

296333

公告本

|      |                        |
|------|------------------------|
| 申請日期 | 83.04.21               |
| 案號   | 83103566               |
| 類別   | Ad/N 43/40, 67D 213/89 |

(以上各欄由本局填註)

296333

發明專利說明書

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

|        |               |   |
|--------|---------------|---|
| 一、發明名稱 | 中文            | 除草用 4-取代吡啶基-3-甲醇類   |
|        | 英文            | HERBICIAL 4-SUBSTITUTED PYRIDYL-3-CARBINOLS                           |
| 二、發明人  | 姓名            | 1. 秦曉玲                      3. 吳顏安<br>2. 魏逸曲                          |
|        | 籍貫<br>(國籍)    | 1. 美國<br>2. 中國<br>3. 美國   |
|        | 住、居所          | 1. 美國加州摩拉葛市威法道 56 號<br>2. 美國加州皮諾里市星馬街 2840 號<br>3. 美國加州里奇門市溫吐拉街 951 號 |
| 三、申請人  | 姓名<br>(名稱)    | 英商奇尼卡公司   |
|        | 籍貫<br>(國籍)    | 英國  |
|        | 住、居所<br>(事務所) | 英國倫敦史丹荷路 15 號   |
|        | 代表人<br>姓名     | 蘇珊簡   |

裝

訂

線

## 五、發明說明( 1 )

本發明領域

在一方面，本發明有關各種表現出人意表之合宜除草活性之新穎4-取代吡啶基-3- 甲醇類。在其他方面，本發明有關各種包含一吡啶基甲醇及一合宜載體之除草組合物，有關一種包含對需要控制之區域施加一除草有效量之吡啶基甲醇化合物之控制不合宜植物之方法，而且有關各種有用於製作此等4-取代吡啶基-3- 甲醇化合物之中間產物。

本發明背景

對有效除草劑之需求無需特別強調。控制雜草及不合宜植物極具經濟重要性，因為雜草競爭作用抑制農作物葉子、果實或種子之生成。雜草之存在可降低收穫效率及穫物之品質。無作區內之雜草可導致火災、不合宜之砂或雪漂移、及（或）對過敏症人士之刺激。因此，抑制不合宜之雜草生長乃極為有利。

準此，本發明之一目的為提供各種有效之新穎除草化合物，並提供一種新穎之除草組合物及一種控制雜草之新穎方法。此外，本發明之一目的為提供各種除表現除草活性外亦有用於生成其他除草活性化合物之中間產物。

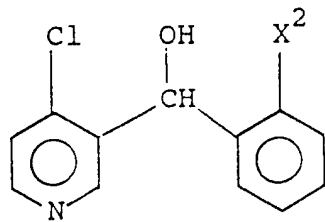
雖然業界揭示某些4-取代吡啶基-3- 甲醇，但此等揭示事項並未包含此等化合物之用途。迄此，Radinov 等人 "Synthesis of 4-Amino-3-pyridinyl and 4-Amino-5-pyrimidinyl Aryl Ketones and Related Compounds Via an ortho-Lithiation REaction", Synthesis, pp. 886-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

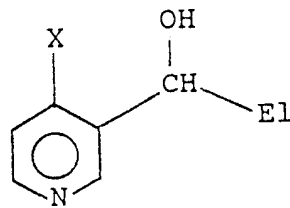
裝  
訂  
線

## 五、發明說明( 2 )

891, November 1986 在第 887 頁內揭示  $X^2$  為氯或氟以及其他事項之具下列通式之化合物：

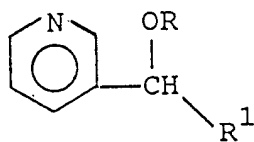


多少類似者為 Marsais 等人 "Directed Lithiation of 4-Halopyridines: Chemoselectivity, Regioselectivity and Application to Synthesis", J. Heterocyclic Chem., Vol 25, pp. 81-87 (1987) 揭示具下列通式之化合物之生成：



式中 E1 苯基或 2-甲氧基苯基。

某些具有下列通式之 (未取代) -吡啶基-3-甲醇類：



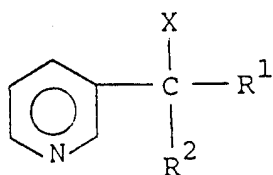
揭示於頒給 Cherpeck 之美國專利第 4,407,806 號中 (式中 R 及  $R^1$  如其中所定義)。

頒給 Krumkalns 之美國專利 4,116,665 號揭示類似之採用具下式之化合物調節水草生長之方法：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

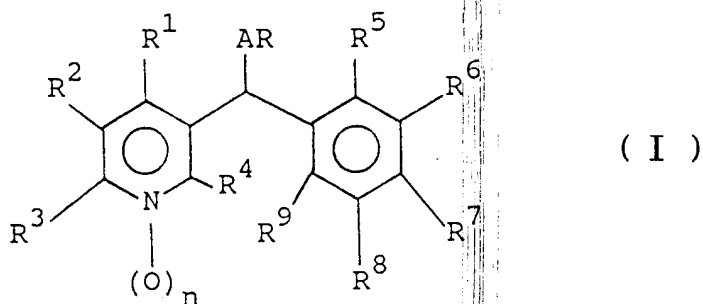
## 五、發明說明( 3 )



式中在其他事項外， $R^1$ 可為氫， $R^2$ 可為（取代）苯基而X可為羥基或烷氧基。

本發明綜述

在一方面，本發明之標的為具有通式(I)之化合物以及其在農業上可被接受之鹽類：



( I )

式中： $R^1$ 及 $R^5$ 各自分別為鹵素、 $C_1 - C_6$ 鹵烷基、 $C_1 - C_6$ 烷基、 $C_1 - C_6$ 烷氧基、 $C_1 - C_6$ 鹵烷氧基、 $(C_1 - C_6)$ 烷氧基— $(C_1 - C_6)$ 烷基、 $-S(O)_m-R^{10}$ 、氰基、 $-OH$ 、硫氰基、硝基或為 $-N(R^{11})(R^{12})$ ；

$R^2$ 、 $R^3$ 及 $R^4$ 各自分別為氫、 $C_1 - C_6$ 烷基、硝基、鹵素、 $C_1 - C_6$ 烷氧基、 $C_1 - C_6$ 鹵烷氧基、 $C_1 - C_6$ 鹵烷基或為 $-S(O)_m-R^{10}$ ；

$R^6$ 、 $R^7$ 及 $R^8$ 各自分別為氫、鹵素、 $C_1 - C_6$ 烷基、 $C_1 - C_6$ 烯基、 $C_1 - C_6$ 炔基、硝基、 $-N(R^{11})(R^{12})$ 、 $C_1 - C_6$ 鹵烷基、 $C_1 - C_6$ 烷氧基、 $C_1 - C_6$ 鹵烷氧基、 $(C_1 - C_6)$ 烷氧基— $(C_1 - C_6)$ 烷基、鹵代 $(C_1 - C_6)$ 烷氧基— $(C_1 - C_6)$ 烷基、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明( 4 )

氰基、 $-C(X)-R^{10}$  或為  $-S(O)_m-R^{10}$  ;

$R^9$  為氫、鹵素、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  鹵烷氧基、 $(C_1-C_6)$  烷氧基- $(C_1-C_6)$  烷基、 $-S(O)_m-R^{10}$ 、氰基、羥基、硫氰基、硝基或為  $-N-(R^{11})(R^{12})$  ;

A 為氧或硫 ;

n 為 0 或 1 ;

R 為氫、取代以一或更多鹵素之氫碳基或為  $C_1-C_6$  烷氧基，或者具有  $-C(X)-R^{10}$ 、 $-C(O)-C(O)-R^{10}$ 、 $-S(O)_2-R^{10}$  或  $-P(X)(R^{15})(R^{16})$  等通式 ;

其中：X 為 O 或 S ;

$R^{10}$  為氫碳基、取代氫碳基、氫碳氧基、取代氫碳氧基、氫碳基-S-、取代氫碳基-S-、或具  $-N(R^{11})(R^{12})$  通式 ;

其中  $R^{11}$  及  $R^{12}$  各自分別為氫、氫碳基、取代氫碳基、氫碳氧基、取代氫碳氧基、吡啶基、呋喃基、噻吩基、 $(C_1-C_6)$  烷氧基羰基  $(C_1-C_6)$  烷基、羥基羰基  $(C_1-C_6)$  烷基、或  $N(R^{13})(R^{14})$  而其中  $R^{13}$  及  $R^{14}$  各自分別為氫、 $C_1-C_6$  烷基或苯基 ;

或者  $R^{11}$  及  $R^{12}$  併同其等所結合之氮形成一氮丙啶、六氫吡啶、嗎啡啉、硫嗎啡啉、硫嗎啡啉亞磺醯基、硫嗎啡啉磺醯基、環己烷亞胺、六氫吡啶、或吡咯啶環，其中任何一種皆可隨意取代以  $C_1-C_6$  烷基 ;

$R^{15}$  及  $R^{16}$  各自分別為  $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  烷硫基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

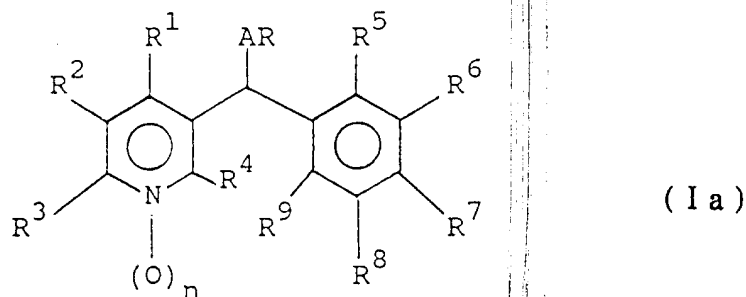
## 五、發明說明( 5 )

或  $C_1 - C_6$  烷氧基；而

$m$  為 0、1 或 2；

但當  $R^1$  為氯或氟， $R^5$  為氫、氯、氟或甲氧基，且  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  及  $R^9$  為氫時， $R$  不為氫。

在另一方面，本發明之標的為一種除草組合物，包含：  
(A) 一具有下列通式 (Ia) 之化合物及其在農業上可被接受之鹽類：



式中： $R^1$  及  $R^5$  各自分別為鹵素、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  烷氧基、 $C_1 - C_6$  鹵烷氧基、 $(C_1 - C_6)$  烷氧基 -  $(C_1 - C_6)$  烷基、 $-S(O)_m - R^{10}$ 、氰基、 $-OH$ 、硫氰基、硝基或為  $-N(R^{11})(R^{12})$ ；

$R^2$ 、 $R^3$  及  $R^4$  各自分別為氫、 $C_1 - C_6$  烷基、硝基、鹵素、 $C_1 - C_6$  烷氧基、 $C_1 - C_6$  鹵烷氧基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基或為  $-S(O)_m - R^{10}$ ；

$R^6$ 、 $R^7$  及  $R^8$  各自分別為氫、鹵素、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  烯基、 $C_1 - C_6$  炔基、硝基、 $-N(R^{11})(R^{12})$ 、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、 $C_1 - C_6$  烷氧基、 $C_1 - C_6$  鹵烷氧基、 $(C_1 - C_6)$  烷氧基 -  $(C_1 - C_6)$  烷基、鹵代  $(C_1 - C_6)$  烷氧基 -  $(C_1 - C_6)$  烷基、氰基、 $-C(X) - R^{10}$  或為  $-S(O)_m - R^{10}$ ；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明( 6 )

$R^9$  為氫、鹵素、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、 $C_1 - C_6$  烷氧基、 $C_1 - C_6$  鹵烷氧基、 $(C_1 - C_6)$  烷氧基 -  $(C_1 - C_6)$  烷基、 $-S(O)_m - R^{10}$ 、氰基、羥基、硫氰基、硝基或為  $-N - (R^{11})(R^{12})$ ;

A 為氧或硫;

n 為 0 或 1;

R 為氫、取代以一或更多鹵素之氫碳基或為  $C_1 - C_6$  烷氧基，或者具有  $-C(X) - R^{10}$ 、 $-C(O) - C(O) - R^{10}$ 、 $-S(O)_2 - R^{10}$  或  $-P(X)(R^{15})(R^{16})$  等通式;

其中：X 為 O 或 S;

$R^{10}$  為氫碳基、取代氫碳基、氫碳氧基、取代氫碳氧基、氫碳基 - S - 、取代氫碳基 - S - 、或具  $-N(R^{11})(R^{12})$  通式;

其中  $R^{11}$  及  $R^{12}$  各自分別為氫、氫碳基、取代氫碳基、氫碳氧基、取代氫碳氧基、吡啶基、呋喃基、噻吩基、 $(C_1 - C_6)$  烷氧基羰基  $(C_1 - C_6)$  烷基、羥基羰基  $(C_1 - C_6)$  烷基、或  $N(R^{13})(R^{14})$  而其中  $R^{13}$  及  $R^{14}$  各自分別為氫、 $C_1 - C_6$  烷基或苯基;

或者  $R^{11}$  及  $R^{12}$  併同其等所結合之氮形成一氮丙啶六氫吡啶、嗎啡啉、硫嗎啡啉、硫嗎啡啉亞磺醯基、硫嗎啡啉磺醯基、環己烷亞胺、六氫吡啶、或吡咯啶環，其中任何一種皆可隨意取代以  $C_1 - C_6$  烷基;

$R^{15}$  及  $R^{16}$  各自分別為  $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  烷硫基或  $C_1 - C_6$  烷氧基; 而

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

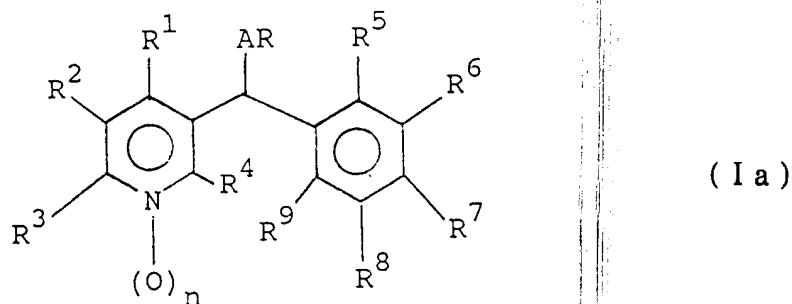
訂

線

## 五、發明說明( 7 )

$m$  為 0、1 或 2；以及 (B) 一其所用之載體。

又一方面，本發明之標的為一種控制不合宜植物之方法，包含對一需要控制之區域施加一除草有效量之式 (Ia) 化合物及其在農業上可被接受之鹽類：



式中： $R^1$  及  $R^5$  各自分別為鹵素、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  烷氧基、 $C_1 - C_6$  鹵烷氧基、 $(C_1 - C_6)$  烷氧基 -  $(C_1 - C_6)$  烷基、 $-S(O)_m - R^{10}$ 、氰基、 $-OH$ 、硫氰基、硝基或為  $-N(R^{11})(R^{12})$ ；

$R^2$ 、 $R^3$  及  $R^4$  各自分別為氫、 $C_1 - C_6$  烷基、硝基、鹵素、 $C_1 - C_6$  烷氧基、 $C_1 - C_6$  鹵烷氧基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基或為  $-S(O)_m - R^{10}$ ；

$R^6$ 、 $R^7$  及  $R^8$  各自分別為氫、鹵素、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  烯基、 $C_1 - C_6$  炔基、硝基、 $-N(R^{11})(R^{12})$ 、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、 $C_1 - C_6$  烷氧基、 $C_1 - C_6$  鹵烷氧基、 $(C_1 - C_6)$  烷氧基 -  $(C_1 - C_6)$  烷基、鹵代  $(C_1 - C_6)$  烷氧基 -  $(C_1 - C_6)$  烷基、氰基、 $-C(X) - R^{10}$  或為  $-S(O)_m - R^{10}$ ；

$R^9$  為氫、鹵素、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、 $C_1 - C_6$  烷氧基、 $C_1 - C_6$  鹵烷氧基、 $(C_1 - C_6)$  烷氧基 -  $(C_1 - C_6)$  烷基、 $-S(O)_m - R^{10}$ 、氰基、羥基、硫氰基、硝基或為  $-N-$

(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 )

 $(R^{11})(R^{12})$ ;

A 為氧或硫;

n 為 0 或 1;

R 為氫、取代以一或更多鹵素之氫碳基或為  $C_1 - C_6$  烷氧基，或者具有  $-C(X)-R^{10}$ 、 $-C(O)-C(O)-R^{10}$ 、 $-S(O)_2-R^{10}$  或  $-P(X)(R^{15})(R^{16})$  等通式；

其中：X 為 O 或 S；

$R^{10}$  為氫碳基、取代氫碳基、氫碳氧基、取代氫碳氧基、氫碳基-S-、取代氫碳基-S-、或具  $-N(R^{11})(R^{12})$  通式；

其中  $R^{11}$  及  $R^{12}$  各自分別為氫、氫碳基、取代氫碳基、氫碳氧基、取代氫碳氧基、吡啶基、呋喃基、噻吩基、 $(C_1 - C_6)$  烷氧基羰基  $(C_1 - C_6)$  烷基、羥基羰基  $(C_1 - C_6)$  烷基、或  $N(R^{13})(R^{14})$  而其中  $R^{13}$  及  $R^{14}$  各自分別為氫、 $C_1 - C_6$  烷基或苯基；

或者  $R^{11}$  及  $R^{12}$  併同其等所結合之氮形成一氮丙啶六氫吡啶、嗎啡啉、硫嗎啡啉、硫嗎啡啉亞磺醯基、硫嗎啡啉磺醯基、環己烷亞胺、六氫吡啶、或吡咯啶環，其中任何一種皆可隨意取代以  $C_1 - C_6$  烷基；

$R^{15}$  及  $R^{16}$  各自分別為  $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  烷硫基或  $C_1 - C_6$  烷氧基；而

m 為 0、1 或 2。

復一方面，由於本發明化合物中 AR 為 OH 者乃供生成本發明其他化合物且具有除草活性之有用化合物，本發明之

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

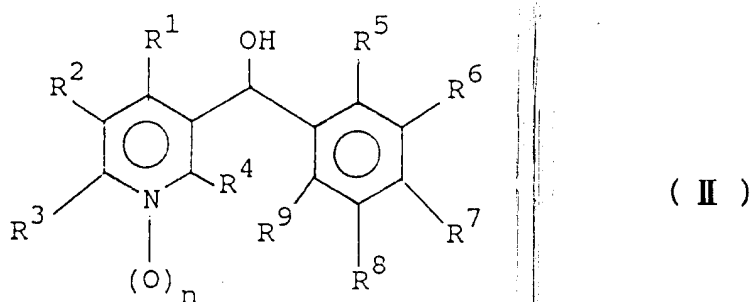
裝

訂

線

## 五、發明說明( 9 )

標的為一種具有通式( II )之化合物及其在農業上可被接受之鹽類：



式中：R<sup>1</sup>及R<sup>5</sup>各自分別為鹵素、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷氧基—(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基、-S(O)<sub>m</sub>-R<sup>10</sup>、氰基、-OH、硫氰基、硝基或為-N(R<sup>11</sup>)(R<sup>12</sup>)；

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及R<sup>4</sup>各自分別為氫、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷基、硝基、鹵素、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>鹵烷氧基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>鹵烷基或為-S(O)<sub>m</sub>-R<sup>10</sup>；

R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>及R<sup>8</sup>各自分別為氫、鹵素、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烯基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>炔基、硝基、-N(R<sup>11</sup>)(R<sup>12</sup>)、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷氧基—(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基、鹵代(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷氧基—(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基、氰基、-C(X)-R<sup>10</sup>或為-S(O)<sub>m</sub>-R<sup>10</sup>；

R<sup>9</sup>為氫、鹵素、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷氧基—(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基、-S(O)<sub>m</sub>-R<sup>10</sup>、氰基、羥基、硫氰基、硝基或為-N-(R<sup>11</sup>)(R<sup>12</sup>)；

n 為 0 或 1 ；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明( 10)

$R^{10}$  為氫碳基、取代氫碳基、氫碳氧基、取代氫碳氧基、氫碳基-S-、取代氫碳基-S-、或具  $-N(R^{11})(R^{12})$  通式；

其中  $R^{11}$  及  $R^{12}$  各自分別為氫、氫碳基、取代氫碳基、氫碳氧基、取代氫碳氧基、吡啶基、呋喃基、噻吩基、 $(C_1 - C_6)$  烷氧基羰基  $(C_1 - C_6)$  烷基、羥基羰基  $(C_1 - C_6)$  烷基、或  $N(R^{13})(R^{14})$  而其中  $R^{13}$  及  $R^{14}$  各自分別為氫、 $C_1 - C_6$  烷基或苯基；

或者  $R^{11}$  及  $R^{12}$  併同其等所結合之氮形成一氮丙啶、六氫吡啶、嗎啡啉、硫嗎啡啉、硫嗎啡啉亞磺醯基、硫嗎啡啉磺醯基、環己烷亞胺、六氫吡啶、或吡咯啶環，其中任何一種皆可隨意取代以  $C_1 - C_6$  烷基；

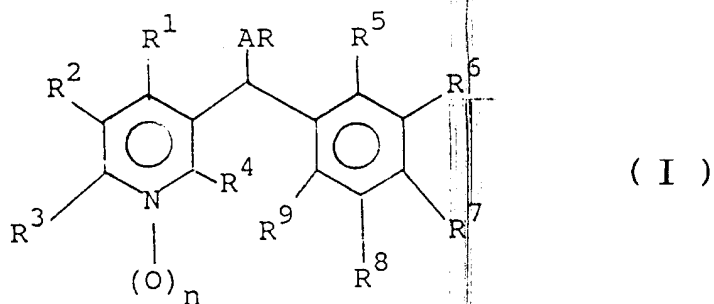
$R^{15}$  及  $R^{16}$  各自分別為  $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  烷硫基或  $C_1 - C_6$  烷氧基；而

$m$  為 0、1 或 2；

但當  $R^5$  為氫、氯、氟或甲氧基，且  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  及  $R^9$  為氫時， $R^1$  不為氯或氟。

較佳具體形式詳述

本發明之各種新穎除草化合物及其在農業上可被接受之鹽類具有通式 (I)：



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

## 五、發明說明(11)

式中： $R^1$ 及 $R^5$ 各自分別為鹵素、 $C_1 - C_6$ 鹵烷基、 $C_1 - C_6$ 烷基、 $C_1 - C_6$ 烷氧基、 $C_1 - C_6$ 鹵烷氧基、 $(C_1 - C_6)$ 烷氧基— $(C_1 - C_6)$ 烷基、 $-S(O)_m-R^{10}$ 、氰基、 $-OH$ 、硫氰基、硝基或為 $-N(R^{11})(R^{12})$ ；

$R^2$ 、 $R^3$ 及 $R^4$ 各自分別為氫、 $C_1 - C_6$ 烷基、硝基、鹵素、 $C_1 - C_6$ 烷氧基、 $C_1 - C_6$ 鹵烷氧基、 $C_1 - C_6$ 鹵烷基或為 $-S(O)_m-R^{10}$ ；

$R^6$ 、 $R^7$ 及 $R^8$ 各自分別為氫、鹵素、 $C_1 - C_6$ 烷基、 $C_1 - C_6$ 烯基、 $C_1 - C_6$ 炔基、硝基、 $-N(R^{11})(R^{12})$ 、 $C_1 - C_6$ 鹵烷基、 $C_1 - C_6$ 烷氧基、 $C_1 - C_6$ 鹵烷氧基、 $(C_1 - C_6)$ 烷氧基— $(C_1 - C_6)$ 烷基、鹵代 $(C_1 - C_6)$ 烷氧基— $(C_1 - C_6)$ 烷基、氰基、 $-C(X)-R^{10}$ 或為 $-S(O)_m-R^{10}$ ；

$R^9$ 為氫、鹵素、 $C_1 - C_6$ 烷基、 $C_1 - C_6$ 鹵烷基、 $C_1 - C_6$ 烷氧基、 $C_1 - C_6$ 鹵烷氧基、 $(C_1 - C_6)$ 烷氧基— $(C_1 - C_6)$ 烷基、 $-S(O)_m-R^{10}$ 、氰基、羥基、硫氰基、硝基或為 $-N-(R^{11})(R^{12})$ ；

A 為氧或硫；

n 為 0 或 1；

R 為氫、取代以一或更多鹵素之氫碳基或為 $C_1 - C_6$ 烷氧基，或者具有 $-C(X)-R^{10}$ 、 $-C(O)-C(O)-R^{10}$ 、 $-S(O)_2-R^{10}$ 或 $-P(X)(R^{15})(R^{16})$ 等通式；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

## 五、發明說明(12)

其中：X 為 O 或 S ；

$R^{10}$  為氫碳基、取代氫碳基、氫碳氧基、取代氫碳氧基、氫碳基-S-、取代氫碳基-S-、或具  $-N(R^{11})(R^{12})$  通式；

其中  $R^{11}$  及  $R^{12}$  各自分別為氫、氫碳基、取代氫碳基、氫碳氧基、取代氫碳氧基、吡啶基、呋喃基、噻吩基、 $(C_1 - C_6)$  烷氧基羰基  $(C_1 - C_6)$  烷基、羥基羰基  $(C_1 - C_6)$  烷基、或  $N(R^{13})(R^{14})$  而其中  $R^{13}$  及  $R^{14}$  各自分別為氫、 $C_1 - C_6$  烷基或苯基；

或者  $R^{11}$  及  $R^{12}$  併同其等所結合之氮形成一氮丙啶、六氫吡啶、嗎啡啉、硫嗎啡啉、硫嗎啡啉亞磺醯基、硫嗎啡啉磺醯基、環己烷亞胺、六氫吡啶、或吡咯啶環，其中任何一種皆可隨意取代以  $C_1 - C_6$  烷基；

$R^{15}$  及  $R^{16}$  各自分別為  $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  烷硫基或  $C_1 - C_6$  烷氧基；而

m 為 0、1 或 2 ；

但當  $R^1$  為氯或氟， $R^5$  為氫、氯、氟或甲氧基，且  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  及  $R^9$  為氫時，R 不為氫。

較佳之情況為：

$R^1$  為鹵素；

$R^2$ 、 $R^3$  及  $R^4$  氫；

$R^5$  為鹵素、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、 $C_1 - C_6$  烷氧基、 $C_1 - C_6$  鹵烷氧基、硝基或  $-S(O)_m - (C_1 - C_3)$  烷基而其中 m 為 0、1 或 2 ；

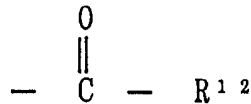
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

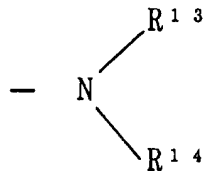
五、發明說明( 13 )

R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>及R<sup>9</sup>各自分別為氫、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、鹵素或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基；而

R 為苯基-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)烷基或具有下列通式：



式中R<sup>12</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>鹵烷基、苯基或具有下列通式：



式中R<sup>13</sup>及R<sup>14</sup>各自分別為C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基、氫、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷氧基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基或者R<sup>13</sup>及R<sup>14</sup>併同其等所結合之氮形成一嗎啡啉、六氫吡啶或吡咯啶環。

更佳之情況為：

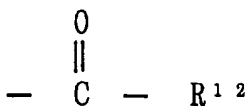
R<sup>1</sup>為氯或溴；

R<sup>5</sup>為三氟甲基、三氟甲氧基、氯、溴、甲氧基、甲基或乙基；

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>7</sup>及R<sup>8</sup>均為氫；

R<sup>6</sup>及R<sup>9</sup>各自分別為氫、氯或甲基；而

R 為苯甲基或具有下列通式：



式中R<sup>12</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基或具有下列通式：

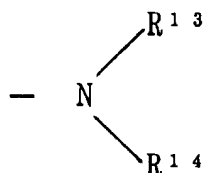
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明( 14 )



式中  $R^{13}$  及  $R^{14}$  各自分別為氫、苯基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、或  $C_1 - C_6$  烷基或者  $R^{13}$  及  $R^{14}$  合併形成一嗎啡啉環。

特佳之化合物包括：

4-氯-3-(1-N,N-二甲基胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基苯甲基)-吡啶；

4-氯-3-(1-N-甲基胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基苯甲基)-吡啶；

4-氯-3-(1-N,N-二乙基胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基苯甲基)-吡啶；

4-氯-3-[1-(4-嗎啡啉)-羰基氧基-2'-三氟甲基苯甲基]-吡啶；

4-氯-3-(1-N-甲基-N-苯基-胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基苯甲基)-吡啶；

4-氯-3-(1-三甲基乙醯氧基-2'-三氟甲基苯甲基)-吡啶；

4-氯-3-[1-(2-N-氯乙基胺甲醯基氧基)-2'-三氟甲基苯甲基)-吡啶；

4-氯-3-(1-N-乙基胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基苯甲基)-吡啶；

4-氯-3-(1-N-異丙基胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基苯甲基)-吡啶；

(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( 15)

4-氯-3-(1-N-丙基胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基苯甲基)-吡啶；

4-溴-3-(1-N,N-二甲基胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基苯甲基)-吡啶；

4-氯-3-(1-N,N-二甲基胺甲醯基氧基-2'-氯苯甲基)-吡啶；

4-氯-3-(1-N,N-二甲基胺甲醯基氧基-2'-甲基苯甲基)-吡啶；

4-氯-3-(1-N-二甲基胺甲醯基氧基-2'-溴苯甲基)-吡啶；

4-氯-3-(1-N,N-二丙基胺甲醯基-2'-三氟甲基苯甲基)-吡啶；

4-氯-3-(1-N-甲基-N-乙基-胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基苯甲基)-吡啶；

4-氯-3-(1-N-丙基胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基苯甲基)-吡啶；以及

4-氯-3-(1-t-丁基胺基氧基-2'-乙基苯甲基)-吡啶。

以上列示之結構式意在包括所繪結構之各種互變異構形式以及各化合物之物理上可分辨修改形式，凡此可例如因分子安排於一晶格內之不同方法，或因部份分子之不能相對於其他部份自由旋轉，或因幾何異構性，或因分子內或分子間氫鍵合，或因其他方式而出現。

具有此等結構式之化合物可以鏡像形式存在。本發明兼包括個別之鏡像物及二者之所有比例混合物。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明( 16 )

如本文中所用，“氫碳基”一詞，不論代表其本身上之一取代基或不不論其為一較大基團（例如在氫碳氧基、氫碳-S-(O)<sub>m</sub>-、等等內）之部份定義，係意在包括具有1至12碳原子之氫碳基團。該氫碳基一詞因此包括例如兼包括直鏈及有支鏈異構物之C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基（例如甲基、乙基、丙基、及己基）；3至12碳原子之環烷基（例如環丙基、環丁基及環己基）；包括例如丙烯基及巴豆基在內之C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>烯基；C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>炔基（例如丙炔基）；苯基；苯烷基；烷苯基；烯苯基；炔苯基；烷苯甲基；烯苯甲基；炔苯甲基；萘基之類。

“取代氫碳基”一詞意在包括如上定義具有一或更多由鹵素（亦即氟、氯、溴、及碘）所組成集團中選出之取代基之氫碳基團；C<sub>1-4</sub>烷氧基；C<sub>1-4</sub>烷基-S-(O)<sub>m</sub>-；氰基；羧基，而且其鹽類、醯胺類與酯類；2至4個碳原子之烷醯基；以及隨意取代以一或更多C<sub>1-4</sub>烷基、C<sub>1-4</sub>烷氧基、C<sub>1-4</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-、硝基、氟、氯、溴、氰基、或CF<sub>3</sub>基團之苯基。在以上定義中，m為0、1或2。

此外，當氫碳基根為一取代芳基根（例如苯基、苯甲基或奈基）時，取代基可包括一或更多列於上段中之取代基，且亦可包括硝基。

以上所用有關羧基取代之“其鹽類、醯胺類及酯類”一語包括例如由鹼金屬（例如鈉、鉀及鋰）、鹼土金屬（例如鈣及鎂）、銨離子、及取代銨離子所形成其中一、二、三或四個氫離子隨意取代以如上所定義C<sub>1-6</sub>氫碳基部份

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

## 五、發明說明(17)

之鹽類。

此外，在前述定義中，“鹵素”一詞包括氟、氯、溴及碘基團。在多鹵化基團中，鹵素可為相同或相異者。

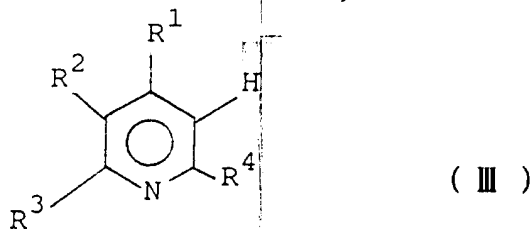
本發明之化合物業經發現為屬有效之除草劑，具有萌生前及萌生後除草劑之用途且有用於對抗一包括闊葉類及草類在內之廣闊植物範圍。

因此，本發明亦有關一種用以控制不合宜植物之方法，包含將一如本文所述具除草有效量之化合物與一適用於除草劑之惰性稀釋劑或載體在此等植物萌生前或萌生後施用於需要控制此等植物之場所。

“除草劑”及“除草性”等詞在本文中係用指對不合宜植物生長之抑制性控制及改性作用。抑制性控制及改性作用包括自然發育之所有離差形式，例如完全殺死、生長阻滯、落葉、乾燥、調節、妨礙生長、發芽、刺激、葉片焦灼及萎縮等。“除草有效量”一詞係用指任何在施用於不合宜植物本身或此等植物生長之區域時可達成此種控制或改性效果之劑量。“植物”一詞意在包括發芽之種子、萌生中之幼苗及長成之植物，兼括根部及地面上部分。

“農業上可被接受之鹽類”一詞可由業界熟練人士輕易決定而包括氫鹵素、乙酸、磺酸、無機及有機酸鹽類。

總體而言，本發明各化合物之製備係藉(A)使一具有通式(III)之取代吡啶：



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

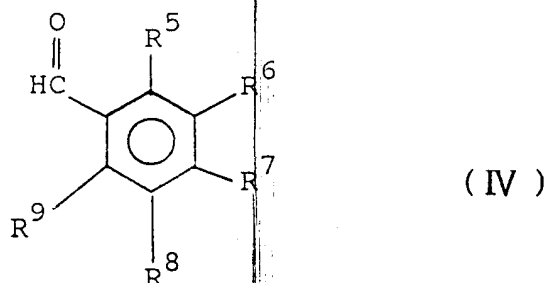
裝

訂

線

## 五、發明說明( 18 )

與一具有通式(IV)之取代苯甲醛：



而式中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  及  $R^9$  均如上就通式(I)所定義者在有一合宜鹼存在時相反應以形成一具有以上通式II之3-吡啶基甲醇(該但書對其不適用)；以及，在適當之場合下，(B)使此一吡啶基甲醇與一適當之衍生劑(例如一烷基或芳基鹵、胺甲鹵、磺鹵或磷鹵)或一適當之異氰酸鹽反應，或先與光氣或光氣等似物再續與一適當之胺反應，以生成所需之化合物。

典型上，約1-2當量之適當鹼(譬如二異丙基胺鎂或n-丁基鎂)於一介於約 $-100^{\circ}\text{C}$ 與約 $-40^{\circ}\text{C}$ 間之溫度添加於一在溶劑(譬如二甲氧基乙醇、四氫呋喃、二乙醚一類)內之具有通式(III)之取代吡啶中。在適宜攪混後，通常添加約1-2當量之取代苯甲醛(IV)。

此反應混合物通常予以攪盪並以1-24小時之時間緩慢溫熱至周圍溫度(約 $25^{\circ}\text{C}$ )。然後通常藉添加一飽和氯化銨水液或鹽酸水液將反應驟冷。此法所生成之吡啶基甲醇可藉習用技術(譬如萃取、過濾一類)回收並藉已知方法例如急驟層析術予以純化。

在第二步驟中，在一合宜溶劑(譬如四氫呋喃、氯甲烷一類)內之吡啶基甲醇(II)通常約於 $0^{\circ}\text{C}$ 添加於一介於

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明( 19 )

約 1-4 當量間之適當鹼 ( 譬如氫化鈉或三甲基胺 ) 中。然後添加介於約 1-3 當量之衍生劑 ( 譬如一胺甲醯鹵、烷基鹵、磺醯鹵或磷醯鹵、烷基或芳基醯鹵 ) 並攪盪混合物至完成。該反應可藉添加冰水予以驟冷，並藉譬如萃取、過濾一類習用技術回收。此法所回收之生成物於是藉習知技術譬如急驟層析術一類予以純化。

另法，在第二步驟中，在合宜溶劑 ( 譬如四氫呋喃、氯甲烷一類 ) 內之吡啶基甲醇可添加於一介於約 2-3 當量之適當異氰酸鹽中。一或更多介於約 1-10 摩爾百分率之適當觸媒例如三乙基胺或二月桂酸二丁錫可加入，並於約 0℃ 至 100℃ 之間攪盪該反應混合物達一適當之時間 ( 譬如 2 至 24 小時 )。生成物可藉習用技術 ( 譬如萃取、過濾一類 ) 回收並藉習用技術譬如急驟層析術一類予以純化。

具有通式 ( III ) 之各經取代吡啶起始物質皆可由市面購得或可由業界普通技術人士採用各種譬如述於 "Heterocyclic Compounds, Pyridine and its Derivatives", R. A. Abramovitch, Vol. 14, Wiley, 1973 中之方法予以製備。通式 ( IV ) 之醛起始物質可由市面購得或可採用各種譬如述於 "Survey of Organic Synthesis", C. A. Buehler et al, Vols. 1 and 2, Wiley-Interscience, 1970。

本發明之各種組合物包含一具有以上通式 ( Ia ) 之化合物以及一合宜載體，該載體乃業界普通技術人士所詳知。

本發明之化合物可用作除草劑，且可用業界熟練人士已知之各種不同方式以不同濃度施用。該等化合物有用於

(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 )

藉萌生前或萌生後施用於需要控制之場所控制不合宜植物之生長。實作中，該等化合物係當作含有為工業界已知或用來便利分散之佐藥及載體之配方予以施用。對任何化合物而言，配方及施用方式之選擇會影響其活性，因此應作適當之選擇。因此，本發明之化合物可配製成顆粒、可濕性粉劑、可乳化濃劑、粉末或粉劑、可流動劑、溶液、懸浮液或乳液、或如微膠囊等控制釋出之形式。這些配方所含活性成分之重量比可能少至約 0.5 % 或者大到 95 % 或更高。任何化合物之最適量係視所欲控制之種子或植物之性質而定。施用率通常是由每英畝約 0.01 至約 10 磅，較佳為由每英畝約 0.02 至約 4 磅。

可濕性粉劑係以可迅速分散於水或其他液態載體之微細顆粒形式存在。顆粒含有留存在一固態基質之活性成分。典型之基質包括漂白土、高嶺土、矽石及其他容易潤濕之有機或無機固體。可濕性粉劑通常含有大約 5 % 至 95 % 之活性成分加上少量之潤濕、分散、或乳化劑。

可乳化濃劑為可分散於水或其他液體之均勻液態組成，可能只含有活性化合物及液態或固態乳化劑，亦可能含有如二甲苯、重芳香石腦油、異樹根皮酮及其他非揮發性有機溶劑等液態傳遞體。實際使用時，這些濃劑係分散於水或其他液體，且通常是以噴劑施用於所欲處理之區域。活性成分之量約為 0.5 % 至約 95 % 濃度。

顆粒配方包括滲出物及較粗之顆粒，通常不需稀釋即施用於欲抑制植物生長之區域。顆粒配方之典型載體包括

(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 )

砂土、漂白土、美國白土、漿土、微晶高嶺石、蛭石、珠岩及其他可吸收或可塗佈以活性化合物之有機或無機物質。顆粒配方通常含有大約5%至25%之活性成分，可包括如重芳香石腦油、煤油及其他石油分餾物、或植物油類等界面活性劑；及（或）如糊精、膠或合成樹脂等之接著劑。粉劑為活性成分與譬如滑石、黏土、麵粉及其他作用如分散劑及載體之有機或無機固體等之微細固體所形成之自由流動攪合物。

微膠囊一般而言為包含在惰性多孔囊內之活性物質液滴或顆粒，可使所包容之物質以一定速率釋出周圍環境中。包囊之液滴直徑通常為1至50微米。所包封之液體通常佔膠囊重之大約50至95%，除了活性化合物外尚可包括溶劑。囊封顆粒通常為以多孔膜封住顆粒孔隙開口之多孔性顆粒，使活性成分以液體形式留存在顆粒孔隙之內。顆粒直徑通常為1毫米至1公分，較佳為1至2毫米。顆粒是以擠製、黏聚或製粒等方式形成，或者為天然形成。這些材料之例證如蛭石、燒結黏土、高嶺土、美國白土、木屑及粒狀碳。囊或膜之材料包括天然或合成之橡膠、纖維質材料、苯乙烯-丁二烯共聚合體、聚丙烯晴類、聚酯類、聚醯胺類、聚尿素類、聚胺基甲酸酯類及澱粉黃酸鹽類。

其他可作為除草劑施用之有效配方包括活性成分在一可於其內完全溶解成所需濃度之溶劑譬如丙酮、烷化萘類、二甲苯及其他有機溶劑中所成之簡單溶液。亦可使用加壓噴霧器，其中使活性成分因低沸點分散溶劑載體譬如氟

(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 )

氣烷冷劑之蒸發而分散成微細形式。

此等配方中有許多包括各種潤濕、分散、或乳化劑。實例為烷基及烷芳基磺酸酯類及硫酸酯類以及其鹽類；多羥醇類；聚乙氧化醇類；酯類及脂肪胺類。此等試劑在使用時通常佔該配方重量之0.1%至15%。

以上每一配方均可製備成一含有該除草劑併同其他配方成份（稀釋劑、乳化劑、表面活性劑等）之包裝。該等配方亦可藉一槽混方法製備，其中各成份係分別獲得而在生長物場址結合。

本發明之化合物在與其他除草劑及（或）摧葉劑、乾殺劑、生長抑制劑一類結合時亦有用。此等其他種物質可佔配方中活性成分之大約5%至95%。此等組合物經常提供較高位準之雜草控制功效，而時常提供個別除草劑之單獨配方所無法達到之結果。

可與本發明化合物合併使用之其他除草劑、摧葉劑、乾殺劑及植物生長抑制劑之實例為：

有用互補性除草劑之實例包括：

A. 苯駢-2, 1,3-硫磷二氮三烯陸園-4-酮-2,2-二氧化物類，譬如 bentazone；

B. 激素除草劑類，特別是苯氧基烷基酸類，如 MCPA、MCPA-硫乙基、dichlorprop、2,4,5-T、MCPB、2,4-D、2,4-DB、mecoprop、trichlopyr、氟氧基-pyr、clopyralid、及其衍生物（如鹽類、酯類及醯胺類）；

C. 1,3-二甲基吡唑衍生物，如 pyrazoxyfen、比唑

（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 )

鹽類、及 benzofenap ;

D. 二硝基酚類及其衍生物，(如乙酸鹽類，例如 DNOC、dinoterb、dinoseb、及其酯類，dinoseb 乙酸鹽；

E. 二硝基苯胺除草劑類，如 dinitramine、trifluralin、ethalfluralin、pendimethalin；及 oryzalin；

F. 芳香基尿素除草劑類，如 diuron、flumeturon、metoxuron、neburon、isoproturon、chlorotoluron、chloroxuron、linuron、monolinuron、chlorobromuron、daimuron 及 methabenthiazuron；

G. 苯基胺甲醯基羥基苯基胺基甲酸酯類，如 phenmedia- pham 及 desmediapham；

H. 2-苯基二氮三烯陸園-3-酮類，chloridazon 及 norflurazon；

I. 2,4-嘧啶二酮除草劑類，如 lenacil、bromacil 及 terbacil；

J. 三氮吡除草劑類，如 atrazin、simazine、aziprotryne、cyanazine、prometryn、dimethametryn、simetryne、及 terbutryn；

K. 偶磷硫鹽除草劑類，如 piperophos、bensulide 及 butamifos；

L. 硫胺基甲酸酯除草劑類，如 cycloate、vernolate、molinate、thiobencarb、butylate、EPTC、triallate、diallate、ethyl esprocarb、tiocarbazil、pyridate

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(24)

及 dimepiperate ;

M. 1,2,4-三氮吡-5-酮除草劑類，如 metamitron 及 metribuzin ;

N. 苯甲酸除草劑類，如 2,3,6-TBA、dicamba、及 chloramben ;

O. 醯基苯胺除草劑類，如 pretilachlor、butachlor、alachlor、propachlor、propanil、metazachlor、metolachlor、acetochlor 及 dimethachlor ;

P. 二鹵化苯甲腈除草劑類，如 dichlobenil、bromoxynil 及 ioxynil ;

Q. 鹵化烷基除草劑類，如 dalapon、TCA 及其鹽類 ;

R. 二苯基乙醚除草劑類，如 lactofen、fluroglycofen 或其鹽類或酯類，nitrofen、bifenox、acifluorfen 及其鹽類與酯類，oxyfluorfen 及 fomesafen ; chlornitrofen 及 chlomethoxyfen ;

S. 苯氧基苯氧基丙酸鹽除草劑類，如 diclofop 及其酯類，如甲酯，fluazifop 及其酯類，haloxyfop 及其酯類，quizalofop 及其酯類，以及 fenoxaprop 及其酯類，如乙醚 ;

T. 環己烷二酮除草劑類，如 alloxydim 及其鹽類，sethoxydim、cycloxydim、tralkoxydim 及 clethodim ;

U. 磺醯基尿素除草劑類，如 chlorosulfuron、sulfometuron、metsulfuron 及其酯類；benzsulfuron 及其酯類，如其甲酯類，DPX-M6313、chlorimuron 及酯類，

(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 )

如其乙酯類， primisulfuron及酯類， 如其甲酯類，  
DPX-LS300及 pyrazosulfuron；

V.咪唑啉二酮除草劑類， 如 imazaquin、  
imazamethabenz、 imazapyr及其異丙基銨鹽類，  
imazethapyr；

W.芳香基醯胺除草劑類， 如 flamprop及其酯類，  
benzoylprop - ethyl、diflufenican；

X.胺基酸除草劑類，如 glyphosate及 glufosinate及  
其鹽類與酯類， sulphosate及 bilanafos；

Y.有機砷除草劑類，如 MSMA；

Z.除草性醯胺衍生物，如 napropamide、propyzamide  
、 carbetamide、 tebutam、 bromobutide、 isoxaben、  
naproanilide、 diphenamid及 naptalam；

AA.其他除草劑類，如 ethofumesate、cinmethylin、  
difenzoquat及其鹽類， 如甲基硫酸鹽， clomazone、  
oxadiazon、 bromofenoxim、barban、tridiphane、（比  
例 3: 1） flurochloridone、quinchlorac及 mefanacet；

BB.有效接觸除草劑類之例證， 包括 bipyridylium除  
草劑類，如其中有效組成爲巴拉刈者，及其中有效組成爲  
diquat者。

\* 此等化合物較佳爲與一解救劑譬如 2, 2-二氯-N,N-二-2-  
丙烯基乙醯胺(dichlormid)組合使用。

這些配方可以傳統方法施用於欲控制之區域。舉例來  
說，粉劑及液態組成可用動力噴粉器、加強及手動噴霧器

(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 )

以及噴霧噴粉器來施用。這些配方亦可以粉劑、噴霧劑或繩式吸附等方式，自飛機上施用。爲了改良或控制發芽種子或羽化幼苗之生長，可用噴霧或噴灑方式使粉劑及液態配方分佈於土壤表面下至少二分之一英吋或者只施用於土壤表面。亦可將配方加入灌溉水中施用。這樣可使配方隨著灌溉水滲入土壤中。施用於土壤表面之粉劑組成、顆粒組成或液態配方，可以用如盤挖、耙土或混合操作等傳統方法使其分佈至土壤表面之下。

以下所述爲典型配方之實例：

- 5 % 粉劑：            5 份活性化合物  
                         95 份滑石
- 2 % 粉劑：            2 份活性化合物  
                         1 份高度分散之矽酸  
                         97 份滑石

這些粉劑之製法爲將各組成混合，然後將混合物研磨成所需之顆粒大小。

- 5 % 顆粒：            5 份活性化合物  
                         0.25 份環氧氯丙烷  
                         0.25 份鯨蠟聚乙二醇醚  
                         3.5 份聚乙二醇  
                         91 份高嶺土（粒徑 0.3—0.8 毫米）

顆粒之製法爲將活性化合物與環氧氯丙烷混合，將混合物溶於 6 份之丙酮中。然後加入聚乙二醇及鯨蠟聚乙二醇醚。將所生成之溶液噴灑於高嶺土上，置於真空中將

(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)

丙酮蒸發。

可濕性粉劑：

- |        |                                  |
|--------|----------------------------------|
| 70 % : | 70 份 活性化合物                       |
|        | 5 份 二丁基萘磺酸鈉                      |
|        | 3 份 萘磺酸 / 酚磺酸 / 甲醛凝液 (3 : 2 : 1) |
|        | 10 份 高嶺土                         |
|        | 12 份 發泡性白堊                       |
| 40 % : | 40 份 活性化合物                       |
|        | 5 份 木質磺酸鈉                        |
|        | 1 份 二丁基萘磺酸鈉                      |
|        | 54 份 矽酸                          |
| 25 % : | 25 份 活性化合物                       |
|        | 4.5 份 木質磺酸鈉                      |
|        | 1.9 份 發泡性白堊 / 乙氧基纖維素 (1 : 1)     |
|        | 1.5 份 二丁基萘磺酸鈉                    |
|        | 19.5 份 矽酸                        |
|        | 19.5 份 發泡性白堊                     |
|        | 28.1 份 高嶺土                       |
| 25 % : | 25 份 活性化合物                       |
|        | 2.5 份 聚辛基苯氧基 - 聚乙烯乙醇             |
|        | 1.7 份 發泡性白堊 / 乙氧基纖維素 (1 : 1)     |
|        | 8.3 份 矽酸鋁鈉                       |
|        | 16.5 份 矽藻土                       |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明( 28 )

- 46 份高嶺土
- 10 % : 10 份活性化合物
- 3 份飽和脂肪醇硫酸鹽類之鈉鹽混合物
- 5 份茶磺酸 / 甲醛凝液
- 82 份高嶺土

這些可濕性粉劑之製備法為將活性化合物與附加劑置於混合機中混合，並將所形成之混合物置於研磨機或滾筒中研磨。

可乳化濃劑：

- 25 % : 25 份活性成分
- 2.5 份環氧化植物油
- 10 份烷苯磺酸鹽 / 脂肪醇聚乙二醇醚之混合物
- 5 份二甲基甲醯胺
- 57.5 份二甲苯

構成一除草有效量之本發明組合物量視待控制種子或植物之本質而定。各活性成份之施用率約在每英畝 0.01 至 25 磅間變化，較佳為約每英畝 0.10 至 10 磅，而實際用量視總成本及所需結果而定。業界熟練人士將迅即明白，凡表現較低除草活性之組合物在相同控制成度上將較更具活性之化合物需要較高之劑量。

實 例

以下實例意在進一步例示本發明，而無意以任何方法限制本發明之範疇。

裝  
訂  
線

## 五、發明說明( 29 )

## 實例 1

4-氯-3-(1-羥基-2',6'-二氯-苯甲基)-吡啶之製備

(第11號化合物)

將8克之4-氯吡啶置入在一配備有磁攪拌器之500毫升裝燒杯內之100毫升二乙醚中。於0℃將6.5克之氫氧化鈉添加於100毫升之水中並攪拌混合物15分鐘。將二乙醚層分離並用水沖洗，在硫酸鎂上乾燥並過濾再予汽提。將5.7克之所生成4-氯吡啶置入三頸燒瓶內之50毫升二甲氧基乙醇內並冷卻至-70℃。於30分鐘時間內添加40毫升之鋰二異丙基醯胺("LDA")，同時將溫度保持-60℃以生成橘色之懸浮液。添加9.2克之2,6-二氯苯甲醛並維持溫度於-45至-60℃之間。在一乾冰浴內攪拌該反應混合物二小時，然後置於室溫過夜。

將35毫升之飽和氯化銨水液添加於該反應混合物，並於室溫攪拌該混合物15分鐘。藉過濾去除固質並先後兩次用水及氯甲烷沖洗以收穫13.2克之4-氯-3-(1-羥基-2',6'-二氯-2-苯甲基)吡啶。

## 實例 2

4-氯-3-(1-N,N-二甲基胺甲醯基氧基-2',6'-二氯-苯甲基)-吡啶之製備 (第77號化合物)

在一配備有磁攪拌器之200毫升裝圓底燒瓶內將1克之4-氯-3-(1-羥基-2',6'-二氯-苯甲基)-吡啶溶於20毫升之四氫呋喃中。於一冰浴內冷卻該溶液，並添加0.3克之氫化鈉。溫度維持0℃並添加0.55毫升之N,N-二甲基胺

(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)

甲醯基氯化物。於室溫攪拌該混合物過夜，傾入冰內並用氯甲烷萃取二次。將結合氯甲烷層分離並用水沖洗，用硫酸鎂乾燥，過濾再汽提以收穫黃色之油狀4-氯-3-(1-N,N-二甲基胺甲醯基氧基-2',6'-二氯-苯甲基)-吡啶。

## 實例 3

2-氯-3-(1-羥基-2'-三氟甲基-苯甲基)-4-三氟甲基-吡啶之製備 (第13號化合物)

將5克之2-氯-4-三氟甲基吡啶及5毫升之二甲氧基乙醇添加至一配備有一滴漏斗、一溫度計以及一附帶一乾燥管之冷凝器之三頸燒瓶。將混合物冷卻至-70℃並緩慢添加22毫升之LDA而溫度保持低於-55℃。於-70℃攪拌反應混合物1.5小時，並添加3.5毫升之2-三氟甲基苯甲醛。在一乾冰浴內攪拌該反應混合物，然後於室溫過夜。添加15毫升之飽和氯化銨水液，汽提溶劑並用水沖洗殘餘油，再用氯甲烷萃取(三次)。用鹽水沖洗結合氯甲烷層，乾燥並汽提以收穫一棕色之油。該棕色之油置於一矽凝膠柱上並用己烷與二乙醚之1:1混合物淘洗以收穫6.2克之2-氯-3-(1-羥基-2'-三氟甲基-苯甲基)-4-三氟甲基-吡啶。

## 實例 4

2-氯-3-[1-(4-嗎啡啉)-羰基氧基-2'-三氟甲基-苯甲基]-4-三氟甲基吡啶之製備 (第87號化合物)

將溶於20毫升四氫呋喃中之1.0克2-氯-3-(1-羥基-2'-三氟甲基-苯甲基)-4-三氟甲基吡啶添加於一配備有磁

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明(31)

攪拌器反應器之200毫升裝圓底燒瓶。於冰中冷卻該溶液，並添加0.3克之氫化鈉。於0℃添加0.5毫升之嗎啡胺甲醯基氧，並於室溫攪拌混合物過夜。形成一橘色之沉澱物並將混合物傾入冰水中，並用氯甲烷萃取二次。結合氯甲烷層用水沖洗，乾燥（在硫酸鎂上），過濾並汽提以收穫1.5克之2-氯-3-[1-(4-嗎啡)-羰基氧基-2'-三氟甲基-苯甲基]-4-三氟甲基吡啶。

## 實例 5

4-氯-3-(1-N,N-二丙烯基胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基-苯甲基)-吡啶之製備 (第48號化合物)

以5分鐘時間將溶於25毫升四氫呋喃中之2克2-氯-3-(1-羥基-2'-三氟甲基-苯甲基)-吡啶（依實例1程序採用2-三氟甲基苯甲醛作為起始物質所製備者）添加於冷卻於一冰浴內之4克光氣（20%，在甲苯中者）中。添加1克之三乙基胺並於室溫攪拌混合物過夜。添加7毫升之二丙烯基胺以形成一黃色之懸浮液。此懸浮液予汽提並於二乙醚中鬆釋。過濾固質並用二乙醚清洗。汽提濾液，置於一矽凝膠柱上，並用10:1之己烷：乙酸乙酯混合物淘洗以收穫2.25克之4-氯-3-(1-N,N-二丙烯基胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基-苯甲基)-吡啶。

## 實例 6

4-氯-3-[1-(2-N-氯乙基胺甲醯基氧基)-2'-三氟甲基-苯甲基]-吡啶之製備 (第41號化合物)

將2當量之2-氯乙基異氰酸鹽連同3滴之三乙基胺及

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

## 五、發明說明(32)

2 滴之二丁基錫二月桂酸鹽添加至溶於 10 毫升之四氫呋喃內之 1.2 克 4-氯-3-(1-羥基-2'-三氟甲基-苯甲基)-吡啶中。於室溫攪拌混合物過夜，並在 20 毫升之氯甲烷內添加 3 滴之三乙基胺及 2 滴之二丁基錫二月桂酸鹽以及額外之 2 當量 2-氯乙基異氰酸鹽。再將混合物攪拌過夜；然後傾入冰水中；以氯甲烷萃取二次，乾燥並汽提。將殘渣置於一矽凝膠柱上並用 4:1 之己烷：二乙醚混合物淘洗以收穫 0.9 克之 4-氯-3-[1-(2-N-氯乙基胺甲醯基氧基)-2'-三氟甲基苯甲基]-吡啶。

實例 7

4-氯-3-(1-N,N-二甲基胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基-苯甲基)-吡啶之製備 (第 27 號化合物)

將 1.5 克之 4-氯-3-(1-羥基-2'-三氟甲基-苯甲基)-吡啶溶於 25 毫升之四氫呋喃中並冷卻至 0 °C。添加 0.5 克之氫化鈉並攪拌混合物 15 分鐘。添加 0.75 毫升之 N,N-二甲基胺甲醯基氯並於室溫攪拌混合物過夜。然後將混合物傾入冰水中並以氯甲烷萃取。用水沖洗氯甲烷層，於硫酸鎂上乾燥，過濾並汽提以生成一橘色之固質。用己烷清洗該固質以收穫 1.53 克之 4-氯-3-(1-N,N-二甲基胺甲醯基氧基-2'-三氟甲基-苯甲基)-吡啶。

實例 8

4-氯-3-(1-三甲基乙醯基氧基-2'-三氟甲基-苯甲基)-吡啶之製備 (第 39 號化合物)

將 2.0 克之 4-氯-3-(1-羥基-2'-三氟甲基-苯甲基)-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明( 33)

吡啶溶於40毫升之四氫呋喃中並冷卻至0℃。添加0.7克之氫化鈉並攪拌混合物15分鐘。添加1.30毫升之三甲基乙醯基氯並於室溫攪拌反應物過夜。然後將反應混合物傾入冰水中並以氯甲烷萃取二次。用水沖洗結合氯甲烷層；於硫酸鎂上乾燥；過濾並汽提以收穫一黃色之油狀4-氯-3-(1-三甲基乙醯基氧基-2'-三氟甲基-苯甲基)-吡啶。

## 實例 9

4-氯-3-(1-苯甲基氧基-2'-三氟甲基-苯甲基)-吡啶之製備  
(第57號化合物)

用2毫升之四氫呋喃清洗0.9克之氫化鈉(80%，於白油中者)四次。以2分鐘時間添加2.9克之2-氯-3-(1-羥基-2'-三氟甲基-苯甲基)-吡啶並將混合物迴流5分鐘且於周圍溫度攪拌1小時。添加苯甲基溴化物(1.7毫升)並攪拌混合物1小時，然後迴流0.5小時。添加0.1克之碘化鈉並攪拌混合物0.5小時。然後汽提混合物並溶於一水/氯甲烷混合物中。由鹽水沖洗有機層並於硫酸鎂上乾燥。將生成物過濾，汽提，置於一矽凝膠柱上並用1:2己烷:乙酸乙酯攪合物淘洗以收穫3.2克之4-氯-3-(1-苯甲基氧基-2'-三氟甲基-苯甲基)-吡啶。

## 實例 10

採用一類似於上述之程序製備以下表 I 中所列各化合物：

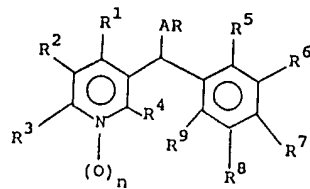
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

五、發明說明( 34)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表 I



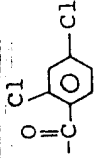
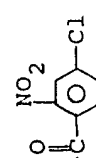
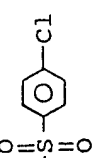
(I)

A 爲-O- 之各化合物

| 化合物編號 | n | R <sup>1</sup>                 | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>    | R <sup>6</sup>                    | R <sup>7</sup>    | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup> | R |
|-------|---|--------------------------------|----------------|----------------|----------------|-------------------|-----------------------------------|-------------------|----------------|----------------|---|
| 1     | 0 | Cl                             | H              | H              | H              | -CH <sub>3</sub>  | H                                 | Cl                | H              | H              | H |
| 2     | 0 | Cl                             | H              | H              | H              | -CH <sub>3</sub>  | H                                 | H                 | H              | H              | H |
| 3     | 0 | Cl                             | H              | H              | H              | -OCH <sub>3</sub> | H                                 | H                 | H              | H              | H |
| 4     | 0 | Cl                             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub>  | H                                 | -OCH <sub>3</sub> | H              | H              | H |
| 5     | 0 | Cl                             | H              | H              | H              | -NO <sub>2</sub>  | H                                 | H                 | H              | H              | H |
| 6     | 0 | Cl                             | H              | H              | H              | Cl                | -OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | -CF <sub>3</sub>  | H              | H              | H |
| 7     | 0 | Br                             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub>  | H                                 | H                 | H              | H              | H |
| 8     | 0 | -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub>  | H                                 | H                 | H              | H              | H |
| 9     | 0 | Cl                             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub>  | H                                 | H                 | H              | H              | H |
| 10    | 0 | Cl                             | H              | H              | H              | Cl                | H                                 | H                 | H              | H              | H |
| 11    | 0 | Cl                             | H              | H              | H              | Br                | H                                 | H                 | H              | H              | H |
| 12    | 1 | Cl                             | H              | H              | H              | Cl                | H                                 | H                 | H              | Cl             | H |
|       |   |                                |                |                |                | -CF <sub>3</sub>  | H                                 | H                 | H              | H              | H |

裝 訂 線

五、發明說明( 35 )

| 化合物編號 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>    | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                  | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup> | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup>   | R   |
|-------|----------------|-------------------|----------------|----------------|---------------------------------|----------------|----------------|----------------|------------------|---|
| 13    | O              | -CF <sub>3</sub>  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                 | H              | H              | H              | H                | H   |
| 14    | O              | Cl                | H              | H              | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | H                | H   |
| 15    | O              | Cl                | H              | H              | -CH <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | -CH <sub>3</sub> | H   |
| 16    | O              | Cl                | H              | H              | -OCH <sub>3</sub>               | H              | H              | H              | H                | H   |
| 17    | O              | Cl                | H              | H              | -OCF <sub>3</sub>               | H              | H              | H              | H                | H   |
| 18    | O              | Cl                | H              | H              | F                               | H              | H              | H              | H                | H   |
| 19    | O              | -SCH <sub>3</sub> | H              | H              | -CF <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | H                | H   |
| 20    | O              | Cl                | H              | H              | -SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | H                | H   |
| 21    | O              | Cl                | H              | H              | -CF <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{CH}_3$   |
| 22    | O              | Cl                | H              | H              | -CF <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{CHCl}_2$   |
| 23    | O              | Cl                | H              | H              | -CF <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{CH}_2\text{Cl}$  |
| 24    | O              | Cl                | H              | H              | -CF <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | H                |   |
| 25    | O              | Cl                | H              | H              | -CF <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | H                |  |
| 26    | O              | Cl                | H              | H              | -CF <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | H                |  |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明(36)

化合物編號

| 化合物編號 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>   | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup> | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup> | R |
|-------|----------------|----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| 27    | O              | Cl             | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 28    | O              | Cl             | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 29    | O              | Cl             | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 30    | O              | Cl             | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 31    | O              | Cl             | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 32    | O              | Cl             | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 33    | O              | Cl             | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 34    | O              | Cl             | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 35    | O              | Cl             | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線


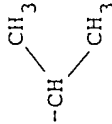
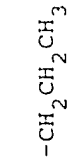

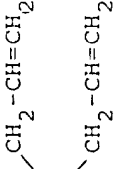


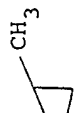

五、發明說明( 37 )

| 化合物編號 | n | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>   | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup> | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup> | R |
|-------|---|----------------|----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| 36    | 0 | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 37    | 0 | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 38    | 0 | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 39    | 0 | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 40    | 0 | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 41    | 0 | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 42    | 0 | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 43    | 0 | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

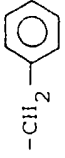
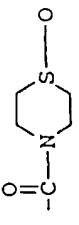
五、發明說明( 38 )

| 化合物編號       | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>   | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup> | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup> | R   |
|-------------|----------------|----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| 44          | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |    |
| 45          | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |    |
| 46          | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |    |
| 47          | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |    |
| 48          | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |    |
| 49          | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |    |
| 化合物49之雙立體構物 |                |                |                |                |                  |                |                |                |                |   |
| 50          | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |  |
| 51          | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |  |
| 52          | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |  |
| 53          | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |   |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

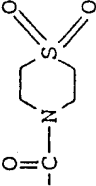
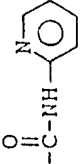
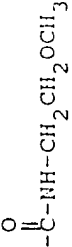
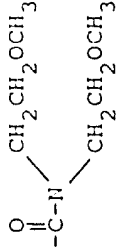
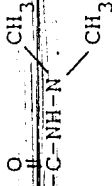
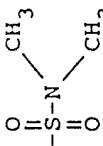
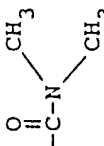
五、發明說明( 39)

| 化合物編號 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>   | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup> | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup> | R   |
|-------|----------------|----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| 54    | O              | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$   |
| 55    | O              | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{C}-\text{OCH}_3 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$          |
| 56    | O              | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{C}-\text{OH} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$             |
| 57    | O              | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |    |
| 58    | O              | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{N} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{CH}_3 \quad \text{OCH}_3 \end{array}$         |
| 59    | O              | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{H} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$   |
| 60    | O              | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{N} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{CH}_3 \quad \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$ |
| 61    | O              | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{C}(\text{CH}_3)_3 \end{array}$   |
| 62    | O              | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |    |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明( 40)

| 化合物編號 | n | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>   | R <sup>6</sup>                  | R <sup>7</sup> | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup> | R   |
|-------|---|----------------|----------------|----------------|----------------|------------------|---------------------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| 63    | O | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H                               | H              | H              | H              |    |
| 64    | O | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H                               | H              | H              | H              |    |
| 65    | O | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H                               | H              | H              | H              |    |
| 66    | O | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H                               | H              | H              | H              |    |
| 67    | O | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H                               | H              | H              | H              |   |
| 68    | O | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H                               | H              | H              | H              |  |
| 69    | O | Cl             | H              | H              | H              | Cl               | -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Br             | H              | H              |  |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明( 41)

| 化合物編號 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>   | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup>  | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup> | R |
|-------|----------------|----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|---|
| 70    | Cl             | H              | H              | H              | -CH <sub>3</sub> | H              | H               | H              | H              |   |
| 71    | Br             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H               | H              | H              |   |
| 72    | Cl             | H              | H              | H              | -NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | H              | H              |   |
| 73    | Cl             | H              | H              | H              | Cl               | H              | H               | H              | H              |   |
| 74    | Cl             | H              | H              | H              | -CH <sub>3</sub> | H              | Cl              | H              | H              |   |
| 75    | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H               | H              | H              |   |
| 76    | Cl             | H              | H              | H              | Br               | H              | H               | H              | H              |   |
| 77    | Cl             | H              | H              | H              | Cl               | H              | H               | H              | Cl             |   |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明(42)

| 化合物編號 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                  | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup> | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup> | R |
|-------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| 78    | Cl             | H              | H              | H              | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | H              |   |
| 70    | Cl             | H              | H              | H              | -NO <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | H              |   |
| 80    | Cl             | H              | H              | H              | -OCH <sub>3</sub>               | H              | H              | H              | H              |   |
| 81    | Cl             | H              | H              | H              | -OCF <sub>3</sub>               | H              | H              | H              | H              |   |
| 82    | Cl             | H              | H              | H              | F                               | H              | H              | H              | H              |   |
| 83    | Cl             | H              | H              | H              | -SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 84    | Cl             | H              | H              | H              | -CH <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | H              |   |
| 85    | Cl             | H              | H              | H              | Br                              | H              | H              | H              | H              |   |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明(43)

| 化合物編號 | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                  | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup> | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup> | R |
|-------|------------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| 86    | Cl               | H              | H              | H              | Cl                              | H              | H              | H              | Cl             |   |
| 87    | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | Cl             | -CF <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | H              |   |
| 88    | Cl               | H              | H              | H              | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | H              |   |
| 89    | Cl               | H              | H              | H              | -OCH <sub>3</sub>               | H              | H              | H              | H              |   |
| 90    | Cl               | H              | H              | H              | -SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | H              |   |
| 91    | Cl               | H              | H              | H              | -CH <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | H              |   |
| 92    | Cl               | H              | H              | H              | Br                              | H              | H              | H              | H              |   |
| 93    | Cl               | H              | H              | H              | Cl                              | H              | H              | H              | Cl             |   |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明(44)

| 化合物編號 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>   | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                  | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup> | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup>   | R   |
|-------|----------------|------------------|----------------|----------------|---------------------------------|----------------|----------------|----------------|------------------|---|
| 94    | O              | -CF <sub>3</sub> | H              | Cl             | -CF <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_3$                     |
| 95    | O              | Cl               | H              | H              | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_3$                     |
| 96    | O              | Cl               | H              | H              | -OCH <sub>3</sub>               | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_3$                     |
| 97    | O              | Cl               | H              | H              | -CH <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | -CH <sub>3</sub> | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_3$                     |
| 98    | O              | Cl               | H              | H              | -OCH <sub>3</sub>               | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{C}_2\text{H}_5$            |
| 99    | O              | Cl               | H              | H              | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{C}_2\text{H}_5$            |
| 100   | O              | Cl               | H              | H              | -SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{C}_2\text{H}_5$            |
| 101   | O              | Cl               | H              | H              | -OCH <sub>3</sub>               | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$                   |
| 102   | O              | Cl               | H              | H              | -NO <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$                   |
| 103   | O              | Cl               | H              | H              | -OCF <sub>3</sub>               | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$                   |
| 104   | O              | Cl               | H              | H              | -OCH <sub>3</sub>               | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ |
| 105   | O              | Cl               | H              | H              | -NO <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | H                | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

A6  
B6

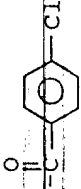
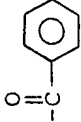
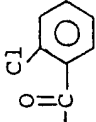
五、發明說明(45)

| 化合物編號 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>    | R <sup>6</sup>                  | R <sup>7</sup>   | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup> | R   |
|-------|----------------|----------------|----------------|----------------|-------------------|---------------------------------|------------------|----------------|----------------|---|
| 106   | Cl             | H              | H              | H              | -OCF <sub>3</sub> | H                               | H                | H              | H              | $\text{-C(=O)-NH-CH}_2\text{-CH}_2\text{Cl}$              |
| 107   | Cl             | H              | H              | H              | F                 | H                               | H                | H              | H              | $\text{-C(=O)-NH-CH}_2\text{-CH}_2\text{Cl}$              |
| 108   | Cl             | H              | H              | H              | -CH <sub>3</sub>  | H                               | H                | H              | H              | $\text{-C(=O)-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$                      |
| 109   | Cl             | H              | H              | H              | Br                | H                               | H                | H              | H              | $\text{-C(=O)-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$                      |
| 110   | Cl             | H              | H              | H              | Cl                | -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Br               | H              | H              | $\text{-C(=O)-C}_6\text{H}_4\text{Cl}$                    |
| 111   | Cl             | H              | H              | H              | -NO <sub>2</sub>  | H                               | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | $\text{-C(=O)-C}_6\text{H}_3\text{Cl}_2$                  |
| 112   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub>  | H                               | H                | H              | H              | $\text{-C(=O)-NH-CH}_2\text{-CH-CH}_2$                    |
| 113   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub>  | H                               | H                | H              | H              | -CH <sub>3</sub>  |
| 114   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub>  | H                               | H                | H              | H              | $\text{-C(=O)-NH-CH}_2\text{-C}\equiv\text{CH}$           |
| 115   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub>  | H                               | H                | H              | H              | $\text{-C(=O)-NH-CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$ |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明(46)

| 化合物編號 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>   | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup> | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup> | R   |
|-------|----------------|----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| 116   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{C}\equiv\text{CH}$       |
| 117   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$     |
| 118   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$   |
| 119   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{Cl})=\text{CH}_2$                                      |
| 120   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{SCH}_3$        |
| 121   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$         |
| 122   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$         |
| 123   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |    |
| 124   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |  |
| 125   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |  |
| 126   | Cl             | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{Cl})=\text{CH}$  |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明(47)

| 化合物編號 | R <sup>1</sup>                  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                   | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup> | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup> | R   |
|-------|---------------------------------|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| 127   | Cl                              | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub>                 | H              | H              | H              | H              | -CH <sub>2</sub> -C(Cl)(Br)-CH <sub>2</sub>                       |
| 128   | Cl                              | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub>                 | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$ |
| 129   | SCH <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub>                 | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{N}(\text{CH}_3)_2$                       |
| 130   | $\text{O}=\text{S}-\text{CH}_3$ | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub>                 | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{N}(\text{CH}_3)_2$                       |
| 131   | $\text{O}=\text{S}-\text{CH}_3$ | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub>                 | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{N}(\text{CH}_3)_2$                       |
| 132   | Cl                              | H              | H              | H              | Cl                               | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_3$                         |
| 133   | Cl                              | H              | H              | H              | Cl                               | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$             |
| 134   | Cl                              | H              | H              | H              | -OCF <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$             |
| 135   | Cl                              | H              | H              | H              | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$                       |
| 136   | Cl                              | H              | H              | H              | Cl                               | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$                       |
| 137   | Cl                              | H              | H              | H              | Br                               | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$                       |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

五、發明說明(48)

| 化合物編號              | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>   | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup> | R <sup>8</sup> | R <sup>9</sup> | R   |
|--------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| 138                | O              | H              | H              | H              | CH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$                     |
| 139                | O              | H              | H              | H              | Br               | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{Cl}$ |
| 140                | O              | H              | H              | H              | -CH <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{Cl}$ |
| 141                | O              | H              | H              | H              | -CH <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\text{O}=\text{C}-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$          |
| <u>A 爲-S-之各化合物</u> |                |                |                |                |                  |                |                |                |                |   |
| 142                | O              | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | $\text{S}=\text{C}-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$          |
| 143                | O              | H              | H              | H              | -CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | -CH <sub>3</sub>  |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂 線

## 五、發明說明(49)

除草劑篩選試驗

以下述方法試驗前表所述化合物之除草效力：熟悉此技術者皆知，除草劑篩選試驗所得之結果會受很多不易控制因素之影響。例如，陽光與水之量、土壤之種類、土壤之pH值、溫度及濕度等環境條件即為這些因素之例證。其他會影響試驗結果之因素有，種植之深度及除草劑之施用率，以及試驗作物之性質。結果亦會隨不同作物及作物間之差異性而改變。

萌生前除草劑篩選試驗

在處理前日，將數種不同雜草種植在砂質壤土中0.5吋(1.3厘米)深處，沿著平面之寬度每一列使用一種雜草。土壤用重量基之17-17-17肥料(N-P<sub>2</sub>O<sub>5</sub>-K<sub>2</sub>O)滋養並糊化。所植雜草為野燕麥(*Avena fatua*)(AVEFA)、水草(*Echinochloa crusgalli*)(ECHCG)、綠狐尾草(*Setaria viridis*)(SETVI)、絨毛草(*Abutilon theophrasti*)(ABUTH)、牽牛花(*Ipomoea spp.*)(IPOSS)以及野芥菜(*Sinapsis arvensis*)(SINAR)。種植密度在每列3至25株之間，視植物之大小而定。

受試化合物溶液之製法為將74.7或18.8毫克之受試化合物稱入一60毫升裝廣口瓶內，然後將化合物溶於25毫升含有1% Tween 20(聚氧乙烯花楸糖一月桂酸鹽乳化劑)之丙酮中，然後添加7毫升之去離子水以達14毫升之最終體積。Tween 20之含量為0.5%之最終噴灑體積。在有需要時可使用不超過2毫升之額外溶劑以溶解化合物。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

## 五、發明說明(50)

土表係在一圍封之直線噴灑臺內部噴灑。用校準成遞送748升/公頃之噴霧溶液噴灑各平盤。施用率為4.0或1.0千克/公頃。

將各平盤置於21-29°C之暖房中並每日以噴灑方式澆水。在處理後17-21日目視評估並記錄雜草受控程度，以相較於一未經處理之檢視平盤內同齡同種之生長之百分控制率表示。

此種萌生前測試之各項結果摘列於下表II中。

萌生後除草劑評估

以就萌生前試驗所述方法製備土壤並植以相同之物種。將各平盤置於21-29°C之暖房中並以噴灑方式澆水。在處理前10-12日植入雜草之種子。一般而言，草本植物係以3至4片葉子之階段噴灑而闊葉植物係以1至2片葉子之階段噴灑。已處理平盤之澆水工作局限於土表而非發芽植物之葉部。在處理後17-21日目視評估並記錄雜草受控程度，以相較於一未經處理之檢視平盤內同齡同種之生長之百分控制率表示。

百分控制率為植物因所有因素包括受抑制發芽、萌生後植物組織之殺死、發育不全、畸形、褪色作用及其他形式之傷害等所造成之總傷害。控制率定係由0至100%，其中0代表無效應而生長等於未受處理對照組，而100則代表完全殺死。短橫線指示非以該施用位準進行試驗。

各項結果列於下表III中。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

## 五、發明說明( 51 )

表 II  
萌生前 - 試驗 ( 4.0 千克 / 公頃 )

| 化合物編號 | AVEFA | ECHCG | SETVI | ABUTH | IPOSS | SINAR |
|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 1     | 0     | 0     | --*   | 0     | 0     | 0     |
| 2     | 0     | 0     | --*   | 0     | 0     | 0     |
| 3     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 4     | 10    | 98    | 10    | 0     | 0     | 0     |
| 5     | 0     | 0     | 0     | 30    | 30    | 10    |
| 6     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 7     | 0     | 98    | 15    | 0     | 0     | 0     |
| 8     | 0     | 0     | 0     | 70    | 20    | 25    |
| 9     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 10    | 5     | 50    | 10    | 0     | 0     | 0     |
| 11    | 0     | 0     | 0     | 5     | 10    | 0     |
| 12    | 0     | 10    | 10    | 0     | 10    | 0     |
| 13    | 0     | 10    | 10    | 0     | 10    | 0     |
| 14    | 5     | 100   | 20    | 0     | 10    | 0     |
| 15    | 40    | 95    | 15    | 40    | 40    | 25    |
| 16    | 30    | 5     | 100   | 60    | 20    | 30    |
| 17    | 10    | 98    | 10    | 0     | 0     | 0     |
| 18    | 0     | 0     | 0     | 60    | 60    | 15    |
| 19    | 15    | 90    | 90    | 0     | 0     | 0     |
| 20    | 0     | 98    | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 21    | 20    | 100   | 10    | 10    | 10    | 20    |
| 22    | 50    | 98    | 40    | 40    | 10    | 20    |
| 23    | 5     | 0     | 70    | 60    | 10    | 40    |
| 24    | 10    | 98    | 100   | 10    | 0     | 0     |
| 25    | 0     | 25    | 95    | 90    | 80    | 50    |
|       |       |       |       | 70    | 10    | 60    |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

## 五、發明說明( 52)

| 化合物編號 | AVEFA | ECHCG | SETVI | ABUTH | IPOSS | SINAR |
|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 26    | 5     | 98    | 20    | 70    | 50    | 0     |
| 27    | 20    | 100   | 100   | 98    | 95    | 75    |
| 28    | 5     | 98    | 10    | 60    | 0     | 10    |
| 29    | 5     | 98    | 80    | 70    | 5     | 15    |
| 30    | 5     | 100   | 20    | 70    | 20    | 20    |
| 31    | 95    | 100   | 100   | 98    | 95    | 90    |
| 32    | 95    | 100   | 100   | 100   | 98    | 85    |
| 33    | 5     | 100   | 100   | 85    | 90    | 20    |
| 34    | 10    | 25    | 100   | 75    | 5     | 10    |
| 35    | 60    | 100   | 80    | 85    | 95    | 25    |
| 36    | 25    | 100   | 95    | 30    | 60    | 20    |
| 37    | 98    | 100   | 100   | 98    | 95    | 80    |
| 38    | 60    | 100   | 100   | 90    | 95    | 70    |
| 39    | 98    | 100   | 100   | 95    | 95    | 90    |
| 40    | 0     | 90    | 95    | 60    | 80    | 5     |
| 41    | 98    | 100   | 100   | 98    | 95    | 60    |
| 42    | 98    | 100   | 100   | 100   | 95    | 90    |
| 43    | 50    | 100   | 30    | --*   | 15    | 30    |
| 44    | 5     | 100   | 20    | 60    | 20    | 10    |
| 45    | 98    | 100   | 100   | 100   | 95    | 70    |
| 46    | 98    | 100   | 100   | 100   | 95    | 85    |
| 47    | 75    | 100   | 100   | 70    | 85    | 75    |
| 48    | 15    | 100   | 100   | 60    | 90    | 50    |
| 49    | 0     | 10    | 100   | 40    | 10    | 15    |
| 50    | 0     | 0     | 10    | 5     | 5     | 10    |
| 51    | 0     | 10    | 100   | 0     | 0     | 10    |
| 52    | 98    | 100   | 100   | 98    | 95    | 80    |
| 53    | 98    | 100   | 100   | 70    | 90    | 40    |
| 54    | 20    | 100   | 30    | 50    | 20    | 60    |
| 55    | 0     | 0     | 0     | 0     | 5     | 0     |
| 56    | 0     | 0     | 0     | 5     | 5     | 10    |
| 57    | 60    | 100   | 100   | 95    | 100   | 85    |
| 58    | 40    | 100   | 100   | 70    | 100   | 40    |
| 59    | 10    | 100   | 100   | 70    | 5     | 10    |
| 60    | 95    | 100   | 100   | 100   | 95    | 75    |
| 61    | 40    | 100   | 100   | 5     | 10    | 0     |
| 62    | 95    | 100   | 100   | 70    | 95    | 40    |
| 63    | 90    | 100   | 100   | 60    | 95    | 60    |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

## 五、發明說明( 53)

| 化合物編號 | AVEFA | ECHCG | SETVI | ABUTH | IPOSS | SINAR |
|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 64    | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 65    | 98    | 100   | 100   | 98    | 95    | 75    |
| 66    | 10    | 100   | 100   | 60    | 90    | 30    |
| 67    | 98    | 100   | 100   | 90    | 90    | 75    |
| 68    | 60    | 100   | 60    | 80    | 30    | 70    |
| 69    | 5     | 70    | 25    | 5     | 10    | 30    |
| 70    | 85    | 100   | 100   | 90    | 95    | 60    |
| 71    | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 72    | 0     | 10    | 10    | 5     | 0     | 0     |
| 73    | 70    | 100   | 100   | 90    | 90    | 40    |
| 74    | 5     | 95    | 90    | 10    | 10    | 0     |
| 75    | 80    | 100   | 100   | 60    | 80    | 10    |
| 76    | 25    | 100   | 100   | 100   | 95    | 30    |
| 77    | 5     | 100   | 100   | 60    | 50    | 15    |
| 78    | 95    | 100   | 100   | 90    | 100   | 85    |
| 79    | 25    | 100   | 100   | 100   | 0     | 25    |
| 80    | 25    | 100   | 100   | 50    | 90    | 5     |
| 81    | 90    | 100   | 100   | 95    | 95    | 60    |
| 82    | 40    | 100   | 100   | 70    | 85    | 5     |
| 83    | 0     | 100   | 98    | 60    | 90    | 20    |
| 84    | 70    | 100   | 100   | 90    | 98    | 60    |
| 85    | 60    | 100   | 100   | 100   | 95    | 90    |
| 86    | 20    | 100   | 100   | 100   | 95    | 25    |
| 87    | 0     | 5     | 0     | 5     | 10    | 0     |
| 88    | 98    | 100   | 100   | 100   | 95    | 60    |
| 89    | 90    | 100   | 100   | 90    | 100   | 60    |
| 90    | 30    | 100   | 98    | 70    | 90    | 10    |
| 91    | 98    | 100   | 100   | 70    | 90    | 50    |
| 92    | 98    | 100   | 100   | 100   | 98    | 75    |
| 93    | 70    | 100   | 100   | 15    | 90    | 15    |
| 94    | 0     | 10    | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 95    | 100   | 100   | 100   | 100   | 98    | 100   |
| 96    | 98    | 100   | 100   | 75    | 95    | 50    |
| 97    | 95    | 100   | 100   | 30    | 98    | 15    |
| 98    | 85    | 100   | 100   | 80    | 95    | 50    |
| 99    | 98    | 100   | 100   | 90    | 95    | 85    |
| 100   | 40    | 100   | 98    | 50    | 40    | 20    |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

五、發明說明( 54 )

化合物編號

|     | <u>AVEFA</u> | <u>ECHCG</u> | <u>SETVI</u> | <u>ABUTH</u> | <u>IPOSS</u> | <u>SINAR</u> |
|-----|--------------|--------------|--------------|--------------|--------------|--------------|
| 101 | 15           | 100          | 100          | 0            | 15           | 5            |
| 102 | 0            | 100          | 100          | 0            | 0            | 0            |
| 103 | 75           | 100          | 100          | 60           | 90           | 20           |
| 104 | 85           | 100          | 100          | 60           | 95           | 20           |
| 105 | 85           | 100          | 100          | 30           | 30           | 30           |
| 106 | 100          | 100          | 100          | 100          | 95           | 70           |
| 107 | 50           | 100          | 100          | 25           | 85           | 10           |
| 108 | 5            | 15           | 20           | 5            | 5            | 10           |
| 109 | 10           | 10           | 20           | 0            | 5            | 40           |
| 110 | 0            | 0            | 40           | 0            | 0            | 0            |
| 111 | 0            | 0            | 0            | 0            | 0            | 0            |
| 112 | 95           | 100          | 100          | 90           | 95           | 85           |
| 113 | 10           | 85           | 100          | 10           | 5            | 10           |
| 114 | 75           | 100          | 100          | 90           | 90           | 50           |
| 115 | 80           | 100          | 100          | 90           | 90           | 60           |
| 116 | 5            | 100          | 100          | 85           | 90           | 60           |
| 117 | 50           | 100          | 100          | 95           | 90           | 80           |
| 118 | 20           | 100          | 100          | 10           | 15           | 5            |
| 119 | 10           | 100          | 100          | 75           | 90           | 60           |
| 120 | 10           | 100          | 95           | 10           | 0            | 20           |
| 121 | 0            | 60           | 100          | 20           | 10           | 10           |
| 122 | 0            | 70           | 98           | 10           | 0            | 20           |
| 123 | 5            | 100          | 100          | 50           | 10           | 30           |
| 124 | 30           | 100          | 100          | 70           | 50           | 60           |
| 125 | 20           | 100          | 100          | 85           | 90           | 80           |
| 126 | 5            | 10           | 60           | 0            | 0            | 10           |
| 127 | 20           | 100          | 100          | 60           | 5            | 90           |
| 128 | 15           | 100          | 100          | 75           | 80           | 60           |
| 129 | 10           | 30           | 98           | 0            | 5            | 30           |
| 130 | 25           | 70           | 98           | 30           | 30           | 10           |
| 131 | 10           | 95           | 98           | 50           | 75           | 20           |
| 132 | 90           | 100          | 100          | 70           | 95           | 60           |
| 133 | 95           | 100          | 100          | 85           | 95           | 50           |
| 134 | 90           | 100          | 100          | 90           | 90           | 90           |
| 135 | 70           | 100          | 100          | 90           | 95           | 80           |
| 136 | 25           | 100          | 100          | 50           | 90           | 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( 55 )

| 化合物編號 | AVEFA | ECHCG | SETVI | ABUTH | IPOSS | SINAR |
|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 137   | 30    | 100   | 100   | 70    | 90    | 50    |
| 138   | 30    | 100   | 100   | 90    | 90    | 90    |
| 139   | 80    | 100   | 100   | 80    | 90    | 30    |
| 140   | 90    | 100   | 100   | 50    | 80    | 75    |
| 141   | 25    | 100   | 100   | 90    | 98    | 90    |
| 142   | 0     | 10    | 60    | 0     | 40    | 10    |
| 143   | 15    | 20    | 80    | 15    | 0     | 10    |

\* -- 指示未受試驗

表 III  
萌生後 - 試驗 ( 4.0 千克 / 公頃 )

| 化合物編號 | AVEFA | ECHCG | SETVI | ABUTH | IPOSS | SINAR |
|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 1     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 2     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 3     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 4     | 0     | 70    | 20    | 0     | 10    | 0     |
| 5     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 6     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 7     | 0     | 95    | 20    | 5     | 30    | 5     |
| 8     | 0     | 0     | 0     | 0     | 5     | 15    |
| 9     | 0     | 0     | 0     | 0     | 5     | 0     |
| 10    | 0     | 0     | 0     | 0     | 20    | 10    |
| 11    | 5     | 10    | 10    | 0     | 0     | 0     |
| 12    | 0     | 0     | 10    | 0     | 5     | 0     |
| 13    | 0     | 0     | 10    | 0     | 5     | 0     |
| 14    | 10    | 70    | 30    | 5     | 80    | 10    |
| 15    | 0     | 0     | 0     | 5     | 15    | 0     |
| 16    | 0     | 0     | 0     | 0     | 5     | 0     |
| 17    | 5     | 5     | 15    | 10    | 15    | 10    |
| 18    | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 19    | 0     | 0     | 0     | 0     | 10    | 0     |
| 20    | 0     | 0     | 0     | 0     | 15    | 5     |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明( 56 )

| 化合物編號 | AVEFA | ECHCG | SETVI | ABUTH | IPOSS | SINAR |
|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 21    | 0     | 25    | 5     | 15    | 10    | 0     |
| 22    | 10    | 90    | 15    | 5     | 90    | 5     |
| 23    | 5     | 0     | 70    | 10    | 0     | 0     |
| 24    | 5     | 0     | 25    | 100   | 85    | 75    |
| 25    | 0     | 0     | 0     | 85    | 85    | 20    |
| 26    | 10    | 95    | 5     | 10    | 60    | 0     |
| 27    | 85    | 98    | 85    | 100   | 95    | 85    |
| 28    | 10    | 95    | 5     | 0     | 20    | 0     |
| 29    | 10    | 98    | 10    | 5     | 30    | 0     |
| 30    | 0     | 98    | 5     | 90    | 90    | 0     |
| 31    | 90    | 98    | 90    | 95    | 90    | 80    |
| 32    | 15    | 95    | 85    | 90    | 90    | 80    |
| 33    | 5     | 80    | 85    | 95    | 90    | 60    |
| 34    | 15    | 10    | 25    | 85    | 60    | 15    |
| 35    | 10    | 98    | 60    | 98    | 90    | 40    |
| 36    | 10    | 70    | 50    | 80    | 90    | 75    |
| 37    | 95    | 98    | 90    | 98    | 90    | 85    |
| 38    | 5     | 98    | 40    | 98    | 90    | 75    |
| 39    | 90    | 98    | 85    | 100   | 90    | 85    |
| 40    | 25    | 30    | 30    | 95    | 90    | 60    |
| 41    | 90    | 98    | 90    | 98    | 90    | 90    |
| 42    | 90    | 95    | 90    | 90    | 90    | 90    |
| 43    | 20    | 95    | 20    | 30    | 30    | 5     |
| 44    | 0     | 50    | 20    | 60    | 60    | 10    |
| 45    | 90    | 100   | 90    | 95    | 90    | 85    |
| 46    | 90    | 98    | 90    | 95    | 90    | 75    |
| 47    | 5     | 98    | 60    | 10    | 20    | 70    |
| 48    | 15    | 100   | 80    | 98    | 95    | 80    |
| 49    | 5     | 10    | 15    | 60    | 60    | 30    |
| 50    | 0     | 0     | 20    | 10    | 15    | 0     |
| 51    | 0     | 0     | 20    | 60    | 80    | 15    |
| 52    | 95    | 100   | 98    | 95    | 90    | 75    |
| 53    | 60    | 100   | 90    | 95    | 90    | 60    |
| 54    | 75    | 100   | 30    | 75    | 85    | 10    |
| 55    | 0     | 10    | 0     | 20    | 20    | 70    |
| 56    | 0     | 0     | 0     | 5     | 25    | 15    |
| 57    | 20    | 98    | 95    | 95    | 95    | 95    |
| 58    | 60    | 100   | 98    | 98    | 90    | 80    |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

## 五、發明說明( 57 )

| 化合物編號 | AVEFA | ECHCG | SETVI | ABUTH | IPOSS | SINAR |
|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 59    | 5     | 98    | 20    | 10    | 15    | 5     |
| 60    | 75    | 100   | 98    | 100   | 90    | 80    |
| 61    | 15    | 40    | 30    | 30    | 85    | 15    |
| 62    | 70    | 95    | 95    | 98    | 90    | 50    |
| 63    | 85    | 98    | 95    | 50    | 85    | 60    |
| 64    | 0     | 0     | 0     | 0     | 5     | 5     |
| 65    | 95    | 100   | 95    | 98    | 95    | 60    |
| 66    | 15    | 20    | 40    | 80    | 90    | 75    |
| 67    | 60    | 98    | 85    | 85    | 90    | 50    |
| 68    | 10    | 98    | 15    | 30    | 10    | 20    |
| 69    | 0     | 0     | 0     | 75    | 90    | 75    |
| 70    | 70    | 98    | 90    | 95    | 90    | 70    |
| 71    | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 72    | 0     | 5     | 15    | 30    | 10    | 10    |
| 73    | 5     | 95    | 90    | 95    | 90    | 40    |
| 74    | 5     | 25    | 10    | 75    | 20    | 20    |
| 75    | 10    | 40    | 60    | 98    | 90    | 70    |
| 76    | 90    | 98    | 90    | 95    | 90    | 90    |
| 77    | 10    | 50    | 70    | 80    | 75    | 80    |
| 78    | 90    | 100   | 95    | 95    | 85    | 75    |
| 79    | 15    | 100   | 85    | 80    | 85    | 30    |
| 80    | 30    | 95    | 85    | 85    | 90    | 25    |
| 81    | 95    | 98    | 90    | 100   | 90    | 40    |
| 82    | 5     | 95    | 90    | 60    | 90    | 75    |
| 83    | 5     | 70    | 85    | 95    | 90    | 60    |
| 84    | 85    | 95    | 75    | 80    | 90    | 60    |
| 85    | 50    | 95    | 75    | 50    | 80    | 30    |
| 86    | 30    | 100   | 70    | 60    | 85    | 30    |
| 87    | 0     | 0     | 0     | 0     | 5     | 0     |
| 88    | 90    | 98    | 90    | 95    | 90    | 80    |
| 89    | 90    | 98    | 90    | 90    | 85    | 50    |
| 90    | 15    | 95    | 60    | 95    | 90    | 25    |
| 91    | 90    | 95    | 80    | 90    | 90    | 60    |
| 92    | 95    | 100   | 90    | 95    | 90    | 75    |
| 93    | 40    | 40    | 15    | 30    | 60    | 50    |
| 94    | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     | 0     |
| 95    | 90    | 98    | 90    | 98    | 90    | 70    |
| 96    | 95    | 98    | 98    | 98    | 85    | 40    |

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

## 五、發明說明( 58 )

| 化合物編號 | AVEFA | ECHCG | SETVI | ABUTH | IPOSS | SINAR |
|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 97    | 90    | 98    | 95    | 60    | 85    | 15    |
| 98    | 100   | 100   | 100   | 98    | 85    | 60    |
| 99    | 98    | 100   | 100   | 98    | 90    | 95    |
| 100   | 25    | 95    | 75    | 90    | 90    | 20    |
| 101   | 60    | 75    | 30    | 75    | 85    | 75    |
| 102   | 10    | 100   | 85    | 70    | 90    | 20    |
| 103   | 50    | 100   | 95    | 90    | 95    | 60    |
| 104   | 98    | 100   | 98    | 90    | 80    | 50    |
| 105   | 60    | 100   | 85    | 50    | 20    | 10    |
| 106   | 90    | 98    | 95    | 100   | 90    | 60    |
| 107   | 40    | 85    | 90    | 30    | 95    | 20    |
| 108   | 20    | 20    | 30    | 60    | 60    | 40    |
| 109   | 5     | 25    | 15    | 60    | 75    | 80    |
| 110   | 0     | 0     | 0     | 25    | 25    | 15    |
| 111   | 0     | 0     | 0     | 10    | 10    | 0     |
| 112   | 90    | 95    | 90    | 98    | 90    | 80    |
| 113   | 0     | 0     | 10    | 15    | 20    | 0     |
| 114   | 80    | 98    | 90    | 98    | 90    | 70    |
| 115   | 85    | 98    | 90    | 90    | 90    | 60    |
| 116   | 70    | 98    | 85    | 70    | 90    | 30    |
| 117   | 5     | 95    | 90    | 98    | 95    | 85    |
| 118   | 10    | 10    | 20    | 20    | 80    | 15    |
| 119   | 5     | 98    | 85    | 90    | 90    | 80    |
| 120   | 0     | 10    | 50    | 50    | 90    | 85    |
| 121   | 0     | 0     | 30    | 70    | 85    | 15    |
| 122   | 0     | 5     | 20    | 80    | 90    | 60    |
| 123   | 0     | 5     | 10    | 95    | 75    | 75    |
| 124   | 20    | 98    | 30    | 90    | 70    | 80    |
| 125   | 10    | 50    | 80    | 95    | 90    | 25    |
| 126   | 5     | 20    | 60    | 90    | 90    | 85    |
| 127   | 15    | 25    | 60    | 70    | 95    | 80    |
| 128   | 25    | 90    | 60    | 75    | 95    | 80    |
| 129   | 0     | 10    | 20    | 60    | 85    | 30    |
| 130   | 10    | 40    | 85    | 98    | 90    | 10    |
| 131   | 5     | 60    | 85    | 90    | 90    | 10    |
| 132   | 95    | 100   | 95    | 85    | 90    | 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( 59 )

| 化合物編號 | AVEFA | ECHCG | SETVI | ABUTH | IPOSS | SINAR |
|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 133   | 90    | 98    | 90    | 85    | 85    | 80    |
| 134   | 90    | 98    | 90    | 98    | 90    | 90    |
| 135   | 50    | 95    | 90    | 95    | 90    | 90    |
| 136   | 20    | 98    | 85    | 75    | 90    | 50    |
| 137   | 15    | 95    | 90    | 90    | 90    | 70    |
| 138   | 20    | 98    | 90    | 90    | 95    | 70    |
| 139   | 90    | 98    | 90    | 95    | 90    | 70    |
| 140   | 75    | 98    | 90    | 75    | 85    | 60    |
| 141   | 10    | 60    | 60    | 60    | 60    | 80    |
| 142   | 0     | 0     | 10    | 60    | 90    | 50    |
| 143   | 0     | 5     | 10    | 30    | 60    | 5     |

以上結果例示本發明各化合物針對各種不同草本及闊葉種屬之萌生前及萌生後功效。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

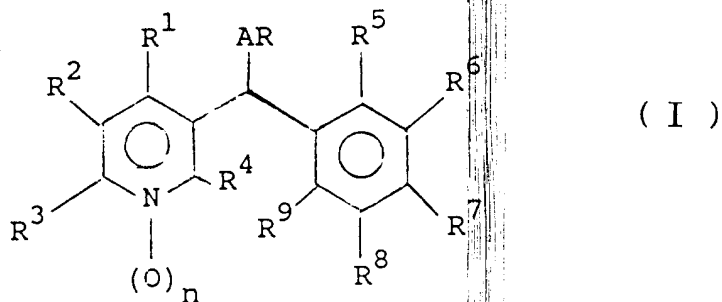
訂

線

四、中文發明摘要(發明之名稱：)

## 除草用4-取代吡啶基-3-甲醇類

具有下列通式之4-取代吡啶基-3-甲醇類：



式中R 爲氫，或爲一醯基、烷基或胺甲醯基團者表現合宜之萌生前及萌生後除草活性。又揭示各種包含此等化合物之除草組合物以及一種採用此等化合物控制不合宜植物之方法。式中AR爲羥基之化合物用作有用之中間產物供生成各種 $\alpha$  苯甲基取代化合物及表現除草活性。

英文發明摘要(發明之名稱：)

附註：本案已向

英

國(地區)申請專利、申請日期：

案號：

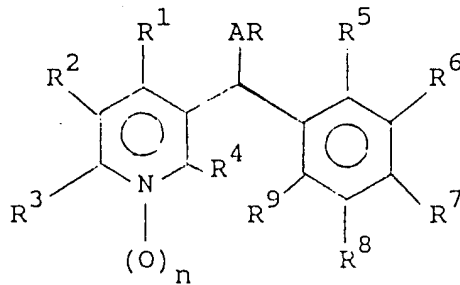
1993.4.22

08/051,490

四、英文發明摘要(發明之名稱：

HERBICIDAL 4-SUBSTITUTED PYRIDYL-3-CARBINOLS

4-substituted pyridyl-3-carbinols of the formula



(I)

wherein R is hydrogen, or an acyl, alkyl or carbamyl group exhibit desirable preemergent and postemergent herbicidal activity. Also disclosed are herbicidal compositions comprising such compounds and; a method of controlling undesirable vegetation employing such compounds. The compounds wherein AR is hydroxyl serve as useful intermediates for the production of the alpha-benzyl substituted compounds as well as exhibiting herbicidal activity.

(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

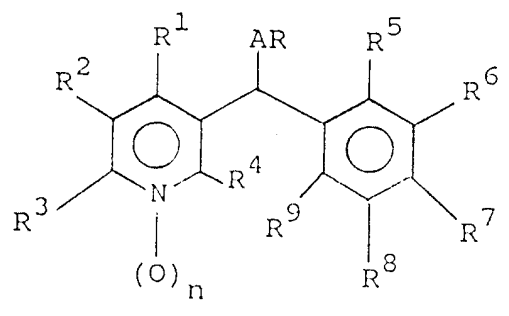
國(地區) 申請專利，申請日期：

案號：

本 生 利 權 申 請 補 充

85.2.5  
補 充

1. 一種具有下列通式之化合物以及其在農業上可被接受之鹽類：



式中：R<sup>1</sup>及R<sup>5</sup>各自分別為鹵素、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>鹵烷氧基、-S(O)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)烷基、硝基、或-OH；

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及R<sup>8</sup>各自分別為氫；

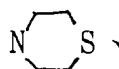
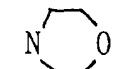
R<sup>4</sup>為氫或鹵素；

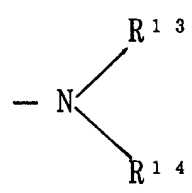
R<sup>6</sup>為氫或C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷氧基；

R<sup>7</sup>及R<sup>9</sup>各自分別為氫、鹵素、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>鹵烷基、或C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷氧基；

A為氧或硫；

n為0或1；

R為氫，C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>烯基，C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>烷基，C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>鹵烷基，-C(O)-R'而其中R'為氫、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>鹵烷基、苯基、經鹵素或硝基取代之苯基、苯氧基、、、



(其中R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>各自分別為氫、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>烷基、

苯基、經鹵素取代之苯基、C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>鹵烷基、C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>烯基、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

## 六、申請專利範圍

吡啶基、 $C_1 - C_4$  烷氧基、 $(C_1 - C_4)$  烷氧基、 $(C_1 - C_4)$  烷基、 $C_2 - C_6$  炔基、或  $R^{11}S(O)_mR^{12}$  而其中  $R^{11}$ 、 $R^{12}$  各自分別為  $C_1 - C_4$  烷基， $m$  為 0、1 或 2 )， $-SO_2R^{11}$  其中  $R^{11}$  為經鹵素取代之苯基、 $C_1 - C_4$  烷基、 $C_1 - C_4$  烷氧基，或  $-C(S)R^{10}$  而其中  $R^{10}$  為  $C_1 - C_4$  烷氧基；或者

$R$  為  $C(O)C(O)OC_2H_5$ 、 $C(O)OCH_3$ 、 $C(O)OC_2H_5$ 、 $C(O)S-CH(CH_3)_2$ 、 $P(O)(OC_2H_5)_2$ 、 $CH(CH_3)C(O)OCH_3$ 、 $C(O)NHCH_2-C(O)OCH_3$ 、 $C(O)NHCH_2C(O)OH$ 、苯甲基、 $C(O)C(CH_3)_2CH_2-CH_2CH_3$ 、 $CH_2-C(Cl)=CH_2$ 、或  $C(O)OCH_2CH_2OCH_3$ ；

但當  $R^1$  為氯或氟， $R^5$  為氯、氟或甲氧基，且  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  及  $R^9$  為氫時， $R$  不為氫。

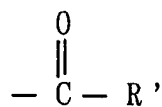
2. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中  $R^1$  為鹵素。

3. 如申請專利範圍第 2 項之化合物，其中  $R^2$ 、 $R^3$  及  $R^4$  為氫。

4. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中  $R^5$  為鹵素、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、 $C_1 - C_6$  鹵烷氧基、 $C_1 - C_6$  烷氧基、硝基、或  $-S(O)_m(C_1 - C_3)$  烷基而其中  $m$  為 0、1、或 2。

5. 如申請專利範圍第 4 項之化合物，其中  $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  及  $R^9$  各自分別為氫、 $C_1 - C_6$  烷基、鹵素或  $C_1 - C_6$  烷氧基。

6. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中  $R$  為苯基、 $(C_1 - C_3)$  烷基或具有下列通式：

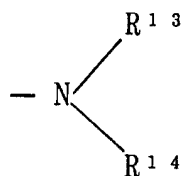


式中  $R'$  為  $C_1 - C_4$  烷基、 $C_1 - C_4$  鹵烷基、苯基或具有下列通

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

## 六、申請專利範圍

式：



式中  $\text{R}^{13}$  及  $\text{R}^{14}$  各自分別為氫、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$  烷基、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$  鹵烷基、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$  烯基、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$  炔基、苯基、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  烷氧基、或  $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$  烷氧基  $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$  烷基。

7. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中：

$\text{R}^1$  為鹵素；

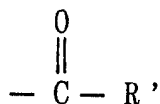
$\text{R}^5$  為鹵素、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$  烷基、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$  鹵烷基、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$  烷氧基、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$  鹵烷氧基、硝基或  $-\text{S}(\text{O})_m(\text{C}_1 - \text{C}_3)$  烷基而其中  $m$  為 0、1 或 2；

$\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$  及  $\text{R}^8$  為氫；

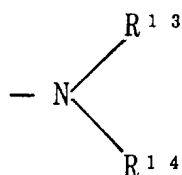
$\text{R}^6$  為氫或  $\text{C}_1 - \text{C}_6$  烷氧基；

$\text{R}^7$  及  $\text{R}^9$  各自分別為氫、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$  烷基、鹵素或  $\text{C}_1 - \text{C}_6$  烷氧基；而

$\text{R}$  為苯基  $-(\text{C}_1 - \text{C}_3)$  烷基或具有下列通式：



式中  $\text{R}'$  為  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  烷基、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  鹵烷基、苯基或具有下列通式：



## 六、申請專利範圍

式中  $R^{13}$  及  $R^{14}$  各自分別為氫、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、 $C_2 - C_6$  烯基、 $C_2 - C_6$  炔基、苯基、 $C_1 - C_4$  烷氧基、或  $(C_1 - C_4)$  烷氧基  $(C_1 - C_4)$  烷基。

8. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中

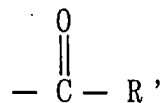
$R^1$  為氯或溴；

$R^5$  為三氟甲基、三氟甲氧基、氯、溴、甲氧基、甲基或乙基；

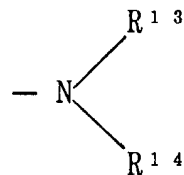
$R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  及  $R^8$  為氫；

$R^9$  為氫、氯或甲基；而

$R$  為苯甲基或具有下列通式：



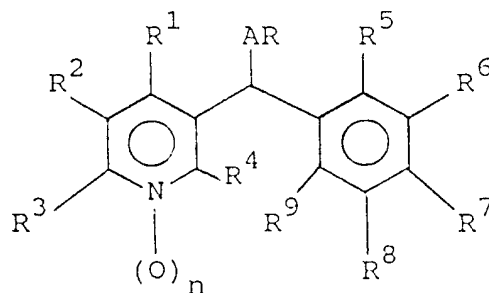
式中  $R'$  為  $C_1 - C_4$  烷基或具有下列通式：



式中  $R^{13}$  及  $R^{14}$  各自分別為氫、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基或苯基。

9. 一種除草組合物，包含：

(A) 一具下列通式之化合物及其在農業上可接受之鹽類：



### 六、申請專利範圍

式中：R<sup>1</sup>及R<sup>5</sup>各自分別為鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>鹵烷氧基、-S(O)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)烷基、硝基、或-OH；

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及R<sup>8</sup>各自分別為氫；



R<sup>4</sup>為氫或鹵素；

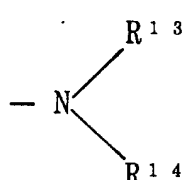
R<sup>6</sup>為氫或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基；

R<sup>7</sup>及R<sup>9</sup>各自分別為氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>鹵烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基；

A為氧或硫；

n為0或1；

R為氫，C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基，C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>鹵烷基，-C(O)-R'而其中R'為氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵烷基、苯基、經鹵素或硝基取代之苯基、苯氧基、、、

 (其中R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>各自分別為氫、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、苯基、經鹵素取代之苯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>鹵烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、吡啶基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷氧基(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、或R<sup>11</sup>S(O)<sub>m</sub>R<sup>12</sup>而其中R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>各自分別為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，m為0、1或2)，-SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>其中R<sup>11</sup>為經鹵素取代之苯基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，或-C(S)R<sup>10</sup>而其中R<sup>10</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基；或者

R為C(O)C(O)OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、C(O)OCH<sub>3</sub>、C(O)OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、C(O)S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、P(O)(OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、CH(CH<sub>3</sub>)C(O)OCH<sub>3</sub>、C(O)NHCH<sub>2</sub>-

## 六、申請專利範圍

$C(O)OCH_3$ 、 $C(O)NHCH_2C(O)OH$ 、苯甲基、 $C(O)C(CH_3)_2CH_2-$   
· $CH_2CH_3$ 、 $CH_2-C(Cl)=CH_2$ 、或 $C(O)OCH_2CH_2OCH_3$ ；以及

(B) 一其所用之載體。

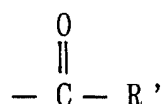
10. 如申請專利範圍第 9 項之組合物，其中  $R^1$  為鹵素。

11. 如申請專利範圍第 10 項之組合物，其中  $R^2$ 、 $R^3$  及  $R^4$  為氫。

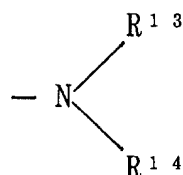
12. 如申請專利範圍第 9 項之組合物，其中  $R^5$  為鹵素、 $C_1$ — $C_6$  烷基、 $C_1$ — $C_6$  鹵烷基、 $C_1$ — $C_6$  鹵烷氧基、 $C_1$ — $C_6$  烷氧基、硝基、或  $-S(O)_m(C_1-C_3)$  烷基而其中  $m$  為 0、1、或 2。

13. 如申請專利範圍第 12 項之組合物，其中  $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  及  $R^9$  各自分別為氫、 $C_1$ — $C_6$  烷基、鹵素或  $C_1$ — $C_6$  烷氧基。

14. 如申請專利範圍第 9 項之組合物，其中  $R$  為苯基—( $C_1$ — $C_3$ ) 烷基或具有下列通式：



式中  $R'$  為  $C_1$ — $C_4$  烷基、 $C_1$ — $C_4$  鹵烷基、苯基或具有下列通式：



式中  $R^{13}$  及  $R^{14}$  各自分別為氫、 $C_1$ — $C_6$  烷基、 $C_1$ — $C_6$  鹵烷基、 $C_2$ — $C_6$  烯基、 $C_2$ — $C_6$  炔基、苯基、 $C_1$ — $C_4$  烷氧基、或 ( $C_1$ — $C_4$ ) 烷氧基 ( $C_1$ — $C_4$ ) 烷基。

15. 如申請專利範圍第 9 項之組合物，其中：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

## 六、申請專利範圍

$R^1$  為鹵素；

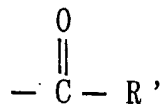
$R^5$  為鹵素、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、 $C_1 - C_6$  烷氧基、 $C_1 - C_6$  鹵烷氧基、硝基或  $-S(O)_m(C_1 - C_3)$  烷基而其中  $m$  為 0、1 或 2；

$R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及  $R^8$  為氫；

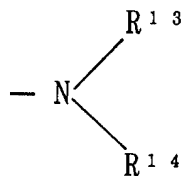
$R^6$  為氫或  $C_1 - C_6$  烷氧基；

$R^7$  及  $R^9$  各自分別為氫、 $C_1 - C_6$  烷基、鹵素或  $C_1 - C_6$  烷氧基；而

$R$  為苯基 -  $(C_1 - C_3)$  烷基或具有下列通式：



式中  $R'$  為  $C_1 - C_4$  烷基、 $C_1 - C_4$  鹵烷基、苯基或具有下列通式：



式中  $R^{13}$  及  $R^{14}$  各自分別為氫、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、 $C_2 - C_6$  烯基、 $C_2 - C_6$  炔基、苯基、 $C_1 - C_4$  烷氧基、或  $(C_1 - C_4)$  烷氧基  $(C_1 - C_4)$  烷基。

16. 如申請專利範圍第 9 項之組合物，其中

$R^1$  為氯或溴；

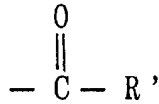
$R^5$  為三氟甲基、三氟甲氧基、氯、溴、甲氧基、甲基或乙基；

$R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  及  $R^8$  為氫；

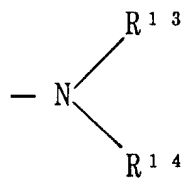
### 六、申請專利範圍

R<sup>9</sup> 為氫、氯或甲基；而

R 為苯甲基或具有下列通式：

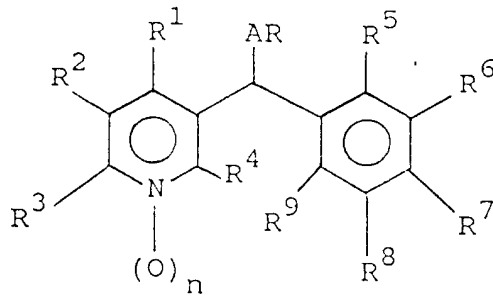


式中 R' 為 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基或具有下列通式：



式中 R<sup>13</sup> 及 R<sup>14</sup> 各自分別為氫、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 鹵烷基或苯基。

17. 一種用以控制不合宜植物之方法，包含對一需要控制之區域施加一除草有效量之具有下列通式之化合物及其在農業上可被接受之鹽類：



式中：R<sup>1</sup> 及 R<sup>5</sup> 各自分別為鹵素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 鹵烷氧基、-S(O)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) 烷基、硝基、或 -OH；

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> 及 R<sup>8</sup> 各自分別為氫；

R<sup>4</sup> 為氫或鹵素；

R<sup>6</sup> 為氫或 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 烷氧基；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝



訂

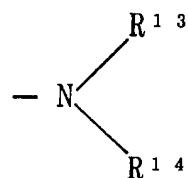
## 六、申請專利範圍

$R^7$  及  $R^9$  各自分別為氫、鹵素、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、或  $C_1 - C_6$  烷氧基；

A 為氧或硫；

n 為 0 或 1；

R 為氫， $C_2 - C_6$  烯基， $C_1 - C_4$  烷基， $C_1 - C_6$  鹵烷基， $-C(O)-R'$  而其中  $R'$  為氫、 $C_1 - C_4$  烷基、 $C_1 - C_4$  鹵烷基、苯基、經鹵素或硝基取代之苯基、苯氧基、 $N$   S、 $N$   O、



（其中  $R^{13}$ 、 $R^{14}$  各自分別為氫、 $C_1 - C_6$  烷基、苯基、經鹵素取代之苯基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、 $C_2 - C_6$  烯基、吡啶基、 $C_1 - C_4$  烷氧基、 $(C_1 - C_4)$  烷氧基  $(C_1 - C_4)$  烷基、 $C_2 - C_6$  炔基、或  $R^{11}S(O)_mR^{12}$  而其中  $R^{11}$ 、 $R^{12}$  各自分別為  $C_1 - C_4$  烷基，m 為 0、1 或 2）， $-SO_2R^{11}$  其中  $R^{11}$  為經鹵素取代之苯基、 $C_1 - C_4$  烷基、 $C_1 - C_4$  烷氧基，或  $-C(S)R^{10}$  而其中  $R^{10}$  為  $C_1 - C_4$  烷氧基；或者

R 為  $C(O)C(O)OC_2H_5$ 、 $C(O)OCH_3$ 、 $C(O)OC_2H_5$ 、 $C(O)S-CH(CH_3)_2$ 、 $P(O)(OC_2H_5)_2$ 、 $CH(CH_3)C(O)OCH_3$ 、 $C(O)NHCH_2-C(O)OCH_3$ 、 $C(O)NHCH_2C(O)OH$ 、苯甲基、 $C(O)C(CH_3)_2CH_2-CH_2CH_3$ 、 $CH_2-C(Cl)=CH_2$ 、或  $C(O)OCH_2CH_2OCH_3$ 。

18. 如申請專利範圍第 17 項之方法，其中  $R^1$  為鹵素。

19. 如申請專利範圍第 18 項之方法，其中  $R^2$ 、 $R^3$  及  $R^4$  為氫。

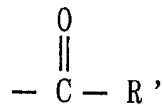
20. 如申請專利範圍第 17 項之方法，其中  $R^5$  為鹵素、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基、 $C_1 - C_6$  鹵烷氧基、 $C_1 - C_6$  烷氧基

## 六、申請專利範圍

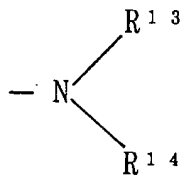
、硝基、或  $-S(O)_m (C_1-C_3)$  烷基而其中  $m$  為 0、1、或 2。

21. 如申請專利範圍第 20 項之方法，其中  $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  及  $R^9$  各自分別為氫、 $C_1-C_6$  烷基、鹵素或  $C_1-C_6$  烷氧基。

22. 如申請專利範圍第 17 項之方法，其中  $R$  為苯基- $(C_1-C_3)$  烷基或具有下列通式：



式中  $R'$  為  $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、苯基或具有下列通式：



· 式中  $R^{13}$  及  $R^{14}$  各自分別為氫、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、苯基、 $C_1-C_4$  烷氧基、或  $(C_1-C_4)$  烷氧基  $(C_1-C_4)$  烷基。

23. 如申請專利範圍第 17 項之方法，其中：

$R^1$  為鹵素；

$R^5$  為鹵素、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  鹵烷氧基、硝基或  $-S(O)_m (C_1-C_3)$  烷基而其中  $m$  為 0、1 或 2；

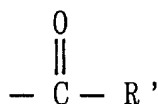
$R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及  $R^8$  為氫；

$R^6$  為氫或  $C_1-C_6$  烷氧基；

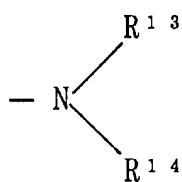
$R^7$  及  $R^9$  各自分別為氫、 $C_1-C_6$  烷基、鹵素或  $C_1-C_6$  烷氧基；而

## 六、申請專利範圍

R 爲苯基 - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) 烷基或具有下列通式：



式中 R' 爲 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 鹵烷基、苯基或具有下列通式：



式中 R<sup>13</sup> 及 R<sup>14</sup> 各自分別爲氫、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 鹵烷基、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> 炔基、苯基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷氧基、或 (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) 烷氧基 (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) 烷基。

24. 如申請專利範圍第 17 項之方法，其中

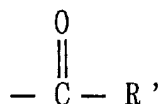
R<sup>1</sup> 爲氯或溴；

R<sup>5</sup> 爲三氟甲基、三氟甲氧基、氯、溴、甲氧基、甲基或乙基；

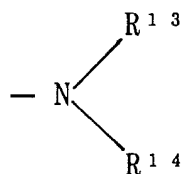
R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> 及 R<sup>8</sup> 爲氫；

R<sup>9</sup> 爲氫、氯或甲基；而

R 爲苯甲基或具有下列通式：



式中 R' 爲 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基或具有下列通式：



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

## 六、申請專利範圍

式中  $R^{13}$  及  $R^{14}$  各自分別為氫、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_6$  鹵烷基或苯基。

25. 如申請專利範圍第 17 項之方法，其中所述化合物係在萌生前施用。

26. 如申請專利範圍第 17 項之方法，其中所述化合物係在萌生後施用。

27. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 A 為氧而 R 為氫。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂