

申請日期	87 年 11 月 20 日
案 號	87119283
類 別	發明專利

A4
C4

444009

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書

一、發明 名稱	中 文	經 1-甲基-5-烷磺醯基, 1-甲基-5-烷亞磺醯基及 1-甲基-5-烷硫基取代之吡唑基吡唑, 其製備方法及其作為除草劑上之用途
	英 文	1-methyl-5-alkylsulfonyl-, 1-methyl-5-alkylsulfinyl- and 1-methyl-5-alkylthio-substituted pyrazolylpyrazoles, processes for their preparation and their use as herbicides
二、發明 人	姓 名	(1) 亞弗烈德·安格曼 Angermann, Alfred (2) 海爾佳·法蘭克 Franke, Helga (3) 雷納·普瑞 Preuß, Rainer
	國 籍	(1) 德國 (2) 德國 (3) 德國
	住、居所	(1) 德國奎夫多賈頓文森路二十五號 In den Gartenwiesen 25, 65830 Kriftel/Ts., Germany (2) 南非桑莫塞特黃金谷山頂路十號 Upper Mountain Rd. 10, Golden Hill, 7130 Somerset West, South Africa (3) 德國賀夫罕康史坦勒路八 a 號 Königsteiner Straße 8a, 65719 Hofheim, Germany
	代 表 人 姓 名	(1) 赫斯特-史林亞格夫公司 Hoechst Schering AgrEvo GmbH
三、申請人	姓 名 (名稱)	(1) 赫斯特-史林亞格夫公司 Hoechst Schering AgrEvo GmbH
	國 籍	(1) 德國
	住、居所 (事務所)	(1) 德國柏林 D-13509 D-13509 Berlin, Germany
	代 表 人 姓 名	(1) 華納·史密特 Schmidt, Werner 朱根·盧茲 Lutz, Jürgen

裝

訂

線

444009

申請日期	87 年 11 月 20 日
案 號	87119283
類 別	

A4
C4

(以上各欄由本局填註)

發 明 專 利 說 明 書
新 型

一、發明 名稱	中 文	
	英 文	
二、發明 創作人	姓 名	(4) 歐·哈特菲爾 Hartfiel, Uwe (5) 賀格·瓦勒 Wagner, Holger (6) 赫曼·畢玲加 Bieringer, Hermann
	國 籍	(4) 德國 (5) 德國 (6) 德國
	住、居所	(4) 德國法蘭克福葛羅伯哈森菲德一二〇號 Großer Hasenpfad 120, 60598 Frankfurt, Germany (5) 德國蘭根—多恩賀斯賀森維千路八號 Veilchenweg 8, 35428 Langgons-Dornholzhausen, Germany (6) 德國艾普斯登·易奇恩路二十六號 Eichenweg 26, D-65817 Eppstein, Germany
	代 表 人 姓 名	
三、申請人	姓 名 (名稱)	
	國 籍	
	住、居所 (事務所)	
	代 表 人 姓 名	

裝

訂

線

444009

申請日期	87 年 11 月 20 日
案 號	87119283
類 別	

A4
C4

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書

一、發明 名稱	中 文	
	英 文	
二、發明 創作人	姓 名	(7) 湯馬士·奧樂 Auler, Thomas (8) 克里斯多佛·羅辛格 Rosinger, Christopher
	國 籍	(7) 德國 (8) 英國
	住、居所	(7) 德國凱斯特貝克卡斯丹尼恩路七號 Kastanienweg 7, 65451 Kelsterbach, Germany (8) 德國賀夫曼賀克菲德三三號 Am Hochfeld 33, D-65719 Hofheim, Germany
三、申請人	姓 名 (名稱)	
	國 籍	
	住、居所 (事務所)	
	代 表 人 姓 名	

裝

訂

線

444009

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大類：
IPC分類：

C6
D6

本案已向：

國(地區) 申請專利，申請日期： 案號： ， ☐有 ☐無主張優先權

德國 1997 年 11 月 24 日 197 51 943.1 ☒有主張優先權

(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)

本發明係關於經1-甲基-5-烷磺醯基、1-甲基-5-烷亞磺醯基及1-甲基-5-烷硫基取代之吡啶基吡啶、其製備方法及其作為除草劑上之用途。

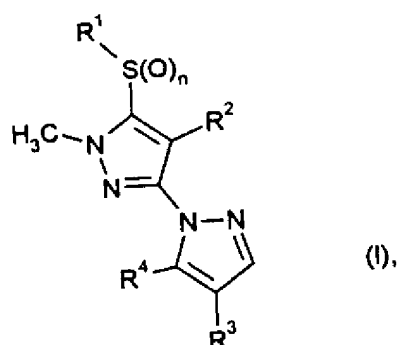
從不同的公開文獻可知吡啶基吡啶具有除草活性。因此EP-A 0 542 388、WO 94/08999及WO 96/09303描述吡啶基吡啶，其在位置5帶有鹵素或任意地經鹵素取代的烷基、烷硫基或烷氧基。德國專利申請案號第1 962 389 2.7號有主張優先權但未公開，提到吡啶基吡啶在位置5帶有未經取代或經鹵素取代的烷基、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基或烷氧基。WO 97/09313揭示吡啶基吡啶，其在吡啶基環上的位置5可被未經取代或經取代的烷基、烷氧基及烷硫基取代，及在其它吡啶基環上的位置5可被硫代氨基醯基取代。

經1-甲基-5-烷磺醯基、1-甲基-5-烷亞磺醯基及1-甲基-5-烷硫基取代之吡啶基吡啶的特別性質未揭示在這些公開文獻中。此外，在這些公開文獻中提到的除草活性化合物總是不充分，若除草活性是充分的，則在有用的農作物上有選擇性的問題。

本發明的目的是提供具有卓越生物性質的吡啶基吡啶。

此目的藉由經1-甲基-5-烷磺醯基、1-甲基-5-烷亞磺醯基及1-甲基-5-烷硫基取代之式(I)吡啶基吡啶被達到

五、發明說明(2)



其中

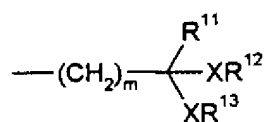
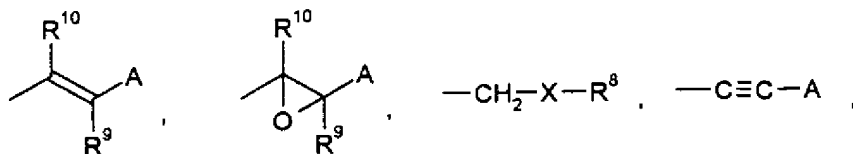
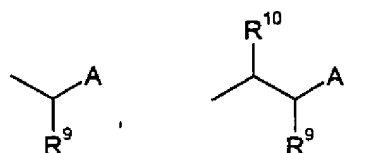
R^1 是 $C_1 - C_3$ - 烷基、 $C_3 - C_8$ - 環烷基或 $C_2 - C_3$ - 烯基，這些基團是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

R^2 是鹵素或氰基；

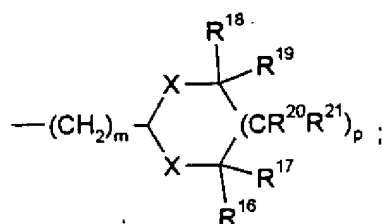
R^3 是氰基、硝基或硫代氮甲醯基；

R^4 是鹵素、未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代之 $C_1 - C_6$ - 烷基或是下列一基團：

NR^5R^6 , NR^5COR^7 , XR^8 , A,



及

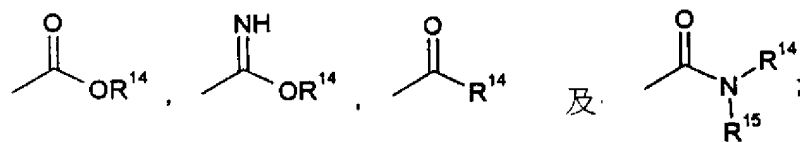


(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

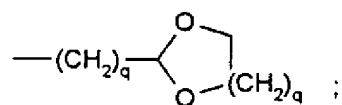
五、發明說明(3)

A 是氰基或是下列一基團：



R^5 是氫、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -烷基、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ -環烷基、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -烯基或 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -炔基，上述後四個基團是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

R^6 是 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -烷基、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ -環烷基、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -烯基或 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -炔基，這四基團是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子、二- ($\text{C}_1 - \text{C}_4$ -烷氧基) - $\text{C}_1 - \text{C}_3$ -烷基或下面基團取代；



R^7 是氫、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -烷基或 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ -環烷基，上述後二個基團是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

R^8 是 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -烷基，其碳鏈可被一或多個相同或不同的雜原子打斷，該雜原子為氧及硫，該烷基是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

R^9 是氫、 $\text{C}_1 - \text{C}_3$ -烷基、鹵素、胺基、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -烷基胺基或二- ($\text{C}_1 - \text{C}_4$ -烷基) 胺基；

R^{10} 是氫、 $\text{C}_1 - \text{C}_3$ -烷基、鹵素、胺基、羥基、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -烷基胺基或二- ($\text{C}_1 - \text{C}_4$ -烷基) 胺基；

R^{11} 是氫、 $\text{C}_1 - \text{C}_3$ -烷基或 X R^{12} 基團；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明(4)

R^{12} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被一或多個相同或不同的雜原子打斷，該雜原子為氧及硫，該烷基是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

R^{13} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被一或多個相同或不同的雜原子打斷，該雜原子為氧及硫，該烷基是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

R^{14} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基、 $C_3 - C_8$ - 環烷基、 $C_2 - C_6$ - 稀基或 $C_2 - C_6$ - 炔基，這四基團是未經取代或經一或多個相同或不同的 $C_1 - C_4$ - 烷氧基、 $C_1 - C_4$ - 烷氧基羰基、氰基或鹵素取代；這四基團的碳鏈可被一或多個相同或不同的雜原子打斷，該雜原子為氧及硫；

R^{15} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基、 $C_3 - C_8$ - 環烷基、 $C_2 - C_6$ - 稀基或 $C_2 - C_6$ - 炔基，這四基團是未經取代或經一或多個相同或不同的 $C_1 - C_4$ - 烷氧基羰基或鹵素取代；這四基團的碳鏈可被一或多個相同或不同的雜原子打斷，該雜原子為氧及硫，或

R^{14} 及 R^{15} 一起與連接的氮原子形成 3 -、5 - 或 6 - 元飽和、部分飽和或最大不飽和環，其是未經取代或經一或多個甲基取代且其一個碳原子可被氧原子取代；

R^{16} 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} 、 R^{20} 及 R^{21} 分別為氫、未經取代或經一或多個相同或不同的鹵原子取代的 $C_1 - C_4$ - 烷基或是兩個基一起形成一個鍵；

X 是氧或硫；

m 是 0、1 或 2；

五、發明說明(5)

n 是 0, 1 或 2 ;

p 是 0, 1 或 2 及

q 是 1 或 2 。

“鹵素”包括氟、氯、溴及碘。除非特別聲明否則，較佳是氯及氟。

“ $C_1 - C_3$ -烷基”是甲基、乙基、丙基及異丙基。 $C_1 - C_6$ -烷基是具有 1、2、3、4、5 或 6 個碳原子的直鏈或支鏈的烴，如除了上述基團外，1-丁基、2-丁基、2-甲基丙基、特-丁基、戊基、2-甲基丁基、1, 1-二甲基丙基及己基。具有不同範圍的碳原子數的烷基是被了解的類似物。

“ $C_3 - C_8$ -環烷基”包括環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基及環辛基。

“ $C_2 - C_6$ -烯基”及“ $C_2 - C_6$ -炔基”表具有 2、3、4、5 或 6 個碳原子的直鏈或支鏈的烴，此烴包括至少一多鍵且此多鍵可位於未經取代基團的任一位置；較佳是非位在與式(I)化合物連接的碳上。因此，“ $C_2 - C_6$ -烯基”表例如乙烯基、烯丙基、2-甲基 2-丙烯基、2-丁烯基、戊烯基、2-甲基戊烯基及己烯基。“ $C_2 - C_6$ -炔基”表例如乙炔基、炔丙基、2-甲基 2-丙炔基、2-丁炔基、2-戊炔基及 2-己炔基。具有不同範圍的碳原子數的烯基及炔基是被了解的類似物。

烷基、烯基及炔基的碳鏈被多於一個雜原子打斷，這些雜原子並非直接相連。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明(6)

“ $C_1 - C_4$ - 烷氧基”被了解為烷氧基其烴類似於烷基的定義。在其它化合物名詞如“ $C_1 - C_4$ - 烷基胺基”中烷基被了解到亦同。在“二 - ($C_1 - C_4$ - 烷基) 胺基”中二烷基可相同或不同。

若一基團是多取代的，此被了解到此基團的至少兩個及所有的氫原子被相同或不同的基所取代。式(I)的不同取代基的組合的可能性以此方式被了解的，化合物的合成通則是可被觀察的，例如無化合物被製備的因取代基的性質及鍵，式(I)化合物可能以立體異構物存在著。若，例如，一或多個烯基存在著，非對映異構物可能發生。若，例如，一或多個不飽和碳原子存在著，對映異構物及非對映異構物可能發生。立體異構物可從混合物中被得到，其可藉由習知分離方法，如層析法，而得到的。亦可能藉由使用光學活性起始物及／或輔劑，進行立體選擇性反應，而給於製備選擇性立體異構物。因此，本發明亦關於所有立體異構物及其混合物，其被式(I)包含但不特別限制。

較有興趣的式(I)化合物

其中

R^1 是 $C_1 - C_3$ - 烷基、 $C_3 - C_6$ - 環烷基或 $C_2 - C_3$ - 烯基，這些基團是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代，該鹵素原子是氯或氟及

R^2 是溴、氯、氟或氰基；

特別興趣的式(I)化合物

五、發明說明(7)

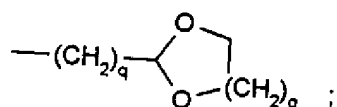
其中

R^1 是 $C_1 - C_3$ - 烷基或 $C_3 - C_6$ - 環烷基，其任意被一或多個相同或不同的鹵素原子取代，該鹵素原子是氯或氟；

R^2 是溴、氯或氰基；

R^5 是氫、 $C_1 - C_6$ - 烷基、 $C_3 - C_6$ - 環烷基、 $C_2 - C_4$ - 烯基或 $C_2 - C_4$ - 炔基，上述後四個基團是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

R^6 是 $C_1 - C_6$ - 烷基、 $C_3 - C_6$ - 環烷基、 $C_2 - C_4$ - 烯基或 $C_2 - C_4$ - 炔基，這四基團是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子、二- ($C_1 - C_1$ - 烷氧基) - $C_1 - C_3$ - 烷基或下面基團取代；



R^7 是氫、 $C_1 - C_4$ - 烷基或 $C_3 - C_6$ - 環烷基，上述後二個基團是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

R^8 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被一或多個相同或不同的雜原子打斷，該雜原子為氧及硫，該烷基是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

R^{12} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被一或多個相同或不同的雜原子打斷，該雜原子為氧及硫，該烷基是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

R^{13} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被一或多個相同或

五、發明說明(8)

不同的雜原子打斷，該雜原子為氧及硫，該烷基是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

R^{14} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基、 $C_3 - C_6$ - 環烷基、 $C_2 - C_4$ - 稀基或 $C_2 - C_4$ - 炔基，這四基團是未經取代或經一或多個相同或不同的 $C_1 - C_4$ - 烷氧基、 $C_1 - C_4$ - 烷氧基羰基、氰基或鹵素取代；這四基團的碳鏈可被一或多個相同或不同的雜原子打斷，該雜原子為氧及硫；

R^{15} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基、 $C_3 - C_6$ - 環烷基、 $C_2 - C_4$ - 稀基或 $C_2 - C_4$ - 炔基，這四基團是未經取代或經一或多個相同或不同的 $C_1 - C_4$ - 烷氧基羰基或鹵素取代；這四基團的碳鏈可被一或多個相同或不同的雜原子打斷，該雜原子為氧及硫，或

R^{14} 及 R^{15} 一起與連接的氮原子形成 3 -、5 - 或 6 - 元飽和、部分飽和或最大不飽和環，其是未經取代或經一或多個甲基取代且其一個碳原子被氧原子取代；

n 是 1 或 2；

較佳的式 (I) 化合物

其中

R^1 是 $C_1 - C_3$ - 烷基或 $C_3 - C_6$ - 環烷基；

R^8 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被氧打斷，該烷基是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

R^{12} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被氧打斷，該烷基是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

R^{13} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被氧打斷，該烷基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明(9)

是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代；

n 是 2。

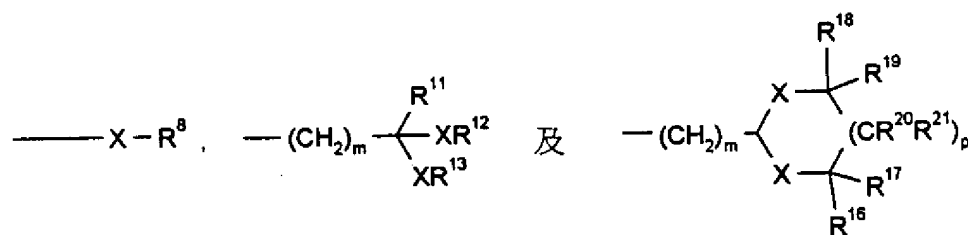
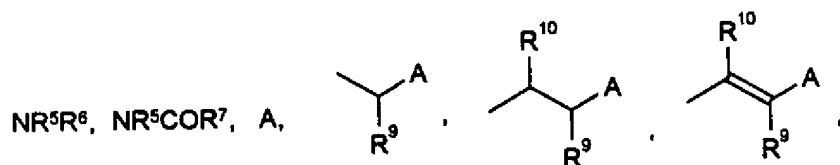
特佳的式 (I) 化合物

其中

R^1 是甲基、乙基、丙基、異丙基或環丙基；

R^3 是氰基或硝基及

R^4 是未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代之 $C_1 - C_6$ -烷基或是下列一基團。



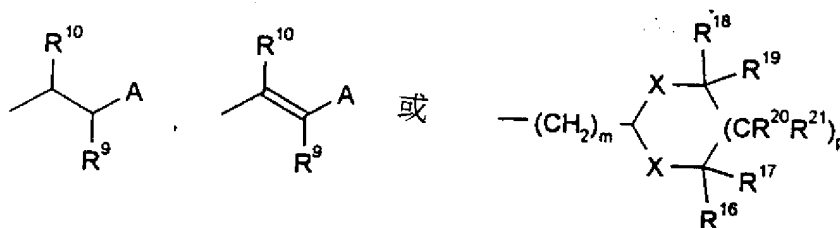
非常特別的式 (I) 化合物

其中

R^1 是甲基或環丙基；

R^2 是氯或溴及

R^4 是下列一基團



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明(10)

依照本發明化合物的製法本身是已知的，或其可藉由已知方法的組合給于類似實施。因此，依照本發明式(I)化合物，其中

n 是 0 及

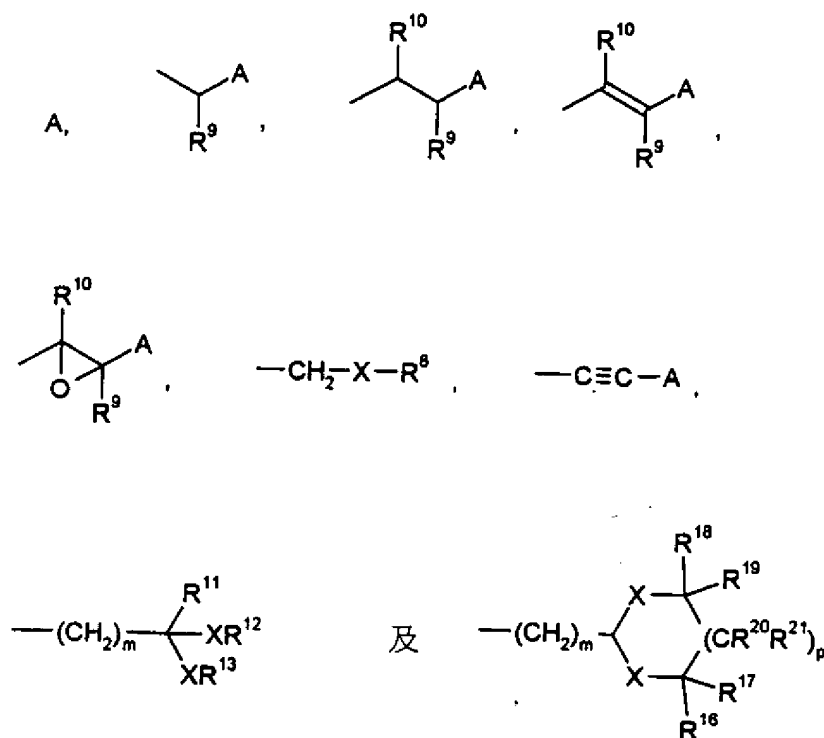
R^4 是氫、鹵素、 NR^5R^6 、 NR^5COR^7 、 XR^8 或未經取代或經一或多個相同或不同的鹵素原子取代之烷基

的製法已見於 WO 94/08999。

此外，依照本發明式(I)化合物，其中

n 是 0 及

R^4 是下列一基團



的製法已見於 WO 96/09303 及德國專利申請案第 189623892.7 號中。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (11)

依照本發明式 (I) 化合物，其中 n 是 1 或 2 可藉由相對應的式 (I) 化合物，其中 n 是 0 的習知方法給予製備，此反應有適合的氧化劑。適合的氧化劑為，例如，次氯酸鹽、有機過酸如間 - 全氯苯甲酸及過乙酸、無機試劑如生氧物、氯、過氧化氫、高碘酸鈉、高硼酸鈉、高錳酸鈉及大氣中的氧氣。

新穎化合物可以習知配方的濕粉末、可乳化的濃縮物、可噴霧的溶液、粉末或顆粒的形式被使用。因此，本發明亦提供除草及調節植物生長的組成物包括式 (I) 化合物。

式 (I) 化合物可因優勢的生物及 / 或物化參數而以不同方式給予配方。適合的配方選擇是濕粉末 (W P)、水 - 可溶的粉末 (S P)、水 - 可溶的濃縮物、可乳化的濃縮物 (E C)、乳濁物 (E W) 如水包油型及油包水型乳化、可噴霧的溶液、懸浮濃縮物 (S C)、以油或水為主的分散液、油 - 可溶混的溶液、膠囊懸浮物 (C S)、粉末 (D P)、種子 - 肥料組成物、為播種及堆肥的顆粒、微顆粒型式的顆粒 (G R)、噴霧顆粒、塗覆顆粒及吸附顆粒、水 - 可分散顆粒 (W G)、水 - 可溶顆粒 (S G)、U L V 配方、微膠囊及蠟。

這些個別配方種類原則上係為已知及已見於，例如 Winnacker-kuchler, "Chemische Technologie" [化學技術], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th. Edition 1986; Wade van Valkenburg, "農業配方", Marcel Dekker, N. Y., 1973; K.

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明(12)

Martens, "噴霧乾燥" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London。

配方的必備輔劑，如惰性物質、介面活性劑、溶劑及其它添加劑亦為習知及見於，例如 Watkins, "殺蟲劑粉末烯釋劑及載劑的手冊", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H. V. Olphen, "黏土膠體化學的介紹", 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N. Y.; C. Marsden, "溶劑指南"; 2nd Ed., Interscience, N. Y. 1963; McCutcheon's "清潔劑及乳化劑年報", MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley 及 Wood, "界面活性劑百科全書", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [界面—活性環氧乙烷加成物], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [化學技術], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Edition 1986。

基於這些配方可能與其它農藥活性物質，例如殺蟲劑、殺菌劑、除草劑及殺菌劑，產生組合，亦可能與安全劑、肥料及／或生長調節劑，例如以真實混合或混合槽型式，產生組合。

濕粉末係以一致分散在水中給予製備的，其包括除了活性化合物外，亦包括稀釋劑或惰性物質、離子及／或非離子型的介面活性劑（潤濕劑、分散劑），例如聚乙氧烷基酚、聚乙氧化脂肪醇、聚乙氧化脂肪胺、脂肪醇聚乙二醇硫酸醚、烷基磺酸鹽、烷基苄磺酸鹽、木質磺酸鈉鹽、2, 2'-二萘甲烷-6, 6'-二磺酸鈉鹽、二丁基萘磺

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明(13)

酸鈉鹽或其它油鹽甲基牛磺酸鈉鹽。爲了製備濕粉末，除草活性化合物是係爲粉末，例如以習知裝置如錘磨機、風扇粉磨機及空氣噴射粉磨機，及同時或隨後與配方輔劑混合。

可乳化的濃縮物係藉由將活性化合物溶於有添加一或多種離子及／或非離子型的介面活性劑（乳化劑）的有機溶劑中，例如丁醇、環己酮、二甲基甲醯胺、二甲苯及其它相對地高沸點芳香族化合物或烴或有機溶劑的混合物。使用的乳化劑爲烷基芳基磺酸鈣鹽如十二苯磺酸鈣鹽，或非離子乳化劑如脂肪酸聚乙二醇醚、烷基芳基聚乙二醇醚、脂肪族醇聚乙二醇醚、甲基氧丙環－環氧乙烷縮合產物、烷基聚醚、山梨糖醇酐酯如山梨糖醇酐脂肪酸酯，或聚氧化乙烯山梨糖醇酐酯如聚氧化乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯。

粉末係藉由用微細地個別固體物質，例如滑石、天然白土如高嶺土、皂土及葉蠟石或硅藻土，研磨活性化合物而製得。

懸浮濃縮物可能以油或水爲主。其可能藉由使用市售珠磨機的濕磨而製得，不論是否添加上述之介面活性劑，例如在其它配方類型。

乳濁物，例如水包油型乳化（E W），其可藉由攪拌、膠體研磨及／或使用含水的有機溶劑的靜態混合器及，若需要，上述之介面活性劑，例如在其它配方類型，而製得。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

五、發明說明 (14)

顆粒可藉由將活性化合物噴至吸附顆粒化的惰性物質上或將活性化合物濃縮物以聯結劑（如聚乙烯醇、聚丙烯酸鈉或其它礦物油）塗覆至載劑（如沙、高嶺土或顆粒化的惰性物質）的表面而製得。適合的活性化合物亦可以相同方式顆粒化，其通常是肥料顆粒的製備，若想要，可與肥料作為混合物。

水—可分散顆粒通常藉由習知方法，如噴霧—乾燥、流化床顆粒化作用、圓板顆粒化作用、使用高速混合器的混合作用及無固體惰性物質的擠壓作用，給予製備。

對於圓板、流化床、擠壓器及噴霧顆粒可參考“噴霧乾燥手冊”3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, “附聚作用”, Chemical and Engineering 1967, pages 147ff.; “Perry's 化學工程手冊”, 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, pp. 8-57。

農作物保護產的物進一步的詳細方法可參考 G. C. Kingman, “Weed Control as a Science”, John Wiley and Sons Inc., New York, 1961, pages 81-96 and J. D. Freyer, S. A. Evans, “Weed Control Handbook”, 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101-103。

農藥配方通常包括 0.1 至 99 重量%，特別是 0.1 至 95 重量%，的式 (I) 活性化合物。

在濕粉末型式，活性化合物的濃度為從約 10 至 90 重量%，剩餘部分至 100 重量%是由習知配方成分組成的。在可乳化的濃縮物型式，活性化合物的濃度可能從約

五、發明說明 (15)

1 至 90 重量%，較佳從 5 至 80 重量%。在粉末型式的配方中包括從 1 至 30 重量%的活性化合物，通常較佳從 5 至 20 重量%的活性化合物，然而，可噴霧的溶液包括從約 0.05 至 80 重量%，較佳從 2 至 50 重量%的活性化合物。在水—可分散顆粒的案例中，活性化合物的含量部分視活性化合物為液體或固體及顆粒化輔劑、填料等等而定。在水—可分散顆粒的案例中，活性化合物的含量是界於 1 及 95 重量%，較佳是界於 10 至 80 重量%。

此外，該活性化合物配方可包括膠黏劑、潤濕劑、分散劑、乳化劑、滲透劑、防腐劑、抗凍劑、溶劑、填料、載劑、色料、抗發泡劑、蒸發抑制劑及 pH 和黏度調節劑，在每一案例中，其為習知。

依據本發明式 (I) 化合物具有顯著的除草活性以抵抗一廣闊的單子葉及雙子葉的有害植物。活性化合物亦可有效地作用在多年生野草，其從地下莖、塊根或其它永久器官處長芽且其難於控制。在本文中，不論物質是應用在播種前、突出體之前或之後皆不重要的。特別是，可能被提到的典型單子葉及雙子葉野草植物，其可被依據本發明化合物控制，且不限定種類。

活性化合物有效地作用在野草種類的例子是與單子葉相同的燕麥、*Lolium*、*Alopecurus*、*Phalaris*、*Echinochloa*、*Digitaria*、*Setaria* 及來自 annual sector 的 *Cyperus* 種類及來自與多年生種類相同的 *Agropyron*、*Cynodon*、*Imperata*、*Sorghum* 及多年生的 *Cyperus* 種類。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (16)

在雙子葉野草種類的案例中，作用至物種的範圍例如， Galium, Viola, Veronica, Lamium, Stellaria, Amaranthus, Sinapis, Ipomoea, Matricaria, Abutilon 及來自與一年生相同的 Sida, 及 Convolvulus, Cirsium, Rumex 即在多年生野草中的 Artemisia。

依據本發明的活性成分亦可有效顯著地控制稻米生長的特殊條件下生長的野草，例如， Echinochloa, Sagittaria, Alisma, Eleocharis, Scirpus 及 Cyperus。

若依據本發明之化合物被運用至發芽前的土壤表面，然後可完全防止長出野草或野草生長至長出子葉然後停止生長，經過 3 至 4 個星期即會完全死亡。

若活性化合物被應用至植物綠色部分的突出體之後，處理後短時間內會戲劇性地停止生長且野草植物會維持在發展步驟的點上，或一定時間後會完全死亡，以致以此態度與野草競爭，該野草對農作物植物有害且及時被消滅。

雖然依據本發明的化合物具有極佳的除草活性以抵抗單子葉及雙子葉野草植物，對重要的經濟農作物，例如，小麥、大麥、裸麥、稻米、玉蜀黍、甜菜、棉花及大豆一點都無害，或只至不足取的範圍。爲了上述理由，本發明化合物是一極適宜用在農業或裝飾植物種植上以選擇控制不想要的植物的生長。

由於他們的除草性質，活性化合物亦可被運用在已知的農作物中以控制有害的植物或發展基因工程植物。轉殖基因的植物通常具有特別優越的性質，例如，抵抗農藥，

五、發明說明 (17)

特別是除草劑，抵抗植物疾病或導致植物疾病的有機體，例如，昆蟲或微生物如黴菌、細菌或病毒。其它特殊性質係關於，例如，量、性質、儲存穩定性組成物及收穫產物的特定成分。因此，具有增加澱粉含量或澱粉的改良性質或具有收穫產物的不同脂肪酸組成物的轉殖基因的植物是已知的。

依據本發明的式 (I) 化合物用於重要的經濟轉殖基因的農作物及裝飾植物，例如，穀類如小麥、大麥、裸麥、燕麥、粟、稻米、manioke 及玉蜀黍或甜菜、棉花、大豆、油菜、馬鈴薯、蕃茄、豌豆及其它蔬菜物種是較佳的。

較佳地，式 (I) 化合物可作為有用農作物的除草劑或藉由基因工程朝除草劑的植物毒素效果以抵抗。

習知方式以製備新穎植物，其與已知植物相比具有已改良的性質，例如，傳統的繁殖方法及突變種的生殖。或者，具有已改良性質的植物可以基因工程方法給予繁殖（見，例如，EP - A 0 2 2 1 0 4 4，EP - A 0 1 3 1 6 2 4）。例如，下述數種案例

• 在農作物方面基因工程的改變是為了改良植物的澱粉合成（例如，WO 9 2 / 1 1 3 7 6，WO 9 2 / 1 4 8 2 7，WO 9 1 / 1 9 8 0 6）。

• 轉殖基因的農作物抵抗 glufosinate-（例如，EP - A 0 2 4 2 2 3 6，EP - A 0 2 4 2 2 4 6）或 glyphosate-型（WO 9 2 / 0 0 3 7 7）或磺胺脲 - 型（EP - A 0 2 5 7 9 9 3，US - A 5 0 1 3 6 5 9）。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

66

五、發明說明 (18)

) 除草劑。

• 轉殖基因的農作物，例如棉花，具有產生蘇雲金芽孢桿菌毒素 (Bt toxins) 的能力，其傳授植物抵抗疫病 (E P - A 0 1 4 2 9 2 4 , E P - A 0 1 9 3 2 5 9) 。

• 具有已改良的脂肪酸組成物的轉殖基因的農作物 (W O 9 1 / 1 3 9 7 2) 。

允許具有改良性質的新穎轉殖基因的植物的製造的多數分子生物技術原則上是習知的，見，例如， Sambrook et al., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2nd ed. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; or Winnacker "Gene und Klone" [Genes and Clones], VCH Weinheim, 2nd edition 1996, or Christou, "Trends in Plant Science" 1(1996) 423-431。爲了實施此基因工程技術，其可能導入核酸分子至質體，其允許藉由 D N A 序列重組而發生在序列上的致突變或改變。使用上述標準製程，其可能，例如，交換鹼基、移除部分序列或加入天然或合成的序列。爲了聯結每一 D N A 片段，可能連結接合體或膠聯劑至片段。

具有已減低活性的基因產物的植物細胞可被製備，例如，藉由運送至少一合適的反向 - R N A、順向 - R N A 以達到共同壓抑效果，或藉由運送至少一合適的架構核糖酶其特定切斷上述基因產物的轉錄。爲了達到結束，可能使用包含可能存在的任何外側序列的基因產物的整個密碼

五、發明說明 (19)

序列的 D N A 分子及包括部分密碼序列的 D N A 分子兩者，這些部分須足夠長已在細胞中引起反向效果。亦可能使用 D N A 序列，其對基因產物的密碼序列具有高程度的同質性，但不是整個相同。

當在植物中運送核酸分子時，合成蛋白質可被定位在植物細胞的某區域中。無論如何，為達到定位在某區域中，可能將密碼區域與 D N A 序列連結，D N A 序列確定定位在某區域中。此序列是熟悉此技藝者所知的 see, for example Braun et al., EMBO J.11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85(1998), 846-850; Sonnewald et al., Plant J.1 (1991), 95-106)。

轉殖基因植物的細胞可使用已知技術而再生至整個植物。轉殖基因植物原則上可在任何想要的植物物種的植物中，例如單子葉及雙子葉兩者。在此方法中，可能得到藉由同質（天然）基因或基因序列的過度運送、壓抑及抑制作用，或異質（外來）基因或基因序列的運送而具有已改良性質的轉殖基因植物。

當在轉殖基因的農作物上使用依據本發明的活性化合物時，除了有效抵抗亦可見於其他農作物的有害植物外，特別施用在個別轉殖基因農作物上通常是有效的，例如已改良或犯為特廣的野草是可被控制的，本案可使用改良的施用速率，較佳是與除草劑組合，在轉殖基因農作物植物的生長及產率是有效的。

因此本發明亦提供依據本發明的式 (I) 化合物作為

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

結

五、發明說明(20)

除草劑以在轉殖基因農作物植物上控制有害植物。

依據本發明的式(I)化合物的施用速率隨外在條件如溫度、溼度、施用除草劑的性質而不同。活性物質可在一大範圍內變化，例如介於0.001及10.0 kg / ha 或更多，但較佳是界於0.005及5 kg / ha 間。

實例

A 配方實例

A. 1 粉末劑

一粉末劑是藉由混合10份重的式(I)化合物及90份重作為惰性物質的滑石，且在錘磨機粉碎混合物，而得到。

A. 2 分散粉末

一水—可分散的濕粉末是藉由混合25份重的式(I)化合物、64份重作為惰性物質的含高領土的石英、10份重的木質素磺酸鉀鹽及1份重作為潤濕劑及分散劑的油鹽甲基牛磺酸鈉鹽，且在圓板粉磨機研磨混合物，而得到。

A. 3 分散濃縮物

一水—可分散的分散濃縮物是藉由混合20份重的式(I)化合物、6份重的烷基酚聚乙二醇醚(® Triton X 207)、3份重的異三葵醇聚乙二醇醚(8EO)及71份重石蠟礦物油(沸點範圍，例如，從約255至277°C。

五、發明說明(21)

），且在珠磨機研磨混合物至微細度小於5微米，而得到。

A . 4 可乳化的濃縮物

一可乳化的濃縮物是藉由混合1.5份重的式(I)化合物、7.5份重作為溶劑的環己烷酮及10份重作為乳化劑的乙氧化的monyl phenol，而得到。

A . 5 水—可分散的顆粒

水—可分散的顆粒是藉由混合7.5份重的式(I)化合物、10份重的木質素磺酸鈣鹽、5份重的十二烷基硫酸鈉鹽、3份重的聚乙烯醇及7份重的高嶺土，在圓板粉磨機研磨混合物及在流化床用作為顆粒作用液體的水噴霧以顆粒化粉末，而得到。

水—可分散的顆粒亦可藉由在膠體研磨中均化及預粉碎2.5份重的式(I)化合物、5份重的2,2'-二萘甲烷-6,6'-二磺酸鈉鹽、2份重的油鹼甲基牛磺酸鈉鹽、1份重的聚乙烯醇及1.7份重的碳酸鈣及50份重的水，隨後在珠磨機研磨，及在噴霧塔中使用單一—物質的噴嘴粉化及乾燥得到的懸浮液，而得到。

B . 製備實例

B . 1 4-氟基-5-二乙氧甲基-1-(4-氟-1-甲基-5-甲流基-3-吡啶基)吡啶

在-30°C時，2.0克(6.2毫莫耳)的4-氟基-5-二乙氧甲基-1-(1-甲基-5-甲流基-3-吡啶基)吡啶在50毫升的二氯甲烷中與0.9克(

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明(22)

6.5 毫莫耳) 的硫醯氯攪拌 3 小時。隨後，反應混合物在碳酸氫鈉中攪拌及用二氯甲烷萃取，有機層被乾燥(硫酸鈉)及濃縮。粗產物使用乙酸乙酯/己烷沖提的矽膠層析法以得到想要的標題化合物，其為無色晶體。產率：

1.80 克(81.3% 理論值)，熔點：129 - 132 °C。

中間體的製備

a) 3-胺基-4-氰基-1-甲基-5-甲基氫硫基吡啶

9.63 克(56.6 毫莫耳)的二(甲基氫硫基)甲撐丙二腈懸浮在 50 毫升的水中及與 3.7 毫升(67.9 毫莫耳)的甲胛混合。混合物在沸點時加熱 1 小時，冷卻反應溶液及用空吸過濾沉澱物，即從乙醇中再結晶。產率：6.55 克(68.8% 理論值)，熔點：120 - 121 °C。

b) 3-胺基-1-甲基-5-甲基氫硫基吡啶

5.55 克(33.0 毫莫耳)的 3-胺基-4-氰基-1-甲基-5-甲基氫硫基吡啶與 50 毫升的 32% 強氫氧化鈉水溶液加熱至沸點且持續 24 小時。反應混合物被冷卻、用磷酸二氫化鈉溶液輕微酸化、在 50 °C 時加熱 8 小時且隨後用乙酸乙酯萃取。有機層用硫酸鈉乾燥、濃縮及用管柱層析法純化(矽膠、己烷/乙酸乙酯)。產率：1.9 克(39.8% 理論值)。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明(23)

c) 3-胍基-1-甲基-5-甲基氫硫基吡啶

在 0 ° C 時，1.1 克 (15.8 毫莫耳) 的亞硝酸鈉在 4 毫升的水中，逐滴加至 1.9 克 (13.1 毫莫耳) 的 3-胍基-1-甲基-5-甲基氫硫基吡啶在 18 毫升的濃氫氯酸中，及此混合物在 0 ° C 時攪拌 2 小時。在 30 ° C 時，7.4 毫升 (32.8 毫莫耳) 的氯化亞錫水合物在 5.5 毫升濃氫氯酸中的溶液被逐滴加至混合物中且在此溫度攪拌 3 小時。此混合物用 32 % 強氫氧化鈉水溶液鹼化及用二氯甲烷萃取。有機層被乾燥 (硫酸鈉) 及溶劑被汽提，得到 2.0 克的產物，其無須進一步純化即可使用。

d) 4-氟基-5-二乙氧甲基-1-(1-甲基-5-甲基硫基-3-吡啶基)-吡啶

2.0 克 (12.6 毫莫耳) 的 3-胍基-1-甲基-5-甲基氫硫基吡啶及 2.86 克 (12.6 毫莫耳) 的 2-氟基-4,4'-二乙氧基-1-(N,N-二甲氨基)-1-丁烯-3-酮在 30 毫升的乙醇中加熱回流 5 小時。然後混合物用旋轉蒸發器濃縮及殘留物用矽膠層析法。得到 2.50 克 (79 %) 的中間體，其為黏性油。

B. 2 4-氟基-5-二乙氧甲基-1-(4-氟-1-甲基-5-甲基磺酸基-3-吡啶基)-吡啶

1.0 克 (2.8 毫莫耳) 的 4-氟基-5-二乙氧甲基-1-(4-氟-1-甲基-5-甲基硫基-3-

五、發明說明(24)

吡唑基) - 吡唑(實例 B . 1) 及 1 . 0 克(5 . 8 毫莫耳) 的間 - 氯過苯甲酸在 10 毫升的二氯甲烷中, 在

0 ° C 時攪拌 3 小時且隨後在室溫時持續 12 小時。反應混合物用硫代硫酸鈉溶液、碳酸氫鈉溶液及水洗及乾燥(硫酸鈉), 及蒸發溶劑。矽膠管柱層析法(乙酸乙酯/己烷)得到產物, 其為無色薄片。產率: 0 . 87 克(80 % 理論值), 熔點: 129 - 132 ° C。

B . 3 4 - 氰基 - 5 - (1, 3 - 二氧戊環 - 2 - 基) - 1 - (4 - 氯 - 1 - 甲基 - 5 - 甲基磺酸基 - 3 - 吡唑基) - 吡唑

0 . 6 克(1 . 5 毫莫耳) 的 4 - 氰基 - 5 - 二乙氧甲基 - 1 - (4 - 氯 - 1 - 甲基 - 5 - 甲基磺酸基 - 3 - 吡唑基) - 吡唑(實例 B . 2) 及 0 . 5 毫升的乙二醇與 10 毫克的對 - 甲苯磺酸在 20 毫升甲苯中加熱回流 3 小時。與碳酸氫鈉及水搖晃、乾燥(硫酸鈉)及使用旋轉蒸發器濃縮, 得到結晶型式的產物, 其須進一步純化, 若要求, 可藉由再結晶或矽膠管柱層析法。產率: 0 . 52 克(94 % 理論值), 熔點: 154 - 158 ° C。

B . 4 4 - 氰基 - 5 - (1, 3 - 二噁烷 - 2 - 基) - 1 - (4 - 氯 - 1 - 甲基 - 5 - 甲基磺酸基 - 3 - 吡唑基) - 吡唑

1 . 0 克(3 . 2 毫莫耳) 的 4 - 氰基 - 5 - 甲醯基 - 1 - (4 - 氯 - 1 - 甲基 - 5 - 甲基磺酸基 - 3 - 吡唑基) - 吡唑、0 . 35 克(4 . 6 毫莫耳) 的 1, 3 - 二

五、發明說明 (25)

經基丙烷及 10 毫克的對-甲苯磺酸在 40 毫升甲苯中加熱 3 小時。如實例 1.3 逐漸完成，得到標題化合物，其為無色晶體。產率：0.98 克 (82.4% 理論值)，熔點：210 - 214 °C。

前驅物的製備

4-氰基-5-甲醯基-1-(4-氯-1-甲基-5-甲基磺酸基-3-吡啶基)-吡啶

1.10 克 (3.5 毫莫耳) 的 4-氰基-5-二乙氧甲基-1-(4-氯-1-甲基-5-甲基磺酸基-3-吡啶基)-吡啶溶於 20 毫升的 1,4-二噁烷及，然後加入 2 毫升的 50% 強硫酸，加熱回流 2 小時。溶液被冷卻及揮發性成分被蒸發，殘留物溶於二氯甲烷，用水及碳酸氫鈉溶液萃取。用硫酸鈉乾燥及用旋轉蒸發器濃縮，得到 0.95 克 (86%) 想要的醛，其無須進一步純化可被反應。

表中列出的化合物可藉由相同或相似的方法給予製備

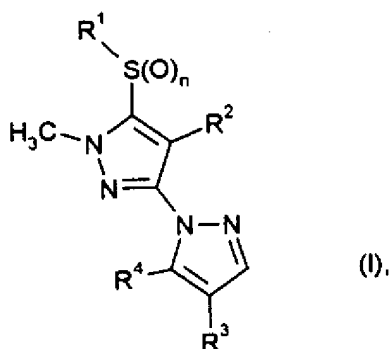
下文使用縮寫的意義

r . i .	折射率	m . p .	熔點
E t	乙基	M e	甲基
P r	n - 正丙基	i - P r	異丙基
c - P r	環丙基	B u	n - 正丁基
B n	苄基	P h	苯基

五、發明說明(26)

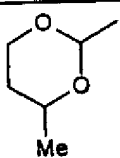
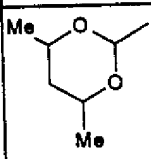
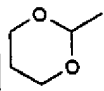
表：

依據本發明之式(1)化合物



實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
5	Me	2	Cl	CN	CH(OPr) ₂	
6	Et	2	Cl	NO ₂	CO ₂ Pr	
7	Pr	2	Cl	CN	(CH ₂) ₂ CO ₂ Et	
8	Me	2	Br	CN	CH(OMe) ₂	
9	Me	2	Cl	CN	CH ₂ CN	
12	Et	2	Cl	NO ₂	(CH ₂) ₂ CN	
11	Me	0	Br	CN	CH(OEt) ₂	106-107
12	Me	2	Cl	CN		155-158
13	Et	2	Cl	CN	CH=CHCO ₂ Et	
14	Me	2	Br	CN		166-168
15	Me	2	Cl	CN		153-157

五、發明說明 (27)

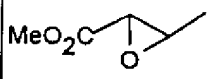
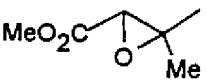
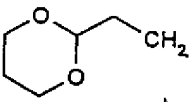
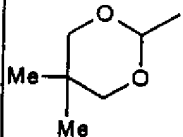
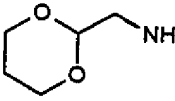
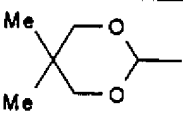
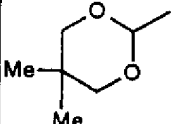
實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
16	Me	2	Cl	CN	CH=CHCO ₂ CH ₂ C≡CH	
17	Et	1	Cl	NO ₂	(CH ₂) ₂ C(OEt) ₃	
18	Me	1	Br	CN	CH(OEt) ₂	
19	Me	2	Cl	CN	CH ₂ C(OMe) ₃	
20	Et	0	Cl	NO ₂	CH=CHCO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	
21	Pr	1	Br	CN	CCl=CCICO ₂ Pr	
22	Me	2	Cl	CN	CH=CHCO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	
23	Et	2	Br	NO ₂	CH=CCICO ₂ Et	
24	Me	2	Br	CN		166-167
25	Me	2	Br	CN	CH(OEt) ₂	
26	Me	2	Cl	CN	CH=CHCO ₂ CH ₂ CF ₃	
27	Et	2	Cl	CN	(CH ₂) ₂ C(OEt) ₃	
28	Me	2	Cl	CN		138-141
29	Me	2	Br	CN	CH=CHCO ₂ CH ₂ CO ₂ Me	
30	Et	2	Cl	CN	C(=NH)OMe	
31	Me	2	Br	CN	CH ₂ CHClCN	
32	Me	0	Cl	CN		115-118

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

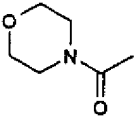
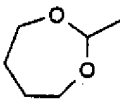
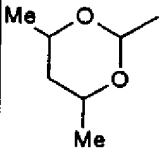
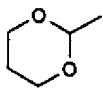
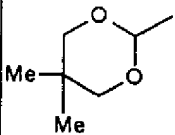
五、發明說明 (28)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
33	i-Pr	0	Cl	CN		
34	Me	2	Br	CN	CH(OPr) ₂	
35	Me	2	Cl	C(=S)NH ₂	NMe ₂	
36	Et	2	Cl	CN		
37	Me	2	Cl	CN	NMe ₂	151-153
38	Et	2	Cl	NO ₂		
39	Me	2	Cl	CN		175-178
40	Me	2	Cl	CN		157-158
41	Me	2	Br	CN	CH=CHCN	
42	Me	2	Br	CN	COCH ₂ C≡CH	
43	c-Pr	2	Cl	CN		
44	Me	2	Cl	C(=S)NH ₂	CO(CH ₂) ₂ CO ₂ Et	
45	Me	2	Br	CN		172-173
46	Me	2	Cl	CN	C(=O)NEtMe	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

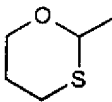
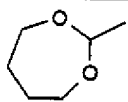
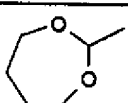
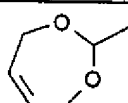
五、發明說明 (29)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
47	Et	2	Cl	CN		
48	Pr	0	Br	NO ₂	CO(CH ₂) ₂ CN	
49	Et	2	Cl	CN	CO ₂ (CH ₂) ₂ OEt	
50	Me	2	Cl	CN		193-196
51	Pr	1	Cl	NO ₂	CO ₂ CH ₂ CF ₃	
52	Me	2	Br	CN	CH=CHCO ₂ Et	
53	Me	2	Br	CN	COCF ₃	
54	Me	2	Br	CN		123-124
55	Me	2	Cl	CN	COCH ₂ CF ₃	
56	Me	1	CN	CN		205-207
57	Et	2	Cl	CN	CH ₂ OMe	119-121
58	Et	2	Cl	NO ₂	CH(NHMe)CHMeCN	
59	Me	2	Br	CN	CHClCHMeCN	
60	Me	2	CN	CN		202-205
61	Et	2	Cl	NO ₂	CCl=CHCN	
62	i-Pr	2	Cl	CN	CH(O(CH ₂) ₂ OMe) ₂	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

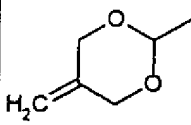
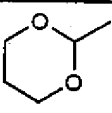
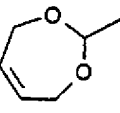
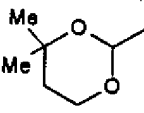
五、發明說明 (30)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
63	Me	2	Br	CN		
64	Et	2	Cl	NO ₂	CH(OCH ₂ OMe) ₂	
65	Me	2	Br	CN	CH ₂ CHClCO ₂ Me	
66	Me	2	CN	CN		193-197
67	Pr	2	Cl	NO ₂	N(Me)CH ₂ CH=CH ₂	
68	c-Pr	2	Cl	CN	NHCO-c-Pr	
69	Me	2	Br	CN	NHCO-i-Pr	
70	Me	2	Cl	NO ₂	CH ₂ CHClCO ₂ Me	
71	Me	2	Br	CN		
72	Me	2	Cl	CN	NHCH ₂ CH(OMe) ₂	156-158
73	Me	2	Cl	NO ₂	CH=CHCN	
74	Me	2	Br	CN	CH=CHCO ₂ Me	
75	Me	2	Cl	CN		193-198
76	Et	2	CN	NO ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	
77	Me	2	Cl	CN	CH ₂ CHClCO ₂ Et	
78	Me	2	Cl	CN	CH=CHCO ₂ Me	
79	Me	2	Cl	CN	NEtMe	113-115

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

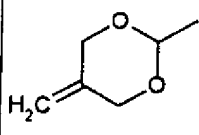
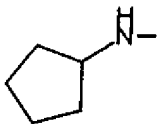
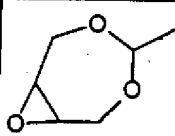
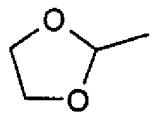
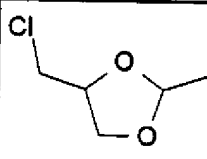
五、發明說明 (31)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or n.i.
80	Me	2	Cl	CN		160-163
81	Et	2	Cl	NO ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	
82	Me	2	Cl	CN	CH ₂ CCl ₃	
83	Me	2	Br	CN	CH ₂ CHClCO ₂ Et	
84	Me	2	CN	CN		217-219
85	Me	2	Br	CN	CH ₂ CCl ₃	
86	Me	2	Br	CN		
87	Et	2	Cl	NO ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	
88	Me	2	Cl	CN	NHMe	205-206
89	Me	2	Cl	CN		n _D ²⁰ = 1.5209
90	Me	2	Cl	NO ₂	CH ₂ CHClCO ₂ Me	
91	Me	2	Cl	CN	NH-iPr	200-202
92	i-Pr	2	Br	CN	C(=NH)OEt	
93	Me	2	Cl	CN	CH ₂ CO ₂ Me	
94	Me	2	Cl	CN	Br	160
95	Me	0	CN	CN		156-158

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

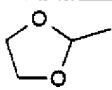
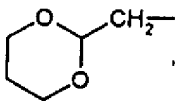
五、發明說明 (32)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
96	Me	2	Br	CN		樹脂
97	Me	2	Cl	CN		190-192
98	Me	2	Cl	CN		
99	Me	2	CN	CN		201-204
100	Me	2	Cl	NO ₂	CH ₂ CHClCN	
101	Me	2	Cl	CN	CH ₂ Cl	
102	i-Pr	2	Br	NO ₂	CH ₂ S(CH ₂) ₂ OMe	
103	Me	2	Cl	CN	CH ₂ CO ₂ Et	
104	Me	2	Iod	CN		樹脂
105	Me	0	CN	CN	CH(OEt) ₂	95-97
106	i-Pr	2	Cl	NO ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ SMe	
107	Me	2	Cl	CN	CH ₂ CH(OMe) ₂	
108	Et	2	Br	NO ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OEt	
109	Pr	2	Cl	CN	C≡CCO ₂ Pr	
110	Me	1	CN	CN	CH(OEt) ₂	163-167

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

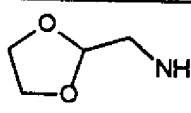
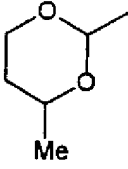
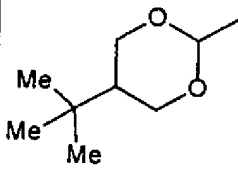
五、發明說明 (33)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
111	Me	2	Br	CN		156-157
112	i-Pr	2	Cl	NO ₂	CHMeCHCO ₂ Et	
113	Me	2	Cl	CN	NEt ₂	127-128
114	Et	2	Cl	CN	CHBrCHMeCN	
115	Me	2	CN	CN	CH(OEt) ₂	135-137
116	i-Pr	2	Cl	NO ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OBu	
117	Me	2	Cl	CN		
118	Et	2	Cl	CN	CBr=CHCN	
119	Me	1	Cl	CN	CH(OEt) ₂	129-135
120	Et	2	CN	NO ₂	C≡CCN	
121	Me	2	Br	CN	CH ₂ CO ₂ Et	
122	Me	2	Cl	CN	CH(OCH ₂ CH ₂ OMe) ₂	87-89
123	Me	2	Cl	CN	N(Me)CH ₂ CH≡CH	122-123
124	Et	2	Br	CN	C≡CCOMe	
125	Me	1	Cl	CN	NEt ₂	161-163
126	Me	2	Cl	CN	(CH ₂) ₂ C(=NH)OMe	
127	Me	2	Cl	NO ₂	CH ₂ CHClCO ₂ Et	
128	Me	2	Cl	NO ₂	CH=CHCO ₂ Et	
129	Me	2	Cl	CN	CH ₂ SMe	144-145
130	Me	2	Cl	CN	NHCOEt	231-233

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

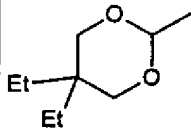
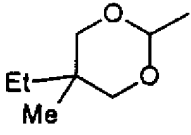
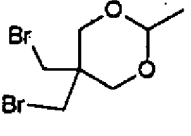
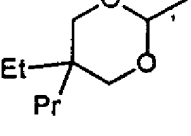
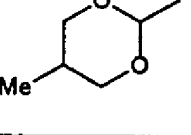
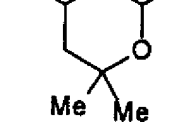
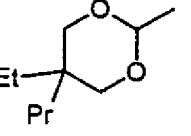
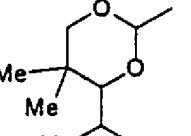
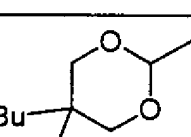
五、發明說明 (34)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
131	Me	2	Cl	CN	NHCOMe	226-228
132	Me	2	Br	CN	CH ₂ CO ₂ Me	
133	Pr	2	Cl	CN	CO ₂ CF ₃	
134	Me	2	Cl	CN	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	86.5-88
135	i-Pr	1	Cl	NO ₂	CO(CH ₂) ₂ OEt	
136	Me	2	Cl	CN	CH ₂ OPr	114-115
137	Me	2	Cl	CN	C(=NH)OEt	
138	Me	2	Cl	CN	CONMeEt	
139	Me	2	Cl	CN	CH ₂ OMe	89.5-91
140	Me	2	Cl	CN	O(CH ₂) ₂ OMe	
141	Me	2	Cl	CN	OEt	
142	Me	1	Cl	CN	CH ₂ OMe	98-99
143	Me	2	Cl	CN	SMe	
144	Me	2	Cl	CN		148-150
145	Me	0	Cl	CN		油
146	Me	0	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

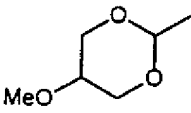
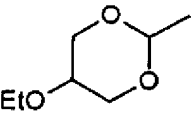
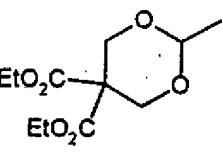
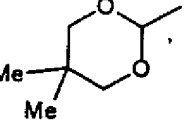
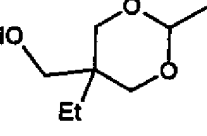
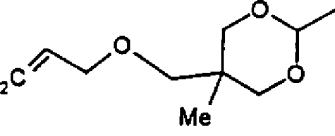
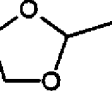
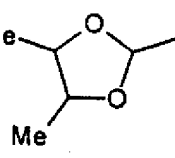
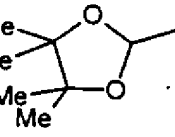
五、發明說明 (35)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
147	Me	0	Cl	CN		樹脂
148	Me	0	Cl	CN		樹脂
149	Me	0	Cl	CN		樹脂
150	Me	0	Cl	CN		樹脂
151	Me	0	Cl	CN		樹脂
152	Me	0	Cl	CN		樹脂
153	Me	0	Cl	CN		樹脂
154	Me	0	Cl	CN		樹脂
155	Me	0	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

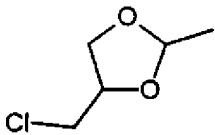
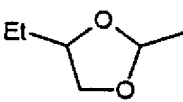
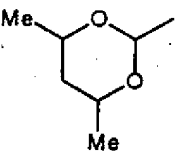
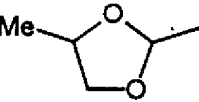
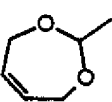
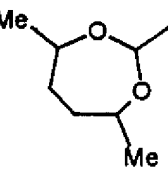
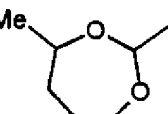
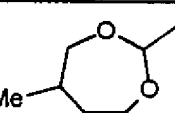
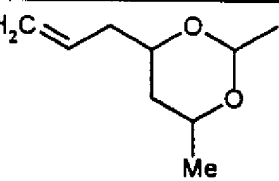
五、發明說明 (36)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
156	Me	0	Cl	CN		樹脂
157	Me	0	Cl	CN		樹脂
158	Me	0	Cl	CN		樹脂
159	Me	0	Cl	CN		樹脂
160	Me	0	Cl	CN		樹脂
161	Me	0	Cl	CN		樹脂
162	Me	0	Cl	CN		樹脂
163	Me	0	Cl	CN		樹脂
164	Me	0	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

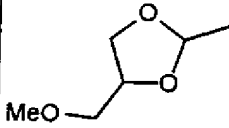
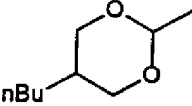
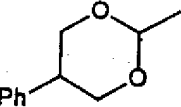
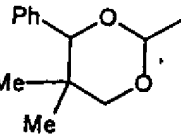
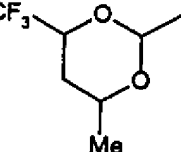
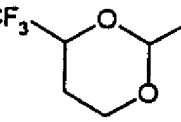
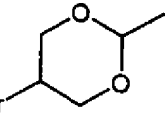
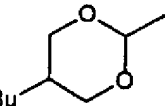
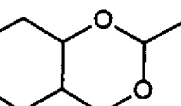
五、發明說明 (37)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
165	Me	0	Cl	CN		樹脂
166	Me	0	Cl	CN		樹脂
167	Me	0	Cl	CN		樹脂
168	Me	0	Cl	CN		樹脂
169	Me	0	Cl	CN		半—結晶
170	Me	0	Cl	CN		半—結晶
171	Me	0	Cl	CN		半—結晶
172	Me	0	Cl	CN		半—結晶
173	Me	0	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

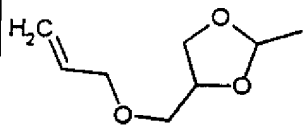
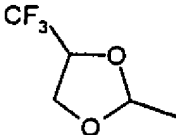
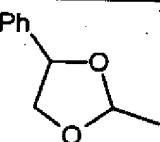
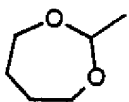
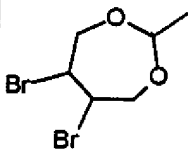
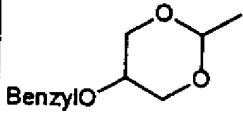
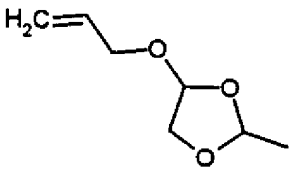
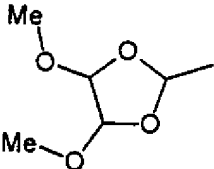
五、發明說明 (38)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
174	Me	0	Cl	CN		樹脂
175	Me	0	Cl	CN		樹脂
176	Me	0	Cl	CN		樹脂
177	Me	0	Cl	CN		樹脂
178	Me	0	Cl	CN		樹脂
179	Me	0	Cl	CN		樹脂
180	Me	0	Cl	CN		樹脂
181	Me	0	Cl	CN		樹脂
182	Me	0	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

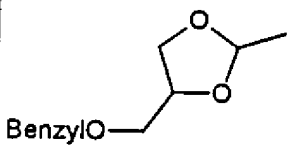
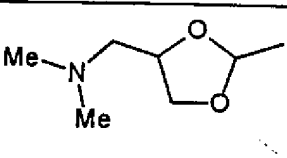
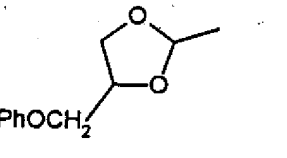
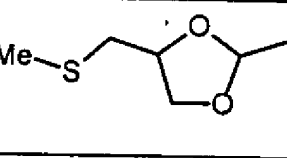
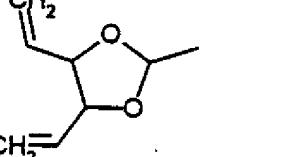
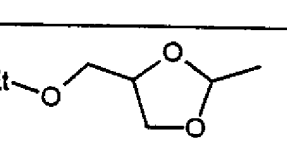
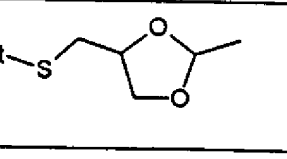
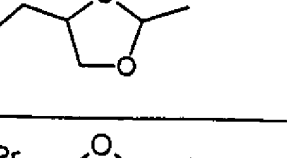
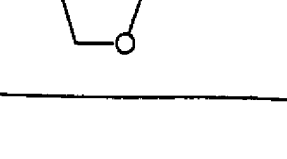
五、發明說明 (39)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
183	Me	0	Cl	CN		樹脂:
184	Me	0	Cl	CN		樹脂:
185	Me	0	Cl	CN		樹脂:
186	Me	0	Cl	CN		樹脂
187	Me	0	Cl	CN		樹脂:
188	Me	0	Cl	CN		樹脂
189	Me	0	Cl	CN		樹脂
190	Me	0	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

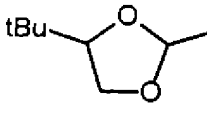
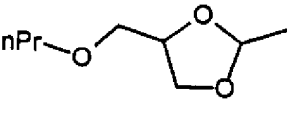
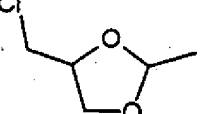
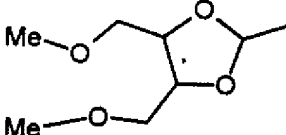
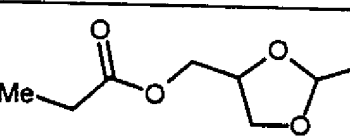
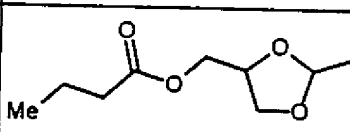
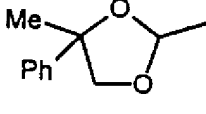
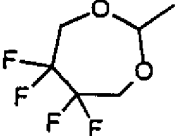
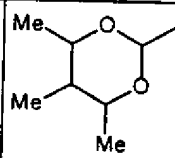
五、發明說明 (40)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
191	Me	0	Cl	CN		樹脂
192	Me	0	Cl	CN		樹脂
193	Me	0	Cl	CN		樹脂
194	Me	0	Cl	CN		樹脂
195	Me	0	Cl	CN		樹脂
196	Me	0	Cl	CN		樹脂
197	Me	0	Cl	CN		樹脂
198	Me	0	Cl	CN		樹脂
199	Me	0	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

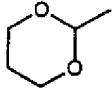
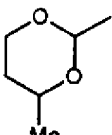
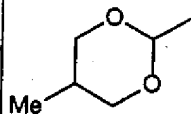
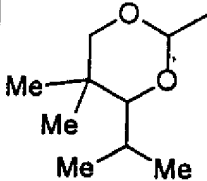
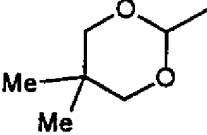
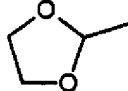
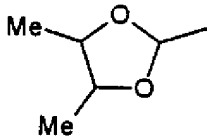
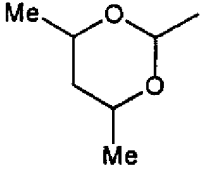
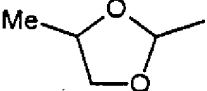
五、發明說明 (41)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
200	Me	0	Cl	CN		樹脂
201	Me	0	Cl	CN		樹脂
202	Me	0	Cl	CN		樹脂
203	Me	0	Cl	CN		樹脂
204	Me	0	Cl	CN		樹脂
205	Me	0	Cl	CN		樹脂
206	Me	0	Cl	CN		樹脂
207	Me	0	Cl	CN		樹脂
208	Me	0	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

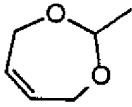
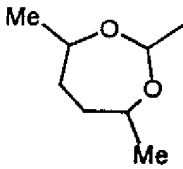
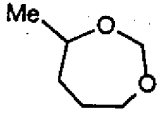
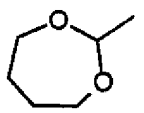
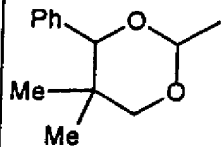
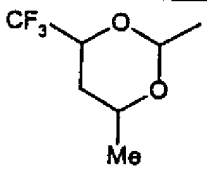
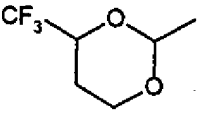
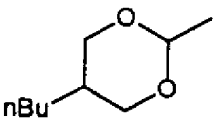
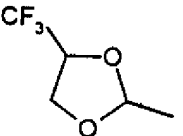
五、發明說明 (42)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
209	Me	0	Br	CN		樹脂
210	Me	0	Br	CN		黏性油
211	Me	0	Br	CN		樹脂
212	Me	0	Br	CN		樹脂
213	Me	0	Br	CN		
214	Me	0	Br	CN		樹脂
215	Me	0	Br	CN		黏性油
216	Me	0	Br	CN		樹脂
217	Me	0	Br	CN		

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

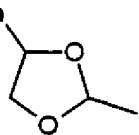
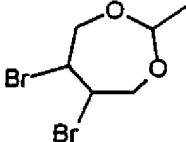
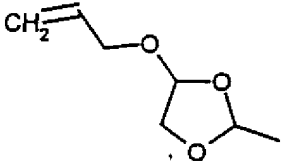
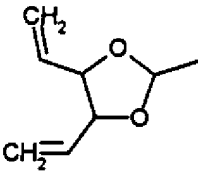
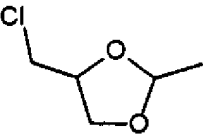
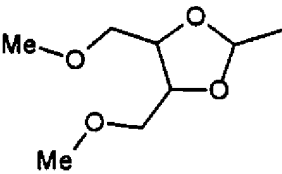
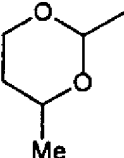
五、發明說明 (43)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
218	Me	0	Br	CN		樹脂
219	Me	0	Br	CN		樹脂
220	Me	0	Br	CN		樹脂
221	Me	0	Br	CN		樹脂
222	Me	0	Br	CN		樹脂
223	Me	0	Br	CN		樹脂
224	Me	0	Br	CN		樹脂
225	Me	0	Br	CN		樹脂
226	Me	0	Br	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

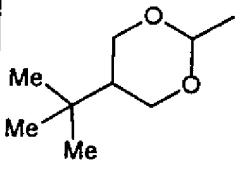
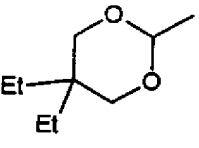
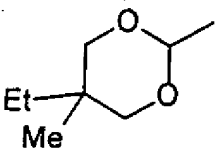
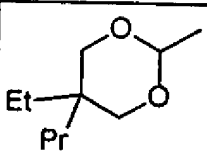
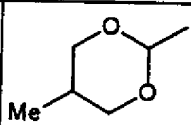
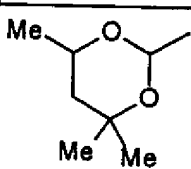
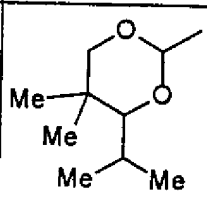
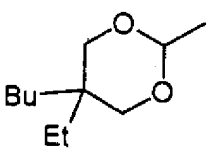
五、發明說明 (44)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
227	Me	0	Br	CN		樹脂
228	Me	0	Br	CN		樹脂
229	Me	0	Br	CN		樹脂
230	Me	0	Br	CN		樹脂
231	Me	0	Br	CN		樹脂
232	Me	0	Br	CN		樹脂
233	Me	1	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

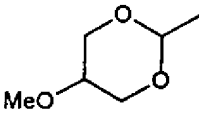
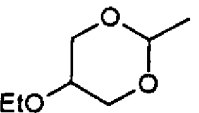
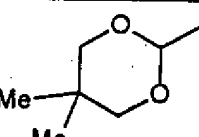
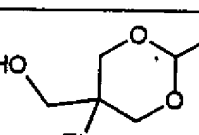
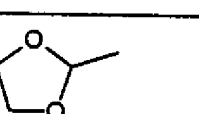
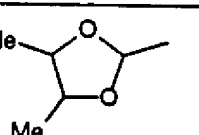
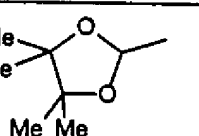
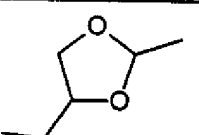
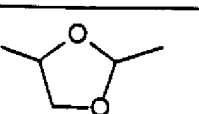
五、發明說明 (45)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
234	Me	1	Cl	CN		樹脂
235	Me	1	Cl	CN		樹脂
236	Me	1	Cl	CN		樹脂
237	Me	1	Cl	CN		樹脂
238	Me	1	Cl	CN		樹脂
239	Me	1	Cl	CN		樹脂
240	Me	1	Cl	CN		樹脂
241	Me	1	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

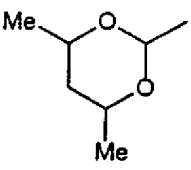
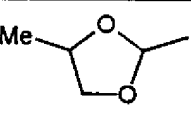
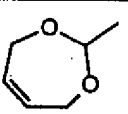
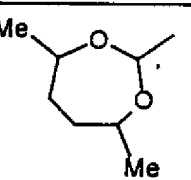
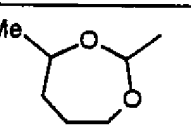
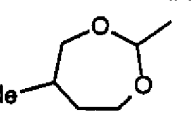
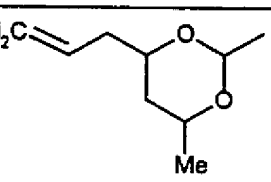
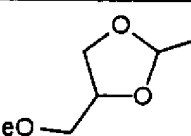
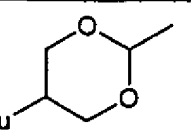
五、發明說明 (46)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
242	Me	1	Cl	CN		樹脂
243	Me	1	Cl	CN		樹脂
244	Me	1	Cl	CN		樹脂
245	Me	1	Cl	CN		樹脂
246	Me	1	Cl	CN		樹脂
247	Me	1	Cl	CN		樹脂
248	Me	1	Cl	CN		樹脂
249	Me	1	Cl	CN		樹脂
250	Me	1	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

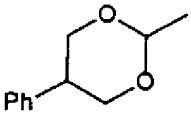
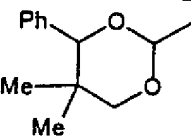
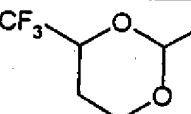
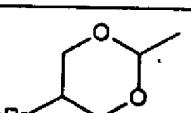
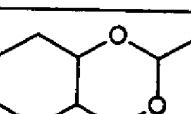
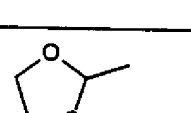
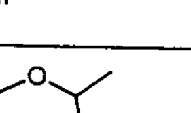
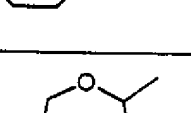
五、發明說明 (47)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
251	Me	1	Cl	CN		樹脂
252	Me	1	Cl	CN		樹脂
253	Me	1	Cl	CN		半一結晶
254	Me	1	Cl	CN		樹脂
255	Me	1	Cl	CN		樹脂
256	Me	1	Cl	CN		樹脂
257	Me	1	Cl	CN		樹脂
258	Me	1	Cl	CN		樹脂
259	Me	1	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

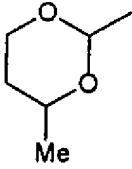
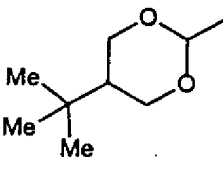
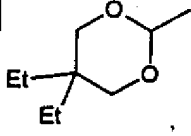
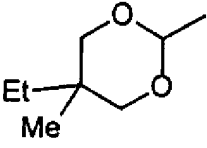
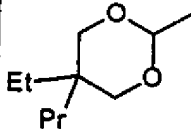
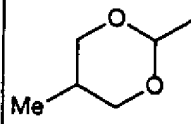
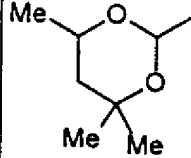
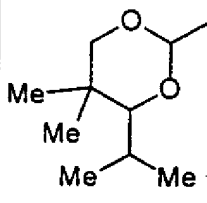
五、發明說明 (48)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
260	Me	1	Cl	CN		樹脂
261	Me	1	Cl	CN		樹脂
262	Me	1	Cl	CN		樹脂
263	Me	1	Cl	CN		樹脂
264	Me	1	Cl	CN		樹脂
265	Me	1	Cl	CN		樹脂
266	Me	1	Cl	CN		樹脂
267	Me	1	Cl	CN		樹脂
268	Me	1	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

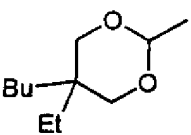
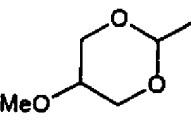
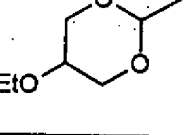
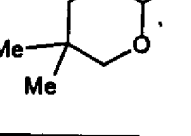
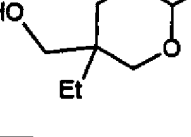
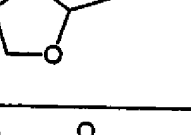
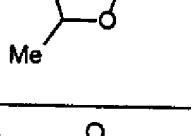
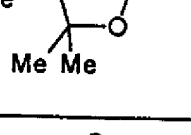
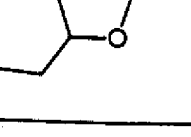
五、發明說明 (49)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
269	Me	1	Br	CN		樹脂
270	Me	1	Br	CN		樹脂
271	Me	1	Br	CN		樹脂
272	Me	1	Br	CN		樹脂
273	Me	1	Br	CN		樹脂
274	Me	1	Br	CN		樹脂
275	Me	1	Br	CN		樹脂
276	Me	1	Br	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

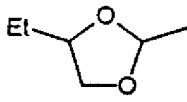
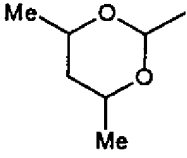
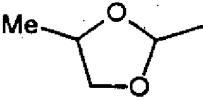
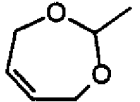
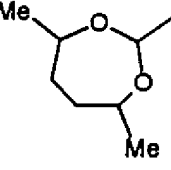
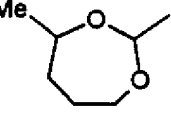
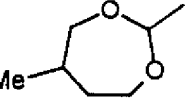
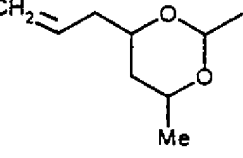
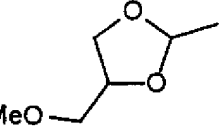
五、發明說明 (50)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
277	Me	1	Br	CN		樹脂
278	Me	1	Br	CN		樹脂
279	Me	1	Br	CN		樹脂
280	Me	1	Br	CN		樹脂
281	Me	1	Br	CN		樹脂
282	Me	1	Br	CN		樹脂
283	Me	1	Br	CN		樹脂
284	Me	1	Br	CN		樹脂
285	Me	1	Br	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

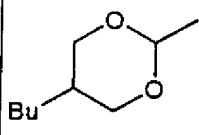
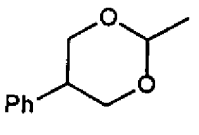
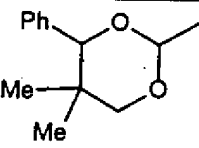
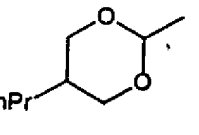
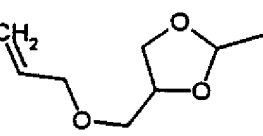
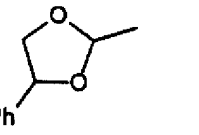
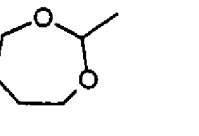
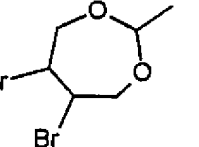
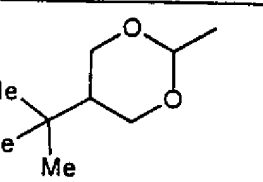
五、發明說明 (51)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
286	Me	1	Br	CN		樹脂
287	Me	1	Br	CN		樹脂
288	Me	1	Br	CN		樹脂
289	Me	1	Br	CN		半一結晶
290	Me	1	Br	CN		樹脂
291	Me	1	Br	CN		樹脂
292	Me	1	Br	CN		樹脂
293	Me	1	Br	CN		樹脂
294	Me	1	Br	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (52)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
295	Me	1	Br	CN		樹脂
296	Me	1	Br	CN		樹脂
297	Me	1	Br	CN		樹脂
298	Me	1	Br	CN		樹脂
299	Me	1	Br	CN		樹脂
300	Me	1	Br	CN		樹脂
301	Me	1	Br	CN		樹脂
302	Me	1	Br	CN		樹脂
303	Me	2	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

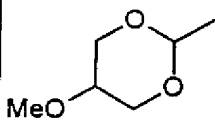
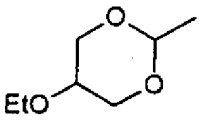
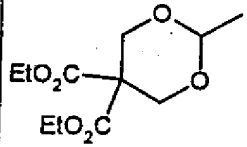
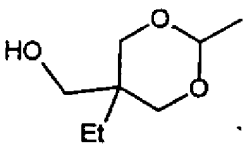
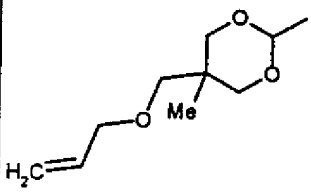
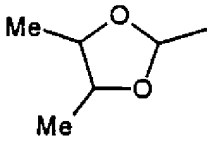
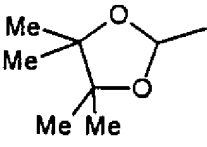
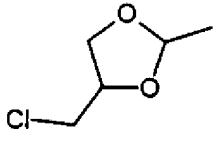
五、發明說明 (53)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
304	Me	2	Cl	CN		130-131
305	Me	2	Cl	CN		134-135
306	Me	2	Cl	CN		樹脂
307	Me	2	Cl	CN		樹脂
308	Me	2	Cl	CN		樹脂
309	Me	2	Cl	CN		樹脂
310	Me	2	Cl	CN		樹脂
311	Me	2	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

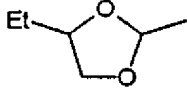
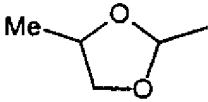
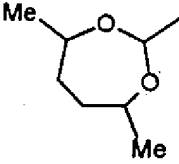
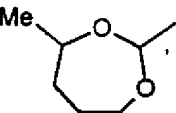
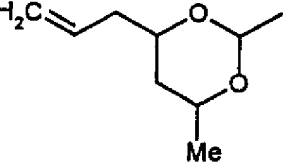
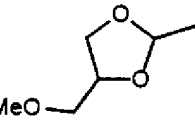
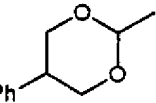
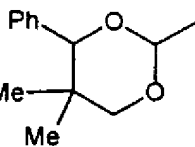
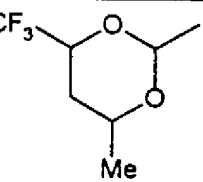
五、發明說明 (54)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
312	Me	2	Cl	CN		樹脂
313	Me	2	Cl	CN		樹脂
304	Me	2	Cl	CN		樹脂
315	Me	2	Cl	CN		樹脂
316	Me	2	Cl	CN		樹脂
317	Me	2	Cl	CN		135-137
318	Me	2	Cl	CN		樹脂
319	Me	2	Cl	CN		105-107

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

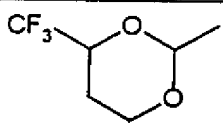
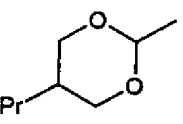
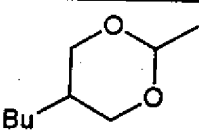
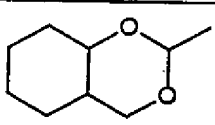
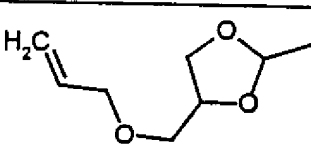
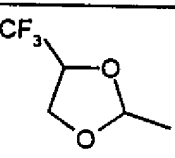
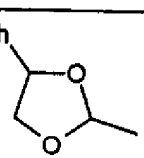
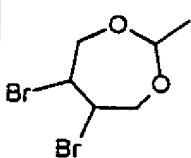
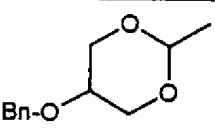
五、發明說明 (55)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
320	Me	2	Cl	CN		118-122
321	Me	2	Cl	CN		128-129
322	Me	2	Cl	CN		樹脂
323	Me	2	Cl	CN		樹脂
324	Me	2	Cl	CN		樹脂
325	Me	2	Cl	CN		樹脂
326	Me	2	Cl	CN		樹脂
327	Me	2	Cl	CN		樹脂
328	Me	2	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

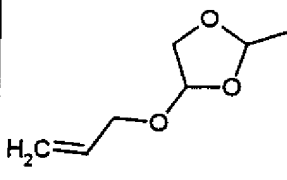
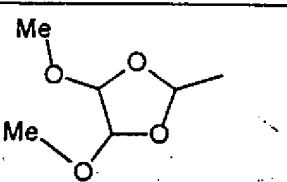
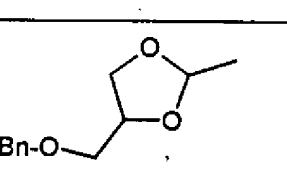
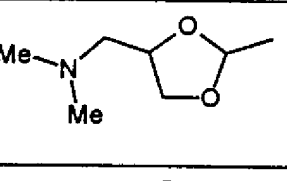
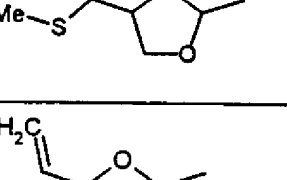
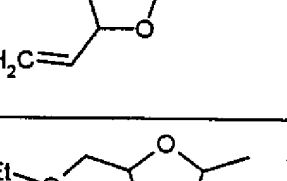
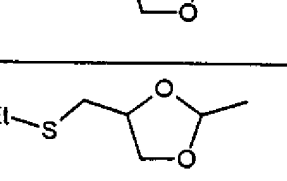
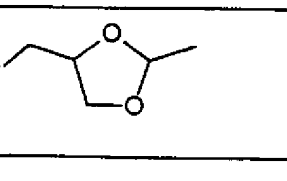
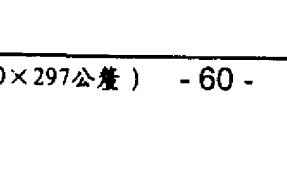
五、發明說明 (56)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
329	Me	2	Cl	CN		樹脂
330	Me	2	Cl	CN		樹脂
331	Me	2	Cl	CN		樹脂
332	Me	2	Cl	CN		樹脂
333	Me	2	Cl	CN		樹脂
334	Me	2	Cl	CN		樹脂
335	Me	2	Cl	CN		樹脂
336	Me	2	Cl	CN		樹脂
337	Me	2	Cl	CN		145-150

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

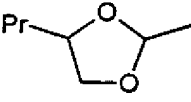
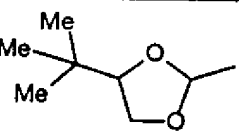
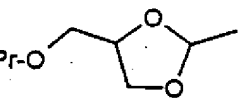
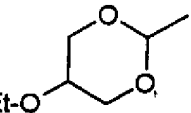
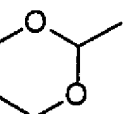
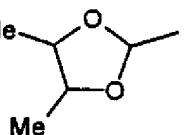
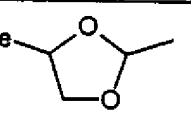
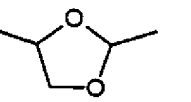
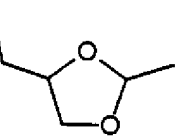
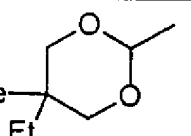
五、發明說明 (57)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
338	Me	2	Cl	CN		樹脂
339	Me	2	Cl	CN		樹脂
340	Me	2	Cl	CN		樹脂
341	Me	2	Cl	CN		樹脂
342	Me	2	Cl	CN		樹脂
343	Me	2	Cl	CN		樹脂
344	Me	2	Cl	CN		樹脂
345	Me	2	Cl	CN		樹脂
346	Me	2	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

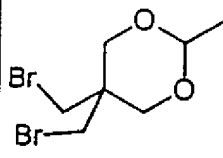
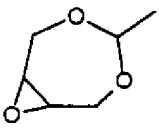
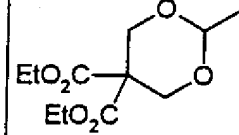
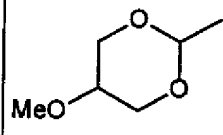
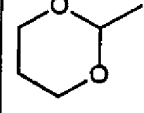
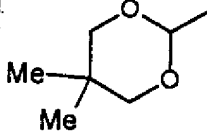
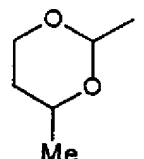
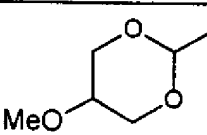
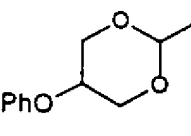
五、發明說明 (58)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
347	Me	2	Cl	CN		樹脂
348	Me	2	Cl	CN		樹脂
349	Me	2	Cl	CN		樹脂
350	Me	2	Br	CN		樹脂
351	Me	2	Br	CN		204-205
352	Me	2	Br	CN		136-137
353	Me	2	Br	CN		120-121
354	Me	2	Br	CN		樹脂
355	Me	2	Br	CN		樹脂
356	Me	2	Br	CN		140-141

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

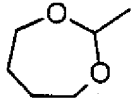
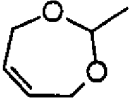
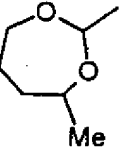
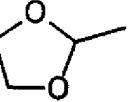
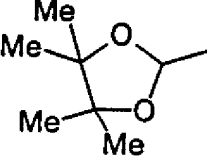
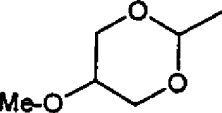
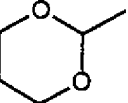
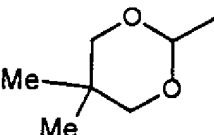
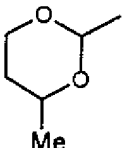
五、發明說明 (59)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
357	Me	2	Br	CN		165-166
358	Me	2	Br	CN		
359	Me	2	Br	CN		樹脂
360	Me	2	Iod	CN		樹脂
361	Me	2	Iod	CN		樹脂
362	Me	2	Iod	CN		樹脂
363	Me	2	Iod	CN		樹脂
364	Me	2	Iod	CN		樹脂
365	Me	2	Iod	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

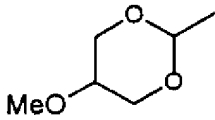
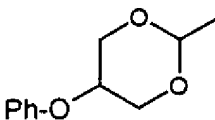
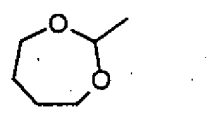
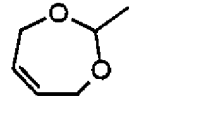
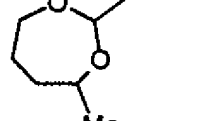
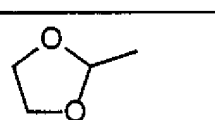
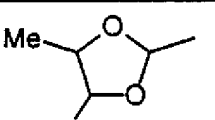
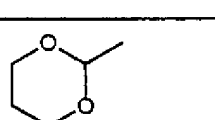
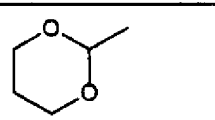
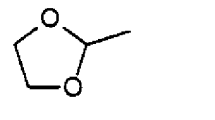
五、發明說明 (60)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
366	Me	2	Iod	CN		樹脂
367	Me	2	Iod	CN		樹脂
368	Me	2	Iod	CN		樹脂
369	Me	2	Iod	CN		樹脂
370	Me	2	Iod	CN		樹脂
371	Me	0	Iod	CN		樹脂
372	Me	0	Iod	CN		樹脂
373	Me	0	Iod	CN		樹脂
374	Me	0	Iod	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

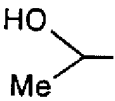
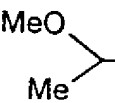
五、發明說明 (61)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
375	Me	0	Iod	CN		樹脂
376	Me	0	Iod	CN		樹脂
377	Me	0	Iod	CN		樹脂
378	Me	0	Iod	CN		樹脂
379	Me	0	Iod	CN		樹脂
380	Me	0	Iod	CN		樹脂
381	Me	0	Iod	CN		樹脂
382	Me	0	Iod	CN		樹脂
383	Me	1	Iod	CN		樹脂
384	Me	1	Iod	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

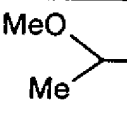
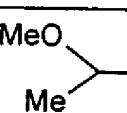
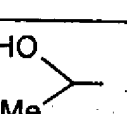
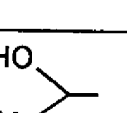
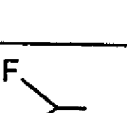
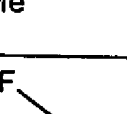
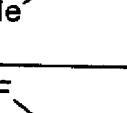
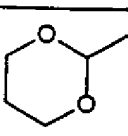
五、發明說明 (62)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
385	Me	0	Cl	CN	CH=CHCO ₂ Me	樹脂
386	Me	0	Br	CN	CH=CHCO ₂ Me	樹脂
387	Me	1	Br	CN	CH=CHCO ₂ Me	156-157
388	Me	0	Cl	CN	CH=CHCO ₂ Pr	樹脂
389	Me	0	Cl	CN	CH=CHCO ₂ Pr	樹脂
390	Me	0	Cl	CN	CH=CHCO ₂ Bu	樹脂
391	Me	0	Cl	CN	CH=CHCO ₂ -n-Pentyl	樹脂
392	Me	0	Cl	CN	CH=CHCO ₂ -n-Hexyl	樹脂
393	Me	0	Cl	CN	CH=CHCO ₂ H	樹脂
394	Me	0	Br	CN	CH=CHCO ₂ Pr	樹脂
395	Me	0	Br	CN	CH=CHCO ₂ Pr	樹脂
396	Me	2	Br	CN	CH=CHCO ₂ Pr	樹脂
397	Me	2	Br	CN	CH=CHCO ₂ Bu	樹脂
398	Me	2	Br	CN	CH=CClCO ₂ Bu	樹脂
399	Me	2	Br	CN	CH=CClCO ₂ Pr	樹脂
400	Me	0	Br	CN	CH ₂ -CHClCO ₂ Et	樹脂
401	Me	2	Br	CN	CH=CClCO ₂ -i-Pr	樹脂
402	Me	2	Cl	CN		樹脂
403	Me	0	Cl	CN		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

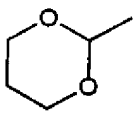
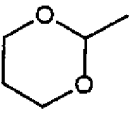
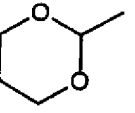
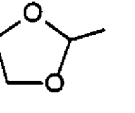
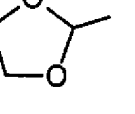
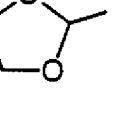
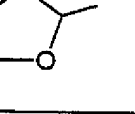
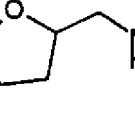
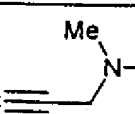
五、發明說明 (63)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
404	Me	0	Br	CN		樹脂
405	Me	2	Cl	CN		樹脂
406	Me	0	Cl	CN		樹脂
407	Me	2	Br	CN		139 -140
408	Me	0	Cl	CN		樹脂
409	Me	0	Br	CN		樹脂
410	Me	2	Cl	CN		樹脂
411	Me	1	Cl	NO ₂	-CHO	黏性油
412	Me	0	Cl	NO ₂	-CHO	黏性油
413	Me	0	Cl	NO ₂	CH(OMe) ₂	59-61
414	Me	2	Cl	NO ₂	CH(OEt) ₂	樹脂
415	Me	2	Br	NO ₂	CH(OMe) ₂	樹脂
416	Me	0	Cl	NO ₂		樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

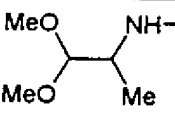
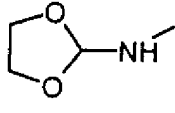
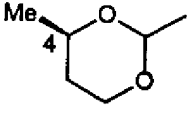
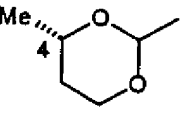
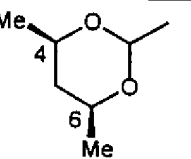
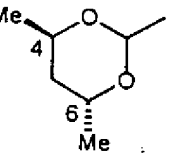
五、發明說明 (64)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
417	Me	0	Br	NO ₂		樹脂
418	Me	2	Br	NO ₂		樹脂
419	Me	1	Br	NO ₂		樹脂
420	Me	0	Cl	NO ₂		樹脂
421	Me	0	Br	NO ₂		樹脂
422	Me	2	Br	NO ₂		樹脂
423	Me	1	Br	NO ₂		樹脂
424	Me	2	Cl	CN	NH ₂	245-248
425	Me	2	Cl	CN		182-184
426	Me	2	Cl	CN	NHCH ₂ CH ₂ OMe	150-152
427	Me	2	Cl	CN		122-123
428	Me	2	CN	CN	NH ₂	300

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (65)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
429	Me	2	Cl	CN		124-126
430	Me	2	Cl	CN		148-150
431	Me	1	Cl	CN	NH ₂	171-173
432	Me	1	Cl	NO ₂	NH ₂	
433	Me	0	Cl	NO ₂	NH ₂	148-151
434	Me	0	Cl	C(=S)NH ₂	NH ₂	159 -162
435	Me	2	Cl	CN	 (4R)- 構型	樹脂
436	Me	2	Cl	CN	 (4S)- 構型	樹脂
437	Me	2	Cl	CN	 (4,6- 內消旋)-構型	樹脂
438	Me	2	Cl	CN	 (4R,6R)- 構型	樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (66)

實例	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	m.p. [°C] or r.i.
439	Me	2	Cl	CN	 (4S,6S)- 構型	樹脂
440	Me	2	Cl	CN	NH(C=O)CH ₂ OMe	194 -195
441	Me	0	F	CN		
442	Me	0	F	CN	CH(OEt) ₂	
443	Me	2	F	CN		
444	Me	2	F	CN	CH(OEt) ₂	
445	Me	2	F	CN		
446	Me	2	F	CN		

(請先閱讀背面之注意事項再填本頁)

訂

五、發明說明 (67)

C . 生物試驗

C . 1 突出體之前

有害 β 有用的單子葉或雙子葉的種子或地下莖片斷被置於直徑為 9 c m 的容器中的砂壤土裏且用土覆蓋之。或者，對於稻米試驗，稻米及有害植物（其在有用的農作物中不想要的）被耕種在充滿水的土壤裏。依據本發明的組成物被調配成可乳化的濃度，然後再施用至土壤的表面作為乳膠在水中體積為 8 0 0 l / h a （已轉化過的），在不同的劑量，或在稻米試驗，被倒入灌溉水中。容器隨後被置於溫室中，進一步在最佳條件下栽培植物。在這些植物的突出體之後，例如開始試驗後約 2 至 4 個星期，評估有用及有害植害的損害比率。

在施用率為 3 3 0 g / t a ，例如化合物 3 9 、 5 0 、 7 5 及 8 4 顯示出 9 0 至 1 0 0 % 有效抵抗 *Setaria viridis* 。以相同的施用率，化合物 3 9 ， 5 0 ， 6 6 及 8 0 顯示出 9 0 至 1 0 0 % 有效抵抗 *Stellaria media* 。

在施用率為 8 0 g / h a ，例如化合物 1 2 及 3 2 顯示出 1 0 0 % 有效抵抗 *Matricaria inodora* , *Chenopodium album* 及 *Veronica persica* 。

在施用率為 8 0 g / h a ，例如化合物 1 2 ， 3 2 及 1 0 5 的稻米沒有損害。此外，在施用率小於 1 0 0 0 g / h a ，化合物 1 4 ， 1 5 ， 2 4 ， 2 8 ， 3 2 ， 3 9 ， 1 1 1 ， 1 4 5 ， 1 4 6 ， 1 5 6 ， 1 6 3 ， 1 6 6 ， 2 1 3 ， 2 4 2 ， 2 4 4 ， 2 4 6 ， 2 4 7 ， 2 5 2 ，

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

訂

五、發明說明(68)

285, 313, 317, 319, 325, 342, 349, 350, 354, 374, 437及438顯示出90至100%有效抵抗不同的單一及雙子葉野草。

C. 2 突出體之後

有用植物及不同野草或禾本植物長在置於溫室裏的直徑為9cm的紙容器中的砂壤土裏直到他們達到長到3-4葉的成長階段，然後用水稀釋本發明化合物的配方，即施用的水量為300l/ha，處理之。4星期後，評估施用活性化合物後，植物的任何損害，特別是生長的最後損害程度。評估效量是以和來處理的控制組相比，以百分比(0-100%)給予測量。

在施用率為330g/ha，例如化合物39, 50, 75及80顯示出90至100%有效抵抗 *Amaranthus retroflexus*。以相同的施用率，例如化合物39及80顯示出90至100%有效抵抗 *Setaria viridis*。

在施用率為80g/ta，例如化合物12及32顯示出100%有效抵抗 *Matricaria inodora*, *Chenopodium album* 及 *Veronica persica*。

在施用率為80g/ta，例如化合物12, 32及105沒有引起稻米的損害。

此外，在施用率小於1000g/ha，化合物14, 15, 24, 28, 32, 36, 39, 89, 111, 145, 146, 156, 163, 180, 202,

五、發明說明(69)

2 0 8 , 2 1 2 , 2 1 5 , 2 1 6 , 2 2 0 , 2 2 9 ,
2 4 7 , 3 0 4 , 3 0 5 , 3 1 2 , 3 1 3 , 3 1 5 ,
3 2 2 , 3 4 9 , 3 5 1 , 3 5 2 , 3 5 3 , 4 3 7 及
4 3 8 顯示出 9 0 至 1 0 0 % 有效抵抗不同的單一及雙子
葉野草。

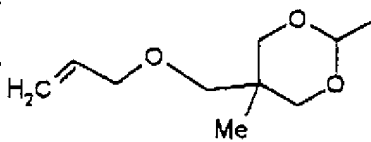
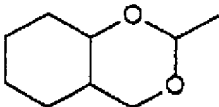
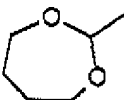
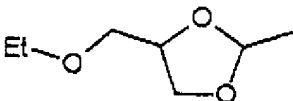
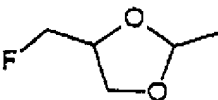
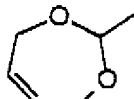
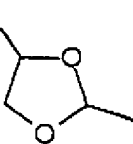
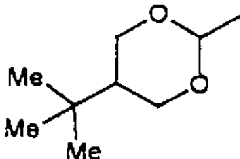
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

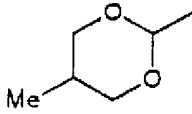
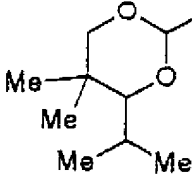
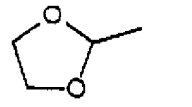
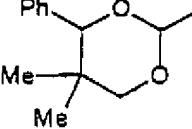
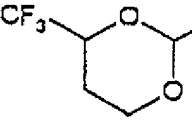
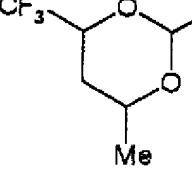
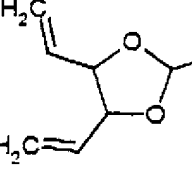
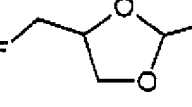
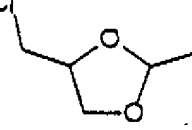
訂

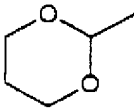
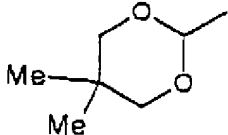
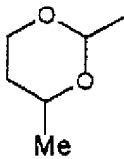
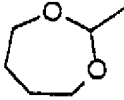
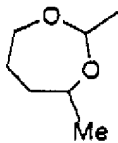
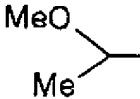
14

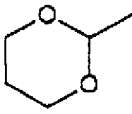
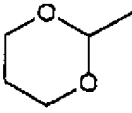
公告本

Enclosure: Supplemented data to Taiwan Patent Application No. 87119283

No.	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	¹ H-NMR
161	Me	0	Cl	CN		7.97 (s, 1H), 6.00-5.80 (m, 2H), 5.63 (s, 1H), 5.32-5.10 (m, 3H), 4.17-3.40 (m, 6H), 4.00 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 1.40-1.08 (m, 4H), 0.82 (mc, 3H)
182	Me	0	Cl	CN		7.98 (m, 1H), 6.15 (s, 1H), 4.22-3.80 (m, 3H), 4.00 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.95-1.05 (m, 8H)
186	Me	0	Cl	CN		7.96 (s, 1H), 5.95 (s, 1H), 4.00 (s, 3H), 3.95-3.60 (m, 4H), 2.02 (s, 3H), 1.93-1.63 (m, 4H)
196	Me	0	Cl	CN		8.03 (s, 1H), 6.04 (s, 1H), 4.41-3.80 (m, 3H), 4.05 (s, 3H), 3.53 (mc, 2H), 2.21 (s, 3H), 1.20 (t, 3H, J=7 Hz)
198	Me	0	Cl	CN		8.00 (s, 1H), 6.07 (s, 1H), 4.78-4.04 (m, 5H), 4.05 (s, 3H), 2.22 (s, 3H)
218	Me	0	Br	CN		7.98 (s, 1H), 6.08 (s, 1H), 5.70 (s, 2H), 4.45 (d, 2H, J=12Hz), 4.20 (d, 2H, J=12Hz), 4.00 (s, 3H), 2.16 (s, 3H)
227	Me	0	Br	CN		8.00 (s, 1H), 7.41-7.22 (m, 5H), 6.22 (s, 1H), 5.08 (m, 1H), 4.35 (m, 1H), 3.83 (m, 1H)
234	Me	1	Cl	CN		7.98 (s, 1H), 5.62 (s, 1H), 0.95 (s, 1H)

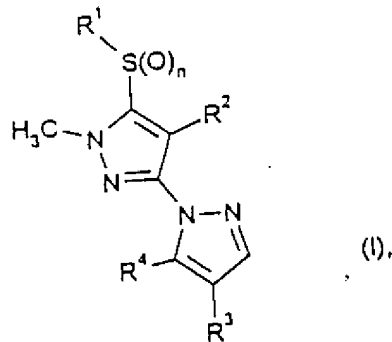
No.	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	¹ H-NMR
238	Me	1	Cl	CN		7.95 (s, 1H), 5.81 (s, 1H), 4.10 (s, 3H), 3.05 (s, 3H), 0.85 (d, 3H, J=7Hz)
240	Me	1	Cl	CN		7.98 (s, 1H), 5.78 (s, 1H), 4.10 (s, 3H), 3.74-3.38 (mc, 2H), 3.10-3.04 (mc, 1H), 3.05 (s, 3H), 3.03 (s, 3H)
246	Me	1	Cl	CN		7.98 (s, 1H), 6.09 (s, 1H), 4.10 (s, 3H), 4.08 (mc, 2H), 4.02 (mc, 2H)
261	Me	1	Cl	CN		8.02 (s, 1H), 7.40-7.18 (m, 5H), 5.98 (s, 1H), 4.65 (s, 1H), 4.19 (s, 3H), 0.90 (s, 3H), 0.85 (s, 3H)
262	Me	1	Cl	CN		8.00 (s, 1H), 5.95 (s, 1H), 4.48-4.32 (mc, 1H), 4.13-3.80 (m, 3H), 4.05 (s, 3H)
328	Me	2	Cl	CN		8.01 (s, 1H), 5.97 (s, 1H), 4.28-4.03 (m, 2H), 4.12 (s, 3H), 3.30 (s, 3H), 2.05-1.60 (m, 2H), 1.35 (d, J=7.5Hz, 3H)
343	Me	2	Cl	CN		8.03 (s, 1H), 6.07 (s, 1H), 6.00-5.72 (m, 2H), 5.44-5.20 (m, 2H), 4.63 (mc, 1H), 4.22 (mc, 1H), 4.23 (s, 3H), 3.30 (s, 3H)
346	Me	2	Cl	CN		8.00 (s, 1H), 6.10 (s, 1H), 4.80-4.02 (m, 5H), 4.22 (s, 3H), 2.18 (s, 3H)
355	Me	2	Br	CN		8.05 (s, 1H), 6.04 (s, 1H), 4.48-3.97 (m, 3H), 4.05 (s, 3H), 3.75-3.57 (m, 2H), 2.22 (s, 3H)

No.	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	¹ H-NMR
361	Me	2	Iod	CN		8.02 (s, 1H), 7.40-7.18 (m, 5H), 5.98 (s, 1H), 4.65 (s, 1H), 4.19 (s, 3H), 0.90 (s, 3H), 0.85 (s, 3H)
373	Me	0	Iod	CN		7.99 (s, 1H), 5.62 (s, 1H), 4.04 (s, 1H), 3.76-3.42 (m, 4H), 3.70 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.25 (s, 3H), 0.75 (s, 3H)
374	Me	0	Iod	CN		7.98 (s, 1H), 5.73 (s, 1H), 4.06 (s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.22 (d, 3H, J=7Hz)
377	Me	0	Iod	CN		7.97 (s, 1H), 5.95 (s, 1H), 4.12-3.50 (m, 4H), 2.20 (s, 3H)
379	Me	0	Iod	CN		7.96 (s, 1H), 5.97 (s, 1H), 4.04 (s, 3H), 1.08 (d, 3H, J=7.5Hz)
397	Me	2	Br	CN	CH=CHCO ₂ Bu	8.05 (s, 1H), 7.42 (d, J=17Hz), 7.04 (d, J=17Hz), 4.28 (s, 3H), 4.10 (m, 2H), 3.33 (s, 3H), 1.75-1.20 (m, 4H), 0.97 (t, 3H, J=7Hz)
400	Me	0	Br	CN	CH ₂ -CHClCO ₂ Et	7.99 (s, 1H), 4.70 (mc, 1H), 4.23 (q, 2H, J=7Hz), 3.99 (s, 3H), 3.62 (mc, 1H), 3.50 (mc, 1H), 2.22 (s, 3H), 1.26 (t, 3H, J=7Hz)
405	Me	2	Cl	CN		7.93 (s, 1H), 5.09 (q, 1H, J=6.5Hz), 4.20 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 3.25 (s, 3H), 1.61 (d, 3H, J=6.5Hz)
412	Me	0	Cl	NO ₂	-CHO	10.44 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 4.02 (s, 3H), 2.42 (s, 3H)

No.	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	¹ H-NMR
417	Me	0	Br	NO ₂		8.25 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 4.08 (s, 3H), 3.80-4.20 (m, 4H), 2.40 (s, 3H), 1.75-1.95 (m, 2H)
418	Me	2	Br	NO ₂		8.25 (s, 1H), 8.40 (s, 1H), 4.25 (s, 3H), 3.80-4.30 (m, 4H), 3.30 (s, 3H), 1.60-1.95 (m, 2H)

四、中文發明摘要 (發明之名稱: 經 1 - 甲基 - 5 - 烷磺醯基、1 - 甲基 - 5 - 烷亞磺醯基及 1 - 甲基 - 5 - 烷硫基取代之吡唑基吡唑、其製備方法及其作為除草劑上之用途)

經 1 - 甲基 - 5 - 烷磺醯基、1 - 甲基 - 5 - 烷亞磺醯基或 1 - 甲基 - 5 - 烷硫基取代之式 (I) 吡唑基吡唑



其中

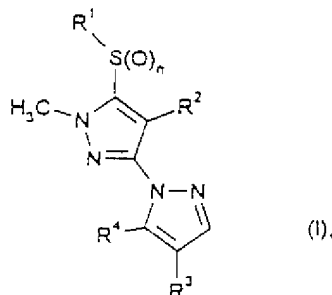
R^1 是 $C_1 - C_3$ - 烷基;

R^2 是鹵素或氰基;

英文發明摘要 (發明之名稱:)

1-Methyl-5-alkylsulfonyl-, 1-methyl-5-alkylsulfinyl- and 1-methyl-5-alkylthio-substituted pyrazolylpyrazoles, processes for their preparation and their use as herbicides

A 1-methyl-5-alkylsulfonyl-, 1-methyl-5-alkylsulfinyl- or 1-methyl-5-alkylthio-substituted pyrazolylpyrazole of the formula (I)



in which

R^1 is $C_1 - C_3$ -alkyl;

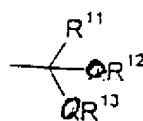
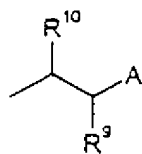
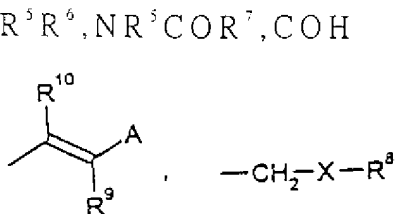
R^2 is halogen or cyano;

四、中文發明摘要(發明之名稱:)

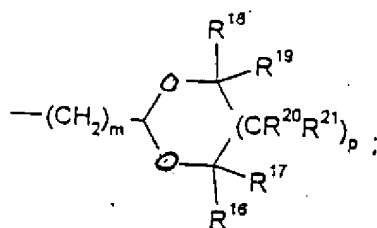
R^3 是氰基、硝基或硫代氨基甲酰基;

R^4 是鹵素、未經取代或經一個經基、鹵素原子或 C_1 - C_6 - 烷氧基取代之 C_1 - C_6 - 烷基或是下列一基團:

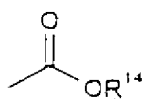
NR^5R^6, NR^5COR^7, COH



及



A 是

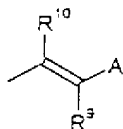
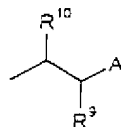


英文發明摘要(發明之名稱:)

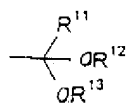
R^3 is cyano, nitro or thiocarbamoyl;

R^4 is halogen, C_1 - C_6 -alkyl which is unsubstituted or substituted by one hydroxyl, halogen atom or C_1 - C_6 -alkyloxy, or is one of the groups

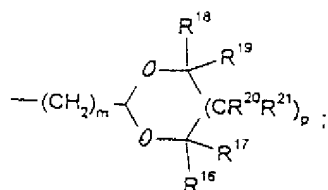
$NR^5R^6, NR^5COR^7, COR^{14},$



$-CH_2-X-R^8$



and



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

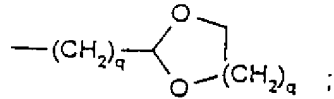
訂

線

四、中文發明摘要 (發明之名稱:)

R^5 是氫、 C_1-C_6 -烷基或 C_2-C_6 -炔基;

R^6 是 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_8 -環烷基或 C_2-C_6 -炔基，其中該烷基是任意地經二-(C_1-C_4 -烷氧基)- C_1-C_3 -烷基、四氫呋喃基或下面基團取代;



R^7 是 C_1-C_4 -烷基;

R^8 是 C_1-C_6 -烷基，其碳鏈可被一個氧原子打斷

;

R^9 是氫、鹵素;

R^{10} 是氫;

R^{11} 是氫;

R^{12} 是 C_1-C_6 -烷基，其碳鏈可被一個氧原子打斷

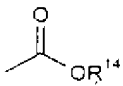
;

R^{13} 是 C_1-C_6 -烷基，其碳鏈可被一個氧原子打斷

;

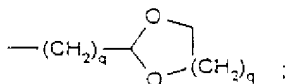
英文發明摘要 (發明之名稱:)

A is



R^5 is hydrogen, C_1-C_6 -alkyl or C_2-C_6 -alkynyl;

R^6 is C_1-C_6 -alkyl, C_3-C_8 -cycloalkyl or C_1-C_6 -alkynyl, where said alkyl is optionally substituted by di-(C_1-C_4 -alkoxy)- C_1-C_3 -alkyl, tetrahydrofuranyl or the group



R^7 is C_1-C_4 -alkyl;

R^8 is C_1-C_6 -alkyl whose carbon chain may be interrupted by one oxygen atom;

R^9 is hydrogen, halogen;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

四、中文發明摘要(發明之名稱：

R^{11} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基；

R^{16} 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} 、 R^{20} 及 R^{21} 分別為氫、碳鏈可被一個氧原子打斷之 $C_1 - C_6$ - 烷、碳鏈可被一個氧原子打斷之 $C_2 - C_6$ - 烯基、苯基、三氟甲基，或是兩個基一起形成一個鍵或 3 -、5 - 或 6 - 圓飽和環，其中該烷基為未經取代或經 1 或多個鹵原子取代。

X 是氧或硫；

m 是 0，1 或 2；

n 是 0，1 或 2；

p 是 0，1 或 2 及

q 是 1 或 2。

英文發明摘要(發明之名稱：

R^{10} is hydrogen;

R^{11} is hydrogen;

R^{12} is $C_1 - C_6$ -alkyl whose carbon chain may be interrupted by one oxygen atom;

R^{13} is $C_1 - C_6$ -alkyl whose carbon chain may be interrupted by one oxygen atom;

R^{14} is $C_1 - C_6$ -alkyl;

R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^{20} and R^{21} independently of one another are hydrogen, $C_1 - C_6$ -alkyl whose carbon chain may be interrupted by one oxygen atom, $C_2 - C_6$ -alkenyl whose carbon chain may be interrupted by one oxygen atom, phenyl, trifluoromethyl or two of these radicals together form a bond or a 3-, 5- or 6-membered saturated ring;

wherein said alkyl is unsubstituted or substituted by one or more halogen.

X is oxygen or sulfur;

m is 0, 1 or 2;

n is 0, 1 or 2;

p is 0, 1 or 2 and

q is 1 or 2.

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

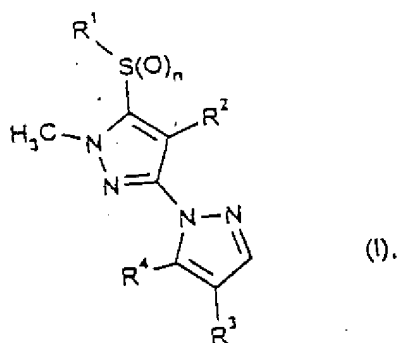
六、申請專利範圍

附件一A: 第 8 7 1 1 9 2 8 3 號專利申請案

中文申請專利範圍修正本

民國 9 0 年 4 月修正

1. 一種經 1 - 甲基 - 5 - 烷磺醯基、1 - 甲基 - 5 - 烷亞磺醯基或 1 - 甲基 - 5 - 烷硫基取代之式 (I) 吡啶基吡啶，



其中

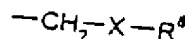
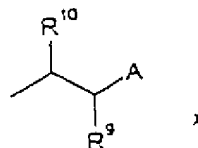
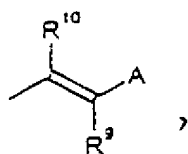
R^1 是 $C_1 - C_3$ - 烷基；

R^2 是鹵素或氰基；

R^3 是氰基、硝基或硫代氨基甲醯基；

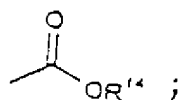
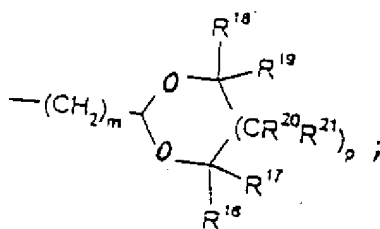
R^4 是鹵素、未經取代或經一個羥基、鹵素原子或 $C_1 - C_6$ - 烷氧基取代之 $C_1 - C_6$ - 烷基或是下列一基團：

$NR^5R^6, NR^5COR^7, COH,$

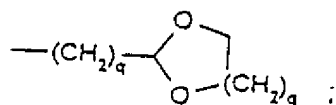


$$\begin{array}{c} \text{R}^{11} \\ \diagup \\ \text{---} \text{C} \text{---} \text{OR}^{12} \\ \diagdown \\ \text{OR}^{13} \end{array}$$

反



R⁶ 是 C₁ - C₆ - 烷基、C₃ - C₈ - 環烷基或 C₂ - 炔基，其中該烷基是任意地經二 - (C₁ - C₄ - 烷基) - C₁ - C₃ - 烷基、四氫呋喃基或下面基團取代：



R^8 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被一個氧原子打斷

$R^{1,2}$ 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被一個氧原子打斷

R^{1,2} 是 C₁ - C₆ - 烷基；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

言

復

六、申請專利範圍

R^{16} 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} 、 R^{20} 及 R^{21} 分別為氫、碳鏈可被一個氧原子打斷之 $C_1 - C_6$ -烷基、碳鏈可被一個氧原子打斷之 $C_2 - C_6$ -烯基、苯基、三氟甲基，或是兩個基一起形成一個鍵或 3-、5-或 6-元飽和環，其中該烷基為未經取代或經 1 或多個鹵原子取代；

X 是氧或硫；

m 是 0、1 或 2；

n 是 0、1 或 2；

p 是 0、1 或 2 及

q 是 1 或 2。

2. 如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 吡啶基吡啶，其中

R^1 是 $C_1 - C_3$ -烷基及

R^2 是溴、氯、氟或氰基。

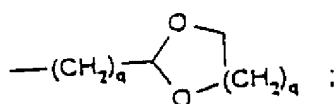
3. 如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 吡啶基吡啶，其中

R^1 是 $C_1 - C_3$ -烷基；

R^2 是溴、氯或氰基；

R^3 是氫、 $C_1 - C_6$ -烷基；

R^6 是 $C_1 - C_6$ -烷基、 $C_3 - C_6$ -環烷基或 $C_2 - C_4$ -炔基，其中該烷基是任意地經二- ($C_1 - C_4$ -烷氧基) - $C_1 - C_3$ -烷基、四氫呋喃基或下面基團取代：



六、申請專利範圍

R^7 是 $C_1 - C_4$ - 烷基；

R^8 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被一個氧原子打斷

；

R^{12} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被一個氧原子打斷

；

R^{13} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被一個氧原子打斷

；

R^{14} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基；

n 是 1 或 2。

4. 如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 吡啶基吡啶，其中

R^1 是 $C_1 - C_3$ - 烷基；

R^8 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被氧原子打斷；

R^{12} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被氧原子打斷；

R^{13} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基，其碳鏈可被氧原子打斷；

n 是 2。

5. 如申請專利範圍第 1 或 2 項之式 (I) 吡啶基吡啶，其中

R^1 是甲基、乙基、丙基或異丙基；

R^3 是氰或硝基及

R^4 是未經取代或經一個羥基、鹵原子、 $C_1 - C_6$ - 烷氧基取代之 $C_1 - C_6$ - 烷基或是下列一基團

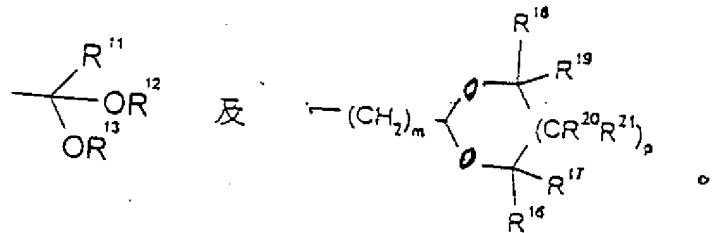
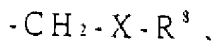
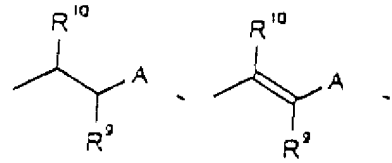
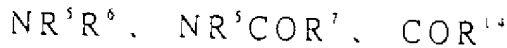
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

六、申請專利範圍

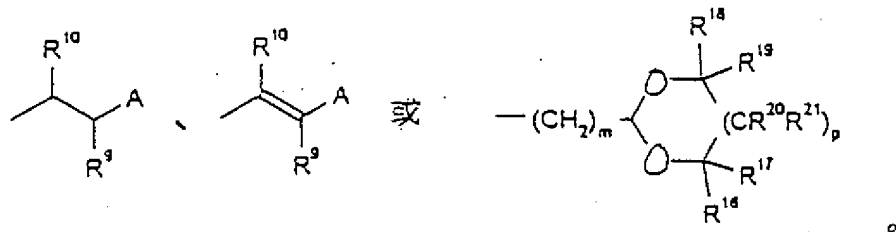


6. 如申請專利範圍第 1 或 2 項之式 (I) 吡啶基吡啶，其中

R^1 是甲基；

R^2 是氯或溴及

R^4 是下列一基團



7. 一種除草劑組成物，其包括至少一種如申請專利範圍第 1 或 2 項之式 (I) 吡啶基吡啶。

8. 如申請專利範圍第 7 項之除草劑組成物，其為與配方輔劑之混合物。

9. 一種控制不想要植物的方法，其包括應用有效量的至少一種如申請專利範圍第 1 或 2 項之式 (I) 吡啶基吡啶在植物上或不想要植物生長的地方。

10. 如申請專利範圍第 1 或 2 項之式 (I) 吡啶基吡啶，係用於控制不想要的植物。

六、申請專利範圍

1 1 . 如申請專利範圍第 1 0 項之式 (I) 吡啉基吡啉，其被用在有用的農作物上以控制不想要的植物。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

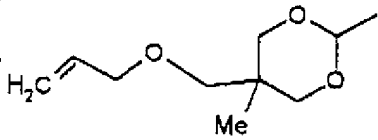
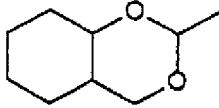
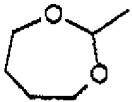
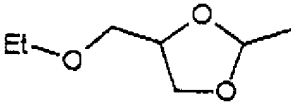
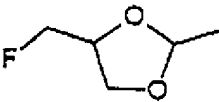
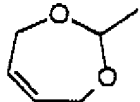
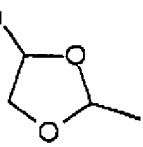
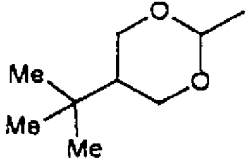
裝

訂

頁

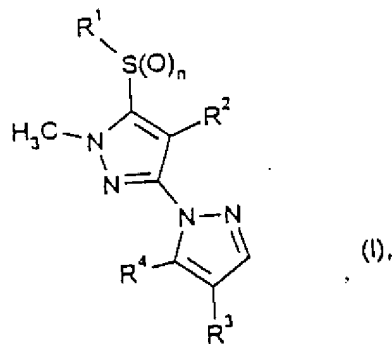
公告本

Enclosure: Supplemented data to Taiwan Patent Application No. 87119283

No.	R ¹	n	R ²	R ³	R ⁴	¹ H-NMR
161	Me	0	Cl	CN		7.97 (s, 1H), 6.00-5.80 (m, 2H), 5.63 (s, 1H), 5.32-5.10 (m, 3H), 4.17-3.40 (m, 6H), 4.00 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 1.40-1.08 (m, 4H), 0.82 (mc, 3H)
182	Me	0	Cl	CN		7.98 (m, 1H), 6.15 (s, 1H), 4.22-3.80 (m, 3H), 4.00 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.95-1.05 (m, 8H)
186	Me	0	Cl	CN		7.96 (s, 1H), 5.95 (s, 1H), 4.00 (s, 3H), 3.95-3.60 (m, 4H), 2.02 (s, 3H), 1.93-1.63 (m, 4H)
196	Me	0	Cl	CN		8.03 (s, 1H), 6.04 (s, 1H), 4.41-3.80 (m, 3H), 4.05 (s, 3H), 3.53 (mc, 2H), 2.21 (s, 3H), 1.20 (t, 3H, J=7 Hz)
198	Me	0	Cl	CN		8.00 (s, 1H), 6.07 (s, 1H), 4.78-4.04 (m, 5H), 4.05 (s, 3H), 2.22 (s, 3H)
218	Me	0	Br	CN		7.98 (s, 1H), 6.08 (s, 1H), 5.70 (s, 2H), 4.45 (d, 2H, J=12Hz), 4.20 (d, 2H, J=12Hz), 4.00 (s, 3H), 2.16 (s, 3H)
227	Me	0	Br	CN		8.00 (s, 1H), 7.41-7.22 (m, 5H), 6.22 (s, 1H), 5.08 (m, 1H), 4.35 (m, 1H), 3.83 (m, 1H)
234	Me	1	Cl	CN		7.98 (s, 1H), 5.62 (s, 1H), 0.95 (s, 1H)

四、中文發明摘要(發明之名稱: 經 1 - 甲基 - 5 - 烷磺醯基、1 - 甲基 - 5 - 烷亞磺醯基及 1 - 甲基 - 5 - 烷硫基取代之吡唑基吡唑、其製備方法及其作為除草劑上之用途)

經 1 - 甲基 - 5 - 烷磺醯基、1 - 甲基 - 5 - 烷亞磺醯基或 1 - 甲基 - 5 - 烷硫基取代之式 (I) 吡唑基吡唑



其中

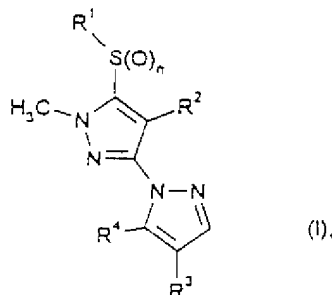
R^1 是 $C_1 - C_3$ - 烷基;

R^2 是鹵素或氰基;

英文發明摘要(發明之名稱:)

1-Methyl-5-alkylsulfonyl-, 1-methyl-5-alkylsulfinyl- and 1-methyl-5-alkylthio-substituted pyrazolylpyrazoles, processes for their preparation and their use as herbicides

A 1-methyl-5-alkylsulfonyl-, 1-methyl-5-alkylsulfinyl- or 1-methyl-5-alkylthio-substituted pyrazolylpyrazole of the formula (I)



in which

R^1 is $C_1 - C_3$ -alkyl;

R^2 is halogen or cyano;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

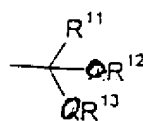
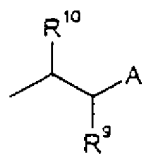
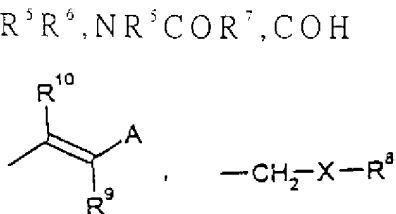
線

四、中文發明摘要(發明之名稱:)

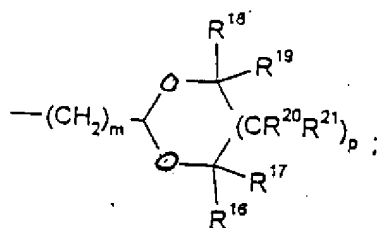
R^3 是氰基、硝基或硫代氨基甲酰基;

R^4 是鹵素、未經取代或經一個經基、鹵素原子或 C_1 - C_6 - 烷氧基取代之 C_1 - C_6 - 烷基或是下列一基團:

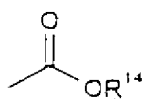
NR^5R^6, NR^5COR^7, COH



及



A 是

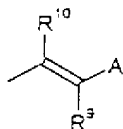
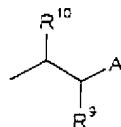


英文發明摘要(發明之名稱:)

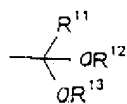
R^3 is cyano, nitro or thiocarbamoyl;

R^4 is halogen, C_1 - C_6 -alkyl which is unsubstituted or substituted by one hydroxyl, halogen atom or C_1 - C_6 -alkyloxy, or is one of the groups

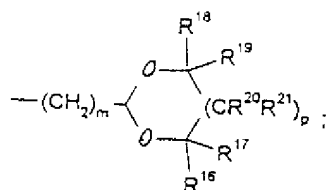
$NR^5R^6, NR^5COR^7, COR^{14},$



$-CH_2-X-R^8$



and



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

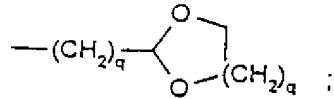
訂

線

四、中文發明摘要 (發明之名稱:)

R^5 是氫、 $C_1 - C_6$ -烷基或 $C_2 - C_6$ -炔基;

R^6 是 $C_1 - C_6$ -烷基、 $C_3 - C_8$ -環烷基或 $C_2 - C_6$ -炔基，其中該烷基是任意地經二-($C_1 - C_4$ -烷氧基)- $C_1 - C_3$ -烷基、四氫呋喃基或下面基團取代;



R^7 是 $C_1 - C_4$ -烷基;

R^8 是 $C_1 - C_6$ -烷基，其碳鏈可被一個氧原子打斷

;

R^9 是氫、鹵素;

R^{10} 是氫;

R^{11} 是氫;

R^{12} 是 $C_1 - C_6$ -烷基，其碳鏈可被一個氧原子打斷

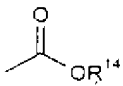
;

R^{13} 是 $C_1 - C_6$ -烷基，其碳鏈可被一個氧原子打斷

;

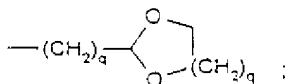
英文發明摘要 (發明之名稱:)

A is



R^5 is hydrogen, $C_1 - C_6$ -alkyl or $C_2 - C_6$ -alkynyl;

R^6 is $C_1 - C_6$ -alkyl, $C_3 - C_8$ -cycloalkyl or $C_1 - C_6$ -alkynyl, where said alkyl is optionally substituted by di-($C_1 - C_4$ -alkoxy)- $C_1 - C_3$ -alkyl, tetrahydrofuranyl or the group



R^7 is $C_1 - C_4$ -alkyl;

R^8 is $C_1 - C_6$ -alkyl whose carbon chain may be interrupted by one oxygen atom;

R^9 is hydrogen, halogen;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

四、中文發明摘要(發明之名稱:)

R^{11} 是 $C_1 - C_6$ - 烷基;

R^{16} 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} 、 R^{20} 及 R^{21} 分別為氫、碳鏈可被一個氧原子打斷之 $C_1 - C_6$ - 烷、碳鏈可被一個氧原子打斷之 $C_2 - C_6$ - 烯基、苯基、三氟甲基，或是兩個基一起形成一個鍵或 3 -、5 - 或 6 - 圓飽和環，其中該烷基為未經取代或經 1 或多個鹵原子取代。

X 是氧或硫;

m 是 0, 1 或 2;

n 是 0, 1 或 2;

p 是 0, 1 或 2 及

q 是 1 或 2。

英文發明摘要(發明之名稱:)

R^{10} is hydrogen;

R^{11} is hydrogen;

R^{12} is $C_1 - C_6$ -alkyl whose carbon chain may be interrupted by one oxygen atom;

R^{13} is $C_1 - C_6$ -alkyl whose carbon chain may be interrupted by one oxygen atom;

R^{14} is $C_1 - C_6$ -alkyl;

R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^{20} and R^{21} independently of one another are hydrogen, $C_1 - C_6$ -alkyl whose carbon chain may be interrupted by one oxygen atom, $C_2 - C_6$ -alkenyl whose carbon chain may be interrupted by one oxygen atom, phenyl, trifluoromethyl or two of these radicals together form a bond or a 3-, 5- or 6-membered saturated ring;

wherein said alkyl is unsubstituted or substituted by one or more halogen.

X is oxygen or sulfur;

m is 0, 1 or 2;

n is 0, 1 or 2;

p is 0, 1 or 2 and

q is 1 or 2.

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

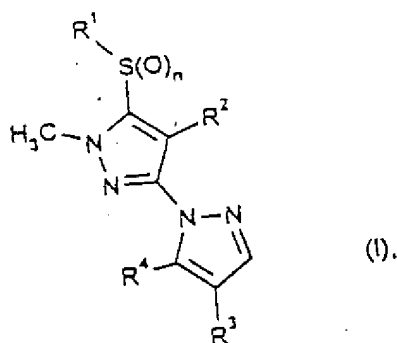
六、申請專利範圍

附件一A: 第 8 7 1 1 9 2 8 3 號專利申請案

中文申請專利範圍修正本

民國 9 0 年 4 月修正

1. 一種經 1 - 甲基 - 5 - 烷磺醯基、1 - 甲基 - 5 - 烷亞磺醯基或 1 - 甲基 - 5 - 烷硫基取代之式 (I) 吡啶基吡啶，



其中

R^1 是 $C_1 - C_3$ - 烷基；

R^2 是鹵素或氰基；

R^3 是氰基、硝基或硫代氨基甲醯基；

R^4 是鹵素、未經取代或經一個羥基、鹵素原子或 $C_1 - C_6$ - 烷氧基取代之 $C_1 - C_6$ - 烷基或是下列一基團：

$NR^5R^6, NR^5COR^7, COH,$

