

302354

公告本

A4  
C4

申請日期	84.05.04
案號	84104472
Int. 別	6 C07C 25/34 A01N 35/03/52

302354

(以上各欄由本局填註)

## 發明專利說明書

一、發明名稱	中文	0-(經亞胺基)乙基環己烯酮肟醚及其作為除草劑之用途
	英文	"0-(OXIMINO)ETHYLCYCLOHEXENONE OXIME ETHERS AND THEIR USE AS HERBICIDES"
二、發明人	姓名	1. 伍夫·米利茲 2. 艾布利克特·哈魯斯 3. 哈特曼·柯尼格 4. 海慕特·瓦特 5. 卡爾-歐托·威斯菲林 6. 馬希亞士·格伯
	國籍	均德國
住、居所		1. 德國紐斯塔特市安賀查爾40號 2. 德國來恩河勞域沙芬市泰克加斯13號 3. 德國海德堡市布魯曼街16號 4. 德國歐布利罕市格倫斯塔特街82號 5. 德國史培爾市茅斯伯格路58號 6. 德國林伯格赫夫市布倫登伯格街24號
三、申請人	姓名 (名稱)	德商巴地斯顏料化工廠
	國籍	德國
	住、居所 (事務所)	德國來恩河勞域沙芬市卡爾-波斯街38號
代表姓名		1. 卡爾-菲得里契·班格 2. 克勞斯·狄特·藍芬

裝

訂

線

308354

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大類：
IPC分類：

A6  
B6

本案已向：

國(地區) 申請專利，申請日期： 案號： ， 有 無主張優先權

德 1994.5.5 P4415871.8

有關微生物已寄存於： ，寄存日期： ，寄存號碼：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

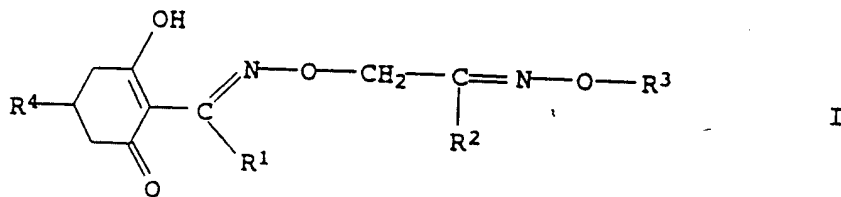
訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

## 五、發明說明(1)

本發明係有關新穎之式 I 0-(經亞胺基)乙基環己烯酮脞  
 醚



其中取代基之定義如下：

$R^1$  為  $C_1-C_6$ -烷基；

$R^2$  為  $C_1-C_6$ -烷基；

$R^3$  為苯基，可未取代或可帶有 1 至 3 個選自下列之取代基：硝基、氟基、鹵素、 $C_1-C_4$ -烷基與  $C_1-C_4$ -鹵烷基；

$C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_4$ -烯基或  $C_3-C_4$ -炔基，此等基團若需要時可帶有一個下列取代基：

鹵素、 $C_1-C_3$ -烷基、

苯基，若需要時可再帶有 1 至 3 個選自下列之自由基：硝基、氟基、鹵素、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -鹵烷基、苯基及苯氧基，或

苯氧基，若需要時可再帶有 1 至 3 個選自下列之自由基：硝基、氟基、鹵素、 $C_1-C_4$ -烷基及  $C_1-C_4$ -鹵烷基；

$R^4$  為  $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_6$ -烷基或  $C_1-C_4$ -烷硫基

## 五、發明說明(2)

-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基；

苯硫基 -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基，該苯基若需要時可帶有 1 至 3 個選自鹵素與 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基中之取代基；

N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- 烷磺醯基)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- 烷基)胺甲基、

C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-環烷基或 C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>-環烯基，其中此等基團可未取代或可分別帶有 1 至 3 個選自下列之取代基：羥基、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷硫基與 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基；

含有 1 或 2 個氧及 / 或硫原子作為雜原子之 5 員飽和雜環，其可未取代或可帶有 1 至 3 個選自下列之取代基：C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷硫基與 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基；

含有 1 或 2 個不相鄰之氧及 / 或硫原子作為雜原子之 6 或 7 員雜環，其可為飽和或單不飽和或二不飽和，其中該雜環可未取代或可帶有 1 至 3 個選自下列之取代基：羥基、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷硫基與 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基；

含有 1 或 2 個氮原子及一個氧或硫原子之 5 員雜芳香基，其中雜芳香基可未取代或可帶有 1 至 3 個選自下列之取代基：鹵素、氟基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷硫基與 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-烯氧基及 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基 -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- 烷基；

苯基或吡啶基，此等基團可未取代或分別帶有 1 至 3 個選自下列之取代基：鹵素、硝基、氟基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷

(請先閱讀背面之注意事項再為本頁)

裝

訂

## 五、發明說明 ( 3 )

基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基、  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-烯氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-炔氧基及-NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>，其中

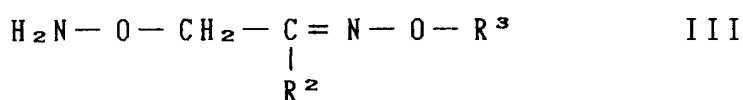
R<sup>a</sup> 為氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-烯基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-炔基，  
且

R<sup>b</sup> 為氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-炔基、  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-醯基或苯甲醯基，該基團若需要時可再帶  
有1至3個選自下列之自由基：硝基、氟基、鹵  
素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷硫基  
及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基，

及I之農業上可利用之鹽，及I與C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-羧酸或無機酸  
形成之酯。

本發明尚有關此等化合物作為除草劑之用途，含此等化  
合物作為活性物質之除草組合物，此等除草組合物之製法  
及使用化合物I控制不要之植物生長之方法。

本發明尚有關新穎之式III O-(羥亞胺基)乙基羥基胺



其中

R<sup>2</sup> 為C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基，且

R<sup>3</sup> 為苯基，可未取代或可帶有1至3個選自下列之取代  
基：硝基、氟基、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基及C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基  
；或

(請先閱讀背面之注意事項再  
寫本頁)

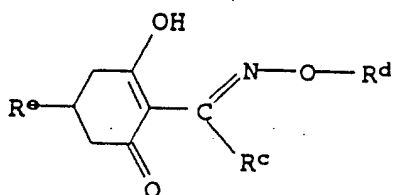
訂

五、發明說明 ( 4 )

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-烯基或C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-炔基，其中此等基團若需要時可帶有一個下列取代基：鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基、苯基，其可未取代或再帶有1至3個選自下列之自由基：硝基、氟基、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基、苯基及苯氧基，或  
 苯氧基，其若需要時可再帶有1至3個選自下列之自由基：硝基、氟基、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基與C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基；

及化合物 III 與無機酸形成之銨鹽。

文獻中曾揭示具有效除草性之式 I' 環己烷二酮



I'

R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>與R<sup>e</sup>特別如下定義：

- US 4,249,937 (R<sup>c</sup> = 低烷基；R<sup>d</sup> = 烷基、烯基；R<sup>e</sup> = 2-(4-氯苯硫基)伸乙基)；
- WO 92/08696 (R<sup>c</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基；R<sup>d</sup> = 苄基；R<sup>e</sup> = N-(甲磺鹽基)-N-甲基-胺甲基)；
- WO 93/10081 (R<sup>c</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基；R<sup>d</sup> = 經取代之3-苯基伸丙烯基；R<sup>e</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)；
- US 4,440,566 (R<sup>c</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基；R<sup>d</sup> = 苄基；R<sup>e</sup> =

(請先閱讀背面之注意事項再寫本頁)

表

訂

## 五、發明說明 ( 5 )

2-乙硫丙基) ;

- EP-A 238 021與EP-A 125 094 ( $R^c = C_1-C_4$ -或  
 $C_1-C_6$ -烷基 ;  $R^d =$  苄基 , 丁-2-烯基 ;  $R^e =$  經取代之  
5 員雜芳基) ;
- EP-A 80 301 ( $R^c = C_1-C_6$ -烷基 ;  $R^d =$  經取代之4-苯  
基伸丁基或4-苯基伸丁烯基 ;  $R^e =$  經取代之5至7員  
雜環) ;
- EP-A 456 112 ( $R^c = C_1-C_6$ -烷基 ;  $R^d =$  經取代之3-苯  
氧伸丙基或2-苯氧伸乙基 ;  $R^e =$  經取代之5至7員雜  
環) ;
- WO 93/16,063 ( $R^c = C_1-C_6$ -烷基 ;  $R^d =$  經取之 (亞苄  
基-亞胺基氧) 伸烷基 ;  $R^e =$  經取代之5至7員雜環  
) ;

由於已知化合物之除草性質，尤其在禾本科作物中對抗  
草本科雜草時之選擇性總是不完全令人滿意，因此本發明  
目的之一為提供新穎之環己烯酮肪醚類，其在禾本科作物  
中（如：稻與玉米）專一性控制草本科雜草之能力將更優  
於先前技藝。

吾等已發現，此目的可由本文初所定義之O-（羥亞胺基  
）乙基環己烯酮肪醚I、其作為除草劑之用途、含化合物  
I之除草組合物、製造此等組合物之方法及使用化合物I  
控制不要之植物生長之方法等來達成。

O-（羥亞胺基）乙基環己烯酮肪醚I可依各種方式得到  
，亦即最好依本身已知方式，由已揭示之式II環己烯酮（

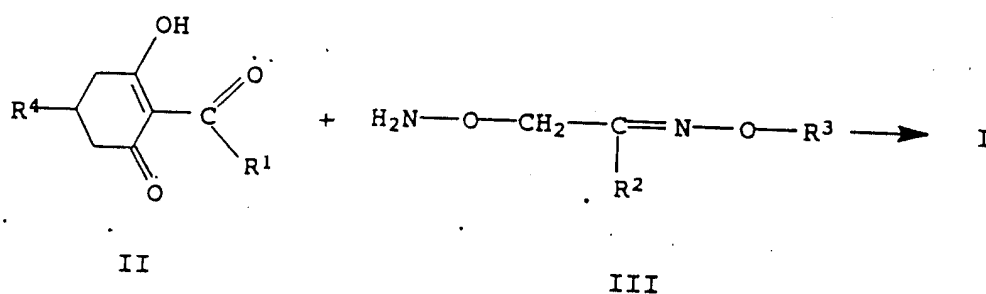
(請先閱讀背面之注意事項再寫本頁)

裝

訂

## 五、發明說明 ( 6 )

參見例如：DE-A 38 38 309、EP-A 456 112、US 4,249,937 與 WO 92/08696 ) 及式 III 0- ( 羥亞胺基 ) 乙基羥基胺製得：



最好使用羥基胺 III 之鹽，特定言之鹽酸鹽，且該反應係於多相中，在惰性溶劑中進行，例如：二甲亞砷、醇如：甲醇、乙醇或異丙醇、芳香烴如：苯甲甲苯、氯化烴如：氯仿或 1,2-二氯乙烷、脂系烴如：己烷或環己烷、酯如：乙酸乙酯或醚如：乙醚、二氧陸圓或四氫呋喃。

該反應係於鹼之存在下進行，鹼之用量通常為胺化合物之約 0.5 至 2 莫耳當量即足夠。

合適之鹼為例如：鹼金屬或鹼土金屬之碳酸鹽、碳酸氫鹽、乙酸鹽、醇鹽或氧化物，特定言之氫氧化鈉、氫氧化鉀、氧化鎂或氧化鈣。此外，有機鹼如：吡啶及三級胺如：三乙胺亦適用。

該反應最好在甲醇中，使用碳酸氫鈉作為鹼來進行。

進行該反應之一種方法為由游離羥基胺 III，在無鹼下，例如：呈水溶液形式反應；依化合物 II 所使用之溶劑而定，可得到單相或二相反應混合物。

(請先閱讀背面之注意事項)

(寫本頁)

裝

訂

## 五、發明說明 ( 7 )

適合此方法之溶劑為例如：醇類如：甲醇、乙醇、異丙醇與環己醇，可氯化之脂系與芳香系烴類如：己烷、環己烷、二氯甲烷、甲苯與二氯乙烷，酯類如：乙酸乙酯，腈類如：乙腈及環狀醚類如：二氧陸圈與四氫呋喃。

環己烯酮 II 與 O- ( 羥亞胺基 ) 乙基羥基胺 III 或其鹽之用量宜約化學計量比例，但有時候其中一個成份或另一個成份宜過量，至高過量約 10 莫耳 % 。

反應溫度通常由 0 °C 至反應混合物之沸點，20 至 80 °C 較佳。

反應在數小時後完成。產物可依習知方法單離，例如：濃縮混合物，殘質分佈在二氯甲烷 / 水中，及減壓蒸餾排除溶劑。

壓力條件沒有一定；因此通常在常壓下或在特定稀釋劑自行產生之壓力下進行反應。

根據本發明環己烯酮肟醚類 I 可呈其農業上可利用之鹽型或烯醇酯型，此時鹽或酯之性質通常沒有影響。一般而言，對 I 之除草作用沒有負面影響之鹼即適合形成鹽，此等酸適合進行酯化。

化合物 I 之鹼金屬鹽之製法可由 3-羥基環己烯酮化合物經鈉或鉀之氫氧化物或醇鹽，於水溶液或有機溶劑中如：甲醇、乙醇、丙酮或甲苯中處理。

其他金屬鹽如：錳、銅、鋅、鐵、鈣、鎂與鋇等鹽類可依一般方法，由鈉鹽製備，及銨、磷、銻與銻 ( Sulfoxonium ) 鹽等則利用銨、磷、銻與銻之氫氧化物製備

(請先閱讀背面之注意事項  
填寫本頁)

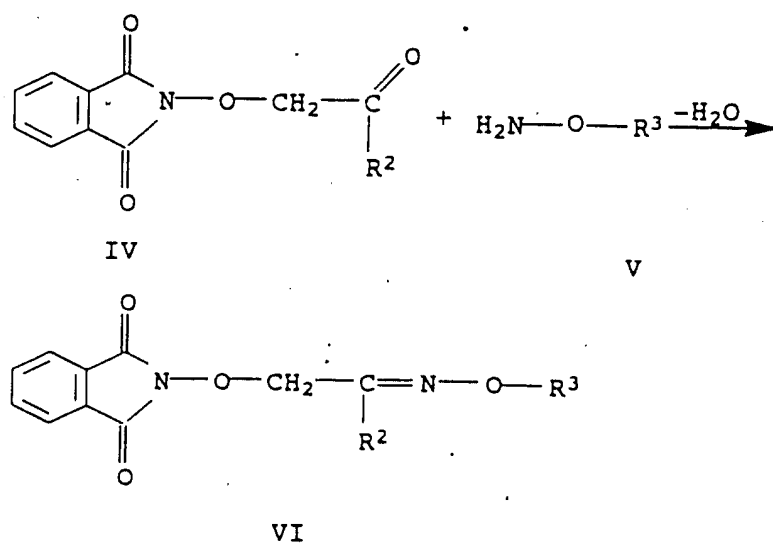
裝

訂

## 五、發明說明( 8 )

化合物 I 之酯同樣地可依一般方式製得(參見例如：“有機學”，柏林 VEB 德國科學出版社，第 17 版，(Organikum, VEB Dentscher Verlag der Wissenschaften, 17 th edition, Berlin)，1988，pp. 405-408)。

新穎之式 III 0-( 羥亞胺基 ) 乙基羥基胺可依本身已知之一系列製造步驟，由已知前體製備。較佳者，依酮製法之已知方式(參見例如：胡本-惠爾之有機化學方法 (Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie), Vol. E 14b, p. 369) 由 N-(2-氧-1-烷氧基) 酞醯亞胺 IV {參見 Pharmazie 25, 400 (1970)} 與羥基胺 V (US 4,249,937、WO 92/08696、WO 93/10081、US 4,440,566、EP-A 238 021、EP-A 080 301、DE-A 38 38 309、EP-A 456 112、WO 93/16033、WO 93/1602) 偶合，並消去水

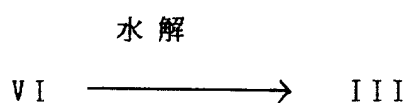


## 五、發明說明(9)

依此方式得到之脞醚衍生物 VI 可依一般操作法，例如：萃取或結晶法，自反應混合物中單離出。

脞醚衍生物 VI 在轉化成 O-(羥亞胺基) 乙基羥基胺 III 之前，若需要時可立即儲存。

形成 O-(羥亞胺基) 乙基羥基胺 III (具有游離胺基) 之轉化作用同樣可依本身已知方法進行。因此可參考 DE-A 36 15 973 及其中所摘錄文獻之詳細說明。最好採用 DE-A 36 15 973 所述之方法，根據該方法，利用乙醇胺釋出羥基胺 III。同樣地亦可能利用其他鹼如：水性無機鹼，利用胺、胼、羥基胺或利用水性酸，釋出羥基胺 III：



O-(羥亞胺基) 乙基羥基胺 III 可利用一般操作法，例如：萃取或結晶法，自所得之反應混合物中單離出。為了促進結晶，經常需使用無機酸或有機酸，將羥基胺轉化成其鹽。因此通常使用酸之稀溶液，以約化學計量之酸及羥基胺衍生物為宜。

如同 O-(羥亞胺基) 乙基羥基胺 III (具有游離胺基)，所得之羥基胺鹽可直接進一步反應，產生式 I 之除草劑，或若需要時則儲存起來。

根據取代基  $R^2$  及  $R^3$ ，O-(羥亞胺基) 乙基羥基胺 III 及 O-(羥亞胺基) 乙基環己烯酮脞醚 I 可在製備期間，呈異

(請先閱讀背面之注意事項)

(寫本頁)

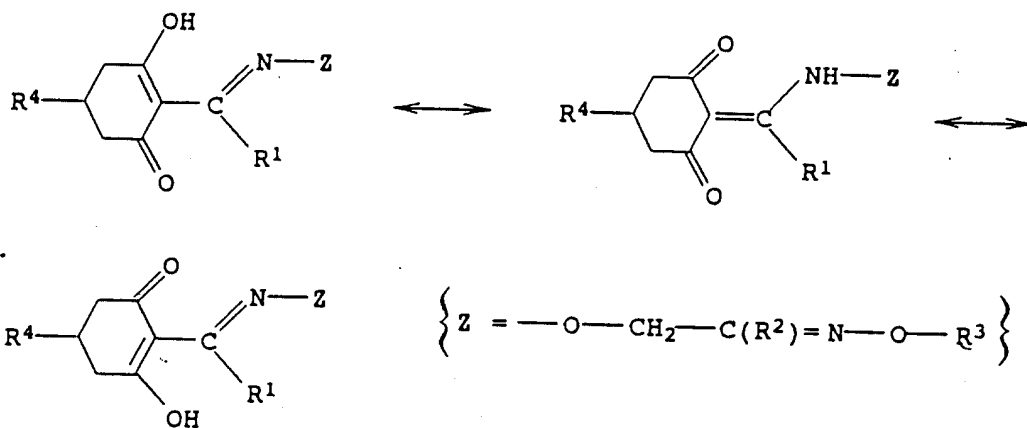
裝

訂

五、發明說明 ( 10 )

構物混合物得到，可能為 E/Z 異構物混合物及 ( R/S ) 對映異構物混合物或非對映異構物混合物。若需要時，可依習知方法例如：層析或結晶法，分離異構物混合物。

O-( 羥亞胺基 ) 乙基環己烯酮肟 I 可寫成數種互變異構型，均涵括在本發明內：



取代基定義中所採用之統稱名詞：

- 鹵素，
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基
- C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> 環烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub> 環烯基，
- C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-烯氧基，
- C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-炔氧基，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

## 五、發明說明 ( 11 )

- N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷磺醯基)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基) 胺甲基，
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基，
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-醯基，

其係各基團組員之簡稱列表。所有烷基、烷氧基、烷硫基、烷磺醯基、鹵烷基、烯基、烯氧基、炔基、炔氧基與醯基部份可為直鏈或分支。鹵烷基部份可帶有相同或相異鹵原子。

明確定義為例如：

- 鹵素：氟、氯、溴、碘；
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基：甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基、正丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、正戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基、1-乙基-2-甲基丙基；
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基：甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基、正丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基；
- C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基：甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基；
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基：甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基

(請先閱讀背面之注意事項，填寫本頁)

裝

訂

## 五、發明說明(12)

乙氧基、正丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基、  
1,1-二甲基乙氧基；

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷硫基：甲硫基、乙硫基、正丙硫基、1-甲基乙硫基、正丁硫基、1-甲基丙硫基、2-甲基丙硫基、1,1-二甲基乙硫基；
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基：如上述C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，其係經氟、氯及／或溴部份或完全取代，亦即例如：氯甲基、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-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、五氟乙基、3-氯丙基、七氟丙基；
- C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-烯基：乙烯基與C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-烯基，如：1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基

(請先閱讀背面之注意事項  
填寫本頁)

裝

訂

## 五、發明說明 (13)

、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基、1-乙基-2-甲基-2-丙烯基；

—  $C_3-C_4$ -烯基：1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基；

—  $C_2-C_6$ -烯氧基：乙烯氧基與  $C_3-C_6$ -烯氧基如：2-丙烯氧基、2-丁烯氧基、3-丁烯氧基、1-甲基-2-丙烯氧基、2-甲基-2-丙烯氧基、2-戊烯氧基、3-戊烯氧基、4-丁烯氧基、1-甲基-2-丁烯氧基、2-甲基-2-丁

(請先閱讀背面之注意事項，填寫本頁)

裝

訂

## 五、發明說明 ( 14 )

烯氧基、3-甲基-2-丁烯氧基、1-甲基-3-丁烯氧基、2-甲基-3-丁烯氧基、3-甲基-3-丁烯氧基、1,1,-二甲基-2-丙烯氧基、1,2,-二甲基-2-丙烯氧基、1-乙基-2-丙烯氧基、2-己烯氧基、3-己烯氧基、4-己烯氧基、5-己烯氧基、1-甲基-2-戊烯氧基、2-甲基-2-戊烯氧基、3-甲基-2-戊烯氧基、4-甲基-2-戊烯氧基、1-甲基-3-戊烯氧基、2-甲基-3-戊烯氧基、3-甲基-3-戊烯氧基、4-甲基-3-戊烯氧基、1-甲基-4-戊烯氧基、4-甲基-4-戊烯氧基、1,1-二甲基-2-丁烯氧基、1,2-二甲基-2-丁烯氧基、1,2-二甲基-3-丁烯氧基、1,3-二甲基-2-丁烯氧基、1,3-二甲基-3-丁烯氧基、2,2-二甲基-3-丁烯氧基、2,3-二甲基-2-丁烯氧基、2,3-二甲基-3-丁烯氧基、1-乙基-2-丁烯氧基、1-乙基-3-丁烯氧基、2-乙基-2-丁烯氧基、2-乙基-3-丁烯氧基、1,1,2-三甲基-2-丙烯氧基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯氧基、1-乙基-2-甲基-2-丙烯氧基；

- C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-炔基：丙-1-炔-1-基、丙-2-炔-3-基、正丁-1-炔-1-基、正丁-1-炔-4-基、正丁-2-炔-1-基、正戊-1-炔-1-基、正戊-1-炔-3-基、正戊-1-炔-4-基、正戊-1-炔-5-基、正戊-2-炔-1-基、正戊-2-炔-4-基、正戊-2-炔-5-基、3-甲基-丁-1-炔-1-基、3-甲基-丁-1-炔-3-基、3-甲基-丁-1-炔-4-基、正己-1-炔-1-基、正己-1-炔-3-基、正己-1-炔-4-基、正己

(請先閱讀背面之注意事項，填寫本頁)

訂

## 五、發明說明(15)

-1-炔-5-基、正己-1-炔-6-基、正己-2-炔-1-基、正己-2-炔-4-基、正己-2-炔-5-基、正己-2-炔-6-基、正己-3-炔-1-基、正己-3-炔-2-基、3-甲基-戊-1-炔-1-基、3-甲基-戊-1-炔-3-基、3-甲基-戊-1-炔-4-基、3-甲基-戊-1-炔-5-基、4-甲基-戊-1-炔-1-基、4-甲基-戊-2-炔-4-基、4-甲基-戊-2-炔-5-基；

- 一 C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-炔基：丙-1-炔-1-基、丙-2-炔-3-基、正丁-1-炔-1-基、正丁-1-炔-4-基、正丁-2-炔-1-基；
- 一 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-炔氧基：丙-1-炔-1-基氧、丙-2-炔-3-基氧、正丁-1-炔-1-基氧、正丁-1-炔-4-基氧、正丁-2-炔-1-基氧、正戊-1-炔-1-基氧、正戊-1-炔-3-基氧、正戊-1-炔-4-基氧、正戊-1-炔-5-基氧、正戊-2-炔-1-基氧、正戊-2-炔-4-基氧、正戊-2-炔-5-基氧、3-甲基丁-1-炔-1-基氧、3-甲基丁-1-炔-3-基氧、3-甲基丁-1-炔-4-基氧、正己-1-炔-1-基氧、正己-1-炔-3-基氧、正己-1-炔-4-基氧、正己-1-炔-5-基氧、正己-1-炔-6-基氧、正己-2-炔-1-基氧、正己-2-炔-4-基氧、正己-2-炔-5-基氧、正己-2-炔-6-基氧、正己-3-炔-1-基氧、正己-3-炔-2-基氧、3-甲基-戊-1-炔-1-基氧、3-甲基-戊-1-炔-3-基氧、3-甲基-戊-1-炔-4-基氧、3-甲基-戊-1-炔-5-基氧、4-甲基-戊-1-炔-1-基氧、4-甲基-戊-2-炔-4-基氧、4-甲基-戊-2-炔-5-基氧；
- 一 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-環烷基：環丙基、環丁基、環戊基、環己基、

(請先閱讀背面之注意事項，填寫本頁)

訂

## 五、發明說明 ( 16 )

環庚基；

- C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>-環烯基；例如：環戊-1-烯基、環戊-2-烯基、環戊-3-烯基、環己-1-烯基、環己-2-烯基、環己-3-烯基、環庚-1-烯基、環庚-2-烯基、環庚-3-烯基、環庚-4-烯基。

有關 O-(羥亞胺基)乙基環己烯酮肟醚 I 之除草活性之取代基本身或組合之特別佳定義如下：

R<sup>1</sup> 乙基與丙基；

R<sup>2</sup> 甲基；

R<sup>3</sup> 苯基，未取代或經下列基團單取代至三取代：

- 硝基、氟基；

- 鹵素，特定言之氟、氯；

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，特定言之甲基；

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基，特定言之三氟甲基；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-烯基或 C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-炔基，其中若需要時，此等基團可帶有下列一個取代基：

- 鹵素，特定言之氟、氯；

- C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基，特定言之甲基；

- 苯基，可未取代或可帶有 1 至 3 個選自下列之取代基：

- 硝基、氟基；

- 鹵素，特定言之氟、氯；

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，特定言之甲基；

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基，特定言之三氟甲基；

(請先閱讀背面之注意事項，填寫本頁)

訂

## 五、發明說明 (17)

- 苯基、苯氧基；

- 苯氧基，可未取代或可帶有 1 至 3 個選自下列之取代基：

- 硝基、氟基；

- 鹵素，特定言之氟、氯；

-  $C_1-C_4$ -烷基，特定言之甲基；

-  $C_1-C_4$ -鹵烷基，特定言之三氟甲基；

R<sup>4</sup> 如上述之  $C_1-C_6$ -烷基，其係經  $C_1-C_4$ -烷氧基（特定言之甲氧基、乙氧基、1-甲基乙氧基或 1,1-二甲基乙氧基），或經  $C_1-C_4$ -烷硫基（特定言之甲硫基或乙硫基）取代，最好於 1-、2-或 3-位置上取代；以 2-乙硫丙基極特別佳；

苯硫基- $C_1-C_6$ -烷基，特定言之 2-(苯硫基)乙基，其中苯環若需要時可帶有 1 至 3 個鹵原子，特定言之氟及 / 或氯原子，及 / 或  $C_1-C_4$ -鹵烷基，特定言之三氟甲基；

N-( $C_1-C_4$ -烷磺醯基)-N-( $C_1-C_4$ -烷基)胺甲基，特定言之 N-甲磺醯基-N-甲胺甲基或 N-乙磺醯基-N-甲胺甲基；

$C_3-C_7$ -環烷基或  $C_5-C_7$ -環烯基，若需要時可帶有 1 至 3 個下列自由基： $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -烷硫基及 / 或  $C_1-C_4$ -鹵烷基；以 1-甲硫基-1-環丙基特別佳；

5 員飽和雜環如：四氫呋喃基、四氫噻吩基、二氧戊

(請先閱讀背面之注意事項)

訂

訂

## 五、發明說明(18)

環基、二硫戊環基與氧硫戊環基，特定言之四氫呋喃基、四氫噻吩基與二氧戊環基，其中雜環可未取代或可帶有1至3個選自下列之自由基： $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -烷硫基及 $C_1-C_4$ -鹵烷基；

6或7員雜環，其

a) 可為飽和，例如四氫吡喃基、四氫硫吡喃基、氧雜環庚烷基、噻班基(thiepanyl)與二氧雜環庚烷-5-基，

b) 可為單不飽和或二不飽和，例如：二氫吡喃-3-基、二氫吡喃-4-基、二氫硫吡喃-3-基與二氫硫吡喃-4-基，

其中雜環可未取代或可帶有一至三個選自下列之自由基：經基、鹵素、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -烷硫基與 $C_1-C_4$ -鹵烷基；

以四氫吡喃-3-基、四氫吡喃-4-基與四氫硫吡喃-3-基特別佳；

5員雜芳香基如：吡咯基、吡唑基、咪唑基、異噁唑基、噁唑基、異噻唑基、噻唑基、呋喃基、噻吩基、1,2,4-噁二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噁二唑-2-基及1,3,4-噻二唑-2-基，以異噁唑基與呋喃基較佳，其中雜芳香基可未取代或可帶有1至3個選自下列之基團：

-  $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -烷硫基與  
 $C_1-C_4$ -鹵烷基，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

## 五、發明說明 ( 19 )

-  $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基如：甲氧甲基、2-甲氧乙基、2-甲氧丙基、3-甲氧丙基、2-甲氧基-1-甲基乙基、乙氧甲基、2-乙氧乙基、2-乙氧丙基、3-乙氧丙基、2-乙氧基-1-甲基乙基及1-乙氧基-1-甲基乙基，特定言之甲氧乙基與乙氧乙基，

-  $C_2-C_6$ -烯基如：乙烯基與 $C_3-C_6$ -烯基，

-  $C_2-C_6$ -烯氧基，特定言之1-甲基乙烯-1-基氧；

苯基或吡啶基，其二者可均未取代，或可共同帶有1至3個選自下列之自由基：

- 1至3個下列之自由基： $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基、 $C_1-C_4$ -烷硫基、 $C_1-C_4$ -鹵烷基、 $C_3-C_6$ -烯氧基、 $C_3-C_6$ -炔氧基及

- 自由基 $-NR^aR^b$ ，其中

$R^a$ 為氫，

$C_1-C_4$ -烷基，特定言之甲基與乙基，

$C_3-C_6$ -烯基，特定言之2-丙烯基與2-丁烯基，或

$C_3-C_6$ -炔基，特定言之2-丙炔基與2-丁炔基，

且

$R^b$ 為氫，

$C_1-C_4$ -烷基，特定言之甲基或乙基，

$C_3-C_6$ -烯基，特定言之2-丙烯基與2-丁烯基，

$C_3-C_6$ -炔基，特定言之2-丙炔基與2-丁炔基，

$C_1-C_6$ -醯基，如：乙醯基、丙醯基、正丁醯基、

2-甲基丙醯基、戊醯基、2-甲基丁醯基、3-甲基丁

(請先閱讀背面之注意事項)  
換寫本頁)

深

訂

## 五、發明說明(20)

醯基、2,2-二甲基丙醯基、正己醯基、2-甲基戊醯基、4-甲基戊醯基、2,2-二甲基丁醯基、2,3-二甲基丁醯基、3,3-二甲基丁醯基、與2-乙基丁醯基，特定言之乙醯基與丙醯基；

或為

苯甲醯基，其可未取代或可帶有1至3個選自下列之自由基：硝基、氰基、鹵素，以氟、氯與溴較佳， $C_1-C_4$ -烷基，以甲基較佳， $C_1-C_4$ -烷氧基，以甲氧基及乙氧基較佳， $C_1-C_4$ -烷硫基，以甲硫基較佳，及 $C_1-C_4$ -鹵烷基，以三氟甲基較佳。

式I 0-(經亞胺基)乙基環己烯酮脞醚之合適鹽為農業上可利用之鹽，例如：鹼金屬鹽，特定言之鈉或鉀鹽，鹼土金屬鹽，特定言之鈣、鎂或鋇鹽，錳、銅、鋅或鐵鹽，及銨、磷、銻或砷鹽，例如：銨鹽、四烷銨鹽、苄基三烷基銨鹽、三烷基銻鹽或三烷基砷鹽。

農業上可利用之酯咸了解最好係指 $C_1-C_{10}$ -脂肪酸之酯，特定言之 $C_1-C_6$ -烷羧酸如：甲烷羧酸(乙酸)、乙烷羧酸(丙酸)、丙烷羧酸(丁酸)、1-甲基乙烷羧酸(異丁酸)、丁烷羧酸、1-甲基丙烷羧酸、2-甲基丙基羧酸、1,1-二甲基乙烷羧酸、戊烷羧酸、1-甲基丁烷羧酸、2-甲基丁烷羧酸、3-甲基丁烷羧酸、1,1-二甲基丙烷羧酸、1,2-二甲基丙烷羧酸、2,2-二甲基丙烷羧酸、1-乙基丙烷羧酸、苯甲酸與經鹵素取代之苯甲酸、己烷羧酸、1-甲基戊烷羧酸、2-甲基戊烷羧酸、3-甲基戊烷羧酸、4-甲基戊

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

## 五、發明說明 ( 21 )

烷羧酸、1,1-二甲基丁烷羧酸、1,2-二甲基丁烷羧酸、1,3-二甲基丁烷羧酸、2,2-二甲基丁烷羧酸、2,3-二甲基丁烷羧酸、3,3-二甲基丁烷羧酸、1-乙基丁烷羧酸、2-乙基丁烷羧酸、1,1,2-三甲基丙烷羧酸、1,2,2-三甲基丙烷羧酸、1-乙基-1-甲基丙烷羧酸與1-乙基-2-甲基丙烷羧酸。

0-(羥亞胺基)乙基環己烯酮肟醚 I，其鹽及酯（包括異構物混合物及純異構物型）適用為除草劑，特定言之控制禾本科（Gramineae）植物品種。通常闊葉作物及不屬於禾本科的單子葉植物均可耐受，因此具選擇性。有些根據本發明化合物 I 亦適合選擇性控制禾本科作物中不要之雜草。

對抗作物（如：小麥、稻、玉米、大豆與棉花）中闊葉雜草及禾本科雜草之選擇性作用特別出現在低施用率時。

0-(羥亞胺基)乙基環己烯酮肟醚 I、其鹽及酯、或含其之除草組合物可呈可直接噴灑之水溶液、散劑、懸浮液、甚至高濃度之水性、油性或其他懸浮液或分散液、乳液、油分散液、糊劑、撒粉組合物或粒劑，可供噴灑，噴霧，撒粉，撒播或澆水。施用形式端賴所計畫之用途而定；但任何情況下均應儘可能確保根據本發明活性化合物均勻分散。

化合物 I 通常適合製成可直接噴灑之溶液、乳液、糊劑或油分散液。合適之惰性添加物為中沸點至高沸點之礦物油餾份介質，如：煤油或柴油，及煤焦油與植物油或動物

（請先閱讀背面之注意事項）

訂

## 五、發明說明 ( 22 )

油，脂系、環系及芳香系烴類例如：石蠟、四氫萘、烷基化萘或其衍生物，烷基化苯或其衍生物，甲醇，乙醇、丙醇、丁醇、環己醇、環己酮或強極性溶劑如：N-甲基吡咯烷酮或水。

水性施用形式可由乳液濃縮物、懸浮液、糊劑、可濕化散劑或水可勻散性粒劑加水製得。製備乳液、糊劑或油分散液時，基質本身或基質溶於油或溶劑中後，於水中與濕化劑、膠粘劑、分散劑或乳化劑均質化。然而，亦可製備含活性物質，濕化劑、膠粘劑、分散劑或乳化劑之濃縮物，亦可製備含溶劑或油之濃縮物，適合加水稀釋。

合適之表面活性劑為：鹼金屬，鹼土金屬與銨之芳香系磺酸鹽，例如：木質素磺酸鹽，苯酚磺酸鹽，萘磺酸鹽與二丁基萘磺酸鹽，及脂肪酸鹽，烷基-與烷芳基磺酸鹽，烷基，十二基醚與脂肪醇硫酸鹽，及硫酸化十六醇，十七醇與十八醇之鹽類，及脂肪醇二醇醚之鹽類，磺酸化萘及其衍生物與甲醛之縮合產物，萘或萘磺酸類與酚及甲醛之縮合產物，聚氧乙烯辛基酚醚類，乙氧化異辛基酚，乙氧化辛基酚與乙氧化壬基酚，烷苯基聚二醇醚類或三丁基苯基聚二醇醚類，烷芳基聚醚醇類，異十三基醇，脂肪醇／環氧乙烷縮合物，乙氧化蓖麻油，聚氧乙烯或聚氧丙烯烷基醚類，月桂基醇聚二醇醚乙酸酯，山梨糖醇酯類，木質素-亞硫酸鹽廢液或甲基纖維素。

製備散劑，撒播劑與撒粉劑時，可使活性物質與一種固態載體混合或共同研磨。

(請先閱讀背面之注意事項再為本頁)

訂

## 五、發明說明(23)

製備粒劑，例如：包覆，浸泡或均質粒劑時，可使活性化合物與固態載劑結合。固態載劑為礦物土如：矽膠，矽酸，矽酸鹽，滑石，高嶺土，石灰石，石灰，白堊，膠塊粘土，黃土，粘土，白雲石，矽藻土，硫酸鈣與硫酸鎂，氧化鎂，合成物磨粉，肥料如：硫酸銨，磷酸銨，硝酸銨，尿素，及植物產物如：穀粉，樹皮，木材粉，與椰子殼粉，纖維素粉末，或其他固體載體。

調配物中通常包含0.01至95重量%，0.5至90重量%較佳之至少一種化合物I。此時所採用之活性化合物之純度為90%至100%，以95%至100%較佳（根據NMR光譜）。

根據本發明化合物I之調配如下：

- I. 取20份重量比No. 3.05化合物溶於含80份重量比烷基化苯、10份重量比由8至10莫耳環氧乙烷對1莫耳油酸N-單乙醇醯胺之加成產物、5份重量比十二烷基苯磺酸之鈣鹽及5份重量比由40莫耳環氧乙烷對1莫耳蓖麻油之加成產物之混合物中。將溶液倒至100,000份重量比水中，均勻分散，得到含0.02重量%活性化合物之水性分散液。
- II. 取20份重量比No. 4.01化合物溶於含40份重量比環己酮、30份重量比異丁醇、20份重量比由7莫耳環氧乙烷對1莫耳異辛基酚之加成產物及10份重量比由40莫耳環氧乙烷對1莫耳蓖麻油之加成產物之混合物中。將溶液倒至100,000份重量比水中，均勻分散，得到含有0.02重量%活性化合物之水性分散液。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

## 五、發明說明 ( 24 )

- Ⅲ . 取 20 份 重量 比 No. 4.03 活 性 化 合 物 溶 於 含 25 份 重 量 比 環 己 酮 、 65 份 重 量 比 沸 點 為 210 至 280 ℃ 之 礦 物 油 餾 份 及 10 份 重 量 比 由 40 莫 耳 環 氧 乙 烷 對 1 莫 耳 蓖 麻 油 之 加 成 產 物 之 混 合 物 中 。 將 溶 液 倒 至 100,000 份 重 量 比 水 中 ， 均 勻 分 散 ， 得 到 含 有 0.02 重 量 % 活 性 化 合 物 之 水 性 分 散 液 。
- Ⅳ . 取 20 份 重 量 比 No. 15.09 活 性 化 合 物 於 錘 磨 機 中 ， 與 3 份 重 量 比 二 異 丁 基 苯 -  $\alpha$  - 磺 酸 之 鈉 鹽 、 17 份 重 量 比 來 自 亞 硫 酸 鹽 廢 液 之 木 質 素 磺 酸 及 60 份 重 量 比 矽 膠 粉 末 均 勻 混 合 ， 及 研 磨 。 取 此 混 合 物 均 勻 散 於 20,000 份 重 量 比 水 中 ， 得 到 含 有 0.1 重 量 % 活 性 化 合 物 之 噴 灑 混 合 物 。
- Ⅴ . 取 3 份 重 量 比 No. 9.04 活 性 化 合 物 與 97 份 重 量 比 細 碎 高 嶺 土 混 合 。 依 此 方 式 ， 得 到 含 有 3 重 量 % 活 性 化 合 物 之 撒 粉 組 合 物 。
- Ⅵ . 取 20 份 重 量 比 No. 12.01 活 性 化 合 物 與 2 份 重 量 比 十 二 烷 基 苯 磺 酸 之 鈣 鹽 、 8 份 重 量 比 脂 肪 醇 聚 二 醇 醚 、 2 份 重 量 比 苯 酚 / 尿 素 / 甲 醛 縮 合 物 之 鈉 鹽 及 68 份 重 量 比 鏈 烷 系 礦 物 油 均 勻 混 合 。 得 到 安 定 之 油 分 散 液 。
- 除 草 組 合 物 或 活 性 化 合 物 可 於 萌 芽 前 或 萌 芽 後 施 用 。 若 某 些 作 物 較 無 法 耐 受 活 性 化 合 物 時 ， 所 採 用 之 施 用 技 術 可 藉 噴 灑 設 備 之 助 ， 噴 灑 除 草 組 合 物 ， 因 此 若 可 能 時 ， 可 不 影 響 敏 感 作 物 之 葉 部 ， 同 時 使 活 性 化 合 物 到 達 該 等 作 物 下 面 之 不 要 之 植 物 葉 部 或 未 覆 蓋 之 土 壤 表 面 ( 後 置 式 (

(請先閱讀背面之注意事項，填寫本頁)

訂

## 五、發明說明 ( 25 )

post-directed, lay-by ) 。

活性化合物根據控制目標、季節、目標植物及生長期而定，其施用率為0.001至3.0，較佳為0.01至1.0公斤／公頃至少一種式I活性物質(a.s.)。

根據各種不同施用法，0-(羥亞胺基)乙基環己烯酮肟醚I或含其之組合物尚可用來消除更多種作物中之不要植物。合適作物實例如下：

葱 (*Allium cepa*)、鳳梨 (*Ananas comosus*)、落花生 (*Arachis hypogaea*)、蘆筍 (*Asparagus officinalis*)、萹菜 (*Beta vulgaris* spp. *altissima*, *Beta vulgaris* spp. *rapa*)、蕓苔 (*Brassica napus* var. *napus*, *Brassica napus* var. *napobrassica*, *Brassica rapa* var. *silvestris*)、山茶 (*Camellia sinensis*)、紅花 (*Carthamus tinctorius*)、山核桃 (*Carya illinoensis*)、檸檬 (*Citrus limon*)、柑橘 (*Citrus sinensis*)、咖啡 (*Coffea arabica*) (*Coffea canephora*, *Coffea liberica*)、甜瓜 (*Cucumis sativus*)、狗牙根 (*Cynodon dactylon*)、胡蘿蔔 (*Daucus carota*)、油椰子 (*Elaeis guineensis*)、蛇莓 (*Fragaria vesca*)、大豆 (*Glycine max*)、棉 (*Gossypium hirsutum*) (*Gossypium arboreum*, *Gossypium herbaceum*, *Gossypium vitifolium*)、向日葵 (*Helianthus annuus*)、巴西橡皮樹 (*Hevea brasiliensis*)、大麥 (

(請先閱讀背面之注意事項，填寫本頁)

訂

### 五、發明說明 ( 26 )

Hordeum vulgare ) 、啤酒花 ( Humulus lupulus ) 、甘藷 ( Ipomoea batatas ) 、胡桃 ( Juglans regia ) 、靈視豆 ( Lens culinaris ) 、亞麻 ( Linum usitatissimum ) 、番茄 ( Lycopersicon lycopersicum ) 、蘋果 ( Malus spp. ) 、白附子 ( Manihot esculenta ) 、苜蓿 ( Medicago sativa ) 、芭蕉 ( Musa spp. ) 、煙草 ( Nicotiana tabacum ) 、( N. rustica ) 、歐洲橄欖 ( Olea europaea ) 、稻 ( Oryza sativa ) 、菜豆 ( Phaseolus lunatus ) ( Phaseolus vulgaris ) 、雲杉 ( Picea abies ) 、松 ( Pinus spp. ) 、豌豆 ( Pisum sativum ) 、梅 ( Prunus avium ) 、櫻 ( Prunus persica ) 、梨 ( Pyrus communis ) 、醋栗 ( Ribes sylestre ) 、蓖麻 ( Ricinus communis ) 、甘蔗 ( Saccharum officinarum ) 、黑麥 ( Secale cereale ) 、茄 ( Solanum tuberosum ) 、高粱 ( Sorghum bicolor ) ( S. vulgare ) 、可可樹 ( Theobroma cacao ) 、三葉草 ( Trifolium pratense ) 、小麥 ( Triticum aestivum ) 、( Triticum durum ) 、蠶豆 ( Vicia faba ) 、葡萄 ( Vitis vinifera ) 、玉米 ( Zea mays ) 。

為了擴大作用範圍及達到協合效果，由 O-( 羥亞胺基 ) 乙基環己烯酮肟醚 I 與許多種其他代表性除草或調節生長之活性化合物類混合及共同施用。例如：合適之混合物成份為二吡啶類、4H-3,1- 苯並嘔吡啶衍生物、苯並嘔二吡啶、2,6-二硝基苯胺、N-苯基胺基甲酸酯、硫胺基甲酸酯、鹵

(請先閱讀背面之注意事項再為本頁)

訂

## 五、發明說明 (27)

羧酸、三吡類、醯胺類、脲類、二苯基醚類、三吡酮類、尿嘧啶類、苯並咪喃衍生物、環己烷-1,3-二酮衍生物，其2-位置上帶有例如：羧基或羰亞胺基，噁啉羧酸衍生物，咪唑啉酮類、磺醯胺類、磺醯基脲類、芳氧基-與雜芳氧基苯氧丙酸及其鹽、酯與醯胺，等等。

此外，化合物 I 亦可以其本身或與其他除草劑併用，再與其他作物保護劑混合施用，例如：與控制有害生物或植物病原性真菌或細菌等製劑混合施用。此外亦應注意其與無機鹽溶液之互溶性，以用來消除營養上及微量元素之缺乏。亦可添加無植物毒性油及油濃縮物。

### 製備實例

2-[1-{2-[2-(4-氯苯氧基)乙氧亞胺基]丙氧亞胺基}丁基]-3-羥基-5-(2H-四氫硫吡喃-3-基)-2-環己烯-1-酮 (化合物 No. 3.04)

取含 1.00 克 (3.56 毫莫耳) 3-羥基-2-丁醯基-5-(2H-四氫硫吡喃-3-基)-2-環己烯-1-酮、0.92 克 (3.56 毫莫耳) 0-{2-[2-(4-氯苯氧基)乙氧亞胺基]丙基}羥基胺及 100 毫升甲醇之混合物於 25℃ 下攪拌 16 小時。反應混合物減壓溶縮後，依已知方法操作殘質，產生產物。收率：65%

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): [ppm]=4.20 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)\*

前體：

0-{2-[2-(4-氯苯氧基)乙氧亞胺基]丙基}羥基胺

(請先閱讀背面之注意事項再寫本頁)

訂

## 五、發明說明 ( 28 )

取含 5.30 克 ( 24 毫莫耳 ) N-(2-氧-1-丙氧基) 酞醯亞胺 ( 參見 Pharmazie 25, (1970) 400 )、4.50 克 ( 24 毫莫耳 ) 0-[2-(4-氯苯氧基)乙基]羥基胺 ( 參見 EP-A 456,112 ) 及 120 毫升甲醇之混合物於 25℃ 下攪拌 16 小時，然後減壓濃縮。殘留之油 ( 10 克 ) 經 100 毫升乙醇胺處理。於 40℃ 下攪拌 4 小時後，混合物攪拌加至水中，以二氯甲烷萃取 3 次。合併之有機相以水洗滌，以硫酸鈉脫水及濃縮。收率：79 %

$^1\text{H-NMR}$  ( 200 MHz,  $\text{CDCl}_3$  ):

## 主要異構物

( 相對含量 : 80% ):  $\delta$  [ppm] = 1.35 (d, 3H), 1.80 (s, 3H), 4.00-4.30 (m, 2H), 4.15 (s, 2H), 4.65 (m, 1H), 5.45 (bs, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H).

## 次要異構物

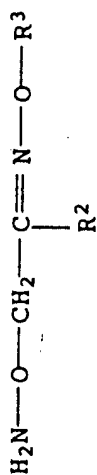
( 相對含量 : 20% ):  $\delta$  [ppm] = 1.30 (d, 3H), 1.95 (s, 3H), 4.00-4.30 (m, 2H), 4.15 (s, 2H), 4.65 (m, 1H), 5.45 (bs, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H).

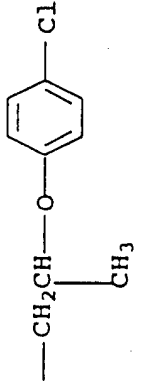
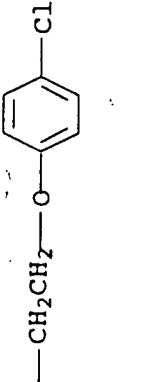
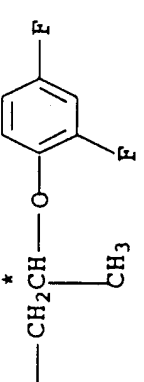
下表 I 中，出示已製成或依相同方式製成之其他 0-(羥亞胺基)乙基羥基胺 III。表 2 至 24 含有根據本發明之 0-(羥亞胺基)乙基環己烯酮脞醚 I。

\*) 經選出之代表性訊號

五、發明說明 (29)

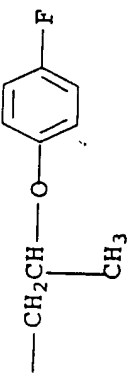
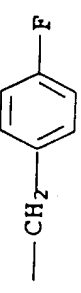
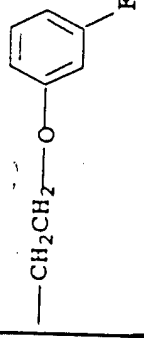

表 1



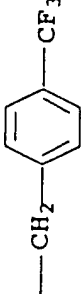
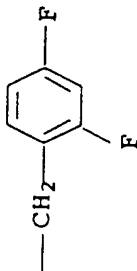
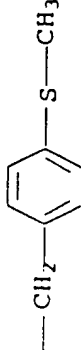
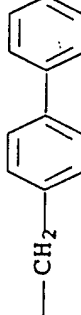
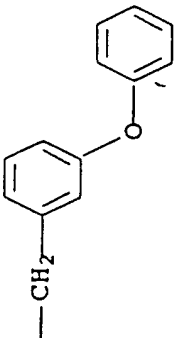
No.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
1.01	甲基		<p>主要異構物: 1.35(d, 3H), 1.80 (s, 3H), 4.00-4.30 (m, 2H), 4.15 (s, 2H), 4.65 (m, 1H), 5.45 (bs, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)</p> <p>次要異構物: 1.30 (d, 3H), 1.95 (s, 3H), 4.00-4.30 (m, 2H), 4.15 (s, 2H), 4.65 (m, 1H), 5.45 (bs, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)</p>
1.02	甲基		<p>主要異構物: 1.90 (s, 3H), 4.00-4.20 (m, 3H), 4.15 (s, 2H), 4.30-4.50 (m, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)</p> <p>次要異構物: 1.95 (s, 3H), 4.00-4.20 (m, 2H), 4.15 (s, 2H), 4.30-4.50 (m, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)</p>
1.03	甲基		<p>主要異構物: 1.35 (d, 3H), 1.80 (s, 3H), 4.00-4.30 (m, 2H), 4.10 (s, 2H), 4.55 (m, 1H), 5.50 (bs, 2H), 6.70-7.10 (m, 3H)</p> <p>次要異構物: 1.30 (d, 3H), 1.95 (s, 3H), 4.00-4.30 (m, 2H), 4.10 (s, 2H), 4.55 (m, 1H), 5.50 (bs, 2H), 6.70-7.10 (m, 3H)</p> <p>[α]<sub>D</sub><sup>25</sup> = -12.5 (c = 1.0; MeOH)</p>

\* = R- 組態

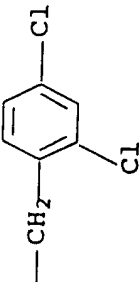
五、發明說明 ( 30 )

No.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
1.04	甲基		<p>主要異構物: 1.35 (d, 3H), 1.80 (s, 3H), 4.00-4.30 (m, 2H), 4.10 (s, 2H), 4.60 (m, 1H), 5.50 (bs, 2H), 6.90 (m, 4H),</p> <p>次要異構物: 1.30 (d, 3H), 1.80 (s, 3H), 4.00-4.30 (m, 2H), 4.10 (s, 2H), 4.60 (m, 1H), 5.50 (bs, 2H), 6.90 (m, 4H)</p>
1.05	甲基		<p>主要異構物: 1.90 (s, 3H), 4.20 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 5.45 (bs, 2H), 7.05 (m, 2H), 7.35 (m, 2H),</p> <p>次要異構物: 1.95 (s, 3H), 4.55 (s, 2H), 5.05 (s, 2H), 5.50 (bs, 2H), 7.05 (m, 2H), 7.35 (m, 2H)</p>
1.06	甲基		<p>主要異構物: 1.90 (s, 3H), 4.10-4.55 (m, 6H), 5.50 (bs, 2H), 6.70 (m, 3H), 7.20 (m, 1H)</p> <p>次要異構物: 1.95 (s, 3H), 4.10-4.55 (m, 6H), 5.50 (bs, 2H), 6.70 (m, 3H), 7.20 (m, 1H)</p>
1.07	甲基		<p>主要異構物: 1.90 (s, 3H), 4.00-4.20 (m, 2H), 4.20 (s, 2H), 4.30-4.50 (m, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.85-7.05 (m, 4H)</p> <p>次要異構物: 1.95 (s, 3H), 4.00-4.20 (m, 2H), 4.20 (s, 3H), 4.30-4.50 (m, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.85-7.05 (m, 4H)</p>

五、發明說明 (31)

No.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
1.08	甲基		主要異構物: 1.95 (s, 3H), 4.20 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 5.45 (bs, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.55 (m, 2H) 次要異構物: 1.95 (s, 3H), 4.75 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 5.50 (bs, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.55 (m, 2H)
1.09	甲基		主要異構物: 1.90 (s, 3H), 4.15 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 5.45 (bs, 2H), 6.80 (m, 2H), 7.40 (m, 1H) 次要異構物: 1.95 (s, 3H), 4.45 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 5.45 (bs, 2H), 6.80 (m, 2H), 7.40 (m, 1H)
1.10	甲基		主要異構物: 1.90 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 4.20 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 5.50 (bs, 2H), 7.20-7.30 (m, 4H) 次要異構物: 1.95 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 4.50 (s, 2H), 5.05 (s, 2H), 5.50 (m, 2H), 7.20-7.30 (m, 1H)
1.11	甲基		主要異構物: 1.95 (s, 3H), 4.20 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 5.40 (bs, 2H), 7.20-7.70 (2m, 9H) 次要異構物: 1.95 (s, 3H), 4.70 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 5.40 (bs, 2H), 7.2-7.70 (2m, 9H)
1.12	甲基		主要異構物: 1.95 (s, 3H), 4.15 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 5.40 (bs, 2H), 6.90-7.40 (2m, 9H) 次要異構物: 1.95 (s, 3H), 4.65 (s, 2H), 5.05 (s, 2H), 5.40 (bs, 2H), 6.90-7.40 (2m, 9H)

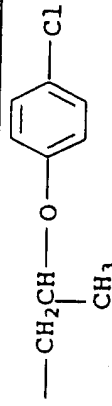
五、發明說明 (32)

No.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
1.13	甲基		主要異構物 : 1.95(s,3H), 4.20(s,2H), 5.20 (s, 2H), 5.45 (bs, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H) 次要異構物 : 1.95 (s, 3H), 4.80 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 5.50 (bs, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H)
1.14	甲基	—CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1.30 (t, 3H), 1.90 (s, 3H), 4.10 (q, 2H), 4.15 (s, 2H), 5.50 (bs, 2H)
1.15	甲基	—CH <sub>2</sub> CH=CHCl	主要異構物 : 1.90 (s, 3H), 4.15 (s, 2H), 4.55 (d, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) 次要異構物 : 1.95 (s, 3H), 4.45 (s, 2H), 4.50 (d, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H)

(請先閱讀背面之注意事項)  
填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 33 )

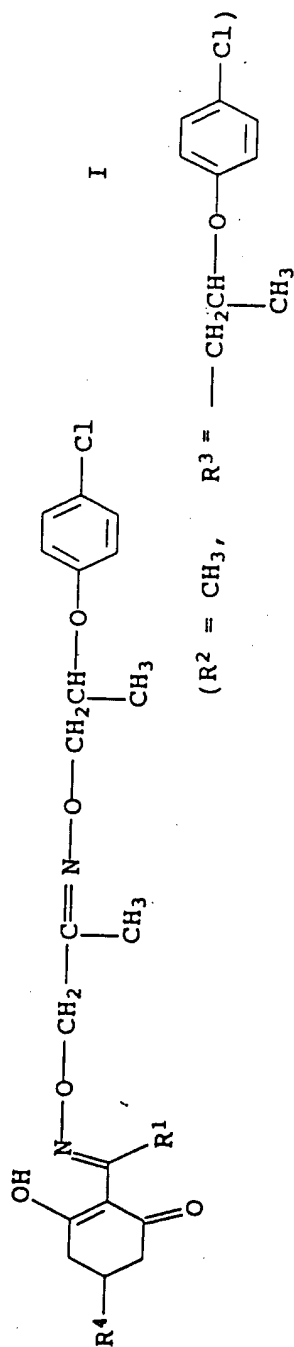
No.	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
1.16	正丁基	—CH <sub>2</sub> CH=CHCl	主要異構物 : 2.25 (t, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H) 次要異構物 : 2.35 (t, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H)
1.17	正丁基		2.25 (t, 2H), 5.50 (bs, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)

(請先閱讀背面之注意事項) 填寫本頁

訂

五、發明說明 ( 34 )

表 2



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
2.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	
2.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
2.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	
2.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.10-4.30 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)
2.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.00 (m, 2H), 4.10-4.30 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)
2.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
2.07	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	

五、發明說明 ( 35 )

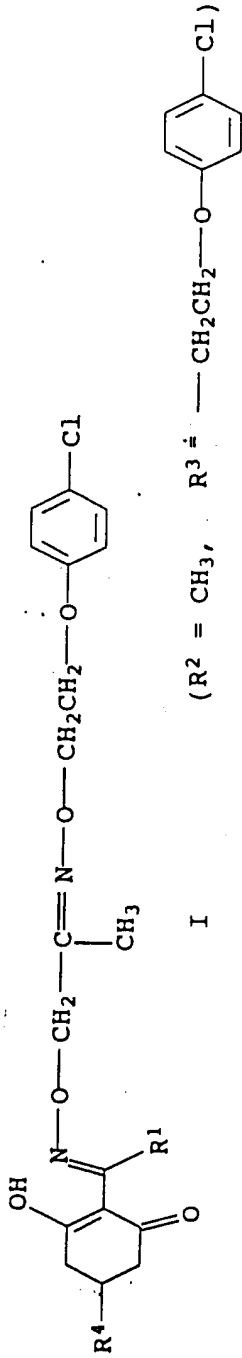
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
2.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
2.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	4.10-4.30 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)
2.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
2.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
2.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
2.13	正丙基	N-(乙硫基)-N-甲胺基	

(請先閱讀背面之注意事項再寫本頁)

訂

五、發明說明 (36)

表 3



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
3.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	
3.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
3.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	
3.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.20 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)
3.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.00 (m, 2H), 4.20 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)
3.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
3.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	

(請先閱讀背面之注意事項，填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 37 )

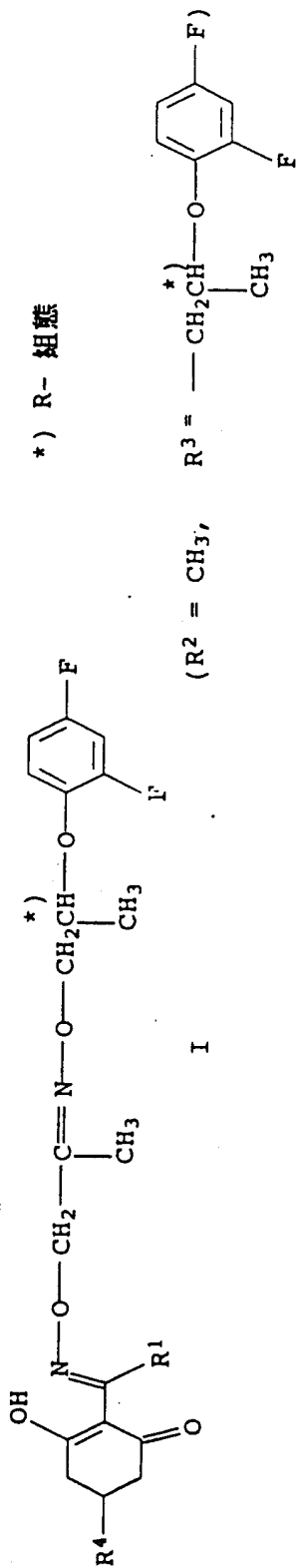
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
3.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
3.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	4.15 (m, 2H), 4.35 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)
3.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
3.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
3.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
3.13	正丙基	N-(乙磺基)-N-甲胺	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 38 )

表 4



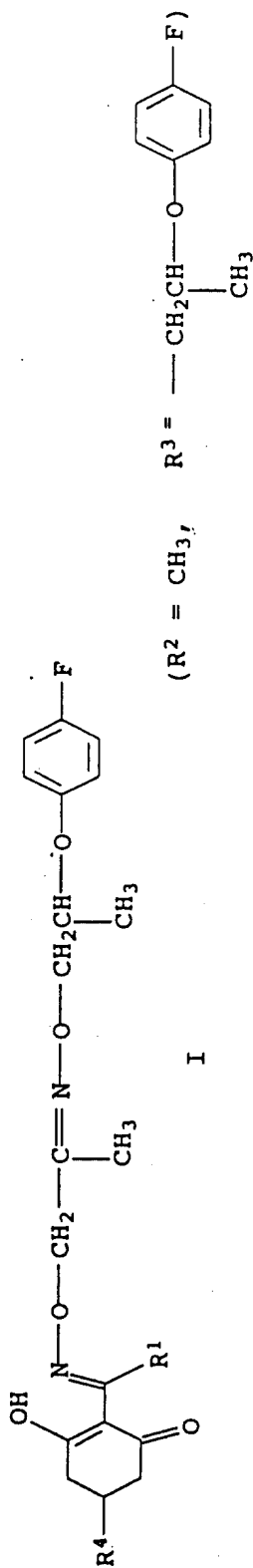
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
4.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	3.90 (m, 2H), 4.10-4.40 (m, 2H), 6.70-7.10 (m, 3H) [α] <sub>D</sub> <sup>25</sup> = -10.9 (c = 1.0; 甲醇)
4.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
4.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.10-4.40 (m, 2H), 6.70-7.10 (m, 3H) [α] <sub>D</sub> <sup>25</sup> = -11.1 (c = 1.0; 甲醇)
4.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.10-4.40 (m, 2H), 6.70-7.10 (m, 3H) [α] <sub>D</sub> <sup>25</sup> = -10.8 (c = 1.0; 甲醇)
4.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.00 (m, 2H), 4.10-4.40 (m, 2H), 6.70-7.10 (m, 3H) [α] <sub>D</sub> <sup>25</sup> = -10.9 (c = 1.0; 甲醇)
4.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
4.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	

五、發明說明 ( 39 )

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
4.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
4.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	4.05-4.35 (m, 2H), 6.70-7.10 (m, 3H) [α] <sub>D</sub> <sup>25</sup> = -6.8 (c = 1.0; 甲醇)
4.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
4.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
4.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
4.13	正丙基	N-(乙磺基)-N-甲胺甲基	

五、發明說明 ( 40 )

表 5



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
5.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	
5.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
5.03	乙基	2H-四氫噻喃-3-基	
5.04	正丙基	2H-四氫噻喃-3-基	4.10-4.30 (m, 2H), 6.85-7.00 (m, 4H)
5.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.00 (m, 2H), 4.10-4.30 (m, 2H), 6.85-7.00 (m, 4H)
5.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
5.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	
5.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	

五、發明說明 ( 41 )

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
5.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	4.10-4.30 (m, 2H), 6.85-7.00 (m, 4H)
5.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
5.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
5.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
5.13	正丙基	N-(乙硫基)-N-甲胺	

(請先閱讀背面之注意事項再寫本頁)

訂 裝

五、發明說明 ( 42 )

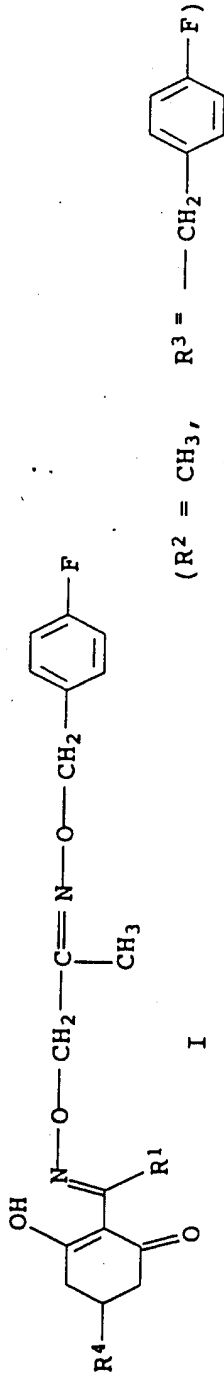


表 6

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
6.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	
6.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
6.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	
6.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.50 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 7.05 (m, 2H), 7.35 (m, 2H)
6.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.05 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 7.05 (m, 2H), 7.35 (m, 2H)
6.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
6.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	

(請先閱讀背面之注意事項再為本頁)

— 訂 — 裝 —

五、發明說明 ( 43 )

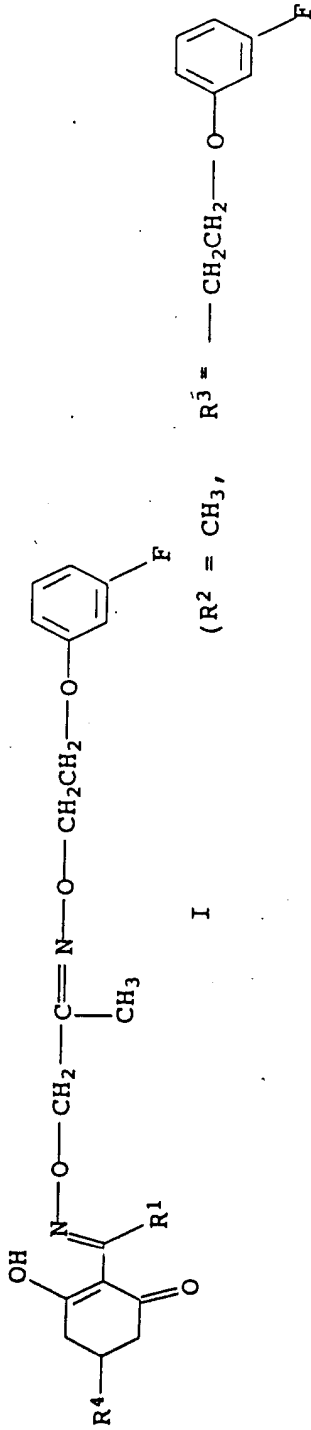
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
6.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
6.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	4.50(s,2H), 5.10(s,2H), 7.05(m,2H), 7.35(m,2H)
6.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
6.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
6.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
6.13	正丙基	N-(乙磺基) -N-甲胺甲基	

(請先閱讀背面之注意事項再  
去寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 44 )

表 7



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
7.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	3.90 (m, 2H), 4.15-4.25 (m, 2H), 4.35-4.45 (m, 2H), 6.65-6.80 (m, 3H), 7.15-7.25 (m, 1H)
7.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
7.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.15-4.30 (m, 2H), 4.35-4.45 (m, 2H), 6.70-6.80 (m, 3H), 7.15-7.25 (m, 1H)
7.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.15-4.25 (m, 2H), 4.35-4.45 (m, 2H), 6.65-6.80 (m, 3H), 7.15-7.25 (m, 1H)
7.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.00 (m, 2H), 4.15-4.25 (m, 2H), 4.35-4.45 (m, 2H), 6.65-6.80 (m, 3H), 7.15-7.25 (m, 1H)
7.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
7.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	

(請先閱讀背面之注意事項)

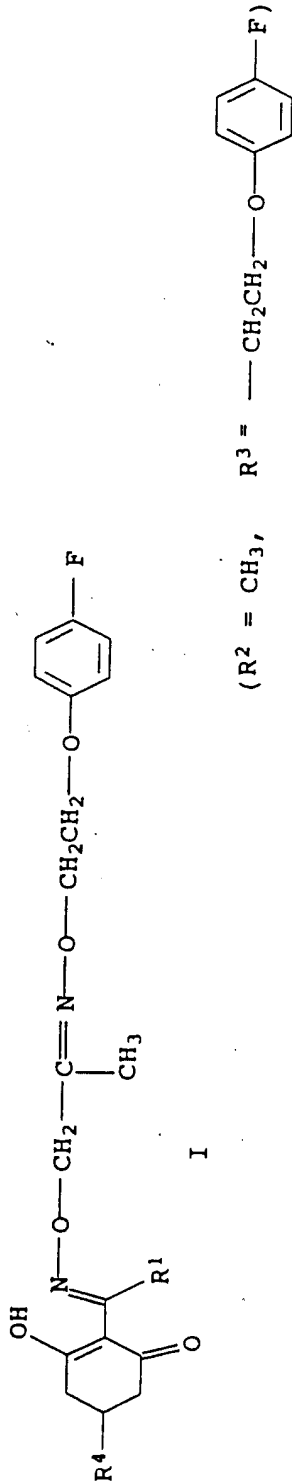
第 一 頁

五、發明說明 ( 45 )

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
7.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
7.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	4.10-4.25(m, 2H), 4.30-4.45(m, 2H), 6.65-6.80(m, 3H), 7.15-7.25 (m, 1H)
7.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
7.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
7.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
7.13	正丙基	N-(乙磺基)-N-甲胺甲基	

五、發明說明 (46)

表 8



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
8.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	3.90 (m, 2H), 4.15-4.25 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 6.95 (m, 2H)
8.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
8.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.15-4.25 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 6.95 (m, 2H)
8.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	
8.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.15-4.25 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 6.95 (m, 2H)
8.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
8.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	4.00 (m, 2H), 4.15-4.25 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 6.95 (m, 2H)

(請先閱讀背面之注意事項再為本頁)

訂

五、發明說明 (47)

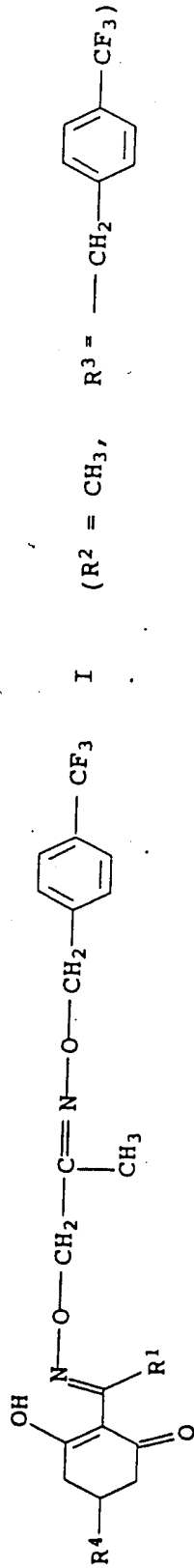
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
8.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
8.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	4.15-4.25 (m, 2H), 4.40 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 6.95 (m, 2H)
8.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
8.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
8.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
8.13	正丙基	N-(乙硫基)-N-甲胺基	

(請先閱讀背面之注意事項再寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 48 )

表 9



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
9.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	3.90 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.60 (m, 2H)
9.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.60 (m, 2H)
9.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.60 (m, 2H)
9.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.60 (m, 2H)
9.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.00 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.20 (m, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.60 (m, 2H)
9.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.00 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.20 (m, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.60 (m, 2H)
9.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	

(請先閱讀背面之注意事項再為本頁)

訂

## 五、發明說明 ( 49 )

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
9.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
9.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.60 (m, 2H)
9.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
9.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
9.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
9.13	正丙基	N-(乙磺基) -N-甲胺甲基	

五、發明說明 ( 50 )

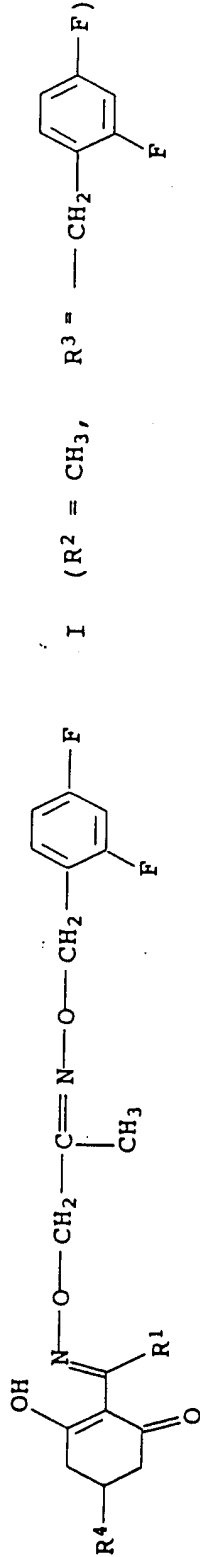


表 10

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
10.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	3.90 (m, 2H), 4.55 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.40 (m, 1H)
10.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
10.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.55 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.40 (m, 2H)
10.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.55 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.40 (m, 1H)
10.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.00 (m, 2H), 4.55 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.40 (m, 1H)
10.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
10.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	

五、發明說明 ( 51 )

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
10.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
10.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	4.55 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.40 (m, 1H)
10.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
10.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
10.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
10.13	正丙基	N-(乙磺基)-N-甲胺基	

(請先閱讀背面之注意事項) 表  
為本頁)

訂

五、發明說明 (52)

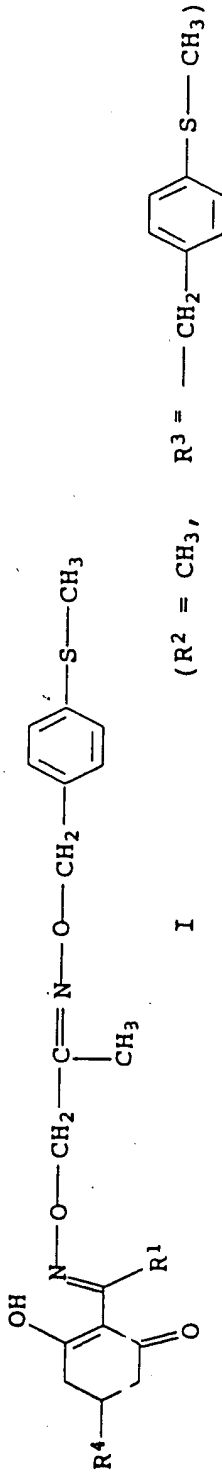


表 11

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
11.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	
11.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
11.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	
11.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	
11.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	
11.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
11.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	
11.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
11.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.30 (m, 4H)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 53 )

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
11.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
11.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
11.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
11.13	正丙基	N-(乙硫基)-N-甲胺	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

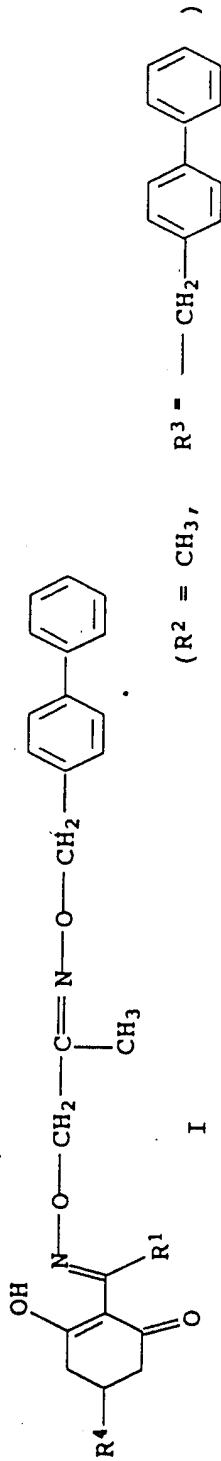
表

訂

( )

五、發明說明 ( 54 )

表 12



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
12.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	3.90 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.70 (3m, 9H)
12.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
12.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.70 (3m, 9H)
12.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	
12.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	
12.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
12.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	
12.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	

五、發明說明 ( 55 )

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
12.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.70 (3m, 9H)
12.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
12.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
12.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
12.13	正丙基	N-(乙硫基)-N-甲氧基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

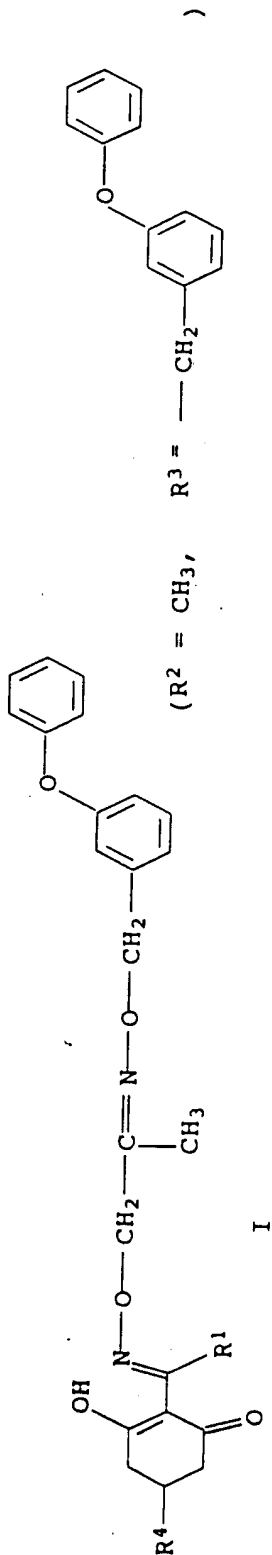
表

訂

三

五、發明說明 ( 56 )

表 13



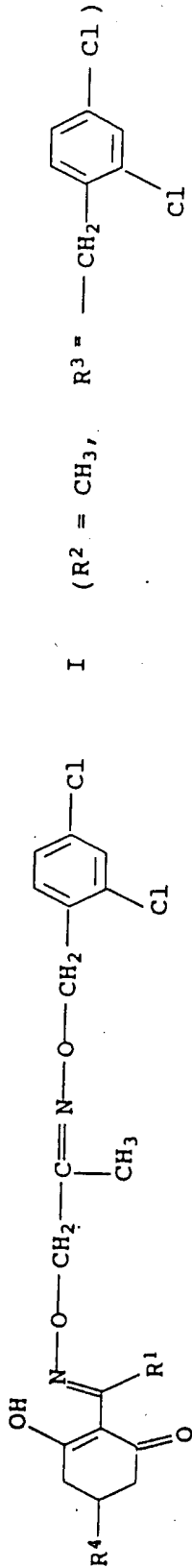
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
13.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	3.90 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.90-7.40 (m, 9H)
13.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
13.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.50 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.90-7.40 (m, 9H)
13.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.50 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.90-7.40 (m, 9H)
13.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.00 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.90-7.40 (m, 9H)
13.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
13.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	

五、發明說明 ( 57 )

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
13.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
13.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	4.50 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.90-7.40 (m, 9H)
13.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
13.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
13.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
13.13	正丙基	N-(乙磺基)-N-甲胺基	

五、發明說明 ( 58 )

表 14



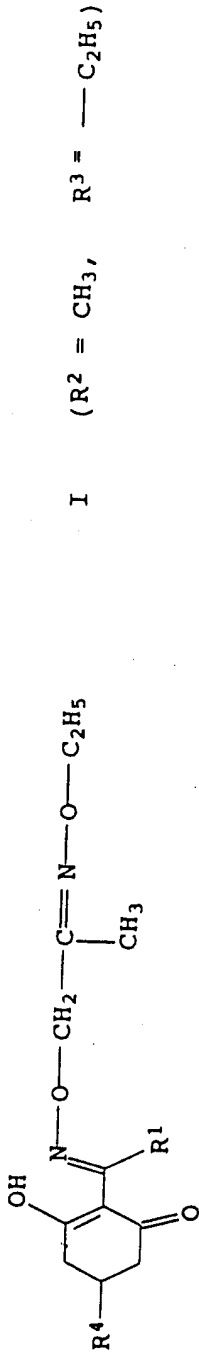
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
14.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	3.90 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H)
14.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
14.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H)
14.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	
14.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H)
14.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
14.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	4.00 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H)

五、發明說明 (59)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
14.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
14.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	4.50 (s, 2H), 5.20 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 3H)
14.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
14.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
14.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
14.13	正丙基	N-(乙磺基)甲胺	

五、發明說明 (60)

表 15



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
15.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	1.90 (s, 3H), 3.90 (m, 2H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H)
15.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	1.90 (s, 3H), 3.90 (m, 2H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H)
15.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	1.90 (s, 3H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H)
15.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	1.90 (s, 3H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H)
15.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	1.90 (s, 3H), 4.00 (m, 2H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H)
15.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	1.90 (s, 3H), 4.00 (m, 2H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H)
15.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	

五、發明說明(61)

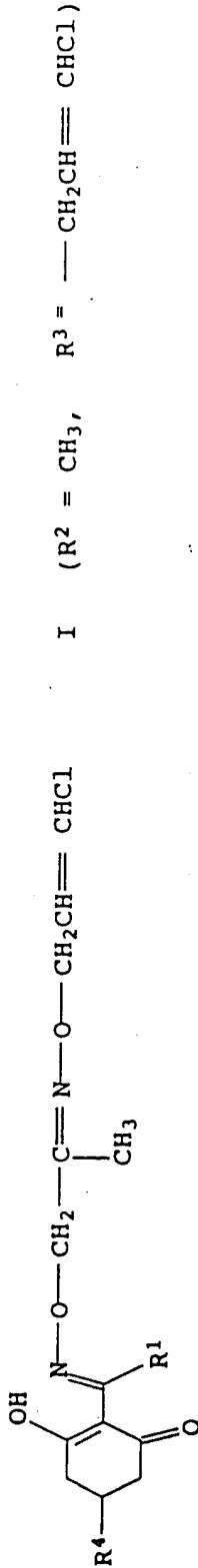
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
15.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
15.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	1.90 (s, 3H), 4.15 (m, 2H), 4.50 (s, 2H)
15.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
15.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
15.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
15.13	正丙基	N-(乙磺基)-N-甲胺甲基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 62 )

表 16



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
16.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	1.90 (s, 3H), 3.90 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H)
16.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	1.90 (s, 3H), 3.90 (m, 2H), 4.50 (m, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H)
16.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	1.90 (s, 3H), 4.50 (s, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H)
16.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	1.90 (s, 3H), 4.50 (s, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H)
16.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	1.90 (s, 3H), 4.00 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H)
16.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	1.90 (s, 3H), 4.00 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H)
16.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	

五、發明說明 ( 63 )

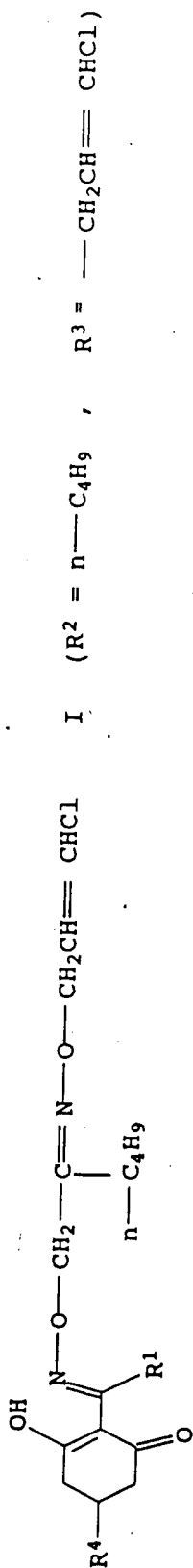
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
16.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
16.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	1.90 (s, 3H), 4.50 (s, 2H), 4.55 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H)
16.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
16.11	正丙基	1,3-二甲基吡嗪-5-基	
16.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
16.13	正丙基	N-(乙磺基)-N-甲胺基	

(請先閱讀背面之注意事項再為本頁)

訂

五、發明說明 ( 64 )

表 17



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
17.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	3.90 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H)
17.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	3.90 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H)
17.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	6.00-6.35 (m, 2H)
17.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	6.00-6.35 (m, 2H)
17.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.00 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H)
17.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.00 (m, 2H), 6.00-6.35 (m, 2H)
17.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	
17.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
17.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明(65)

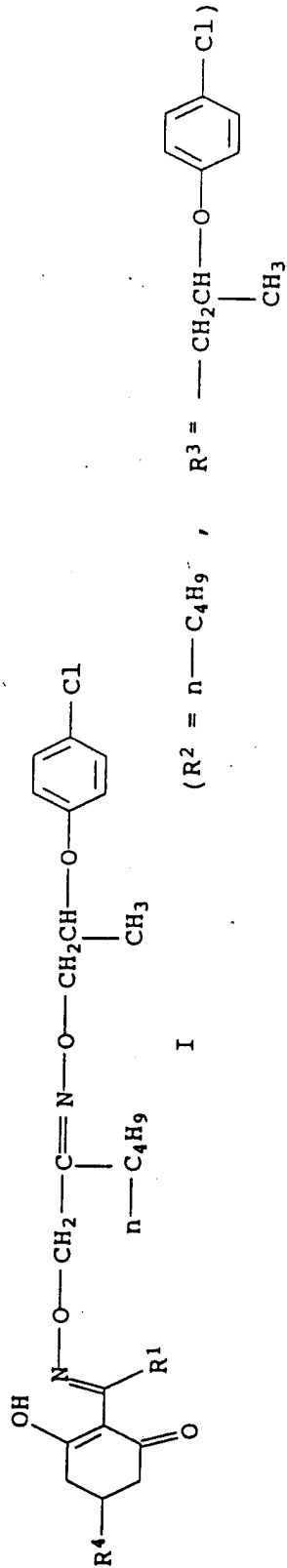
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
17.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
17.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
17.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
17.13	正丙基	N-(乙磺基)-N-甲胺	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 66 )

表 18



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
18.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	3.90 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)
18.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	3.90 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)
18.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)
18.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)
18.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.00 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)
18.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	4.00 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 7.20 (m, 2H)
18.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	
18.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
18.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 67 )

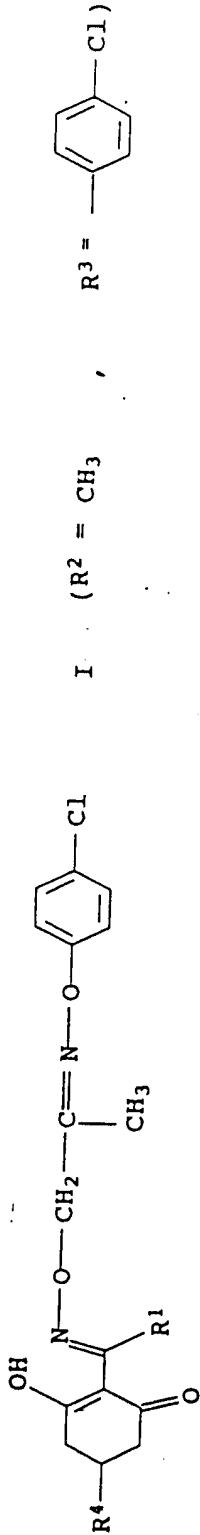
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm] )
18.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
18.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
18.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
18.13	正丙基	N-(乙磺基) -N-甲胺甲基	

(請先閱讀背面之注意事項再  
寫本頁)

訂

五、發明說明 (68)

表 19



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
19.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	
19.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
19.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	
19.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	0.9-1.0 (m), 1.5-1.8 (m), 1.8-1.9 (m), 2.0-2.15 (m), 2.3-2.6 (m), 7.1-7.3 (m)
19.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	
19.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
19.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	
19.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
19.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 裝

五、發明說明 (69)

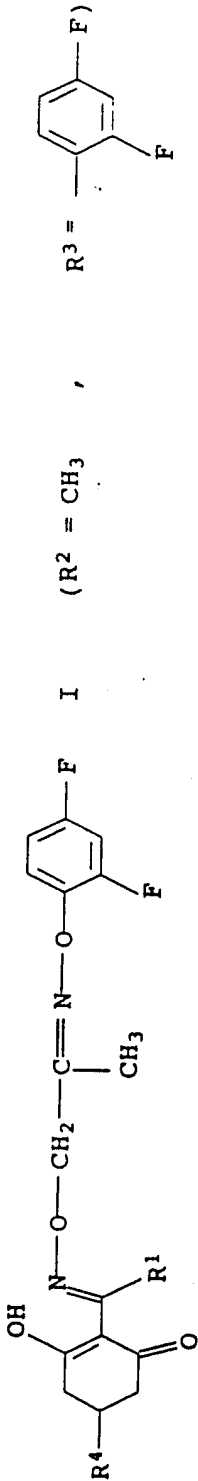
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
19.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
19.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
19.12	正丙基	3-異丙基異吡啶-5-基	
19.13	正丙基	N-(乙磺基)-N-甲胺甲基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (70)

表 20



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
20.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	
20.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
20.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	
20.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	
20.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	
20.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
20.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	
20.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
20.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 71 )

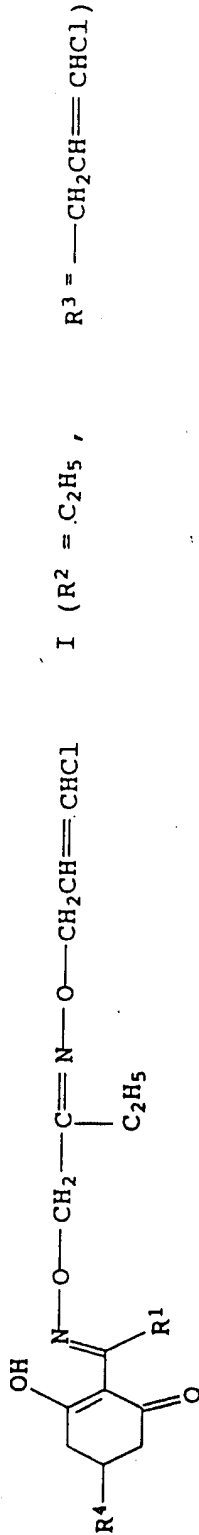
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm] )
20.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
20.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
20.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
20.13	正丙基	N-(乙磺基) -N-甲胺甲基	

(請先閱讀背面之注意事項)  
為本頁)

訂

五、發明說明 (72)

表 21



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
21.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	
21.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
21.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	
21.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	1.0-1.1 (m), 4.45-4.55 (m), 6.0-6.1 (m), 6.3-6.4 (d)
21.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	1.1 (m), 3.4 (m), 4.0 (m), 4.5-4.6 (m), 6.1 (m), 6.35 (d)
21.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
21.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	
21.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	

五、發明說明 ( 73 )

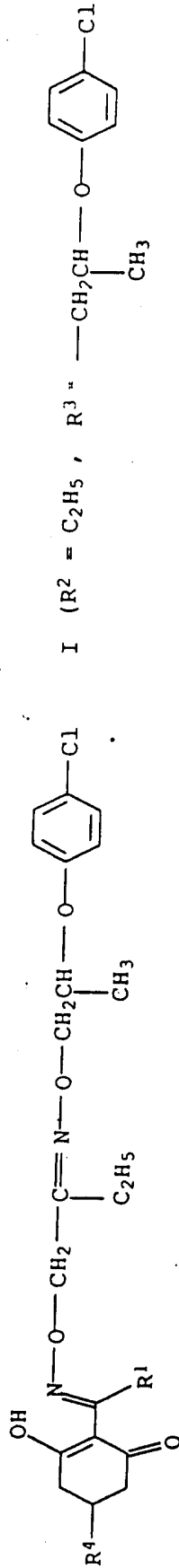
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm] )
21.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	
21.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
21.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
21.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
21.13	正丙基	N-(乙硫基)-N-甲胺	

(請先閱讀背面之注意事項再寫本頁)

訂

五、發明說明 ( 74 )

表 22



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
22.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	1.1 (m), 1.3 (m), 3.2 (m), 3.35 (m), 3.85-4.0 (m), 6.8-7.25 (m)
22.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
22.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	1.1 (m), 1.6-2.6 (m), 2.8-2.9 (m), 4.0-4.7 (m), 6.8-7.3 (m)
22.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	0.9-1.2 (m), 1.3-2.65 (m), 2.8-2.9 (m), 4.2-4.7 (m), 6.7-7.2 (m)
22.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	1.0-1.15 (m), 1.3-1.5 (m), 1.6-1.7 (m), 1.8-1.9 (m), 2.15-2.6 (m), 2.8-2.9 (m), 3.3-3.4 (m), 3.9-4.7 (m), 6.8-7.2 (m)
22.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
22.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	0.9-1.7 (m), 1.8-1.9 (m), 2.2-2.9 (m)

五、發明說明 (75)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
22.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
22.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	
22.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
22.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
22.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
22.13	正丙基	N-(乙磺基)-N-甲胺基	

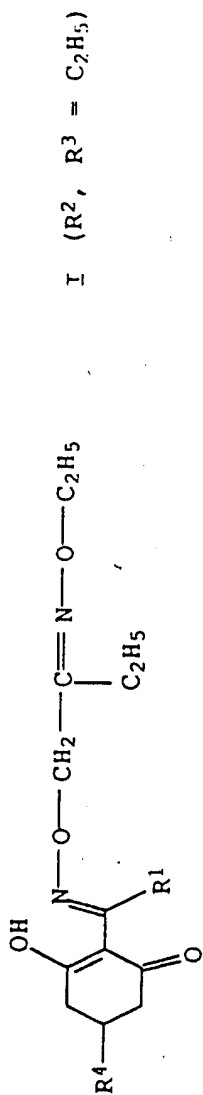
經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(請先閱讀背面之注意事項)  
(填寫本頁)

訂

五、發明說明 (76)

表 23



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 (1H-NMR [ppm])
23.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	
23.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
23.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	
23.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	0.9-1.3 (m), 1.5-2.6 (m), 2.8-2.9 (m), 4.0-4.2 (m)
23.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	1.1-1.5 (m), 1.6-1.7 (m), 1.8-2.0 (m), 2.2-2.6 (m), 2.8-2.9 (m), 3.3-3.4 (t), 4.0-4.2 (m)
23.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
23.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	
23.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	

五、發明說明 ( 77 )

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm] )
23.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	
23.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
23.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
23.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
23.13	正丙基	N-(乙磺基)-N-甲胺基	

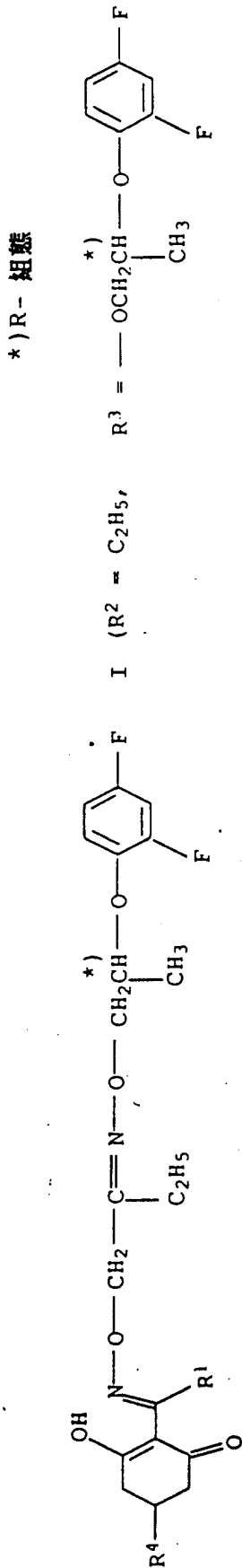
(請先閱讀背面之注意事項，填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 ( 78 )

表 24



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm] )
24.01	乙基	2H-四氫吡喃-3-基	
24.02	正丙基	2H-四氫吡喃-3-基	
24.03	乙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	1.0-1.4 (m), 1.6-2.9 (m), 4.1-4.3 (m), 4.5-4.6 (m), 6.7-7.1 (m)
24.04	正丙基	2H-四氫硫吡喃-3-基	0.9-1.2 (m), 1.3-1.4 (m), 1.5-2.9 (m), 4.1-4.3 (m), 4.5-4.65 (m), 6.7-7.0
24.05	乙基	2H-四氫吡喃-4-基	1.0-1.2 (m), 1.3-1.5 (m), 1.6-1.7 (m), 1.8-1.9 (m), 2.15-2.9 (m), 3.3-3.4 (t), 4.0-4.1 (m), 4.1-4.35 (m), 4.5-4.7 (m), 6.7-7.0 (m)
24.06	正丙基	2H-四氫吡喃-4-基	
24.07	乙基	2,4,6-三甲苯基	

五、發明說明 (79)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	物理數據 ( <sup>1</sup> H-NMR [ppm])
24.08	乙基	1-甲硫環丙-1-基	
24.09	正丙基	2-(乙硫)丙-1-基	
24.10	乙基	2-(4-氟苯硫)乙基	
24.11	正丙基	1,3-二甲基吡啶-5-基	
24.12	正丙基	3-異丙基異噁唑-5-基	
24.13	正丙基	N-(乙磺基)-N-甲胺基	

(請先閱讀背面之注意事項，填寫本頁)

裝 訂

## 五、發明說明 (80)

### 應用實例

可採用溫室試驗證實式 I 0-(羥亞胺基)乙基環己烯酮肟醚之除草作用：

所使用之栽培容器為含有土壤及約 3.0% 腐植土作為基質之塑膠花盆。取試驗植物之種子根據品種分開播種。

若進行萌芽前處理時，活性化合物係懸浮於水中或於水中乳化，待播種後，利用均勻分佈之噴嘴直接施用。容器內稍微灑水，以促進發芽與生長，然後覆上透明塑膠罩，直到植物長根為止。如果試驗植物未受到活性化合物傷害時，這樣的覆蓋可使發芽平均。

進行萌芽後處理時，首先栽培試驗植物，依其生長形式，使之長至高 3 至 15 公分，然後僅以於水中懸浮或乳化之活性化合物處理。試驗植物係為了此目的而直接播種並於相同容器內生長，或先另外栽培至幼苗，然後於實驗前幾天再移植至實驗容器中。萌芽後處理之施用率為 0.25 至 0.125 公斤 / 公頃活性物質 (a.s.)。

植物依品種特性保持在 10-25 °C 或 20-35 °C 下。試驗期為 2 至 4 週。此期間，照顧植物，並評估其對各處理之反應。

依 0 至 100 之等級進行評估。100 表示沒有植物萌芽，或至少地上部完全破壞，而 0 則表示沒有傷害或正常生長。

溫室試驗所採用之植物品種如下：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

## 五、發明說明 ( 81 )

學名	俗名
<i>Echinochloa crus-gali</i>	稗子
<i>Setaria italica</i>	梁粟
<i>Setaria faberii</i>	巨粟
<i>Setaria viridis</i>	綠粟
<i>Oryza sativa</i>	稻
<i>Triticum aestivum</i>	冬小麥

結果顯示，使用 Nos. 3.05、4.01、4.03與9.04化合物時，以小麥或稻為實例之作物中，不要之雜草已受到極佳之控制。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

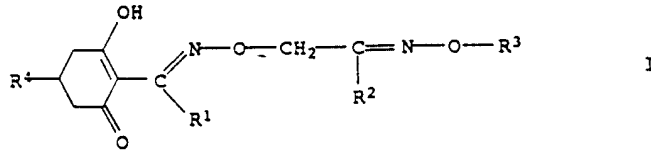
A5  
年 月 日  
補充

四、中文發明摘要 (發明之名稱：

302354

0-(羥亞胺基)乙基環己烯酮肟醚及其  
作為除草劑之用途

本發明係說明 0-(羥亞胺基)乙基環己烯酮肟醚 I



R<sup>1</sup>與 R<sup>2</sup>=C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基；

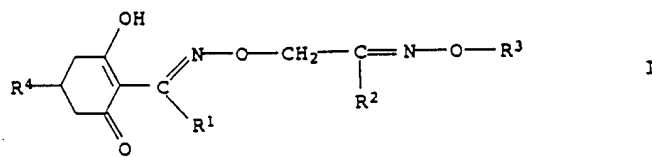
R<sup>3</sup>= 為苯基，其帶有 1 至 3 個鹵素原子；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-烯基，此等基團若需要時可帶有一  
個下列取代基：

英文發明摘要 (發明之名稱：

"0-(OXIMINO)ETHYLCYCLOHEXENONE OXIME  
ETHERS AND THEIR USE AS HERBICIDES"

0-(Oximino)ethylcyclohexenone oxime ether I



R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;

R<sup>3</sup> = the phenyl group, which can carry one to three halogen  
atoms;

a C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-alkenyl group, these groups if  
desired being able to carry one of the following  
substituents:

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

A85.9.-4  
B 年 月 日 修正  
補充

四、中文發明摘要 (發明之名稱：)

鹵素、 $C_1-C_3$ -烷基、

苯基，若需要時可再帶有 1 至 3 個選自下列之自由基

：鹵素、 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -鹵烷基、苯基及苯氧基

，或

苯氧基，若需要時可再帶有 1 至 3 個鹵素原子；

$R^4$  為  $C_1-C_4$ -烷硫基 - $C_1-C_6$ - 烷基；

含有 1 個氧或硫原子作為雜原子之飽和 6 或 7 員雜環

；

及其農業上可利用之鹽與酯。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

英文發明摘要 (發明之名稱：)

halogen,  $C_1-C_3$ -alkyl, phenyl, which if desired, in turn can carry one to three radicals selected from the group consisting of halogen,  $C_1-C_4$ -haloalkyl, phenyl and phenoxy, or phenoxy which, if desired, in turn can carry one to three halogen atoms;

$R^4 = C_1-C_4$ -alkylthio- $C_1-C_6$ -alkyl group;

a saturated 6- or 7-membered heterocycle having one oxygen or sulfur atoms as heteroatoms;

and their agriculturally utilisable salts and esters are described.

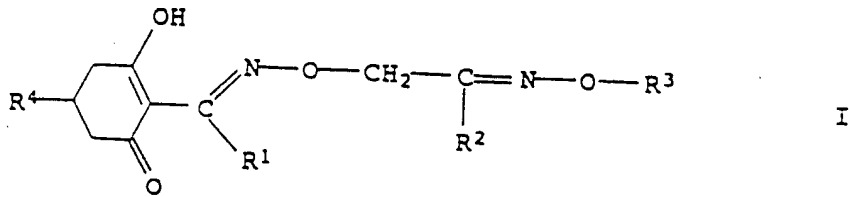
訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

六、申請專利範圍

1. 一種式 I 之 O-(羥亞胺基)乙基環己烯酮肟醚或式 I 化合物之農業上可利用之鹽，或式 I 化合物與 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 羧酸或無機酸形成之酯



其中取代基之定義如下：

R<sup>1</sup> 為 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基；

R<sup>2</sup> 為 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基；

R<sup>3</sup> 為苯基，其帶有 1 至 3 個鹵素原子；

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-烯基，此等基團若需要時可帶有一個下列取代基：

鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基、

苯基，若需要時可再帶有 1 至 3 個選自下列之自由基：鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基、苯基及苯氧基，或

苯氧基，若需要時可再帶有 1 至 3 個鹵素原子；

R<sup>4</sup> 為 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷硫基 -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>- 烷基；

含有 1 個氧或硫原子作為雜原子之飽和 6 或 7 員雜環。

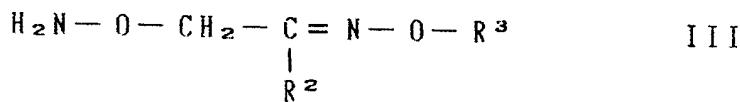
2. 根據申請專利範圍第 1 項之式 I 之 O-(羥亞胺基)乙基環

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

## 六、申請專利範圍

- 己烯酮肟醚或式 I 化合物之農業上可利用之鹽或式 I 化合物與 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-羧酸或無機酸形成之酯，其係作為除草劑。
3. 一種除草組合物，其含有除草有效量之根據申請專利範圍第 1 項之至少一種式 I 之 O-(羥亞胺基)乙基環己烯酮肟醚或式 I 化合物之農業上可利用之鹽或式 I 化合物與 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-羧酸或無機酸形成之酯，及至少一種液體與／或固體載體，及若需要時之至少一種輔劑。
4. 一種控制不要之植物生長之方法，其包括使除草有效量之根據申請專利範圍第 1 項之至少一種式 I 之 O-(羥亞胺基)乙基環己烯酮肟醚或式 I 化合物之農業上可利用之鹽或式 I 化合物與 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-羧酸或無機酸形成之酯，作用於植物、其環境或種子上。
5. 一種式 III 之 O-(羥亞胺基)乙基羥基胺



其中

R<sup>2</sup> 為 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基，且

R<sup>3</sup> 為苯基，其可帶有 1 至 3 個鹵素原子；或

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基或 C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-烯基，其中此等基團若需要時可帶有一個下列取代基：鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基、苯基，其可再帶有 1 至 3 個選自下列之自由基：鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基、苯基及苯氧基，或苯氧基，其若需要時可再帶有 1 至 3 個鹵素原子；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

六、申請專利範圍

及式 III 化合物與無機酸形成之銨鹽。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線