

# 發明專利說明書 200305667

(填寫本書件時請先行詳閱申請書後之申請須知，作※記號部分請勿填寫)

※申請案號：P2105616 ※IPC分類：H01N 37/18  
※申請日期：P2. 3. 14 607C 251/48

## 壹、發明名稱

(中文) Z-取代之丙烯醯胺，其製備及含彼等之組合物  
(英文) Z-SUBSTITUTED ACRYLAMIDES, THEIR PREPARATION AND  
COMPOSITIONS COMPRISING THEM

## 貳、發明人 (共 15 人)

發明人 1 (如發明人超過一人，請填說明書發明人續頁)

姓名：(中文) 瓦西里歐斯 葛蒙農  
(英文) WASSILIOS GRAMMENOS

住居所地址：(中文) 德國來恩河勞域沙芬市柏西葛街5號  
(英文) BORSIGSTR. 5. 67053 LUDWIGSHAFEN, GERMANY

國籍：(中文) 希臘 (英文) GREECE

## 參、申請人 (共 1 人)

申請人 1 (如申請人超過一人，請填說明書申請人續頁)

姓名或名稱：(中文) 德商巴地斯顏料化工廠  
(英文) BASF AKTIENGESELLSCHAFT

住居所或營業所地址：(中文) 德國來恩河勞域沙芬市  
(英文) 67056 LUDWIGSHAFEN, GERMANY

國籍：(中文) 德國 (英文) GERMANY

代表人：(中文) 1. 史達克 2. 衛克  
(英文) 1. PPA. STARK 2. PPA. WICKE

發明人 2

姓名：(中文) 湯瑪斯 葛特

(英文) THOMAS GROTE

住居所地址：(中文) 德國瓦臣漢市伊恩赫恩漢辛路 18 號

(英文) IM HOEHENHAUSEN 18, 67157 WACHENHEIM,

GERMANY

國籍：(中文) 德國

(英文) GERMANY

發明人 3

姓名：(中文) 卡斯汀 貝特尼

(英文) CARSTEN BLETTNER

住居所地址：(中文) 德國蒙漢市李查華格納路 48 號

(英文) RICHARD-WAGNER-STR. 48, 68165 MANNHEIM,

GERMANY

國籍：(中文) 德國

(英文) GERMANY

發明人 4

姓名：(中文) 馬庫斯 葛衛赫

(英文) MARKUS GEWEHR

住居所地址：(中文) 德國凱斯特勞市葛斯街 21 號

(英文) GOETHESTRABE 21, 56288 KASTELLAUN, GERMANY

國籍：(中文) 德國

(英文) GERMANY

發明人 5

姓名：(中文) 安卓斯 亞普西

(英文) ANDREAS GYPSE

住居所地址：(中文) 德國蒙漢市 B4 街 4 號

(英文) B4 4, 68159 MANNHEIM, GERMANY

國籍：(中文) 德國

(英文) GERMANY

發明人 6

姓名：(中文) 柏納 穆爾

(英文) BERND MULLER

住居所地址：(中文) 德國法蘭肯斯市史達克林街 7 號

(英文) STOCKINGERSTR. 7, 67227 FRANKENTHAL, GERMANY

國籍：(中文) 德國

(英文) GERMANY

發明人 7

姓名：(中文) 傑卡恩 芮林赫蒙

(英文) JOACHIM RHEINHEIMER

住居所地址：(中文) 德國來恩河勞域沙芬市門查葛街 24 號

(英文) MERZIGER STR. 24, 67063 LUDWIGSHAFEN, GERMANY

國籍：(中文) 德國

(英文) GERMANY

發明人 8

姓名：(中文) 彼得 雪夫

(英文) PETER SCHAFFER

住居所地址：(中文) 德國歐特司漢市洛蒙街 1 號

(英文) ROMERSTR. 1, 67308 OTTERSHEIM, GERMANY

國籍：(中文) 德國

(英文) GERMANY

發明人 9

姓名：(中文) 安傑 雪衛爾

(英文) ANJA SCHWOGLER

住居所地址：(中文) 德國蒙漢市辛芮屈-蘭茲街 3 號

(英文) HEINRICH-LANZ-STR. 3, 68165 MANNHEIM, GERMANY

國籍：(中文) 德國

(英文) GERMANY

發明人 10

姓名：(中文) 傑狄 圖馬 I 保斯卡

(英文) JORDI TORMO I BLASCO

住居所地址：(中文) 德國勞汀貝許市卡爾-班茲街 10-3 號

(英文) CARL-BENZ-STR. 10-3, 69514 LAUDENBACH, GERMANY

國籍：(中文) 西班牙

(英文) SPAIN

發明人 11

姓名：(中文) 諾貝特 葛茲

(英文) NORBERT GOTZ

住居所地址：(中文) 德國瓦恩市雪夫爾街 25 號

(英文) SCHOFFERSTR.25, 67547 WORMS, GERMANY

國籍：(中文) 德國

(英文) GERMANY

發明人 12

姓名：(中文) 吉西拉 洛蘭

(英文) GISELA LORENZ

住居所地址：(中文) 德國拿史達市伊爾林衛街 13 號

(英文) ERLLENWEG 13, 67434 NEUSTADT, GERMANY

國籍：(中文) 德國

(英文) GERMANY

發明人 13

姓名：(中文) 伊柏赫 亞蒙漢

(英文) EBERHARD AMMERMAN

住居所地址：(中文) 德國喜潘漢市凡葛格街 2 號

(英文) VON-GAGERN-STR. 2, 64646 HEPPENHEIM, GERMANY

國籍：(中文) 德國

(英文) GERMANY

發明人 14

姓名：(中文) 西葛菲 史崔斯蒙

(英文) SIEGFRIED STRATHMANN

住居所地址：(中文) 德國林柏葛赫夫市都尼柏格街9號

(英文) DONNERSBERGSTR. 9, 67117 LIMBURGERHOF.

GERMANY

國籍：(中文) 德國

(英文) GERMANY

發明人 15

姓名：(中文) 芮尼赫得 史堤爾

(英文) REINHARD STIERL

住居所地址：(中文) 德國密特史達市金司特街17號

(英文) GINSTERSTR. 17, 67112 MUTTERSTADT, GERMANY

國籍：(中文) 德國

(英文) GERMANY

## 捌、聲明事項

☐ 本案係符合專利法第二十條第一項 ☐ 第一款但書或 ☐ 第二款但書規定之期間，其日期為：\_\_\_\_\_

☒ 本案已向下列國家（地區）申請專利，申請日期及案號資料如下：

【格式請依：申請國家（地區）；申請日期；申請案號 順序註記】

1. 德國；2002 年 03 月 14 日；10211291.6

2. 德國；2002 年 04 月 25 日；10218619.7

3. \_\_\_\_\_

☒ 主張專利法第二十四條第一項優先權：

【格式請依：受理國家（地區）；日期；案號 順序註記】

1. 德國；2002 年 03 月 14 日；10211291.6

2. 德國；2002 年 04 月 25 日；10218619.7

3. \_\_\_\_\_

4. \_\_\_\_\_

5. \_\_\_\_\_

6. \_\_\_\_\_

7. \_\_\_\_\_

8. \_\_\_\_\_

9. \_\_\_\_\_

10. \_\_\_\_\_

☐ 主張專利法第二十五條之一第一項優先權：

【格式請依：申請日；申請案號 順序註記】

1. \_\_\_\_\_

2. \_\_\_\_\_

3. \_\_\_\_\_

☐ 主張專利法第二十六條微生物：

☐ 國內微生物 【格式請依：寄存機構；日期；號碼 順序註記】

1. \_\_\_\_\_

2. \_\_\_\_\_

3. \_\_\_\_\_

☐ 國外微生物 【格式請依：寄存國名；機構；日期；號碼 順序註記】

1. \_\_\_\_\_

2. \_\_\_\_\_

3. \_\_\_\_\_

☐ 熟習該項技術者易於獲得，不須寄存。

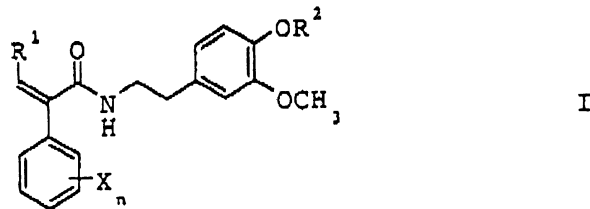
(1)

## 玖、發明說明

(發明說明應敘明：發明所屬之技術領域、先前技術、內容、實施方式及圖式簡單說明)

### 技術領域

本發明關於式 I 之 Z-取代之丙烯醯胺



其中取代基具有以下之意義：

X 為氫、鹵素、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、與 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷氧基，其中 X 在 3-或 4-位置；

n 為 1 或 2，如果 n 表示 2 則 X 可不相同；

R<sup>1</sup> 為 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷氧基、吡啶基、與環氧乙基；及

R<sup>2</sup> 為氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-鹵烷基、烯丙基、炔丙基、或 CH<sub>2</sub>C≡C-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基。

本發明進一步關於其製法，含彼等之組合物，及其在控制有害植物病原真菌之用途。

### 先前技術

α-羥亞胺基苯基乙酸芳基醯胺在 WO-A 96/17825 與 WO-A 96/23763 專利中敘述為殺真菌劑，及在 JP 02/200 658 專利中敘述為除草劑。芳基丙烯基醯胺僅包括於 WO-A 96/17825 專利之一般揭示中。WO-A 01/95721 專利揭示具殺真菌作用之丙烯醯胺。

Z-取代之丙烯醯胺包括於 WO-A 01/95721 專利之一般揭示中。

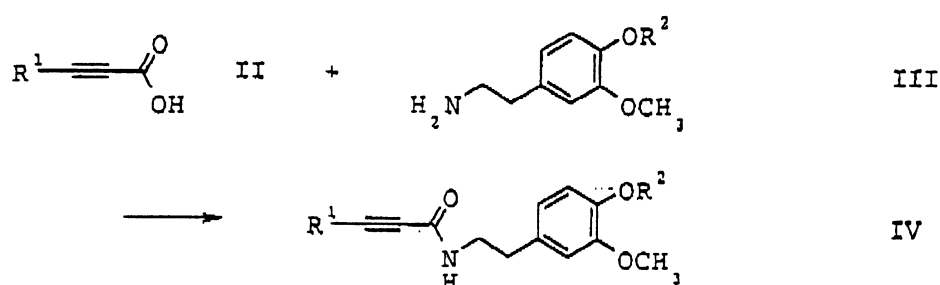
然而，上述文件中敘述之化合物之殺真菌作用在許多情

形不令人滿意。因此，本發明之目的為發現具改良作用之化合物。

#### 發明內容

已發現以 Z-取代之丙烯醯胺與含彼等之組合物達成此目的。

Z-取代之丙烯醯胺可由式 II 之羧酸與式 III 之苯乙胺開始，藉下述之途徑有利地獲得：



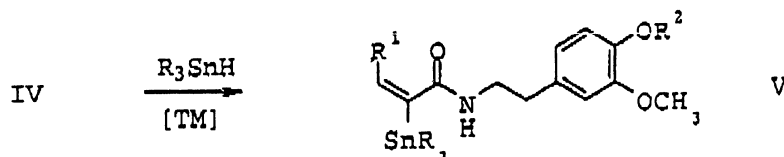
式 II 之羧酸可以已知方式以式 III 之苯乙胺直接醯胺化產生式 IV 化合物 [參考資料 Houben-Weyl 之 Methoden der Organischen Chemie, 第 E5 卷, 第 941-972 頁, Georg Thieme Verlag, Stuttgart and New York, 1985]。

原料通常以等莫耳量彼此反應。使用對 II 為過量之 III 對產量為有利的。

或者，可首先在將式 II 之羧酸以 III 醯胺化前活化，例如，轉化成為酸鹵，特別是酸氯。

製備化合物 I 所必要之原料 II 與 III 為商業可得的，在文獻中為已知的 [GB-A 2 355 724 專利；Chem. Commun., 1113 (1999)；Synthesis (1), 72 (1981)；Org. Synth. V, 1043 (1973)；CS-B 153 831；DE-A 19 958 165 專利；Bull. Chem. Soc. Jpn., 第 63 卷, 1252 (1990)]，或可依照所列文獻而製備。

式 IV 之 苯 乙 基 醯 胺 係 以 三 烷 錫 氫 化 物 ( 其 中 R 為 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷 基 ) , 例 如 三 丁 錫 氫 化 物 或 三 苯 錫 氫 化 物 轉 化 成 為 式 V 之 有 機 錫 化 合 物



此反應通常在 -20°C 至 80°C , 較佳為 0°C 至 60°C 間之溫度 , 在惰性有機溶劑中在觸媒存在下進行 [參考資料 Tetrahedron, 49 (21), 4677 (1993); 同前, 33(31), 4495 (1992); 同前, 48(40), 8801 (1992); Synth. Commun., 23(2), 143 (1993)]。

適當之溶劑為脂族烴、芳族烴、鹵化烴、醚類(如二乙醚、二異丙醚、第三丁基甲基醚、二噁烷、甲氧苯、與四氫呋喃)、及二甲基亞碲、二甲基甲醯胺、與二甲基乙醯胺, 特佳為四氫呋喃與二甲基乙醯胺。亦可使用所述溶劑之混合物。

反應係在觸媒存在下進行, 例如, 過渡金屬。適當之過渡金屬觸媒為鐵、鈷、鎳、鉍、鈮、或鉑化合物, 特別是鎳(0)、鎳(II)與鈮(0)化合物及鈮(II)化合物。因此, 可使用鹽(如氯化鎳、氯化鈮或乙酸鈮)或錯合物。唯一之要求為鈮上之配位子在反應條件下可被基質取代。膦配位子特別適合, 例如, 芳基烷基膦, 特別是甲基二苯膦或異丙基二苯膦, 三芳基膦, 特別是三苯膦、三甲苯膦、或三-二甲苯膦, 三雜芳膦, 如三呋喃膦, 或二聚膦。烯烴配位子亦特別適合, 特別是二亞苄基丙酮或其鹽, 或環辛-1,5-二烯, 或胺, 如三烷胺(例如, 三乙胺、四甲基仲乙二胺或N-甲基

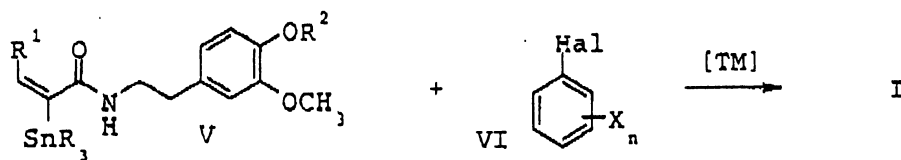
嗎啉)或吡啶。

使用之錯合物可直接用於反應中。因此，例如，可使用以下進行反應：溴化貳(三苯膦)鎳(II)、氯化貳(三苯膦)鎳(II)、氯化[1,3-貳(三苯膦)丙烷]鎳(II)、氯化[1,2-貳(三苯膦)乙烷]鎳(II)、肆(三苯膦)鈹(0)、二氯化貳(三苯膦)鈹、二乙酸貳(三苯膦)鈹、二亞苄基丙酮鈹(0)錯合物、肆(甲基二苯膦)鈹(0)、或二氯化[1,2-貳(二苯膦)乙烷]鈹。亦可使用鎳或鈹鹽，此外，及然後僅原位形成催化活性錯合物之適當配位子。此步驟可用於，例如，上述之鹽與膦配位子，例如，三呋喃膦或三甲苯膦。鎳或鈹錯合物，例如，參(二亞苄基丙酮)二鈹、貳(二亞苄基丙酮)鈹、或二氯化1,5-環辛二烯鈹，亦可藉由加入配位子(例如，三呋喃膦或三甲苯膦)而進一步活化。

通常使用相對原料為0.001至12莫耳%，特別是0.001至5莫耳%之觸媒。亦可為較高之量但通常為不必要的。

原料通常以等莫耳量彼此反應。

式V化合物係藉過渡金屬以式VI之苯基鹵轉化成為式I化合物，其中Hal為溴或碘，特別是溴。



此反應通常在0°C至80°C，較佳為20°C至60°C間之溫度，在惰性溶劑中在過渡金屬觸媒[TM]存在下進行[參考資料Tetrahedron, 50 (41), 12029 (1994); Org. Lett., 2 (8), 1211 (2000)]。

適當之溶劑為脂族烴、芳族烴、鹵化烴、醚類(如二乙醚、

二異丙醚、第三丁基甲基醚、二噁烷、甲氧苯、與四氫呋喃)、及二甲基亞砷、二甲基甲醯胺、與二甲基乙醯胺，特佳為四氫呋喃、二甲基乙醯胺與二甲基甲醯胺。亦可使用所述溶劑之混合物。

反應係在觸媒存在下進行，例如，過渡金屬。適當之過渡金屬觸媒為鐵、鈷、鎳、銻、鈮、或鉑化合物，特別是鎳(0)、鎳(II)與鈮(0)化合物及鈮(II)化合物。因此，可使用鹽(如氯化鎳、氯化鈮或乙酸鈮)或錯合物。唯一之要求為鈮上之配位子在反應條件下可被基質取代。膦配位子特別適合，例如，芳基烷基膦，特別是甲基二苯膦或異丙基二苯膦，三芳基膦，特別是三苯膦、三甲苯膦、或三-二甲苯膦，三雜芳膦，如三呋喃膦，或二聚膦。烯烴配位子亦特別適合，特別是二亞苄基丙酮或其鹽，或環辛-1,5-二烯，或胺，如三烷胺(例如，三乙胺、四甲基仲乙二胺或N-甲基嗎啉)或吡啶。

使用之錯合物可直接用於反應中。因此，例如，可使用以下進行反應：溴化貳(三苯膦)鎳(II)、氯化貳(三苯膦)鎳(II)、氯化[1,3-貳(三苯膦)丙烷]鎳(II)、氯化[1,2-貳(三苯膦)乙烷]鎳(II)、肆(三苯膦)鈮(0)、二氯化貳(三苯膦)鈮、二乙酸貳(三苯膦)鈮、二亞苄基丙酮鈮(0)錯合物、肆(甲基二苯膦)鈮(0)、或二氯化[1,2-貳(二苯膦)乙烷]鈮。亦可使用鎳或鈮鹽，此外，及然後僅原位形成催化活性錯合物之適當配位子。此步驟可用於，例如，上述之鹽與膦配位子，例如，三呋喃膦或三甲苯膦。鎳或鈮錯合物，例如，參(二亞苄基

丙酮)二鈹、貳(二亞苺基丙酮)鈹、或二氯化1,5-環辛二烯鈹，亦可藉由加入配位子(例如，三呋喃膦或三甲苯膦)而進一步活化。

反應在作為額外觸媒之亞銅(I)鹽存在下有利地進行，例如，Cu(I)I。

通常使用相對原料為0.001至12莫耳%，特別是0.001至5莫耳%之觸媒。亦可為較高之量但通常為不必要的。

原料通常以等莫耳量彼此反應。使用對V為過量之VI對產量為有利的。

反應混合物係以一般作業加工，例如，與水混合，將相分離，如果適當，及將粗產物層析純化。在某些情形，中間物及最終產物係以無色或淡棕色黏油之形式得到，其在低壓下及在適度之高溫將揮發性成分清除或純化。如果中間物及最終產物係如固體而得到，純化亦可藉再循環或研製進行。

如果個別化合物I無法由上述途徑獲得，則其可藉由將其他化合物I衍生化而製備。

#### 實施方法

在上式所示之符號定義中使用概略性名詞，此概略性名詞通常表示以下之取代基：

鹵素：氟、氯、溴、與碘；

烷基：具1至4個碳原子之飽和直鏈或支鏈烴基，例如，甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、與1,1-二甲基乙基；

鹵烷基：具1至4個碳原子之直鏈或分支鏈烷基(如上所述)，這些基中之氫原子可部份地或全部地被上述之鹵素原子取代，例如， $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基，如氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、與五氟乙基；

烷氧基：具1至8個碳原子之直鏈或分支烷基(如上所述)，其經一氧原子(-O-)鍵結至主幹；

鹵烷氧基：具1至4個碳原子之直鏈或分支鹵烷基(如上所述)，其經一氧原子(-O-)鍵結至主幹。

關於式I之丙烯醯胺之意圖用途，以下之取代基意義(在各情形為單獨或組合)特佳：

關於變數之中間物之特佳具體實施例係對應式I之基團 $X_n$ 、 $R^1$ 或 $R^2$ 。

較佳化合物I為其中 $R^1$ 表示 $C_1$ - $C_4$ -烷基、鹵甲基、或 $C_3$ - $C_5$ -環烷基者。

特佳化合物I為其中 $R^1$ 表示甲基、乙基、異丙基、第三丁基、三氟甲基、環丙基、或環戊基者。

此外，特佳化合物I為其中 $R^2$ 為甲基、乙基、炔丙基、 $C_2$ -鹵烷基(特別是2,2,2-三氟乙基)、或烯丙基者。

特佳化合物I為其中X不為氫者。

此外，特佳化合物I為其中n表示1且X在4-位置者。

同樣地，特佳化合物I為其中n表示2且X在3,4-位置者。

此外，特佳化合物I為其中 $R^2$ 為氫者。其不僅有作為活性化合物之價值，亦可在其他化合物I之製備中作為中間物。

就其用途而言，下表中編列之化合物I特佳。取代基表中提及之基進一步表示所討論取代基之特佳具體實施例，其本質上視為其中提及之獨立組合。

表 1

式 I 化合物，其中 $R^1$ 與 $R^2$ 為甲基，及基團 $X_n$ 對應表 A 中各化合物之列。

表 2

式 I 化合物，其中 $R^1$ 為甲基且 $R^2$ 為乙基，及基團 $X_n$ 對應表 A 中各化合物之列。

表 3

式 I 化合物，其中 $R^1$ 為甲基且 $R^2$ 為炔丙基，及基團 $X_n$ 對應表 A 中各化合物之列。

表 4

式 I 化合物，其中 $R^1$ 為甲基且 $R^2$ 為 2,2,2-三氟乙基，及基團 $X_n$ 對應表 A 中各化合物之列。

表 5

式 I 化合物，其中 $R^1$ 為甲基且 $R^2$ 為烯丙基，及基團 $X_n$ 對應表 A 中各化合物之列。

表 6

式 I 化合物，其中 $R^1$ 為乙基且 $R^2$ 為甲基，及基團 $X_n$ 對應表 A 中各化合物之列。

表 7

式 I 化合物，其中  $R^1$  與  $R^2$  為乙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 8

式 I 化合物，其中  $R^1$  為乙基且  $R^2$  為炔丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 9

式 I 化合物，其中  $R^1$  為乙基且  $R^2$  為 2,2,2-三氟乙基，及基團  $\bar{X}_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 10

式 I 化合物，其中  $R^1$  為乙基且  $R^2$  為烯丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 11

式 I 化合物，其中  $R^1$  為異丙基且  $R^2$  為甲基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 12

式 I 化合物，其中  $R^1$  為異丙基且  $R^2$  為乙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 13

式 I 化合物，其中  $R^1$  為異丙基且  $R^2$  為炔丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 14

式 I 化合物，其中  $R^1$  為異丙基且  $R^2$  為 2,2,2-三氟乙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 15

式 I 化合物，其中  $R^1$  為異丙基且  $R^2$  為烯丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 16

式 I 化合物，其中  $R^1$  為第三丁基且  $R^2$  為甲基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 17

式 I 化合物，其中  $R^1$  為第三丁基且  $R^2$  為乙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 18

式 I 化合物，其中  $R^1$  為第三丁基且  $R^2$  為炔丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 19

式 I 化合物，其中  $R^1$  為第三丁基且  $R^2$  為 2,2,2-三氟乙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 20

式 I 化合物，其中  $R^1$  為第三丁基且  $R^2$  為烯丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 21

式 I 化合物，其中  $R^1$  為三氟甲基且  $R^2$  為甲基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 22

式 I 化合物，其中  $R^1$  為三氟甲基且  $R^2$  為乙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 23

式 I 化合物，其中  $R^1$  為三氟甲基且  $R^2$  為炔丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 24

式 I 化合物，其中  $R^1$  為三氟甲基且  $R^2$  為 2,2,2-三氟乙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 25

式 I 化合物，其中  $R^1$  為三氟甲基且  $R^2$  為烯丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 26

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環丙基且  $R^2$  為甲基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 27

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環丙基且  $R^2$  為乙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 28

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環丙基且  $R^2$  為炔丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 29

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環丙基且  $R^2$  為 2,2,2-三氟乙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

## 表 30

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環丙基且  $R^2$  為烯丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 31

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環丁基且  $R^2$  為甲基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 32

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環丁基且  $R^2$  為乙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 33

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環丁基且  $R^2$  為炔丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 34

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環丁基且  $R^2$  為 2,2,2-三氟乙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 35

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環丁基且  $R^2$  為烯丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 36

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環戊基且  $R^2$  為甲基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 37

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環戊基且  $R^2$  為乙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 38

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環戊基且  $R^2$  為炔丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 39

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環戊基且  $R^2$  為 2,2,2-三氟乙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 40

式 I 化合物，其中  $R^1$  為環戊基且  $R^2$  為烯丙基，及基團  $X_n$  對應表 A 中各化合物之列。

表 A

| 號碼   | $X_n$                                             |
|------|---------------------------------------------------|
| A-1  | 3-Cl                                              |
| A-2  | 4-Cl                                              |
| A-3  | 3-F                                               |
| A-4  | 4-F                                               |
| A-5  | 3-Br                                              |
| A-6  | 4-Br                                              |
| A-7  | 3-I                                               |
| A-8  | 4-I                                               |
| A-9  | 3-CH <sub>3</sub>                                 |
| A-10 | 4-CH <sub>3</sub>                                 |
| A-11 | 3-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-12 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-13 | 3-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-14 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-15 | 3-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               |
| A-16 | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               |
| A-17 | 3-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                |
| A-18 | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                |
| A-19 | 3-CF <sub>3</sub>                                 |
| A-20 | 4-CF <sub>3</sub>                                 |
| A-21 | 3-OCH <sub>3</sub>                                |
| A-22 | 4-OCH <sub>3</sub>                                |
| A-23 | 3-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                |

| 號 碼  | X <sub>n</sub>                                                                         |
|------|----------------------------------------------------------------------------------------|
| A-24 | 4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                                     |
| A-25 | 3-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                     |
| A-26 | 4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                     |
| A-27 | 3-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                                   |
| A-28 | 4-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                                   |
| A-29 | 3-OCF <sub>3</sub>                                                                     |
| A-30 | 4-OCF <sub>3</sub>                                                                     |
| A-31 | 3-OCHF <sub>2</sub>                                                                    |
| A-32 | 4-OCHF <sub>2</sub>                                                                    |
| A-33 | 3,4-F <sub>2</sub>                                                                     |
| A-34 | 3,4-Cl <sub>2</sub>                                                                    |
| A-35 | 3-F-4-Br                                                                               |
| A-36 | 3-Cl-4-Br                                                                              |
| A-37 | 3-Cl-4-CH <sub>3</sub>                                                                 |
| A-38 | 3-Cl-4-OCH <sub>3</sub>                                                                |
| A-39 | 3-Cl-4-OCF <sub>3</sub>                                                                |
| A-40 | 3-Cl-4-OCHF <sub>2</sub>                                                               |
| A-41 | 3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                                    |
| A-42 | 3,4-(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                    |
| A-43 | 3-CH <sub>3</sub> -4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                   |
| A-44 | 3-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -4-CH <sub>3</sub>                                   |
| A-45 | 3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                                   |
| A-46 | 3,4-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                   |
| A-47 | 3-OCH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 |
| A-48 | 3-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub>                                 |
| A-49 | 3-OCH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |
| A-50 | 3-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub>                 |
| A-51 | 3-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-52 | 3-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |
| A-53 | 3-OCH <sub>3</sub> -4-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               |
| A-54 | 3-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -4-OCH <sub>3</sub>                               |
| A-55 | 3-OCH <sub>3</sub> -4-OCF <sub>3</sub>                                                 |
| A-56 | 3-OCF <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub>                                                 |

| 號 碼  | X <sub>n</sub>                         |
|------|----------------------------------------|
| A-57 | 3-CH <sub>3</sub> -4-OCF <sub>3</sub>  |
| A-58 | 3-CH <sub>3</sub> -4-OCHF <sub>2</sub> |
| A-59 | 3-CH <sub>3</sub> -4-Cl                |
| A-60 | 3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub>  |
| A-61 | 3-OCH <sub>3</sub> -4-Cl               |
| A-62 | 3-OCH <sub>3</sub> -4-CH <sub>3</sub>  |
| A-63 | 3-CH <sub>3</sub> -4-OCF <sub>3</sub>  |
| A-64 | 3-CH <sub>3</sub> -4-Br                |
| A-65 | 3-CH <sub>3</sub> -4-Br                |
| A-66 | 3-OCH <sub>3</sub> -4-Br               |

化合物I適合作為殺真菌劑。其因對抗廣泛範圍之植物病原真菌之傑出效果而獨特，特別是對於子囊菌綱(Ascomycetes)、半知菌綱(Deuteromycetes)、藻菌綱(Phycomycetes)、及擔子菌綱(Basidiomycetes)類。其中某些為系統性有效且其可作為葉面或土壤殺真菌劑而用於植物保護。

其對於各種耕種植物，如小麥、黑麥、大麥、燕麥、稻、玉蜀黍、牧草、香蕉、棉、大豆、咖啡、甘蔗、藤、水果、與觀賞植物，及蔬菜，如黃瓜、豌豆、蕃茄、馬鈴薯、與葫蘆，及對於這些植物之種子之多種真菌之控制特別重要。

其特別適合控制以下之植物疾病：

- 水果與蔬菜之交鏈孢黴(*Alternaria*)物種，
- 草莓、蔬菜、觀賞植物、與葡萄藤之葡萄孢屬灰(*Botrytis cinerea*)(灰黴(gray mold))，
- 花生之花生尾孢菌屬(*Cercospora arachidicola*)，
- 葫蘆之菊苣白粉菌屬(*Erysiphe cichoracearum*)與單絲殼

(*Sphaerotheca fuliginea*)，

- 穀類之禾本 (*Blumeria graminis*) (白粉病 (powdery mildew))，
- 各種植物之鐮刀黴 (*Fusarium*) 與幹枝孢菌屬 (*Verticillium*) 物種，
- 穀類上之長蠕孢屬 (*Helminthosporium*) 物種，
- 香蕉與花生之球腔菌屬 (*Mycosphaerella*) 物種，
- 馬鈴薯與蕃茄之疫黴屬 (*Phytophthora*) 寄生蟲，
- 葡萄藤之葡萄生單軸黴 (*Plasmopara viticola*)，
- 葡萄之蘋果白粉病菌 (*Podosphaera leucotricha*)，
- 小麥與大麥之假尾孢屬 (*Pseudocercospora*) *herpotrichoides*，
- 鴉片與黃瓜之假霜黴屬 (*Pseudoperonospora*) 物種，
- 穀類之柄銹菌屬 (*Puccinia*) 種，
- 稻之稻 *Pyricularia*，
- 棉、稻與草坪之絲核菌屬 (*Rhizoctonia*) 物種，
- 小麥之小麥穎枯病菌 (*Septoria nodorum*)，
- 葡萄藤之鉤絲殼屬板口線蟲 (*Uncinula necator*)，
- 穀類與甘蔗之黑粉菌屬 (*Ustilago*) 物種，及
- 蘋果與桃子之黑星菌屬 (*Venturia*) 物種 (斑點病)。

化合物 I 亦適合用於控制有害真菌，如擬青黴 (*Paecilomyces variotii*)，以保護材料 (例如，木頭、紙、塗料分散液、纖維、或織品) 及保護儲存之產品。

式 I 化合物係藉由以殺真菌有效量之活性化合物處理真菌或保護不受真菌侵襲之植物、種子、材料、或土壤而使用。此應用可在材料、植物或種子被真菌感染之前或之後

進行。

殺真菌組合物通常包含 0.1 至 95%，較佳為 0.5 至 90% 重量比之活性化合物。

在用於植物保護時，視所需效果之種類而定，應用量為每公頃 0.01 至 2.0 公斤之活性化合物。

在種子處理中，每公斤種子 0.001 至 0.1 克，較佳為 0.01 至 0.05 克之活性化合物量通常為必要的。

在用於保護材料或儲存產品時，應用之活性化合物量視應用面積及所需效果之種類而定。用於材料保護之習用應用量為，例如，每立方米所處理材料 0.001 克至 2 公斤，較佳為 0.005 克至 1 公斤之活性化合物。

化合物 I 可轉化成為一般調配物，例如，溶液、乳液、懸浮液、塵粉、漿料、與顆粒。應用形式視各意圖用途而定；在任何情形，其應保證依照本發明化合物之細微且均勻分布。

調配物可以已知方式製備，例如，藉由將活性化合物摻和溶劑及/或載劑，如果需要則使用乳化劑與分散劑，在稀釋劑為水時亦可使用其他之有機溶劑作為輔助溶劑。用於此目的之適當輔助劑本質上為：溶劑，如芳族(例如，二甲苯)、氯化芳族(例如，氯苯)、鏈烷烴(例如，石蠟脂餾份)、醇類(例如，甲醇、丁醇)、酮類(例如，環己酮)、胺類(例如，乙醇胺、二甲基甲醯胺)、與水；載劑，如研磨天然礦物(例如，高嶺土、黏土、滑石、白堊)與研磨合成礦(例如，高分散矽酸、矽酸鹽)；乳化劑，如非離子性與陰離子性乳

化劑(例如，聚環氧乙烷脂肪醇醚、烷基磺酸酯與芳基磺酸酯)，及分散劑，如木亞硫酸廢液與甲基纖維素。

適當之界面活性劑為木磺酸、萘磺酸、酚磺酸、與二丁基萘磺酸之鹼金屬、鹼土金屬與銨鹽，烷基芳基磺酸酯、烷基硫酸酯、烷基磺酸酯、脂肪醇硫酸酯、與脂肪酸，及其鹼金屬與鹼土金屬鹽，硫酸化脂肪醇二醇醚之鹽、磺酸化萘與萘衍生物以甲醛縮合之產物，萘或萘磺酸以酚與甲醛縮合之產物，聚環氧乙烷辛酚醚、乙氧化異辛酚、辛酚、與壬酚，烷基酚聚二醇醚、三丁基苯聚二醇醚、烷基芳基多醚醇、異十三碳醇、脂肪醇環氧乙烷縮合物、乙氧化蓖麻油、聚環氧乙烷烷基醚、乙氧化聚環氧丙烷、月桂醇聚二醇醚乙醛、葡萄糖醇酯、木亞硫酸廢液、與甲基纖維素。

具有中至高沸點之石蠟脂餾份，如燈油或柴油，其他之炭榕油，及蔬菜或動物精油，脂肪、環形與芳族烴，例如，苯、甲苯、二甲苯、鏈烷烴、四氫萘、烷化萘或其衍生物，甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、氯仿、四氯化碳、環己醇、環己酮、氯苯、或異佛爾酮，或高極性溶劑，例如，二甲基甲醯胺、二甲基亞砷、N-甲基吡咯啉酮、或水，適合用於製備可直接噴灑溶液、乳液、漿料、或油分散液。

粉末、散播用組合及塵粉可藉由而混合或相互地研磨活性物質與固態載劑而製備。

顆粒，例如，塗覆顆粒、浸漬顆粒與均質顆粒，可藉由將活性化合物黏合至固態載劑而製備。固態載劑為，例如，礦物土，如矽酸、矽膠、滑石、高嶺土、attaclay、石灰石、

白堊、細黏土、黃土、黏土、白雲石、矽藻土、硫酸鈣、硫酸鎂、氧化鎂，研磨合成材料，肥料，例如，硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、或尿素，及植物產物，如穀粉、樹皮、木粉、與堅果殼粉，纖維素粉末，及其他之固態載劑。

此調配物通常包含 0.01 至 95 重量%，較佳為 0.1 至 90 重量%之活性化合物。活性化合物係以 90% 至 100%，較佳為 95% 至 100% 之純度（依照 NMR 光譜）用於其中。

調配物之實例為：

- I. 將 5 重量份依照本發明之化合物緊密地混合 95 重量份細微分割高嶺土。以此方式得到含 5 重量%之活性化合物之塵粉。
- II. 將 30 重量份依照本發明之化合物緊密地混合 92 重量份粉碎矽膠與 8 重量份已噴灑在此矽膠表面上之液態鏈烷烴。以此方式得到具良好黏著性質之活性化合物製品（活性化合物含量 23 重量%）。
- III. 將 10 重量份依照本發明之化合物溶於包括 90 重量份二甲苯、6 重量份加成產物（8 至 10 莫耳環氧乙烷與 1 莫耳之油酸之 N-單乙醇醯胺）、2 重量份十二碳基苯磺酸鈣鹽、與 2 重量份加成產物（40 毫升環氧乙烷與 1 莫耳蓖麻油）之混合物中（活性化合物含量 9 重量%）。
- IV. 將 20 重量份依照本發明之化合物溶於包括 60 重量份環己酮、30 重量份異丁醇、5 重量份加成產物（7 莫耳環氧乙烷與 1 莫耳異辛基酚）、與 5 重量份加成產物（40 莫耳環氧乙烷與 1 莫耳蓖麻油）之混合物中（活性化合物含量 16 重

量%)。

- V. 將80重量份依照本發明之化合物緊密地混合3重量份二異丁基萘- $\alpha$ -磺酸鈉鹽、10重量份得自亞硫酸鹽廢液之木磺酸鈉鹽、與7重量份粉碎矽膠，而且在錘磨機中研磨(活性化合物含量80重量%)。
- VI. 將90重量份依照本發明之化合物混合10重量份N-甲基- $\alpha$ -吡咯啉酮，得到適合以非常小滴形式使用之溶液(活性化合物含量90重量%)。
- VII. 將20重量份依照本發明之化合物溶於包括40重量份環己酮、30重量份異丁醇、5重量份加成產物(7莫耳環氧乙烷與1莫耳異辛基酚)、與10重量份加成產物(40莫耳環氧乙烷與1莫耳蓖麻油)之混合物中。使溶液流入100000重量份水中且於其中細微分散，得到含0.02重量%之活性化合物之水性分散液。
- VIII. 將20重量份依照本發明之化合物緊密地混合3重量份二異丁基萘- $\alpha$ -磺酸鈉鹽、17重量份得自亞硫酸鹽廢液之木磺酸鈉鹽、與60重量份粉碎矽膠，而且在錘磨機中研磨。藉由使混合物細微分散於20000重量份水中而得到含0.1重量%之活性化合物之噴灑乳液。

活性化合物可直接，以藉由噴灑、霧化、塵化、散播、或加水而由其製備之其調配物之形式或應用形式使用，例如，可直接噴灑溶液、粉末、懸浮液或分散液、乳液、油分散液、漿料、塵粉、散播用組合物、或顆粒之形式；在任何情形，其應保證依照本發明之活性化合物之最細微可

能分布。

水性使用形式可藉由加水而由可乳化濃縮物、漿料、或可潤濕粉末(噴灑粉末、油分散液)製備。為了製備乳液、漿料或油分散液，將此物質直接或溶於油中或溶劑中而藉潤濕劑、膠黏劑、分散劑、或乳化劑在水中均化。然而，亦可製備含活性成分、潤濕劑、膠黏劑、分散劑、或乳化劑，可能及溶劑或油之濃縮物，此濃縮物適合以水稀釋。

活性化合物在已可使用組合物中之濃度可在相當廣泛之範圍內變化。其通常為0.0001至10%，較佳為0.01至1%之間。

活性化合物亦可極為成功地用於超低體積(ULV)方法中，其可應用具超過95重量%之活性化合物之調配物，或甚至無添加劑之活性化合物。

如果需要，亦可恰在使用前將各種型式之油、除草劑、殺真菌劑、其他殺蟲劑與殺菌劑加入活性化合物(槽混合)。這些試劑可以1:10至10:1之重量比例加入依照本發明之組合物。

在作為殺真菌劑之應用形式中，依照本發明之組合物亦可與其他活性化合物一起存在，例如，除草劑、殺昆蟲劑、生長調節劑、殺真菌劑、或肥料。在混合化合物I或含彼等之組合物時，在許多情形中得到擴大之殺真菌活性範圍。

下列依照本發明之化合物可結合使用之殺真菌劑意圖描述可能組合而非限制之：

- 硫、二硫胺甲酸鹽與其衍生物，如二甲基二硫胺甲酸鐵(III)、二甲基二硫胺甲酸鐵鋅、仲乙貳二硫胺甲酸鋅、仲

乙貳二硫胺甲酸錳、仲乙二胺貳二硫胺甲酸錳鎂、二硫化四甲基秋蘭姆、(N,N'-仲乙貳二硫胺甲酸)鋅之氮錯合物、(N,N'-仲丙貳二硫胺甲酸)鋅之氮錯合物、(N,N'-仲丙貳二硫胺甲酸)鋅、或二硫化N,N'-聚仲丙貳(硫胺甲醯基)；

- 硝基衍生物，如巴豆酸二硝基(1-甲基庚基)苯酯、3,3-二甲基丙烯酸2-第二丁基-4,6-二硝基苯酯、碳酸2-第二丁基-4,6-二硝基苯基異丙酯、或5-硝基異酞酸二異丙酯；
- 雜環物質，如2-十七碳基-2-咪唑啉乙酸酯、2-氯-N-(4'-氯聯苯-2-基)菸鹼鹽胺、2,4-二氯-6-(鄰-氯苯胺)-s-三吡啶、酞醯亞胺基二硫代磷酸O,O-二乙酯、5-胺基-1-[貳(二甲胺基)氧膦基]-3-苯基-1,2,4-三唑、2,3-二氟基-1,4-二硫蒽醌、2-硫-1,3-二硫并[4,5-b]噻唑啉、1-(丁基胺甲醯基)-2-苯并咪唑胺甲酸甲酯、2-(甲氧基羰基胺基)苯并咪唑、2-(2-呋喃基)苯并咪唑、2-(4-噻唑基)苯并咪唑、N-(1,1,2,2-四氯甲硫基)四氫酞亞鹽胺、N-(三氯甲硫基)四氫酞亞鹽胺或N-(三氯甲硫基)酞亞鹽胺，
- N-二氯氟甲硫基-N',N'-二甲基-N-苯基硫鹽胺、5-乙氧基-3-三氯甲基-1,2,3-噻二唑、2-硫氟鹽基甲硫基苯并噻唑、1,4-二氯-2,5-二甲氧基苯、4-(2-氯苯基胼基)-3-甲基-5-異噻唑胼、2-硫吡啶-1-氧化物、8-羥基噻啉或其銅鹽、2,3-二氫-5-羧苯鹽胺-6-甲基-1,4-氧硫雜芑、2,3-二氫-5-羧苯鹽胺-6-甲基-1,4-氧硫雜芑-4,4-二氧化物、2-甲基-5,6-二氫-4H-呋喃-3-羧苯鹽胺、2-甲基呋喃-3-羧苯鹽胺、2,5-二甲基呋喃-3-羧苯鹽胺、2,4,5-三甲基呋喃-3-羧苯鹽胺、N-環己基-2,5-二甲

基呋喃-3-羧醯胺、N-環己基-N-甲氧基-2,5-二甲基呋喃-3-羧醯胺、2-甲基苯并苯醯胺、2-碘苯并苯醯胺、N-甲醯基-N-嗎啉、2,2,2-三唑乙基乙醛、六氫吡啶-1,4-二基貳-1-(2,2,2-三氯乙基)甲醯胺、1-(3,4-二氯苯胺基)-1-甲醯基胺基-2,2,2-三氯乙烷、2,6-二甲基-N-十三碳基嗎啉或其鹽、2,6-二甲基-N-環十二碳基嗎啉或其鹽、N-[3-(對(第三丁基)苯基)-2-甲基丙基]-順-2,6-二甲基嗎啉、N-[3-(對(第三丁基)苯基)-2-甲基丙基]-六氫吡啶、1-[2-(2,4-二氯苯基)-4-乙基-1,3-二噁烷-2-基乙基]-1H-1,2,4-三唑、1-[2-(2,4-二氯苯基)-4-(正丙基)-1,3-二噁烷-2-基甲基]-1H-1,2,4-三唑、N-(正丙基)-N-(2,4,6-三氯苯氧基乙基)-N'-咪唑基脲、1-(4-氯苯氧基)-3,3-二甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-2-丁酮、1-(4-氯苯氧基)-3,3-二甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-2-丁醇、(2RS,3RS)-1-[3-(2-氯苯基)-2-(4-氯苯基)環氧乙-2-基甲基]-1H-1,2,4-三唑、 $\alpha$ -(2-氯苯基)- $\alpha$ -(4-氯苯基)-5-嘧啶甲醇、5-丁基-2-二甲胺基-4-羥基-6-甲基嘧啶、貳(對氯苯基)-3-吡啶甲醇、1,2-貳(3-乙氧基羰基-2-硫脲基)苯、或1,2-貳(3-甲氧基羰基-2-硫脲基)苯，

- 斯托必如林(strobilurines)，如E-甲氧基亞胺基[ $\alpha$ -(鄰甲苯氧基)-鄰甲苯基]乙酸甲酯、E-2-{2-[6-(2-氯基苯氧基)嘧啶-4-基氧基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯、甲基E-甲氧基亞胺基(2-苯氧基苯基)乙醯胺、甲基E-甲氧基亞胺基[ $\alpha$ -(2,5-二甲基苯氧基)-鄰甲苯基]乙醯胺、E-2-{2-[2-三氯甲基吡啶-6-基]氧基甲基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(E,E)-甲氧基亞

胺基 {2-[1-(3-三氟甲基苯基)亞乙基胺基氧基甲基]苯基} 乙酸甲酯、或 N-(2-{[1-(4-氯苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基甲基} 苯基)-N-甲氧基胺甲酸甲酯，

- 苯胺基嘧啶，如 N-(4,6-二甲基嘧啶-2-基)苯胺、N-[4-甲基-6-(1-丙炔基)嘧啶-2-基]苯胺、或 N-[4-甲基-6-環丙基嘧啶-2-基]苯胺，
- 苯基吡唑，如 4-(2,2-二氟-1,3-苯并二唑-4-基)吡唑-3-腈，
- 桂皮醯胺，如 3-(4-氯苯基)-3-(3,4-二甲氧基苯基)丙烯醯基嗎啉、或 3-(4-氟苯基)-3-(3,4-二甲氧基苯基)丙烯醯基嗎啉，
- 及各種殺真菌劑，如十二碳基胍啶乙酸酯、1-(3-溴-6-甲氧基-2-甲基苯基)-1-(2,3,4-三甲氧基-6-甲基苯基)甲酮、3-[3-(3,5-二甲基-2-氧基環己基)-2-羥乙基]戊二醯胺、六氯苯、N-(2,6-二甲基苯基)-N-(2-呋喃醯基)-DL-丙胺酸甲酯、N-(2,6-二甲基苯基)-N-(2'-甲氧基乙醯基)-DL-丙胺酸甲酯、N-(2,6-二甲基苯基)-N-氯乙醯基-D,L-2-胺基丁內酯、N-(2,6-二甲基苯基)-N-(苯基乙醯基)-DL-丙胺酸甲酯、5-甲基-5-乙烯基-3-(3,5-二氯苯基)-2,4-二氧-1,3-噁唑啉、3-(3,5-二氯苯基)-5-甲基-5-甲氧基甲基-1,3-噁唑啉-2,4-二酮、3-(3,5-二氯苯基)-1-異丙基胺甲醯基尿酸素、N-(3,5-二氯苯基)-1,2-二甲基環丙烷-1,2-二羧醯醯亞胺、2-氟基-N-(乙胺基羰基)-2-[甲氧基亞胺基]乙醯胺、1-[2-(2,4-二氯苯基)戊基]-1H-1,2,4-三唑、2,4-二氟- $\alpha$ -(1H-1,2,4-三唑基-1-甲基)二苯甲醇、N-(3-氯-2,6-二硝基-4-三氟甲基苯基)-5-三氟甲基-3-氯-2-胺基吡啶、1-((貳(4-氟苯基)甲基矽烷基)甲

基)-1H-1,2,4-三唑、5-氯-2-氰基-4-(對甲苯基)咪唑-1-磺酸二甲鹽胺、或3,5-二氯-N-(3-氯-1-乙基-1-甲基-2-氧丙基)-4-甲基苯甲鹽胺。

#### 合成例

使用以下合成例中所述之步驟，藉由適當地修改原料而製備其他之化合物I。如此得到之化合物與物理資料列於下表中。

#### 實例1：5-異丙基-2,4-二氫-3H-吡唑-3-酮之合成

在10至30°C將70克(1.26莫耳)胼水合物逐滴加入100克(0.62莫耳)異丁基乙酸乙酯於60毫升乙醇之溶液中。在放熱反應消退後，又在20至25°C將混合物攪拌約14小時，然後冷卻至約-10°C。藉過濾隔離52克標題化合物。

$^1\text{H}$  NMR [ $\delta$  ( $\text{CDCl}_3$ )] : 9.5 (br, 1H) ; 5.25 (s, 1H) ; 2.75 (q, 1H) ; 1.1 (d, 6H)。

#### 實例2：4,4-二溴-5-異丙基-2,4-二氫-3H-吡唑-3-酮之合成

將140克(0.87莫耳)溴逐滴加入52克(0.41莫耳)得自實例1之吡唑胼於300毫升冰醋酸，而且又在20至25°C將混合物攪拌約14小時。繼而將混合物倒入冰水中且將沉澱濾出。得到113克標題化合物。

$^1\text{H}$  NMR [ $\delta$  ( $\text{CDCl}_3$ )] : 9.5 (br, 1H) ; 3.0 (q, 1H) ; 1.35 (d, 6H)。

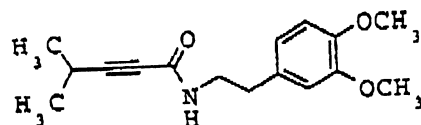
#### 實例3：4-甲基-2-戊炔酸之合成

在0°C將60克(0.21莫耳)得自實例2之吡唑胼於150毫升甲基第三丁基醚(MTBE)逐滴加入400毫升之10%氫氧化鈉水溶液，而且在20至25°C將組合之混合物攪拌3小時。將水相分

離，以濃氫氯酸提高至 pH 2.5，及以 MTBE 萃取，而且將有機萃取液乾燥。在去除溶劑後，得到 23.3 克標題化合物。

$^1\text{H}$  NMR [ $\delta$  ( $\text{CDCl}_3$ )] : 8.0 (br, 0H) ; 2.7 (q, 1H) ; 1.2 (d, 6H)。

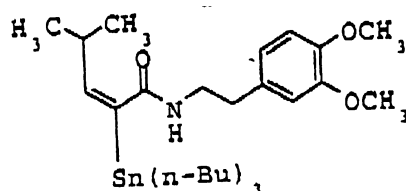
實例 4：N-[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]-4-甲基-2-戊炔醯胺之合成



在 0 至 5°C 將 38.2 克 (280 毫莫耳) 氯甲酸異丁酯及在 5 至 15°C 將 28.3 克 (280 毫莫耳) N-甲基嗎啉逐滴加入 28.4 克 (254 毫莫耳) 4-甲基-2-戊炔酸 (實例 3) 於 100 毫升四氫呋喃 (THF) 之溶液中。繼而逐滴加入 46 克 (254 毫莫耳) 均聚藜蘆胺同時以冰冷卻，及使混合物在 20 至 25°C 攪拌 48 小時。然後將反應溶液濃縮且將殘渣倒入水/10% 氫氯酸溶液中，及以 MTBE 萃取。乾燥後，將揮發性成分蒸發及在矽膠上層析 (環己烷：MTBE [3 : 1])，得到 44 克標題化合物。

$^1\text{H}$  NMR [ $\delta$  ( $\text{CDCl}_3$ )] : 6.85-6.6 (m, 3H) ; 5.75 (m, 1H) ; 3.85 (s, 3H) ; 3.80 (s, 3H) ; 3.5 (q, 2H)。

實例 5：(2E)-N-[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]-4-甲基-2-(三丁錫基)-2-戊醯胺之合成

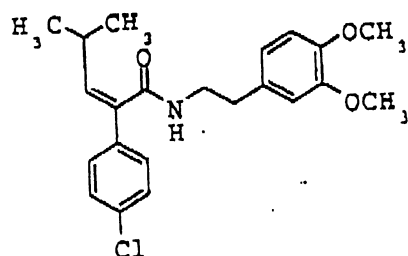


將 0.8 克  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$  加入 47.1 克 (170 毫莫耳) 得自實例 4 之醯胺於 200 毫升 THF 之溶液，然後在 15 至 20°C 逐滴加入 51 克 (175 毫

莫耳) 氫化三丁錫於 50 毫升 THF。在 20 至 25°C 攪拌約 14 小時後，將反應溶液濃縮且將殘渣倒入稀氫氯酸中，及以 MTBE 萃取。乾燥後，將揮發性成分蒸發及在矽膠上層析(環己烷：MTBE [3：1])，得到 88.8 克標題化合物如黏油。

$^1\text{H}$  NMR [ $\delta$  ( $\text{CDCl}_3$ )]：6.8-6.7 (m, 3H)；5.4 (d, 1H)；5.2 (m, 1H)；3.9 (s, 3H)；3.85 (s, 3H)。

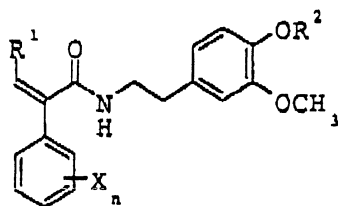
實例 6：(2Z)-2-(4-氯苯基)-N-[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]-4-甲基-2-戊醯胺 [I-2] 之合成



將 10 克 (17.6 毫莫耳) (2E)-N-[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]-4-甲基-2-(三丁錫基)-2-戊醯胺 (5) 於 15 毫升二甲基甲醯胺 (DMF) 之溶液混合 4.2 克 (17.7 毫莫耳) 4-氯碘苯、0.5 克  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ 、與 0.5 克碘化亞銅 (I)。在 20 至 25°C 攪拌約 14 小時後，將反應溶液倒入水中及以 MTBE 萃取。將有機相以水清洗，乾燥及去除溶劑。在矽膠上層析(環己烷：MTBE [7：1 至 1：1])後，得到 5.8 克標題化合物。

$^1\text{H}$  NMR [ $\delta$  ( $\text{CDCl}_3$ )]：1.0 (d, 6H)；2.8 (m, 1H)；2.9 (t, 2H)；3.8 (q, 2H)；3.92 (s, 3H)；3.97 (s, 3H)；5.6 (m, NH)；5.9 (d, 1H)；6.7-6.9 (m, 3H) 及 7.2-7.3 (m, 4H)。

表 I



I

| 號碼   | X <sub>n</sub>                        | R <sup>1</sup>                    | R <sup>2</sup>                  | 物理資料 (M.p. [°C];<br>1H-NMR δ [ppm]; M [m/e]) |
|------|---------------------------------------|-----------------------------------|---------------------------------|----------------------------------------------|
| I-1  | 4-Cl                                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.25 (p); 2.8 (t); 3.6 (q)                   |
| I-2  | 4-Cl                                  | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | (see ex. 6)                                  |
| I-3  | 4-Cl                                  | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | oil                                          |
| I-4  | 4-CF <sub>3</sub>                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 110-111                                      |
| I-5  | 3,4-Cl <sub>2</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 93-96                                        |
| I-6  | 4-Br                                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 112-114                                      |
| I-7  | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2.8 (t); 3.6 (q); 3.8 (s)                    |
| I-8  | H                                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 58-60                                        |
| I-9  | 3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 77-79                                        |
| I-10 | 3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 64                                           |
| I-11 | 3-OCH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2.8 (t); 3.6 (q); 5.6 (t)                    |
| I-12 | 4-F                                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 132-134                                      |
| I-13 | 3-Cl-4-CH <sub>3</sub>                | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 57-60                                        |
| I-14 | 4-OCF <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 103-105                                      |
| I-15 | 3-F-4-Br                              | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 87-89                                        |
| I-16 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 92-93                                        |
| I-17 | 4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 96-97                                        |
| I-18 | 3-Cl-4-F                              | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 85-86                                        |
| I-19 | 4-Cl                                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 98-100                                       |
| I-20 | 4-OCH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2.3 (q); 2.8 (q); 3.6 (q)                    |
| I-21 | 4-Cl                                  | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.65 (h); 2.8 (t);<br>3.75 (s)               |
| I-22 | 3,4-Cl <sub>2</sub>                   | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | oil                                          |
| I-23 | 3,4-Cl <sub>2</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | 2.8 (t); 2.6 (q); 3.8 (s)                    |
| I-24 | 3-OCH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | 3.6 (q); 3.8 (s); 3.85 (s)                   |
| I-25 | 4-CF <sub>3</sub>                     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | 2.8 (t); 3.7 (q); 3.8 (s)                    |
| I-26 | 4-Br                                  | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | 1.9 (d); 2.8 (t); 3.6 (q)                    |
| I-27 | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | 1.85 (d); 2.8 (t); 3.6 (q)                   |
| I-28 | 3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | 1.9 (d); 2.8 (t); 3.6 (q)                    |
| I-29 | 4-Cl                                  | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | 2.8 (s); 3.6 (d); 3.8 (s)                    |
| I-30 | 4-OCH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | 1.9 (d); 2.8 (t); 3.6 (q)                    |
| I-31 | 4-OCH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | oil                                          |
| I-32 | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.35 (s); 1.45 (t); 2.8 (t)                  |
| I-33 | 4-Br                                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 98-101                                       |
| I-34 | 3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.05 (t); 1.4 (t); 2.8 (t)                   |

| 號碼   | X <sub>n</sub>                        | R <sup>1</sup>                    | R <sup>2</sup>                  | 物理資料(M.p.[°C];<br><sup>1</sup> H-NMR δ [ppm]; M [m/e]) |
|------|---------------------------------------|-----------------------------------|---------------------------------|--------------------------------------------------------|
| I-35 | 3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 80-81                                                  |
| I-36 | 3-OCH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 93-94                                                  |
| I-37 | 3-Cl-4-CH <sub>3</sub>                | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 76-78                                                  |
| I-38 | 3-Cl-4-F                              | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 75                                                     |
| I-39 | 4-OCF <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 82-84                                                  |
| I-40 | 3-F-4-Br                              | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 85-87                                                  |
| I-41 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 77-79                                                  |
| I-42 | 4-OCH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 88-90                                                  |
| I-43 | 4-CF <sub>3</sub>                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 103-104                                                |
| I-44 | 3,4-Cl <sub>2</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 65                                                     |
| I-45 | H                                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 86-88                                                  |
| I-46 | 4-F                                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 87-89                                                  |
| I-47 | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 1.05(t); 2.8(t); 3.8(s)                                |
| I-48 | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 85-87                                                  |
| I-49 | 4-OCH <sub>3</sub>                    | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 3.6(q); 3.8(s); 7.13(s)                                |
| I-50 | 4-CF <sub>3</sub>                     | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 2.65(h); 2.8(t); 3.6(q)                                |
| I-51 | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 3.6(t); 3.8(s); 3.85(s)                                |
| I-52 | 4-Br                                  | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 3.85(s)                                |
| I-53 | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                 |
| I-54 | 4-OCF <sub>3</sub>                    | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                 |
| I-55 | 3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 1.0(s); 1.05(s); 2.8(t)                                |
| I-56 | 3-F-4-Br                              | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 2.65(h); 2.8(t); 3.8(s)                                |
| I-57 | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                 |
| I-58 | 3,4-Cl <sub>2</sub>                   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.15(s); 2.8(t); 3.6(q)                                |
| I-59 | 4-F                                   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | oil                                                    |
| I-60 | 3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 76-79                                                  |
| I-61 | 3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 70-73                                                  |
| I-62 | H                                     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 75-78                                                  |
| I-63 | 3-OCH <sub>3</sub>                    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 103-106                                                |
| I-64 | 3-F-4-Cl                              | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.75(s);<br>4.05(q)                            |
| I-65 | 3-F-4-Br                              | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.4(t); 2.8(t); 4.05(q)                                |
| I-66 | 4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.15(s); 2.8(t);<br>3.75(s)                            |
| I-67 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                 |
| I-68 | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 2.9(h); 3.6(q)                                 |
| I-69 | 4-Br                                  | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                 |
| I-70 | 3-Cl-4-CH <sub>3</sub>                | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.75(s)                                |
| I-71 | 4-OCF <sub>3</sub>                    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3.6(q); 3.8(s); 4.1(q)                                 |
| I-72 | 4-OCH <sub>3</sub>                    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 4.1(q)                                 |
| I-73 | 4-CF <sub>3</sub>                     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                 |

| 號碼    | $X_A$                                 | $R^1$                             | $R^2$                           | 物理資料(M.p.[°C];<br>$^1H$ -NMR $\delta$ [ppm]; M [m/e]) |
|-------|---------------------------------------|-----------------------------------|---------------------------------|-------------------------------------------------------|
| I-74  | 3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-75  | 3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 3.75(s)                               |
| I-76  | H                                     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 3.75(s)                               |
| I-77  | 4-F                                   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-78  | 3-Cl-4-F                              | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 5.5(t)                                |
| I-79  | 3-CH <sub>3</sub> -4-Cl               | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.35(s); 2.8(t); 3.6(q)                               |
| I-80  | 4-OCF <sub>3</sub>                    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 5.5(t)                                |
| I-81  | 3-F-4-Br                              | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-82  | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.6(q); 2.75(t);<br>3.55(q)                           |
| I-83  | 4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-84  | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-85  | 4-Cl                                  | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-86  | 3,4-Cl <sub>2</sub>                   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-87  | 4-OCH <sub>3</sub>                    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 3.85(s)                               |
| I-88  | 3-OCH <sub>3</sub>                    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.8(t); 3.6(q); 3.85(s)                               |
| I-89  | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 1.2(s); 2.8(t); 3.6(q)                                |
| I-90  | 4-CF <sub>3</sub>                     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 1.15(s); 2.75(t);<br>3.6(q)                           |
| I-91  | 4-Br                                  | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 2.75(t); 3.6(q);<br>3.75(s)                           |
| I-92  | H                                     | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3.6(q); 3.75(s);<br>4.05(q)                           |
| I-93  | 4-OCH <sub>3</sub>                    | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3.6(q); 3.8(s); 4.0(q)                                |
| I-94  | 4-CF <sub>3</sub>                     | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3.6(q); 3.75(s); 4.0(q)                               |
| I-95  | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3.6(q); 3.75(s);<br>4.05(q)                           |
| I-96  | 4-Br                                  | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-97  | 4-F                                   | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.65(q); 3.8(s)                               |
| I-98  | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3.65(q); 3.8(s);<br>4.05(q)                           |
| I-99  | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>     | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3.6(q); 3.8(s); 4.05(q)                               |
| I-100 | 4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-101 | 3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-102 | 3-OCH <sub>3</sub>                    | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-103 | 3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 3.6(q); 3.8(s); 5.7(d)                                |
| I-104 | 3,4-Cl <sub>2</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.65(q); 3.8(s)                               |
| I-105 | 4-OCH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-106 | 4-Br                                  | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-107 | 3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-108 | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 2.85(h); 4.0(q)                               |
| I-109 | 4-Cl                                  | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.6(q); 3.8(s)                                |
| I-110 | 4-CF <sub>3</sub>                     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.65(q); 3.8(s)                               |

| 號碼    | X <sub>n</sub>                        | R <sup>1</sup>                    | R <sup>2</sup>                  | 物理資料(M.P. [°C];<br><sup>1</sup> H-NMR δ [ppm]; M [m/e]) |
|-------|---------------------------------------|-----------------------------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------|
| I-111 | 3-CH <sub>3</sub> -4-Cl               | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | oil                                                     |
| I-112 | 4-Cl                                  | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 100-102                                                 |
| I-113 | 4-F                                   | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 70-72.5                                                 |
| I-114 | 3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 75-79                                                   |
| I-115 | 3,4-Cl <sub>2</sub>                   | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 63-66                                                   |
| I-116 | 4-CF <sub>3</sub>                     | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 47-49                                                   |
| I-117 | 4-OCH <sub>3</sub>                    | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 62-65                                                   |
| I-118 | 4-OCF <sub>3</sub>                    | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 2.85(t); 3.65(q);<br>3.8(s)                             |
| I-119 | 4-Br                                  | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 103-105                                                 |
| I-120 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>     | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 55-57                                                   |
| I-121 | 4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 95-97                                                   |
| I-122 | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 54-59                                                   |
| I-123 | 3-OCH <sub>3</sub>                    | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 53-60                                                   |
| I-124 | 3-Cl-4-CH <sub>3</sub>                | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 67-72                                                   |
| I-125 | 3-Cl-4-F                              | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 3.65(q); 3.75(s);<br>5.75(d)                            |
| I-126 | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 76-77                                                   |
| I-127 | 3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CHF <sub>2</sub>                | 102                                                     |
| I-128 | 4-Cl                                  | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub>                | 48-51                                                   |
| I-129 | 4-F                                   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub>                | 54-56                                                   |
| I-130 | 3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub>                | 2.8(t); 3.6(q); 3.75(s)                                 |
| I-131 | 3,4-Cl <sub>2</sub>                   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub>                | 2.8(t); 3.65(q);<br>3.75(s)                             |
| I-132 | 4-Br                                  | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub>                | 66-67                                                   |
| I-133 | 4-CF <sub>3</sub>                     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub>                | 64-66.5                                                 |
| I-134 | 4-OCH <sub>3</sub>                    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub>                | 2.75(t); 3.5(q);<br>3.75(s)                             |
| I-135 | 4-OCF <sub>3</sub>                    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub>                | 2.8(t); 3.5(q); 3.75(s)                                 |
| I-136 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub>                | 7.13(d); 7.4(m);<br>7.75(d)                             |
| I-137 | 4-Cl                                  | c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | 3.85(s); 3.8(s); 5.8(d)                                 |
| I-138 | 4-Cl                                  | c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4.05(q); 3.8(s); 3.6(q)                                 |
| I-139 | H                                     | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 5.3(d); 3.6(q); 2.8(q)                                  |
| I-140 | 4-F                                   | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.85(q);<br>3.8(q); 5.75(NH)                            |
| I-141 | 4-CF <sub>3</sub>                     | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 3.6(q); 3.8(s); 3.9(s);<br>5.3(d)                       |
| I-142 | 4-Br                                  | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2.75(q); 3.75(q);<br>5.3(d)                             |
| I-143 | 4-OCH <sub>3</sub>                    | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 5.25(d); 3.9(s);<br>3.85(s)                             |
| I-144 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>     | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 5.2(d); 3.5(q); 2.8(q)                                  |
| I-145 | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 1.2(d); 2.0(m)                                          |

| 號碼    | X <sub>n</sub>                        | R <sup>1</sup>                                    | R <sup>2</sup>                  | 物理資料 (M.p. [°C];<br><sup>1</sup> H-NMR δ [ppm]; M [m/e])   |
|-------|---------------------------------------|---------------------------------------------------|---------------------------------|------------------------------------------------------------|
| I-146 | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | 1.3 (s); 5.3 (d)                                           |
| I-147 | 3,4-Cl <sub>2</sub>                   | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | 5.3 (d); 0.5 (m); 0.8 (d)                                  |
| I-148 | 3,4-CH <sub>3</sub>                   | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | 5.2 (d); 2.2 (s); 2.75 (s)                                 |
| I-149 | 3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | 5.2 (d); 2.8 (d); 3.8 (d)                                  |
| I-150 | 4-Cl                                  | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4.0 (q); 3.8 (s); 3.6 (q)                                  |
| I-151 | 3,4-Cl <sub>2</sub>                   | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4.0 (q); 3.8 (s); 2.8 (q)                                  |
| I-152 | 4-CH <sub>3</sub>                     | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 5.2 (d); 4.0 (q); 3.8 (s)                                  |
| I-153 | 3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 4.1 (q); 3.8 (s); 3.6 (q)                                  |
| I-154 | 4-Br                                  | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 113-115                                                    |
| I-155 | 4-CF <sub>3</sub>                     | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 120-121                                                    |
| I-156 | 4-OCF <sub>3</sub>                    | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 100                                                        |
| I-157 | 3-Cl-4-CH <sub>3</sub>                | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 5.2 (d); 4.0 (q); 3.8 (s)                                  |
| I-158 | 4-OCH <sub>3</sub>                    | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 82-85                                                      |
| I-159 | 4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | m/e 398 (M+1)                                              |
| I-160 | 4-F-3-CH <sub>3</sub>                 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | m/e 386 (M+1)                                              |
| I-161 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>       | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | m/e 382 (M+1)                                              |
| I-162 | 4-CH <sub>3</sub>                     | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | m/e 368 (M+1)                                              |
| I-163 | 4-Br                                  | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 2.8 (t); 3.65 (t); 3.8 (s);<br>3.85 (s)                    |
| I-164 | 4-CF <sub>3</sub>                     | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 1.3 (m); 1.5 (m);<br>2.85 (t); 3.65 (t)                    |
| I-165 | 4-Cl                                  | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 1.3 (m); 1.5 (m);<br>2.35 (m); 5.5 (s); 5.6 (d)            |
| I-166 | 4-CH <sub>3</sub>                     | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 2.35 (d); 2.8 (m); 3.6 (m);<br>3.8 (s); 3.85 (s); 5.5 (m); |
| I-167 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>     | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 0.9 (m); 2.4 (m); 2.6 (m);<br>5.5 (s)                      |
| I-168 | 4-OCH <sub>3</sub>                    | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 2.35 (m); 2.8 (m);<br>3.6 (m); 5.5 (s); 5.6 (d)            |
| I-169 | 4-CH <sub>3</sub> -3-Cl               | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 2.3 (s); 3.0 (m); 3.6 (m);<br>5.5 (s); 5.6 (d)             |
| I-170 | 4-CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>   | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 1.25 (d); 2.35 (m);<br>2.8 (m); 2.9 (m); 5.6 (d)           |
| I-171 | 4-F-3-Cl                              | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 1.25 (m); 1.5 (m); 2.3 (m);<br>2.8 (m); 5.5 (s); 5.75 (d)  |
| I-172 | 3,4-Cl <sub>2</sub>                   | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 1.3 (m); 1.5 (m); 2.3 (m);<br>2.8 (m); 5.5 (s); 5.75 (d)   |
| I-173 | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 83-85                                                      |
| I-174 | 4-Br-3-F                              | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 1.3 (m); 1.5 (m); 2.25 (m);<br>2.8 (m); 3.6 (m)            |
| I-175 | 4-OCH <sub>3</sub> -3-CH <sub>3</sub> | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 1.3 (m); 1.5 (m); 2.2 (m);<br>2.4 (m); 2.8 (t)             |
| I-176 | 3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                 | 69-72                                                      |

| 號碼    | X <sub>n</sub>                        | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup>  | 物理資料(M.P. [°C];<br>1H-NMR δ [ppm]; M [m/e])                    |
|-------|---------------------------------------|-----------------------------------------------------|-----------------|----------------------------------------------------------------|
| I-177 | 4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 2.35(m); 2.8(m);<br>3.6(m); 4.0(t)                             |
| I-178 | 4-OCF <sub>3</sub>                    | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1.3(m); 1.5(m); 2.3(m);<br>2.8(t); 3.65(m)                     |
| I-179 | 3-OCH <sub>3</sub>                    | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 63-65                                                          |
| I-180 | 4-Cl                                  | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | 83-86                                                          |
| I-181 | 4-CF <sub>3</sub>                     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1.4(s); 2.8(m); 3.2(s);<br>3.6(m); 3.8(s);<br>3.85(s); 5.95(s) |
| I-182 | 4-CH <sub>3</sub>                     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1.4(m); 2.8(m); 3.2(m);<br>3.65(m)                             |
| I-183 | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1.3(s); 1.4(m); 2.8(m);<br>3.2(s)                              |
| I-184 | 4-CH <sub>3</sub> -3-Cl               | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | 112-115                                                        |
| I-185 | 4-Br                                  | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1.4(s); 2.8(m); 3.2(s);<br>3.6(m)                              |
| I-186 | 4-F                                   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1.5(s); 2.8(t); 3.2(s);<br>3.65(m)                             |
| I-187 | 4-OCH <sub>3</sub> -3-CH <sub>3</sub> | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1.5(m); 2.25(s); 2.8(t);<br>3.2(s)                             |
| I-188 | 4-OCF <sub>3</sub>                    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1.4(s); 2.8(t); 3.2(s);<br>3.65(m)                             |
| I-189 | 4-Br                                  | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 0.9(s); 1.0(s); 2.5(m);<br>2.8(t)                              |
| I-190 | 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 0.9(t); 1.0(d);<br>1.25(s); 3.65(m)                            |
| I-191 | 4-F                                   | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 2.5(m); 2.9(t);<br>3.65(m); 5.7(d)                             |
| I-192 | 4-OCF <sub>3</sub>                    | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 2.5(m); 2.8(t); 3.7(m);<br>3.9(d)                              |
| I-193 | 4-OCH <sub>3</sub> -3-CH <sub>3</sub> | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 0.9(t); 1.0(d);<br>2.25(s); 2.8(t)                             |
| I-194 | 4-CF <sub>3</sub>                     | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 0.9(t); 1.0(d);<br>1.55(s); 2.5(m); 2.8(t)                     |
| I-195 | 4-Cl                                  | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 0.9(t); 1.0(d); 1.4(m);<br>2.25(s); 2.8(t)                     |
| I-196 | 4-CH <sub>3</sub>                     | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 0.9(t); 1.0(d); 1.4(m);<br>2.5(m); 3.7(m)                      |
| I-197 | 4-Cl                                  | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | 117-120                                                        |
| I-198 | 4-CH <sub>3</sub>                     | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | 102-105                                                        |
| I-199 | 4-Br-3-F                              | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | 115-118                                                        |
| I-200 | 4-CH <sub>3</sub> -3-Cl               | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | 0.5(t); 0.9(m); 2.0(m);<br>2.8(t)                              |
| I-201 | 4-Br-3-CH <sub>3</sub>                | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | 0.5(t); 0.9(m); 2.0(m);<br>2.75(m)                             |
| I-202 | 4-CH <sub>3</sub>                     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | 1.15(s); 2.4(s);<br>2.8(t); 3.65(m)                            |

| 號碼    | X <sub>n</sub>                        | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup>                  | 物理資料(M.p.[°C];<br><sup>1</sup> H-NMR δ [ppm]; M [m/e]) |
|-------|---------------------------------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------|--------------------------------------------------------|
| I-203 | 4-Br-3-CH <sub>3</sub>                | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                 | 1.15(s); 2.4(s);<br>2.8(t); 3.8(s)                     |
| I-204 | 4-Br                                  | c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 74-79                                                  |
| I-205 | 4-Br-3-CH <sub>3</sub>                | c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 82-86                                                  |
| I-206 | 4-Br                                  | c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>                     | CH <sub>3</sub>                 | 108-113                                                |
| I-207 | 4-Br-3-CH <sub>3</sub>                | c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>                     | CH <sub>3</sub>                 | 81-84                                                  |
| I-208 | 4-Br                                  | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.4(s); 1.5(t); 2.8(m);<br>3.25(s)                     |
| I-209 | 4-CF <sub>3</sub>                     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.4(s); 1.45(t);<br>2.75(m); 3.25(s); 3.8(s)           |
| I-210 | 4-CH <sub>3</sub>                     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(m); 3.25(s);<br>3.6(m); 3.75(s)                    |
| I-211 | 4-Cl                                  | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.35(s); 1.45(t);<br>2.8(m); 3.2(s)                    |
| I-212 | 4-CH <sub>3</sub> -3-Br               | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.35(s); 1.45(t);<br>2.8(t); 4.1(m)                    |
| I-213 | 3,4-Cl <sub>2</sub>                   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.35(s); 1.45(t);<br>3.2(s); 4.1(s); 5.9(s)            |
| I-214 | 3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.35(s); 1.45(t);<br>3.2(s); 4.1(s); 5.9(s)            |
| I-215 | 3-OCH <sub>3</sub>                    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(m); 3.2(s);<br>3.65(m); 3.85(s)                    |
| I-216 | 4-F-3-Cl                              | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.3(s); 1.5(t);<br>2.75(t); 3.2(s); 3.8(s)             |
| I-217 | 4-Br-3-F                              | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.4(s); 2.8(t); 3.2(s);<br>3.6(m)                      |
| I-218 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>     | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.6(s); 2.75(t); 3.25(s);<br>3.75(s); 4.1(m)           |
| I-219 | 4-F                                   | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.45(s); 1.5(t); 2.8(t);<br>3.2(s); 3.6(m)             |
| I-220 | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>      | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(t); 3.2(s);<br>3.65(m); 3.8(s)                     |
| I-221 | 4-OCH <sub>3</sub> -3-CH <sub>3</sub> | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(m); 3.25(s); 3.6(m);<br>3.80(s); 3.85(s)           |
| I-222 | 4-OCF <sub>3</sub>                    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.4(s); 2.8(m); 3.25(s);<br>3.6(m); 3.80(s); 4.1(m)    |
| I-223 | 4-Br                                  | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.5(m); 2.8(m); 3.6(m);<br>4.1(m)                      |
| I-224 | 4-Cl                                  | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.5(m); 2.8(t); 3.6(m);<br>3.65(m); 3.8(s)             |
| I-225 | 4-CF <sub>3</sub>                     | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.8(m); 3.25(s); 3.6(m);<br>3.80(s); 3.85(s)           |
| I-226 | 4-F                                   | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.5(m); 2.8(t); 3.6(m);<br>3.75(s); 4.1(m)             |
| I-227 | 4-OCH <sub>3</sub> -3-CH <sub>3</sub> | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2.5(m); 2.8(t); 3.6(m);<br>3.75(s); 4.1(m)             |

| 號碼    | X <sub>2</sub>          | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup>                                        | 物理資料 (M.p. [°C];<br>1H-NMR δ [ppm]; M [m/e])                                                                          |
|-------|-------------------------|-----------------------------------------------------|-------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| I-228 | 4-CH <sub>3</sub> -3-Br | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                       | 0.9(t); 1.0(d); 2.5(m);<br>2.8(t); 3.6(t)                                                                             |
| I-229 | 3,4-Cl <sub>2</sub>     | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                       | 0.9(t); 1.0(d); 2.5(m);<br>3.8(s); 5.75(d)                                                                            |
| I-230 | 4-CH <sub>3</sub>       | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                       | 0.9(t); 1.0(d); 2.5(m);<br>2.8(t); 3.6(m)                                                                             |
| I-231 | 4-Br-3-Cl               | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub>                                       | 105-111                                                                                                               |
| I-232 | 4-Br-3-Cl               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                     | CH <sub>3</sub>                                       | 95-113                                                                                                                |
| I-233 | 4-Br-3-Cl               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                     | CH <sub>3</sub>                                       | 103-105                                                                                                               |
| I-234 | 4-Br-3-CH <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                       | 92-94                                                                                                                 |
| I-235 | 4-Cl-3-CH <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                     | CH <sub>3</sub>                                       | 94-99                                                                                                                 |
| I-236 | 4-Cl-3-CH <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                       | 70-80                                                                                                                 |
| I-237 | 4-Cl-3-CH <sub>3</sub>  | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | CH <sub>3</sub>                                       | 116-118                                                                                                               |
| I-238 | 4-Cl-3-CH <sub>3</sub>  | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                       | 94-95                                                                                                                 |
| I-239 | 4-Cl-3-CH <sub>3</sub>  | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                       | 0.95(t); 2.3(d); 2.8(t);<br>3.6(m); 3.75(s)                                                                           |
| I-240 | 4-Cl-3-CH <sub>3</sub>  | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub>                                       | 117-120                                                                                                               |
| I-241 | 4-F-3-Cl                | c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub>                                       | 93-98                                                                                                                 |
| I-242 | 4-Br-3-CH <sub>3</sub>  | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                       | 1.15(s); 1.35(t);<br>2.25(s); 2.8(m);<br>3.65(m); 3.75(s);<br>4.0(m); 5.8(s)                                          |
| I-243 | 4-Br                    | C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> -<br>C=CC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 1.0(t); 1.1(s);<br>2.25(q); 2.75(q);<br>3.5(q); 3.7(s); 4.6(s);<br>5.6(s); 5.8(s); 6.6(m);<br>6.85(m); 7.2(m); 7.4(m) |

c-C<sub>3</sub>H<sub>5</sub> = 環丙基

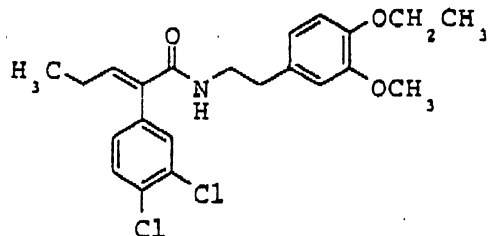
c-C<sub>5</sub>H<sub>9</sub> = 環戊基

對抗有害真菌之作用之實例

式I化合物之殺真菌作用可由以下之測試證明：

分別地或一起製備活性化合物I，成為在70重量%之環己酮、20重量%之Nekanil<sup>®</sup> LN (Lutensol<sup>®</sup> AP6，乙氧化烷酚為主之具乳化及分散作用之潤濕劑)、與10重量%之Wettol<sup>®</sup> EM (乙氧化蓖麻油為主之非離子性乳化劑)之混合物中之10%乳液，及以水適當地稀釋成所需濃度。

使用化合物 A 作為比較性活性化合物，其已知為得自 WO-A 01/95721 專利之化合物號碼 I-17：



比較例 - 對抗因葡萄生單軸黴造成之葡萄霜黴病之活性 (持續效果)

將由包括 10% 之活性化合物、85% 之環己酮、與 5% 之乳化劑之原料溶液製備之活性化合物之水性製品，噴灑在盆栽 “Müller-Thurgau” 種之藤之葉子上至溢出點。為了可評定物質之持續效果，在噴灑塗料乾燥後，將植物置於溫室中 7 日。然後以霜黴病之泳動孢子水性懸浮液僅接種葉子。然後起初將藤置於在 24°C 以水蒸氣飽和之槽中 48 小時，繼而在 20 至 30°C 間溫度之溫室中 5 日。在此期間後，再度將植物置於潮濕槽中 16 小時以加速孢囊之長出。然後目視地測定在葉子下側發生感染之程度。

在此試驗中，經 63 ppm 之活性化合物 I-44 處理之植物顯示 3% 感染，而經 63 ppm 之比較性活性化合物 A 處理之植物為 40% 感染，及未經處理植物為 90% 感染。

使用例 1 - 對抗因葡萄生單軸黴造成之葡萄霜黴病之活性

在上述之實驗條件下，經 250 ppm 之活性化合物 I-1 至 I-23、I-26 至 I-50、I-52 至 I-87、I-89 至 I-101、I-103 至 I-112、I-128、I-130、I-132、I-134、與 I-136 處理之植物顯示無或至多 15% 感染，而未經處理植物為 90% 感染。

使用例 2-對抗因疫黴屬寄生蟲造成之蕃茄枯萎病之活性

將由包括 10%之活性化合物、85%之環己酮、與 5%之乳化劑之原料溶液製備之活性化合物之水性製品，噴灑在“Große Fleischtomate St. Pierre”種之盆栽植物之葉子上至溢出點。次日以具  $0.25 \times 10^6$  個孢子/毫升濃度之疫黴屬寄生蟲之泳動孢子冷水性懸浮液感染葉子。繼而將植物置於在 18 至 20°C 間溫度以水蒸氣飽和之槽中。6 日後，未經處理但感染對照植物之蕃茄枯萎病已廣泛地發生而可目視地測定感染 %。

在此試驗中，經 250 ppm 之活性化合物 I-1 至 I-7、I-9 至 I-11、I-13 至 I-23、I-26、I-28、I-29、I-31、I-33 至 I-35、I-37 至 I-44、I-46 至 I-52、I-54、I-55、I-57 至 I-88、I-90、I-91、I-93 至 I-97、I-99、I-101、I-103 至 I-111、I-128、I-130、I-139 至 I-158、I-180 至 I-182、I-184、I-185、I-187、I-188、I-197 至 I-203、I-208 至 I-218、I-221、I-223、I-224、及 I-228 至 I-240 處理之植物顯示無或至多 15% 感染，而未經處理植物為 100% 感染。

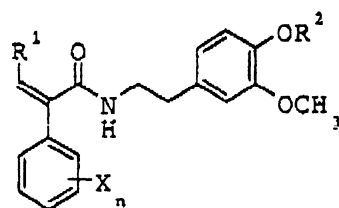
使用例 3-對抗因葡萄生單軸黴造成之葡萄霜黴病之活性

將下示濃度之活性化合物之水性懸浮液噴灑在“Müller-Thurgau”種盆栽藤上至溢出點。懸浮液或乳液係由以 10%之活性化合物於包括 85%之環己酮與 5%之乳化劑之混合物之原料溶液製備。次日以霜黴病之泳動孢子水性懸浮液接種葉子下側。然後起初將藤置於在 24°C 以水蒸氣飽和之槽中 48 小時，繼而在 20 至 30°C 間溫度之溫室中 5 日。在此期間後，再度將植物置於潮濕槽中 16 小時以加速孢囊之長出。然後目視地測定在葉子下側發生感染之程度。

在此試驗中，經 250 ppm 之活性化合物 I-150 至 I-158、I-168、I-171、I-180 至 I-189、I-194 至 I-204、I-207 至 I-225、及 I-227 至 I-240 處理之植物顯示無或至多 7% 感染，而未經處理植物為 90% 感染。

## 肆、中文發明摘要

式 I 之 Z-取代之丙烯醯胺



I

其中取代基具有以下之意義：

X 為氫、鹵素、烷基、鹵烷基、烷氧基、與鹵烷氧基，其中 X 在 3-或 4-位置；

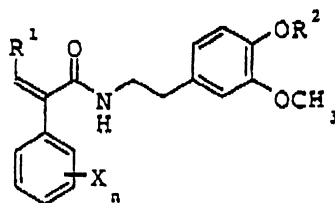
n 為 1 或 2，如果 n 表示 2 則 X 可不相同；

R¹ 為烷基、鹵烷基、環烷基、烷氧基、鹵烷氧基、吡啶基、與環氧乙基；及

R² 為氫、烷基、鹵烷基、烯丙基、炔丙基、或 CH₂C≡C-烷基。其製法及含彼等之組合物，及其在控制有害植物病原真菌之用途。

## 伍、英文發明摘要

Z-substituted acrylamides of the formula I



I

in which the substituents have the following meanings:

X is hydrogen, halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy and haloalkoxy, in which X is in the 3- or 4-position

n is 1 or 2, it being possible for X to be different if n represents 2;

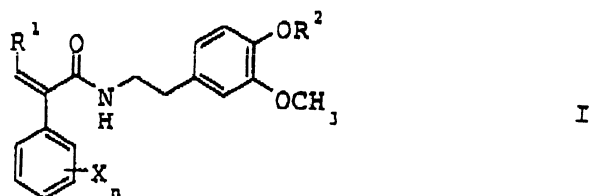
R¹ is alkyl, haloalkyl, cycloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, aziridinyl and oxiranyl; and

R² is hydrogen, alkyl, haloalkyl, allyl, propargyl or CH₂C≡C-alkyl.

Process for their preparation and compositions comprising them and their use in the control of harmful phytopathogenic fungi.

## 拾、申請專利範圍

1. 一種式 I 之 Z-取代之丙烯醯胺

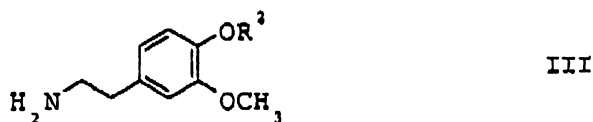


其中取代基具有以下之意義：

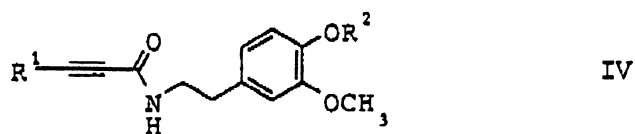
- X 為氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、與 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷氧基，其中 X 在 3-或 4-位置；
- n 為 1 或 2，如果 n 表示 2 則 X 可不相同；
- R<sup>1</sup> 為 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷氧基、吡啶基、與環氧乙基；及
- R<sup>2</sup> 為氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-鹵烷基、烯丙基、炔丙基、或 CH<sub>2</sub>C≡C-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基。
2. 根據申請專利範圍第 1 項之式 I 之丙烯醯胺，其中 X 為 4-鹵素。
3. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之式 I 之丙烯醯胺，其中 R<sup>1</sup> 為乙基、異丙基、第三丁基、環丙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、或三氟甲氧基。
4. 一種製備根據申請專利範圍第 1 或 2 項之化合物之方法，其包含反應式 II 之羧酸，



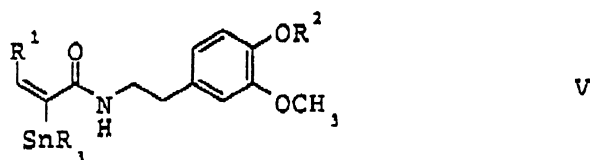
其中 R<sup>1</sup> 具有式 I 所示之意義，與式 III 之苯乙胺，



其中  $R^2$  具有式 I 所示之意義，產生式 IV 之苯乙基醯胺



以氫化三烷錫將其轉化成為式 V 之有機錫化合物



其中 R 為  $C_1$ - $C_6$ -烷基，以式 VI 之苯基鹵化物進行過渡金屬催化



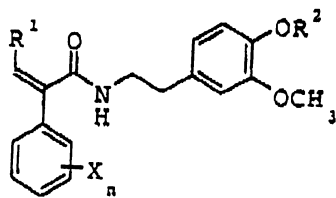
其中 Hal 為溴或碘，將此化合物轉化成為式 I 化合物。

5. 一種適合控制有害植物病原真菌之組合物，其包含固態或液態載劑及根據申請專利範圍第 1 或 2 項之式 I 化合物。
6. 一種將根據申請專利範圍第 1 或 2 項之式 I 化合物作為中間物之用途，其中  $R^2$  表示氫。
7. 一種控制有害植物病原真菌之方法，其包含以有效量之根據申請專利範圍第 1 或 2 項之通式 I 化合物處理真菌或保護不受真菌侵襲之材料、植物、土壤、或種子。

陸、(一)、本案指定代表圖為：第\_\_\_\_\_圖

(二)、本代表圖之元件代表符號簡單說明：

柒、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



I