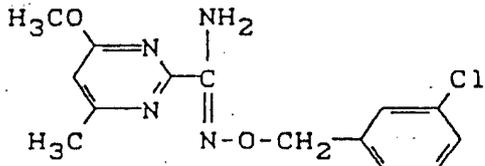
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

五、發明說明。( )  
黑星菌試驗(蘋果) / 保護性  
活性化合物

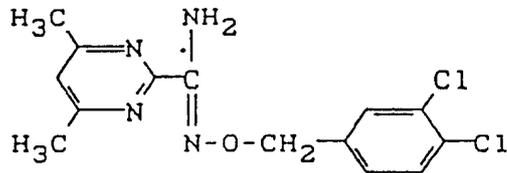
表 B (續)

在活性化合物濃度  
為10ppm時，相對於  
未處理控制組的活  
性程度百分比



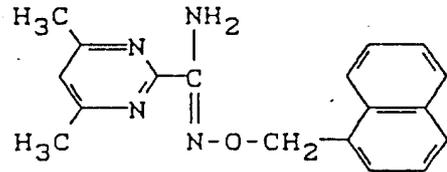
(34)

89



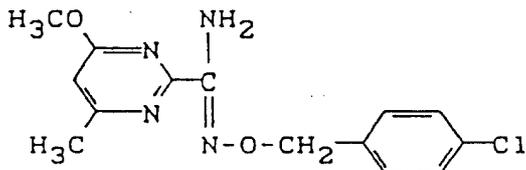
(35)

98



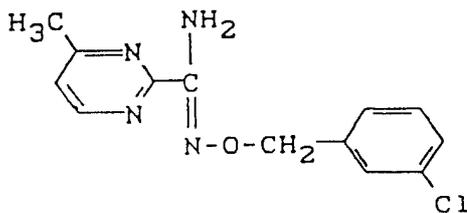
(36)

81



(37)

100



(42)

77

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

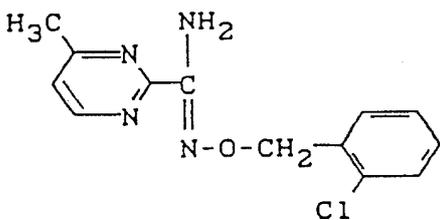
五、發明說明(一)

表 B (續)

黑星菌試驗(蘋果) / 保護性

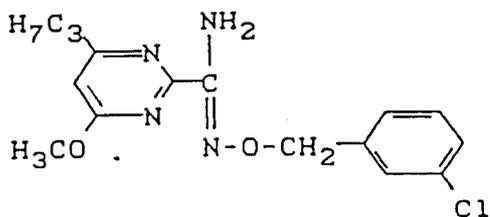
活性化合物

在活性化合物濃度  
為10ppm時，相對於  
未處理控制組的活  
性程度百分比



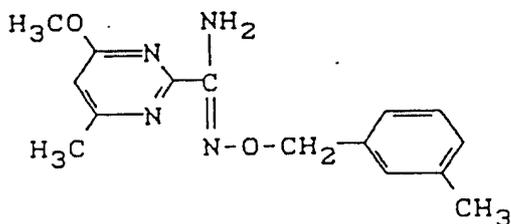
(43)

67



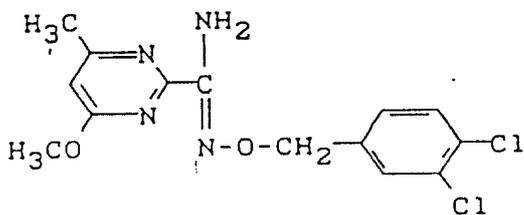
(46)

82



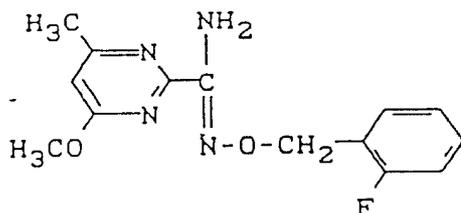
(69)

88



(77)

42



(83)

92

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

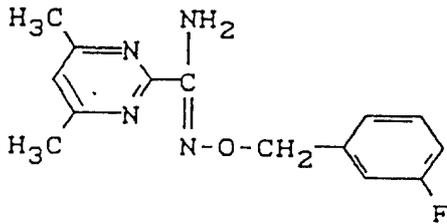
五、發明說明。( )

表 B (續)

黑星菌試驗(蘋果)/保護性

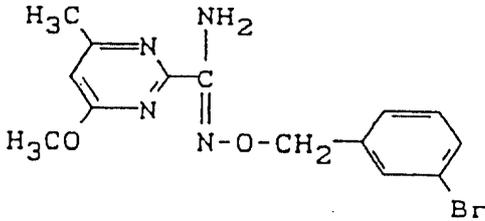
活性化合物

在活性化合物濃度  
為10ppm時，相對於  
未處理控制組的活  
性程度百分比



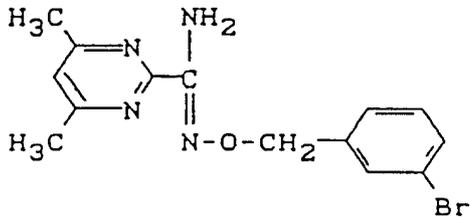
(87)

92



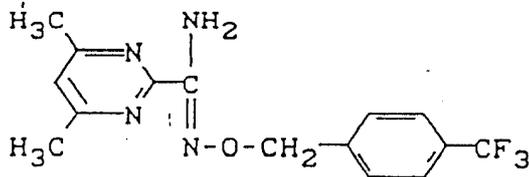
(90)

85



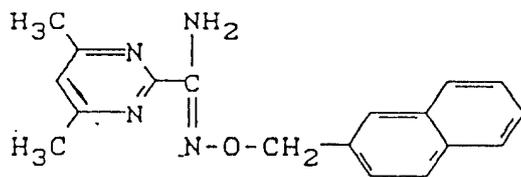
(91)

75



(105)

91



(55)

75

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

.....裝.....訂.....線.....

## 五、發明說明。( )

實例 C

禾旋孢腔菌試驗(大麥)/保護性

溶劑:100份二甲基甲醯胺

乳化劑:0.25份烷基芳基聚乙二醇醚

為製備活性化合物之適當製劑，將1重量份活性化合物與所述量溶劑及乳化劑混合，之後以水稀釋濃縮液至所需濃度。

為測試保護活性，將幼小植物噴以活性化合物製劑直至露濕。於噴塗層業乾燥後，將植物噴以禾旋孢腔菌之分生孢子懸浮液。將植物保存於在20°C 100%相對大氣濕度下之培養室中48小時。

將植物放置於在約20°C溫度約80%相對大氣濕度下之溫室中。

於接種後7天進行評估。

該等活性化合物、活性化合物的濃度和其結果可從下表得知：

表 C

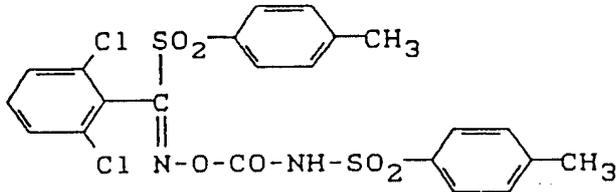
禾旋孢腔菌試驗(大麥)/保護性

活性化合物

在活性化合物濃度為  
250ppm時，相對於未  
處理控制組的活性程  
度百分比

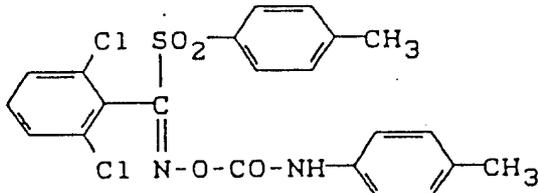
揭示於 EP-OS 0,205,076 :

五、發明說明。( )



(A)

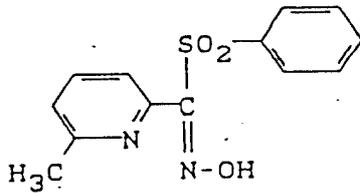
41



(B)

0

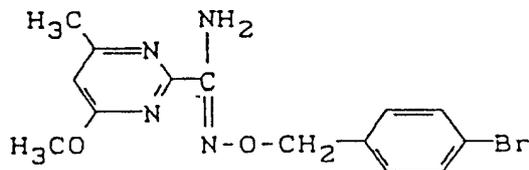
揭示於 EP-OS 0,236,919 :



(G)

0

根據本發明：



(12)

88

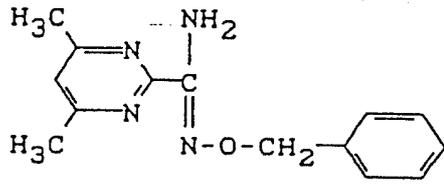
五、發明說明 ( )

表 C (續)

禾旋孢腔菌試驗(大麥) / 保護性

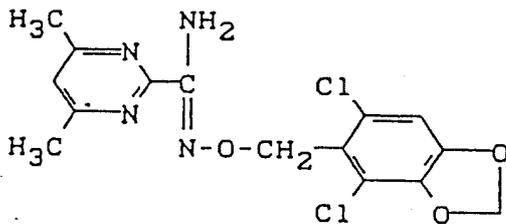
活性化合物

在活性化合物濃度為  
250ppm時，相對於未  
處理控制組的活性程  
度百分比



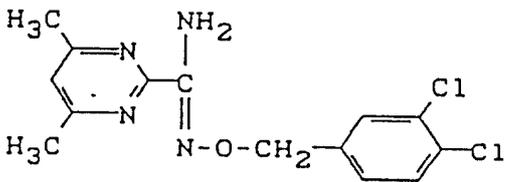
(16)

100



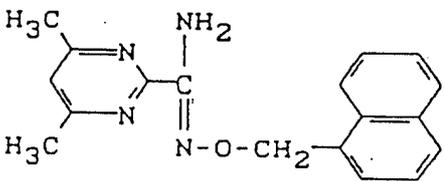
(31)

100



(35)

83



(36)

83

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · · · · · 訂 · · · · · 線 · · · · ·



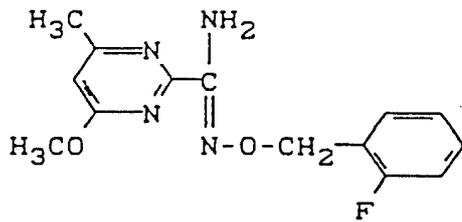
五、發明說明 ( )

表 C (續)

禾旋孢腔菌試驗(大麥) / 保護性

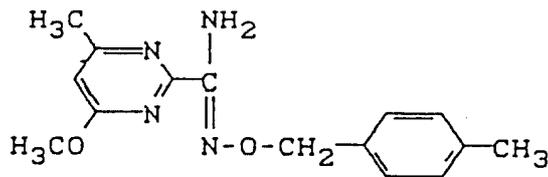
活性化合物

在活性化合物濃度為  
250ppm時，相對於未  
處理控制組的活性程  
度百分比



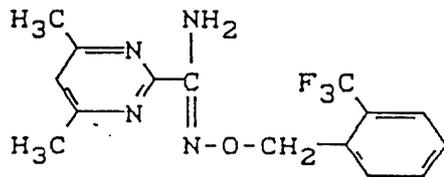
(83)

83



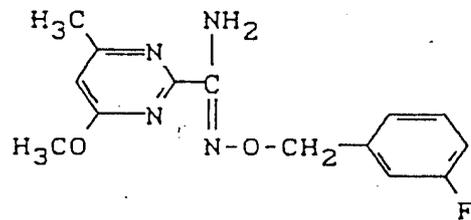
(84)

100



(88)

100



(89)

83

## 五、發明說明。( )

實例 D

圓核腔菌試驗(大麥)保護性

溶劑:100重量份二甲基甲醯胺

乳化劑:0.25重量份烷基芳基聚乙二醇醚

為製備活性化合物之適當製劑，將1重量份活性化合物與所述量溶劑及乳化劑混合，之後以水稀釋濃縮液至所需濃度。

為測試保護活性，將幼小植物噴以活性化合物製劑直至露濕。於噴塗層業乾燥後，將植物噴以圓核腔菌之分生孢子懸浮液。然後將植物保存於在20℃100%相對大氣濕度下之培養至中48小時。

將植物放置於在約20℃溫度約80%相對大氣濕度下之溫室中。

接種後7天進行評估。

該等活性化合物、活性化合物的濃度和其結果可從下表得知：

.....  
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)  
.....

.....裝.....訂.....線.....

五、發明說明 ( )

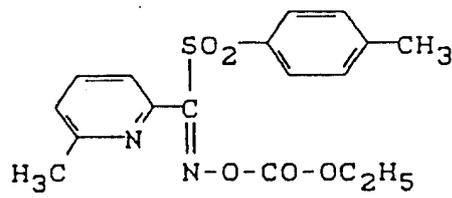
表 D

圓核腔菌試驗(大麥) / 保護性

活性化合物

在活性化合物濃度為  
250ppm時，相對於未  
處理控制組的活性程  
度百分比

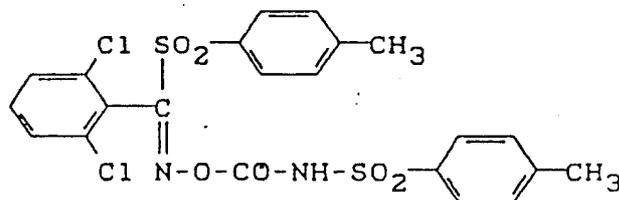
揭示於 EP-OS 0,236,897 :



(E)

0

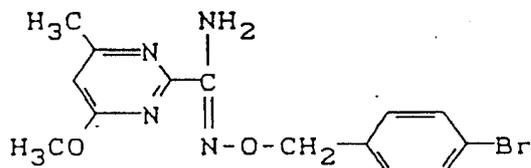
揭示於 EP-OS 0,205,076 :



(A)

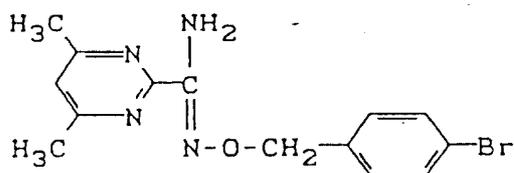
66

根據本發明 :



(12)

88



(15)

100

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

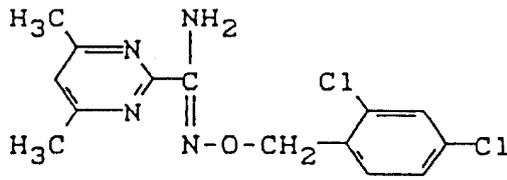
裝  
訂  
線

五、發明說明。( )  
表 D (續)

圓核腔菌試驗(大麥) / 保護性

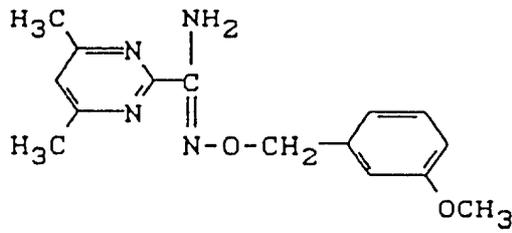
活性化合物

在活性化合物濃度為  
250ppm時，相對於未  
處理控制組的活性  
度百分比



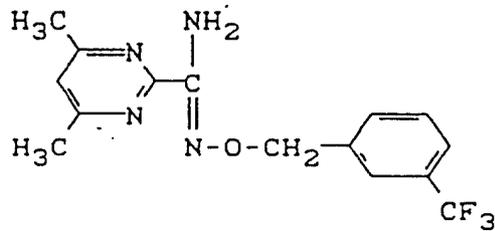
(18)

88



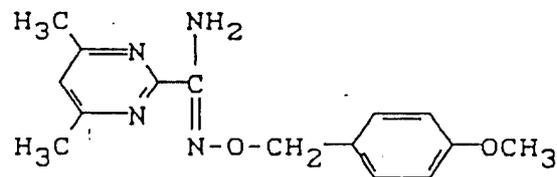
(1)

88



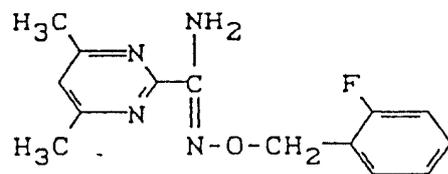
(20)

88



(21)

88



(22)

88

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

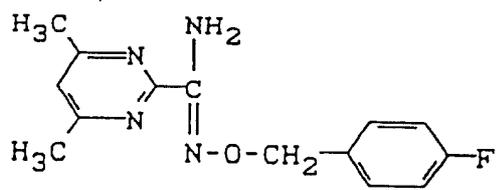
五、發明說明 ( )

表 D (續)

圓核腔菌試驗 (大麥) / 保護性

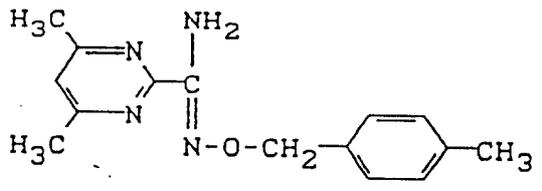
活性化合物

在活性化合物濃度為  
250ppm時，相對於未  
處理控制組的活性程  
度百分比



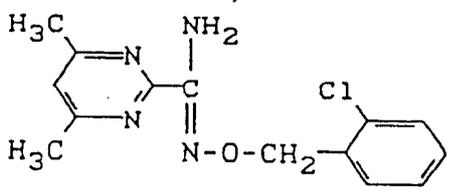
(23)

88



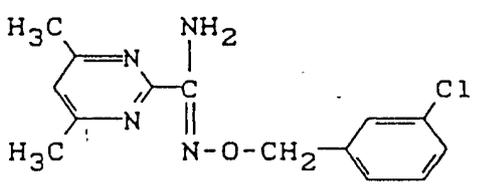
(24)

88



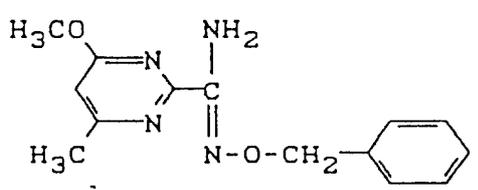
(27)

88



(28)

88



(32)

88

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

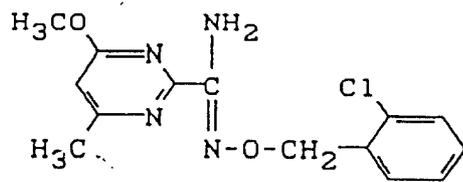
五、發明說明。( )

表 D (續)

圓核腔菌試驗(大麥)/保護性

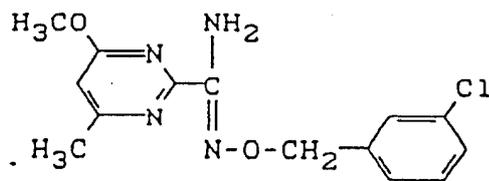
活性化合物

在活性化合物濃度為  
250ppm時，相對於未  
處理控制組的活性  
度百分比



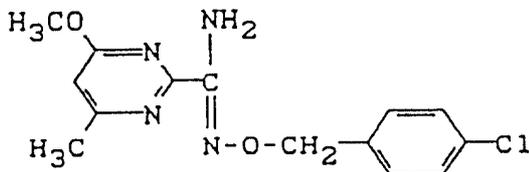
(33)

88



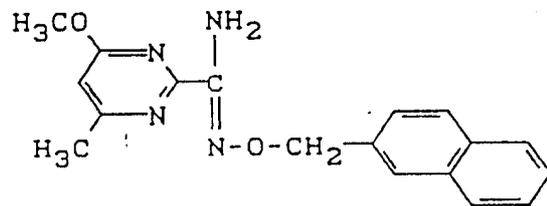
(34)

88



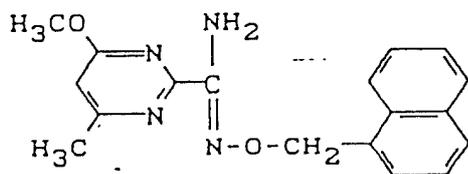
(37)

100



(56)

94



(68)

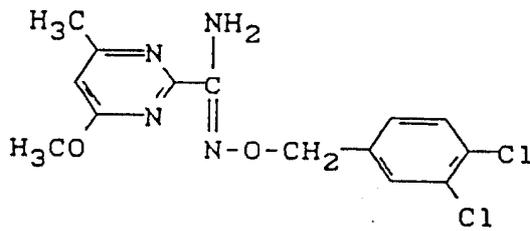
100

五、發明說明 ( )

表 D (續)

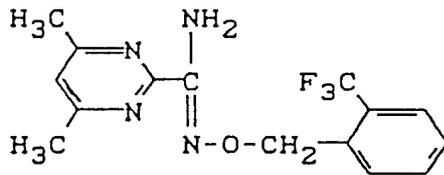
圓核腔菌試驗(大麥) / 保護性  
活性化合物

在活性化合物濃度為  
250ppm時，相對於未  
處理控制組的活性程  
度百分比



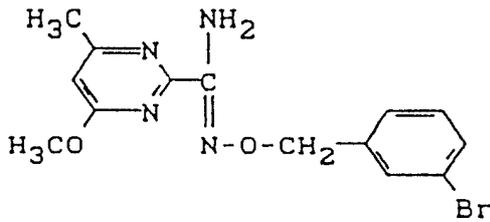
(77)

100



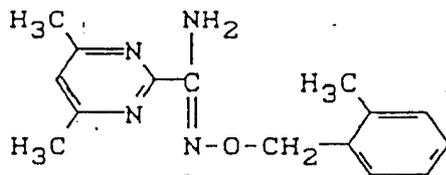
(88)

100



(90)

100



(92)

88

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

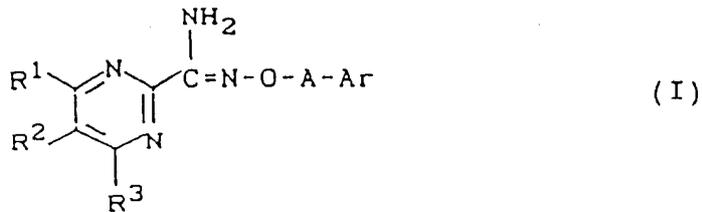
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

四、中文發明摘要(發明之名稱：

經取代嘧啶基醯胺脒

通式(I)之新穎之經取代嘧啶基醯胺脒



其中

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ , A 及 Ar 如說明中所定義, 其製法中新穎之  
中間體, 及其對抗有害生物之用途。

新穎之式(I)化合物可由類似之方法製備, 如以適  
當之烷化劑與適當的嘧啶基醯胺脒反應, 亦為新穎之起  
始化合物, 即式(II)之嘧啶基醯胺脒其中 -A-Ar 代表氫,  
可由適當的氰基嘧啶與脛胺或其酸加合物來製備。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

附註：本案已向

德 (地區) 申請專利, 申請日期:

案號:

德

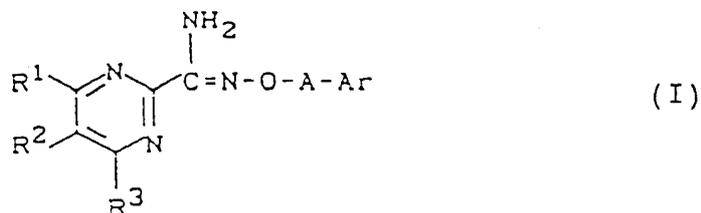
1990年12月12日 P40 39 630.4

四、 文發明摘要(發明之名稱：

Substituted pyrimidylamide oximes

## A b s t r a c t

New substituted pyrimidylamide oximes of the general formula (I)



in which

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, A and Ar have the meanings given in the description, new intermediates for their preparation, and their use for combating pests.

The new compounds of the formula (I) can be prepared by analogous processes, for example by reacting suitable pyrimidylamide oximes with suitable alkylating agents. The starting compounds which are also new, namely the pyrimidylamide oximes of the formula (II) in which -A-Ar represents hydrogen, can be prepared from suitable cyanopyrimidines with hydroxylamine or its acid adducts.

- 2-A -

附註：本案已向

國(地區) 申請專利，申請日期：

案號：

(請先閱請背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

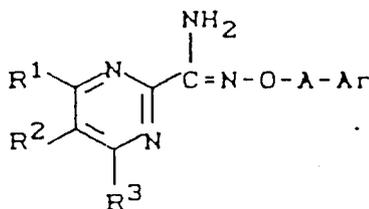
訂

線

## 六、申請專利範圍

專利申請案第80108852號  
 ROC Patent Appln. No.80108852  
 修正之申請專利範圍中文本- 附件(-)  
Amended Claims in Chinese - Encl. I  
 (民國 81 年 12 月 29 日送呈)  
 (Submitted on December 29, 1992)

## 1. 一種如通式 (I) 之經取代嘧啶基醯胺肪



其中，

$R^1$  代表氫、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基或二( $C_1-C_4$ -烷基)胺基；

$R^2$  代表氫、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基或與 $R^1$ 或 $R^3$ 一起代表三亞甲基或四亞甲基；

$R^3$  代表氫、 $C_1-C_4$ -烷基或 $C_1-C_4$ -烷氧基；

A 代表 $C_1-C_5$ -烷二基；

Ar 代表苯基或萘基、吡啶基或苯並噁唑基等。

## 2. 根據申請專利範圍第 1 項之式 (I) 經取代嘧啶基醯胺肪，其中

$R^1$  代表氫、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基或二甲胺基，

$R^2$  代表氫、甲基或甲氧基，

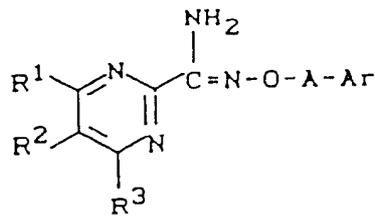
$R^3$  代表氫、甲基、乙基、丙基、甲氧基或乙氧基，

## 六、申請專利範圍

A 代表甲-1,1-二基(亞甲基), 乙-1,1-二基(亞乙基)或乙-1,2-二基(二亞甲基), 及

Ar 代表苯基、萘基、苯並噁唑基或吡啶基。

## 3. 一種製備式(I)之經取代嘧啶基醯胺肟的方法



其中,

$\text{R}^1$  代表氫、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷氧基或二( $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷基)胺基;

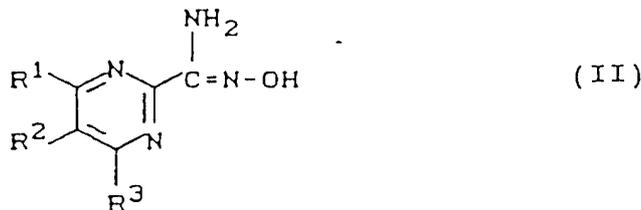
$\text{R}^2$  代表氫、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷氧基或與 $\text{R}^1$ 或 $\text{R}^3$ 一起代表三亞甲基或四亞甲基;

$\text{R}^3$  代表氫、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷基或 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷氧基;

A 代表 $\text{C}_1$ - $\text{C}_5$ -烷二基;

Ar 代表苯基或萘基、吡啶基或苯並噁唑基等,

其特徵在於將式(II)之嘧啶基醯胺肟



其中,

$\text{R}^1$  代表氫、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷氧基或二( $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷基)胺基;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

打

線

## 六、申請專利範圍

$R^2$  代表氫、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基或與 $R^1$ 或 $R^3$ 一起代表三亞甲基或四亞甲基；

$R^3$  代表氫、 $C_1-C_4$ -烷基或 $C_1-C_4$ -烷氧基；

若適當於一酸接受劑存在下，及若適當於一稀釋劑在下，與式(III)之烷化劑進行反應



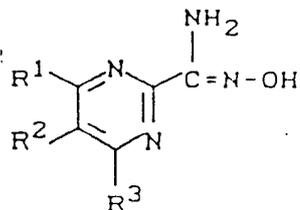
其中，

A 代表 $C_1-C_5$ -烷二基；

Ar 代表苯基或萘基、吡啶基或苯並噁唑基等，及

X 代表鹵素。

4. 一種殺真菌劑，其特點在於包含至少一種根據申請專利範圍第1或2項之經取代嘧啶基醯胺肪。
5. 一種對抗真菌的方法，其特徵在於使至少一種根據申請專利範圍第1或2項之式(I)經取代嘧啶基醯胺肪作用在真菌及／或其棲息處。
6. 一種製備殺真菌劑的方法，其特徵在於將至少一種根據申請專利範圍第1或2項之式(I)經取代嘧啶基醯胺肪與填充劑及／或界面活性劑混合。
7. 一種如式(II)之嘧啶基醯胺肪



(II)

其中，

$R^1$  代表氫、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基或二( $C_1-C_4$ -烷基)胺基；

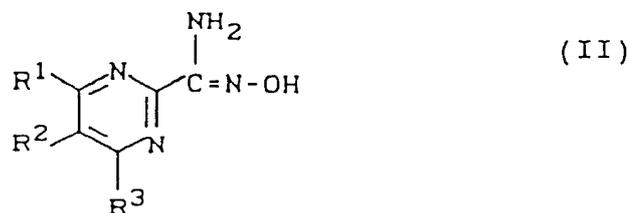
## 六、申請專利範圍

$R^2$  代表氫、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基或與 $R^1$ 或 $R^3$ 一起代表三亞甲基或四亞甲基；

$R^3$  代表氫、 $C_1-C_4$ -烷基或 $C_1-C_4$ -烷氧基；

嘧啶-2-醯胺肟 ( $R^1=R^2=R^3=H$ ) 除外。

## 8. 一種製備式 (II) 之嘧啶基醯胺肟的方法



其中，

$R^1$  代表氫、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基或二 ( $C_1-C_4$ -烷基) 胺基；

$R^2$  代表氫、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基或與 $R^1$ 或 $R^3$ 一起代表三亞甲基或四亞甲基；

$R^3$  代表氫、 $C_1-C_4$ -烷基或 $C_1-C_4$ -烷氧基；

嘧啶-2-醯胺肟 ( $R^1=R^2=R^3=H$ ) 除外，

其特徵在於將式 (IV) 之氰基嘧啶



其中

$R^1$ 、 $R^2$ 或 $R^3$ 具上述定義，

於若適當一酸接受劑存在下及若適當稀釋劑存在下，於溫度介於 $20^\circ\text{C}$ 至 $100^\circ\text{C}$ 間，與脛基胺或其酸加合物反應。