

發明專利說明書

(本申請書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：97113060

※申請日期：97 年 04 月 10 日

※IPC 分類：

A01N 43/56 (2006.01)

C07D 231/20 (2006.01)

A01P 13/00 (2006.01)

一、發明名稱：

(中) 4 - (4 - 三氟甲基 - 3 - 硫基苯甲醯基) 吡唑類及其作為除草劑之用途

(英) 4-(4-trifluoromethyl-3-thiobenzoyl)pyrazoles and their use as herbicides

二、申請人：(共 1 人)

1. 姓 名：(中) 拜耳農業科學股份有限公司

(英) BAYER CROPSCIENCE AG

代表人：(中) 1. 魯道夫 偉伯 2. 諾伯特 史溫克

(英) 1. WEIBERT, RUDOLF 2. SCHWENK, NORBERT

地 址：(中) 德國蒙海姆

(英) D-40789 Monheim, Germany

國籍：(中英) 德國 GERMANY

三、發明人：(共 9 人)

1. 姓 名：(中) 哈姆特 亞倫斯

(英) AHRENS, HARTMUT

國 籍：(中) 德國

(英) GERMANY

2. 姓 名：(中) 安卓斯 艾恩斯克

(英) VAN ALMSICK, ANDREAS

國 籍：(中) 德國

(英) GERMANY

3. 姓 名：(中) 莫尼卡 史密特

(英) SCHMITT, MONIKA

國 籍：(中) 德國

(英) GERMANY

4. 姓 名：(中) 珍 迪特俊

國 籍：(英) DITTGEN, JAN
(中) 德國
(英) GERMANY

5. 姓 名：(中) 馬丁 希爾斯
(英) HILLS, MARTIN
國 籍：(中) 英國
(英) UNITED KINGDOM

6. 姓 名：(中) 海茲 凱恩
(英) KEHNE, HEINZ
國 籍：(中) 德國
(英) GERMANY

7. 姓 名：(中) 克里斯多佛 羅辛格
(英) ROSINGER, CHRISTOPHER
國 籍：(中) 英國
(英) UNITED KINGDOM

8. 姓 名：(中) 史特凡 雷爾
(英) LEHR, STEFAN
國 籍：(中) 德國
(英) GERMANY

9. 姓 名：(中) 戴特 菲克特
(英) FEUCHT, DIETER
國 籍：(中) 德國
(英) GERMANY

四、聲明事項：

◎本案申請前已向下列國家（地區）申請專利 ☐ 主張國際優先權：

【格式請依：受理國家（地區）；申請日；申請案號數 順序註記】

1. 歐洲 ; 2007/04/12 ; 07007493.5 ☒ 有主張優先權

國 籍：(英) DITTGEN, JAN
(中) 德國
(英) GERMANY

5. 姓 名：(中) 馬丁 希爾斯
(英) HILLS, MARTIN
國 籍：(中) 英國
(英) UNITED KINGDOM

6. 姓 名：(中) 海茲 凱恩
(英) KEHNE, HEINZ
國 籍：(中) 德國
(英) GERMANY

7. 姓 名：(中) 克里斯多佛 羅辛格
(英) ROSINGER, CHRISTOPHER
國 籍：(中) 英國
(英) UNITED KINGDOM

8. 姓 名：(中) 史特凡 雷爾
(英) LEHR, STEFAN
國 籍：(中) 德國
(英) GERMANY

9. 姓 名：(中) 戴特 菲克特
(英) FEUCHT, DIETER
國 籍：(中) 德國
(英) GERMANY

四、聲明事項：

◎本案申請前已向下列國家（地區）申請專利 ☐ 主張國際優先權：

【格式請依：受理國家（地區）；申請日；申請案號數 順序註記】

1. 歐洲 ; 2007/04/12 ; 07007493.5 ☒ 有主張優先權

九、發明說明

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於除草劑領域，特別是在有用植物群中選擇性防治闊葉雜草和野草之領域。

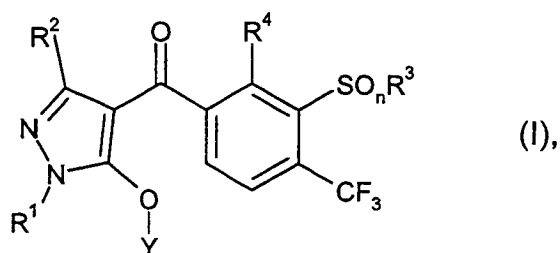
【先前技術】

由各種公開刊物，已經知道某些苯甲醯基吡唑類具有除草性質。因此 DE 2513750、EP 0352543、EP 0203428、WO 97/41106、WO 00/03993 和 US 4,557,753 提及經各種取代基取代的苯甲醯基吡唑類。

然而，由這些公開刊物所知道的化合物的除草活性常常是不充分的。因此，本發明的目的是提供具有除草性質比先前技術所揭示之化合物之除草性質好的除草性活性化合物。

【發明內容】

已發現某些 4-苯甲醯基吡唑類，其苯基環在 3-位置上帶有硫基和在 4-位置上帶有三氟甲基，特別適於作為除草劑。本發明的部分標的因此為式 (I) 之 4-(4-三氟甲基-3-硫基苯甲醯基)吡唑類或其鹽類



其中

R^1 為 (C₁-C₄)-烷基，

R^2 為氫或 (C₁-C₄)-烷基，

R^3 為 (C₁-C₄)-烷基，

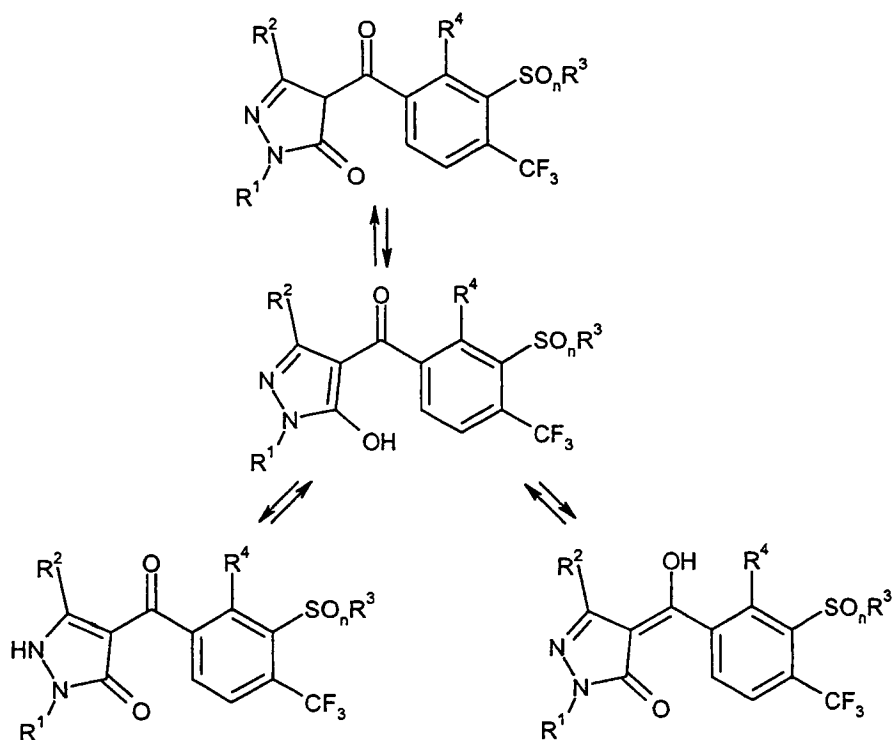
R^4 為 (C₁-C₄)-烷基，

Y 為氫、(C₁-C₆)-烷基磺醯基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基磺醯基，或為苯基磺醯基、噻吩基-2-磺醯基、苯甲醯基、苯甲醯基-(C₁-C₆)-烷基或苯甲基，其每一者經 m 個相同或不同取代基取代，該取代基選自鹵素、(C₁-C₄)-烷基和 (C₁-C₄)-烷氧基，

m 為 0、1、2、或 3，

n 為 0、1 或 2。

當 Y 為氫，本發明式 (I) 化合物視外在條件如溶劑和 pH，可以不同互變異構結構存在：



取決於取代基本質，通式（I）化合物包括可經由與鹼反應而被移除之酸性質子。適當的鹼為，例如，鋰、鈉、鉀、鎂和鈣的氫化物、氫氧化物和碳酸鹽，和亦為氨和有機胺，例如三乙胺和吡啶。亦可能藉由與有機酸（例如，甲酸或乙酸）和無機酸（例如，磷酸、鹽酸和硫酸）形成加成物而形成鹽類。此等鹽類亦構成本發明的部分標的。

於式（I）和所有後續的化學式中，具有多於 2 個碳原子之烷基可為直鏈或支鏈。烷基為，例如，甲基、乙基、正-或異-丙基、正-、異-、第三-或 2-丁基、戊基、己基，例如正-己基、異-己基和 1,3-二甲基丁基。鹵素為氟、氯、溴或碘。甲苯磺醯基為 4-甲基苯基磺醯基。

若基團被取代基多取代時，此可被理解為：此基團經一或多個相同或不同所提及之取代基取代。

取決於取代基的種類和連接，通式（I）化合物可以立體異構物存在。例如，若有一或多個不對稱碳原子或硫原子（即，於亞砜的案例）存在，可存在對映異構物和非對映異構物。可以慣用分離方法，例如層析分離法，從製備得到的混合物獲得立體異構物。同樣地，立體異構物可藉由使用立體選擇性反應，使用光學活性起始材料和/或助劑，而選擇性地予以製備。本發明亦關於通式（I）所涵蓋但未具體界定的所有立體異構物和其混合物。

較佳者為通式（I）化合物，其中

R^1 為甲基或乙基，

R^2 爲氫、甲基或乙基，

R^3 爲甲基或乙基，

R^4 爲甲基或乙基，

Y 爲氫、(C₁-C₃)-烷基磺醯基、(C₁-C₂)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基磺醯基，或爲苯基磺醯基、噻吩基-2-磺醯基、苯甲醯基、苯甲醯基-(C₁-C₆)-烷基或苯甲基，其每一者經 m 個甲基取代，

m 爲 0 或 1，

n 爲 0、1 或 2。

特別佳者爲通式 (I) 化合物，其中

R^1 爲甲基或乙基，

R^2 爲氫、甲基或乙基，

R^3 爲甲基或乙基，

R^4 爲甲基或乙基，

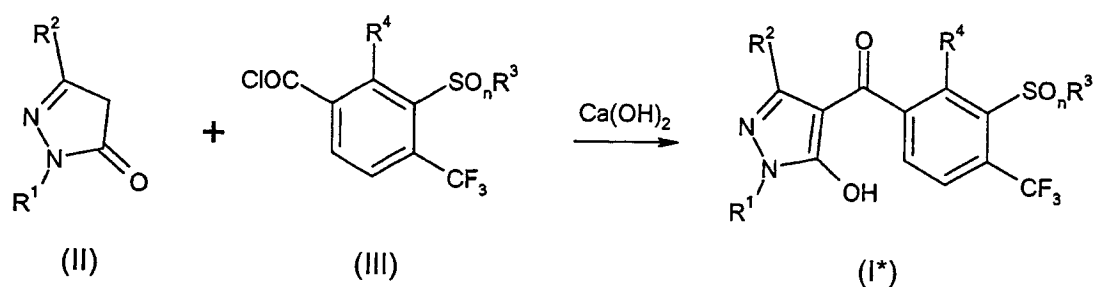
Y 爲氫，

n 爲 0、1 或 2。

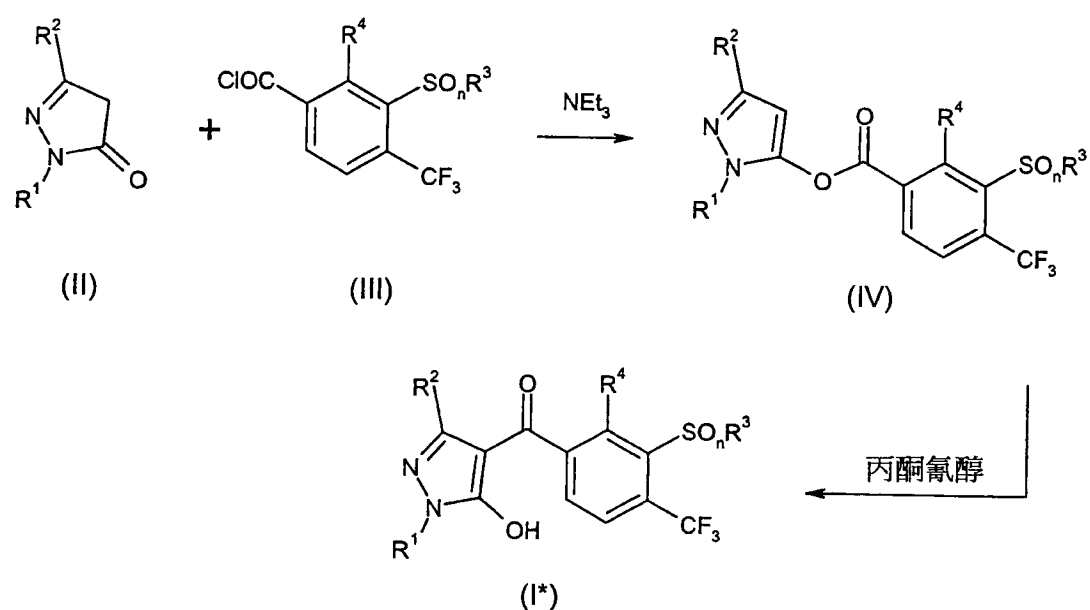
於下面所有化學式中，取代基和符號具有如式 (I) 所述之相同意義，除非另有定義。

本發明化合物 (其中 Y 爲氫) 可，例如，經由流程圖 1 所示且由 Acta Chem. Scand. 13, (1959), 1668-1670 知道之方法，藉由苯甲醯鹵 (III) 與吡啶啉酮 (II) 的鹼催化反應予以製備，或依據流程圖 2 所示且由例如 EP-A 0186117 知道的方法，藉由苯甲醯鹵 (III) 與吡啶啉酮 (II) 的鹼催化反應和隨後的重排予以製備。

流程圖 1

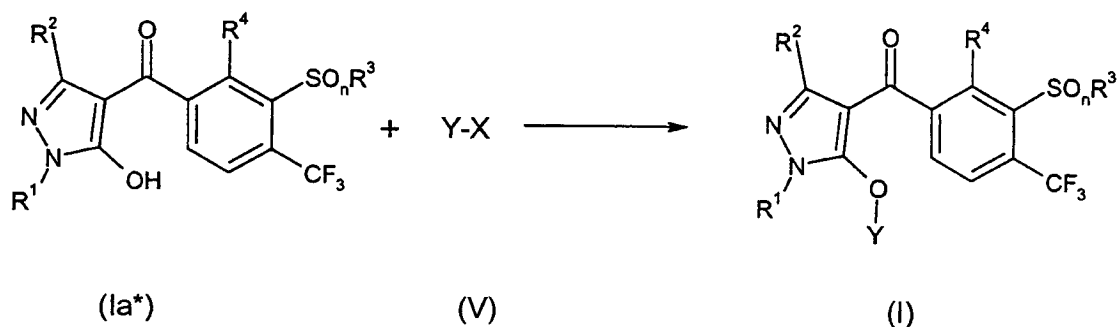


流程圖 2



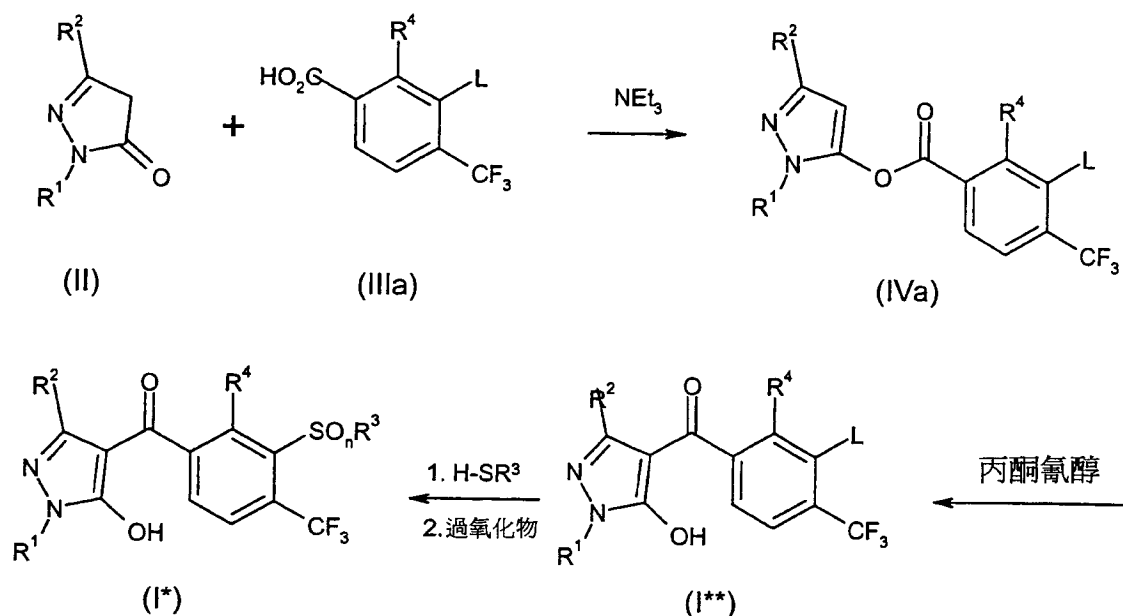
依據流程圖 3，本發明化合物（其中 Y 具有不同於氫之意義）方便地從流程圖 1 或 2 所得到的化合物，藉由與適當的式 (V) 醯化劑 Y-X（其中 X 為離去基，例如鹵素）的鹼催化反應而製得。此等方法原則上為熟悉該領域者所周知的且被描述於，例如，DE-A 25 13 750。

流程圖 3

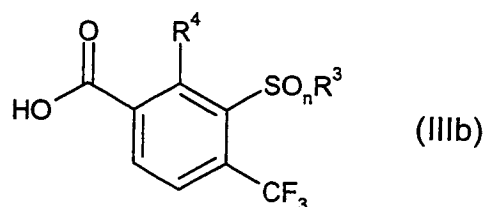


本發明化合物亦可依據流程圖 4 所示且由 WO 98/42678 知道的方法，藉由使吡唑啉酮（II）與鹵苯甲酸（IIIa）反應且隨後用硫化合物 HS-R^3 之親核芳香取代作用和，若適當，硫基的氧化作用而予以製備。於此，L 為，例如，氯、溴、碘或三氟甲基磺醯基。此取代反應為熟悉該領域者所周知的且被描述於 Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie [Methods of organic chemistry], Georg Thieme Verlag Stuttgart, vol. E11, 額外和補充資料至第 4 版 1985, p 174 等等。

流程圖 4



上述之式 (III) 化合物可，例如，藉由依據熟悉該領域者所周知的方法，與鹼基氯反應，從式 (IIIb) 化合物予以製備。



式 (III) 和 (IIIb) 化合物 (其中 R^3 、 R^4 和 n 為如針對式 (I) 所定義者) 為新穎的且亦構成本發明的部分標的。

上面流程圖所使用的起始材料為商業購得或可經由已知方法製備。因此，式 (II) 吡唑啉酮可，例如，經由 EP-A 0 240 001 和 J. Prakt. Chem. 315, 382, (1973) 所述之方法予以製備，而式 (III) 苯甲鹼氯可經由 EP-A 0 527 036 和 WO 03/014071 所述之方法予以製備。

本發明式 (I) 化合物對寬廣範圍的經濟性重要的單子葉和雙子葉有害植物具有優異的除草活性。活性物質對從根莖 (rhizomes, root stocks) 或其他多年生器官發芽且難以防治的多年生雜草的防治同樣良好。於本文中，不論是在播種、幼苗出土前或幼苗出土後之前施用該物質通常是不重要的。可被本發明防治的單子葉和雙子葉雜草植物群的一些代表例可能個別地提及作為實例，但此不會意指限制於某些種類。防治良好的單子葉雜草種類為，例如，來自一年生組群的燕麥屬 (Avena)、黑麥草屬 (Lolium)、看麥娘屬 (Alopecurus)、鵲草屬 (Phalaris

)、稗屬 (*Echinochloa*)、馬唐屬 (*Digitaria*)、狗尾草屬 (*Setaria*) 和莎草屬 (*Cyperus*) 種類，和多年生種類中的鵝觀草屬 (*Agropyron*)、狗牙根屬 (*Cynodon*)、白茅屬 (*Imperata*) 和蜀黍屬 (*Sorghum*) 或其他多年生莎草屬種類。於雙子葉雜草種類的案例中，作用範疇延伸至下面種類：例如，一年生組群之豬殃殃屬 (*Galium*)、堇菜屬 (*Viola*)、鹹蝦花屬 (*Veronica*)、野芝麻屬 (*Lamium*)、繁縷屬 (*Stellaria*)、莧屬 (*Amaranthus*)、芥屬 (*Sinapis*)、番薯屬 (*Ipomoea*)、黃花稔屬 (*Sida*)、香菊屬 (*Matricaria*) 和蕎麻屬 (*Abutilon*)，和多年生雜草中之三色牽牛屬 (*Convolvulus*)、薊屬 (*Cirsium*)、酸模屬 (*Rumex*) 和艾屬 (*Artemisia*)。在稻米特定耕種條件下發現的有害植物，例如，稗屬 (*Echinochloa*)、慈姑屬 (*Sagittaria*)、澤瀉屬 (*Alisma*)、荸薺屬 (*Eleocharis*)、莞屬 (*Scirpus*) 和莎草屬亦被本發明活性物質顯著地防治良好。若本發明化合物在萌芽之前施用至土壤表面，之後完全阻止雜草幼苗出現，或雜草生長至子葉階段但之後停止生長且，在 3 至 4 星期之後，植物最後完全死亡。當活性物質被施用至萌芽後綠色植物部分，在處理之後生長亦非常快速地激烈停止，且雜草保持在施用時的生長階段，或某段時間後，其完全死亡，使得對農作物植物有害的雜草競爭因此在非常早期階段或以持續方式消除。特別地，本發明化合物對抵抗 *Apera spica venti*、藜 (*Chenopodium album*)、小野芝麻 (

Lamium purpureum)、卷莖蓼 (*Polygonum convolvulus*)、繁縷 (*Stellaria media*)、歐洲阿拉伯婆婆納 (*Veronica hederifolia*)、阿拉伯婆婆納 (*Veronica persica*) 和香堇菜 (*Viola tricolor*) 具有顯著作用。

雖然本發明化合物對單子葉和雙子葉雜草具有顯著的除草活性，經濟性重要的農作物植物，例如，小麥、大麥、裸麥、稻米、玉米、甜菜、棉花和大豆，若有，僅承受微不足道的損害。特別地，其在穀類，例如小麥、大麥和玉米，特別是小麥，具有顯著良好的耐受性。以農業有用植物或觀賞植物立場而言，這就是為何本發明化合物高度適宜選擇性防治非所欲之植物。

由於其除草性質，活性物質亦可於已知植物群或終必發展的基因改質植物群中用於防治有害植物。基因轉殖植物通常以特別有利的性質為特徵，例如，抵抗某些農藥，特別某些除草劑，抵抗植物疾病或植物疾病的病原體，例如，某些昆蟲或微生物，例如，真菌、細菌或病毒。其它特殊性質係關於，例如，收成物的數量、品質、儲存性、組成和特殊成分。因此，收成物中具有增加澱粉含量或已改變澱粉品質或其脂肪酸組成的不同基因轉殖植物是已知的。

本發明式 (I) 化合物或其鹽類較佳地用於有用植物和觀賞植物中的經濟性重要的基因轉殖農作物，例如，穀類植物，例如，小麥、大麥、裸麥、燕麥、小米、稻米、木薯和玉米，或其它農作物：甜菜、棉花、大豆、油菜、

馬鈴薯、番茄、豌豆和其它蔬菜。式 (I) 化合物可較佳地作為有用植物群的除草劑，該植物群對除草劑的植物毒性效果具有抵抗性或已經由基因改質而有抵抗性。

與既存植物相比，產生已修改性質之新穎植物的常用途徑為，例如，傳統的育種方法和產生突變體。或者，具有已修改性質的新穎植物可由重組方法的幫助而得到（參考，例如，EP-A-0221044、EP-A-0131624）。例如，下面已描述數個案例：

- 農作物植物的重組修改的目的是為了修改於植物中所合成的澱粉（例如，WO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806），
- 顯示對草銨膦（glufosinate）類型（參見，例如，EP-A-0242236、EP-A-242246）、草甘膦（glyphosate）類型（WO 92/00377）或磺酰脲類型（EP-A-0257993、US-A-5013659）的某些除草劑具有抵抗性之基因轉殖農作物植物，
- 具有產生蘇力菌毒素（Bt 毒素）能力之基因轉殖農作物植物，例如，棉花，該蘇力菌造成植物對某些害蟲有抵抗性（EP-A-0142924、EP-A-0193259），
- 具有已修改脂肪酸組成物之基因轉殖農作物植物（WO 91/13972）。

原則上用已知的眾多分子生物技術的幫助可產生具有已修改性質的新穎基因轉殖植物；參考，例如，Sambrook

et al., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2nd Ed. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY ; 或 Winnacker "Gene und Klone" [Genes and Clones], VCH Weinheim 2nd Edition 1996, 或 Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431。

爲了執行此重組運用，核酸分子可被併入於容許透過重組 DNA 序列而突變誘發或序列改變之質體。用上述標準方法的幫助，可能，例如，進行鹼基取代、移除部份序列或加入天然或合成序列。片斷可被具有連接子（adapter 或 linker）以使 DNA 片斷互相連接。

具有減少基因產物活性的植物細胞的獲得可，例如，藉由表現至少一種對應的反義 RNA、有義 RNA 以達到共抑制效果，或藉由表現至少一種可專一性切斷上述基因產物的轉錄的適當建構的核糖酵素。

爲此目的，一方面，可能使用包括含有可能存在之任何側翼序列之基因產物的整個編碼序列之 DNA 分子，或只包括部分編碼序列之 DNA 分子，這些部分必須夠長以在細胞引起反義效果。另一可能性是使用對基因產物的編碼序列具有高程度的同源性但並不完全相同之 DNA 序列。

當於植物中表現核酸分子時，合成的蛋白質可被局限於任何所欲之植物細胞的隔室中。然而，爲了達成局限於特定的隔室中，編碼區域可，例如，被連接至保證局限於特別隔室中之 DNA 序列。此等序列爲熟習該領域者所週

知的（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）。

基因轉殖植物細胞可藉由已知技術再生，以提供完整無缺的植物。原則上，基因轉殖植物可為任何所欲植物種類的植物，即，單子葉或雙子葉植物兩者。因此，可得到基因轉殖植物，該植物顯示由於同源（=天然）基因或基因序列的過度表現、抑制（suppression, inhibition）或異源（=外來）基因或基因序列的表達而修改性質。

當本發明活性物質用於基因轉殖農作物，除了對在其他農作物中的有害植物所觀察的效果之外，時常觀察到下面特別是施用於所討論的基因轉殖農作物時之效果，例如，可被防治的已修改或具體延伸的雜草範疇、可用於施用之已修改的施用速率、與除草劑（基因轉殖農作物對其具有抵抗性）的較佳良好組合性、和對基因轉殖農作物植物的生長和產量的影響。本發明因此亦關於使用本發明化合物作為除草劑以防治基因轉殖農作物植物中的有害植物。

本發明物質對於農作物植物額外地具有顯著的生長調節性質。其以調節方式參與植物的新陳代謝，且因此可用於植物成分的靶標控制和有助於收成，例如，刺激乾燥和妨礙生長。再者，其亦適宜一般防治和抑制非所欲之植物生長，且於過程中無須破壞植物。抑制植物生長在許多單子葉和雙子葉農作物扮演著重要角色，因為藉此可減少或

完全阻止倒伏。

本發明化合物可以下面形式用於常用製劑中：可濕性粉末、可乳化的濃縮物、可噴霧的溶液、粉劑或顆粒。因此本發明亦關於含有式（I）化合物之除草性組成物。

（I）化合物可依據主要的生物和/或物化參數以各種方式予以調配。可能的適當調合物的實例為：可濕性粉末（WP）、水可溶的粉末（SP）、水可溶的濃縮物、可乳化的濃縮物（EC）、乳液（EW）（例如，水包油型乳液或油中水型乳液）、可噴霧的溶液、懸浮液濃縮物（SC）、油-或水-為基底的分散液、油可溶混的溶液、膠囊懸浮液（CS）、粉劑（DP）、種子拌藥產物、用於散佈和土壤施用之顆粒、微顆粒形式之顆粒（GR）、噴霧顆粒、經塗覆的顆粒和吸附顆粒、水可分散的顆粒（WG）、水可溶的顆粒（SG）、ULV 調合物、微膠囊和蠟。這些個別調合物類型原則上是已知的且被描述於，例如：

Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical Engineering], Volumn 7, C. Hauser 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。

必要的調合助劑，例如，惰性材料、介面活性劑、溶劑和另外的添加劑，同樣地為已知且被描述於，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" [Surface-active ethylene oxide adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Ed. 1986.

可濕性粉末為均勻地分散於水中之製劑，其除了活性物質之外，亦包括離子和/或非離子類型的介面活性劑（濕潤劑、分散劑），例如，聚氧乙基化烷基酚類、聚氧乙基化脂肪醇類、聚氧乙基化脂肪胺類、脂肪醇聚乙二醇醚硫酸酯、烷磺酸酯、烷基苯磺酸酯、2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸鈉、木質磺酸鈉、二丁基萘磺酸鈉或其他油鹽基甲基牛磺酸鈉，除了稀釋劑或惰性物質之外。為了製備可濕性粉末，除草性活性物質被微細地研磨，例如，於常用裝置中，例如，鏈磨機、吹氣研磨（blowing mills）和氣流粉碎，且同時或隨後與調合助劑混合。

可乳化的濃縮物係藉由使活性物質溶解於下面有機溶劑中而予以製備：例如，丁醇、環己酮、二甲基甲醯胺、二甲苯或其他高沸點之芳香族類或烴類或有機溶劑與加入

一或多種離子性和/或非離子性類型介面活性劑（乳化劑）之混合物。可使用的乳化劑實例為：烷基芳基磺酸鈣如十二烷基苯磺酸鈣，或非離子性乳化劑如脂肪酸聚乙二醇酯、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、山梨糖醇酯如山梨糖醇脂肪酸酯、或聚氧乙烯山梨糖醇酯如聚氧乙烯山梨糖醇脂肪酸酯。

粉劑係藉由使用微細固體材料，例如，滑石、天然黏土（如高嶺土、皂土和葉蠟石）、或矽藻土，研磨活性物質而得到的。

懸浮液濃縮物可為以水-或油為底質者。其可，例如，藉由經由常用球磨機，若適當，和加入介面活性劑之濕研磨而予以製備，該介面活性劑，例如，已在上面其它調合物類型中提及。

乳液（例如，水包油乳液（EW））可，例如，藉由攪拌器、膠體研磨機和/或靜態混合器，使用水性有機溶劑和，若適當，介面活性劑而予以製備，該介面活性劑，例如，已在上面其它調合物類型中提及。

顆粒可藉由使活性物質噴霧在吸附性之粒化的惰性材料上，或藉由使活性物質濃縮物經由黏著劑，例如，聚乙炔醇、聚丙烯酸鈉或其它礦物油，的幫助塗覆在載體（例如，沙、高嶺石或顆粒惰性材料）表面上而予以製備。適當的活性物質亦可以製備肥料細粒常用方式顆粒化，若需要，為與肥料之混合物。

水可分散的顆粒一般係藉由常用方法，例如，噴霧乾燥法、流動化床造粒法、盤式造粒法、以高速攪拌器混合法和擠壓法，予以製備，無須固體惰性材料。

盤式顆粒、流動化床顆粒、擠壓機顆粒和噴霧顆粒的製備方法參考，例如，"Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, pages 147 et seq.; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, pp. 8-57 的方法。

關於農作物保護劑的調合物的進一步細節參考，例如，G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pages 81-96 and J. D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101-103。

農化製劑通常包括從 0.1 至 99 重量%，特別是從 0.1 至 95 重量%，的式 (I) 活性物質。於可濕性粉末中，活性物質濃度為，例如，約 10 至 90 重量%；至 100 重量%的剩餘者係由常用調合物成分構成。於可乳化的濃縮物案例中，活性物質濃度可總計約 1 至 90 重量%，較佳地 5 至 80 重量%。粉劑型調合物包括 1 至 30 重量%的活性物質，較佳地在大部分案例中 5 至 20 重量%的活性物質，和可噴霧的溶液包括約 0.05 至 80 重量%，較佳地 2 至 50 重量%的活性物質。於水可分散的顆粒的案例中，活性物

質含量部分取決於，活性化合物是否為固體或液體形式和是否使用造粒助劑、填充劑等等。於水可分散的顆粒的案例中，例如，活性物質的含量為，例如，介於 1 和 95 重量 % 之間，較佳地介於 10 和 80 重量 % 之間。

此外，所提及的活性物質調合物包括，若適當，黏著劑、濕潤劑、分散劑、乳化劑、滲透劑、防腐劑、抗冷凍劑、溶劑、填充劑、載劑、著色劑、消泡劑、蒸發抑制劑、和 pH 和黏度調節劑，其為每一案例所慣用的。

基於這些調合物，亦可能與下面其他農藥活性物質（例如，殺蟲劑、殺蟎劑、除草劑、殺真菌劑）和與安全劑（safener）、肥料和/或生長調節劑，製備為例如摻水即可用或藥桶混合劑形式之組合物。

可與本發明的活性物質組合以混合調合物或藥桶混合劑形式使用之活性物質為，例如，被描述於下面的已知活性物質，且，例如，Weed Research 26, 441-445 (1986)，或“The Pesticide Manual”, 11th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 1997，和於該處所引用之文獻。必須被提及且可與式 (I) 化合物組合之已知除草劑為，例如，下面活性物質（注意：化合物依據國際標準組織 (ISO) 之俗名或化學名稱，若適當，一起與常用代號命名）：

乙草胺 (acetochlor)；亞喜芬 (acifluorfen)；苯草醚 (aclonifen)；AKH 7088 (即，[[[1-[5-[2-氯-4-(三氟甲基)-苯氧基]-2-硝基苯基]-2-甲氧基亞乙基]胺基]氧

基]乙酸及其甲酯)；甲草胺(alachlor)；亞汰草(alloxydim)；莠滅津(amestryn)；噠嘧磺隆(amidosulfuron)；殺草強(amtrol)；AMS(即，胺磺酸鉍)；莎稗磷(anilofos)；亞速爛(asulam)；莠去津(atrazine)；四唑嘧磺隆(azimsulfuron)(DPX-A8947))；疊氮津(aziprotryn)；燕麥靈(barban)；BAS 516 H(即，5-氟-2-苯基-4H-3,1-苯並噁咩-4-酮)；草除靈(benazolin)；倍尼芬(benfluralin)；草磺(benfuresate)；苄嘧磺隆(bensulfuron-methyl)；地散磷(bensulide)；滅草松(bentazone)；草酮(benzofenap)；氟草黃(benzofluor)；新燕靈(benzoylprop-ethyl)；苯隆(benzthiazuron)；雙丙氨膦(bialaphos)；甲羧除草醚(bifenox)；除草定(bromacil)；溴丁草胺(bromobutide)；溴酚(bromofenoxim)；溴苯(bromoxynil)；bromuron；buminafos；羥草酮(busoxinone)；丁草胺(butachlor)；抑草磷(butamifos)；丁烯草胺(butenachlor)；丁噻咪草酮(buthidazole)；比達寧(butralin)；拉敵草(butylate)；唑草胺(cafenstrole)(CH-900)；草長滅(carbetamide)；cafentrazone；CDAA(即，2-氯-N,N-二-2-丙烯基乙噠胺)；CDEC(即，二乙基二硫胺甲酸2-氯烯丙酯)；甲氧基護谷(chlomethoxyfen)；克攔本(chloramben)；chlorazifop-butyl；氯溴隆(chlorbromuron)；氯快靈(chlorbufam)；伐草克(

chlorfenac) ; 氯甲丹 (chlorflurecol-methyl) ; 氯草敏
 (chloridazon) ; 氯嘧磺隆 (chlorimuron ethyl) ; 全滅
 草 (chlornitrofen) ; 綠麥隆 (chlorotoluron) ; 枯草龍
 (chloroxuron) ; 克普芬 (chlorpropham) ; 氯磺隆 (chlorsulfuron) ; 氯酞酸二甲酯 (chlorthal-dimethyl) ;
 草克樂 (chlorthiamid) ; 環庚草醚 (cinmethylin) ; 醚
 磺隆 (cinosulfuron) ; 烯草酮 (clethodim) ; 炔草酸 (clodinafop) 及其酯類衍生物 (如炔草酯 (clodinafop-propargyl) ; 異惡草酮 (clomazone) ; 克普草 (clomeprop) ; cloproxydim ; 二氯吡啶酸 (clopyralid) ;
 苄草隆 (cumyluron) (JC 940) ; 氰草津 (cyanazine)
 ; 草滅特 (cycloate) ; 環磺隆 (cyclosulfamuron) (AC 104) ; 環殺草 (cycloxydim) ; 環莠隆 (cycluron) ; 氰
 氟草酸 (cyhalofop) 及其酯類衍生物 (例如丁酯 , DEH-112) ; 賽伯刈 (cyperquat) ; 環丙津 (cyprazine) ; 三
 環塞草胺 (cyprazole) ; 殺草隆 (daimuron) ; 2,4-DB、
 茅草枯 (dalapon) ; 甜安寧 (desmedipham) ; 敵草淨 (desmetryn) ; 燕麥敵 (di-allate) ; 麥草畏 (dicamba)
 ; 二氯苯晴 (dichlobenil) ; 2,4-滴丙酸 (dichlorprop)
 ; 禾草畏 (diclofop) 及其酯類 (例如 , diclofop-甲基)
 ; 乙醯甲草胺 (酸) (diethatyl) ; 枯莠隆 (difenoxuron) ; difenzoquat ; 氟草胺 (diflufenican) ; 惡唑隆 (dimefuron) ; 二甲草胺 (dimethachlor) ; 異戊乙淨 (dimethametryn) ; 汰草滅 (dimethenamid) (SAN-582H

) ; 異惡草酮 (dimethazone) ; 異惡草松 (clomazon)
 ; 稷菱得 (dimethipin) ; dimetrasulfuron ; 撻乃安 (dinitramine) ; 達諾殺 (dinoseb) ; 特樂酯 (dinoterb)
 ; 大芬滅 (diphenamid) ; 異丙淨 (dipropetryn) ; 二刈 (diquat) ; 汰硫草 (dithiopyr) ; 達有龍 (diuron) ;
 DNOC ; 甘草津 (eglinazine-ethyl) ; EL 77 (即 , 5-氟基-1-(1,1-二甲基乙基)-N-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺) ;
 茵多酸 (endothal) ; EPTC ; 禾草畏 (esprocarb) ; 乙丁烯氟靈 (ethalfluralin) ; 胺苯磺隆 (ethametsulfuron-methyl) ; 磺隆 (ethidimuron) ; 乙草酮 (ethiozin) ;
 益覆滅 (ethofumesate) ; F5231 (即 , N-[2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-4,5-二氫-5-酮基-1H-四唑-1-基]-苯基]乙磺醯胺) ;
 氯氟草醚 (ethoxyfen) 和其酯類 (例如 , 乙酯 , HN252) ; 乙氧苯草胺 (etobenzanid) (HW 52) ;
 2,4,5-涕丙酸 (fenoprop) ; fenoxan ; 唑禾草靈 (fenoxaprop) 和精惡唑禾草靈 (fenoxaprop-P) 和其酯類 , 例如精噁唑禾草靈 (fenoxaprop-P-ethyl) 和惡唑禾草靈 (fenoxaprop-ethyl) ; fenoxydim ; 非草隆 (fenuron)
 ; 麥草氟甲酯 (flamprop-methyl) ; 伏速隆 (flazasulfuron) ; 伏寄普 (fluazifop) 和 fluazifop-P 和其酯類 , 例如 , fluazifop-butyl 和 fluazifop-P-butyl ; 貝殺靈 (fluchloralin) ; 氟酮磺隆 (flucarbazone) 、 氟草胺 (flufenacet) ; 唑嘧磺草胺 (flumetsulam) ; flumeturon ; 氟烯草酸 (flumiclorac) 和其酯類 (例如戊酯 , S-

23031) ; 丙炔氟草胺 (flumioxazin) (S-482) ; 炔草胺 (flumipropyn) ; 氟胺草啞 (flupoxam) (KNW-739) ; 三氟硝草醚 (fluorodifen) ; 乙羧氟草醚 (fluoroglycofen-ethyl) ; flupropacil (UBIC-4243) ; 氟啞草酮 (fluridone) ; 氟咯草酮 (flurochloridone) ; 氟氯比 (fluroxypyr) ; 草酮 (flurtamone) ; 氟磺胺草醚 (fomesafen) ; 甲胺磺隆 (foramsulfuron) ; 殺木磷 (fosamine) ; 氧草醚 (furyloxyfen) ; 固殺草 (glufosinate) ; 嘉磷塞 (glyphosate) ; halosafen ; 氯嘧磺隆 (halosulfuron) 和其酯類 (例如 , 甲酯 , NC-319) ; 甲基合氯氟 (haloxyfop) 和其酯類 ; 精氟氯禾靈 (haloxyfop-R) (=R-haloxyfop) 和其酯類 ; 菲殺淨 (hexazinone) ; 依滅草 (imazapyr) ; 咪草酸甲酯 (imazamethabenz-methyl) ; 咪啞啞啞啞酸 (imazaquin) 和鹽類如銨鹽 ; 碘苯 (ioxynil) ; imazethamethapyr ; 咪草煙 (imazethapyr) ; 啞吡嘧磺隆 (imazosulfuron) ; 甲基碘磺隆鈉鹽 (iodosulfuron-methyl-sodium) ; 草特靈 (isocarbamid) ; 異丙樂靈 (isopropalin) ; 異丙隆 (isoproturon) ; 異噁隆 (isouron) ; 異噁草胺 (isoxaben) ; 異惡草醚 (isoxapyrifop) ; 卡靈草 (karbutilate) ; 乳氟禾草靈 (lactofen) ; 環草定 (lenacil) ; 理有龍 (linuron) ; MCPA ; MCPB ; mecoprop ; 滅芬草 (mefenacet) ; 氟磺醯草胺 (mefluidid) ; 甲基二黃隆 (mesosulfuron) ; 硝草酮 (mesotrione) ; 苯草酮 (

metamitron) ; 滅草胺 (metazachlor) ; 斯美地 (metham) ; 甲基苯隆 (methabenzthiazuron) ; 滅草唑 (methazole) ; 苯草酮 (methoxyphenone) ; 甲基殺草隆 (methyldymron) ; metabenzuron ; methobenzuron ; 撲多草 (metobromuron) ; 莫多草 (metolachlor) ; 磺草唑胺 (metosulam) (XRD 511) ; 甲氧隆 (metoxuron) ; 滅必淨 (metribuzin) ; 甲磺隆 (metsulfuron-methyl) ; MH ; 禾草敵 (molinate) ; 庚草胺 (monalide) ; 綠谷隆 (monolinuron) ; 滅草隆 (monuron) ; monocarbamide dihydrogensulfate ; MT 128 (即 , 6-氯 -N- (3-氯 -2-丙基) -5-甲基 -N-苯基 -3-噁吡胺) ; MT 5950 (即 , N-[3-氯 -4- (1-甲基乙基) -苯基]-2-甲基戊醯胺) ; 萘丙胺 (naproanilide) ; 敵草胺 (napropamide) ; 萘草胺 (naptalam) ; NC 310 (即 , 4- (2,4-二氯苯甲醯基) -1-甲基 -5-苯甲基氧基吡唑) ; 草不隆 (neburon) ; 煙嘧磺隆 (nicosulfuron) ; 吡氯草胺 (nipyraclufen) ; 磺樂靈 (nitralin) ; 除草醚 (nitrofen) ; 三氟甲草醚 (nitrofluorfen) ; 達草滅 (norflurazon) ; 坪草丹 (orbencarb) ; 安磺靈 (oryzalin) ; 丙炔惡草酮 (oxadiargyl) (RP-020630) ; 樂滅草 (oxadiazon) ; 復祿芬 (oxyfluorfen) ; 巴拉刈 (paraquat) ; 克草敵 (pebulate) ; 施得圃 (pendimethalin) ; 黃草伏 (perfluidone) ; 棉胺寧 (phenisopham) ; 甜菜寧 (phenmedipham) ; 百草枯 (picloram) ; 唑啞草酯 (

pinoxaden) ; 哌草磷 (piperophos) ; piributicarb ;
 pirifenop-butyl ; 普拉草 (pretilachlor) ; 氟嘧磺隆 (primisulfuron-methyl) ; 環丙青津 (procyazine) ; 氨氟
 樂靈 (prodiamine) ; 環丙氟靈 (profluralin) ;
 proglinazine-ethyl ; 撲滅通 (prometon) ; 撲草淨 (prometryn) ; 毒草胺 (propachlor) ; 除草靈 (propanil)
) ; 普拔草 (propaquizafop) 和其酯類 ; 普拔根 (propazine) ; 苯胺靈 (propham) ; 異丙草胺 (propisochlor) ; 丙苯磺隆 (propoxycarbazone) ; 戊炔草
 胺 (propyzamide) ; 甲硫磺樂靈 (prosulfalin) ; 苄草丹
 (prosulfocarb) ; 氟磺隆 (prosulfuron) (CGA-152005)
) ; 丙炔草胺 (prynachlor) ; pyrazolate ; 殺草敏 (pyrazon) ; pyrasulfotole ; 百速隆 (pyrazosulfuron-ethyl)
) ; 草啞 (pyrazoxyfen) ; 必汰草 (pyridate) ; 嘧硫草
 醚 (pyrithiobac) (KIH-2031) ; pyroxofop 和其酯類 (例如炔丙酯) ; 快克草 (quinclorac) ; 氯甲喹啉酸 (quinmerac) ; quinofofop 和其酯類衍生物 ; 禾靈 (quizalofop) 和精禾靈 (quizalofop-P) 和其酯類衍生物 , 例如快伏草 (quizalofop-ethyl) ; 禾糠酯 (quizalofop-P-tefuryl) 和快伏草 (quizalofop-ethyl) ; renriduron ; 玉
 嘧磺隆 (rimsulfuron) (DPX-E 9636) ; S 275 (即 , 2-[4-氯-2-氟-5-(2-丙炔基氧基)苯基]-4,5,6,7-四氫-2H-吡啶) ; 密草通 (secbumeton) ; 西殺草 (sethoxydim) ; 環草隆 (siduron) ; 西瑪津 (simazine) ; 西草淨 (

simetryn) ; SN 106279 (即 , 2-[[7-[2-氯-4-(三 氟 甲 基) 苯 氧 基]-2-萘 基]氧 基]-丙 酸 和 其 甲 酯) ; 磺 草 酮 (sulcotrione) ; 甲 磺 草 胺 (sulfentrazone) (FMC-97285, F-6285) ; sulfazuron ; 甲 嘧 磺 隆 (sulfometuron-methyl) ; 草 硫 磷 (sulfosate) (ICI-A0224) ; TCA ; 牧 草 胺 (tebutam) (GCP-5544) ; 丁 噻 隆 (tebuthiuron) ; tembotrione ; 特 草 定 (terbacil) ; 特 草 靈 (terbucarb) ; 特 丁 草 胺 (terbuchlor) ; 特 丁 通 (terbumeton) ; 草 淨 津 (terbuthylazine) ; 特 丁 淨 (terbutryn) ; TFH 450 (即 , N,N-二 乙 基 -3-[(2-乙 基 -6-甲 基 苯 基) 磺 醯 基]-1H-1,2,4-三 唑 -1-羧 醯 胺) ; 欣 克 草 (thenylchlor) (NSK-850) ; 噻 氟 隆 (thiazafluron) ; thien carbazole ; 噻 草 定 (thiazopyr) (Mon-13200) ; 噻 二 唑 草 胺 (thidiazimin) (SN-24085) ; 殺 丹 (thiobencarb) ; 噻 吩 磺 隆 (thifensulfuron-methyl) ; 仲 草 丹 (tiocarbazil) ; 三 甲 苯 草 酮 (tralkoxydim) ; 野 燕 畏 (tri-allate) ; 醚 苯 磺 隆 (triasulfuron) ; triazofenamide ; 苯 磺 隆 (tribenuron-methyl) ; 三 氯 比 (triclopyr) ; 滅 草 環 (tridiphan) ; 草 達 津 (trietazine) ; 三 福 林 (trifluralin) ; triflusulfuron 和 酯 類 (例 如 , 甲 酯 , DPX-66037) ; 三 甲 隆 (trimeturon) ; tsitodef ; 滅 草 敵 (vernolate) ; WL 110547 (即 , 5-苯 氧 基 -1-[3-(三 氟 甲 基) -苯 基]-1H-四 唑) ; UBH-509 ; D-489 ; LS 82-556 ; KPP-300 ; NC-324 ; NC-330 ; KH218 ; DPX-N8189 ; SC-0774 ; DOWCO-535

； DK-8910 ； V-53482 ； PP-600 ； MBH-001 ； KIH-9201 ； ET-751 ； KIH-6127 和 KIH-2023 。

關於應用，以市場可購得之形式存在的調合物，若適當，係以常用方式予以稀釋，例如，於下面案例中係使用水：可濕性粉末、可乳化的濃縮物、分散液和水可分散的顆粒。用於散佈和可噴霧之溶液且為粉劑、土壤顆粒、顆粒形式之製劑在使用之前通常無須進一步用其他惰性物質予以稀釋。

式（I）化合物所需要的施用速率隨外部條件，例如，溫度、溼度、所使用的除草劑本質等等，而改變。其可在寬廣範圍內改變，例如，介於 0.001 和 1.0 kg/ha 或更多的活性物質，但較佳地介於 0.005 和 750 g/ha。

【實施方式】

下面實例說明本發明。

A. 化學實例

1-乙基-4-(3'-乙基磺醯基-2'-甲基-4'-(三氟甲基)苯甲醯基-5-羥基吡啶)的製備

步驟 1：3-氟-2-甲基-4-三氟甲基苯甲酸

25.0 g (120.1 mmol) 的 3-氟-4-三氟甲基苯甲酸被溶解於 250 ml 的 THF 中，和在 -40℃ 逐滴加入 100.9 ml (2.5M 於甲烷中，252.3 mmol) 的正丁基鋰。混合物攪拌 3.5 小時，之後逐滴加入 51.2 g (360.4 mmol) 的碘化甲

烷的 50 ml 乾燥 THF 溶液。混合物攪拌 16 小時，半小時後，溫度緩慢增加至室溫（RT）。小時加入 150 ml 的 1 M HCl 整理結束反應。混合物用二乙醚萃取，且有機相之後用 1M NaOH 萃取。水相被酸化之後用二乙醚萃取。有機相用水清洗、乾燥和移除溶劑。殘留物用正庚烷滴定，且固體藉由過濾而被取出。分離出 13.5 g 的純淨產物。

步驟 2：3-乙基硫基-2-甲基-4-三氟甲基苯甲酸

一開始將 3.00 g (13.5 mmol) 的 3-氟-2-甲基-4-三氟甲基苯甲酸置於 50 ml 的 N,N-二甲基甲醯胺中。每一次一點點地加入 1.68 g (純度 60 重量%，41.9 mmol) 的 NaH。當氣體的放出要結束時，逐滴加入 1.77 g (純度 95 重量%，27.0 mmol) 的乙硫醇。混合物在 RT 攪拌 2 小時，之後在 80℃ 受熱 10 小時。反應混合物被冷卻、被倒入冰-水以整理結束反應，之後用濃鹽酸酸化。產物被沉澱出來且藉由過濾而分離出來。分離出 3.7 g 的純淨產物。

步驟 3：1-乙基-4(3'-乙基硫基-2'-甲基-4'-三氟甲基)苯甲醯基-5-羥基吡啶的合成

一開始將 300 mg (1.14 mmol) 的 3-乙基硫基-2-甲基-4-三氟甲基苯甲酸置於 20 ml 的乾燥 CH₂Cl₂，加入 288 mg (2.27 mmol) 的草醯氯。混合物回流受熱 15 分鐘，之後可觀察到不再放出氣體。內容物被冷卻至 RT 和濃縮。以此方式所得到的醯基氯被溶解於 20 ml 的乾燥

CH_2Cl_2 ，溶液被加入至 140 mg (1.25 mmol) 的 1-乙基-5-羥基吡啶和催化量的 4-N,N-二甲基胺基吡啶的混合物中。之後緩慢逐滴加入 230 mg (2.27 mmol) 的三乙胺，反應混合物在 RT 攪拌 16 小時。爲了整理結束反應，加入 3 ml 的 1 M HCl，且相分離之後，有機相被移除溶劑。以此方式所得到的烯醇酯被溶於 20 ml 的乙腈，和加入 230 mg (2.27 mmol) 的三乙胺之後加入 8 滴的丙酮氰醇和一點點的 KCN。混合物在 RT 攪拌 16 小時且之後被濃縮。將 20 ml 的 CH_2Cl_2 和 3 ml 的 1 M HCl 依序加入至殘留物中。相分離後，溶劑被移除。殘留物經由層析術予以純化，其給予 182 mg 的純淨產物。

步驟 4：1-乙基-4 (3'-乙基磺醯基-2'-甲基-4'-三氟甲基) 苯甲醯基-5-羥基吡啶的合成

182 mg (0.51 mmol) 的 1-乙基-4 (3'-乙基硫基-2'-甲基-4'-三氟甲基) 苯甲醯基-5-羥基吡啶被溶解於 20 ml 的 CH_2Cl_2 ，之後加入 376 mg (純度 70 重量%，1.52 mmol) 的間-氯過苯甲酸。混合物之後在 RT 攪拌 16 小時。爲了整理結束反應，混合物用 CH_2Cl_2 稀釋且用 10% 強亞硫酸鈉水溶液清洗。混合物用 1 M HCl 酸化，和分離相和分析確定無過氧化物之後，有機相被乾燥且移除溶劑。殘留物被層析純化，其給予 88.8 mg 的純淨產物。

5-羥基-1,3-二甲基-4- (2'-甲基-3'-甲基磺醯基-4'-三

氟甲基) 苯甲醯基吡啶的製備

步驟 1：2-甲基-3-甲基硫基-4-三氟甲基苯甲酸的合成

一開始將 300 mg (1.35 mmol) 的 3-氟-2-甲基-4-三氟甲基苯甲酸置於 5 ml 的 N,N-二甲基甲醯胺中，加入 59 mg (純度 60 重量%，1.49 mmol) 的 NaH。混合物攪拌 10 分鐘，之後加入 199 mg (純度 95 重量%，2.70 mmol) 的甲硫醇鈉。混合物在 RT 攪拌 1.5 小時且之後在 80°C 受熱 16 小時。反應混合物被冷卻，爲了整理結束反應，被倒入-水和用乙酸乙酯萃取，且水相之後用濃 HCl 酸化。混合物用第三丁基甲基醚萃取 2 次、乾燥和濃縮。此給予 301 mg 的產物。

步驟 2：2-甲基-3-甲基磺醯基-4-三氟甲基苯甲酸的合成

一開始將 1.50 g (5.99 mmol) 的 2-甲基-3-甲基硫基-4-三氟甲基苯甲酸置於 20 ml 的冰醋酸中。加入 59 mg (0.18 mmol) 的鎢酸(VI) 鈉二水合物，且混合物之後在 50-60°C 受熱。在此溫度，小心地逐滴加入 2.45 ml (30% 強，23.98 mmol) 的過氧化氫水溶液。混合物再此溫度攪拌數小時，直到 HPLC 分析顯示不再有起始物質和亞磺。反應混合物之後被冷卻和，爲了整理結束反應，而被倒入水。混合物用乙酸乙酯萃取 3 次，結合的有機相用飽和的亞硫酸氫鈉水溶液清洗和，分析確定無過氧化物存在後，混合物用 1 M HCl 酸化。有機相被乾燥且移除溶劑。分離出 1.67 g 的純淨產物。

步驟 3：5-羥基-1,3-二甲基-4-(2'-甲基-3'-甲基磺醯基-4'-三氟甲基)苯甲醯基吡啶的合成

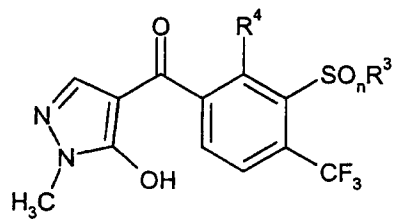
一開始將 200 mg (0.71 mmol) 的 2-甲基-3-甲基磺醯基-4-三氟甲基苯甲酸與 87 mg (0.78 mmol) 的 5-羥基-1,3-二甲基吡啶和催化量的 4-N,N-二甲基胺基吡啶一起置於 20 ml 的乾燥 CH_2Cl_2 中，加入 163 mg (0.85 mmol) 的 1-(3-二甲基胺基丙基)-3-乙基碳二醯亞胺鹽酸鹽。混合物在 RT 攪拌 3 小時，之後加入 3 ml 的 1 M HCl。分離相後，水相用 CH_2Cl_2 萃取。有機相被乾燥和濃縮。殘留物被溶於 20 ml 的乙腈和 143 mg (1.42 mmol) 的三乙胺，加入 8 滴的丙酮氰醇和一點點的 KCN。混合物在 RT 攪拌 16 小時和被濃縮。將 15 ml 的 CH_2Cl_2 和 2 ml 的 1 M HCl 依序加入至殘留物中。相分離後，水相用 CH_2Cl_2 萃取。結合的有機相被乾燥和濃縮。殘留物被層析純化。分離出 112.7 mg 的純淨產物。

下表中所給予的實例係以類似上述方法予以製備，或可以類似上述方法得到。這些化合物係是特別佳的。

所使用的縮寫表示：

Bu=丁基	Et=乙基	Me=甲基	Pr=丙基
i=異	s=第二	t=第三	Ph=苯基

表 A：本發明式（I）化合物，其中 R¹ 為甲基，且 R² 和 Y 各自為氫

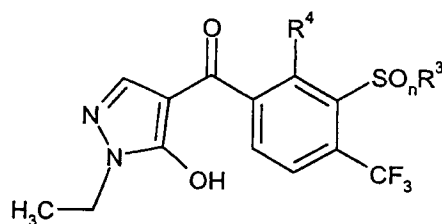


編號	R ³	R ⁴	n	物理數據：
				¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
1-1	Me	Me	0	7.68 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.30 (s, 1H), 3.71 (s, 3H), 2.68 (s, 3H), 2.31 (s, 3H)
1-2	Et	Me	0	7.69 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.31 (s, 1H), 3.72 (s, 3H), 2.77 (q, 2H), 2.66 (s, 3H), 1.22 (t, 3H)
1-3	n-Pr	Me	0	
1-4	i-Pr	Me	0	
1-5	n-Bu	Me	0	
1-6	i-Bu	Me	0	
1-7	s-Bu	Me	0	
1-8	t-Bu	Me	0	
1-9	Me	Me	1	7.71 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.28 (s, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.03 (s, 3H), 2.90 (s, 3H)

編號	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
1-10	Et	Me	1	7.71 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.26 (s, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.47 (dq, 1H), 2.96 (dq, 1H), 2.85 (s, 3H), 1.43 (t, 3H)
1-11	n-Pr	Me	1	
1-12	i-Pr	Me	1	
1-13	n-Bu	Me	1	
1-14	i-Bu	Me	1	
1-15	s-Bu	Me	1	
1-16	t-Bu	Me	1	
1-17	Me	Me	2	7.91 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.27 (s, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.27 (s, 3H), 2.76 (s, 3H)
1-18	Et	Me	2	
1-19	n-Pr	Me	2	
1-20	i-Pr	Me	2	
1-21	n-Bu	Me	2	
1-22	i-Bu	Me	2	
1-23	s-Bu	Me	2	
1-24	t-Bu	Me	2	
1-25	Me	Et	0	7.68 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.30 (s, 1H), 3.71 (s, 3H), 3.16 (q, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.19 (t, 3H)
1-26	Et	Et	0	
1-27	n-Pr	Et	0	
1-28	i-Pr	Et	0	
1-29	n-Bu	Et	0	
1-30	i-Bu	Et	0	
1-31	s-Bu	Et	0	
1-32	t-Bu	Et	0	
1-33	Me	Et	1	
1-34	Et	Et	1	
1-35	n-Pr	Et	1	
1-36	i-Pr	Et	1	
1-37	n-Bu	Et	1	
1-38	i-Bu	Et	1	
1-39	s-Bu	Et	1	
1-40	t-Bu	Et	1	

No.	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
1-41	Me	Et	2	
1-42	Et	Et	2	
1-43	n-Pr	Et	2	
1-44	i-Pr	Et	2	
1-45	n-Bu	Et	2	
1-46	i-Bu	Et	2	
1-47	s-Bu	Et	2	
1-48	t-Bu	Et	2	

表 B：本發明式 (I) 化合物，其中 R¹ 為乙基，且 R² 和 Y 各自為氫

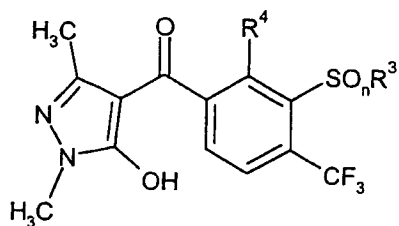


編號	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
2-1	Me	Me	0	7.69 (d, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.31 (s, 1H), 4.08 (q, 2H), 2.69 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.46 (t, 3H)
2-2	Et	Me	0	7.68 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.31 (s, 1H), 4.07 (q, 2H), 2.76 (q, 2H), 2.66 (s, 3H), 1.45 (t, 3H), 1.22 (t, 3H)
2-3	n-Pr	Me	0	
2-4	i-Pr	Me	0	
2-5	n-Bu	Me	0	
2-6	i-Bu	Me	0	
2-7	s-Bu	Me	0	
2-8	t-Bu	Me	0	
2-9	Me	Me	1	7.71 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.29 (s, 1H), 4.09 (q, 2H), 3.03 (s, 3H), 2.90 (s, 3H), 1.46 (t, 3H)
2-10	Et	Me	1	7.72 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.27 (s, 1H), 4.08 (q, 2H), 3.47 (dq, 1H), 2.96 (dq, 1H), 2.87 (s, 3H), 1.49 – 1.41 (m, 6H)
2-11	n-Pr	Me	1	

編號	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
2-12	i-Pr	Me	1	
2-13	n-Bu	Me	1	
2-14	i-Bu	Me	1	
2-15	s-Bu	Me	1	
2-16	t-Bu	Me	1	
2-17	Me	Me	2	7.91 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.28 (s, 1H), 4.08 (q, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.78 (s, 3H), 1.46 (t, 3H)
2-18	Et	Me	2	7.91 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.27 (s, 1H), 4.10 (q, 2H), 3.36 (q, 2H), 2.77 (s, 3H), 1.51 – 1.42 (m, 6H)
2-19	n-Pr	Me	2	
2-20	i-Pr	Me	2	
2-21	n-Bu	Me	2	
2-22	i-Bu	Me	2	
2-23	s-Bu	Me	2	
2-24	t-Bu	Me	2	
2-25	Me	Et	0	7.69 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.30 (s, 1H), 4.08 (q, 2H), 3.16 (q, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.46 (t, 3H), 1.20 (t, 3H)
2-26	Et	Et	0	
2-27	n-Pr	Et	0	
2-28	i-Pr	Et	0	
2-29	n-Bu	Et	0	
2-30	i-Bu	Et	0	
2-31	s-Bu	Et	0	
2-32	t-Bu	Et	0	
2-33	Me	Et	1	
2-34	Et	Et	1	
2-35	n-Pr	Et	1	
2-36	i-Pr	Et	1	
2-37	n-Bu	Et	1	
2-38	i-Bu	Et	1	
2-39	s-Bu	Et	1	
2-40	t-Bu	Et	1	
2-41	Me	Et	2	7.90 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.28 (s, 1H), 4.10 (q, 2H), 3.32 (q, 2H), 3.29 (s, 3H), 1.46 (t, 3H), 1.23 (t, 3H)

編號	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
2-42	Et	Et	2	
2-43	n-Pr	Et	2	
2-44	i-Pr	Et	2	
2-45	n-Bu	Et	2	
2-46	i-Bu	Et	2	
2-47	s-Bu	Et	2	
2-48	t-Bu	Et	2	

表 C：本發明式 (I) 化合物，其中 R¹ 和 R² 各自為甲基，且 Y 為氫

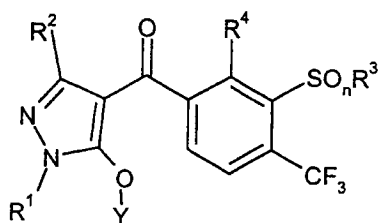


編號	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
3-1	Me	Me	0	7.69 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 3.62 (s, 3H), 2.60 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.62 (s, 3H)
3-2	Et	Me	0	7.72 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 3.66 (s, 3H), 2.78 (q, 2H), 2.59 (s, 3H), 1.66 (s, 3H), 1.26 (t, 3H)
3-3	n-Pr	Me	0	
3-4	i-Pr	Me	0	
3-5	n-Bu	Me	0	
3-6	i-Bu	Me	0	
3-7	s-Bu	Me	0	
3-8	t-Bu	Me	0	
3-9	Me	Me	1	7.72 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 3.66 (s, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.82 (s, 3H), 1.69 (s, 3H)
3-10	Et	Me	1	7.72 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 3.65 (s, 3H), 3.44 (dq, 1H), 2.93 (dq, 1H), 2.78 (s, 3H), 1.67 (s, 3H), 1.42 (t, 3H)
3-11	n-Pr	Me	1	
3-12	i-Pr	Me	1	

編號	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
3-13	n-Bu	Me	1	
3-14	i-Bu	Me	1	
3-15	s-Bu	Me	1	
3-16	t-Bu	Me	1	
3-17	Me	Me	2	7.91 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 3.65 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 2.71 (s, 3H), 1.68 (s, 3H)
3-18	Et	Me	2	
3-19	n-Pr	Me	2	
3-20	i-Pr	Me	2	
3-21	n-Bu	Me	2	
3-22	i-Bu	Me	2	
3-23	s-Bu	Me	2	
3-24	t-Bu	Me	2	
3-25	Me	Et	0	7.70 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 3.63 (s, 3H), 3.42 (q, 2H), 2.32 (s, 3H), 1.63 (s, 3H), 1.18 (t, 3H)
3-26	Et	Et	0	
3-27	n-Pr	Et	0	
3-28	i-Pr	Et	0	
3-29	n-Bu	Et	0	
3-30	i-Bu	Et	0	
3-31	s-Bu	Et	0	
3-32	t-Bu	Et	0	
3-33	Me	Et	1	
3-34	Et	Et	1	
3-35	n-Pr	Et	1	
3-36	i-Pr	Et	1	
3-37	n-Bu	Et	1	
3-38	i-Bu	Et	1	
3-39	s-Bu	Et	1	
3-40	t-Bu	Et	1	
3-41	Me	Et	2	
3-42	Et	Et	2	
3-43	n-Pr	Et	2	
3-44	i-Pr	Et	2	

編號	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
3-45	n-Bu	Et	2	
3-46	i-Bu	Et	2	
3-47	s-Bu	Et	2	
3-48	t-Bu	Et	2	

表 D：本發明式 (I) 化合物



編號	R¹	R²	R³	R⁴	n	Y	物理數據： ¹H-NMR: δ [CDCl₃]
4-1	Me	H	Me	Me	0	- SO₂-n-Pr	
4-2	Me	H	Et	Me	0	- SO₂-n-Pr	
4-3	Me	H	n-Pr	Me	0	- SO₂-n-Pr	
4-4	Me	H	Me	Me	1	- SO₂-n-Pr	7.68 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.71 (m, 2H), 3.00 (s, 3H), 2.83 (s, 3H), 2.12 (m, 2H), 1.18 (t, 3H)
4-5	Me	H	Et	Me	1	- SO₂-n-Pr	
4-6	Me	H	n-Pr	Me	1	- SO₂-n-Pr	
4-7	Me	H	Me	Me	2	- SO₂-n-Pr	7.90 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.43 (s, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.67 (m, 2H), 3.26 (s, 3H), 2.71 (s, 3H), 2.11 (m, 2H), 1.18 (t, 3H)
4-8	Me	H	Et	Me	2	- SO₂-n-Pr	
4-9	Me	H	n-Pr	Me	2	- SO₂-n-Pr	
4-10	Me	H	Me	Me	0	- SO₂-(CH₂)₂OMe	
4-11	Me	H	Et	Me	0	- SO₂-(CH₂)₂OMe	
4-12	Me	H	n-Pr	Me	0	- SO₂-(CH₂)₂OMe	
4-13	Me	H	Me	Me	1	- SO₂-(CH₂)₂OMe	7.68 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 4.04 (m, 4H), 3.91 (s, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.83 (s, 3H)

編號	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	Y	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
4-14	Me	H	Et	Me	1	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-15	Me	H	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-16	Me	H	Me	Me	2	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	7.89 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 4.02 (m, 4H), 3.91 (s, 3H), 3.45 (s, 3H) 3.25 (s, 3H), 2.71 (s, 3H)
4-17	Me	H	Et	Me	2	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-18	Me	H	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-19	Me	H	Me	Me	0	- SO ₂ -Ph	
4-20	Me	H	Et	Me	0	- SO ₂ -Ph	
4-21	Me	H	n-Pr	Me	0	- SO ₂ -Ph	
4-22	Me	H	Me	Me	1	- SO ₂ -Ph	7.98 (d, 2H), 7.77 (tt, 1H), 7.62 (m, 3H), 7.52 (s, 1H), 7.37 (d, 1H), 3.78 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2.77 (s, 3H)
4-23	Me	H	Et	Me	1	- SO ₂ -Ph	
4-24	Me	H	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -Ph	
4-25	Me	H	Me	Me	2	- SO ₂ -Ph	7.95 (d, 2H), 7.83 – 7.74 (m, 2H), 7.62 (m, 2H), 7.57 (s, 1H), 7.48 (d, 1H), 3.76 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 2.66 (s, 3H)
4-26	Me	H	Et	Me	2	- SO ₂ -Ph	
4-27	Me	H	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -Ph	
4-28	Me	H	Me	Me	0	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-29	Me	H	Et	Me	0	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-30	Me	H	n-Pr	Me	0	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-31	Me	H	Me	Me	1	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	7.83 (d, 2H), 7.61 (d, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.42 – 7.36 (m, 3H), 3.74 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2.78

編號	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	Y	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
							(s, 3H), 2.47 (s, 3H)
4-32	Me	H	Et	Me	1	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-33	Me	H	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-34	Me	H	Me	Me	2	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	7.80 (m, 3H), 7.61 (s, 1H), 7.49 (m, 1H), 7.41 (d, 2H), 3.73 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 2.67 (s, 3H), 2.47 (s, 3H)
4-35	Me	H	Et	Me	2	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-36	Me	H	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-37	Me	H	Me	Me	0	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-38	Me	H	Et	Me	0	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-39	Me	H	n-Pr	Me	0	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-40	Me	H	Me	Me	1	- SO ₂ -(thien-2-yl)	7.86 (m, 2H), 7.62 (d, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.22 (dd, 1H), 3.79 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2.78 (s, 3H)
4-41	Me	H	Et	Me	1	- SO ₂ -(Thien-2-yl)	
4-42	Me	H	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -(Thien-2-yl)	
4-43	Me	H	Me	Me	2	- SO ₂ -(Thien-2-yl)	7.88 (d, 1H), 7.86 – 7.82 (m, 2H), 7.58 (s, 1H), 7.52 (m, 1H), 7.22 (m, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 2.67 (s, 3H)
4-44	Me	H	Et	Me	2	- SO ₂ -(Thien-2-yl)	
4-45	Me	H	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -(Thien-2-yl)	
4-46	Me	H	Me	Me	0	- CO-Ph	
4-47	Me	H	Et	Me	0	- CO-Ph	
4-48	Me	H	n-Pr	Me	0	- CO-Ph	
4-49	Me	H	Me	Me	1	- CO-Ph	7.93 – 7.87 (m, 3H), 7.68 (t, 1H), 7.52 – 7.36 (m, 4H), 3.73 (s, 3H),

編號	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	Y	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
							2.87 (s, 3H), 2.81 (s, 3H)
4-50	Me	H	Et	Me	1	- CO-Ph	
4-51	Me	H	n-Pr	Me	1	- CO-Ph	
4-52	Me	H	Me	Me	2	- CO-Ph	7.93 (s, 1H), 7.85 (d, 2H), 7.68 (tt, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.52 – 7.46 (m, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.10 (s, 3H), 2.68 (s, 3H)
4-53	Me	H	Et	Me	2	- CO-Ph	
4-54	Me	H	n-Pr	Me	2	- CO-Ph	
4-55	Me	H	Me	Me	0	- CO-SEt	
4-56	Me	H	Et	Me	0	- CO-SEt	
4-57	Me	H	n-Pr	Me	0	- CO-SEt	
4-58	Me	H	Me	Me	1	- CO-SEt	7.72 (s, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 3.72 (s, 3H), 2.99 (s, 3H), 2.92 (q, 2H), 2.81 (s, 3H), 1.32 (t, 3H)
4-59	Me	H	Et	Me	1	- CO-SEt	
4-60	Me	H	n-Pr	Me	1	- CO-SEt	
4-61	Me	H	Me	Me	2	- CO-SEt	7.87 (d, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.53 (d, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 2.89 (q, 2H), 2.68 (s, 3H), 1.32 (t, 3H)
4-62	Me	H	Et	Me	2	- CO-SEt	
4-63	Me	H	n-Pr	Me	2	- CO-SEt	
4-64	Me	H	Me	Me	0	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-65	Me	H	Et	Me	0	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-66	Me	H	n-Pr	Me	0	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-67	Me	H	Me	Me	1	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	7.82 (d, 2H), 7.62 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.29 (d, 2H), 7.13 (s, 1H),

編號	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	Y	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
							6.22 (d, 1H), 6.12 (d, 1H), 3.89 (s, 3H), 2.96 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 2.41 (s, 3H)
4-68	Me	H	Et	Me	1	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-69	Me	H	n-Pr	Me	1	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-70	Me	H	Me	Me	2	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	7.82 (m, 3H), 7.52 (d, 1H), 7.30 (d, 2H), 7.12 (s, 1H), 6.16 (s, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 2.58 (s, 3H), 2.42 (s, 3H)
4-71	Me	H	Et	Me	2	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-72	Me	H	n-Pr	Me	2	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-73	Et	H	Me	Me	0	- SO ₂ -n-Pr	
4-74	Et	H	Et	Me	0	- SO ₂ -n-Pr	
4-75	Et	H	n-Pr	Me	0	- SO ₂ -n-Pr	
4-76	Et	H	Me	Me	1	- SO ₂ -n-Pr	
4-77	Et	H	Et	Me	1	- SO ₂ -n-Pr	
4-78	Et	H	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -n-Pr	
4-79	Et	H	Me	Me	2	- SO ₂ -n-Pr	
4-80	Et	H	Et	Me	2	- SO ₂ -n-Pr	
4-81	Et	H	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -n-Pr	
4-82	Et	H	Me	Me	0	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-83	Et	H	Et	Me	0	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-84	Et	H	n-Pr	Me	0	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-85	Et	H	Me	Me	1	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-86	Et	H	Et	Me	1	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-87	Et	H	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-88	Et	H	Me	Me	2	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-89	Et	H	Et	Me	2	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-90	Et	H	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-91	Et	H	Me	Me	0	- SO ₂ -Ph	
4-92	Et	H	Et	Me	0	- SO ₂ -Ph	

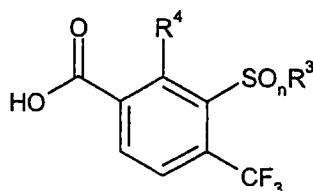
編號	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	Y	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
4-93	Et	H	n-Pr	Me	0	- SO ₂ -Ph	
4-94	Et	H	Me	Me	1	- SO ₂ -Ph	
4-95	Et	H	Et	Me	1	- SO ₂ -Ph	
4-96	Et	H	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -Ph	
4-97	Et	H	Me	Me	2	- SO ₂ -Ph	
4-98	Et	H	Et	Me	2	- SO ₂ -Ph	
4-99	Et	H	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -Ph	
4-100	Et	H	Me	Me	0	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-101	Et	H	Et	Me	0	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-102	Et	H	n-Pr	Me	0	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-103	Et	H	Me	Me	1	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-104	Et	H	Et	Me	1	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-105	Et	H	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-106	Et	H	Me	Me	2	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-107	Et	H	Et	Me	2	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-108	Et	H	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-109	Et	H	Me	Me	0	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-110	Et	H	Et	Me	0	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-111	Et	H	n-Pr	Me	0	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-112	Et	H	Me	Me	1	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-113	Et	H	Et	Me	1	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-114	Et	H	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-115	Et	H	Me	Me	2	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-116	Et	H	Et	Me	2	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-117	Et	H	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-118	Et	H	Me	Me	0	- CO-Ph	
4-119	Et	H	Et	Me	0	- CO-Ph	
4-120	Et	H	n-Pr	Me	0	- CO-Ph	
4-121	Et	H	Me	Me	1	- CO-Ph	
4-122	Et	H	Et	Me	1	- CO-Ph	
4-123	Et	H	n-Pr	Me	1	- CO-Ph	
4-124	Et	H	Me	Me	2	- CO-Ph	
4-125	Et	H	Et	Me	2	- CO-Ph	
4-126	Et	H	n-Pr	Me	2	- CO-Ph	

編號	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	Y	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
4-127	Et	H	Me	Me	0	- CO-SEt	
4-128	Et	H	Et	Me	0	- CO-SEt	
4-129	Et	H	n-Pr	Me	0	- CO-SEt	
4-130	Et	H	Me	Me	1	- CO-SEt	
4-131	Et	H	Et	Me	1	- CO-SEt	
4-132	Et	H	n-Pr	Me	1	- CO-SEt	
4-133	Et	H	Me	Me	2	- CO-SEt	
4-134	Et	H	Et	Me	2	- CO-SEt	
4-135	Et	H	n-Pr	Me	2	- CO-SEt	
4-136	Et	H	Me	Me	0	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-137	Et	H	Et	Me	0	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-138	Et	H	n-Pr	Me	0	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-139	Et	H	Me	Me	1	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-140	Et	H	Et	Me	1	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-141	Et	H	n-Pr	Me	1	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-142	Et	H	Me	Me	2	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-143	Et	H	Et	Me	2	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-144	Et	H	n-Pr	Me	2	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-145	Me	Me	Me	Me	0	- SO ₂ -n-Pr	
4-146	Me	Me	Et	Me	0	- SO ₂ -n-Pr	
4-147	Me	Me	n-Pr	Me	0	- SO ₂ -n-Pr	
4-148	Me	Me	Me	Me	1	- SO ₂ -n-Pr	
4-149	Me	Me	Et	Me	1	- SO ₂ -n-Pr	
4-150	Me	Me	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -n-Pr	
4-151	Me	Me	Me	Me	2	- SO ₂ -n-Pr	
4-152	Me	Me	Et	Me	2	- SO ₂ -n-Pr	
4-153	Me	Me	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -n-Pr	
4-154	Me	Me	Me	Me	0	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-155	Me	Me	Et	Me	0	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-156	Me	Me	n-Pr	Me	0	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-157	Me	Me	Me	Me	1	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-158	Me	Me	Et	Me	1	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-159	Me	Me	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-160	Me	Me	Me	Me	2	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	

編號	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	Y	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
4-161	Me	Me	Et	Me	2	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-162	Me	Me	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -(CH ₂) ₂ OMe	
4-163	Me	Me	Me	Me	0	- SO ₂ -Ph	
4-164	Me	Me	Et	Me	0	- SO ₂ -Ph	
4-165	Me	Me	n-Pr	Me	0	- SO ₂ -Ph	
4-166	Me	Me	Me	Me	1	- SO ₂ -Ph	
4-167	Me	Me	Et	Me	1	- SO ₂ -Ph	
4-168	Me	Me	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -Ph	
4-169	Me	Me	Me	Me	2	- SO ₂ -Ph	
4-170	Me	Me	Et	Me	2	- SO ₂ -Ph	
4-171	Me	Me	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -Ph	
4-172	Me	Me	Me	Me	0	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-173	Me	Me	Et	Me	0	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-174	Me	Me	n-Pr	Me	0	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-175	Me	Me	Me	Me	1	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-176	Me	Me	Et	Me	1	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-177	Me	Me	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-178	Me	Me	Me	Me	2	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-179	Me	Me	Et	Me	2	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-180	Me	Me	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -(4-Me-Ph)	
4-181	Me	Me	Me	Me	0	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-182	Me	Me	Et	Me	0	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-183	Me	Me	n-Pr	Me	0	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-184	Me	Me	Me	Me	1	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-185	Me	Me	Et	Me	1	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-186	Me	Me	n-Pr	Me	1	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-187	Me	Me	Me	Me	2	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-188	Me	Me	Et	Me	2	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-189	Me	Me	n-Pr	Me	2	- SO ₂ -(thien-2-yl)	
4-190	Me	Me	Me	Me	0	- CO-Ph	
4-191	Me	Me	Et	Me	0	- CO-Ph	
4-192	Me	Me	n-Pr	Me	0	- CO-Ph	
4-193	Me	Me	Me	Me	1	- CO-Ph	
4-194	Me	Me	Et	Me	1	- CO-Ph	

編號	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	Y	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
4-195	Me	Me	n-Pr	Me	1	- CO-Ph	
4-196	Me	Me	Me	Me	2	- CO-Ph	
4-197	Me	Me	Et	Me	2	- CO-Ph	
4-198	Me	Me	n-Pr	Me	2	- CO-Ph	
4-199	Me	Me	Me	Me	0	- CO-SEt	
4-200	Me	Me	Et	Me	0	- CO-SEt	
4-201	Me	Me	n-Pr	Me	0	- CO-SEt	
4-202	Me	Me	Me	Me	1	- CO-SEt	
4-203	Me	Me	Et	Me	1	- CO-SEt	
4-204	Me	Me	n-Pr	Me	1	- CO-SEt	
4-205	Me	Me	Me	Me	2	- CO-SEt	
4-206	Me	Me	Et	Me	2	- CO-SEt	
4-207	Me	Me	n-Pr	Me	2	- CO-SEt	
4-208	Me	Me	Me	Me	0	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-209	Me	Me	Et	Me	0	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-210	Me	Me	n-Pr	Me	0	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-211	Me	Me	Me	Me	1	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-212	Me	Me	Et	Me	1	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-213	Me	Me	n-Pr	Me	1	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-214	Me	Me	Me	Me	2	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-215	Me	Me	Et	Me	2	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	
4-216	Me	Me	n-Pr	Me	2	- CH ₂ -CO-(4-Me-Ph)	

表 E：本發明通式（IIIb）化合物

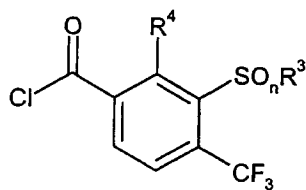


編號	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
5-1	Me	Me	0	7.98 (d, 1H), 7.66 (d, 1H), 2.92 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
5-2	Et	Me	0	7.98 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 2.91 (s, 3H), 2.75 (q, 2H), 1.22 (t, 3H)

編號	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
5-3	n-Pr	Me	0	
5-4	i-Pr	Me	0	
5-5	n-Bu	Me	0	
5-6	i-Bu	Me	0	
5-7	s-Bu	Me	0	
5-8	t-Bu	Me	0	
5-9	Me	Me	1	(DMSO-d ₆): 7.92 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 3.04 (s, 3H), 2.91 (s, 3H)
5-10	Et	Me	1	(DMSO-d ₆): 7.92 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 3.46 (dq, 1H), 3.02 (dq, 1H), 2.88 (s, 3H), 1.27 (t, 3H)
5-11	n-Pr	Me	1	
5-12	i-Pr	Me	1	
5-13	n-Bu	Me	1	
5-14	i-Bu	Me	1	
5-15	s-Bu	Me	1	
5-16	t-Bu	Me	1	
5-17	Me	Me	2	8.11 (d, 1H), 7.87 (d, 1H), 3.30 (s, 3H), 2.96 (s, 3H)
5-18	Et	Me	2	
5-19	n-Pr	Me	2	
5-20	i-Pr	Me	2	
5-21	n-Bu	Me	2	
5-22	i-Bu	Me	2	
5-23	s-Bu	Me	2	
5-24	t-Bu	Me	2	
5-25	Me	Et	0	
5-26	Et	Et	0	
5-27	n-Pr	Et	0	
5-28	i-Pr	Et	0	
5-29	n-Bu	Et	0	
5-30	i-Bu	Et	0	
5-31	s-Bu	Et	0	
5-32	t-Bu	Et	0	
5-33	Me	Et	1	
5-34	Et	Et	1	
5-35	n-Pr	Et	1	

編號	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
5-36	i-Pr	Et	1	
5-37	n-Bu	Et	1	
5-38	i-Bu	Et	1	
5-39	s-Bu	Et	1	
5-40	t-Bu	Et	1	
5-41	Me	Et	2	8.07 (d, 1H), 7.87 (d, 1H), 3.50 (q, 2H), 3.29 (s, 3H), 1.36 (t, 3H)
5-42	Et	Et	2	
5-43	n-Pr	Et	2	
5-44	i-Pr	Et	2	
5-45	n-Bu	Et	2	
5-46	i-Bu	Et	2	
5-47	s-Bu	Et	2	
5-48	t-Bu	Et	2	

表 F：本發明通式（III）化合物



編號	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
6-1	Me	Me	0	
6-2	Et	Me	0	
6-3	n-Pr	Me	0	
6-4	i-Pr	Me	0	
6-5	n-Bu	Me	0	
6-6	i-Bu	Me	0	
6-7	s-Bu	Me	0	
6-8	t-Bu	Me	0	
6-9	Me	Me	1	
6-10	Et	Me	1	
6-11	n-Pr	Me	1	
6-12	i-Pr	Me	1	

編號	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
6-13	n-Bu	Me	1	
6-14	i-Bu	Me	1	
6-15	s-Bu	Me	1	
6-16	t-Bu	Me	1	
6-17	Me	Me	2	
6-18	Et	Me	2	
6-19	n-Pr	Me	2	
6-20	i-Pr	Me	2	
6-21	n-Bu	Me	2	
6-22	i-Bu	Me	2	
6-23	s-Bu	Me	2	
6-24	t-Bu	Me	2	
6-25	Me	Et	0	
6-26	Et	Et	0	
6-27	n-Pr	Et	0	
6-28	i-Pr	Et	0	
6-29	n-Bu	Et	0	
6-30	i-Bu	Et	0	
6-31	s-Bu	Et	0	
6-32	t-Bu	Et	0	
6-33	Me	Et	1	
6-34	Et	Et	1	
6-35	n-Pr	Et	1	
6-36	i-Pr	Et	1	
6-37	n-Bu	Et	1	
6-38	i-Bu	Et	1	
6-39	s-Bu	Et	1	
6-40	t-Bu	Et	1	
6-41	Me	Et	2	
6-42	Et	Et	2	
6-43	n-Pr	Et	2	
6-44	i-Pr	Et	2	
6-45	n-Bu	Et	2	
6-46	i-Bu	Et	2	

編號	R ³	R ⁴	n	物理數據： ¹ H-NMR: δ [CDCl ₃]
6-47	s-Bu	Et	2	
6-48	t-Bu	Et	2	

B. 調合物實例

1. 粉劑

粉劑係藉由使 10 重量份的通式 (I) 化合物和 90 重量份的滑石 (作為惰性物質) 混合且於鏈磨機中研磨混合物而得到。

2. 可分散的粉末

輕易分散在水中的可濕性粉末係藉由使 25 重量份的通式 (I) 化合物、64 重量份的含有高嶺土之石英 (作為惰性物質)、10 重量份的木質磺酸鉀和 1 重量份的油醯基甲基牛磺酸鈉 (作為濕潤劑和分散劑) 混合且於盤磨機中研磨混合物而得到的。

3. 分散性濃縮物

輕易分散在水中的分散性濃縮物係藉由使 20 重量份的通式 (I) 化合物與 6 重量份的烷基酚聚乙二醇醚 (®Triton X 207)、3 重量份的異十三烷醇聚乙二醇醚 (8 EO) 和 71 重量份的石蠟礦物油 (沸點範圍, 例如, 從約 255 至高於 277°C), 且於摩擦球磨機中研磨混合物至小於 5 微米的細微度而得到的。

4. 可乳化的濃縮物

可乳化的濃縮物係從 15 重量份的通式 (I) 化合物、

75 重量份的環己酮（作為溶劑）和 10 重量份的乙氧基壬基酚（作為乳化劑）而得到的。

5. 水可分散的顆粒

水可分散的顆粒係藉由混合

75 重量份的通式（I）化合物，

10 重量份的木質磺酸鈣，

5 重量份的月桂基硫酸鈉，

3 重量份的聚乙烯醇和

7 重量份的高嶺土

，在針-盤式磨機中研磨混合物，和在流動化床上藉由噴霧在水（作為造粒液體）上使粉末顆粒化而得到的。

水可分散的顆粒亦藉由在膠體研磨機中均質化和預粉碎下述成分：

25 重量份的通式（I）化合物，

5 重量份的 2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸鈉，

2 重量份的油醯基甲基牛磺酸鈉，

1 重量份的聚乙烯醇，

17 重量份的碳酸鈣和

50 重量份的水

之後在珠磨機上研磨混合物，且在噴霧塔中經由 1-物質噴嘴（one-substance nozzle）霧化和乾燥得到的懸浮液，而得到的。

C. 生物實例

1. 抗有害植物的萌芽前除草作用

單-和雙子葉有害植物的種子或根莖塊被置於直徑 9 至 13cm 盆中的沙壤土內且用土壤覆蓋。已被調製成可乳化濃縮物或粉劑形式的除草劑物係以不同劑量之水性分散液或懸浮液或乳液施用至覆蓋土壤的表面，施用速率 300 至 800 l 水/ha（已轉換）。為進一步栽培植物，盆之後被置於溫室且在最理想的條件下。處理之後 3-4 星期，視覺評分對有害植物的損害。如這些比較表的結果所示，所選用的本發明化合物比先前技術所揭示的化合物對寬廣範圍經濟性重要的單-和雙子葉有害植物具有更好的除草活性。

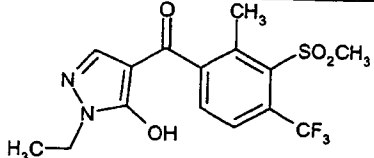
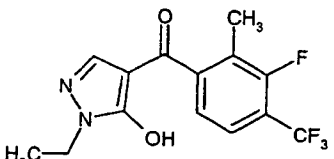
2. 抗有害植物的萌芽後除草作用

單-或雙子葉有害植物的種子被置於硬紙板盆中的沙壤土裡、用土壤覆蓋且在溫室於良好生長條件下生長。播種之後 2 至 3 星期，試驗植物在三葉階段時被處理。被調配成可濕性粉末或乳液濃縮物之本發明化合物以表 1 至 5 中所述之劑量被噴霧在綠色植物部分的表面，施用速率 600 至 800 l 水/ha（已轉換）。試驗植物被置於溫室且於最理想的生長條件約 3 至 4 星期之後，與先前技術所揭示之化合物相比，評分本發明化合物的作用。如這些比較表的結果所示，所選用的本發明化合物比先前技術所揭示的化合物對寬廣範圍經濟性重要的單-和雙子葉有害植物具有更好的除草活性。

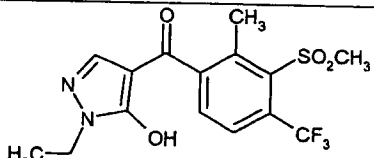
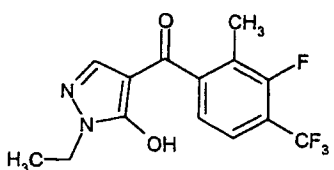
下面比較表中所使用的縮寫意義：

ABUTH	青麻 (<i>Abutilon theophrasti</i>)
AMARE	青莧 (<i>Amaranthus retroflexus</i>)
AVEFA	野燕麥 (<i>Avena fatua</i>)
DIGSA	馬唐 (<i>Digitaria sanguinalis</i>)
ECHCG	稗草 (<i>Echinochloa crus galli</i>)
GALAP	豬殃殃 (<i>Galium aparine</i>)
LOLMU	義大利黑麥草 (<i>Lolium multiflorum</i>)
MATIN	<i>Matricaria inodora</i>
POLCO	卷莖蓼 (<i>Polygonum convolvulus</i>)
SETVI	狗尾草 (<i>Setaria viridis</i>)
STEME	鵝兒腸 (<i>Stellaria media</i>)
VERPE	婆婆納 (<i>Veronica persica</i>)
VIOTR	三色堇 (<i>Viola tricolor</i>)
XANST	蒼耳 (<i>Xanthium strumarium</i>)

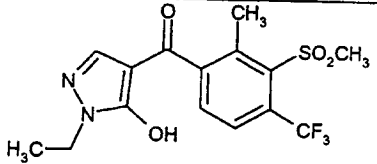
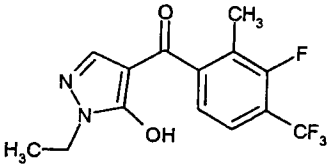
比較表 1：萌芽前

化合物編號	劑量 [g a.i./ha]	抵抗有害植物的活性		
		ECHCG	LOLMU	ABUTH
 本發明化合物	80	100%	70%	100%
 先前技術已知化合物	80	30%	0%	0%

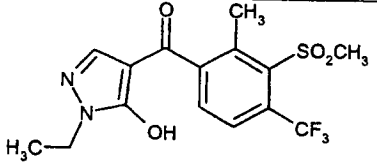
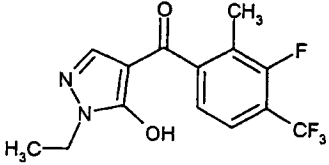
比較表 2：萌芽前

化合物編號	劑量 [g a.i./ha]	抵抗有害植物的活性		
		AMARE	STEME	VERPE
 本發明化合物	80	90%	90%	90%
 先前技術已知化合物	80	0%	40%	0%

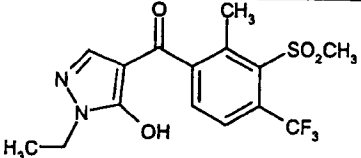
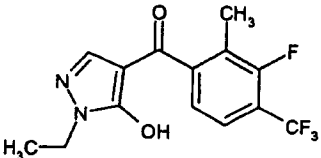
比較表 3：萌芽後

化合物編號	劑量 [g a.i./ha]	抵抗有害植物的活性		
		ECHCG	LOLMU	SETVI
 本發明化合物	80	90%	60%	100%
 先前技術已知化合物	80	0%	0%	0%

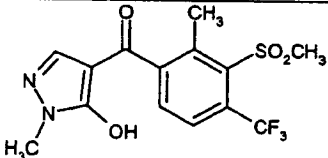
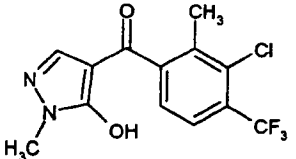
比較表 4：萌芽後

化合物編號	劑量 [g a.i./ha]	抵抗有害植物的活性		
		ABUTH	AMARE	MATIN
 本發明化合物	80	90%	100%	90%
 先前技術已知化合物	80	80%	0%	0%

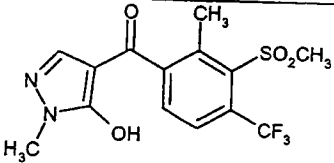
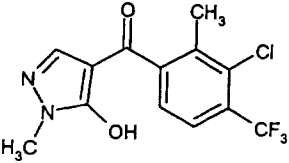
比較表 5：萌芽後

化合物編號	劑量 [g a.i./ha]	抵抗有害植物的活性			
		POLCO	STEME	VERPE	VIOTR
 本發明化合物	80	100%	90%	90%	80%
 先前技術已知化合物	80	60%	0%	0%	0%

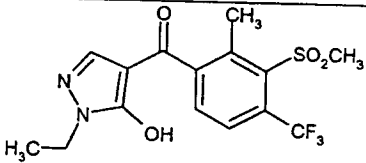
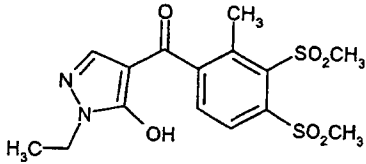
比較表 6：萌芽前

化合物編號	劑量 [g a.i./ha]	抵抗有害植物的活性			
		AVESA	LOLMU	SETVI	AMARE
 本發明化合物	320	90%	90%	100%	100%
 先前技術已知化合物	320	20%	20%	20%	50%

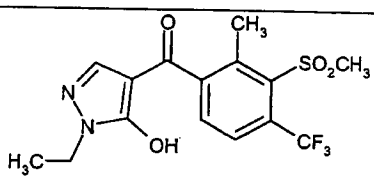
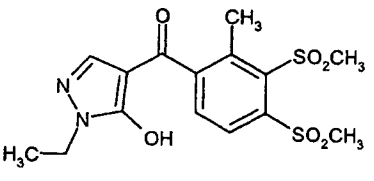
比較表 7：萌芽後

化合物編號	劑量 [g a.i./ha]	抵抗有害植物的活性			
		AVESA	ECHCG	LOLMU	SETVI
 本發明化合物	80	70%	90%	80%	90%
 先前技術已知化合物	320	20%	0%	20%	30%

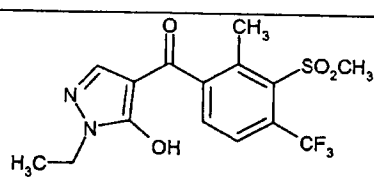
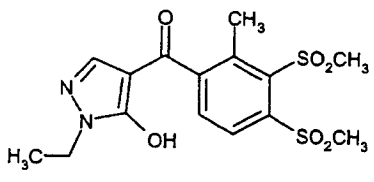
比較表 8：萌芽前

化合物編號	劑量 [g a.i./ha]	抵抗有害植物的活性		
		LOLMU	GALAP	POLCO
 本發明化合物	80	70%	80%	50%
 先前技術已知化合物	80	0%	60%	30%

比較表 9：萌芽前

化合物編號	劑量 [g a.i./ha]	抵抗有害植物的活性		
		VERPE	VIOTR	XANST
 本發明化合物	80	90%	90%	100%
 先前技術已知化合物	80	80%	20%	40%

比較表 10：萌芽後

化合物編號	劑量 [g a.i./ha]	抵抗有害植物的活性			
		DIGSA	ECHCG	LOLMU	SETVI
 本發明化合物	80	100%	90%	60%	100%
 先前技術已知化合物	80	80%	80%	20%	80%

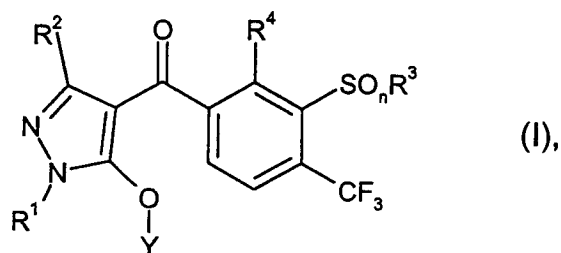
比較表 11：萌芽後

化合物編號	劑量 [g a.i./ha]	抵抗有害植物的活性			
		MATIN	VERPE	VIOTR	XANST
<chem>CCN1C=CC(=C1C(=O)c2cc(C)c(S(=O)(=O)C)cc2C(F)(F)F)O</chem> 本發明化合物	80	90%	90%	80%	100%
<chem>CCN1C=CC(=C1C(=O)c2cc(C)c(S(=O)(=O)C)cc2S(=O)(=O)C)O</chem> 先前技術已知化合物	80	40%	80%	50%	70%

五、中文發明摘要

發明之名稱：4-（4-三氟甲基-3-硫基苯甲醯基）吡唑類及其作為除草劑之用途

本案係描述通式（I）之 4-（4-三氟甲基-3-硫基苯甲醯基）吡唑類及其作為除草劑之用途。

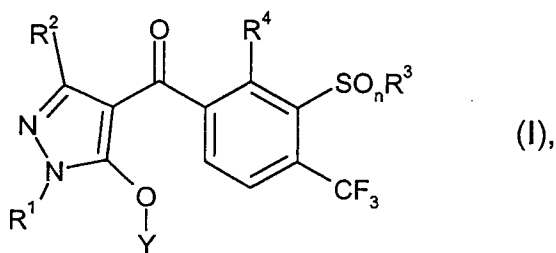


於此通式（I）中， R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 為例如氫之基團，和例如烷基之有機基團。Y 為氫或保護基，例如甲苯磺醯基。

六、英文發明摘要

發明之名稱：**4-(4-trifluoromethyl-3-thiobenzoyl)pyrazoles and their use as herbicides**

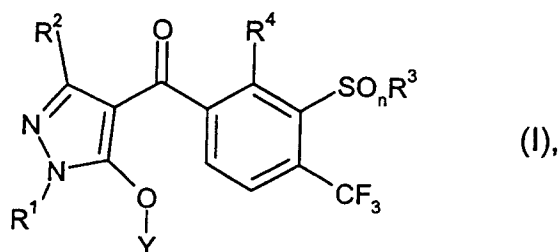
What is described are 4-(4-trifluoromethyl-3-thiobenzoyl)pyrazoles of the general formula (I) and their use as herbicides.



In this formula (I), R^1 , R^2 , R^3 and R^4 are radicals such as hydrogen and organic radicals, such as alkyl. Y is hydrogen or a protective group, such as tosyl.

十、申請專利範圍

1. 一種式 (I) 之 4- (4-三氟甲基-3-硫基苯甲醯基) 吡唑 , 或其鹽類



其中

R^1 為 (C_1-C_4) -烷基 ,

R^2 為氫或 (C_1-C_4) -烷基 ,

R^3 為 (C_1-C_4) -烷基 ,

R^4 為 (C_1-C_4) -烷基 ,

Y 為氫、(C_1-C_6) -烷基磺醯基、(C_1-C_4) -烷氧基 - (C_1-C_6) -烷基磺醯基 , 或為苯基磺醯基、噻吩基-2-磺醯基、苯甲醯基、苯甲醯基 - (C_1-C_6) -烷基或苯甲基 , 其每一者經 m 個相同或不同取代基取代 , 該取代基選自鹵素、(C_1-C_4) -烷基和 (C_1-C_4) -烷氧基 ,

m 為 0、1、2、或 3 ,

n 為 0、1 或 2。

2. 如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 之 4- (4-三氟甲基-3-硫基苯甲醯基) 吡唑 , 其中

R^1 為甲基或乙基 ,

R^2 為氫、甲基或乙基 ,

R^3 為甲基或乙基 ,

R^4 爲甲基或乙基，

Y 爲氫、 (C_1-C_3) -烷基磺醯基、 (C_1-C_2) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基磺醯基，或爲苯基磺醯基、噻吩基-2-磺醯基、苯甲醯基、苯甲醯基- (C_1-C_6) -烷基或苯甲基，其每一者經 m 個甲基取代，

m 爲 0 或 1，

n 爲 0、1 或 2。

3. 如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 之 4-(4-三氟甲基-3-硫基苯甲醯基) 吡啶，其中

R^1 爲甲基或乙基，

R^2 爲氫、甲基或乙基，

R^3 爲甲基或乙基，

R^4 爲甲基或乙基，

Y 爲氫，

n 爲 0、1 或 2。

4. 一種除草性組成物，其包括除草有效量之至少一種如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 化合物。

5. 如申請專利範圍第 4 項之除草性組成物，其係爲與調合助劑之混合物。

6. 一種防治不欲植物之方法，其包括施用有效量之至少一種如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 化合物或如申請專利範圍第 4 項之除草性組成物至植物或不欲植物生長之地點。

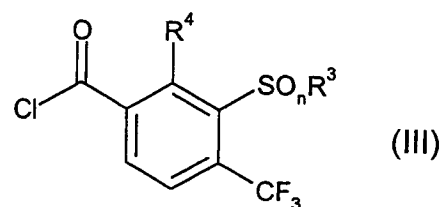
7. 一種如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 化合物或如

申請專利範圍第 4 項之除草性組成物之用途，其係用於防治不欲植物。

8.如申請專利範圍第 7 項之用途，其中式 (I) 化合物係用於防治有用植物群中的不欲植物。

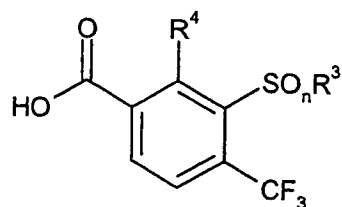
9.如申請專利範圍第 8 項之用途，其中該有用植物為基因轉殖有用植物。

10.一種式 (III) 化合物，



其中 R^3 、 R^4 和 n 為如申請專利範圍第 1 項中所定義者。

11.一種式 (IIIb) 化合物，



其中 R^3 、 R^4 和 n 為如申請專利範圍第 1 項中所定義者。

七、指定代表圖：

(一) 本案指定代表圖為：無

(二) 本代表圖之元件符號簡單說明：無

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：式 I

