



(21)申請案號：105119256

(22)申請日：中華民國 105 (2016) 年 06 月 20 日

(51)Int. Cl. : C07D209/54 (2006.01)

A01N43/38 (2006.01)

(30)優先權：2015/06/22 歐洲專利局

15173092.6

(71)申請人：拜耳作物科學股份有限公司(德國)BAYER CROPSCIENCE

AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

德國

(72)發明人：安格曼 阿爾弗雷德 ANGERMANN, ALFRED (DE)；萊爾 斯蒂芬 LEHR, STEFAN (DE)；赫姆基 昂德里克 HELMKE, HENDRIK (DE)；費希爾 雷納 FISCHER, REINER (DE)；波捷克 基多 BOJACK, GUIDO (DE)；勒辛格 克里斯托弗 ROSINGER, CHRISTOPHER HUGH (GB)；加茨魏勒 埃爾馬爾 GATZWEILER, ELMAR (DE)；迪特里克 漢斯耶爾格 DIETRICH, HANSJOERG (DE)

(74)代理人：林秋琴；陳彥希；何愛文

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：24 項 圖式數：0 共 60 頁

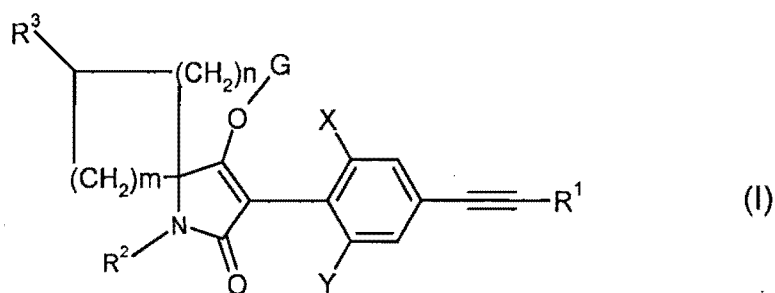
## (54)名稱

新穎之經炔基取代之 3-苯基吡咯啉-2,4-二酮及其作為除草劑之用途

NOVEL-ALKYNYL-SUBSTITUTED 3-PHENYLPYRROLIDINE-2,4-DIONES AND USE THEREOF AS HERBICIDES

## (57)摘要

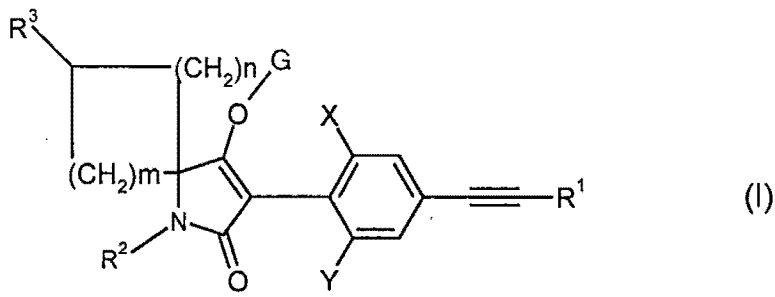
本發明係關於新穎有效之根據通式(I)的經炔基取代之 3-苯基吡咯啉-2,4-二酮或其農化上可接受的鹽，



其中 X=C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基；Y=C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基；n=1,2 或 3；m=1 或 2；R<sup>1</sup>=C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基，或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基；R<sup>2</sup>=氫或甲基；R<sup>3</sup>=C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基，或帶有氧或硫原子的五元或六元雜環；G=氫、一個可切斷的基團 L 或陽離子 E。

本發明亦關於根據本發明的化合物用於防治雜草和有用的植株作物中之雜草之用途。

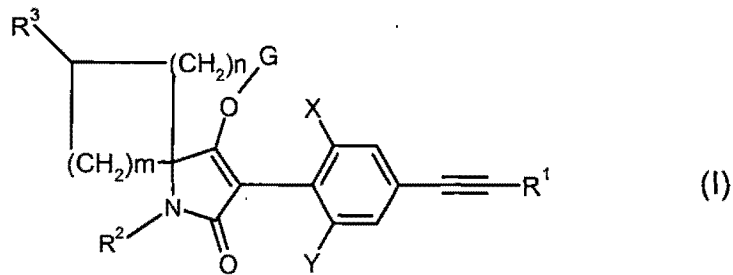
The present invention relates to novel effective alkynyl-substituted 3-phenylpyrrolidine-2,4-diones according to the general formula (I) or agrochemically acceptable salts thereof,



where X = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalkyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl; Y = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl; n = 1, 2 or 3; m = 1 or 2; R<sup>1</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl; R<sup>2</sup> = hydrogen or methyl; R<sup>3</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, or a saturated five- or six-membered heterocycle with an oxygen or sulphur atom; G = hydrogen, a cleavable group L or a cation E.

The invention also relates to the use of the compounds according to the invention for controlling weeds and weed grasses in crops of useful plants.

特徵化學式：



## 發明摘要

※ 申請案號：105719256.

607D 209/54 (2006.01)

※ 申請日：105.6.20

※IPC 分類：A01N 43/28 (2006.01)

## 【發明名稱】(中文/英文)

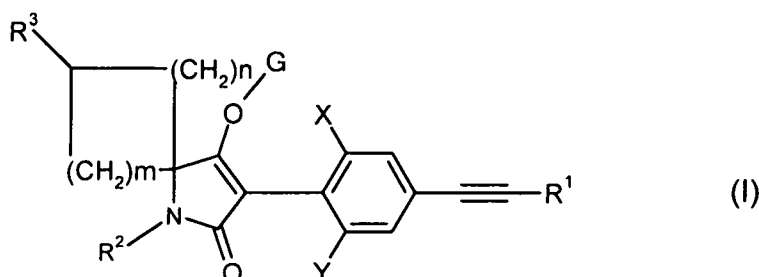
新穎之經炔基取代之3-苯基吡咯啉-2,4-二酮及其作為除草劑之用途

NOVEL-ALKYNYL-SUBSTITUTED

3-PHENYLPYRROLIDINE-2,4-DIONES AND USE THEREOF AS HERBICIDES

## 【中文】

本發明係關於新穎有效之根據通式(I)的經炔基取代之3-苯基吡咯啉-2,4-二酮或其農化上可接受的鹽，



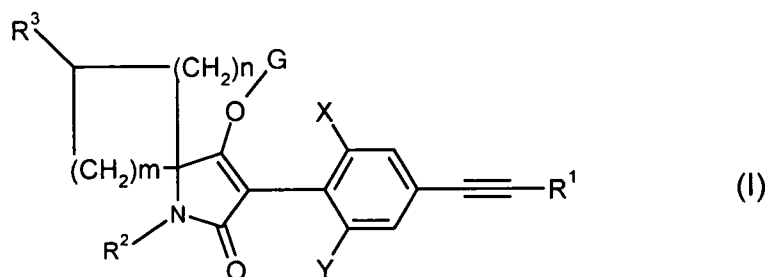
其中

X = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基； Y = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基； n = 1, 2 或 3； m = 1 或 2； R<sup>1</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基，或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基； R<sup>2</sup> = 氫或甲基； R<sup>3</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基，或帶有氧或硫原子的五元或六元雜環； G = 氫、一個可切斷的基團L或陽離子E。

本發明亦關於根據本發明的化合物用於防治雜草和有用的植株作物中之雜草之用途。

## 【英文】

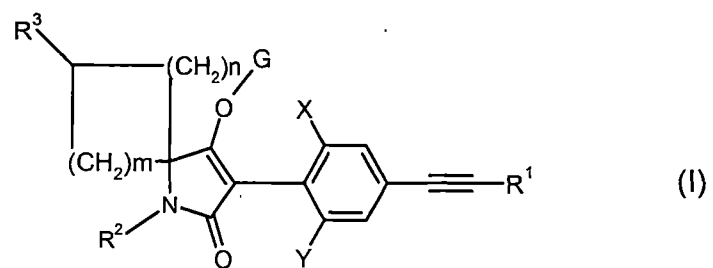
The present invention relates to novel effective alkynyl-substituted 3-phenylpyrrolidine-2,4-diones according to the general formula (I) or agrochemically acceptable salts thereof,



where

X = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalkyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl; Y = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl; n = 1, 2 or 3; m = 1 or 2; R<sup>1</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, or C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl; R<sup>2</sup> = hydrogen or methyl; R<sup>3</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, or a saturated five- or six-membered heterocycle with an oxygen or sulphur atom; G = hydrogen, a cleavable group L or a cation E.

The invention also relates to the use of the compounds according to the invention for controlling weeds and weed grasses in crops of useful plants.

**【代表圖】****【本案指定代表圖】：**無**【本代表圖之符號簡單說明】：**無**【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】：**

# 發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

## 【發明名稱】(中文/英文)

新穎之經炔基取代之3-苯基吡咯啉-2,4-二酮及其作為除草劑之用途

NOVEL-ALKYNYL-SUBSTITUTED

3-PHENYLPYRROLIDINE-2,4-DIONES AND USE THEREOF  
AS HERBICIDES

## 【技術領域】

本發明係關於根據通式(I)之新穎有效之經炔基取代之3-苯基吡咯啉-2,4-二酮或其農化上可接受的鹽類，以及其用於防治雜草和有用的植株作物中之雜草的用途。

## 【先前技術】

先前技藝已熟知3-芳基吡咯啉-2,4-二酮類化合物及其製備和作為除草劑的用途。

而且，例如具有除草劑、殺昆蟲劑或殺真菌劑效果的二環的3-芳基吡咯啉-2,4-二酮衍生物(EP-A-355 599, EP-A-415 211 和 JP-A 12-053 670 ff.)以及經取代的單環3-芳基吡咯啉-2,4-二酮衍生物(EP-A-377 893 和 EP-A-442 077 ff.)也被說明過。具有除草劑效果之經炔基取代之N-苯基吡咯啉-2,4-二酮亦從 WO 96/82395、WO 98/05638、WO 01/74770、WO 14/032702 或 WO15/040114 得知。

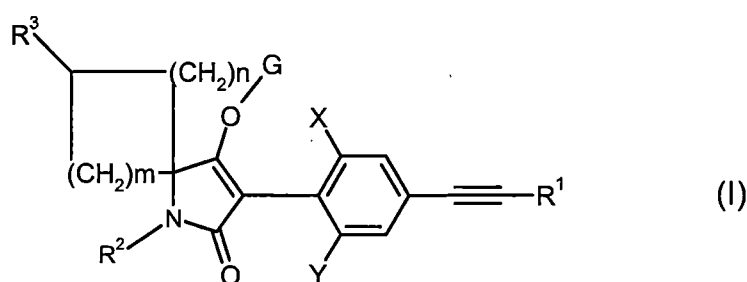
這些殺草劑對於有害植物的效果視各種參數而定，例如所使用的施用比例、製備物的形式(調配物)、在每一情形中要防治的有害植物、有害植株的譜系範圍、以及氣候和土壤比率，以及作用時間和/或除草劑的分解速率。為了發展充分

的除草劑效果，各種出自 3-芳基吡咯啉-2,4-二酮群組的除草劑需要高的施用比例和/或狹窄的有害植株譜系範圍，這使其施用在經濟學上不具吸引力。因此吾人需要具有改進之性質且在經濟學上具有吸引力且同時有效率的其他除草劑。

### 【發明內容】

因此，本發明的目標是要提供不具有所述缺點的新穎化合物。

因此本發明係關於通式(I)之新穎之經炔基取代之 N-苯基吡咯啉-2,4-二酮，



或一種其在農化上可接受的鹽。

其中

X = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基，

Y = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基，

n = 1、2 或 3，

m = 1 或 2，

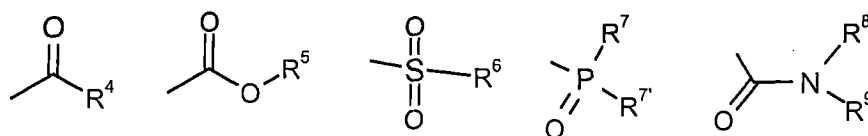
R<sup>1</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基，或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基，

R<sup>2</sup> = 氫或甲基，

R<sup>3</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基，或帶有氧或硫原子的五元或六元雜環，

G = 氫、可切斷的 L 基團或 E 陽離子；其中

L = 以下基團之一



其中

$R^4$  = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基 或 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，

$R^5$  = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，

$R^6$  = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、未飽和的苯基或苯基，其被鹵基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-halo 烷氧基、硝基或氰基取代一或多次，

$R^7$ ，  $R^{7'}$  = 在每一情形中彼此獨立為甲氧基或乙氧基，

$R^8$  和  $R^9$  = 在每一情形中彼此獨立為 甲基、乙基、苯基或共同形成飽和的五元、六元或七元環，或共同形成帶有氧原子或硫原子的飽和五元、六元或七元雜環，

E = 鹼金屬離子、鹼土金屬離子、鋁離子或過渡金屬離子、氫鎂陽離子，或  
 銨離子，其中視需要一個、兩個、三個或四個氫原子經完全相同的或相異的出自氫、C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-烷氧基或 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>- 環烷基群組的基團取代，在每一情形中經氟、氯、溴、氰基、羥基取代一或多次或被一個或多個氧或硫原子介入，或是  
 環狀的二級或三級脂肪族的或雜脂肪族的胺基離子，例如嗎啉陽離子、硫代嗎啉陽離子、哌啶陽離子、吡咯啶陽離子，或在每一情形中為經過質子化的 1,4-二氮雜二環[2.2.2]辛烷(DABCO)或 1,5-二氮雜二環[4.3.0]十一-7-烯(DBU)，或  
 雜環銨離子，例如在每一情形中為質子化的 吡啶、

2-甲基吡啶、3-甲基吡啶、4-甲基吡啶、2,4-二甲基吡啶、2,5-二甲基吡啶、2,6-二甲基吡啶、5-乙基-2-甲基吡啶、吡咯、咪唑、喹啉、喹噁啉、1,2-二甲基咪唑、1,3-二甲基咪甲基硫酸鹽，或進而為銻離子。

本發明之一項通用的定義係以通式(I)提出。本說明書之以上和以下所提化學式中之較佳取代基或基團範圍於之後說明：

在式(I)和所有以下的化學式中，具有多於兩個碳原子的烷基可為直鏈的或分支的。烷基 為例如甲基、乙基、正-或異丙基、正-、異-、三級-或 2-丁基、戊基如正戊基、2,2-二甲基丙基和 3-甲基丁基。環烷基是一個具有三到六個碳原子的碳環之飽和環系統，例如環丙基、環丁基、環戊基或環己基。

鹵基是氟、氯、溴或碘。

式(I)化合物可視取代基的形式以幾何的和/或光學異構物或異構物混合物存在於不同的組成物中，視需要可以常見的方式將其分離。本發明提供純粹的異構物以及互變異構物、異構物或鏡像異構物的混合物、其製備和用途，以及包含這些異構物的組成物。然而，簡單起見，本說明書以下所使用的術語是指式(I)化合物，儘管吾人意圖指純化合物和視需要指具有不同比率之異構物與互變異構化合物的混合物。

請參照以下化合物，其中

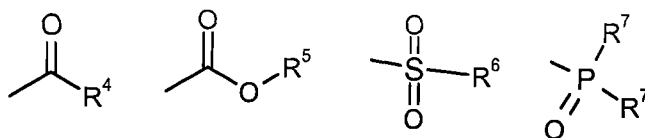
- X = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基，  
 Y = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基 或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基，  
 n = 1、2 或 3，  
 m = 1 或 2，  
 R<sup>1</sup> = 甲基、乙基、異丙基或環丙基，

$R^2$  = 氫或甲基，

$R^3$  =  $C_1$ - $C_3$ -烷氧基- $C_1$ - $C_3$ -烷基，

G = 氫、可切斷的 L 基團或 E 陽離子；其中

L = 以下基團之一者



其中

$R^4$  =  $C_1$ - $C_4$ -烷基，

$R^5$  =  $C_1$ - $C_4$ -烷基，

$R^6$  =  $C_1$ - $C_4$ -烷基，未經取代的苯基或經鹵基、 $C_1$ - $C_4$ -烷基或  $C_1$ - $C_4$ -烷氧基取代的苯基，

$R^7$ 、 $R^{7'}$  = 彼此獨立的甲氧基或乙氧基，

E = 鹼金屬離子、鹼土金屬離子、鋁離子或過渡金屬離子、或

銨離子，其中視需要一個、兩個、三個或所有四個氫原子被完全相同的或相異的基團取代，該基團係選自氫或  $C_1$ - $C_5$ -烷基，或三級脂肪族或雜脂肪族銨離子，或一個雜環的銨陽離子的群組，例如在每一情形中為經質子化吡啶、喹啉、喹噁啉、1,2-二甲基咪唑、1,3-二甲基咪唑甲基硫酸鹽或亦可為銻離子，

尤佳者當屬以下化合物，其中

X = 甲基、乙基或環丙基，

Y = 甲基或乙基，

n = 1 或 2，

$m = 1$  或  $2$ ，

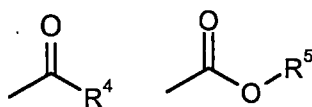
$R^1 =$  甲基、乙基、異丙基或環丙基，

$R^2 =$  氫

$R^3 =$   $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$  或  $\text{CH}_3\text{OCH}_2-$ ，

$G =$  氫、可切斷的 L 基團或 E 陽離子；其中

L = 以下基團之一者



其中

$R^4 =$   $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷基，

$R^5 =$   $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -烷基，

E = 鹼金屬離子、鹼土金屬離子、鋁的離子對等物、過渡金屬的離子對等物或鹵化鎂陽離子、四- $\text{C}_1$ - $\text{C}_5$ -烷基銨離子或雜環的銨離子，例如在每一情形中為質子化的吡啶或喹啉，或亦可為銻離子。

非常尤佳者當屬式(I)的化合物，其中

X = 甲基或乙基，

Y = 甲基或乙基，

n = 1 或 2，

m = 1 或 2，

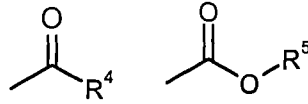
$R^1 =$  甲基、乙基、異丙基或環丙基，

$R^2 =$  氫，

$R^3 =$   $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$  或  $\text{CH}_3\text{OCH}_2-$ ，

G = 氫、可切斷的 L 基團或 E 陽離子；其中

L = 以下基團之一者



其中

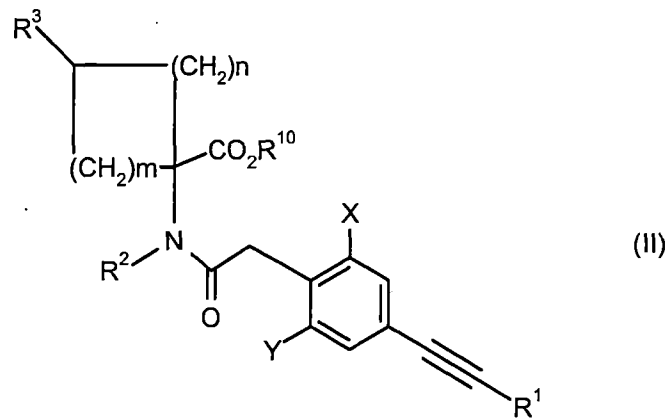
$R^4$  = 甲基、乙基或異丙基，

$R^5$  = 甲基或乙基，

E = 鈉、鉀、三甲基銨、吡啶陽離子、喹啉陽離子或三甲基銻離子或是鈣或鎂的離子對等物。

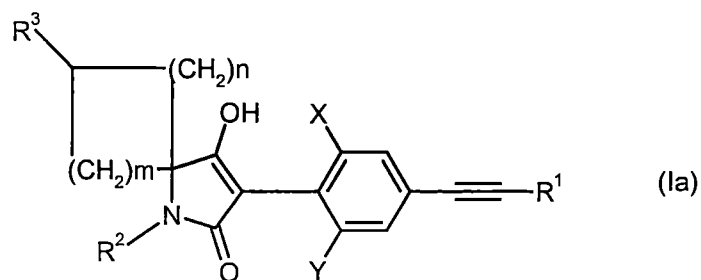
根據本發明之通式(I)化合物的製備基本上已知和/或可依照文獻中已知的方法來實行，例如藉由

a) 將通式(II)的化合物環化



其中 X、Y、 $R^1$ 、 $R^2$  和  $R^3$ 、以及 n 和 m 具有以上所給的意義，且  $R^{10}$  是烷基，較佳是甲基或乙基，視需要在適當的溶劑或稀釋劑存在下，以適當的鹼以正規方式切下  $R^{10}OH$  基團，或

b) 將通式(Ia)化合物，

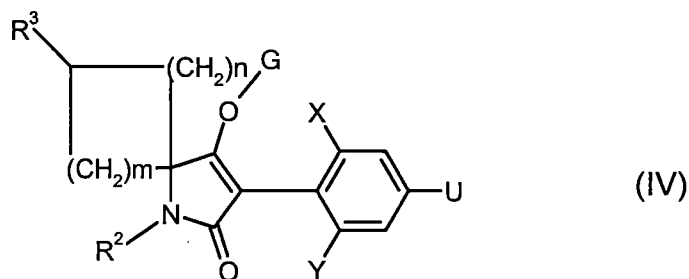


其中 X, Y, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> 和 R<sup>3</sup> , 以及 n 和 m 具有以上所給意義者, 與通式(III)的化合物反應。

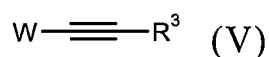
### Hal-L (III)

其中 L 具有以上所給的意義且 Hal 是鹵基, 較佳是氯或溴或可為磺酸基團, 視需要在 適當的溶劑或稀釋劑還有適當的鹼存在下進行。

### (c) 將通式(IV)的化合物



其中 X、Y、R<sup>2</sup> 和 R<sup>3</sup> , 以及 m、n 和 G 具有以上所給的意義, 且 U 為適當脫離基者, 與通式(V)之適當炔化試劑反應,

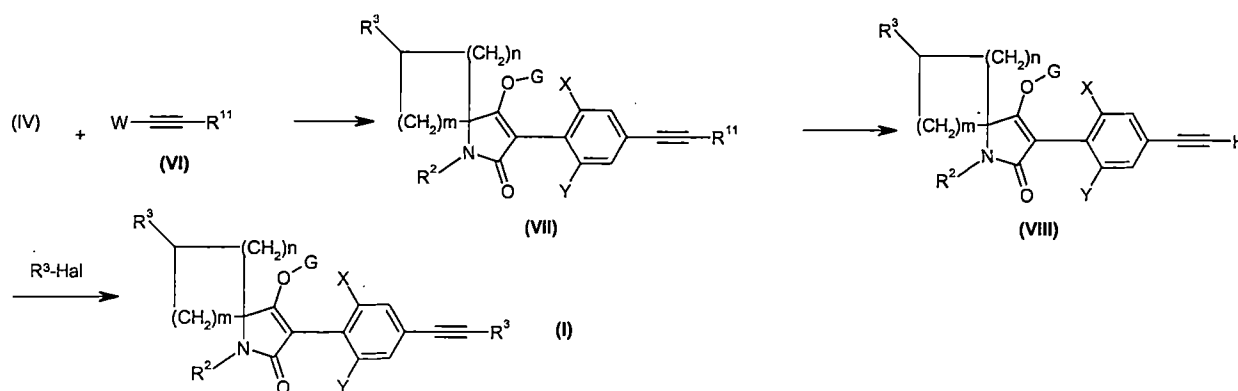


其中 R<sup>3</sup> 具有以上所給的意義且 W 為氫或適當的脫離基, 視需要於適當的催化劑和適當的鹼存下進行。適當的脫離基 W 為例如鹵原子如氯、溴或碘, 烷基磺酸酯基團, 例如:

三氟酸酯、甲磺酸酯或全氟丁基磺酸酯、氯化鎂、氯化鋅、三烷基錫基團，和硼酸基團如  $B(OH)_2$  或  $-B(O\text{烷基})_2$ 。  $Pd^0$  錯合物尤其非常立即適用於作為催化劑，在許多情形中添加  $Cu^{(I)}$  鹽是非常有利的。

所說明的方法學是先前技藝中已知的而且在此關聯中也在「鈀催化的交叉耦合」、「蘭頭[Sonogashira]、根岸[Negishi]、鈴木[Suzuki]、史蒂利 [Stille] 或熊田[Kumada]耦合」之關鍵字下。

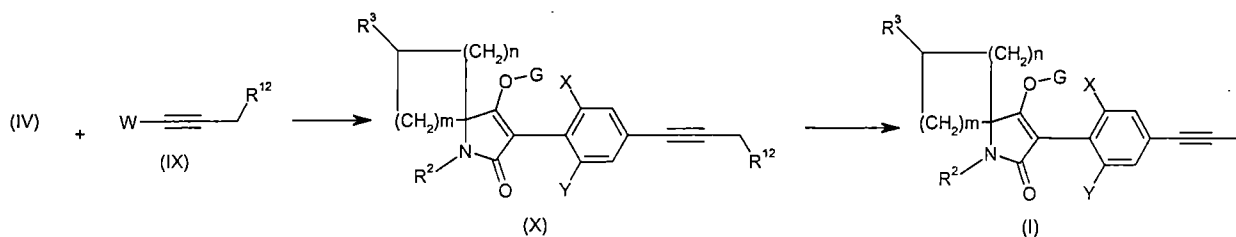
或者，通式(IV)的化合物亦可與通式(VI)的炔基試劑藉與以上說明耦合方法相似的施行方式反應，然後經切割成為通式(VIII)的乙炔基化合物且最後將這些物質用適當的烷化試劑轉換成根據本發明的式(I)化合物，其中在每一情形中 X、Y、 $R^2$ 、 $R^3$ 、n、m、G 和 W 具有所說明的意義且該可切斷的基團  $R^{11}$  可為例如  $(C_1-C_4\text{-烷基})_2C-OH$  基團。



這項技術同樣在文獻中為已知，在例如《Beilstein Journal of Organic Chemistry》2011, 7(55), 426-431 和在《and Catalysis Communications》, 2015, 60, 82-87 中被更詳細解釋。

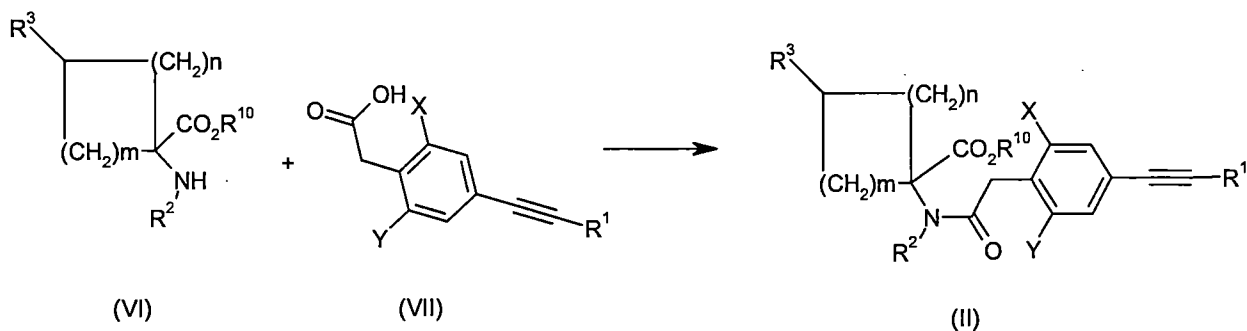
還有另一技術係包含將通式(IV)的化合物與通式(IX)的炔基試劑以和以上說明之偶合方法相似的施行方式反應。然後，可在適當條件下將  $R^{12}$  基團切下，產生根據本發明之式

(I)化合物，其中  $R^3 = \text{Me}$ ，其中在每一情形裡  $X$ 、 $Y$ 、 $R^2$ 、 $n$ 、 $m$ 、 $G$  和  $W$  具有該說明之意義。 $R^{12}$  是  $C_1$ - $C_4$ -三烷基矽基。



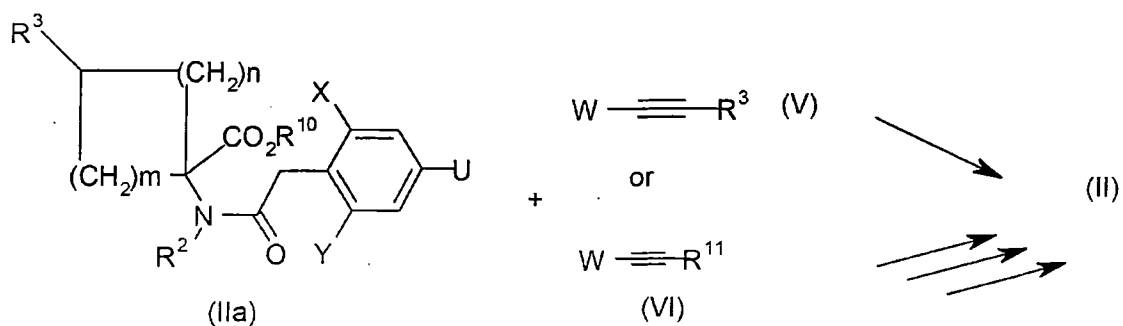
這項技術是文獻中已知者，說明在例如《Journal of Medicinal Chemistry》2007, 50 (7), 1627-1634。

所需之通式(II)的前驅體



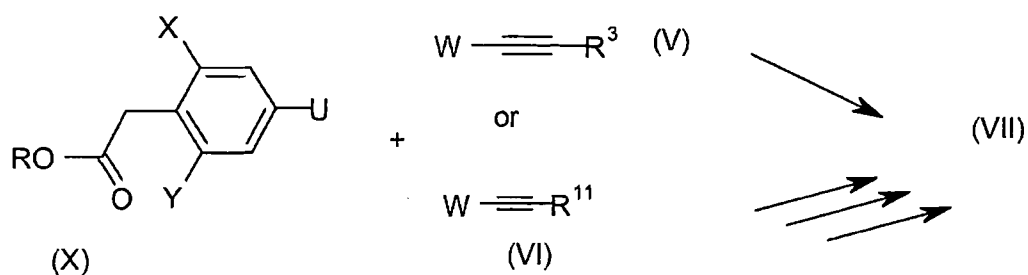
可經已知方法製備，將通式(VI)的胺基酸酯與通式(VII)的苯基乙酸反應，其中  $X$ 、 $Y$ 、 $R^1$ 、 $R^2$  和  $R^3$  和  $R^{10}$ ，還有  $n$  和  $m$  具有以上說明的意義，視需要藉著添加一種脫水劑且視需要在適當的溶劑或稀釋劑存在下進行。

還有一項製備通式(II)之化合物之改變的方法包括例如也是將式(IIa)化合物，其中  $X$ 、 $Y$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $n$  和  $m$  以及  $U$  具有以上所給意義者反應，藉由已說明過的交叉偶合法進行。



通式(VII)的苯基乙酸-稱為 2,6-二甲基-4-炔丙基苯基乙酸-基本上是在 WO 2015/040114 被提到，但未說明這些化合物的取得途徑。

然而，其可依照文獻中已知的方法製備，例如藉著將通式(X)的化合物，其中 X, Y, U, W,  $R^3$ ,  $R^{10}$  和  $R^{11}$  如以上定義且  $R = C_1-C_4$ -烷基者與通式(VI)或(V)的試劑反應，其再次使用以上說明過的技術。



根據本發明的式(I)化合物(和/或其鹽)，於以下統稱為「根據本發明的化合物」具有對抗寬廣譜系之經濟上重要之單子葉或雙子葉一年生雜草之優良的除草劑效果。該活性成分亦有效作用在從根莖、根幹和其他多年生器官產生芽且難以防治的多年生雜草。

因此本發明也提供防治不想要的植株或調節植株生長的方法，較佳是在植株作物中，其中一種或多於一種根據本發明的化合物被施用於植株(例如有害植株如單子葉或雙子葉雜草或不想要的作物植株)，種子(例如穀實、種子、營養繁

殖芽如塊莖或帶芽的幼枝部分) 或植株生長的區域(例如耕種的區域)。本發明的化合物可在例如播種前(若適當亦可藉著將其併入土壤中)、發芽前或發芽後佈署。吾人特定地藉由實例提出的數種可被根據本發明的化合物防治單子葉或雙子葉的雜草族群，但無意提出名稱來對某些植株種類加以限制。

單子葉之以下屬別的有害植株：山羊草屬(*Aegilops*)、鵝觀草屬(*Agropyron*)、剪股穎屬(*Agrostis*)、看麥娘屬(*Alopecurus*)、早熟禾(*Apera*)、野燕麥(*Avena*)、臂形草屬(*Brachiaria*)、雀麥屬(*Bromus*)、蒺藜草屬(*Cenchrus*)、鴨跖草屬(*Commelina*)、狗牙根屬(*Cynodon*)、莎草屬(*Cyperus*)、(*Dactyloctenium*)、馬唐屬(*Digitaria*)、稗屬(*Echinochloa*)、荸薺屬(*Eleocharis*)、稊屬(*Eleusine*)、畫眉草屬(*Eragrostis*)、野黍屬(*Eriochloa*)、羊茅屬(*Festuca*)、飄拂草屬(*Fimbristylis*)、異蕊花屬(*Heteranthera*)、白茅屬(*Imperata*)、鴨嘴草屬(*Ischaemum*)、千金子屬(*Leptochloa*)、毒麥屬(*Lolium*)、鴨舌草屬(*Monochoria*)、稷屬(*Panicum*)、雀稗屬(*Paspalum*)、鵲草屬(*Phalaris*)、梯牧草屬(*Phleum*)、早熟禾屬(*Poa*)、筒軸茅屬(*Rottboellia*)、慈姑屬(*Sagittaria*)、莞屬(*Scirpus*)、狗尾草屬(*Setaria*)、高粱(*Sorghum*)。

雙子葉之以下屬別的雜草：苘麻屬(*Abutilon*)、莧屬(*Amaranthus*)、豚草屬(*Ambrosia*)、錦葵科(*Anoda*)、春黃菊屬(*Anthemis*)、薔薇科(*Aphanes*)、艾屬(*Artemisia*)、濱藜屬(*Atriplex*)、雛菊屬(*Bellis*)、鬼針屬(*Bidens*)、薺屬(*Capsella*)、飛廉屬(*Carduus*)、決明屬(*Cassia*)、矢車菊屬(*Centaurea*)、藜屬(*Chenopodium*)、薊屬(*Cirsium*)、旋花屬(*Convolvulus*)、曼陀羅屬(*Datura*)、山螞蝗屬(*Desmodium*)、蓼科(*Emex*)、糖芥屬(*Erysimum*)、大戟屬(*Euphorbia*)、鼬瓣花屬(*Galeopsis*)、小米菊屬(*Galinsoga*)、拉拉藤屬(*Galium*)、木槿屬(*Hibiscus*)、

番薯屬(*Ipomoea*)、地膚屬(*Kochia*)、野芝麻屬(*Lamium*)、獨行菜屬(*Lepidium*)、母草屬(*Lindernia*)、母菊屬(*Matricaria*)、薄荷屬(*Mentha*)、山靛屬(*Mercurialis*)、番杏科(*Mullugo*)、勿忘草屬(*Myosotis*)、罌粟屬(*Papaver*)、牽牛花屬(*Pharbitis*)、車前屬(*Plantago*)、蓼屬(*Polygonum*)、馬齒莧屬(*Portulaca*)、毛茛屬(*Ranunculus*)、蘿蔔屬(*Raphanus*)、蔊菜屬(*Rorippa*)、水豬母乳屬(*Rotala*)、酸模屬(*Rumex*)、豬毛菜屬(*Salsola*)、黃菀屬(*Senecio*)、田菁屬(*Sesbania*)、黃花稔屬(*Sida*)、歐白芥屬(*Sinapis*)、茄屬(*Solanum*)、苦苣菜屬(*Sonchus*)、尖瓣花屬(*Sphenoclea*)、繁縷屬(*Stellaria*)、蒲公英(*Taraxacum*)、遏藍菜屬(*Thlaspi*)、三葉草屬(*Trifolium*)、蕁麻(*Urtica*)、婆婆納屬(*Veronica*)、堇菜屬(*Viola*)、蒼耳屬(*Xanthium*)。

若本發明的化合物在發芽前被施用於土壤表面，雜草幼苗的發芽被完全預防或雜草生長至其達到子葉階段，但其在三到四週過後停止生長並且最終完全死掉。

若是活性成分在發芽後被施用到植株的綠色部分，則在處理之後生長停止，且有害植株在施用時保持在生長階段，或其在某時間之後完全死亡，使得有害於作物植株的雜草之競爭非常早就以延續方式被縮限。

雖然根據本發明的化合物對於單子葉和雙子葉的雜草具有優良的除草活性，而對重要的經濟作物例如雙子葉的以下屬別：花生屬(*Arachis*)、甜菜(*Beta*)、芸苔屬(*Brassica*)、香瓜屬(*Cucumis*)、南瓜屬(*Cucurbita*)、向日葵屬(*Helianthus*)、胡蘿蔔屬(*Daucus*)、大豆屬(*Glycine*)、棉屬(*Gossypium*)、番薯屬(*Ipomoea*)、萵苣屬(*Lactuca*)、亞麻屬(*Linum*)、番茄屬(*Lycopersicon*)、菸草屬(*Nicotiana*)、菜豆屬(*Phaseolus*)、豌豆屬(*Pisum*)、茄屬(*Solanum*)、蠶豆屬(*Vicia*)，或以下屬別的單子葉作物：蔥屬(*Allium*)、鳳梨屬(*Ananas*)、天門冬屬(*Asparagus*)、野燕麥(*Avena*)、大麥屬(*Hordeum*)、稻屬(*Oryza*)、

稷屬(Panicum)、甘蔗屬(Saccharum)、黑麥屬(Secale)、高粱屬(Sorghum)、黑小麥屬(Triticale)、小麥屬(Triticum)、玉蜀黍屬(Zea)，尤其是玉蜀黍屬(Zea)和小麥屬(Triticum)，僅不顯著的受損或完全不受損，是根據本發明的特殊化合物的結構及其施用比例而定。因為這些理由，本發明之化合物非常適用於選擇性的防治作物植株如農業上有用的植株或裝飾用植株中不想要的植株生長。

此外，根據本發明的化合物(視其特殊結構和所配置的施用比例而定)在作物植株具有傑出的生長調節性質。其以調節作用干涉植株本身的代謝，因此可用於受控的影響植株成分和輔助收成，例如藉著乾燥和阻礙生長。還有，其亦適用於一般防治和抑制不想要的植物生長而不殺死該過程中的植株。抑制植物生長在許多單子葉和雙子葉作物中扮演重要的角色，因為例如該貯存物質的形成可因此被降低或完全預防。

因其除草和植物生長調節性質，活性成分亦可用於防治基改植株或藉由傳統突變法修改的植株作物中之有害植株。一般而言，基因轉殖的植株之特徵為其特殊的有利性質，例如對於某些除害蟲劑的抗對性，對於某些除草劑，植物疾病或植物疾病之病原體一如某些昆蟲或微生物如真菌、細菌或病毒的對抗性。其他特殊的性質係關於例如收成物資的收成量、品質、可貯存性、組成和特定成分。例如，具有提高的澱粉含量或經改變之澱粉性質的基因轉殖植株，或收成物資中具有不同的脂肪酸組成的基因轉殖植株。

關於基因轉殖作物，較佳者當屬施用根據本發明的化合物於經濟上重要的有用植株和裝飾用植株之基因轉殖作物，例如穀物如小麥、大麥、裸麥、燕麥、粟米、水稻、樹薯和玉米或其他甘蔗、棉花、大豆、油菜、馬鈴薯、番茄、豌豆和其他蔬菜作物。較佳是本發明的化合物可作為除草劑，用

於能對抗或經遺傳工程改造能對抗除草劑之植物毒性影響的有用植株作物。

與既存植株相較，具有經改進的性質之新穎植株的傳統生產方法包括，例如：傳統培養法和生產突變株。或者，具有經修飾性質之新穎植株可借助重組的方法產生(請參考例如 EP-A-0221044、EP-A-0131624)。例如，在以下數種情形中已有說明：

- 以達到修改植株中合成澱粉為目的之基因修飾作物植株(例如：WO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806)，
- 能對抗某些固殺草(glufosinate) 型(請參考例如 EP A-0242236, EP-A-242246)或嘉磷塞型 (WO 92/00377)或磺醯基尿素型(EP-A-0257993, US A 5013659)除草劑的基因轉殖作物植株，
- 基因轉殖的作物植株，例如棉花，其具有生產蘇力菌毒素的能力，這使植株能對抗特殊的害蟲 (EP-A-0142924, EP-A-0193259)，
- 具有經修改之脂肪酸組成的基因轉殖的作物植株 (WO 91/13972)，
- 具有新穎成分或二級代謝物例如新穎的植物抗菌素之基因改造作物植株，該物質能造成增進的疾病抵抗力(EPA 309862, EPA0464461)，
- 具有降低之光呼吸作用之基改植株，其具有較高產率和較高的壓力耐受性 (EPA 0305398)，
- 能產生醫藥上或診斷上重要之蛋白質(「分子藥物養殖業」)的基因轉殖作物植株，
- 標榜較高產率或較佳品質的基因轉殖的作物植株，
- 以先前所提新穎性質之組合為特徵(「基因堆壘」)的基因轉殖作物植株。

基本上已知許多可被用於生產新穎之具備經修改性質之

基因轉殖植株的分子生物學技術，請參考，例如：I. Potrykus and G. Spangenberg (eds.) *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg, 或 Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431)。

對於此種重組操作，可將容許突變或藉由 DNA 序列重組使序列改變的核酸分子導入質體中。借助標準方法吾人可以例如進行鹼基交換，移除掉序列之部分或添加天然的或合成的序列。為了將 DNA 片段一一連接起來，可將轉接序列或連接序列放到該片段中，請參考 Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2nd edition Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY, 或 Winnacker "Gene und Klone [Genes and clones]", VCH Weinheim 2nd edition 1996。

例如，要想產生具有降低之基因產物活性的植物細胞可藉著表現至少一項對應的反意義股 RNA、或表現至少一種適當建立的核糖酶來達成，該核糖酶特定地切斷以上所提基因產物的轉錄片段。為此目的，首先可使用涵蓋基因產物之整個編碼序列(包括任何可能出現的側翼序列)的 DNA 分子，亦可使用僅涵蓋編碼序列部分的 DNA 分子，在該情形中這些部分必須長到夠在細胞中具有反意義核酸效應。亦可使用對於基因產物之編碼序列高度同源但非與其完全相同的 DNA 序列。

將核酸分子在植株中表現時，所合成蛋白質可位在植株細胞之任何所希望的小室中。然而，為了達成使其位在某一胞器中，吾人可以例如將該編碼區與能確保其位在某一小室中的 DNA 序列連接。此種序列對於熟習本技藝者是已知(請參考例如，Braun et al., *EMBO J.* 11 (1992), 3219-3227； Wolter et al., *Proc. Natl. Acad. Sci. USA* 85 (1988), 846-850； Sonnewald et al., *Plant J.* 1 (1991), 95-106)。核酸分子亦可在

植株細胞的胞器中表現。

該基因轉殖植株的細胞可以藉已知的技術再生成為整株植物。基本上，該基因轉殖植株可為任何想要的植物品種的植株，亦即不僅是單子葉且亦可為雙子葉植株。

因此，可以得到基因轉殖的植株，其性質藉由過度的表達、壓抑或抑制同源的(天然的)基因或基因序列或是表現異源的(外來的)基因或基因序列而被改變。

本發明的化合物可優先使用在能對抗生長調節劑，例如麥草畏(Dicamba)，或能對抗抑制必須植物酵素的除草劑，例如乙醯乳酸合成酶(ALS)、EPSP 合成酶、麩醯胺酸合成酶(GS 或羥基苯基丙酮酸鹽二氧化化酶(HPPD)，或選自以下群組：磺醯基尿素、嘉磷塞、固殺草(glufosinate)或苯甲醯基異噁唑類之除草劑和相似活性成分的基因轉殖作物。

當本發明的活性成分被用於基因轉殖作物時，不僅對於在其他作物中觀察到之有害植株的影響被觀察到，而且也經常觀察到特定於施用在特殊基因轉殖作物的影響，例如經改變的或特定放大的可被防治之雜草範圍、經改變之可被使用的施用比例，較佳是與基因轉殖作物能對抗的除草劑有良好的相容性，以及影響基因轉殖的作物植株的生長和產率。

因此本發明也提供本發明的化合物作為除草劑以防治基因轉殖的作物植株中之有害植株的用途。

在本發明之一項較佳實例中，通式(I)的化合物可被用於防治那些有害植株，例如出自以下群組的植株：剪股穎屬(Agrostis)、看麥娘屬(Alopecurus)、早熟禾(Apera)、野燕麥(Avena)、臂形草屬(Brachiaria)、雀麥屬(Bromus)、蒺藜草屬(Cenchrus)、馬唐屬(Digitaria)、稗屬(Echinochloa)、糝屬(Eleusine)、野黍屬(Eriochloa)、千金子屬(Leptochloa)、毒麥屬(Lolium)、奧圖草屬(Ottochloa)、稷屬(Panicum)、狼尾草屬(Pennisetum)、鶉草屬(Phalaris)、早熟禾屬(Poa)、筒軸

茅屬(*Rottboellia*)、狗尾草屬(*Setaria*)和/或高粱屬(*Sorghum*)雜草；尤其是看麥娘屬(*Alopecurus*)、早熟禾(*Apera*)、野燕麥(*Avena*)、臂形草屬(*Brachiaria*)、雀麥屬(*Bromus*)、馬唐屬(*Digitaria*)、稗屬(*Echinochloa*)、野黍屬(*Eriochloa*)、毒麥屬(*Lolium*)、稷屬(*Panicum*)、鵲草屬(*Phalaris*)、早熟禾屬(*Poa*)、狗尾草屬(*Setaria*)和/或高粱屬(*Sorghum*)雜草，

- 其對一種或多於一種能抑制乙醯基-CoA-羧酸酯酶(ACCase)的除草劑具有抗藥性。能抑制 ACCase 的殺草劑為尤其是啞啞草酯(pinoxaden)、炔草酯(clodinafop-propargyl)、精惡啞禾草靈(fenoxaprop-P-ethyl)、克硫松(diclofop-methyl)、伏寄普(fluzafop-P-butyl)、甲基合氯氟(haloxyfop-P-methyl)、快伏草(quizalofop-P-ethyl)、普拔草(propaquizafop)、丁基賽伏草(cyhalofop-butyl)、剋草同(clethodim)、西殺草(sethoxydim)、環殺草(cycloxydim)、苯草酮(tralkoxydim)或丁苯草酮(butroxydim)；

- 和/或對嘉磷塞具有抗藥性，

- 和/或對一種或多於一種能抑制乙醯乳酸鹽合成酶(ALS)的除草劑具有抗藥性，例如一種或多於一種磺醯基尿素除草劑，例如碘甲磺隆(iodosulphurone-methyl)、甲基二磺隆(mesosulphurone-methyl)、苯磺隆(tribenuron-methyl)、醚苯磺隆(triasulphurone)、氟磺隆(prosulphurone)、磺醯磺隆(sulphosulphurone)、百速隆(pyrazosulphurone-ethyl)、免速隆(bensulphurone-methyl)、菸嘧磺隆(nicosulphurone)、氟速隆(flazasulphurone)、iofensulphurone、甲磺隆(metsulphurone-methyl)，或任何其他揭示在《The Pesticide Manual》，15th edition (2009)或16th edition (2012), C.D.S. Tomlin, British Crop Protection Council 中的磺醯基尿素和/或一種或多於一種三啞啞啞除草劑(例如雙氟磺草胺[florasulam]、甲氧磺草胺[pyroxsulam]或平速爛[penoxsulam])

和/或一種或多於一種嘧啶基(硫代或氧基)苯甲酸鹽除草劑(例如雙草醚[bispyribac-sodium]或環酯草醚[pyriftalid])和/或一種或多於一種磺醯基胺基羰基三唑啉酮除草劑(例如噻吩基卡巴腓-甲基、丙氧基卡巴腓-鈉或氟酮磺隆)和/或咪唑啉酮除草劑(例如甲氧咪草煙[imazamox])。

此種能對抗 ACCase 和/或 ALS 抑制劑和/或的嘉磷塞特定實例尤其是大穗看麥娘 (*Alopecurus myosuroides*)、*Apera spica-venti*、野燕麥(*Avena fatua*)、*Avena sterilis*、*Brachiaria decumbens*、信號草(*Brachiaria plantaginea*)、大馬唐草(*Digitaria horizontalis*)、(*Digitaria insularis*)、血紅色馬唐(*Digitaria sanguinalis*)、光頭稗(*Echinochloa colona*)、稗(*Echinochloa crus-galli*)、牛筋草(*Eleusine indica*)、(多花黑麥草(*Lolium multiflorum*)、硬直黑麥草(*Lolium rigidum*)、黑麥草(*Lolium perenne*)、小籽藹草(*Phalaris minor*)、*Phalaris paradoxa*、狗尾草(*Setaria viridis*)、大狗尾草(*Setaria faberi*)或 金色狗尾草(*Setaria glauca*)。

在本發明的一項尤佳之具體實例中，通式(I)之根據本發明的化合物可用於對抗以下有害植株：

- 能對抗一種或多於一種 ACCase 抑制性除草劑(例如選自以上列表)或其實至少部分由於有害植株的 ACCase 標靶位置中有一個或多於一個胺基酸經突變(例如取代)的植株(請參考例如 S.B. Powles and Qin Yu, "Evolution in Action : Plants Resistant to herbicides ", *Annu. Rev. Plant Biol.*, 2010, 61, p. 317-347)；和/或

- 能對抗嘉磷塞或其實至少部分由於所提到雜草中的嘉磷塞所導向之 EPSPS 標靶部位中有一個或多於一個胺基酸經突變(例如取代)的植株；和/或

- 能對抗一種或多於一種 ALS 抑制性除草劑(例如選自以上 ALS 抑制性除草劑列表)且其實至少部分由於所提到

雜草中的 ALS 標靶部位中有一個或多於一個胺基酸經突變(例如取代)的植株(請參考例如 S.B. Powles and Qin Yu, "Evolution in Action : Plants Resistant to herbicides ", Annu. Rev. Plant Biol., 2010, 61, p. 317-347) ; 和/或

- 能對抗一種或多於一種 ACCase 抑制性除草劑(例如選自以上列表)和/或嘉磷塞和/或一種或多於一種 ALS 抑制性除草劑(例如選自以上列表)且其實至少部分經由代謝誘發, 例如至少部分因為細胞色素 P450-調節之代謝作用所導致除草劑抗性的植株(請參考例如 S.B. Powles and Qin Yu, "Evolution in Action : Plants Resistant to herbicides", Annu. Rev. Plant Biol., 2010, 61, p. 317-347)。

根據本發明的化合物與先前技藝的化合物(例如 WO 2015/040114, 化合物 42.03)相比展現傑出的性質(亦請參考表 9 和 10 中的比較數據)。

本發明的化合物可以傳統調配物中的可濕潤粉末、可乳化濃縮物、可噴灑溶液、塵佈用產品或顆粒施用。因此本發明也提供包含本發明化合物的除草和植物生長調節組成物。

根據本發明的化合物可以各種方式調配, 此係根據預先給定的生物和/或化學物理的參數。可能的調配物包括, 例如: 可濕潤的粉末(WP)、水可溶粉末(SP)、水可溶濃縮物、可乳化濃縮物(EC)、乳化物(EW), 如油在水中和水在由中的乳化物、可噴灑溶液、懸浮液濃縮物(SC)、已油禍水為基底的分散物、油可溶混的溶液、膠囊懸浮物(CS)、塵佈用產品(DP)、施用物料、用於散播和土壤施用的顆粒、微顆粒形式的顆粒(GR)、噴灑用顆粒、吸收和吸附用顆粒、水可分散的顆粒(WG)、水可溶顆粒(SG)、ULV 調配物、微膠囊和蠟。這些個別的調配物型式基本上是已知的且被說明在例如: Winnacker Küchler, "Chemische Technologie [Chemical Technology]", Volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Ed.

1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973, K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London。

所需的調配物輔助劑如惰性物質、表面活性劑、溶劑和更多添加物，同樣為已知的並且說明在例如：Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd ed., Darland Books, Caldwell N.J.; H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide", 2nd ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J., Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964, Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte [Interface-active ethylene oxide adducts]", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976, Winnacker Küchler, "Chemische Technologie [Chemical Technology]", Volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Ed. 1986。

在這些調配物的基礎上，亦可與其他具除害劑活性的物質，例如殺昆蟲劑、殺蟻劑、除草劑、殺真菌劑，還有與藥害減輕劑、肥料和/或生長調節劑一起生產組合物，例如呈已混合完畢的調配物形式或呈分開以供混桶的形式。適當的藥害減輕劑是例如吡啶解草酯、環丙磺醯胺、雙苯惡唑酸、解毒啞(cloquintocet-mexyl)和二氯丙烯胺(dichlormid)。

可濕潤的粉末是能均勻分散在水中的製備物，其除稀釋劑或惰性物質外與活性成分併存，還包含離子的和/或非離子型式的表面活性劑(濕潤劑，分散劑)，例如聚氧乙基化的烷基分類、聚氧乙基化的脂肪醇類、聚氧乙基化的脂肪胺類、脂肪醇聚乙二醇醚硫酸酯類、烷基磺酸酯類、烷基苯磺酸酯類、木質素磺酸鈉、2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸鈉、二丁基

萘磺酸鈉或其他油鹼基甲基牛磺酸鈉。為了生產可濕潤的粉末，吾人將具除草劑活性的成分精細研磨，例如在傳統的裝置如錘磨機、風箱研磨機和氣壓噴射碾磨機，且同時或緊接著與調配物的輔助劑混合。

可乳化的濃縮物系將活性成分溶解在一種有機溶劑中，例如丁醇、環己酮、二甲基甲醯胺、二甲苯、或其他較為高沸點的芳香類或烴類或有機溶劑的混合物，並添加一種或多於一種離子的和/或非離子的表面活性劑(乳化劑)所產生的。可使用的乳化劑實例為：烷芳基磺酸鈣如十二醯基苯磺酸鈣或非離子的乳化劑如脂肪酸聚乙二醇酯類、烷基芳基聚乙二醇醚、脂肪醇聚乙二醇醚、環氧丙烷環氧乙烷縮合產物、烷基聚醚類、山梨糖酯類例如山梨糖脂肪酸酯或聚氧乙烯山梨糖酯例如聚氧乙烯山梨糖脂肪酸酯。

可用於塵佈的粉末係將活性成分與精細分散的固態物質，例如滑石、天然黏土如高嶺土、皂土和葉蠟石，或矽藻土一起研磨而獲得。

懸浮液的濃縮物可用水或油為基底。其可藉由濕磨來生產，利用標準的市售研磨機研磨並且視需要添加表面活性劑，如以上已被列出用於其他型式之調配物者。

乳化物例如油在水中的乳化物(EW)可以例如利用攪拌機、膠體研磨機和/或靜態混合器，使用水溶液的有機溶劑且視需要使用如以上已被列出用於其他型式之調配物的表面活性劑來製備。

顆粒可以藉著將活性成分噴灑到吸附性的顆粒惰性物質上或將活性成分濃縮物利用吸附劑例如聚乙烯醇、聚丙烯酸鈉或其他礦物油施加到載劑如砂子、高嶺土或顆粒的惰性物質表面來製備。適當的活性成分亦可用傳統生產肥料顆粒的方法—若需要在一種與肥料的混合物中予以結粒。

水可分散的顆粒通常是藉由傳統方法如噴灑-乾燥法、流

體化床結粒法、盤皿結粒法、用高速混合機混合並且不加固態惰性物質即予以擠壓成型的方式生產。

盤皿、流體化床、擠壓成形和噴灑顆粒的生產請參考例如，《Spray Drying Handbook》 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London, J.E. Browning, 《Agglomeration》, Chemical and Engineering 1967, pages 147 ff, 《Perry's Chemical Engineer's Handbook》, 5th Ed., McGraw Hill, New York 1973, p. 857 中的方法。

更多關於作物保護組成物之調配的細節請參考例如：G.C. Klingman, 《Weed Control as a Science》, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pages 81-96 和 J.D. Freyer, S.A. Evans, 《Weed Control Handbook》, 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101-103。

該農化製備物通常包含 0.1 到 99%重量比，尤其是 0.1 至 95%重量比之根據本發明的化合物。

在可濕潤的粉末中，活性成分的濃度是例如大約 10 至 90%重量比，剩下用來達到 100% 重量比的物質包括傳統調配物的成分。在可乳化濃縮物的情形中，該活性成分的濃度可為大約 1 至 90，較佳是 5 至 80%重量比。塵粉型式的調配物包含

1 至 30%重量比的活性成分，較佳是最多 5 至 20%重量比的活性成分，可噴灑溶液包含大約 0.05 至 80，較佳是 2 至 50%重量比的活性成分。在水可分散顆粒的情形中，活性成分含量部分視活性化合物是以液體或固體形式存在以及使用哪種結粒輔助劑、填充劑等。在水可分散的顆粒中，活性成分的含量是介於例如 1 和 95%重量比之間，較佳是介在 10 和 80%重量比之間。

此外，該特定的活性成分調配物視需要包含黏著劑、乳化劑、穿透劑、保存劑、抗凍劑和溶劑、填充劑、運輸劑和

染料、消泡劑、蒸發抑制劑和慣用於每一種情形之影響 pH 和黏度的用劑。

以這些調配物為基礎，亦可生產與其他具有除害劑活性的物質，例如殺昆蟲劑、殺蟎劑、除草劑、殺真菌劑，還有安全劑、肥料和/或生長調節劑生產組合物，例如呈已混合完畢的調配物形式或呈分開以供混桶的形式。

為了施用，呈市售形式調配物若適當，例如在可濕潤粉末、可乳化濃縮物、分散物和水可分散顆粒與水的情形中係以傳統方式稀釋。塵粉型式的製備物、土壤施用的顆粒或用於散播的顆粒和可噴灑溶液則並未在施用前再與其他惰性物質進行慣常的稀釋。

式(I)化合物的所需施用比例因外在條件而異，包括溫度、濕度和所使用的殺草劑型式。其可在寬廣的限制中，例如在 0.001 和 1.0 kg/ha 之間或更多的活性物質中作改變，但較佳是在 0.005 和 750 g/ha 之間作改變。

### 【圖式簡單說明】

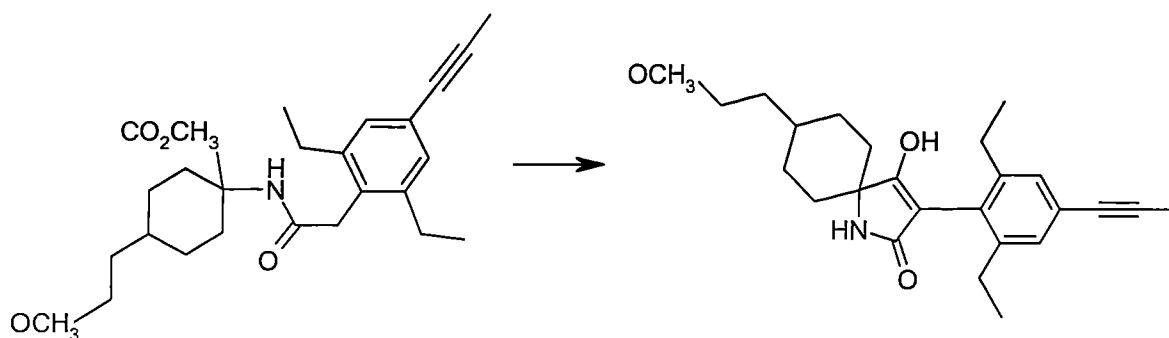
無

### 【實施方式】

以下實例係藉由舉例說明本發明：

#### A. 化學實例

實例 I-1



I-1

將 1.14 g (2.67 mmol) 前驅體溶於 10 ml DMF 的溶液在室溫下經 30 min 滴加到 8 ml DMF 和 748 mg (2.5 eq) 三級丁酸鉀，並在此溫度下攪拌 18 h。然後將混合物在 40°C 加熱 4 h，將溶劑減壓移除並將殘留物溶於 100 ml 水中。將混合物用 1N 鹽酸調整到 pH = 1 並將所得到的殘留物濾出，產生 1.00 g (95%) 目標化合物 A1，呈無色油液。

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{d}_6\text{-DMSO}$ ): 3.33 (s, 1H,  $\text{CH}_2\text{-OCH}_3$ ), 2.04 (s, 3H,  $\text{CH}_3\text{-C}\equiv\text{C}$ )

以相似於實例 I-1 的方式並且根據與生產有關的一般細節，得到以下根據本發明的化合物：

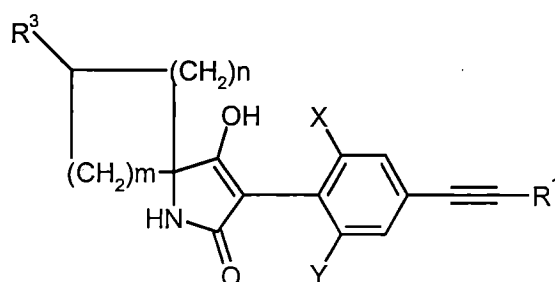
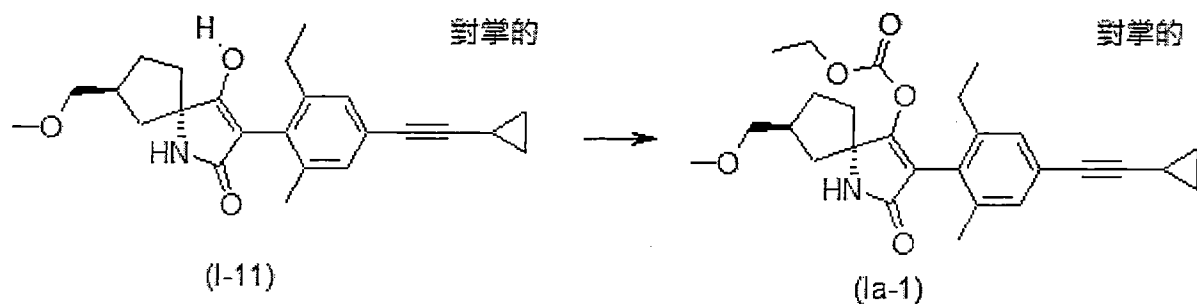


表 1 :

實例 編號	n	m	R <sup>3</sup>	X	Y	R <sup>1</sup>	備註
I-1	2	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Et	Et	Me	nd
I-2	2	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Et	Me	nd
I-3	2	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Me	Me	nd
I-4	2	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Me	環丙基	nd
I-5	2	2	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Et	Me	nd
I-6	2	2	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Et	Et	Me	nd
I-7	2	2	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Et	環丙基	nd
I-8	2	2	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Me	環丙基	nd
I-9	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Et	Me	順式
I-10	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Et	Me	反式
I-11	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Et	環丙基	反式
I-12	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Et	環丙基	順式
I-13	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Me	環丙基	反式
I-14	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Me	環丙基	順式/反式 混合物

nd = 未測定

## 實例 Ia-1



將 0.5 ml 三乙胺和 1.5 mg DMAP 溶於 8 ml 二氯甲烷添加到根據本發明的化合物(I-11) 1.00 g (2.6 mmol)並且在 40°C 下攪拌 10 min。然後緩緩滴加氯甲酸乙酯 0.315 g (2.9 mmol)溶於二氯甲烷 2 ml的溶液並將混合物在 40°C 攪拌 6 小時，然後在 RT 下至隔夜。添加碳酸氫鈉溶液 10 ml 然後將有機層分出。將濃縮後留下的殘留物用管柱層析術純化(矽膠，梯度 EtOAc/正庚烷)，產生 0.920 g (77%)化合物 B1，此係根據乙酸酯/己烷 v/v = 20 : 80)，共得到 0.43 g (47%)反式異構物呈無色晶體，m.p. 183-184 °C。

以相似於實例 Ia-1 的方式並且根據與生產有關的一般細節，得到以下式(I-1-b)的化合物：

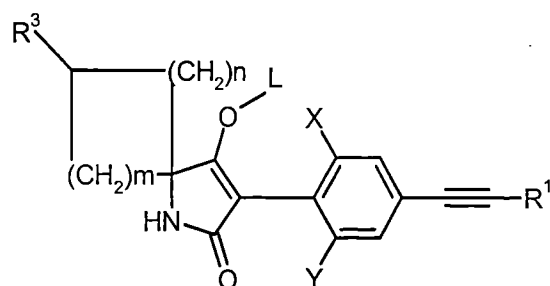


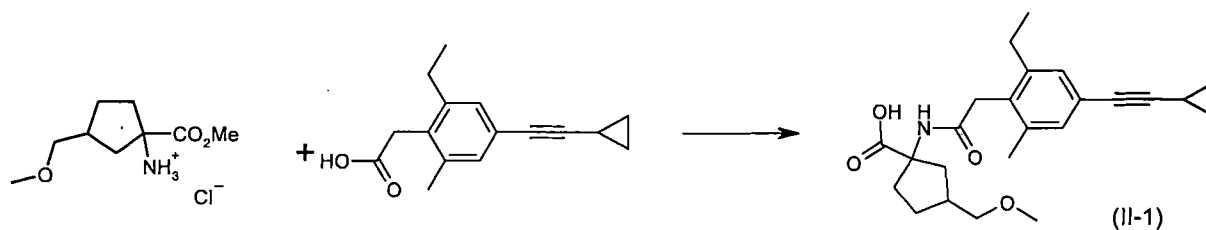
表 2 :

實例 編號	n	m	R <sup>3</sup>	X	Y	R <sup>1</sup>	L	備註
la-1	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH 3	Me	Et	環丙基	-COOEt	反式
la-2	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH 3	Me	Me	環丙基	-COOEt	Nd
la-3	2	2	-CH <sub>2</sub> OCH 3	Me	Et	Me	-COCH(CH <sub>3</sub> ) 2	反式
la-4	2	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> -	Me	Et	Me	-COCH(CH <sub>3</sub> ) 2	Nd
la-5	2	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> -	Et	Et	Me	-COCH(CH <sub>3</sub> ) 2	Nd
la-6	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH 3	Me	Et	Me	-COCH(CH <sub>3</sub> ) 2	反式
la-7	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH 3	Me	Et	Me	-COCH(CH <sub>3</sub> ) 2	順式
la-8	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH 3	Me	Et	Me	-COCH(CH <sub>3</sub> ) 2	反式
la-9	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH 3	Me	Et	Me	-COCH(CH <sub>3</sub> ) 2	順式
la-1 0	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH 3	Me	Et	環丙基	-COCH(CH <sub>3</sub> ) 2	順式/ 反式 混合 物
la-1 1	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH 3	Me	Et	環丙基	-COCH(CH <sub>3</sub> ) 2	反式
la-1 2	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH 3	Me	Et	環丙基	-COCH(CH <sub>3</sub> ) 2	順式

la-1 3	2	2	-OCH <sub>2</sub> CH 2OCH <sub>3</sub>	Et	Et	Me	-COCH(CH <sub>3</sub> ) 2	Nd
la-1 4	2	2	-OCH <sub>2</sub> CH 2OCH <sub>3</sub>	Me	Et	Me	-COOEt	Nd
la-1 5	1	2	-OCH <sub>2</sub> CH 2OCH <sub>3</sub>	Et	Me	Me	-COOEt	Nd
la-1 6	1	2	-CH <sub>2</sub> OCH 3	Me	Et	Me	-SO <sub>2</sub> Me	Nd
la-1 7	2	2	-CH <sub>2</sub> OCH 3	Me	Et	Me	-COOEt	m.p. 197° C

## B. 製備實例(起始物質)

### 實例 II-1



將 1.10 g(4.5 mmol) 4-環丙基乙炔基-2-乙基-6-甲基苯基乙酸溶解在 20 ml 二氯甲烷中並且與一滴 DMF 混合。添加 0.75 g(1.3 eq)草醯氯並將混合物加熱迴流至沸騰直到氣體停止冒出。然後，將反應溶液濃縮，在每一情形中與 20ml 二氯甲烷混合兩次以上並且再次濃縮，以便最終將殘留物溶於 4 ml 二氯甲烷(溶液 1)中。將 1.015 (4.5 mmol) 3-甲氧基甲基環戊烷胺基酸甲酯鹽酸鹽和 1 g 三乙胺溶解在 20 ml 二氯甲烷中並滴加溶液 1 經 90 min 的時間。攪拌 18 h 之後，將混合物與 50 ml 水混合，把有機相分出，予以濃縮並且用管柱層析術純化(矽膠梯度 EtOAc/正庚烷)。這樣產生 1.16 g

(62%)所需的標靶化合物。

相似於實例 II-1 且根據生產相關的細節，得到以下式(II)的化合物：

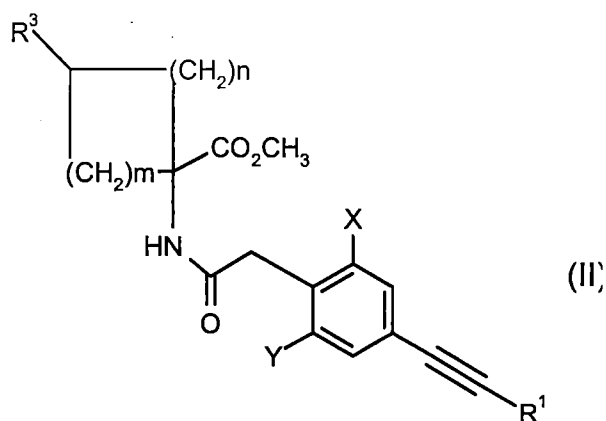
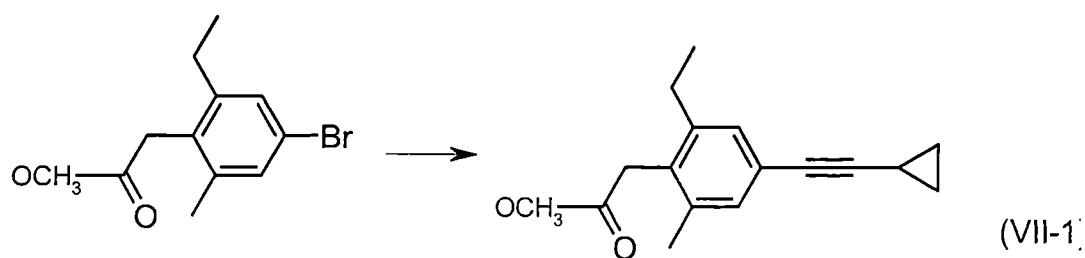


表 3：

實例編號	n	m	R <sup>3</sup>	X	Y	R <sup>1</sup>	物理數據
II-2	2	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	Me	Et	Me	<sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): 3.70 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ), 3.44 (pseudo t, 2H, CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub> ), 2.05 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -C≡C)
II-3	2	1	-CH <sub>2</sub> OMe	Me	Et	Me	<sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): 3.70 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ), 3.07 (d, 2H, CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub> ), 2.05 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -C≡C)
II-4	2	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	Et	Et	Me	<sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): 3.67 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ), 3.34 (pseudo t, 2H, CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub> ), 2.07 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -C≡C)

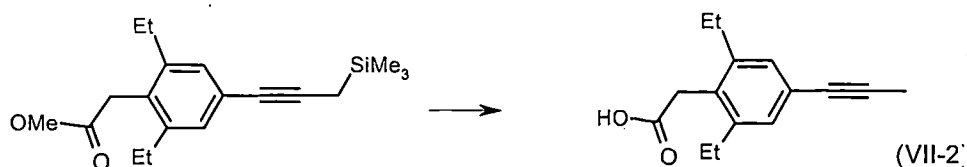
## 實例 (VII-1)



最初將 8.41 g(32.7 mmol)文獻已知的 4-溴-2,6 二甲基苯基乙酸甲酯添加 0.1 mol%二氯雙三苯基鈀氯化物溶於 45 ml 三乙胺和 18 ml 吡啶 的混合物並且添加 4.11 g (1.9 eq) 環丙基乙炔。將混合物加熱迴流至沸騰經 7.5 h 然後在室溫下攪拌至隔夜。將所得到的鹽過濾出來並且在每一情形中用三乙胺和二乙醚沖洗兩次。將母液減壓濃縮，先與水混合然後與 32 ml 之濃度 3%的鹽酸溶液混合。然後，用乙酸乙酯進行萃取並將此有機相用水沖洗兩次。使有機相乾燥之後，進行濃縮並且將所得到的殘留物用管柱層析法純化(矽膠，正庚烷/乙酸乙酯)。這樣產生出 6.83 g (86%)所需化合物。

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 7.07 (s, 2H, Ar-H), 3.67 (s, 5H,  $\text{OCH}_3$  and  $\text{CH}_2\text{-Ar}$ ), 2.26 (s, 3H, Ar- $\text{CH}_3$ ), 1.42 (s, 1H, CH-c-Pr)

## 實例 (VII-2)



將 7.5 g(24.8 mmol)2,6-二乙基-4-三甲基矽丙炔基苯基乙酸甲酯溶解在 200 ml 乙醇中並且與 4 當量氫氧化鉀溶於

200 ml 乙醇的溶液混合。將混合物迴流加熱至沸騰經 7 h，把溶液移除並添加 500 ml 水。然後用鹽酸建立其 pH 值為 1 並在每一情中將混合物用 100 ml 乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機項用硫酸鈉乾燥、濃縮並且用管柱層析術純化(矽膠，EtOAc/正庚烷梯度)。由此產生 4.3 g 根據本發明的化合物 (VII-2)。

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 7.09 和 7.07 每一者(s, 1H, Ar-H), 3.70 (s, 2H,  $\text{CH}_2\text{-Ar}$ ), 2.62 (q, 2H, Ar- $\text{CH}_2$ ), 2.29 (s, 3H, Ar- $\text{CH}_3$ ), 2.03 (s, 3H,  $\text{CH}_3\text{-C}\equiv\text{C}$ ), 1.18 (t, 3H,  $\text{CH}_3\text{-CH}_2\text{-Ar}$ )

以下化合物係以相似的方式獲得

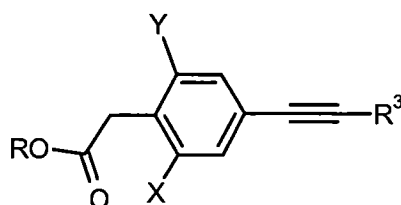


表 4:

實例編號	R	X	Y	R <sup>3</sup>	物理數據
VII-3	Me	Et	Et	$-\text{CH}_2\text{SiMe}_3$	$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, $\text{CDCl}_3$ ): 7.07 (s, 2H, Ar-H), 3.70 (s, 2H, $\text{CH}_2\text{-Ar}$ ), 3.64 (s, 3H, $\text{OCH}_3$ ), 2.59 (q, 2H, $\text{CH}_2\text{-Ar}$ ), 0.16 (s, 9H, $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ )
VII-4	Me	Me	Et	$-\text{CH}_2\text{SiMe}_3$	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{CDCl}_3$ ): 3.68 (s, 2H, $\text{CH}_2\text{-Ar}$ ), 3.66 (s, 3H, $\text{OCH}_3$ ), 2.62 (q, 2H, $\text{CH}_2\text{-Ar}$ ), 0.16 (s, 9H, $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ )

					Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
VII -5	Me	Me	Me	-CH <sub>2</sub> SiMe <sub>3</sub>	Oil
VII -6	Me	Me	Et	Me	<sup>1</sup> H-NMR (300 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) : 3.66 (s, 2H, CH <sub>2</sub> -Ar), 3.64 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ), 2.01 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -C≡C)
VII -7	Me	Et	Et	Me	Oil
VII -8	Me	Me	Me	Me	<sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) : 3.68(s, 3H, OCH <sub>3</sub> ), 3.67 (s, 2H, CH <sub>2</sub> -Ar), 2.03 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -C≡C)
VII -9	Me	Me	Cl	Me	<sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) : 3.81(s, 2H, CH <sub>2</sub> -Ar), 3.67 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ), 2.03 (s, 3H, CH <sub>3</sub> -C≡C)
VII-1 0	Me	Me	Et	-CH <sub>2</sub> -C-(OH) (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) : 3.78(s, 2H, CH <sub>2</sub> -Ar), 3.75 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ), 1.63 (s, 6H, (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )
VII-1 1	Me	Me	Cl	-CH <sub>2</sub> -C-(OH) (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) : 3.85(s, 2H, CH <sub>2</sub> -Ar), 3.68 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ), 1.60 (s, 6H, (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )
VII-1 2	Me	Me	Me	-CH <sub>2</sub> -C-(OH) (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) : 3.67 (s, 5H, OCH <sub>3</sub> and CH <sub>2</sub> -Ar), 1.60

					(s, 6H, (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )
VII-1 3	H	Et	Et	Me	<sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): 7.12 (s, 2H, Ar-H), 3.72 (s, 2H CH <sub>2</sub> -Ar), 2.62 (q, 2H, CH <sub>2</sub> -Ar), 2.03 (s, 3H, Ar-C≡C-CH <sub>3</sub> )
VII-1 4	H	Me	Me	Me	<sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): 7.05 (s, 2H, Ar-H), 3.70 (s, 2H, CH <sub>2</sub> -Ar), 3.66 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ), 2.01 (s, 3H, Ar-C≡C-CH <sub>3</sub> ),
VII-1 5	H	Me	Et	環丙基	<sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): 7.03 (s, 2H, Ar-H), 3.60 (s, 2H, CH <sub>2</sub> -Ar), 1.51 (s, 1H, CH-c-Pr)
VII-1 6	H	Me	Me	環丙基	<sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): 7.03 (s, 2H, Ar-H), 3.57 (s, 2H, CH <sub>2</sub> -Ar), 1.51 (s, 1H, CH-c-Pr)

經挑選實例的 NMR 數據

NMR 尖峰列表的方法

經挑選實例的 <sup>1</sup>H NMR 數據係以 <sup>1</sup>H NMR 尖峰列表的形式陳述。對於每一信號尖峰而言，在圓形括弧中首先是以 ppm 為單位表示的 δ 值然後是信號的強度被列出。不同信號尖峰之成對的 δ 值-信號強度數字係以分號彼此分開列示。

因此一項實例的尖峰列表具有以下形式：

$\delta_1$  (強度 1) ;  $\delta_2$  (強度 2) ; ..... ;  $\delta_i$  (強度 i) ; ..... ;  $\delta_n$  (強度 n)

銳利的信號之強度與印出之 NMR 光譜實例中以 cm 為單位的信號高度相關聯並且顯示真正的信號強度比率。在寬扁信號的情形中，數個尖峰或該間的中間及其相對強度可能被顯示出來與該光譜中最強的信號做比較。

為了校正  $^1\text{H-NMR}$  光譜的化學偏移，吾人使用四甲基矽和/或尤其是在 DMSO 中測量光譜的情形下之溶劑的化學偏移。因此，四甲基矽尖峰並不一定要出現在 NMR 尖峰列表中。

$^1\text{H}$  NMR 的尖峰列表相似於傳統的  $^1\text{H-NMR}$  印出光譜，因此通常包含所有列在傳統 NMR 解讀內容中的尖峰。

此外，就像傳統的  $^1\text{H}$  NMR 印出光譜，其可顯示溶劑信號、同樣構成本發明之主題要件之部分的目標化合物之立體異構物信號，以及/或是雜質的尖峰。

在吾人的  $^1\text{H}$  NMR 尖峰列表中陳述溶劑和或水的 $\delta$ 範圍中之化合物信號時，常見的溶劑尖峰，例如 DMSO- $\text{D}_6$  中的 DMSO 尖峰和水的尖峰都被顯示出來，通常具有平均說來之高強度。

目標化合物之立體異構物尖峰和/或雜質尖峰通常具有平均而言比目標化合物的尖峰(例如純度 > 90%)較低的強度。

此種立體異構物和/或雜質對於特別的製備法而言是典型的。因而在此情形中其尖峰可以參考「副產物指紋」以幫助鑑認吾人之製備法的複現性。

藉由已知方法(MestreC、ACD 模擬，但亦使用實驗評估出來的期望值)計算目標化合物尖峰的專家若需要可以分離出目標化合物的尖峰，是需要利用另外的強度濾器來進行。此種分離法相似於在傳統的  $^1\text{H-NMR}$  解讀內容中之挑選相

關尖峰。

更多  $^1\text{H}$  NMR 尖峰列表的細節見於 Research Disclosure Database 第 564025 號。

實例 Ia-7 :  $^1\text{H}$ -NMR ( MHz,  $\text{CDCl}_3$  ) :  $\delta$ =  
 7.261(50.0);7.101(5.5);7.084(5.2);6.877(1.5);6.851(1.5);3.644(1.0);3.456(1.0);  
 3.447(1.8);3.438(1.1);3.434(1.7);3.425(3.2);3.416(1.9);3.406(25.1);3.403(24.7);  
 3.375(2.7);3.366(2.6);3.352(1.8);3.348(2.8);3.343(1.7);3.338(2.3);3.324(0.4);  
 3.146(1.8);2.981(1.5);2.573(0.3);2.565(0.3);2.554(1.0);2.548(1.6);2.535(1.8);  
 2.530(3.7);2.517(2.9);2.513(4.8);2.496(4.6);2.478(2.9);2.471(2.1);2.465(2.3);  
 2.452(2.0);2.446(2.1);2.434(1.2);2.428(1.2);2.415(0.6);2.409(0.6);2.371(1.3);  
 2.344(1.0);2.337(1.5);2.314(1.3);2.310(1.1);2.287(1.0);2.280(1.4);2.253(1.0);  
 2.210(0.4);2.199(2.1);2.190(26.5);2.178(1.5);2.053(0.7);2.046(0.8);2.034(38.2);  
 2.017(1.0);2.011(1.5);2.004(2.0);1.987(2.9);1.969(1.2);1.962(1.3);1.953(0.5);  
 1.935(0.5);1.887(0.4);1.860(1.6);1.843(3.0);1.833(1.4);1.825(2.1);1.780(0.3);  
 1.705(1.3);1.701(1.3);1.696(1.4);1.692(1.3);1.667(1.2);1.662(1.2);1.658(1.2);  
 1.571(4.1);1.256(0.9);1.193(0.8);1.185(0.3);1.174(1.5);1.155(9.0);1.148(1.1);  
 1.136(17.5);1.129(1.6);1.118(8.0);1.110(0.7);1.014(1.2);1.012(1.2);0.996(12.7);  
 0.992(12.1);0.984(1.7);0.978(11.7);0.975(11.7);0.967(13.4);0.966(15.7);  
 0.950(12.3);0.948(14.3);0.008(0.9);0.000(32.2);-0.009(0.9)

實例 I-1 :  $^1\text{H}$ -NMR ( MHz,  $\text{CDCl}_3$  ) :  $\delta$ =  
 7.758(0.9);7.350(0.6);7.265(50.0);7.146(15.1);7.127(0.4);7.070(0.3);6.407(1.1);  
 4.727(1.0);3.444(2.5);3.428(6.1);3.413(3.5);3.395(1.5);3.379(0.7);3.323(0.9);  
 3.310(36.6);3.287(6.8);2.879(7.4);2.785(6.2);2.516(0.6);2.496(1.1);2.478(1.8);  
 2.460(4.1);2.445(4.4);2.442(4.4);2.436(1.6);2.427(4.3);2.417(1.3);2.409(2.0);  
 2.399(0.6);2.391(0.9);2.381(0.4);2.372(0.4);2.269(0.3);2.217(0.4);2.212(0.4);  
 2.063(0.7);2.049(28.3);2.039(1.9);2.023(0.7);1.999(0.7);1.985(1.3);1.975(1.3);  
 1.951(1.9);1.941(2.2);1.918(1.1);1.908(1.7);1.883(1.7);1.855(1.8);1.699(1.3);  
 1.646(0.4);1.630(0.6);1.615(0.5);1.580(2.3);1.543(4.0);1.527(4.1);1.512(2.0);  
 1.479(0.7);1.199(0.4);1.182(0.6);1.170(0.7);1.164(0.8);1.134(2.0);1.131(1.9);  
 1.116(2.4);1.113(2.3);1.103(15.7);1.092(2.1);1.084(32.7);1.065(14.5);0.008(0.6);  
 0.000(28.3);-0.008(0.9)

實例 Ia-13 :  $^1\text{H}$ -NMR ( MHz,  $\text{CDCl}_3$  ) :  $\delta$ =  
 7.264(22.2);7.141(18.0);5.298(18.0);4.031(3.7);4.013(12.5);3.995(12.6);3.977(3.8);  
 3.424(2.9);3.409(6.7);3.394(3.1);3.306(50.0);2.589(0.5);2.570(1.6);2.551(3.2);  
 2.532(5.5);2.521(1.9);2.513(5.3);2.502(5.2);2.495(2.0);2.484(5.6);2.465(3.1);  
 2.446(1.6);2.427(0.5);2.049(34.9);2.036(0.4);1.931(0.9);1.921(1.6);1.894(4.7);  
 1.863(3.3);1.682(2.7);1.651(4.7);1.521(2.8);1.509(4.8);1.499(2.9);1.197(0.7);  
 1.190(0.9);1.177(20.5);1.165(2.9);1.158(44.3);1.146(2.1);1.139(20.3);1.133(15.1);  
 1.124(1.3);1.115(27.9);1.106(1.1);1.097(13.0);1.083(0.4);1.038(0.6);0.901(1.1);  
 0.882(0.5);0.008(0.4);0.000(13.6);-0.009(0.4)

實例 Ia-5 :  $^1\text{H}$ -NMR ( MHz,  $\text{CDCl}_3$  ) :  $\delta$ =  
 7.266(0.4);7.265(0.6);7.262(45.3);7.258(0.9);7.256(0.5);7.255(0.4);7.126(13.8);  
 6.711(1.4);5.299(2.1);3.444(2.8);3.429(6.6);3.414(3.2);3.326(50.0);2.587(

0.4);2.568(1.4);2.549(2.7);2.534(1.6);2.531(4.7);2.517(4.3);2.512(4.6);2.500(7.0);2.493(1.9);2.482(4.3);2.480(4.9);2.465(1.5);2.461(2.7);2.447(0.3);2.442(1.4);2.424(0.5);2.046(29.5);1.919(1.6);1.887(1.7);1.838(0.9);1.828(0.7);1.804(2.3);1.795(1.9);1.771(1.6);1.761(1.3);1.691(2.5);1.659(1.5);1.594(16.1);1.592(14.8);1.554(0.6);1.539(2.6);1.524(3.9);1.510(2.4);1.498(0.9);1.486(0.8);1.460(0.4);1.181(0.5);1.169(17.2);1.163(2.1);1.150(38.2);1.137(2.4);1.131(17.5);1.120(0.8);1.110(1.1);1.103(1.2);1.077(0.5);1.038(0.9);1.025(0.4);1.010(0.4);0.999(0.6);0.993(0.5);0.978(45.5);0.961(45.0);0.901(0.5);0.008(0.7);0.000(24.5);-0.009(0.7)

實例 I-9 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $d_6$ -DMSO) :  $\delta$ =  
10.713(0.9);7.069(0.5);7.057(0.6);3.339(0.4);3.315(50.0);3.251(4.2);3.246(0.7);2.510(6.2);2.505(13.7);2.500(19.3);2.496(13.6);2.491(6.2);2.385(0.5);2.367(0.5);2.029(3.6);1.025(0.5);1.022(0.5);1.007(1.0);1.003(1.0);0.988(0.5);0.984(0.5)

實例 Ia-8 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$ =  
7.270(0.3);7.2696(0.4);7.269(0.4);7.268(0.5);7.267(0.7);7.266(1.0);7.263(50.0);7.258(0.5);7.127(4.7);7.103(4.7);6.999(0.3);6.583(2.2);4.131(0.5);4.113(0.5);4.037(2.6);4.028(0.3);4.019(8.7);4.001(9.3);3.983(3.1);3.403(0.7);3.401(1.0);3.393(0.7);3.385(0.7);3.377(0.9);3.370(2.3);3.362(2.3);3.354(2.7);3.348(29.4);3.342(30.6);3.334(2.5);3.328(2.9);3.322(0.9);3.311(0.7);3.306(0.7);2.548(0.5);2.537(0.8);2.529(1.0);2.518(1.6);2.511(1.8);2.499(2.4);2.492(2.1);2.481(2.2);2.475(2.2);2.465(1.6);2.456(1.8);2.446(1.4);2.438(0.9);2.428(0.8);2.419(0.5);2.409(0.4);2.303(0.5);2.284(0.6);2.279(0.7);2.270(0.6);2.260(0.7);2.251(0.8);2.245(1.0);2.239(0.6);2.227(0.9);2.220(0.7);2.211(0.8);2.205(0.9);2.191(12.4);2.182(13.6);2.054(0.9);2.046(3.5);2.041(35.7);2.021(0.9);2.013(1.3);2.008(0.5);2.001(1.4);1.993(0.7);1.980(1.3);1.956(2.3);1.933(3.4);1.926(2.4);1.917(1.2);1.901(1.8);1.893(0.5);1.867(0.6);1.862(0.9);1.849(1.1);1.829(1.5);1.816(0.9);1.796(0.6);1.677(0.4);1.663(0.7);1.658(0.5);1.652(0.5);1.644(0.9);1.639(0.8);1.631(1.0);1.625(0.8);1.620(1.2);1.608(13.3);1.588(0.6);1.278(0.7);1.260(1.5);1.242(0.7);1.163(5.8);1.157(5.3);1.144(13.0);1.139(11.5);1.126(13.3);1.120(5.4);1.109(22.0);1.091(10.3);0.008(0.8);0.000(27.5);-0.009(0.7)

實例 Ia-9 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$ =  
7.270(0.3);7.269(0.4);7.2684(0.4);7.2676(0.5);7.267(0.7);7.266(1.0);7.263(50.0);7.259(1.5);7.258(0.5);7.257(0.3);7.125(3.8);7.101(3.8);6.999(0.3);6.920(1.3);6.909(1.3);4.131(0.5);4.113(0.5);4.035(1.7);4.021(1.1);4.017(5.5);4.015(3.5);4.003(1.2);3.999(5.6);3.985(0.5);3.982(1.8);3.461(0.8);3.458(0.9);3.453(0.9);3.449(0.8);3.438(1.4);3.435(1.5);3.430(1.5);3.427(1.4);3.410(23.2);3.408(23.1);3.381(2.1);3.373(2.2);3.355(3.8);3.349(3.7);2.555(0.7);2.537(1.3);2.518(2.3);2.499(2.5);2.479(1.9);2.474(1.4);2.460(1.2);2.455(1.3);2.449(1.2);2.442(0.7);2.436(0.8);2.422(0.9);2.416(1.4);2.406(1.1);2.388(0.7);2.378(0.7);2.372(1.1);2.344(0.7);2.218(0.3);2.196(19.0);2.182(1.3);2.139(0.6);2.118(0.9);2.103(0.4);2.094(0.8);2.073(1.0);2.058(0.7);2.046(3.6);2.039(29.0);2.016(0.6);2.008(1.0);2.002(0.8);1.987(0.4);1.981(0.5);1.963(0.3);1.940(0.4);1.877(1.0);1.859(1.0);1.847(1.9);1.829(1.8);1.812(0.7);1.713(0.5);1.706(0.9);1.701(1.0);1.679(0.6);1.673(0.9);1.666(0.9);1.585(12.2);1.321(0.6);1.303(1.3);

1.290(1.5);1.286(1.6);1.278(2.4);1.264(5.9);1.260(6.0);1.242(1.5);1.174(0.3);1.164(7.9);1.158(1.0);1.145(17.2);1.139(2.0);1.132(6.1);1.130(6.7);1.126(8.2);1.120(1.2);1.114(12.2);1.112(12.7);1.096(5.7);1.094(5.8);0.899(3.4);0.882(12.6);0.864(4.7);0.008(0.8);0.000(28.7);-0.008(0.8)

實例 I-10 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $d_6$ -DMSO) :  $\delta$ =

10.693(0.5);7.068(0.5);7.057(0.5);3.326(50.0);3.295(0.4);3.283(0.4);3.278(0.4);3.246(4.0);2.510(4.1);2.505(9.0);2.501(12.7);2.496(9.0);2.491(4.1);2.370(0.3);2.035(1.3);2.029(3.5);1.024(0.4);1.020(0.4);1.005(1.0);1.001(0.9);0.986(0.4);0.983(0.4)

實例 I-12 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $d_6$ -DMSO) :  $\delta$ =

10.728(1.0);8.135(1.3);7.736(0.9);7.411(1.5);7.046(6.0);7.029(6.0);4.175(0.4);4.157(1.1);4.140(1.1);4.122(0.4);3.465(15.7);3.422(0.7);3.359(1.0);3.342(1.4);3.336(3.5);3.320(4.2);3.305(3.4);3.293(0.7);3.282(1.3);3.263(0.9);3.249(39.5);3.244(7.7);3.125(0.5);2.835(0.5);2.523(0.7);2.510(16.7);2.505(36.2);2.501(50.0);2.496(35.7);2.492(16.2);2.395(1.9);2.375(11.0);2.358(5.9);2.339(2.6);2.323(0.7);2.224(1.0);2.212(1.0);2.201(0.9);2.190(1.6);2.178(1.2);2.167(0.8);2.155(0.8);2.090(0.6);2.074(0.5);2.064(0.6);2.054(0.7);2.046(0.8);2.023(21.6);2.006(1.6);1.995(0.7);1.987(0.7);1.978(0.6);1.910(0.7);1.897(0.9);1.892(1.0);1.880(1.1);1.867(1.1);1.862(1.1);1.849(0.5);1.801(0.3);1.654(1.0);1.637(1.1);1.623(0.9);1.588(0.8);1.558(1.7);1.545(2.3);1.537(2.7);1.533(1.8);1.524(3.6);1.516(1.7);1.512(2.3);1.504(2.1);1.491(1.9);1.470(1.1);1.455(1.0);1.437(0.9);1.262(1.2);1.245(2.4);1.227(1.1);1.059(0.4);1.016(4.9);1.013(5.1);0.998(10.3);0.994(10.5);0.979(4.8);0.975(4.7);0.896(1.8);0.885(4.7);0.879(6.0);0.870(2.7);0.865(4.8);0.858(5.5);0.849(2.2);0.833(0.3);0.725(2.2);0.716(6.0);0.713(3.5);0.710(5.3);0.704(5.8);0.697(5.5);0.687(1.6);0.008(0.4);0.000(15.1);-0.009(0.5)

實例 Ia-12 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$ =

7.263(50.0);7.112(6.7);7.090(6.5);6.981(0.3);6.518(2.7);4.033(3.0);4.015(9.5);3.998(9.8);3.980(3.2);3.420(0.3);3.400(5.5);3.392(0.8);3.383(0.8);3.375(1.4);3.368(2.9);3.360(2.6);3.347(25.6);3.341(26.0);3.333(2.8);3.327(3.1);3.321(0.9);3.310(0.8);3.304(0.7);2.537(0.9);2.526(1.1);2.518(1.7);2.508(2.1);2.500(2.5);2.489(3.0);2.482(2.7);2.470(2.8);2.464(2.3);2.454(2.1);2.445(1.9);2.436(1.8);2.427(1.2);2.417(1.0);2.408(0.8);2.398(0.7);2.380(0.3);2.299(0.5);2.279(0.7);2.275(0.7);2.265(0.7);2.256(0.9);2.246(0.9);2.240(1.2);2.223(1.1);2.215(0.9);2.206(0.9);2.201(0.9);2.180(15.1);2.170(14.7);2.156(0.7);2.111(0.3);2.066(0.3);2.050(0.7);2.030(1.6);2.017(1.0);2.009(1.6);1.997(1.8);1.976(1.6);1.951(2.7);1.928(4.3);1.921(2.8);1.912(1.5);1.896(2.0);1.888(0.5);1.857(1.2);1.844(1.6);1.823(2.0);1.810(1.1);1.790(0.8);1.675(0.5);1.661(0.9);1.643(1.1);1.638(0.9);1.629(1.1);1.618(1.2);1.605(1.2);1.591(7.3);1.471(0.8);1.458(1.7);1.451(1.8);1.446(1.1);1.438(2.9);1.425(1.9);1.417(1.9);1.405(1.0);1.254(0.6);1.156(6.3);1.150(5.4);1.137(14.3);1.132(20.5);1.115(24.6);1.097(10.8);0.881(1.7);0.875(1.4);0.868(3.6);0.861(6.1);0.854(3.7);0.847(3.7);0.841(6.0);0.833(3.1);0.827(1.5);0.821(1.2);0.809(3.1);0.800(6.1);0.795(5.9);0.787(6.0);0.782(5.1);0.773(1.1);0.769(1.3);0.008(0.7);0.000(25.7);-0.008(0.8)

實例 I-11 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $d_6$ -DMSO) :  $\delta$ =

10.699(2.1);7.918(1.5);7.046(6.7);7.029(7.0);3.398(23.7);3.336(0.8);3.316(1.

0);3.305(0.8);3.292(3.2);3.280(4.1);3.276(3.7);3.263(3.9);3.258(1.8);3.248(9.0);3.244(42.4);2.533(0.4);2.523(0.7);2.509(16.9);2.505(36.1);2.501(50.0);2.496(36.3);2.492(17.2);2.452(0.6);2.397(1.4);2.379(3.9);2.361(4.1);2.339(1.6);2.327(0.5);2.188(0.3);2.146(0.4);2.136(0.5);2.122(0.7);2.114(1.1);2.103(1.1);2.093(1.2);2.084(1.0);2.073(0.8);2.061(0.8);2.026(15.4);2.022(16.9);1.980(0.5);1.960(1.1);1.949(0.7);1.940(1.2);1.929(1.3);1.909(1.2);1.890(0.5);1.831(1.0);1.825(0.9);1.799(2.1);1.793(1.3);1.773(1.3);1.767(1.1);1.653(1.0);1.636(1.6);1.620(1.5);1.602(1.7);1.588(1.3);1.569(1.3);1.558(1.7);1.545(2.4);1.537(2.3);1.533(1.6);1.524(3.7);1.516(1.2);1.512(2.1);1.504(2.2);1.491(1.4);1.482(0.9);1.476(0.9);1.469(1.2);1.457(1.2);1.446(1.1);1.438(0.8);1.415(0.4);1.016(5.6);1.012(5.3);0.997(11.8);0.993(11.0);0.978(5.5);0.974(4.9);0.896(2.0);0.886(5.2);0.879(6.6);0.870(2.9);0.865(5.2);0.858(5.9);0.849(2.3);0.833(0.4);0.813(0.3);0.726(2.4);0.717(6.5);0.710(5.8);0.704(6.2);0.698(5.9);0.687(1.8);0.008(0.6);0.000(19.1);-0.008(0.6)

實例 Ia-11 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$ =

7.969(1.5);7.283(2.0);7.272(0.3);7.271(0.4);7.270(0.5);7.269(0.7);7.267(5.3);7.266(4.9);7.264(48.0);7.263(50.0);7.2585(1.0);7.2576(0.7);7.257(0.6);7.256(0.4);7.254(0.3);7.111(8.0);7.089(8.2);6.920(2.7);6.907(2.7);6.231(0.7);4.246(0.4);4.229(1.3);4.211(1.3);4.193(0.5);4.031(3.1);4.014(9.8);3.996(10.1);3.978(3.4);3.639(0.4);3.454(1.5);3.450(1.7);3.432(2.8);3.427(2.7);3.407(43.9);3.379(4.0);3.370(4.2);3.354(5.4);3.353(5.4);3.348(5.7);3.142(0.7);2.980(0.6);2.565(0.4);2.546(1.4);2.527(2.8);2.509(4.8);2.490(5.2);2.470(3.6);2.464(2.6);2.451(2.5);2.445(4.0);2.433(1.7);2.423(8.3);2.422(8.5);2.411(2.6);2.401(2.0);2.383(1.3);2.373(1.2);2.367(1.9);2.340(1.3);2.232(0.4);2.212(0.5);2.185(34.6);2.171(2.9);2.134(1.2);2.113(1.6);2.097(0.7);2.089(1.4);2.068(1.9);2.052(1.0);2.027(2.1);2.005(1.5);1.999(1.5);1.985(0.9);1.979(0.9);1.957(0.7);1.934(0.8);1.901(0.5);1.891(0.5);1.873(1.7);1.855(1.9);1.843(3.9);1.825(3.6);1.808(1.4);1.696(2.0);1.665(1.9);1.586(15.8);1.471(0.9);1.458(1.9);1.450(2.0);1.445(1.2);1.437(3.4);1.425(2.2);1.417(2.2);1.404(1.2);1.341(1.4);1.323(2.7);1.305(1.3);1.259(0.3);1.186(0.4);1.158(11.7);1.139(30.8);1.119(33.8);1.101(11.5);1.083(0.4);0.878(1.5);0.872(1.4);0.865(4.1);0.859(7.3);0.852(3.6);0.844(4.6);0.839(6.5);0.830(3.2);0.826(1.7);0.818(1.3);0.807(3.3);0.799(8.3);0.794(6.8);0.787(7.5);0.781(5.3);0.771(1.4);0.768(1.5);0.008(0.7);0.001(25.5);0.000(27.0);-0.007(0.8)

實例 Ia-1 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$ =

7.269(0.3);7.2684(0.3);7.2676(0.4);7.267(0.6);7.266(0.8);7.262(50.0);7.109(4.9);7.087(4.8);6.491(2.1);4.025(2.8);4.007(9.1);3.989(9.2);3.972(2.9);3.381(0.6);3.350(45.3);3.332(9.5);3.230(0.5);3.214(0.5);2.542(0.8);2.523(1.4);2.505(2.3);2.485(2.7);2.466(2.7);2.446(2.5);2.428(1.5);2.409(0.8);2.186(22.5);2.159(0.4);2.060(0.8);2.039(1.5);2.019(2.1);1.999(1.1);1.904(1.1);1.781(0.8);1.770(0.7);1.757(1.7);1.747(2.0);1.736(2.1);1.725(2.1);1.719(1.9);1.708(1.4);1.692(1.0);1.678(1.2);1.660(3.4);1.634(2.9);1.616(1.2);1.575(9.9);1.470(0.7);1.458(1.4);1.450(1.5);1.445(0.9);1.437(2.4);1.431(0.8);1.424(1.5);1.417(1.6);1.404(0.9);1.254(1.4);1.187(0.3);1.158(8.1);1.139(17.2);1.119(13.9);1.101(19.6);1.083(9.2);0.881(1.5);0.875(1.2);0.868(2.9);0.861(4.9);0.854(2.8);0.847(3.1);0.841(4.8);0.833(2.5);0.827(1.2);0.820(1.0);0.808(2.6);0.800(4.6);0.

795(4.5);0.788(4.7);0.782(4.1);0.773(0.9);0.769(1.1);0.008(0.9);0.004(0.3);0.000(32.8);-0.005(0.8);-0.0056(0.6);-0.0065(0.5);-0.008(1.1)

實例 I-7 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$ =

8.015(0.6);7.520(0.3);7.372(2.6);7.261(50.0);7.190(0.5);7.110(5.1);7.095(5.2);7.033(0.3);6.296(1.3);3.887(0.9);3.670(0.5);3.623(0.4);3.343(31.5);3.331(7.2);3.326(2.4);3.309(0.3);3.249(6.3);3.233(6.6);3.192(0.5);3.115(0.4);2.931(0.3);2.883(19.6);2.845(1.6);2.790(17.4);2.758(0.6);2.649(0.4);2.630(0.4);2.493(0.4);2.475(1.0);2.463(1.1);2.457(2.4);2.445(2.7);2.438(2.6);2.426(2.8);2.419(1.1);2.408(1.2);2.397(0.3);2.390(0.4);2.301(0.4);2.288(0.9);2.226(0.4);2.167(0.6);2.157(0.4);2.129(0.4);2.107(21.4);2.035(0.5);1.982(1.4);1.966(1.4);1.938(2.6);1.923(2.3);1.896(2.0);1.773(0.5);1.735(0.8);1.724(0.7);1.652(0.8);1.644(1.0);1.636(0.9);1.614(2.7);1.587(1.9);1.468(0.8);1.455(1.6);1.449(3.1);1.443(1.2);1.435(2.9);1.428(1.1);1.422(1.8);1.414(1.8);1.402(0.9);1.255(0.9);1.237(0.3);1.225(0.4);1.210(0.5);1.193(1.1);1.182(2.3);1.174(1.2);1.153(2.0);1.122(1.7);1.109(1.0);1.098(8.4);1.090(1.8);1.079(17.4);1.060(7.8);0.887(1.3);0.874(3.1);0.868(4.9);0.859(3.4);0.854(3.4);0.847(4.2);0.839(2.5);0.821(1.0);0.805(1.1);0.800(2.4);0.791(4.7);0.786(4.5);0.779(4.9);0.773(4.5);0.768(1.7);0.760(1.2);0.008(0.7);0.000(29.2);-0.008(1.0)

實例 Ia-6 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$ =

7.261(50.0);7.104(7.2);7.086(7.4);6.630(2.5);3.398(1.2);3.395(1.3);3.373(0.8);3.357(1.1);3.350(3.2);3.340(37.2);3.330(38.8);3.321(4.1);3.315(5.2);3.298(0.9);3.291(0.4);2.561(1.6);2.548(0.9);2.543(4.2);2.537(1.3);2.526(6.1);2.518(2.3);2.508(5.7);2.500(3.2);2.491(4.5);2.481(3.1);2.471(2.8);2.460(2.6);2.452(2.4);2.441(2.2);2.433(1.4);2.423(1.3);2.415(0.8);2.404(0.7);2.227(0.7);2.207(1.1);2.204(1.1);2.187(20.0);2.179(19.1);2.151(1.8);2.142(0.8);2.132(1.0);2.122(1.2);2.099(1.1);2.036(48.2);2.020(1.9);2.001(1.5);1.987(1.9);1.967(1.7);1.947(1.3);1.930(2.4);1.920(3.6);1.914(2.5);1.896(3.5);1.887(0.7);1.864(2.5);1.847(1.1);1.839(2.8);1.830(2.4);1.820(1.3);1.815(1.6);1.805(1.7);1.797(1.1);1.782(0.7);1.651(0.5);1.638(0.5);1.628(1.1);1.615(1.1);1.610(1.1);1.605(1.1);1.590(5.4);1.577(1.1);1.564(0.8);1.554(0.5);1.541(0.4);1.258(0.8);1.244(0.3);1.154(7.0);1.148(7.2);1.135(15.4);1.129(15.5);1.116(6.9);1.110(6.8);1.012(17.4);1.010(19.4);0.995(17.9);0.992(19.8);0.987(16.8);0.982(16.6);0.970(15.6);0.964(16.4);0.948(0.8);0.008(0.8);0.000(33.3);-0.002(12.6);-0.008(0.9)

實例 Ia-16 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$ =

7.267(0.3);7.2666(0.5);7.262(37.0);7.256(0.4);7.212(2.5);7.174(7.3);7.149(7.2);7.068(0.7);7.016(0.4);4.054(0.4);4.037(0.7);4.021(0.4);3.615(0.6);3.388(2.7);3.370(2.8);3.352(14.9);3.327(1.9);3.315(50.0);3.220(9.3);3.205(9.5);2.859(1.1);2.777(0.6);2.598(0.3);2.579(1.0);2.561(2.1);2.542(3.7);2.530(1.3);2.523(3.6);2.511(3.6);2.504(1.4);2.493(3.8);2.474(2.2);2.462(0.4);2.455(1.3);2.440(43.2);2.422(12.1);2.378(0.3);2.323(0.3);2.263(0.3);2.241(0.6);2.222(34.1);2.115(0.4);2.101(0.5);2.088(0.7);2.063(2.3);2.044(48.1);2.022(1.2);2.009(1.3);1.999(1.9);1.976(2.7);1.965(5.5);1.951(2.9);1.940(4.0);1.929(3.1);1.915(3.0);1.878(0.6);1.867(0.5);1.830(0.6);1.818(0.6);1.748(0.6);1.737(0.8);1.706(2.3);1.700(2.3);1.690(2.0);1.673(3.6);1.652(1.8);1.644(2.1);1.622(2.1);1.588(0.7);1.570(0.6);1.555(0.5);1.448(0.3);1.430(0.3);1.252(1.0);1.240(0.9);1.

207(2.2);1.191(13.5);1.172(29.8);1.153(12.9);1.089(0.4);1.076(0.4);1.070(1.0);1.051(1.0);1.032(0.4);0.983(0.8);0.965(1.5);0.946(0.6);0.008(0.6);0.000(2.0);-0.008(0.6)

實例 Ia-10 :  $^1\text{H-NMR}$  ( MHz,  $\text{CDCl}_3$  ) :  $\delta$ =  
 7.262(50.0);7.205(1.0);7.070(18.7);6.916(3.0);6.371(1.5);4.055(0.6);4.051(0.7);4.037(0.6);4.033(0.9);4.029(2.2);4.026(3.5);4.011(6.9);4.008(10.9);3.994(7.0);3.990(11.0);3.976(2.3);3.972(3.6);3.450(1.7);3.442(1.8);3.428(3.3);3.419(3.1);3.406(4.0);3.402(43.0);3.389(1.0);3.378(3.4);3.370(3.8);3.367(3.0);3.356(2.5);3.345(28.5);3.333(2.5);3.327(0.9);3.310(0.8);2.529(0.6);2.511(1.4);2.501(1.1);2.491(1.6);2.485(1.1);2.472(1.3);2.455(0.4);2.423(2.7);2.395(1.7);2.389(2.9);2.362(1.8);2.285(0.6);2.266(0.8);2.261(0.8);2.252(0.7);2.242(0.8);2.233(1.1);2.228(0.9);2.209(0.9);2.193(3.2);2.184(1.7);2.170(28.2);2.166(41.9);2.157(16.1);2.129(0.5);2.112(1.9);2.091(2.5);2.070(0.6);2.051(1.8);2.029(1.8);2.018(1.4);2.009(1.7);2.001(2.0);1.990(0.6);1.979(1.3);1.957(0.5);1.939(4.2);1.917(3.7);1.883(0.6);1.866(1.5);1.855(1.4);1.842(3.2);1.836(2.8);1.830(1.5);1.821(3.8);1.801(1.5);1.789(0.5);1.702(1.3);1.698(1.4);1.694(1.4);1.676(0.6);1.669(1.3);1.664(1.6);1.644(0.7);1.634(0.6);1.625(0.5);1.620(0.7);1.611(0.5);1.606(0.4);1.601(0.5);1.587(10.7);1.460(1.0);1.447(2.0);1.439(2.1);1.434(1.3);1.426(3.7);1.420(1.2);1.414(2.2);1.406(2.4);1.393(1.2);1.264(0.8);1.154(0.8);1.134(12.9);1.116(24.5);1.114(16.6);1.098(11.4);1.096(8.0);0.899(0.4);0.882(1.4);0.874(1.0);0.871(1.5);0.862(2.4);0.853(5.5);0.847(2.6);0.844(3.5);0.841(2.4);0.837(4.0);0.834(4.0);0.831(5.0);0.827(2.1);0.823(2.7);0.813(1.5);0.810(1.0);0.794(3.6);0.786(6.2);0.781(5.7);0.774(7.1);0.768(5.2);0.760(1.2);0.755(1.3);0.008(0.7);0.000(29.1);-0.008(0.9)

實例 I-14 :  $^1\text{H-NMR}$  ( MHz,  $d_6$ -DMSO ) :  $\delta$ =  
 10.713(0.6);7.898(0.3);7.713(0.6);7.267(0.6);7.249(2.4);7.230(1.7);7.181(1.8);7.163(1.5);7.142(0.8);7.029(12.1);3.423(8.7);3.361(0.6);3.338(2.1);3.324(2.4);3.321(2.3);3.307(2.1);3.293(1.4);3.282(1.5);3.276(1.3);3.265(1.3);3.250(25.1);3.245(15.9);2.544(0.3);2.509(15.6);2.504(35.2);2.499(50.0);2.495(35.5);2.490(16.0);2.377(0.5);2.358(0.7);2.335(0.6);2.299(7.3);2.226(1.0);2.202(0.9);2.192(1.4);2.168(0.9);2.123(0.5);2.095(0.6);2.071(2.4);2.037(28.1);2.016(1.1);2.005(0.7);1.988(0.8);1.963(0.4);1.911(0.7);1.882(0.7);1.833(0.6);1.801(0.8);1.775(0.6);1.651(1.0);1.635(0.7);1.619(0.9);1.593(0.5);1.564(0.8);1.552(1.1);1.539(2.0);1.531(1.6);1.527(1.0);1.519(3.1);1.511(1.1);1.506(1.7);1.498(1.8);1.486(1.3);1.472(1.1);1.457(0.9);1.439(0.8);0.895(1.4);0.884(3.7);0.878(4.9);0.868(2.0);0.864(3.8);0.857(4.3);0.848(1.7);0.718(1.7);0.709(4.8);0.702(4.2);0.697(4.6);0.690(4.3);0.680(1.2);0.008(0.7);0.000(27.3);-0.009(0.8)

實例 I-8 :  $^1\text{H-NMR}$  ( MHz,  $d_6$ -DMSO ) :  $\delta$ =  
 10.635(5.0);10.594(1.4);8.044(2.8);7.948(0.7);7.268(0.7);7.249(2.0);7.230(1.8);7.181(2.0);7.163(1.6);7.142(0.9);7.124(0.3);7.026(13.8);6.979(0.3);3.362(1.3);3.343(1.6);3.320(49.2);3.259(8.3);3.235(28.7);3.165(4.9);3.149(5.1);2.509(16.1);2.504(35.7);2.500(50.0);2.495(35.5);2.490(16.1);2.299(7.7);2.280(0.6);2.210(0.7);2.076(2.5);2.044(42.1);1.898(1.3);1.874(2.0);1.840(1.2);1.716(1.5);1.686(1.7);1.551(1.4);1.539(2.0);1.530(2.1);1.526(1.5);1.518(3.4);1.506(1.9);1.498(1.8);1.485(1.0);1.396(2.0);1.358(2.3);1.324(1.8);1.294(1.6);1.2

61(0.5);0.894(1.6);0.883(4.0);0.877(5.2);0.868(2.4);0.863(4.2);0.856(4.6);0.847(1.9);0.718(1.9);0.709(5.2);0.703(4.6);0.697(5.0);0.690(4.7);0.680(1.5);0.008(0.5);0.000(14.6);-0.009(0.4)

實例 Ia-2 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$ =  
 7.261(37.4);7.206(0.8);7.070(14.2);6.859(2.2);4.131(0.6);4.113(0.6);4.050(0.6);4.032(0.7);4.024(3.2);4.007(9.8);3.989(10.0);3.971(3.2);3.693(0.6);3.350(2.3);3.333(38.7);3.303(0.4);3.300(0.4);3.232(8.1);3.217(8.2);2.358(0.3);2.324(0.3);2.298(0.4);2.195(3.2);2.167(50.0);2.044(2.9);2.005(0.4);1.948(2.1);1.926(3.3);1.913(2.6);1.901(4.1);1.890(2.1);1.867(2.0);1.857(1.5);1.704(3.4);1.667(2.8);1.650(1.0);1.642(0.9);1.628(0.7);1.587(10.7);1.460(0.7);1.447(1.4);1.439(1.5);1.435(0.9);1.426(2.6);1.420(0.8);1.414(1.5);1.406(1.6);1.393(0.9);1.277(1.1);1.259(2.0);1.241(1.3);1.237(1.0);1.204(2.3);1.195(1.7);1.173(2.0);1.165(1.6);1.152(0.9);1.132(10.7);1.114(21.5);1.101(1.7);1.096(9.9);1.084(0.6);0.899(0.5);0.882(1.5);0.874(1.5);0.867(1.6);0.861(3.3);0.855(5.1);0.847(3.4);0.841(3.2);0.834(4.1);0.826(2.5);0.814(1.1);0.794(3.2);0.786(5.0);0.781(4.6);0.774(5.4);0.768(4.5);0.761(1.1);0.755(1.2);0.008(0.7);0.0004(19.8);-0.0002(22.6);-0.009(0.7)

實例 I-13 :  $^1\text{H-NMR}$  (MHz,  $d_6$ -DMSO) :  $\delta$ =  
 10.689(0.9);7.897(0.6);7.030(3.7);3.326(50.0);3.293(0.8);3.282(0.8);3.276(1.0);3.265(0.8);3.250(2.5);3.245(9.6);2.509(12.0);2.505(26.9);2.500(38.0);2.496(26.8);2.491(12.0);2.072(0.6);2.041(5.9);2.036(6.6);1.831(0.3);1.799(0.5);1.774(0.4);1.651(0.3);1.635(0.3);1.601(0.3);1.540(0.5);1.532(0.4);1.519(0.9);1.507(0.5);1.499(0.5);1.486(0.4);0.895(0.4);0.885(1.1);0.878(1.5);0.869(0.6);0.864(1.2);0.858(1.3);0.848(0.5);0.719(0.6);0.709(1.5);0.703(1.3);0.697(1.4);0.690(1.3);0.680(0.4);0.000(5.2)

### C. 調配物實例

a) 一種塵佈(dusting)產品是藉著將 10 份重量的式(I)化合物和/或其鹽及 90 份重量的滑石作為惰性物質相混合並將混合物在一個衝擊式粉碎機中研成粉末來獲得。

b) 一種易被水分散之可濕潤粉末係藉著將 25 份重量的式(I)化合物和/或其鹽、64 份重量之含高嶺土的實應作為惰性物質、10 份重量的木質素磺酸鉀和一份重量的油醃基甲基牛磺酸鈉作為濕潤劑以及分散劑混合並且在一個多方槌的碟盤粉碎機中研磨而獲得。

c) 一種易被水分散之分散物的濃縮液係藉著將 20 份重量的醚

(®Triton X 207), 3 份重量的異十三醇聚二醇醚(8 EO)和 71 份重量的石蠟系礦物油(沸點範圍, 例如大約 255 到多於 277°C)混合而獲得並將之以球磨式粉碎機研磨至低於 5 微米的細小程度。

d) 一種可乳化的濃縮物係從 15 份重量的式(I)化合物和/或其鹽、75 份重量的環己酮作為溶劑和 10 份重量的乙氧基化之王基酚作為乳化劑 獲得。

e) 水可分散的顆粒係藉由混合以下成分而獲得：

75 份重量的式(I)化合物和或其鹽，

10 份重量的木質素磺酸鈣，

5 份重量的月桂基硫酸鈉，

3 份重量的聚乙烯醇和

7 份重量的高嶺土，

將混合物在一個多方槳的碟盤粉碎機中研磨，並且使粉末結成顆粒，此係在流體化床上藉著噴灑方式給水作為使其結粒的液體。

f) 水可分散的顆粒亦可藉著均質化和預先研成粉末來獲得：

25 份重量的式(I)化合物和或其鹽，

5 份重量的 2,2' 二萘基甲烷-6,6' 二磺酸鈉，

2 份重量的油鹽基甲基牛磺酸鈉，

1 份重量的聚乙烯醇，

17 份重量的碳酸鈣和

50 份重量的水在膠體研磨機上，

然後將混合物在一個珠磨機中研磨並在噴灑塔中利用單相噴嘴將所得到的懸浮液霧化且予乾燥。

## D. 生物數據

### 1. 萌芽前處理之除草劑的效用和作物植株的相容性

使單子葉和雙子葉雜草植株和作物植株的種子佈設在木頭纖維盆的砂質土壤中並且用土覆蓋。然後把調配成可濕潤粉末(WP)或乳化物濃縮液(EC)形式之根據本發明的化合物以水溶液的懸浮物或乳化物施用，其水施用比例為 600 到 800 l/ha(經換算的)，並添加 0.2% 濕潤劑到覆蓋土的表面。

處理之後，將盆子放在溫室中並且將其保持在對試驗植株良好的生長條件下。試驗植株的損害是在三週的試驗期後用目測法與未處理的對照組比較來評分(除草劑活性百分率(%): 100% 活性= 植株已經死亡，0% 活性 = 如同對照組的植株)。

吾人不希望的植株/雜草：

ALOMY :	大穗看麥娘 ( <i>Alopecurus myosuroides</i> )	SETVI :	狗尾草( <i>Setaria viridis</i> )
AMARE :	反枝莧( <i>Amaranthus retroflexus</i> )	AVEFA :	野燕麥( <i>Avena fatua</i> )
CYPES :	油莎草( <i>Cyperus esculentus</i> )	ECHCG :	稗( <i>Echinochloa crus-galli</i> )
LOLMU :	多花黑麥草( <i>Lolium multiflorum</i> )	STEME :	繁縷( <i>Stellaria media</i> )
VERPE :	阿拉伯婆婆納 ( <i>Veronica persica</i> )	VIOTR :	三色堇( <i>Viola tricolor</i> )
POLCO :	卷莖蓼( <i>Polygonum convolvulus</i> )		

表 5： 萌芽前處理的效果

實例 編號	劑量 [g/ha]	ALOM Y	AVEFA	CYPES	ECHCG	LOLMU	SETVI	AMARE	VIOTR	VERPE
I-1	320	100	80		100	100	100			
	80	80			100	100	100			
I-2	320	100	100	100	100	100	100			100
	80	100	80		100	100	100			
I-5	320	100	100	100	100	100	100			80
	80	100	100		100	100	100			
I-7	320	100			100	100	100			
	80	80			100	100	90			
I-8	320	100			100	100	90			90
	80	90			100	90	80			
I-9	320	100	90		100	100	100			
	80	100			100	80	90			
I-10	320	100	100		100	100	100			
	80	90	80		100	100	80			
I-11	320	100	80	100	100	100	100			80
	80	100			100	100	90			
I-12	320	100	80		100	100	100			
	80		100		90	100	90			
I-13	320	100			100	90	100			
	80				100		90			
I-14	320	100	80		100	100	90			
	80				100		90			

表 6： 萌芽前處理的效果

實例 編號	劑量 [g/ha]	ALOM Y	AVEFA	CYPES	ECHCG	LOLMU	SETVI	AMARE	VIOTR	VERPE
Ia-1	320	100	90		100	100	100			90
	80	90	80		100	100	100			
Ia-2	320	100		100	100	80	100			
	80	80			100		90			
Ia-3	320	100	90		100	100	100			90
	80	90	80		100	100	100			
Ia-4	320	80			100	90	100		100	90
	80				100		100			
Ia-5	320	100	100	100	100	100	100	100		100
	80	100	80	100	100	100	100			
Ia-6	320	100	90		100	100	100			
	80	100	90		100	100	100			
Ia-7	80	100			100	100	100			
Ia-8	320	100	90		100	100	100			
	80	100	90		100	100	80			
Ia-10	320	100		80	100	100	100			
	80	90			100	80	90			
Ia-11	320	100	80		100	100	100			
	80	100			100	100	100			
Ia-12	320	100	90		100	100	100			
	80	100			100	100	90			
Ia-13	320	100	100		100	100	100			
	80	100	80		100	100	100			
Ia-14	320	100	80	100	100	100	100			
	80	80	80		100	90	100			
Ia-16	320	90			100	90	90			
	80	90			90		90			

如表 5 和 6 所顯示的結果，根據本發明的化合物具有對抗寬廣譜系之雜草和野草的良好除草劑萌芽前處理效果。例如，在每一情形中化合物編號 No. I-1、 I-2、 I-5、 I-9、 I-10、 I-11、 I-12、 I-14、 Ia-1、 Ia-2、 Ia-3、 Ia-5、 Ia-6、 Ia-8、 Ia-9、 Ia-10、 Ia-11、 Ia-12、 Ia-13 和 Ia-14 且以 320 g/ha 的施用比例展現 80 – 100% 對抗大穗看麥娘 (*Alopecurus myosuroides*)、野燕麥 (*Avena fatua*)、稗 (*Echinochloa crus-galli*)、多花黑麥草 (*Lolium multiflorum*) 和狗尾草 (*Setaria viridis*) 的效果。相對地，化合物 I-7、 I-8、 I-13、 Ia-4 和 Ia-16，在每一情形中以 320 g/ha 的施用比例展現 80 – 100% 對抗大穗看麥娘 (*Alopecurus myosuroides*)、稗 (*Echinochloa crus-galli*)、多花黑麥草 (*Lolium multiflorum*) 和狗尾草 (*Setaria viridis*) 的效果。因此，根據本發明的化合物適用於藉由萌芽前處理法防治不想要的植株生長。

## 2. 發芽後的除草劑效果與作物植株的相容性

單子葉和雙子葉雜草和作物植株的種子被攤放木頭纖維盆裡的砂質土壤中，用土壤覆蓋並且在良好的生長條件下的溫室中培養。播種 2 到 3 週後，在單片葉子階段對試驗植行處理。根據本發明的化合物，經調配成可濕潤粉末 (WP) 的形式調配或呈乳化濃縮物 (EC)，然後以水溶液的懸浮物或乳化物，以 600 到 800 l/ha (經轉換的) 的水施用比例並添加 0.2% 的濕潤劑噴灑在植株的綠色部分。該試驗植株已被放置在溫室中在最佳生長條件下經大約三週之後，與未經處理的對照組比較以目測評估該製備物的作用 (除草劑作用百分率 (%): 100% 活性 = 植株已死， 0% 活性 = 看起來像對照組植株)。

表 7： 萌芽後處理的效果

實例 編號	劑量 [g/ha]	ALOM Y	AVEFA	ECHCG	LOLMU	SETVI	POLCO	VERPE
I-1	80	90	90	100	90	100		
	20			100	90	90		
I-2	80	100	100	100	100	100		
	20	90	90	100	90	100		
I-5	80	100	100	100	100	100		
	20	90	90	100	90	90		
I-7	80	100	100	100	100	100	80	
	20	90		100	90	100		
I-8	80	100	80	100	90	100		
	20	90		100	90	100		
I-9	80	100	100	100	100	100		
	20	100	90	100	100	100		
I-10	80	100	100	100	100	100		
	20	100	100	100	100	90		
I-11	80	100	100	100	100	100		
	20	80	80	100	90	100		
I-12	80	90	80	100	90	100		
	20		80	100		100		
I-13	80	80		90	90	90		
	20			90		90		
I-14	80	80		100	90	90		
	20			90	90	90		

表 8：萌芽後處理的反應

實例編號	劑量 [g/ha]	ALOMY	AVEFA	ECHCG	LOLMU	SETVI	POLCO	VERPE
Ia-1	80	80		100		90		
	20			90				
Ia-2	80			80		80		
Ia-3	80	100		100	100	100		90
	20	90		90		90		
Ia-6	80	100		100	90	100		
	20			100	90			
Ia-7	80	100		100	100	80		
	20			90				
Ia-8	80	100	100	100	100	100		
	20	100		100	100	100		
Ia-9	80	100	90	100	90	100		
	20	100	90	100	90	100		
Ia-10	80	80		90	90	100		
	20			90	80	100		
Ia-11	80	90		100	90	90		
	20			100		80		
Ia-12	80	90	100	100	100	100		
	20	90	100	100	90	100		
Ia-13	80			100		80		
	20			80				

如表 7 和表 8 的結果所顯示的，根據本發明的化合物具有對抗寬廣譜系之雜草和野草的良好除草劑萌芽後處理效果。例如，化合物編號 I-1、I-2、I-5、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、Ia-3、Ia-6、Ia-7、Ia-8、Ia-9、Ia-11 和 Ia-12 且以 80 g/ha 的施用比例展現 80 – 100% 對抗大穗看麥娘 (*Alopecurus myosuroides*)、野燕麥 (*Avena fatua*)、稗 (*Echinochloa crus-galli*)、多花黑麥草 (*Lolium multiflorum*) 和

狗尾草(*Setaria viridis*)的效果。因此，根據本發明的化合物適用於藉由萌芽後處理法防治不想要的植株生長。

與最近的技藝(WO 2015/040114, 化合物 42.03)相比較，本發明的化合物對於萌芽前處理和萌芽後處理均具有改良的除草劑效果，如下表所顯示的。

表 9：萌芽前處理效果的比較數據

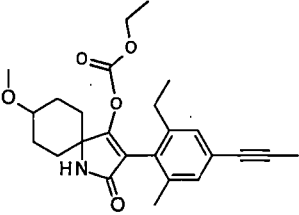
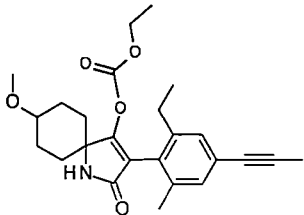
實例編號	劑量 (g a.i./ha)	AVEFA	CYPES	SETVI
1a-17	20	60	100	100
WO 2015/040114	20	50	0	80
				

表 10：萌芽後處理效果的比較數據

實例編號	劑量 (g a.i./ha)	ALOMY	AVEFA	PHBPU
1-5	20	90	90	30
WO 2015/040114	20	80	70	0
				

**【符號說明】**

無

**【生物材料寄存】**

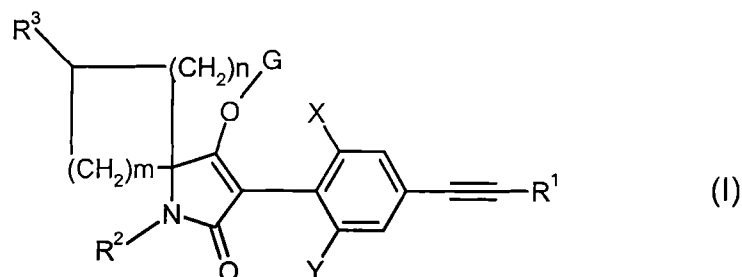
無

**【序列表】** (請換頁單獨記載)

無

## 申請專利範圍

1. 式(I)之經炔基取代之 N-苯基吡咯啉-2,4-二酮



或其農化上可接受的鹽，其中

X = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基 或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基，

Y = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基，

n = 1、2 或 3，

m = 1 或 2，

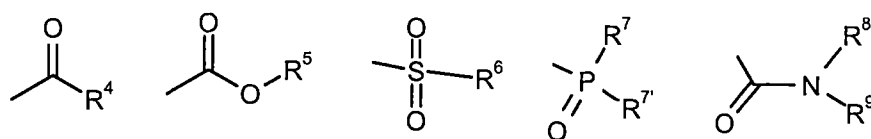
R<sup>1</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基，

R<sup>2</sup> = 氫或甲基，

R<sup>3</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基，或帶有氧或硫原子的五元或六元雜環，

G = 氫、可切斷的 L 或陽離子 E；其中

L = 以下基團之一



其中

R<sup>4</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基；

$R^5 = C_1-C_4$ -烷基，

$R^6 = C_1-C_4$ -烷基或未經取代的苯基或經鹵基、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -鹵烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -鹵烷氧基、硝基或氰基取代一次或多次的苯基，

$R^7, R^{7'}$  = 在每一情形中彼此獨立為甲氧基或乙氧基，

$R^8$  和  $R^9$  = 在每一情形中彼此獨立為甲基,乙基,苯基或共同形成飽和的 五元、六元或七元環，或共同形成飽和的五元、六元或七元之帶有氧或硫原子的雜環，

E = 鹼金屬離子、鹼土金屬離子、鋁離子或過渡金屬離子、鹵化鎂陽離子，或

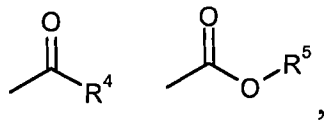
個銨離子，其中視需要一個、兩個、三個或所有四個氫原子被完全相同或相異之以下群組基團取代：氫、 $C_{1-5}$ -烷基、 $C_1-C_5$ -烷氧基或  $C_3-C_7$ -環烷基，在每一情形中可經氟、氯、溴、氰基、羥基取代一次或多次或可被一個或多個氧或硫原子介入，或

環狀的二級或三級脂肪族或雜脂肪族銨離子，例如嗎啉陽離子、硫代嗎啉陽離子、哌啶陽離子、吡咯啶陽離子，或在每一情形中為質子化的 1,4-二氮雜二環[2.2.2]辛烷(DABCO)或 1,5-二氮雜二環[4.3.0]十一-7-烯(DBU)，或

雜環的銨離子，例如在每一情形中為經質子化的吡啶、2-甲基吡啶、3-甲基吡啶、4-甲基吡啶、2,4-二甲基吡啶、2,5-二甲基吡啶、2,6-二甲基吡啶、5-乙基-2-甲基吡啶、吡咯、咪唑、喹啉、喹噁啉、

1,2-二甲基咪唑、1,3-二甲基咪唑陽離子甲基硫酸鹽，或一個銻離子。

2. 根據請求項 1 之通式(I)的化合物或其農化上可接受的鹽，其中 X 和 Y 彼此獨立在每一情形中為 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-烷基。
3. 根據請求項 2 之通式(I)的化合物或其農化上可接受的鹽，其中 X 和 Y 彼此獨立在每一情形中定義為甲基、乙基或環丙基。
4. 根據請求項 1 或 2 之通式(I)的化合物或其農化上可接受的鹽，其中 R<sup>1</sup> = 甲基、乙基、異丙基或環丙基。
5. 根據請求項 1 或 2 之通式(I)的化合物或其農化上可接受的鹽，其中 n 和 m 在每一情形中彼此獨立定義為 1 或 2。
6. 根據請求項 1 或 2 之通式(I)的化合物或其農化上可接受的鹽，其中 R<sup>3</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基。
7. 根據請求項 1 或 2 之通式(I)的化合物或其農化上可接受的鹽，其中 G = 氫，或選自以下之可切斷的基團 L：

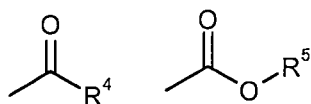


其中

R<sup>4</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，且 R<sup>5</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，或

一種選自 Na、K、Ca 或 Mg 之鹼金屬或鹼土金屬離子之離子對等物。

8. 根據請求項 7 之通式(I)的化合物，其中 G = 氫、或選自以下之可切割 L 基團，



其中  $R^4$  = 甲基、乙基、或異丙基，且  $R^5$  = 甲基或乙基，或鈉、鉀、三甲基銨、吡啶陽離子、喹啉陽離子或三甲基銻離子或鈣或鎂的離子對等物。

9. 根據請求項 1 之通式(I)的化合物或其農化上可接受的鹽，其中

X= 甲基、乙基或環丙基，

Y= 甲基或乙基，

$R^1$  = 甲基、乙基、異丙基或環丙基，且

$R^3$  =  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ -或  $\text{CH}_3\text{OCH}_2$ 。

10. 根據請求項 1 至 8 之通式(I)的化合物或其農化上可接受的鹽，其中 X = 甲基且 Y = 乙基。

11. 根據請求項 1 之通式(I)的化合物或其農化上可接受的鹽，其中

X= 甲基、乙基或環丙基，

Y= 甲基、乙基，

$R^1$  = 甲基、乙基、異丙基或環丙基，且

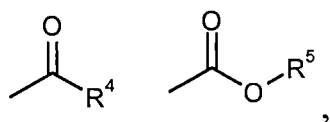
$R^2$  = 氫，

$R^3$  =  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ - 或  $\text{CH}_3\text{OCH}_2$

n 和 m 在每一情形中彼此獨立為 1 或 2，

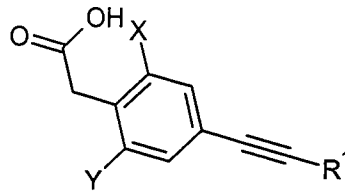
G = 氫，或

一個選自以下的可切斷之基團 L



其中  $R^4$  = 甲基、乙基，或異丙基，且  $R^5$  = 甲基或乙基，或選自鈉、鉀或鈣鎂之離子對等物的陽離子 E。

12. 一種通式(VII)之經炔基取代之苯基乙酸，



(VII)

其中

X = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基、

Y = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基 或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基，且

R<sup>1</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基，

但是化合物 2,6-二甲基-4-炔丙基苯基乙酸除外。

13. 根據請求項 13 之通式(VII)的化合物，其中

X = 甲基、乙基或環丙基；

Y = 甲基或乙基，且

R<sup>1</sup> = 甲基、乙基、異丙基或環丙基，

其中化合物 2、6-二甲基-4-炔丙基苯基乙酸除外。

14. 一種除草劑組成物，其包含根據請求項 1 至 11 中任一項之通式(I)的化合物或其農藥上可接受的鹽且視需要一種農藥上可接受的載劑、稀釋劑和/或溶劑。

15. 根據請求項 14 之除草劑組成物，其包含至少另一種出自殺昆蟲劑、殺蟎劑、除草劑、殺真菌劑、安全劑和生長調節劑之群組的除害劑活性成分。

16. 根據請求項 15 之除草劑組成物，其包含一種安全劑。

17. 根據請求項 14 到 16 之除草劑組成物，其尚包含另一種除草劑。

18. 一種防治不想要的植株生長之方法，其中根據請求項 1 至 11 中任一項之化合物被施用於待防治的植株、植株部分、植株種子或不想要的植株生長之區域。

19. 根據請求項 18 的方法，其中該不想要的植株生長係挑選自似草的單子葉雜草。

20. 根據請求項 18 或 19 的方法，其中在有用植株中具有抗藥性的雜草之生長被防治，且其中根據請求項 1 至 11 中任一項之除草劑組成物被施用於待防治的雜草。
21. 根據請求項 20 的方法，其中該有用的植株係選自小麥、大麥、裸麥、燕麥、稻米、甘蔗、大豆、油菜、葵花和玉米。
22. 防治有害植株的方法，其中使用根據請求項 1 之式(I)化合物或其農化上可接受的鹽。
23. 根據請求項 22 的方法，特徵在於式(I)化合物或其農化上可接受的鹽被用於防治有用的植株作物中之有害植株。
24. 根據請求項 23 的方法，其特徵在於該有用的植株為基因轉殖的有用植株。