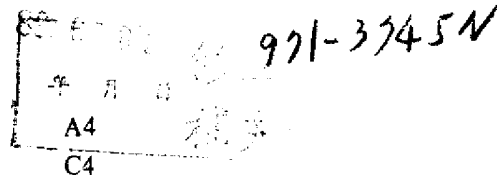


415830

申請日期	86.4.8
案 號	86104446
類 別	A1133/6, C11C28/62



(以上各欄由本局填註)

發 明 專 利 說 明 書

415830

一、發明 名稱	中 文	α -烷氧亞胺苄基衍生物及以其為有效成分之農藥 (89年6月1日修正)
	英 文	ALKOXYIMINO BENZYL DERIVATIVES AND PESTICIDES CONTAINING THE SAME AS ACTIVE INGREDIENT
二、發明 創作人	姓 名	1.甲斐浩幸 2.榊井盛泰
	國 籍	1.日本 2.日本
	住、居所	1.奈良縣大和郡山市高田町 32-11 2.三重縣四日市市櫻花台 1 丁目 21 番地の 3
三、申請人	姓 名 (名稱)	鹽野義製藥股份有限公司 (鹽野義製藥株式會社)
	國 籍	日本
	住、居所 (事務所)	大阪府大阪市中心區道修町 3 丁目 1 番 8 號
	代 表 人 名 姓	鹽野芳彦 (鹽野芳彦)

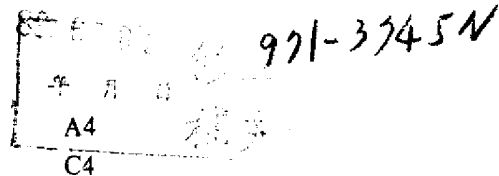
裝

訂

線

415830

申請日期	86.4.8
案 號	86104446
類 別	A1133/6, C11C28/62



(以上各欄由本局填註)

發 明 專 利 說 明 書

415830

一、發明 名稱	中 文	α -烷氧亞胺苄基衍生物及以其為有效成分之農藥 (89年6月1日修正)
	英 文	ALKOXYIMINO BENZYL DERIVATIVES AND PESTICIDES CONTAINING THE SAME AS ACTIVE INGREDIENT
二、發明 創作人	姓 名	1.甲斐浩幸 2.榊井盛泰
	國 籍	1.日本 2.日本
	住、居所	1.奈良縣大和郡山市高田町 32-11 2.三重縣四日市市櫻花台 1 丁目 21 番地の 3
三、申請人	姓 名 (名稱)	鹽野義製藥股份有限公司 (鹽野義製藥株式會社)
	國 籍	日本
	住、居所 (事務所)	大阪府大阪市中心區道修町 3 丁目 1 番 8 號
	代 表 人 名 姓	鹽野芳彦 (鹽野芳彦)

裝

訂

線

415830

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大類：
IPC分類：

A6

B6

本案已向：

日本國(地區) 申請專利，申請日期： 案號： ，☒有 ☐無主張優先權
1996年 4月 11日 特願平 8-89118號(主張優先權)

有關微生物已寄存於：

，寄存日期：

，寄存號碼：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明(1)

技術領域

本發明係關於一種新穎 α -烷氧亞胺苄基衍生物及其做為有效成分之農藥。

技術背景

關於 α -烷氧亞胺苄基衍生物，迄今已知具有殺蟲作用之苯並呋喃基唑衍生物（特開平1-308260號，特開平5-1046號，特開平5-331011號，特開平5-331012號，特開平6-41086號，特開平6-145151號、特開平6-345738號，特開平7-173155號，W092/09581號），具有殺蟲作用之呋衍生物（特開平3-68559號），具有殺菌，殺黴菌作用之1-唑基取代之呋醚類（特開昭60-87269號），具有殺菌作用之噁唑基與噁唑二唑基衍生物（W094/22844號），具有除草及殺菌作用之嘧啶衍生物（特開平6-49039號，特開平7-48359號，W094/08975號，具有殺菌，除草以及生長調整作用之苯醛呋衍生物（特開平7-70081號）以具有殺菌作用之呋衍生物（W095/26956號）。

惟以上之諸發明案未有具體揭示在 α -烷氧亞胺苄基之正取代基中與本案類似取代基之化合物。

發明之揭示

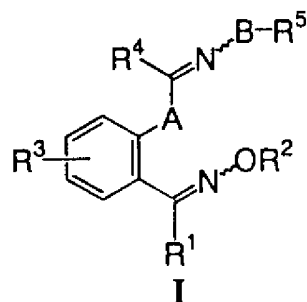
本發明之目的旨在於提供一種具有優異殺菌作用等有用性之化合物。

本發明者為能達成以上目的經由潛心研究結果，發現以下所說明之具有優異殺菌作用之 α -烷氧亞胺苄基

五、發明說明(2)

衍生物，進而完成本發明。

亦即本發明係關於一種以一般式(I)



[式中， R^1 為可被取代之雜環基，CHO或 CH_2OR^6 (R^6 為氫原子，烷基，鏈烯基，烷醯基，烷氧羰基或烷氧烷基)； R^2 為烷基， R^3 為氫原子，烷基，烷氧基，鹵素原子，硝基，氨基或氫化烷基； R^4 為氫原子，烷基，環烷基，烷氧烷基，烷氧羰基，氨基，鹵化烷基，可被取代之芳基或可被取代之雜環基； R^5 為氫，可被取代之烷基，環烷基，鏈烯基，炔基，烷醯基，芳醯基，烷氧羰基，可被取代之芳基或可被取代之雜環基；A 為 (1) $-CH_2ON=C(R^7)-$ [R^7 為氫原子，烷基，鹵化烷基，氨基，烷硫基或環烷基。]，(2) $-CH_2N(R^8)-N=C(R^7)-$ [R^8 為氫原子，烷基或烷醯基， R^7 同上述意義。] (3) $-CH=NOC(R^9)(R^{10})-$ [R^9 與 R^{10} 各自獨立代表氫原子，烷基，氨基或鹵化烷基。] 或 (4) $-CH=NN=C(R^7)-$ [R^7 同上述意義。]；B 為氧原子或 NR^{11} (R^{11} 為氫原子，烷基，苯基或烷醯基)；；波線(～)為 E 體，Z 體或為其任何一種基所配置而成之混合物。] 所代表之化合物。

在說明書中所用「低級」之用辭，並無特別之限制，

五、發明說明(3)

係表碳原子為1~8個，宜以碳原子數為1~6個，而最好以碳原子數為1~4個之基。

以R¹所代表可被取代之雜環基為，除非取代之雜環基外，尚含有取代雜環基。此等雜環基例如包括有，在環內含有選自氮，硫，氧原子之1~4個雜原子之5~7員雜環基，具體而言，包括吡啶基（如吡啶-2-基，吡啶-3-基等），噻啶基（如噻啶-2-基，噻啶-4-基等），異噁唑基（如異噁唑-3-基，異噁唑-4-基，異噁唑-5-基），異噁唑烷基（如2-異噁唑烷-3-基，2-異噁唑烷-5-基等），異噻唑基（如異噻唑-5-基等），噻二唑基〔例如，1,3,4-噻二唑基（如1,3,4-噻二唑-2-基等），1,2,3-噻二唑基等〕，噻嗪基（如噻嗪-2-基等），吡唑基（如吡唑-1-基，吡唑-5-基等），呋喃基（如呋喃-2-基等），噻吩基（如噻吩-2-基等），咪唑基（如咪唑-1-基，咪唑-2-基等），噁唑基（如噁唑-2-基，噁唑-5-基等），噻唑基（如噻唑-2-基等），噻二唑基（如噻二唑-2-基等），噁二唑基〔例如，1,3,4-噁二唑基（如1,3,4-噁二唑-2-基等），1,2,4-噁二唑等〕，三唑基〔例如1,2,4-三唑基（如1H-1,2,4-三唑-1-基，4H-1,2,4-三唑-4-基，1,2,4-三唑-5基）等〕，或吡嗪基等。

此等雜環基可形成碳環或其他之雜環與縮合環。該縮合環，例如包括有，苯噁唑基（如苯噁唑-2-基等），苯噻唑基（如苯噻唑-2-基等），苯異噁唑基（如苯異噁唑-3-基等），四甲撐異噁唑基（如3,4-四甲撐異噁

五、發明說明(4)

唑-5-基，4,5-四甲撐異噁唑-3-基)等。

此等雜環及縮合環，其連結鍵可在任何位置上面。

R^1 所代表取代雜環基之取代基，例如為，低烷基(如甲基，乙基，丙基，丁基等)，低鏈烯基(如乙烯基，烯丙基，2-丁烯等)，低炔基(如乙炔，2-丙炔，3-丁炔等)，環烷基(如環丙基，環戊基，環己基等)，環烯基(如環戊烯，環己烯等)，鹵化低烷基(如三氟甲基，三氯甲基，二氟甲基，氫甲基，2-溴乙基，1,2-二氯丙基等)，鹵素原子(如，氟，氯，溴，碘原子)，硝基，氰基，低烷硫基(如甲硫基，乙硫基，丙硫基等)， $-OR^{12}$ [式中 R^{12} 為氫原子，低烷基(如甲基，乙基，丙基等)，低鏈烯基(如乙烯基，烯丙基，2-丁烯基等)，低炔基(如乙炔，2-丙炔，3-丁炔等)]，低烷磺基(如甲磺基等)，苯基，苯低烷基(如苄基，苯乙基等)，苯(低級)鏈烯基(如苯乙烯，肉桂基等)。其中，以低烷基或鹵化低烷基為佳，而最好者為甲基。

此等取代基，可在該雜環基可供取代之任何位置予以取代，其數目為1~3個。

由 R^6 所代表之烷基，例如碳原子數為1~6個，宜為1~4個烷基，具體而言，包括有甲基，乙基，丙基，異丙基，丁基，異丁基，第二丁基，第三丁基等。其中以甲基者為佳。

由 R^6 所代表之鏈烯基，例如其碳原子數為2~6個，宜為2~4個碳原子之鏈烯基，具體而言，包括有1-丙烯

五、發明說明(5)

基，異丙烯基，烯丙基，2-丁烯基等。其中，以烯丙基為佳。

由 R^6 所代表之烷醯基，例如具有1~6個碳原子數，宜為1~4個碳原子數烷基之烷醯基，具體而言，例如包括有乙醯基，三氟乙醯基，丙醯基，丁醯基等。其中以乙醯基為佳。

由 R^6 所代表之烷氧羰基，例如具有~6個碳原子數，宜為1~4個烷基之烷氧羰基，具體而言，例如包括有甲氧羰基，乙氧羰基，丙氧羰基等。其中，以甲氧羰基為佳。

由 R^6 所表示之烷氧烷基，例如碳原子數為2~8個，宜為2~5個之烷氧烷基，具體而言，例如包有有甲氧甲基，甲氧乙基，丙氧甲基，丙氧乙基等。其中最好為甲氧甲基，乙氧甲基。

R^1 最好為，彼此可被取代之異噁唑-3-基，異噁唑-4-基，異噁唑-5-基，2-異噁唑烷-3-基，2-異噁唑烷-5-基，咪唑-1-基，咪唑-2-基，1,3,4-噁二唑-2-基，呋喃-2-基，1,2,4-噁二唑-3-基，1H-1,2,4-三唑-1-基，噻唑烷-2-基，噁唑-5-基，CHO或 CH_2OR^6 。

最好之 R^1 為咪唑-1-基，1-甲基咪唑-2-基，異噁唑-3-基，3-甲基異噁唑-5-基，5-甲基異噁唑-3-基，2-異噁唑烷-3-基，1,3,4-噁二唑-2-基，CHO， CH_2OH 或 CH_2OCH_3 。

由 R^2 所代表之烷基，包括以上 R^6 所代表烷基所例示

五、發明說明.(6)

者相同。其中，以甲基者為佳。

由 R^3 所代表之烷基，包括以上 R^6 所示烷基例示者相同。

由 R^3 所代表之烷氧基，例如包括有，碳原子數為 1~6 個，宜為 1~4 個之烷氧基，具體而言，為甲氧基，乙氧基，丙氧基，異丙氧基，丁氧基，異丁氧基，第二丁氧基，第三丁氧基等。

由 R^3 所代表之鹵素原子，包括有氟，氯，溴，碘原子。

R^3 所代表之鹵化烷基，例如碳原子數 1~6 個，宜為 1~4 個之烷基，具體而言，包括有甲基，乙基，丙基，異丙基，丁基等烷基至少由 1 個鹵素原子（例如氟，氯，溴，碘原子）予以取代者。例如二氟甲基，三氟甲基，三氯甲基，1,2-二氯丙基等。

R^3 最好為氫原子。

R^4 所代表之烷基，包括相同於以上 R^6 所示烷基之例示者。

而 R^4 所代表之環烷基，例如包括有，碳原子數 3~8 個，宜為 3~6 個之環烷基。具體而言，包括環丙基，環戊基，環己基等。

由 R^4 所代表之烷氧烷基，包括以上 R^6 所代表烷氧烷基例示者相同。

由 R^4 所代表之烷氧羰基，包括以上 R^6 所示烷氧羰基例示者相同。

五、發明說明(7)

由 R^4 所代表鹵化烷基，包括以上 R^3 所示鹵化烷基例示者相同。

由 R^4 所代表之可被取代芳基之芳基為，碳原子數 6~14 個之芳基，例如苯基，萘基（如 1-萘基，2-萘基）等。

由 R^4 所示可被取代之雜環基，除非取代之雜環基外，尚含有取代之雜環基。此等雜環基，例如包括，選自氮，硫及氧在環內含有 1~4 個雜原子之 5~7 員雜環基，具體而言，有吡啶基（如吡啶-2-基，吡啶-3-基，吡啶-4-基），噻啶基（如噻啶-2-基，噻啶-4-基，噻啶-5-基），異噁唑基（如異噁唑-3-基，異噁唑-5-基等），噻二唑基（如 1,3,4-噻二唑-2-基，1,2,3-噻二唑等），噻嗪基（如噻嗪-3-基等），吡咯基，吡唑基，呋喃基（如呋喃-2-基，呋喃-3-基），噻吩基（如噻吩-2-基，噻吩-3-基），咪唑基，噁唑基，噻唑基（如以噻唑-2-基等），噻二唑基（如 1,3,4-噻二唑-2-基，1,2,4-噻二唑-5-基等），吡喃基，噻啉基（如噻啉-2-基等）或吡嗪基等。此等雜環基，亦可形成碳環或其他之雜環與縮合環。

由 R^4 所表示之取代芳基以及取代雜環基的取代基，包括以上 R^1 所示取代雜環基之取代基所例示者相同。其中以鹵素原子，低烷基，鹵化低烷基，低烷氧基及低烷硫基為佳。此等取代基可在該雜環基之可以被取代之任何位置予以取代，其數目為 1~3 個。

R^4 宜為氫原子，甲基，乙基，甲氧羰基，乙氧羰基，

五、發明說明(8)

氟基或可被取代之苯基。

由 R^5 所示可被取代烷基之烷基，例如包括前述 R^6 所例示之相同烷基者。該烷基被取代時之取代基，例如為，氟基，鹵素原子（如氟，氯，溴，碘原子），環烷基（如環丙基，環丁基，環戊基，環己基等），烷氧基（如甲氧基，乙氧基，丙氧基，丁氧基等），烷氧羰基（如甲氧羰基，乙氧羰基，丙氧羰基等），可被取代之芳基（如 1-萘基，2-萘基，苯基等），可被取代之雜環基（如前述由 R^4 所示可被取代雜環基所例示之相同基）或可被取代之氨基甲鹽基〔例如，無取代，單取代以及雙取代氨基甲鹽。此取代基包括上述 R^1 所示取代雜環基之取代基所例示者相同。如為雙取代之氨基甲鹽時，彼此之取代基係相同或各異，或為 2 個取代基結合形成為單環或多環。單環或多環係含有 2 個取代基所結合之氮原子同時形成為雜原子（如氧，氮，硫等）之 4~8 員環，亦可為該環與其他之環形成為縮合環。該環之具體例包括有，吡咯烷基，哌啶基，嗎啉基，硫代嗎啉基，哌嗪基，六甲撐亞胺，四氫哇啉基，四氫異哇啉基等。該環之取代基，與前述由 R^1 所示取代雜環基之取代基所例示者相同〕等。

由 R^5 所示之環烷基，則包括前述 R^4 所示環烷基中例示者相同。

由 R^5 所示之鏈烯基，則包括前述 R^6 所示鏈烯基中例示者相同。

五、發明說明(9)

由 R^5 所示之炔基，例如，碳原子數 3~6 個，宜為 3~4 個之炔基，具體而言，包括有 2-丙炔基，3-丁炔基等。

由 R^5 所示之烷醯基，則包括前述由 R^6 所示烷醯基中例示者相同。

R^5 所示之芳醯基，例如為碳原子數 7~15 個之芳醯基，具體而言，例如包括有苯醯基，萘醯基等。

由 R^5 所示之烷氧羰基，係包括前述 R^6 所示烷氧羰基中例示者相同。

由 R^5 所示之可取代芳基，則包括前述 R^4 所示可取代之芳基中例示者相同。

由 R^5 所示之可被取代之雜環基，包括前述 R^4 所示可被取代雜環基中例示者相同。

R^5 宜為氫原子，甲基，乙基，丙基，異丙基，丁基，烯丙基，2-丙烯基，甲氧甲基，乙氧甲基，乙醯基，甲氧羰基，乙氧羰基或為可被取代之苄基。

由 $R^7 \sim R^{10}$ 所示之烷基，包括前述 R^6 所示烷基中例示者相同。

R^7, R^9, R^{10} 所示之鹵化烷基，包括前述 R^3 所示鹵化烷基中例示者相同。

由 R^7 所示烷硫基，包括具有碳原子數 1~6 個，最好為 1~3 個烷基，具體而言，為甲硫基，乙硫基，丙硫基等。

由 R^7 所示之環烷基，包括前述 R^4 所示環烷基中例示者相同。

五、發明說明(10)

R^6 所示之烷醯基，包括前述 R^6 所示烷醯基中例示者相同。

A 之較佳具體例，包括有 $-CH_2 ON=C(CH_3)-$ ，
 $-CH_2 ON=C(C_2H_5)-$ ， $-CH_2 ON=C(CN)-$ ， $-CH_2 N(Ac)N=C(CH_3)-$ ，
 $-CH=NOCH(CH_3)-$ ， $-CH=NOCH(C_2H_5)-$ ，
 $-CH=NOC(CH_3)_2-$ ， $-CH=NN=C(CH_3)-$ ，
 $-CH=NN=C(C_2H_5)-$ 。

A 之較佳具體例，包括有 $-CH_2 ON=C(CH_3)-$ ，
 $-CH_2 ON=C(C_2H_5)-$ ， $-CH_2 ON=C(CN)-$ ， $-CH_2 N(Ac)N=C(CH_3)-$ ，
 $-CH=NOCH(CH_3)-$ ， $-CH=NOCH(C_2H_5)-$ ，
 $-CH=NOC(CH_3)_2-$ ， $-CH=NN=C(CH_3)-$ ，
 $-CH=NN=C(C_2H_5)-$ 。

R^{11} 所示之烷基，包括前述 R^6 所示烷基中例示者相同。

R^{11} 所示之烷醯基，包括前述 R^6 所示烷醯基中例示者相同。

B 之較佳具體例，包括有氧原子子， $-NH-$ ， $-N(CH_3)-$ ，
 $-N(Ac)-$ ， $-N(Ph)-$ 。

本發明之化合物，在亞胺部分存在有 E 體及 Z 體之二種異構物，而本發明則包含有此等異構物以及此異構物之任何比率之混合物。在說明書中，於一般式則使用波線 (~) 加以表示。

實施發明所需之最佳形態

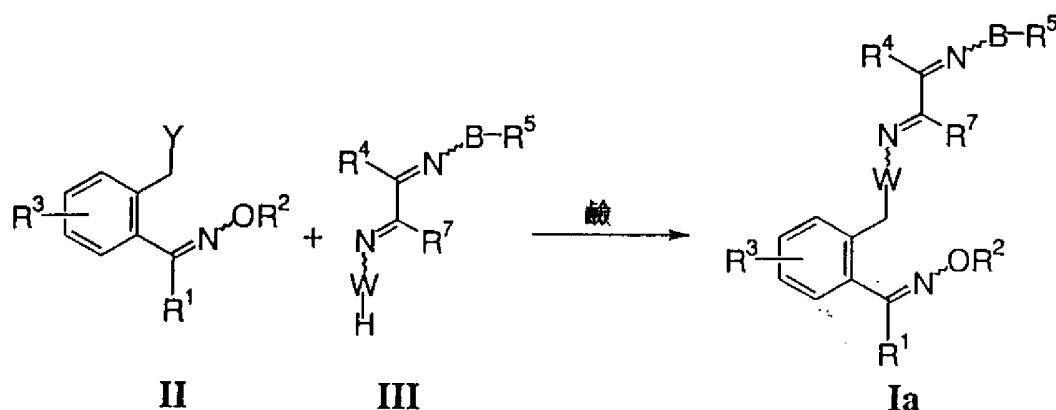
本發明之化合物 (I) [亦即，以一般式 (I) 所代表之化合物。以下，對於以另種方式表達之化合物亦做相同

五、發明說明 (11)

之略記。〕，例可由下述合成途徑予以製造。

〔途徑 1〕

(反應式 1)



〔式中，Y 為鹵素原子（如氯，溴，碘等），W 表示氧原子或 NR^6 ，其他之記號係與前述者相同。〕

亦即，由一般式 (I a) 所示之本發明化合物，係在鹼之存在下，於無溶劑或適當之溶劑（單一或混合）中，使化合物 (II) 與化合物 (III) 反應而製造。

在本反應中，化合物 (III) 對化合物 (II) 使當量以上，而最好為使用 1~2 當量。

可供使用之鹼，例如包括金屬氫氧化物（如氫氧化鈉，氫氧化鉀等），金屬碳酸鹽（如碳酸鈉，碳酸鉀等），金屬烷醇鹽（如甲醇鈉，乙醇鈉，第三丁醇鉀等），金屬氫化物（如氫化鈉，氫化鉀等），可使用 1 當量或以上，而最好為 1~3 當量。

可供使用之溶劑，例如包括有，N,N-二甲基甲醯胺 (DMF)，二甲基亞砷 (DMSO)，芳香族烴類（如甲苯，苯

五、發明說明(12)

，二甲苯等)，飽和烴類(如環己烷，己烷等)，醚類(如，四氫呋喃，二噁烷等)，酮類(如丙酮，甲乙酮等)，腈類(如乙腈等)，水以及其混合溶劑等。

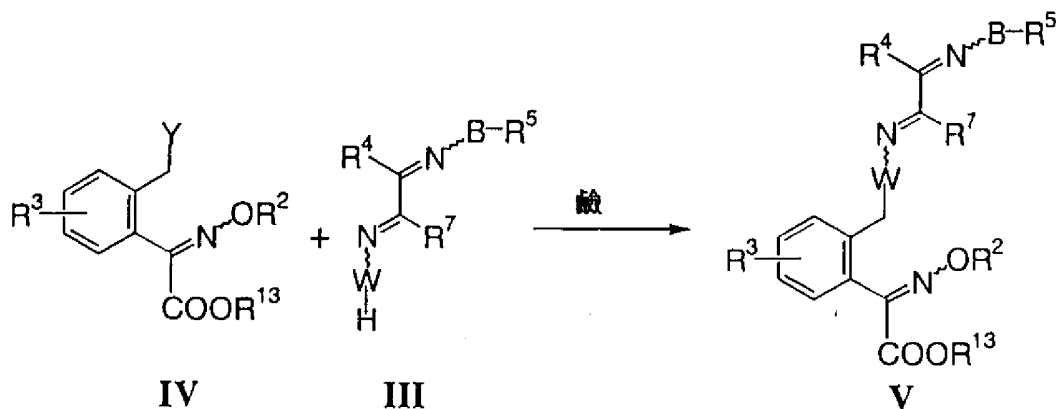
反應溫度為 $-30^{\circ}\text{C} \sim 160^{\circ}\text{C}$ ，最好為 $-10^{\circ}\text{C} \sim 120^{\circ}\text{C}$ 。反應時間則與化合物而有異，宜在 $0.5 \sim 120$ 小時內使之反應即可。

所獲得之化合物(I a)，如有需要時可依一般方法(如管柱式層析法，再結晶等)加以精製。

又，在本反應中所用之原料化合物(II)，可依照W095/26956號，化合物(III)則依W095/18789號所揭示之方法予以製造。

[途徑2]

(反應式2)



[式中， R^{13} 為烷(如甲基，乙基等)，至於其他記號則同前述。]亦即，以一般式(V)所代表之化合物，係在鹼之存在下，於無溶劑或適當之溶劑(單一或混合)中，使化合物(IV)與化合物(III)反應而可製造。

五、發明說明(13)

在本反應中，化合物(Ⅱ)係對化合物(Ⅳ)使用1當量或以上，而最好係使用1~2當量。

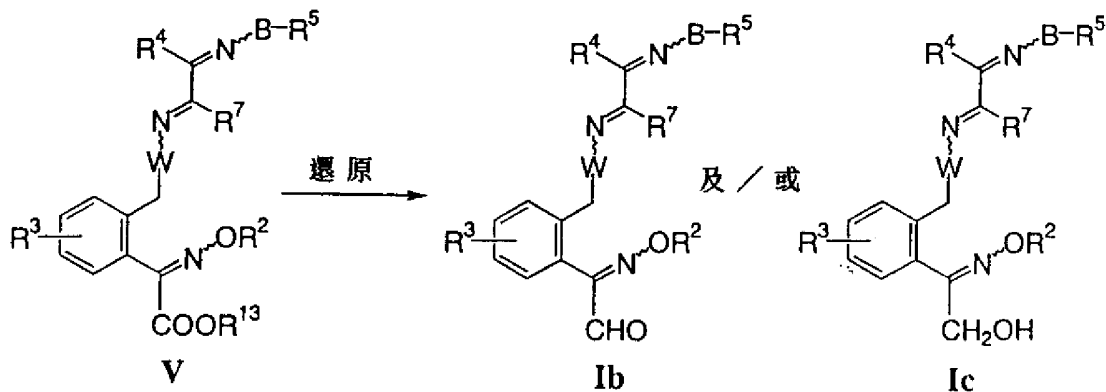
可供使用之鹼及溶劑，包括同上述反應式I所例者。

該溫度為-30℃~150℃，而最好為-10℃~100℃。反應時間即與化合物而有所不同，以反應0.5~120小時為宜。

所獲得之化合物(V)，可由反應液之粗製物，或依常法(如管柱式層析法，再結晶等)予以精製而供下一步驟使用。

又，關於本反應做為原料用之化合物，例如可依照特開平3-246268號或特開平5-97768號之方法予以製造。

(反應式3)



(式中，各種記號與以上所述者相同。)

亦即，以一般式(Ib)所示之本發明化合物，可將化合物(V)以各種之金屬氫化物予以還原而製造。

可供使用之金屬氫化物，例如包括有，氫化鋁鋰，氫化鋁鉀，氫化鋁鈉，二異丁基氫化鋁鈉，二異丁基氫化鋁，雙(甲氧乙氧)氫化鋁鈉，雙(N-甲基吡嗪基)氫化鋁

五、發明說明(14)

，三甲氧氫化鋁鋰，三乙氧氫化鋁鋰等。

以一般式(I c)所代表之本發明化合物，可藉由化合物(V)與各種金屬氫化物予以還原，或以添加接觸氫方法使之還原而製造。

可供使用之金屬氫化物，例如包括氫化鋁，氫化鋁鋰，氫化鋁鋰-氯化鋁，三甲氧氫化鋁鋰，雙(甲氧乙氧)氫化鋁鋰，二異丁基氫化鋁，氫化硼鈉，氫化鋁鈉，第三丁氧氫化鋁鋰，氫化鋁鎂，氫化硼鋰等。

添加接觸氫方法所使用之觸媒，例如包括有銅絡鐵礦，鋅絡鐵礦，氧化銻，鈮，阮來鐳等。

當然，依所需化合物(I b)與化合物(I c)之不同其還原方法亦有差異。而且，因化合物(V)之不同構造其還原方法也不同。例如可選擇金屬氫化物之種類與當量以及反應條件(溫度，時間等)。

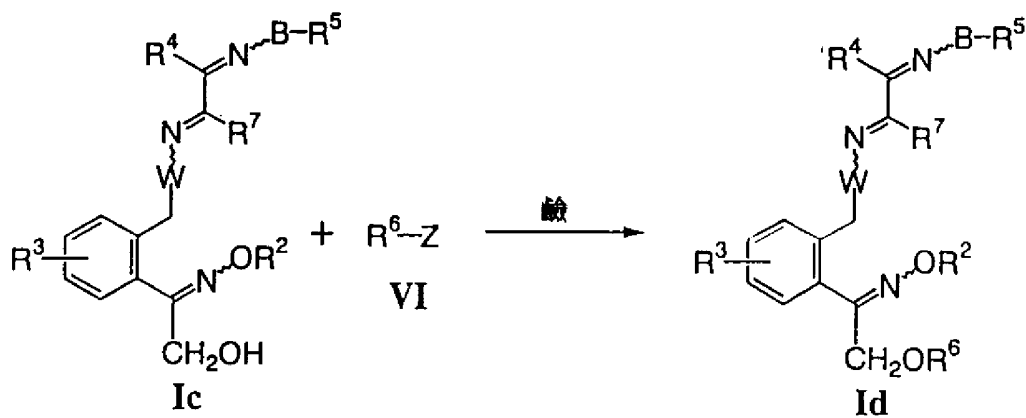
由化合物(V)之還原所製造之化合物(I b)與化合物(I c)，得參考習知之方法，如M. Hudlicky「Reductions in Organic Chemistry」Ellis Horwood Limited(1984)中所詳細述明的方法予以製造。

所獲得之化合物(I b)與化合物(I c)為混合物時，可由粗製物逕加使用，如有需要時，可依常法(如管柱層析法，再結晶等)予以精製而使用此混合物，或有需要時可將化合物(I b)與化合物(I c)加以分離使用。

[途徑3]

(反應式4)

五、發明說明 (15)



[式中，Z 係代表鹵素原子（如氯，溴原子等），烷基磷醯氧（如甲磷醯基氧，乙磷醯基氧等之低烷磷醯基氧等），烷氧磷醯氧（如甲氧基磷醯氧，乙氧基磷醯氧等低烷氧基磷醯氧等），芳磷醯氧（如苯磷醯氧，對甲苯磷醯氧等），其他之記號則同上述之意義。]

亦即，以一般式 (I d) 所示之本發明化合物，係在鹼之存在下，於適當之溶劑（單一或混合）中，使化合物 (I c) 與化合物 (VI) 反應而製造。

本反應中化合物 (VI) 係對化合物 (I c) 使用 1 當量或以上，而最好係使用 1~2 當量。

可供使用之鹼與所用化合物 (VI) 而不同，例如包括可使用金屬氫化物（如氫化鈉，氫化鉀等），金屬碳酸鹽（如碳酸鈉，碳酸鉀等），金屬烷醇鹽（如甲醇鈉，乙醇鈉，第三丁醇鉀等），有機鹼（如吡啶，三乙胺等），可使用 1 當量或以上，最好係使用 1~2 當量。

可供使用之溶劑，例如包括有 N,N-二甲基甲醯胺 (DMF)，二甲基亞砷 (DMSO)，芳香族烴類（如甲苯，苯，二甲

五、發明說明(16)

苯等)，飽和烴類（如環己烷，己烷等），鹵化烴類（如二氯甲烷，1,2-二氯乙烷等），醚類（如四氫呋喃，二噁烷等），腈類（如乙腈等），水以及其混合溶劑。

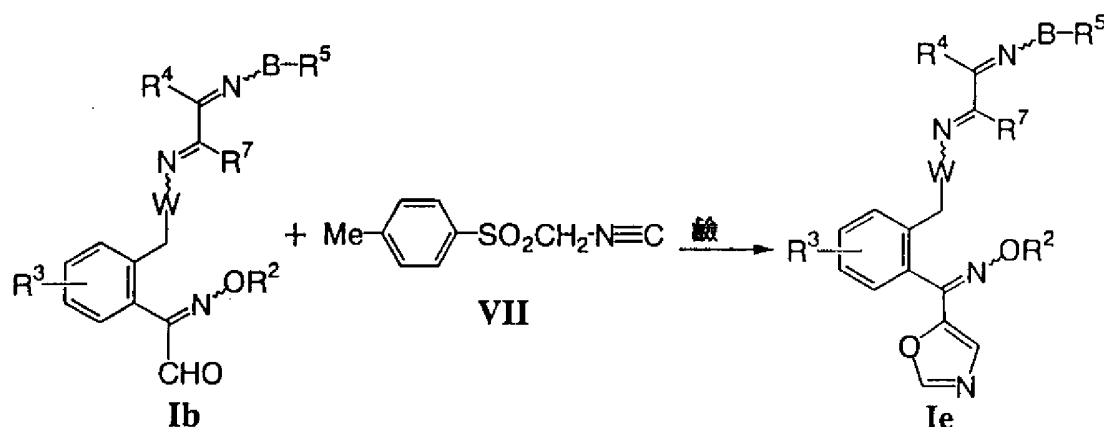
反應溫度為 $-30 \sim 150^{\circ}\text{C}$ ，最好為 $-10 \sim 100^{\circ}\text{C}$ 。

反應時間依化合物而有異，可使之反應 $0.5 \sim 90$ 小時。

所得標的之化合物 (I d)，如有需要時得依常法（如管柱層析法，再結晶等）予以精製。

[途徑 4]

(反應式 5)



(式中，各種記號依上述所表示者相同。)

亦即，以一般式 (I e) 所代表之本發明化合物，例如可依照特開昭 58-131984 號之內容，在鹼之存在下，於適當之溶劑（單一或混合）中，使化合物 (I b) 與化合物 (VII) 反應而製造。

在本反應中，化合物 (VII) 係對化合物 (I b) 使用 1 當量或以上，而最好係使用 $1 \sim 2$ 當量。

可供使用之鹼，例如包括有，金屬氫氧化物（如氫氧

五、發明說明 (17)

化鈉，氫氧化鉀等），金屬碳酸鹽（如碳酸鈉，碳酸鉀等），金屬醇鹽（如甲醇鈉，乙醇鈉，第三丁醇鉀等），可使用1當量或以上，最好係使用1~2當量。

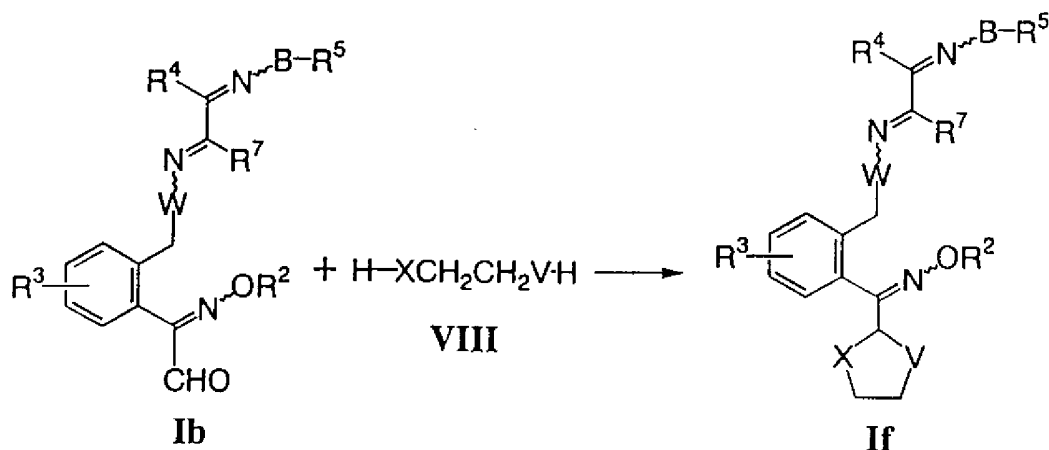
可供使用之溶劑，例如包括有，芳香族烴類（如甲苯，苯，二甲苯等），飽和烴類（如環己烷，己烷等），醇類（如甲醇，乙醇，丙醇等），以及其混合溶劑等。

反應溫度為 30~150℃，最好為 50~100℃，反應時間依化合物而有差異，可使之反應 0.5~90 小時。

所得之標的化合物 (Ic)，如有需要時可依常法（如管柱層析法，再結晶等）予以精製。

[途徑 5]

(反應式 6)



[式中，X 及 V 係彼此獨立，代表氧，硫或 N-R¹⁴ (R¹⁴ 為氫原子，低烷基)，其他之記號則同前述。]

亦即，由一般式所代表之本發明化合物，可參考 T. W. Green 氏所著「Protective Groups in Organic Synthesis」，p.109~151 John Willy & Sons (1981) 出

五、發明說明(18)

版所記載之方法，在鹼之存在下或不存在下，或酸之存在或不存在下，或金屬鹽的存在下或不存在下，於無溶劑或適當之溶劑（單一或混合）中，使化合物(I b)與化合物(VI)或其鹽（如鹽酸鹽，溴化氫酸鹽等）反應而製造。

在本反應中，化合物(VI)係對化合物(I b)使用1當量或以上，最好係使用1~5當量。

可供使用之鹼，例如包括有胺類（如三乙胺等），對化合物(I b)係使用1當量或以上，最好使用1~6當量。

可被使用之酸，例如包括有，無機酸（如鹽酸，硫酸等）以及磷酸類（如對甲苯磺酸等），對化合物(I b)係使用0.01~0.5當量，而最好係使用0.02~0.2當量。

可供使用之金屬鹽，例如包括有碳酸鉀，醋酸鋅等，對化合物(I b)使用0.01~0.5當量，最好為0.02~0.2當量。

所使用之溶劑例如包括有N,N-二甲基甲醯胺(DMF)，二甲基亞砷(DMSO)，芳香族烴類（如甲苯，苯，二甲苯等），飽和烴類（如環己烷，己烷等），鹵化烴類（如二氯甲烷，1,2-二氯乙烷等），醚類（如四氫呋喃，二噁烷等），醇類（如丁醇，2-甲氧乙醇，乙二醇，甘油等），以及其混合溶劑等。

反應溫度為20~200℃，宜為50~160℃。

反應時間依化合物而有差異，可反應0.5~90小時。

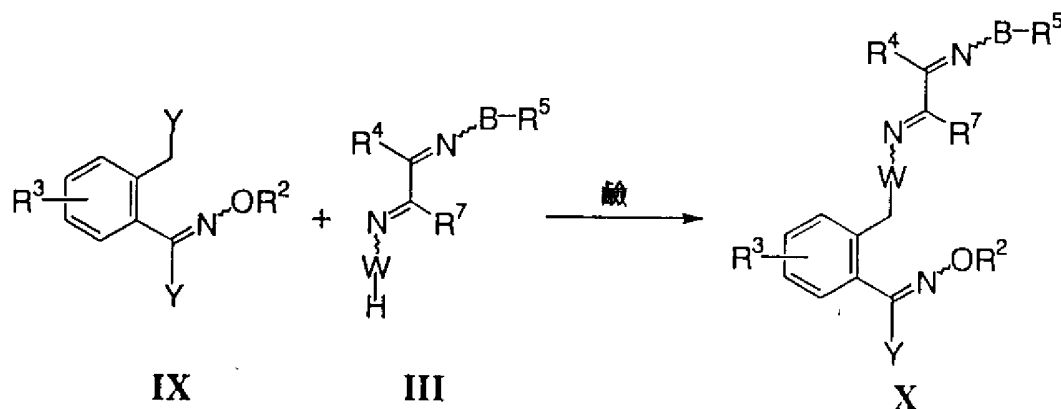
所獲得之標的化合物(I f)，如有需要時可依照常法

五、發明說明(19)

(如管柱層析法，再結晶等) 予以精製。

[途徑 6]

(反應式 7)



(式中，各種記號與前述者相同。)

亦即，以一般式(X)所示之化合物，係在鹼的存在下，於無溶劑和適當之溶劑(單一或混合)中，使化合物(IX)與化合物(III)反應而製造。

在本反應中，化合物(III)對化合物(IX)係使用1當量或以上，而最好係使用1~2當量。

可供使用之鹼，例如包括有金屬氫氧化物(如氫氧化鈉，氫氧化鉀等)，金屬碳酸鹽(如碳酸鈉，碳酸鉀等)，金屬醇鹽(如甲醇鈉，乙醇鈉，第三丁醇鉀等)，金屬氫化物(如氫化鈉，氫化鉀等)，係使用1當量或以上，而最好係使用1~3當量。

可供使用之溶劑，例如包括有，N,N-二甲基甲醯胺(DMF)，二甲基亞砜(DMSO)，芳香族烴類(如甲苯，苯，二甲苯等)，飽和烴類(如環己烷，己烷等)，醚類

五、發明說明 (20)

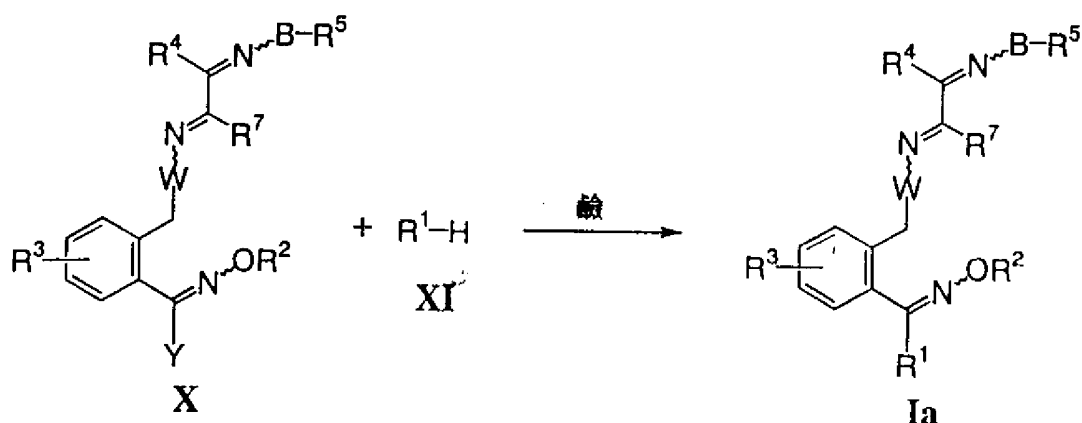
(如四氫呋喃，二噁烷等)，酮類(如乙酮，甲乙酮等)，腈類(如乙腈等)，水以及其混合溶劑等。

反應溫度為 $-30\sim 160^{\circ}\text{C}$ ，而最好為 $-10\sim 120^{\circ}\text{C}$ ，反應時間與化合物而有異，可使之反應 $0.5\sim 120$ 小時。

所獲得之化合物(X)，得依反應液的粗製物，或由常法(如管柱層析法，再結晶等)予以精製，而可供做為下一步驟使用。

又，關於本反應中做為原料使用之化合物，例如可依照W095/26956號之方法加以製造。

(反應式8)



[式中，各種記號係同上所述。但，在本反應中 R^1 最好為可各自取代之咪唑基(如咪唑-1-基等)或三唑基(如1H-1,2,4-三唑-1-基等)]

以一般式(Ia)所示之本發明化合物，係在鹼之存在或不存在下，於溶劑或適當之溶劑(單一或混合)中，使化合物(X)與化合物(XI)反應而製造。

本反應中，化合物(XI)係對化合物(X)使用1當量或

五、發明說明(21)

以上，而最好係使用1~5當量。

可供使用之鹼，例如包括有金屬氫氧化物（如氫氧化鈉，氫氧化鉀等），金屬氫化物（如氫化鈉，氫化鉀等），金屬碳酸鹽（如碳酸鈉，碳酸鉀等），金屬醇鹽（如甲醇鈉，乙醇鈉，第三丁醇鉀等），胺類（如吡啶，三乙胺等），係使用1當量或以上，而最好係使用1~5當量。

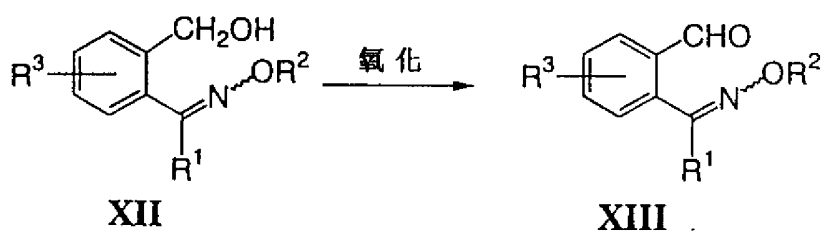
可供使用之溶劑，例如包括有N,N-二甲基甲醯胺(DMF)，二甲基亞砜(DMSO)，芳香族烴類（如甲苯，苯，二甲苯等），飽和烴類（如環己烷，己烷等），鹵化烴類（如二氯甲烷，1,2-二氯乙烷等），醚類（如四氫呋喃，二噁烷等），酮類（如丙酮，甲乙酮等），腈類（如乙腈等），水以及其混合溶劑。

反應溫度為-30~170℃，而最好為-10~140℃。反應時間與化合物而有異，可使之反應0.5~100小時。

所得之標的化合物(Ia)，如有需要可依常法（如管柱層析法，再結晶等）予以精製。

[途徑7]

(反應式9)



(式中，各種記號同以上所述意義。)

五、發明說明 (22)

亦即，以一般式 (XIII) 所示之苯醛衍生物，可將化合物 (XII) 以各種氧化劑予以氧化而製造。

可供使用之氧化劑，例如包括有，氯鉻酸吡啶鎘，鉻酸第三丁酯，過氧化鎳，活性化 DMSO 等。

使用活性化 DMSO 之各種活性化 DMSO 氧化法係屬已知，其中以斯旺 (Swern) 氧化予以製造時，做為 DMSO 及親電子劑所用之草醯氯，係對化合物 (XII) 各自使用 1 當量或以上，而最好係使用 1~4 當量。

可供使用之溶劑，例如包括有二氯甲烷等之鹵化烴類。

反應溫度為 $-78 \sim -20^{\circ}\text{C}$ ，最好為 $-78 \sim -40^{\circ}\text{C}$ 。反應時間依化合物而有別，可反應 15 分鐘至 3 小時。

接著添加三乙胺一般之鹼使之形成亞胺硫化物。

所用之鹼，對化合物 (XII) 係使用 1 當量或以上，而最好為 1~6 當量。

反應溫度為 $-78 \sim 50^{\circ}\text{C}$ ，最好為 $-78 \sim 30^{\circ}\text{C}$ 。反應時間依化合物而有別，可使之反應 15 分鐘~3 小時。

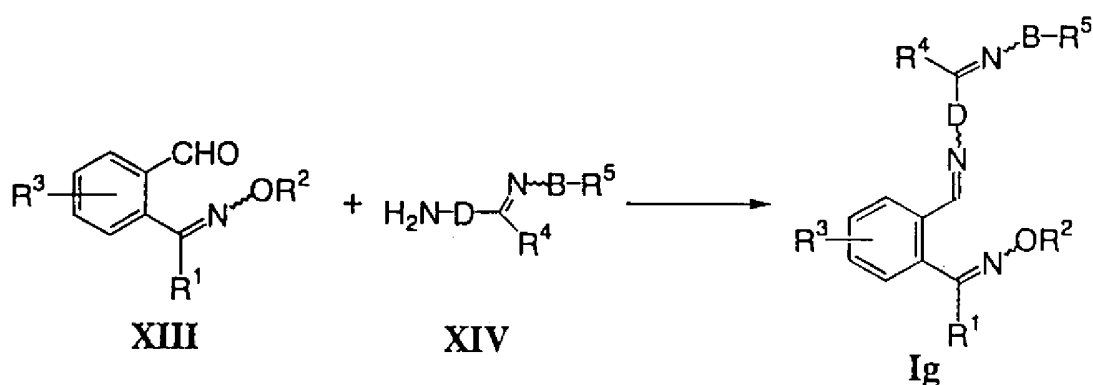
反應終止後，加水用溶劑萃取。

所得之化合物 (XIII)，可依反應液之粗製物，或依常法（如管柱層析法，再結晶等）加以精製而可供下一步驟之用。

又，在反應中做為原料用之化合物 (XII)，例如可依照 W095/26956 號之方法予以製造。

（反應式 10）

五、發明說明 (23)



(式中，D 係代表 $-OC(R^9)(R^{10})-$ 或 $-N=C(R^7)-$ ，其他之記號則同以上所述意義。)

亦即，以一般式 (I g) 所代表之本發明化合物，在化合物 (XIII) 以化合物 (XIV) 所示鄰位取代羥基胺或脲衍生物或其鹽（如鹽酸鹽，硫酸鹽）在適當溶劑（單一或混合）中，使之反應而製造。

在本反應中，化合物 (XIV) 係對化合物 (XIII) 使用 1 當量或以上，最好係使用 1~3 當量。

可供使用之溶劑，例如包括有芳香族烴類（如甲苯，苯，二甲苯等），飽和烴類（如環己烷，己烷等），醇類（如甲醇，乙醇，丙醇等），醚類（如四氫呋喃，二噁烷等），水以及其混合溶劑等。

反應溫度為 0~160℃，宜為 20~130℃。反應時間依化合物而有別，可使之反應 0.5~90 小時。

所得標的化合物 (I g)，如有需要可依常法（如管柱層析法，再結晶等）予以精製。

又，在反應中做為原料用之化合物 (XIV) 所代表之脲衍生物，則由對應之酮衍生物與肼之反應予以製造。

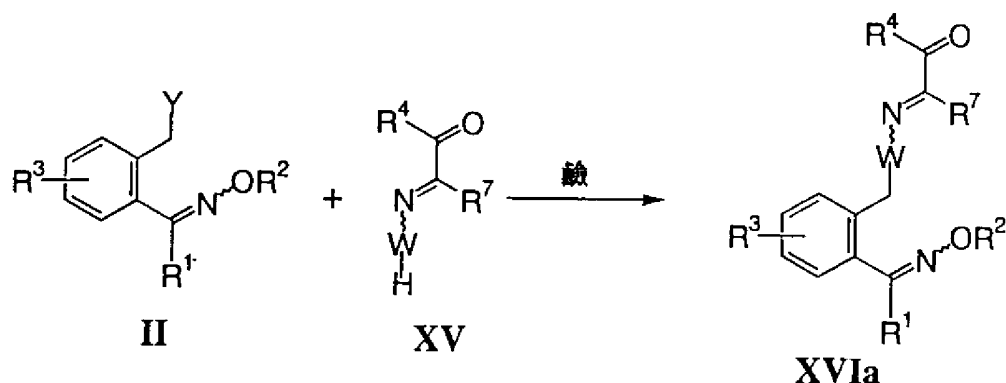
415830

五、發明說明(24)

由化合物(XIV)所代表之鄰位取代羥基胺衍生物，得由Houben-Weyl所著"Methoden der Organischen Chemie"X/1 卷所記載之類似習知方法予以製造。

[途徑 8]

(反應式 11)



(式中，各種記號同以上所述意義。)

亦即，以一般式(XVIa)所代表之化合物，係在鹼之存在下，於無溶劑或適當之溶劑(單一或混合)中，使化合物(II)與化合物(XV)反應而製造。

在本反應中，化合物(XV)對化合物(II)係使用1當量或以上，而最好為1~2當量。

可供使用之鹼及溶劑，則包括相同於上述反應式I所例示者。

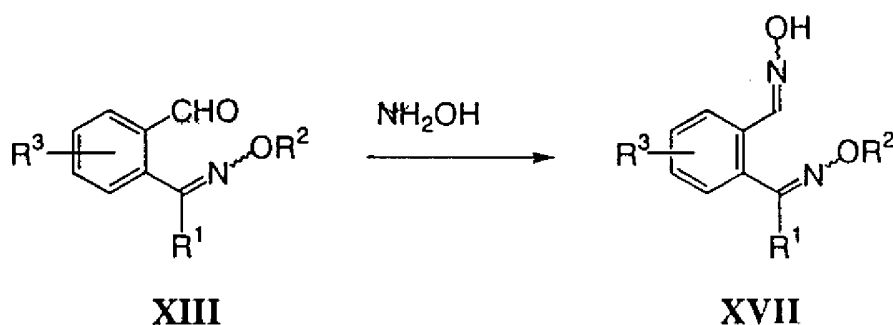
反應溫度為-30 ~ 150℃，宜為-10℃ ~ 100℃。反應時間依化合物而有別，可使之反應0.5~120小時。

所獲得之化合物(XVIa)，得以反應液之粗製物，或依常法(如管柱層析法，再結晶等)予以精製而可做為下一步驟之用。

五、發明說明(25)

又，本反應中做為原料用之(XV)，係可使用市售品，或依常法逕加製造者。

(反應式12)



(式中，各種記號同以上所述意義。)

亦即，化合物(XVII)係使化合物(XIII)與羥基胺或其鹽在適當之溶劑中予以反應而製造。

羥基胺係對化合物(XIII)使用1~4當量，最好為1~2.5當量。

羥基胺之鹽，例如包括有，鹽酸鹽，硫酸鹽等之礦酸鹽等。使用該鹽時，可用鹼加以中和。可供使用之鹼，例如包括有金屬氫氧化物(如氫氧化鈉，氫氧化鉀等)，金屬碳酸鹽(如碳酸鈉，碳酸鉀等)，金屬醇鹽(如甲醇鈉，乙醇鈉等)，吡啶等，其使用量係對羥基胺之鹽為1~3當量，最好為1~2當量。

可使用之溶劑，例如包括有，烴類(如苯，甲苯，二甲苯等)，鹵化烴類(如氯仿，1,2-二氯乙烷等)，醚類(如四氫呋喃，二噁烷等)，醇類(如甲醇，乙醇，正丙醇，異丙醇等)，水以及其混合溶劑。

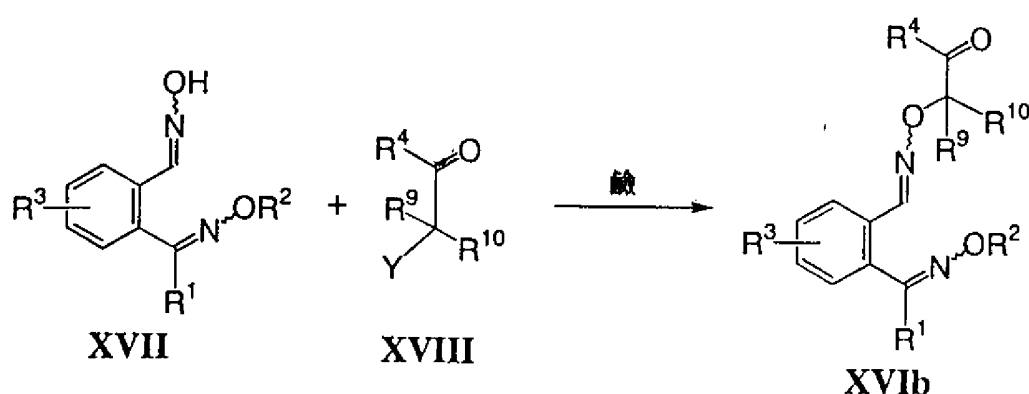
反應溫度為0~150℃，最好為20~100℃。反應時間

五、發明說明 (26)

通常為約 15 分鐘至 24 小時。

所獲得之化合物 (XVII)，以反應液之粗製物，或依常法（如管柱層析法，再結晶等）予以精製而做為下一步驟之用。

（反應式 13）



（式中，各種記號同以上所述意義。）

亦即，以一般式 (XVIb) 所示之化合物，係在鹼之存在下，於無溶劑或適當之溶劑（單一或混合）中，使化合物 (XVII) 與化合物 (XVIII) 反應而製造。

在本反應中，化合物 (XVIII) 對化合物 (XVII) 係使用 1 當量或以上。

可供使用之鹼，例如包括有金屬氫氧化物（如氫氧化鈉，氫氧化鉀等），金屬碳酸鹽（如碳酸鈉，碳酸鉀等），金屬醇鹽（如甲醇鈉，乙醇鈉，第三丁醇鉀等），金屬氫化物（如氫化鈉，氫化鉀等），可使用 1 當量或以上，最好為 1~3 當量。

所使用之溶劑，例如包括有，N,N-二甲基甲醯胺 (DMF)，二甲基亞砷 (DMSO)，芳香族烴類（如甲苯，苯，二甲

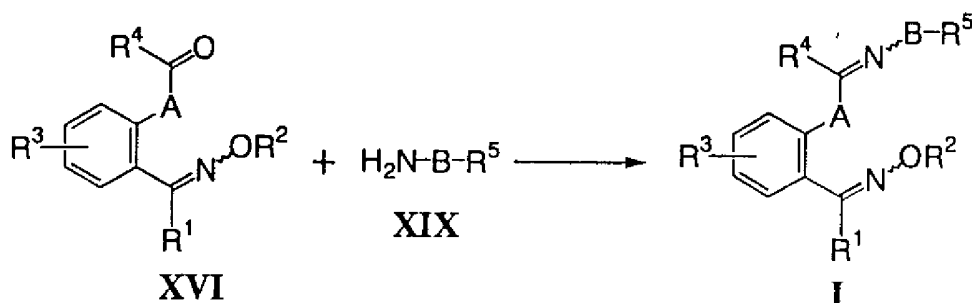
五、發明說明 (27)

苯等)，飽和烴類（如環己烷，己烷等），醚類（如四氫呋喃，二噁烷等），酮類（如丙酮，甲乙酮等），腈類（如乙腈等），水及其混合溶劑。

反應溫度為 $-30 \sim 120^{\circ}\text{C}$ ，宜為 $0 \sim 90^{\circ}\text{C}$ 。反應時間即與化合物而有別可使之反應 $0.5 \sim 90$ 小時。

所獲得之化合物 (XVIb)，得以反應液之粗製物，或依常法（如管柱層析法，再結晶等）予以精製而可做為下一步驟使用。

（反應式 14）



（式中，各種記號係如前述所述意義。）

亦即，以一般式 (I) 所代表之本發明化合物，係使化合物 (XVI) 與化合物 (XIX) 所示鄰位取代羥基胺或胺衍生物及其鹽（如鹽酸鹽，硫酸鹽）在適當之溶劑（單一或混合）中予以反應而製造。

使用該鹽時，則可用鹼予以中和。可被使用之鹼，例如包括有，金屬氫氧化物（如氫氧化鈉，氫氧化鉀等），金屬碳酸鹽（如碳酸鈉，碳酸鉀等），金屬醇鹽（如甲醇鈉，乙醇鈉等），吡啶等，其使用量係對化合物 (XIX) 之鹽為 $1 \sim 3$ 當量，最好為 $1 \sim 2$ 當量。

五、發明說明(28)

在反應中，化合物(XIX)對化合物(XVI)係使用1當量或以上，最好係使用1~3當量。

可使用之溶劑，例如包括有，芳香族烴類（如甲苯，苯，二甲苯等），飽和烴類（如環己烷，己烷等），醇類（如甲醇，乙醇，丙醇等），醚類（如四氫呋喃，二噁烷等），水以及其混合溶劑。

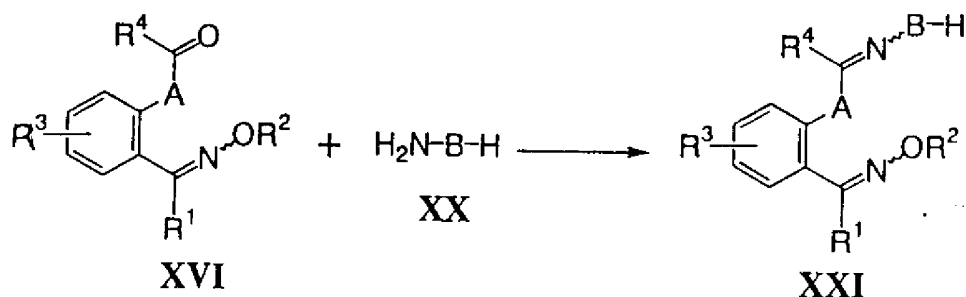
反應溫度為0~160℃，最好為20~130℃。反應時間依化合物而有別可使之反應0.5~90小時。

所獲得之化合物(I)，如有需要時可依常法（如管柱層析法，再結晶等）予以精製。

以化合物(XIX)所示之鄰位取代羥基胺衍生物為習知，或可依Houben-Weyl氏所著"Methoden der Organischen Chemie"X/1卷所記載之方法以類似與習知之方法予以製造。

由化合物(XIX)所示之胺衍生物為習知，或以Houben-Weyl氏所著"Methoden der Organischen Chemie"X/2卷所記載之方法以類似與習知之方法予以製造。

(反應式15)



(式中，各種記號係同以上所述意義。)

五、發明說明 (29)

亦即，以一般式 (XXI) 所示化合物，係使化合物 (XVI) 與由化合物 (XX) 所示之羥基胺及其鹽（如鹽酸鹽，硫酸鹽）在適當之溶劑（單一或混合）中，予以反應而製造。

使用該鹽時，可用鹼中和而反應。可供使用之鹼，例如包括有，金屬氫氧化物（如氫氧化鈉，氫氧化鉀等），金屬碳酸鹽（如碳酸鈉，碳酸鉀等），金屬醇鹽（如甲醇鈉，乙醇鈉等）吡啶等，其使用量係對化合物 (XX) 之鹽為 1~3 當量，最好為 1~2 當量。

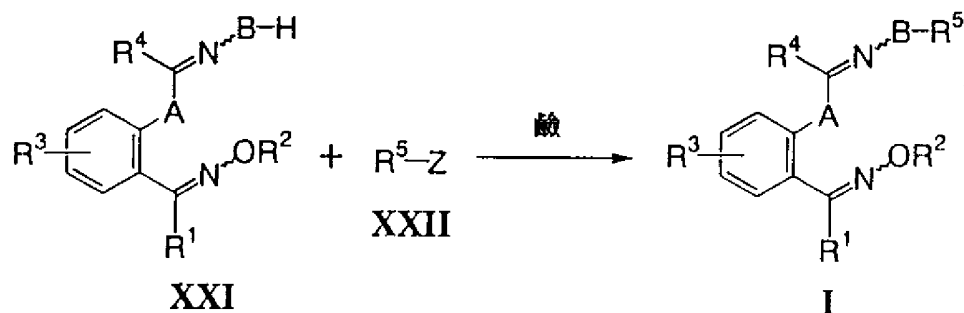
在本反應中，化合物 (XX) 對化合物 (XVI) 係使用 1 當量或以上，最好為 1~3 當量。

可供使用之溶劑，例如包括有，芳香族烴類（如甲苯，苯，二甲苯等），飽和烴類（如環己烷，己烷等），醇類（如甲醇，乙醇，丙醇等），醚類（如四氫呋喃，二噁烷等），水及其混合溶劑。

反應溫度為 0~160℃，宜為 20~130℃，反應時間與化合物而有別，可使之反應 0.5~90 小時。

所獲得之化合物 (XXI)，可依反應液之粗製物，或依常法（如管柱層析法，再結晶等）予以精製而可供下一步驟使用。

（反應式 16）



五、發明說明(30)

[式中，各種記號同上所述。]

亦即，以一般式(I)所代表之本發明化合物係在鹼之存在下，於適當之溶劑(單一或混合)中，使化合物(XXI)與化合物(XXII)反應而製造。

本反應中之化合物(XXII)係對化合物(XXI)使用1當量或以上，最好係使用1~2當量。

可供使用之鹼係與所用化合物(XXII)而有差異，例如包括有金屬氫化物(如氫化鈉，氫化鉀等)，金屬碳酸鹽(如碳酸鈉，碳酸鉀等)，金屬醇鹽(如甲醇鈉，乙醇鈉，第三丁醇鈉等)，有機鹼(如吡啶，三乙胺等)，可使用1當量或以上，最好係使用1~2當量。

可供使用之溶劑，例如包括有，N,N-二甲基甲醯胺(DMF)，二甲基亞砜(DMSO)，芳香族烴類(如甲苯，苯，二甲苯等)，飽和烴類(如環己烷，己烷等)，鹵化烴類(如二氯甲烷，1,2-二氯乙烷等)，醚類(如四氫呋喃，二噁烷等)，腈類(如乙腈等)，水以及其混合溶劑。

反應溫度為-30~150℃，最好為-10~100℃。

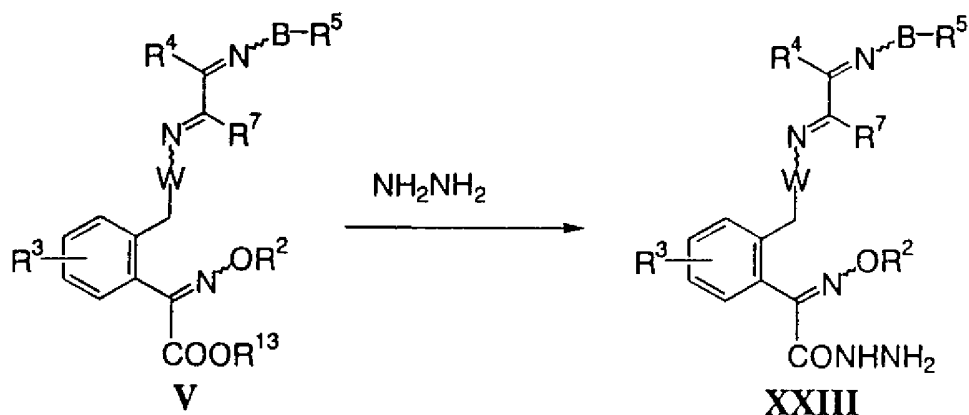
反應時間依化合物而有別可使之反應0.5~90小時。

所得之標的化合物(I)，如有需要可依常法(如管柱層析法，再結晶等)予以精製。

[途徑9]

(反應式17)

五、發明說明 (31)



(式中，各種記號同以上所述意義。)

亦即，以一般式 (XXIII) 所示之化合物，係在適當之溶劑（單一或混合）中，使化合物 (V) 與肼之一水合物或其鹽（如鹽酸鹽，硫酸鹽）反應而製造。

在本反應中，肼對化合物 (V) 係使用 1 當量或以上，而最好為 1~5 當量。

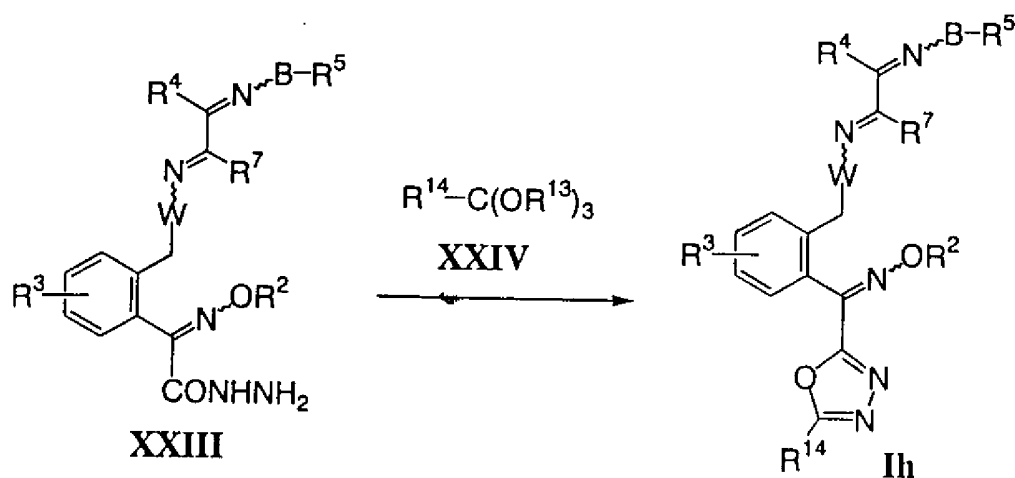
可供使用之溶劑，例如包括有芳香族烴類（如甲苯，苯，二甲苯等），飽和烴類（如環己烷，己烷等），醇類（如甲醇，乙醇，丙醇等），醚類（如 THF，二噁烷等），以及其混合溶劑等。

反應溫度為 0~160℃，最好為 10~130℃。反應時間與化合物而有別，可使之反應 0.5~90 小時。

所得之化合物 (XXIII)，可依反應液之粗製物，或由常法（如管柱層析法，再結晶等）予以精製而可做為下一步驟使用。

(反應式 18)

五、發明說明(32)



(式中，各種記號同以上所述意義。)

亦即，以一般式(Ih)所示之本發明化合物，可參考 C. Ainaworth J. Am. Chem. Soc. 77, 1148(1955)，在無溶劑或適當之溶劑（單一或混合）中，於酸之存在下或不存在下，使化合物(XXIII)與化合物(XXIV)反應而製造。

在本反應中，化合物(XXIV)對化合物(XXIII)係使用1當量或以上，最好為1~20當量。

可使用之酸，包括有鹵化氫類（如氯化氫，溴化氫，碘化氫等），磷酸類（如三氟甲磷酸等之脂肪族磷酸及甲苯磷酸等之芳香族磷酸等）。

酸的使用量，對化合物(XXIII)係使用痕跡量~1當量。

可供使用之溶劑，包括有，芳香族烴類（如甲苯，苯，二甲苯等），飽和烴類（如環己烷，己烷等），醚類（如四氫呋喃，二噁烷等），以及其混合溶劑等。

反應溫度為20~200℃，宜為50~170℃。反應時間與

五、發明說明 (33)

化合物而有別，可使之反應0.5~90小時。

所得標的化合物(Ih)，如有需要可依常法(如管柱層析法，再結晶等)予以精製。

本發明化合物(I)對於源自栽培植物或其種子，例如稻，小麥，大麥，燕麥，玉蜀黍，玉米，小米，蕎麥，大豆，小豆，花生等，或為果樹，例如柑橘類，葡萄，蘋果，梨子，桃子，或為蔬菜，如黃瓜，茄子，番茄，南瓜或為冒犯藥豆之病原菌(真菌)以及對於源自土壤之病原菌極為有效。本發明化合物特別對於稻熱病菌(*pyricularia oryzae*)，稻紋枯病菌(*Rhizoctonia solani*)，麥類白粉病菌(*Erysiphe graminis*)，瓜類白粉病菌(*sphaerotheca fuliginea*)，菸草白粉病菌(*Erysiphe cichoracearum*)，馬鈴薯晚疫病菌(*phytophthora infestans*)，黃瓜霜霉病菌(*pseudoperonospora cubensis*)，大豆霜霉病菌(*peronospora manshurica*)，葡萄霜霉病菌(*plasmopara viticola*)，或為蔬菜類，葡萄等之灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)，黃瓜苗立枯病菌(*pythium aphanidermatum*)，蕎麥，大豆，油菜等菌核病菌(*sclerotinia sclerotiorum*)，大豆，小豆，馬鈴薯，花生等之白絹病菌(*corticium rolfsii*)，麥類眼紋病(*pseudocercospora herpotrichoides*)等顯示有很強之抗菌活性。是以，本發明之化合物(I)乃為一種可做為農業用殺菌劑之有用殺菌劑。

五、發明說明 (34)

關於本發明化合物(I)之適用係在植物上經施加以噴霧，散佈，塗佈等處理，或對植物種子，植物周圍之土壤，或為播種種子之土壤，水田，水耕栽培的水均可進行有效物質之處理，可在植物感染病原菌之前或感染後進行處理。

本發明化合物可採用一般製劑之形態，例如，液劑，水和劑，乳化劑，懸浮劑，液態濃縮劑，錠劑，顆粒劑，氣溶膠，粉劑，糊劑，燻煙劑等農用殺菌劑所適用之藥劑。

此種樣態可依通常之方法，將至少一種本發明之化合物與適當固體或液體的載體，並視其所需，可混合以改善有效物質之分散性或其他性質的適當輔助劑（例如，界面活性劑，展著劑，分散劑，安定劑）而獲得者。

固體之載體，或稀釋劑之例子，有植物性物質（如穀粉，煙草莖粉，大豆粉，五穀類穀粉，蔬菜粉末，刨屑，米糠，樹皮粉，纖維素粉，蔬菜萃取殘渣），纖維狀物質（如紙，瓦楞紙，破布），人工之可塑性粉末，黏土（如高嶺土，皂土，白土），滑石及無機物質（葉蠟石，絹雲母，輕石，硫黃粉，活性碳），化學肥料（如硫胺，磷酸銨，硝酸銨，尿素，氯化銨）等。

液體載體及稀釋劑，即有水，醇類（如甲醇，乙醇），酮類（如丙酮，甲乙酮），醚類（如二乙醚，二噁烷，溶纖素，四氫呋喃），芳香族烴（如苯，甲苯，二甲苯，甲萘），脂肪族烴（如汽油，煤油，燈油），酯類

五、發明說明(35)

， 腈類， 酸酐胺（如二甲基甲酐胺， 二甲基乙酐胺）， 鹵化烴（如二氯乙烷， 四氯化碳）等。

界面活性劑的例子包括有， 硫酸烷酯， 磷酸烷酯， 磷酸烷芳酯， 聚乙二醇， 多價醇酯類等。展著劑或分散劑的例子有酪朊， 明膠， 澱粉， 羧甲基纖維素， 阿拉伯樹膠， 海藻酸木質素， 皂土， 糖蜜， 聚乙烯醇， 松油及瓊脂等。安定劑有， PAP（磷酸異丙酯混合物）， 磷酸三甲苯酯(TCP)， 牛油， 環氧油， 界面活性劑類， 脂肪酸類及其酯類。

除以上成分之外， 本發明之製劑可混合使用其他之殺菌劑， 殺蟲劑， 除草劑， 或肥料。

通常， 以上之製劑含有1~95重量%之至少一種以一般式(I)所代表之本發明化合物， 宜為含有2.0~80重量%。此等製劑可單獨， 或經由稀釋後再予以使用。本發明之該化合物用量為， 約1g~5kg/ha， 而最好為約10g~1000g/ha， 一般係以約1~5,000ppm， 最好為約10~1,000ppm的濃度予以使用。

實施例

以下茲例示實施例及試驗例， 詳細說明本發明， 惟本發明並不受此等實施例等之限制。實施例中所記載

¹H-NMR(CDCl₃)之數值， 在270MHz下予以測定， 於重氮仿中， 以四甲基矽烷做為內部標準而以δ值(ppm)表示。結合定數(J)則標記為Hz。在數據中， s為單重線， d為雙重線， t為三重線， q為四重線， sept為七重線， m則為多

五、發明說明(36)

重線。

(實施例1)

製造 3-[α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苯基]異噁唑

在冰冷下將 0.23 克 3-(2-氧甲基- α -甲氧亞胺基)異噁唑添加 3 ml DMF, 0.16 克 (1.2 mmol) 之 3-甲氧亞胺基-2-丁酮肟於室溫下攪拌 2 小時。加乙醚於反應液, 用 80 ml 食鹽水洗淨 2 次。乙醚層經由無水硫酸鎂乾燥後, 減壓濃縮所獲得之殘渣以矽凝膠層析法 (醋酸乙酯/正己烷) 加以精製, 得 0.19 克 (收率 55.2%) 之 3-[α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苯基]異噁唑之無色結晶。

mp 125~126.5°C

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}: 1.85(3\text{H}, \text{s}), 1.90(3\text{H}, \text{s}), 3.92(3\text{H}, \text{s}), 4.00(3\text{H}, \text{s}), 5.09(2\text{H}, \text{s}), 6.74(1\text{H}, \text{d}, J=1.8), 7.24-7.54(4\text{H}, \text{m}), 8.38(1\text{H}, \text{d}, J=1.8)。$

(實施例2)

製造 (2-甲氧亞胺基-2-[2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苯基]乙醇與 2-甲氧亞胺基-2-[2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苯基]乙醛

(i) 製造 α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苯基醋酸甲酯

在冰冷下, 於 2.86 克 (10 mmol) 之 2-溴甲基- α -甲氧亞胺基苯基醋酸甲酯添加 10 ml DMF, 1.43 克 (11 mmol) 3-甲

五、發明說明(37)

氧亞胺基-2-丁酮肟及0.44克(11mmol)之60%氫化鈉並在室溫下攪拌3小時。加200ml乙醚於反應溶液，用100ml食鹽水洗淨2次。乙醚層經無水硫酸鎂乾燥後，減壓濃縮所得之殘渣用矽凝膠層析法(醋酸乙酯/正己烷)予以精製，得2.62克(收率78.1%)之 α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苯基醋酸甲酯之無色結晶。

¹H-NMR(CDCl₃) δ ppm: 1.95(3H,s), 1.99(3H,s), 3.84(3H,s), 3.93(3H,s), 4.04(3H,s), 5.06(2H,s), 7.15-7.20(1H,m), 7.34-7.47(3H,m)。

(2) 製造2-甲氧亞胺基-2-[2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苯基]乙醇與2-甲氧亞胺基-2-[2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苯基]乙醛

在2.35克(7mmol)之 α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苯基醋酸甲酯與14ml之二氯甲烷混合液在-60℃下以10分鐘的時間滴加以8.4ml(8.4mmol)之1M之二異丁基鋁氧化物/甲苯溶液後，從-78℃起至0℃至攪拌5小時。加6ml甲醇於反應溶液，在室溫攪拌1小時，去除所析出之不溶物，將減壓濃縮所得之殘渣用矽凝膠層析法(醋酸乙酯/正己烷)予以精製，得0.77克(收率35.8%)之2-甲氧亞胺基-2-[2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苯基]乙酯及0.77克(收率36.0%)之2-甲氧亞胺基-2-[2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苯基]乙醛之無色結晶。

五、發明說明(38)

醇：mp 84~85℃

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm: } 1.96(3\text{H}, \text{s}), 2.03(3\text{H}, \text{s}), 2.74(1\text{H}, \text{t}, J=5.5), 3.87(3\text{H}, \text{s}), 3.94(3\text{H}, \text{s}), 4.43(2\text{H}, \text{d}, J=5.5), 5.09(2\text{H}, \text{s}), 7.12-7.18(1\text{H}, \text{m}), 7.34-7.51(3\text{H}, \text{m}),$

醛：mp 61~63℃

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm: } 1.93(3\text{H}, \text{s}), 1.97(3\text{H}, \text{s}), 3.93(3\text{H}, \text{s}), 4.11(3\text{H}, \text{s}), 5.01(2\text{H}, \text{s}), 7.08-7.12(1\text{H}, \text{m}), 7.34-7.47(3\text{H}, \text{m}), 10.03(1\text{H}, \text{s})。$

(實施例3)

製造5-[α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]噁唑

在0.24克(0.8mmol)之2-甲氧亞胺基-2-[2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]乙醛中，添加0.19克(0.96mmol)對甲苯磺酸鹽甲基異氰化物，0.14克(1.04mmol)碳酸鉀與3ml甲醇，在還流下攪拌3小時。反應後，添加100ml乙醚用80ml食鹽水洗淨2次。乙醚層經無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所獲得之殘渣以矽凝膠層析法(醋酸乙酯/正己烷)予以精製後，再結晶而得0.11克(收率39.9%)之5-[α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]噁唑之無色結晶。

mp 84~85℃

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm: } 1.86(3\text{H}, \text{s}), 1.89(3\text{H}, \text{s}), 3.92(3\text{H}, \text{s}), 4.00(3\text{H}, \text{s}), 5.09(2\text{H}, \text{s}), 6.82(1\text{H}, \text{s}), 7.21-7.54(4\text{H}, \text{m}), 7.92(1\text{H}, \text{s})。$

五、發明說明(39)

(實施例 4)

製造 2-[α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]噻唑烷

在 0.31 克 (1 mmol) 之 2-甲氧亞胺基-2-[2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]乙醛加入 2 ml 甲苯, 2 ml 丁醇, 0.23 克 (2 mmol) 肼胺鹽酸鹽以及 0.28 克 (2 mmol) 之三乙胺, 在室溫下攪拌 3 小時。反應後, 加入 50 ml 半飽和食鹽水, 用 100 ml 醋酸乙酯萃取 2 次。萃取液經無水硫酸鎂乾燥後, 將減壓濃縮所獲得之殘渣以矽凝膠層析法 (醋酸乙酯/正己烷) 加以精製後, 獲得 0.36 克 (收率 98.8%) 之 2-[α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]噻唑烷的無色結晶。

mp 83~84.5℃

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm: } 1.98(3\text{H}, \text{s}), 2.07(3\text{H}, \text{s}), 2.70-3.10(3\text{H}, \text{m}), 3.40-3.70(2\text{H}, \text{m}), 3.894(3\text{H}, \text{s}), 3.94(3\text{H}, \text{s}), 5.14-5.50(3\text{H}, \text{m}), 7.30-7.51(4\text{H}, \text{m})$ 。

(實施例 5)

製造 1-[α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]咪唑

(i) 製造 2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)- α -甲氧亞胺苄基氯化物

在 1.09 克 (5 mmol) 之 2-氯甲基- α -甲氧亞胺苄基氯化物中, 加入 0.65 克 (5 mmol) 之 3-甲氧亞胺基-2-丁酮肟, 5 ml DMF, 與 1.04 克 (7.5 mmol) 之碳酸鉀在室溫下攪拌 3

五、發明說明(40)

天。反應後，加入100ml乙醚，用100ml食鹽水洗淨2次。乙醚層經無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所獲得之殘渣以矽凝膠層析法（醋酸乙酯／正己烷）予以精製，得0.97克(91.2%)之2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)- α -甲氧亞胺苄基氯化物的無色油狀物。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm: } 1.97(3\text{H}, \text{s}), 2.07(3\text{H}, \text{s}), 3.94(3\text{H}, \text{s}), 4.08(3\text{H}, \text{s}), 5.41(2\text{H}, \text{s}), 7.33-7.61(4\text{H}, \text{m})$ 。

(2) 製造1-[α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]咪唑

在0.27克(3.9 mmol)之咪唑中，加入3ml二甲基甲醯胺與0.16克(3.9 mmol)之60%氫化鈉，於室溫攪拌10分鐘後，加入0.40克(1.3 mmol)之2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)- α -甲氧亞胺苄基氯化物，在110℃下攪拌2小時，反應後，加入100ml乙醚，用80ml食鹽水洗淨2次。乙醚層經無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所得之殘渣以矽凝膠層析法（醋酸乙酯／正己烷）予以精製，獲得0.23克(51.1%)之1-[α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]咪唑之無色油狀物。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm: } 1.90(3\text{H}, \text{s}), 1.91(3\text{H}, \text{s}), 3.93(3\text{H}, \text{s}), 4.04(3\text{H}, \text{s}), 5.10(2\text{H}, \text{s}), 7.03(1\text{H}, \text{s}), 7.12(1\text{H}, \text{s}), 7.34-7.50(4\text{H}, \text{m}), 8.00(1\text{H}, \text{s})$ 。

(實施例6)

五、發明說明(41)

製造 3-[α -甲氧亞胺基-2-(2-二甲基亞肼基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]異噁唑

(1) 製造 3-[α -甲氧亞胺基-2-(1-甲基-2-氧代亞丙胺基氧甲基)苄基]異噁唑

在 2.95 克 (10 mmol) 之 3-(2-溴甲基- α -甲氧亞胺苄基)異噁唑中加入 20 ml 甲乙酮，1.52 克 (15 mmol) 3-氧代-2-丁酮肟及 2.76 克 (20 mmol) 碳酸鉀於還流下攪拌 5 小時。反應後，將除去不溶物後之反應液減壓濃縮所獲得之殘渣經由矽凝膠層析法（醋酸乙酯／正己烷）予以精製，獲得 2.60 克（收率 82.5%）之 3-[α -甲氧亞胺基-2-(1-甲基-2-氧代亞丙胺基氧甲基)苄基]異噁唑的無色結晶。

mp 86~87°C（部分以醋酸乙酯／正己烷再結晶）。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}$: 1.73(3H, s), 2.25(3H, s), 4.00(3H, s), 5.19(2H, s), 6.76(1H, d, $J=1.8$), 7.24-7.51(4H, m), 8.38(1H, d, $J=1.8$)。

(2) 製造 3-[α -甲氧亞胺基-2-(2-二甲吡唑基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]異噁唑

將 0.32 克 (1 mmol) 之 3-[α -甲氧亞胺苄基-2-(1-甲基-2-氧代亞丙胺基氧甲基)苄基]異噁唑溶解於 3 ml 甲醇，加入 0.23 ml (3 mmol) 之 N,N-二甲基聯氨在還流下攪拌 8 小時。反應後，將減壓濃縮所得之殘渣經矽凝膠層析法

（醋酸乙酯／正己烷）予以精製，得 0.19 克（收率 53.2%）之 3-[α -甲氧亞胺基-2-(2-二甲吡唑基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]異噁唑之無色油狀物。

五、發明說明(42)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm: } 1.87(3\text{H}, \text{s}), 1.99(3\text{H}, \text{s}), 2.54(6\text{H}, \text{s}), 4.00(3\text{H}, \text{s}), 5.09(2\text{H}, \text{s}), 6.74(1\text{H}, \text{d}, J=1.8), 7.24-7.53(4\text{H}, \text{m}), 8.37(1\text{H}, \text{d}, J=1.8)。$

(實施例 7)

製造 3-[2-(3-甲氧亞胺基-2-丁基氧亞胺甲基)- α -甲氧亞胺苄基]異噁唑

(i) 製造 3-(2-甲醯- α -甲氧亞胺苄基)異噁唑

在含有 3.12ml (36.4mmol) 草酸氯之 65ml 二氯甲烷溶液，於 -60°C 下歷 4 分鐘滴加以 2.77ml (39mmol) 之 DMSO，滴加後，在 $-70 \sim -60^\circ\text{C}$ 下攪拌 16 分鐘後。其次將 3.02 克 (13mmol) 3-(2-羥甲基- α -甲氧亞胺苄基)異噁唑溶解於 26ml 二氯甲烷所形成之溶液在 -60°C 以下，滴加 25 分鐘，滴下後，在 $-70 \sim -60^\circ\text{C}$ 下攪拌 25 分鐘。在 -60°C 以下以 5 分鐘的時間滴加 9.06ml (65mmol) 之三乙胺於反應溶液，從 -70°C 起至 -10°C 為止攪拌 1.5 小時。反應後，加入 250ml 半飽和氯化銨水溶液，並以 150ml 二氯甲烷萃取 2 次。將二氯甲烷層以無水硫酸鎂乾燥，經減壓濃縮所得之殘渣以矽凝膠層析法（醋酸乙酯／正己烷）予以精製，得 2.38 克（收率 78.9%）之 3-(2-甲醯- α -甲氧亞胺苄基)異噁唑之無色結晶。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm: } 3.99(3\text{H}, \text{s}), 6.87(1\text{H}, \text{d}, J=1.8), 7.40(1\text{H}, \text{d}, J=7.3), 7.61(1\text{H}, \text{t}, J=7.9), 7.71(1\text{H}, \text{td}, J=7.3, 2.3), 8.01(1\text{H}, \text{d}, J=7.3), 8.43(1\text{H}, \text{d}, J=1.8), 9.88(1\text{H}, \text{s})。$

五、發明說明(4)

(2) 製造 3-(2-羥基亞胺甲基- α -甲氧亞胺苄基)異噁唑

將 1.38 克 (6 mmol) 之 3-(2-甲醯- α -甲氧亞胺苄基)異噁唑溶解於 12 ml 甲醇，加入 0.83 克 (12 mmol) 羥基胺鹽酸鹽，1.31 ml (16.2 mmol) 吡啶在還流下攪拌 3 小時。反應後，加入 150 ml 0.1N 鹽酸水溶液，並用 100 ml 二氯甲烷萃取 2 次。將二氯甲烷層以無水硫酸鎂乾燥，經減壓濃縮所獲得之殘渣以矽凝膠層析法（醋酸乙酯／正己烷）予以精製，得 1.04 克（收率 70.7%）3-(2-羥基亞胺甲基- α -甲氧亞胺苄基)異噁唑之無色結晶。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm: } 4.00(3\text{H}, \text{s}), 6.79(1\text{H}, \text{d}, J=1.8), 7.24-7.51(4\text{H}, \text{m}), 7.87-7.91(1\text{H}, \text{m}), 7.97(1\text{H}, \text{s}), 8.41(1\text{H}, \text{d}, J=1.8)。$

(3) 製造 3-[2-(3-氧代-2-丁氧亞胺甲基)- α -甲氧亞胺苄基]異噁唑

將 0.37 克 (1.5 mmol) 之 3-(2-羥基亞胺甲基- α -甲氧亞胺苄基)異噁唑，在冰冷下加入 3 ml DMF，0.30 ml (3 mmol) 之 3-氯-2-丁酮及 0.09 克 (2.25 mmol) 之 60% 氫化鈉，於室溫下攪拌 4 小時。加 100 ml 乙醚於反應液，用 80 ml 食鹽水洗淨 2 次。乙醚層經無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所獲得之殘渣以矽凝膠層析法（醋酸乙酯／正己烷）予以精製，得 0.30 克（收率 63.4%）之 3-[2-(3-氧代-2-丁氧亞胺甲基)- α -甲氧亞胺苄基]異噁唑之無色油狀物。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm: } 1.35(3\text{H}, \text{d}, J=6.7), 2.12(3\text{H}, \text{s}), 3.99(3\text{H}, \text{s}), 4.54(1\text{H}, \text{q}, J=1.8), 6.78(1\text{H},$

五、發明說明(44)

d, J=1.8), 7.23-7.30(1H, m), 7.40-7.51(2H, m), 7.79-7.82(1H, m), 8.02(1H, s), 8.40(1H, d, J=1.8)。

(4) 製造 3-[2-(3-甲氧亞胺基-2-丁氧亞胺甲基)- α -甲氧亞胺苄基]異噁唑

將 0.19 克 (0.6 mmol) 之 3-[2-(3-氧代-2-丁氧亞胺甲基)- α -甲氧亞胺苄基]異噁唑溶解於 2 ml 甲醇，加入 0.08 克 (0.9 mmol) 之甲氧基胺鹽酸鹽及 0.08 克 (1.02 mmol) 吡啶在還流下攪拌 1 小時。反應後，加入 100 ml 0.1N 鹽酸水溶液，用 50 ml 二氯甲烷萃取 2 次。二氯甲烷層用無水硫酸鎂予以乾燥，經減壓濃縮所獲得之殘渣以矽凝膠層析法（醋酸乙酯／正己烷）予以精製，得 0.18 克（收率 87.1%）之 3-[2-(3-甲氧亞胺基-2-丁氧亞胺甲基)- α -甲氧亞胺苄基]異噁唑之無色油狀物。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}$: 1.36(3H, d, J=6.7), 1.76(3H, s), 3.89(3H, s), 3.98(3H, s), 4.74(1H, q, J=6.7), 6.79(1H, d, J=1.2), 7.24-7.26(1H, m), 7.40-7.48(2H, m), 7.84-7.90(1H, m), 7.93(1H, s), 8.39(1H, d, J=1.2)。

(實施例 8)

製造 3-[2-(2-異丙氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)- α -甲氧亞胺苄基]異噁唑

(i) 製造 3-[2-(2-羥亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)- α -甲氧亞胺苄基]異噁唑

將 1.58 克 (5 mmol) 之 3-[α -甲氧亞胺基-2-(1-甲基-2-

五、發明說明(45)

氧代亞丙胺基氧甲基)苄基]異噁唑溶解於10ml甲醇，加入0.52克(7.5mmol)羥基胺鹽酸鹽及0.67克(8.5mmol)吡啶在還流下攪拌1小時。反應後，加入150ml 0.1N鹽酸水溶液，用100ml二氯甲烷萃取2次。二氯甲烷層以無水硫酸鎂予以乾燥，減壓濃縮所獲得之殘渣以醋酸乙酯/正己烷進行再結晶，得1.26克(收率76.3%)3-[2-(2-羥亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)- α -甲氧亞胺苄基]異噁唑之無色結晶。

mp 109~110℃

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}: 1.83(3\text{H}, \text{s}), 1.96(3\text{H}, \text{s}), 4.00(3\text{H}, \text{s}), 5.10(2\text{H}, \text{s}), 6.74(1\text{H}, \text{d}, J=1.8), 7.24-7.27(1\text{H}, \text{m}), 7.37-7.52(4\text{H}, \text{m}), 8.38(1\text{H}, \text{d}, J=1.8)。$

(2) 製造3-[2-(2-異丙氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)- α -甲氧亞胺苄基]異噁唑

在冰冷下於0.33克(1mmol)3-[2-(2-羥亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)- α -甲氧亞胺苄基]異噁唑加入2ml DMF, 0.13ml(1.3mmol)碘丙烷及0.05克(1.3mmol)60%氫化鈉，在室溫攪拌2小時，加100ml乙醚於反應液，以80ml食鹽水洗淨2次。乙醚層以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所獲得之殘渣以矽凝膠層析法(醋酸乙酯/正己烷)予以精製後，再予以再結晶，得0.30克(收率63.4%)之3-[2-(2-異丙氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)- α -甲氧亞胺苄基]異噁唑之無色結晶。

mp 97~98℃

415830

五、發明說明(46)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm: } 1.24(6\text{H}, \text{d}, J=6.1), 1.86(3\text{H}, \text{s}), 1.90(3\text{H}, \text{s}), 4.00(3\text{H}, \text{s}), 4.35(1\text{H}, \text{sept}, J=6.1), 5.08(2\text{H}, \text{s}), 6.74(1\text{H}, \text{d}, J=1.8), 7.23-7.52(4\text{H}, \text{m}), 8.37(1\text{H}, \text{d}, J=1.2)。$

(實施例 9)

製造 2-[α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]-1,3,4-噁二唑

(1) 製造 α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄乙酸鹽肼

在 1.01 克 (3 mmol) 之 α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄乙酸甲酯中，加入 6 ml 甲醇，6 ml THF 與 0.6 克 (12 mmol) 之肼水合物在室溫下攪拌 2 天。反應後，加 200 ml 水，用 80 ml 二氯甲烷萃取 2 次，二氯甲烷層以無水硫酸鎂乾燥後，將減壓濃縮所獲得之殘渣再結晶（醋酸乙酯／正己烷）得 0.80 克 (79.2%) 之 α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄乙酸鹽肼之無色油狀物。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm: } 1.95(3\text{H}, \text{s}), 1.99(3\text{H}, \text{s}), 3.91(2\text{H}, \text{brs}), 3.93(3\text{H}, \text{s}), 3.96(3\text{H}, \text{s}), 5.06(2\text{H}, \text{s}), 7.17-7.20(1\text{H}, \text{m}), 7.34-7.48(3\text{H}, \text{m}), 7.77(1\text{H}, \text{s})。$

(2) 製造 2-[α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]-1,3,4-噁二唑

在 0.34 克 (1 mmol) 之 α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄乙酸鹽肼中，加入 1 ml 正甲

五、發明說明 (415830)

酸乙酯在還流下攪拌1小時後將減壓濃縮所獲得之殘渣加入2ml苯與0.02克(0.1mmol)對甲苯磺酸水合物在還流下攪拌45分鐘。加100ml乙醚於反應液，用80ml食鹽水洗淨2次。乙醚層以無水硫酸鎂乾燥後，經減壓濃縮所獲得之殘渣以矽凝膠層析法(醋酸乙酯/正己烷)予以精製後再施予再結晶(醋酸乙酯/正己烷)，得0.23克(收率65.7%)之2-[α -甲氧亞胺基-2-(2-甲氧亞胺基-1-甲基亞丙胺基氧甲基)苄基]-1,3,4-噁二唑之無色結晶。

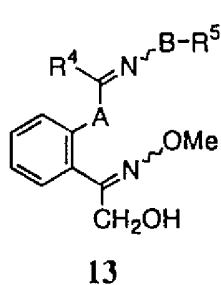
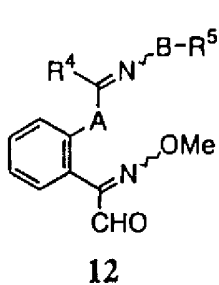
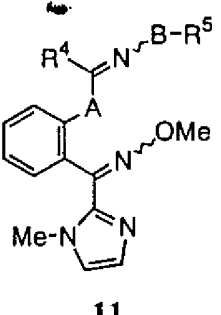
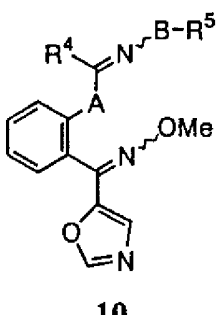
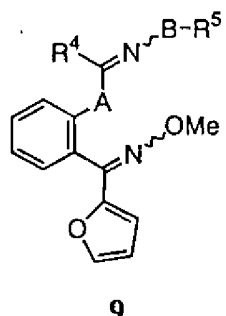
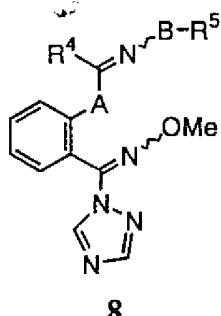
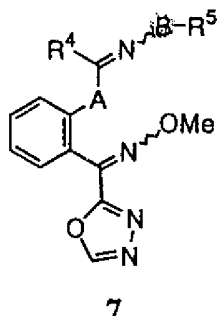
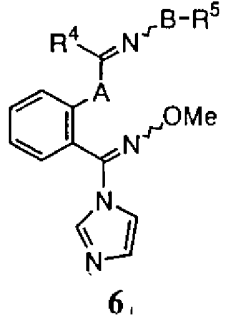
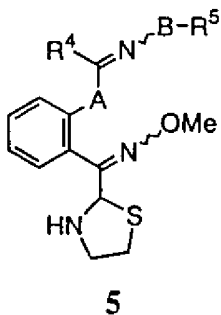
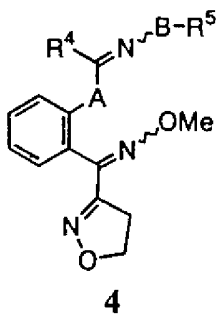
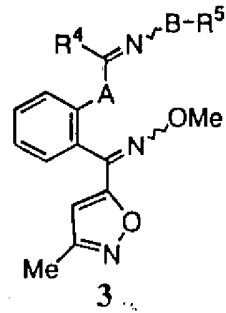
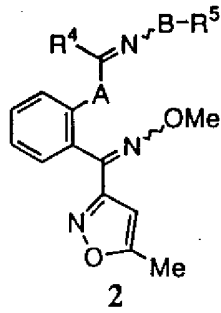
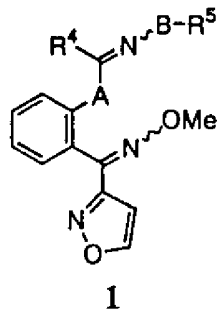
mp 110~111℃

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm: } 1.84(3\text{H}, \text{s}), 1.89(3\text{H}, \text{s}), 3.92(3\text{H}, \text{s}), 4.09(3\text{H}, \text{s}), 5.10(2\text{H}, \text{s}), 7.28-7.32(1\text{H}, \text{m}), 7.40-7.53(3\text{H}, \text{m}), 8.43(1\text{H}, \text{s})。$

仿上述實施例所獲得之由一般式所代表化合物的例子則由以下化合物群1~14予以表示，化合物群1~14之取代基A，B，R⁴，R⁶之組合例即由表1~22所示。彼等化合物的物性即由表23~24表示。又，在表中，亦併述有以上實施例所得化合物的物性值。又，表23~24中之化合物編號及後述試驗中的化合物編號，係表示化合物群的編號與表1~22取代基組合例中之編號，例如化合物編號3-2即表示為化合物群之3而取代基組合例之編號為2者。

五、發明說明 (415830)

化合物群



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (49)

表 1

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
1	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	H
2	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	Me
3	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	Et
4	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	n-Pr
5	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	i-Pr
6	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	n-Bu
7	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	i-Bu
8	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	s-Bu
9	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	正戊基
10	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	正己基
11	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	CHF_2
12	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	烯丙基
13	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	2-丙炔基
14	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	2-丁炔基
15	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	2-氧代丙基
16	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	$\text{MeOC}(=\text{O})-$
17	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	$\text{EtOC}(=\text{O})-$
18	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	$\text{EtOC}(=\text{O})\text{CH}_2-$
19	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	$\text{EtOC}(=\text{O})\text{CH}(\text{Me})-$
20	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	$\text{MeOC}(=\text{O})\text{CH}_2-$

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

5X

五、發明說明 (50)

表 2

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
21	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	Ph
22	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	苯基
23	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	α -甲苄基
24	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	2-甲苄基
25	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	3-甲苄基
26	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	4-甲苄基
27	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	2-氯苄基
28	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	3-氯苄基
29	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	4-氯苄基
30	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	MeOCH_2-
31	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	EtOCH_2-
32	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	$\text{MeO}(\text{CH}_2)_2-$
33	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	$\text{EtO}(\text{CH}_2)_2-$
34	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	乙醚基
35	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	NCCH_2-
36	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	$\text{NC}(\text{CH}_2)_2-$
37	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	c-Pentyl
38	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	c-Pentyl CH_2-
39	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	5-甲基-異噁唑 -3-基甲基
40	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	CF_3CH_2-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紙

五、發明說明 (51)

表 3

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
41	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	H
42	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	Me
43	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	Et
44	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	n-Pr
45	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	i-Pr
46	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	n-Bu
47	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	i-Bu
48	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	s-Bu
49	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	正戊基
50	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	正己基
51	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	CHF_2
52	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	烯丙基
53	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	2-丙炔基
54	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	2-丁炔基
55	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	2-氧代丙基
56	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	$\text{MeOC}(=\text{O})-$
57	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	$\text{EtOC}(=\text{O})-$
58	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	$\text{EtOC}(=\text{O})\text{CH}_2-$
59	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	$\text{EtOC}(=\text{O})\text{CH}(\text{Me})-$
60	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	$\text{MeOC}(=\text{O})\text{CH}_2-$

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (52)

表 4

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
61	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	Ph
62	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	苯基
63	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	α -甲苄基
64	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	2-甲苄基
65	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	3-甲苄基
66	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	4-甲苄基
67	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	2-氯苄基
68	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	3-氯苄基
69	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	4-氯苄基
70	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	MeOCH_2-
71	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	EtOCH_2-
72	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	$\text{MeO}(\text{CH}_2)_2-$
73	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	$\text{EtO}(\text{CH}_2)_2-$
74	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	乙醯基
75	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	NCCH_2-
76	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	$\text{NC}(\text{CH}_2)_2-$
77	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	c-Pentyl
78	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	c-Pentyl CH_2-
79	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	5-甲基-異噁唑 -3-基甲基
80	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Et	CF_3CH_2-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紙

五、發明說明 (53)

表 5

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
81	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	H
82	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	Me
83	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	Et
84	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	n-Pr
85	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	i-Pr
86	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	n-Bu
87	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	i-Bu
88	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	s-Bu
89	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	正戊基
90	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	正己基
91	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	CHF ₂
92	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	烯丙基
93	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	2-丙炔基
94	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	2-丁炔基
95	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	2-氯代丙基
96	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	MeOC(=O)-
97	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	EtOC(=O)-
98	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	EtOC(=O)CH ₂ -
99	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	EtOC(=O)CH(Me)-
100	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	MeOC(=O)CH ₂ -

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (54)

表 6

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
101	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	Me	Ph	
102	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	苯基
103	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	α -甲苄基
104	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	2-甲苄基
105	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	3-甲苄基
106	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	4-甲苄基
107	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	2-氯苄基
108	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	3-氯苄基
109	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	4-氯苄基
110	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	MeOCH_2-
111	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	EtOCH_2-
112	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	$\text{MeO}(\text{CH}_2)_2-$
113	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	$\text{EtO}(\text{CH}_2)_2-$
114	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	乙醯基
115	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	NCCH_2-
116	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	$\text{NC}(\text{CH}_2)_2-$
117	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	c-Pentyl
118	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	c-Pentyl CH_2-
119	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	5-甲基-異噁唑 -3-基甲基
120	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	CF_3CH_2-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紙

五、發明說明 (55)

表 7

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
121	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	H
122	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	Me
123	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	Et
124	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	n-Pr
125	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	i-Pr
126	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	n-Bu
127	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	i-Bu
128	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	s-Bu
129	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	正戊基
130	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	正己基
131	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	CHF_2
132	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	烯丙基
133	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	2-丙炔基
134	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	2-丁炔基
135	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	2-氯代丙基
136	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	$\text{MeOC}(=\text{O})-$
137	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	$\text{EtOC}(=\text{O})-$
138	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	$\text{EtOC}(=\text{O})\text{CH}_2-$
139	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	$\text{EtOC}(=\text{O})\text{CH}(\text{Me})-$
140	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	$\text{MeOC}(=\text{O})\text{CH}_2-$

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (56)

表 8

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
141	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	Ph
142	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	苯基
143	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	α -甲苄基
144	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	2-甲苄基
145	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	3-甲苄基
146	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	4-甲苄基
147	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	2-氯苄基
148	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	3-氯苄基
149	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	4-氯苄基
150	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	MeOCH_2-
151	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	EtOCH_2-
152	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	$\text{MeO}(\text{CH}_2)_2-$
153	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	$\text{EtO}(\text{CH}_2)_2-$
154	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	乙醚基
155	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	NCCH_2-
156	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	$\text{NC}(\text{CH}_2)_2-$
157	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	c-Pentyl
158	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	c-Pentyl CH_2-
159	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	5-甲基-異噁唑 -3-基甲基
160	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Et	CF_3CH_2-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (57)

表 9

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
161	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	H
✓ 162	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	Me
163	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	Et
164	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	n-Pr
165	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	i-Pr
166	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	n-Bu
167	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	i-Bu
168	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	s-Bu
169	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	正戊基
170	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	正己基
171	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	CHF ₂
172	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	烯丙基
173	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	2-丙炔基
174	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	2-丁炔基
175	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	2-氧代丙基
176	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	MeOC(=O)-
177	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	EtOC(=O)-
178	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	EtOC(=O)CH ₂ -
179	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	EtOC(=O)CH(Me)-
180	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	MeOC(=O)CH ₂ -

(請先閱讀背面之注意事項，填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (58)

表 1 0

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
181	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	Ph
182	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	苯基
183	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	α -甲苄基
184	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	2-甲苄基
185	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	3-甲苄基
186	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	4-甲苄基
187	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	2-氯苄基
188	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	3-氯苄基
189	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	4-氯苄基
190	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	MeOCH ₂ -
191	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	EtOCH ₂ -
192	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	MeO(CH ₂) ₂ -
193	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	EtO(CH ₂) ₂ -
194	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	乙醯基
195	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	NCCH ₂ -
196	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	NC(CH ₂) ₂ -
197	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	Me	n-Pentyl
198	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	n-PentylCH ₂ -
199	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	5-甲基-異噁唑 -3-基甲基
200	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	CF ₃ CH ₂ -

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (59)

表 1 1

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
201	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Me	Me
202	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Me	Et
203	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Me	n-Pr
204	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Me	i-Pr
205	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Me	烯丙基
206	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Me	2-丙炔基
207	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Me	苄基
208	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Me	4-氯苄基
209	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Me	MeOCH_2-
210	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Me	EtOCH_2-
211	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Et	Me
212	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Et	Et
213	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Et	n-Pr
214	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Et	i-Pr
215	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Et	烯丙基
216	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Et	2-丙炔基
217	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Et	苄基
218	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Et	4-氯苄基
219	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Et	MeOCH_2-
220	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{CN})-$	O	Et	EtOCH_2-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (60)

表 1 2

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
221	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Ph	Me
222	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Ph	Et
223	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Ph	n-Pr
224	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Ph	i-Pr
225	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Ph	烯丙基
226	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Ph	2-丙炔基
227	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Ph	苄基
228	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Ph	4-氯苄基
229	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Ph	MeOCH_2-
230	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Ph	EtOCH_2-
231	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOMe	Me
232	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOMe	Et
233	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOMe	n-Pr
234	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOMe	i-Pr
235	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOMe	烯丙基
236	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOMe	2-丙炔基
237	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOMe	苄基
238	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOMe	4-氯苄基
239	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOMe	MeOCH_2-
240	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOMe	EtOCH_2-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (61)

表 1 3

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
241	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	Me
242	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	Et
243	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	n-Pr
244	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	i-Pr
245	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	烯丙基
246	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	2-丙炔基
247	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	苄基
248	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	4-氯苄基
249	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	MeOCH_2-
250	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	EtOCH_2-
251	$-\text{CH}_2\text{N}(\text{Ac})\text{N}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	Me
252	$-\text{CH}_2\text{N}(\text{Ac})\text{N}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	Et
253	$-\text{CH}_2\text{N}(\text{Ac})\text{N}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	n-Pr
254	$-\text{CH}_2\text{N}(\text{Ac})\text{N}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	i-Pr
255	$-\text{CH}_2\text{N}(\text{Ac})\text{N}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	烯丙基
256	$-\text{CH}_2\text{N}(\text{Ac})\text{N}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	2-丙炔基
257	$-\text{CH}_2\text{N}(\text{Ac})\text{N}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	苄基
258	$-\text{CH}_2\text{N}(\text{Ac})\text{N}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	4-氯苄基
259	$-\text{CH}_2\text{N}(\text{Ac})\text{N}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	MeOCH_2-
260	$-\text{CH}_2\text{N}(\text{Ac})\text{N}=\text{C}(\text{Me})-$	O	Me	EtOCH_2-

五、發明說明 (62)

表 1 4

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
261	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NH	Me	Me
262	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NH	Me	Et
263	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NH	Me	n-Pr
264	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NH	Me	i-Pr
265	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NH	Me	烯丙基
266	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NH	Me	2-丙炔基
267	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NH	Me	苄基
268	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NH	Me	4-氯苄基
269	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NH	Me	MeOCH_2-
270	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NH	Me	EtOCH_2-
271	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NMe	Me	Me
272	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NMe	Me	Et
273	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NMe	Me	n-Pr
274	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NMe	Me	i-Pr
275	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NMe	Me	烯丙基
276	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NMe	Me	2-丙炔基
277	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NMe	Me	苄基
278	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NMe	Me	4-氯苄基
279	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NMe	Me	MeOCH_2-
280	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	NMe	Me	EtOCH_2-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明(63)

表 1 5

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
281	-CH=NOCH(Me)-	NH	Me	Me
282	-CH=NOCH(Me)-	NH	Me	Et
283	-CH=NOCH(Me)-	NH	Me	n-Pr
284	-CH=NOCH(Me)-	NH	Me	i-Pr
285	-CH=NOCH(Me)-	NH	Me	烯丙基
286	-CH=NOCH(Me)-	NH	Me	2-丙炔基
287	-CH=NOCH(Me)-	NH	Me	苄基
288	-CH=NOCH(Me)-	NH	Me	4-氯苄基
289	-CH=NOCH(Me)-	NH	Me	MeOCH ₂ -
290	-CH=NOCH(Me)-	NH	Me	EtOCH ₂ -
291	-CH=NOCH(Me)-	NMe	Me	Me
292	-CH=NOCH(Me)-	NMe	Me	Et
293	-CH=NOCH(Me)-	NMe	Me	n-Pr
294	-CH=NOCH(Me)-	NMe	Me	i-Pr
295	-CH=NOCH(Me)-	NMe	Me	烯丙基
296	-CH=NOCH(Me)-	NMe	Me	2-丙炔基
297	-CH=NOCH(Me)-	NMe	Me	苄基
298	-CH=NOCH(Me)-	NMe	Me	4-氯苄基
299	-CH=NOCH(Me)-	NMe	Me	MeOCH ₂ -
300	-CH=NOCH(Me)-	NMe	Me	EtOCH ₂ -

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (64)

表 1 6

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
301	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	Me	4-Cl- α -Me- Benzyl
302	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	Me	c-Hexyl
303	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	Me	Cl(CH ₂) ₂ -
304	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	Me	Cl(CH ₂) ₃ -
305	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	Me	3,4-Cl ₂ -Benzyl
306	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	4-Cl- α -Me- Benzyl
307	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	c-Hexyl
308	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	Cl(CH ₂) ₂ -
309	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	Cl(CH ₂) ₃ -
310	-CH=NOCH(Me)-	O	Me	3,4-Cl ₂ -Benzyl
311	-CH ₂ ON=C(Et)-	O	Me	4-Cl- α -Me- Benzyl
312	-CH ₂ ON=C(Et)-	O	Me	c-Hexyl
313	-CH ₂ ON=C(Et)-	O	Me	Cl(CH ₂) ₂ -
314	-CH ₂ ON=C(Et)-	O	Me	Cl(CH ₂) ₃ -
315	-CH ₂ ON=C(Et)-	O	Me	3,4-Cl ₂ -Benzyl
316	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	4-Cl- α -Me- Benzyl
317	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	c-Hexyl
318	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	Cl(CH ₂) ₂ -
319	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	Cl(CH ₂) ₃ -
320	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	3,4-Cl ₂ -Benzyl

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (65)

表 1 7

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
321	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	H	Me
322	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	H	Et
323	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	H	n-Pr
324	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	H	i-Pr
325	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	H	烯丙基
326	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	H	2-丙炔基
327	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	H	苄基
328	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	H	4-氯苄基
329	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	H	MeOCH_2-
330	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	H	EtOCH_2-
331	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOEt	Me
332	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOEt	Et
333	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOEt	n-Pr
334	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOEt	i-Pr
335	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOEt	烯丙基
336	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOEt	2-丙炔基
337	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOEt	苄基
338	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOEt	4-氯苄基
339	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOEt	MeOCH_2-
340	$-\text{CH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})-$	O	COOEt	EtOCH_2-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紙

五、發明說明(66)

表 1 8

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
341	-CH=NOCH(Me)-	O	H	Me
342	-CH=NOCH(Me)-	O	H	Et
343	-CH=NOCH(Me)-	O	H	n-Pr
344	-CH=NOCH(Me)-	O	H	i-Pr
345	-CH=NOCH(Me)-	O	H	烯丙基
346	-CH=NOCH(Me)-	O	H	2-丙炔基
347	-CH=NOCH(Me)-	O	H	苄基
348	-CH=NOCH(Me)-	O	H	4-氯苄基
349	-CH=NOCH(Me)-	O	H	MeOCH ₂ -
350	-CH=NOCH(Me)-	O	H	EtOCH ₂ -
351	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	CN	Me
352	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	CN	Et
353	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	CN	n-Pr
354	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	CN	i-Pr
355	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	CN	烯丙基
356	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	CN	2-丙炔基
357	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	CN	苄基
358	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	CN	4-氯苄基
359	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	CN	MeOCH ₂ -
360	-CH ₂ ON=C(Me)-	O	CN	EtOCH ₂ -

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(67)

表 1 9

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
361	-CH=NOCH(Me)-	O	Ph	Me
362	-CH=NOCH(Me)-	O	Ph	Et
363	-CH=NOCH(Me)-	O	Ph	n-Pr
364	-CH=NOCH(Me)-	O	Ph	i-Pr
365	-CH=NOCH(Me)-	O	Ph	烯丙基
366	-CH=NOCH(Me)-	O	Ph	2-丙炔基
367	-CH=NOCH(Me)-	O	Ph	苄基
368	-CH=NOCH(Me)-	O	Ph	4-氯苄基
369	-CH=NOCH(Me)-	O	Ph	MeOCH ₂ -
370	-CH=NOCH(Me)-	O	Ph	EtOCH ₂ -
371	-CH ₂ ON=C(Me)-	NPh	Me	Me
372	-CH ₂ ON=C(Me)-	NPh	Me	Et
373	-CH ₂ ON=C(Me)-	NPh	Me	n-Pr
374	-CH ₂ ON=C(Me)-	NPh	Me	i-Pr
375	-CH ₂ ON=C(Me)-	NPh	Me	烯丙基
376	-CH ₂ ON=C(Me)-	NPh	Me	2-丙炔基
377	-CH ₂ ON=C(Me)-	NPh	Me	苄基
378	-CH ₂ ON=C(Me)-	NPh	Me	4-氯苄基
379	-CH ₂ ON=C(Me)-	NPh	Me	MeOCH ₂ -
380	-CH ₂ ON=C(Me)-	NPh	Me	EtOCH ₂ -

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(68)

表 20

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
381	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	H
382	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	Me
383	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	Et
384	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	n-Pr
385	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	i-Pr
386	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	n-Bu
387	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	i-Bu
388	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	s-Bu
389	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	正戊基
390	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	正己基
391	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	CHF ₂
392	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	烯丙基
393	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	2-丙炔基
394	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	2-丁炔基
395	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	2-氧代丙基
396	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	MeOC(=O)-
397	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	EtOC(=O)-
398	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	EtOC(=O)CH ₂ -
399	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	EtOC(=O)CH(Me)-
400	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	MeOC(=O)CH ₂ -

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

封

五、發明說明 (69)

表 2 1

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
401	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	Ph
402	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	苯基
403	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	α -甲苄基
404	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	2-甲苄基
405	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	3-甲苄基
406	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	4-甲苄基
407	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	2-氯苄基
408	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	3-氯苄基
409	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	4-氯苄基
410	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	MeOCH ₂ -
411	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	EtOCH ₂ -
412	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	MeO(CH ₂) ₂ -
413	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	EtO(CH ₂) ₂ -
414	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	乙醯基
415	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	NOCH ₂ -
416	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	NC(CH ₂) ₂ -
417	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	c-Pentyl
418	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	c-PentylCH ₂ -
419	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	5-甲基-異噁唑 -3-基甲基
420	-CH=NOCH(Et)-	O	Me	CF ₃ CH ₂ -

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紙

五、發明說明 (70)

表 2 2

No.	A	B	R ⁴	R ⁵
421	$-\text{CH}=\text{NOC}(\text{Me})_2-$	O	Me	Me
422	$-\text{CH}=\text{NOC}(\text{Me})_2-$	O	Me	Et
423	$-\text{CH}=\text{NOC}(\text{Me})_2-$	O	Me	n-Pr
424	$-\text{CH}=\text{NOC}(\text{Me})_2-$	O	Me	i-Pr
425	$-\text{CH}=\text{NOC}(\text{Me})_2-$	O	Me	烯丙基
426	$-\text{CH}=\text{NOC}(\text{Me})_2-$	O	Me	2-丙炔基
427	$-\text{CH}=\text{NOC}(\text{Me})_2-$	O	Me	苄基
428	$-\text{CH}=\text{NOC}(\text{Me})_2-$	O	Me	4-氯苄基
429	$-\text{CH}=\text{NOC}(\text{Me})_2-$	O	Me	MeOCH_2-
430	$-\text{CH}=\text{NOC}(\text{Me})_2-$	O	Me	EtOCH_2-
431	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	Me
432	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	Et
433	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	n-Pr
434	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	i-Pr
435	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	烯丙基
436	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	苄基
438	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	4-氯苄基
439	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	MeOCH_2-
440	$-\text{CH}=\text{NN}=\text{C}(\text{Et})-$	O	Me	EtOCH_2-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紙

五、發明說明 (71)

表 2 3

No	物理數據
1-1	mp 109~110°C
1-2	mp 125~126.5°C
1-5	mp 97~98°C
1-12	¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm : 1.85(3H, s), 1.93(3H, s), 4.00(3H, s), 4.60-4.63(2H, m), 5.09(2H, s), 5.17-5.32(2H, m), 5.92-6.06(1H, m), 6.74(1H, d, J=1.8), 7.24-7.51(4H, m), 8.37(1H, d, J=1.8).
1-29	mp 133.5~134.5°C
1-30	mp 56~59°C
1-162	¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm : 1.36(3H, d, J=6.7), 1.76(3H, s), 3.89(3H, s), 4.74(1H, q, J=6.7), 6.79(1H, d, J=1.2), 7.24-7.26(1H, m), 7.40-7.48(2H, m), 7.84-7.90(1H, m), 7.93(1H, s), 8.39(1H, d, J=1.2).
1-211	mp 122~123.5°C
1-221	mp 135.5~136.5°C
1-231	¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm : 1.84(3H, s), 3.80(3H, s), 3.96(3H, s), 3.99(3H, s), 5.07(2H, s), 6.74(1H, d, J=1.8), 7.22-7.48(4H, m), 8.38(1H, d, J=1.8).
1-271	¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm : 1.87(3H, s), 1.99(3H, s), 2.54(6H, s), 4.00(3H, s), 5.09(2H, s), 6.74(1H, d, J=1.8), 7.24-7.53(4H, m), 8.37(1H, d, J=1.8).

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

外

五、發明說明(72)

表 2 4

No	物理數據
3-2	mp 99~100°C
4-2	mp 78~79°C
5-2	mp 83~84.5°C
6-2	¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm : 1.90(3H, s), 1.91(3H, s), 3.93(3H, s), 4.04(3H, s), 5.10(2H, s), 7.03(1H, s), 7.12(1H, s), 7.34-7.50(4H, m), 8.00(1H, s).
7-2	mp 110~111°C
8-2	¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm : 1.90(3H, s), 1.92(3H, s), 3.93(3H, s), 4.10(3H, s), 4.98(2H, s), 7.41-7.53(4H, m), 7.94(1H, s), 9.14(1H, s).
9-2	¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm : 1.87(3H, s), 1.90(3H, s), 3.92(3H, s), 3.98(3H, s), 5.10(2H, s), 6.11(1H, d, J=4.3), 6.36(1H, dd, J=3.7, 1.8), 7.22(1H, dd, J=7.3, 1.1.8), 7.35-7.53(4H, m).
10-2	mp 84~85°C
12-2	mp 61~63°C
13-2	mp 84~85°C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(73)

其次就本發明殺菌劑的效果由以下之試驗例逐加說明之。

[1.散佈在莖葉中對各種植物病害之防除試驗(盆栽試驗)]

試驗方法

將化合物溶解在少量之N,N-二甲基甲醯胺，以含有展著劑之蒸餾水稀釋至所定濃度調製成被檢液。將被檢液噴霧處理檢定植物，經24小時後，由以下所述方法接種病原菌。

並由下式求出其防除率

(無處理區之發病程度・病斑數等-處理區之發病程度・病斑數等)

$$\text{防除率(\%)} = 100 \times \frac{\text{(無處理區之發病程度・病斑數等)} - \text{(處理區之發病程度・病斑數等)}}{\text{(無處理區之發病程度・病斑數等)}}$$

試驗例1

稻熱病防除效果試驗

將播種2星期後之稻苗(品種：愛知旭)移植在直徑9公分之塑膠杯，經育苗2星期後，將化合物溶液或懸濁液散佈處理在莖葉部。經噴霧以培養在燕麥粉培養基之稻熱病菌(*pyricularia oryzae*)的分子孢子懸浮液進行病原菌的接種，接種後在濕室(28℃, 100%RH)保持24小時，再於溫室育苗5天。接種6天後測定呈現在接

五、發明說明 (74)

種葉的病斑數並求出其防除率。

結果如以下所示。

化 合 物 編 號	在 莖 葉 部 散 佈 以 500ppm時 , 對 稻 熱 病 的 預 防 效 果 (防 除 率)
1-5	97
1-12	90
1-30	95
1-162	90
1-221	90
1-231	90
1-271	90
4-2	97
7-2	97
8-2	97
9-2	90
13-2	97
對 照 藥 劑 : 法 撒 拉 得	97

(Fthalide)

試驗例 2

黃瓜白粉病防除效果試驗

播種在直徑9公分塑膠杯上經育苗2~3週後，在黃瓜苗（品種：筑波白疣）的第1支葉表面散佈處理以化合物溶液或懸浮液。將培養在黃瓜葉子上面之黃瓜白粉病菌（*sphaerotheca fuliginea*）的分生孢子懸浮液施加噴

五、發明說明(75)

霧進行病原菌的接種。接種後保持在20℃的溫室10天，然後調查在接種葉上所呈現徵兆之佔有面積程度並求出其防除率。

結果如下所示。

化 合 物 編 號	在莖葉部散佈以500ppm時， 黃瓜白粉病的預防效果(防除率)
1-1	97
1-2	100
1-5	100
1-12	100
1-29	100
1-30	100
1-162	100
1-221	100
1-231	100
1-271	100
3-2	100
4-2	100
5-2	100
6-2	100
7-2	100
9-2	100
12-2	100
13-2	100
對照藥劑：法蘭黑莫	100

(Fenarimol)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明(76)

試驗例 3

黃瓜灰霉病防除效果試驗

於播種在直徑 9 公分塑膠杯經育苗 2~3 星期後之黃瓜
(品種：筑波白疣) 的第 1 葉子表面散佈處理以化合物
溶液或懸浮液，然後將培養在蔗糖加用馬鈴薯煎汁之瓊
脂培養基之灰霉病菌 (*Botrytis cinerea*) 的菌絲圓盤
(ϕ 4mm) 放置在黃瓜葉表面進行病原菌的接種。接種後
保持在 20℃ 之濕室歷 3 天，測定病斑直徑求出其防除率。

結果如以下所示。

化合物	在莖葉部散佈以 500ppm 時，
編號	黃瓜灰霉病的預防效果

1-12	70
1-162	70
1-231	70
4-2	70
5-2	70
6-2	70
7-2	70
12-2	70
13-2	70

對照藥劑：

伊普羅日旺 (iprodione) 100

試驗例 4

五、發明說明(77)

小麥白粉病防除效果試驗

於播種在直徑9公分塑膠內徑育苗2~3星期後之小麥(品種：農林61號)苗散佈處理以化合物溶液或懸浮液。並將培養在小麥葉上小麥白粉病菌(*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*)的分生孢子擴散抖落在被檢定之植物上，進行病原菌接種。接種後保持在20℃溫室10天，調查在接種葉所呈現病害徵兆之佔有面積程度並求出其防除率。

化合物

在莖葉部散佈以500ppm時，

編號

對小麥白粉病之預防效果(防除率)

1-1	97
1-5	90
1-12	97
1-30	97
1-162	90
1-221	90
3-2	90
4-2	100
5-2	97
7-2	100
8-2	90
10-2	90
12-2	90
13-2	97

對照藥劑：飛納里摩 97

(Fenarimol)

五、發明說明(78)

商業上的可利用性

由於本發明化合物具有廣泛殺菌光譜，確屬為一種有用之殺菌，特別是農業用殺菌劑。

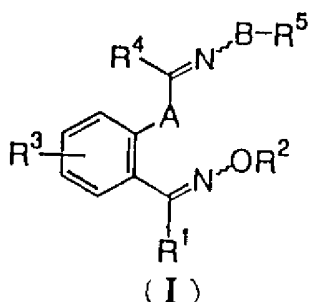
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

四、中文發明摘要 (發明之名稱： α -烷氧亞胺苄基衍生物及其為有效成分之農藥)

一種一般式 (I) 所代表之化合物，



式中， R^1 為一可經 C_{1-6} 烷基取代之咪唑基、異噁唑基、異噁唑啉基、噁二唑基、呋喃基、噁唑基、三唑基或噻唑烷基，或 CHO 或 CH_2OH ； R^2 為 C_{1-6} 烷基， R^3 為氫原子； R^4 為氫原子、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基或苯基； R^5 為氫原子、一可經 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基取代之 C_{1-6} 烷基或 C_{2-6} 鏈烯基、或一可經鹵素取代之苄基； A 為 (1) $-CH_2ON=C(R^7)-$ [R^7 為氫原子、 C_{1-6} 烷基或氰基] 或 (3) $-CH=NOC(R^9)(R^{10})-$ [R^9 與 R^{10} 各獨立地代表氫原子或 C_{1-6} 烷基]； B 為氧原子或 NR^{11} (R^{11} 為 C_{1-6} 烷基)；波線 (~) 代表 E 體、Z 體或其混合物之任何配置。

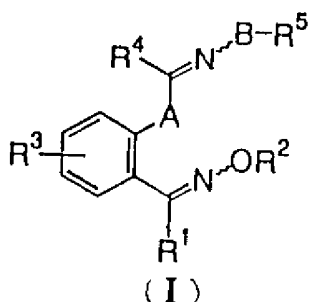
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

四、中文發明摘要 (發明之名稱： α -烷氧亞胺苄基衍生物及其為有效成分之農藥)

一種一般式 (I) 所代表之化合物，



式中， R^1 為一可經 C_{1-6} 烷基取代之咪唑基、異噁唑基、異噁唑啉基、噁二唑基、呋喃基、噁唑基、三唑基或噻唑烷基，或 CHO 或 CH_2OH ； R^2 為 C_{1-6} 烷基， R^3 為氫原子； R^4 為氫原子、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基或苯基； R^5 為氫原子、一可經 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基取代之 C_{1-6} 烷基或 C_{2-6} 鏈烯基、或一可經鹵素取代之苄基； A 為 (1) $-CH_2ON=C(R^7)-$ [R^7 為氫原子、 C_{1-6} 烷基或氰基] 或 (3) $-CH=NOC(R^9)(R^{10})-$ [R^9 與 R^{10} 各獨立地代表氫原子或 C_{1-6} 烷基]； B 為氧原子或 NR^{11} (R^{11} 為 C_{1-6} 烷基)；波線 (~) 代表 E 體、Z 體或其混合物之任何配置。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

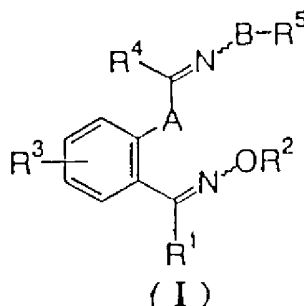
裝

訂

四、中文發明摘要 (發明之名稱：

ALKOXYIMINO BENZYL
DERIVATIVES AND PESTICIDES
CONTAINING THE SAME AS
ACTIVE INGREDIENT

A compound of the formula (I):

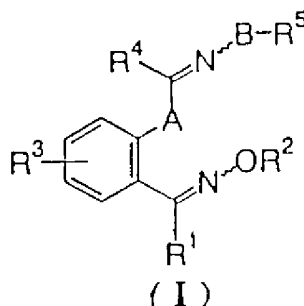


wherein R^1 is optionally C_{1-6} alkyl-substituted imidazolyl, isoxazolyl, isooxazoliny, oxadiazolyl, furyl, oxazolyl, triazolyl or thiazolidinyl, or CHO or CH_2OH ; R^2 is C_{1-6} alkyl, R^3 is hydrogen; R^4 is hydrogen, C_{1-6} alkyl, C_{1-6} alkoxy or phenyl; R^5 is hydrogen, C_{1-6} alkyl or C_{2-6} alkenyl group optionally substituted by C_{1-6} alkyl or C_{1-6} alkoxy, or benzyl optionally substituted by halogen; A is (1) $-CH_2ON=C(R^7)-$ wherein R^7 is hydrogen, C_{1-6} alkyl or cyano, or (3) $-CH=NOC(R^9)(R^{10})-$ wherein R^9 and R^{10} are each independently hydrogen or C_{1-6} alkyl; B is oxygen or NR^{11} wherein R^{11} is C_{1-6} alkyl; curve (~) represents any configuration of E form, Z form or the mixture thereof.

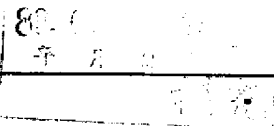
四、中文發明摘要 (發明之名稱：

ALKOXYIMINO BENZYL
DERIVATIVES AND PESTICIDES
CONTAINING THE SAME AS
ACTIVE INGREDIENT

A compound of the formula (I):



wherein R^1 is optionally C_{1-6} alkyl-substituted imidazolyl, isoxazolyl, isooxazoliny, oxadiazolyl, furyl, oxazolyl, triazolyl or thiazolidinyl, or CHO or CH_2OH ; R^2 is C_{1-6} alkyl, R^3 is hydrogen; R^4 is hydrogen, C_{1-6} alkyl, C_{1-6} alkoxy or phenyl; R^5 is hydrogen, C_{1-6} alkyl or C_{2-6} alkenyl group optionally substituted by C_{1-6} alkyl or C_{1-6} alkoxy, or benzyl optionally substituted by halogen; A is (1) $-CH_2ON=C(R^7)-$ wherein R^7 is hydrogen, C_{1-6} alkyl or cyano, or (3) $-CH=NOC(R^9)(R^{10})-$ wherein R^9 and R^{10} are each independently hydrogen or C_{1-6} alkyl; B is oxygen or NR^{11} wherein R^{11} is C_{1-6} alkyl; curve (~) represents any configuration of E form, Z form or the mixture thereof.



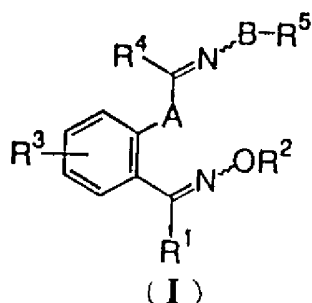
六、申請專利範圍

第 86104446 號「 α -烷氧亞胺苄基衍生物及其為有效成分之農藥」專利案

(89 年 6 月 1 日修正)

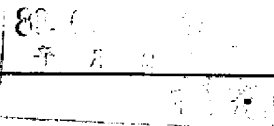
六 申請專利範圍：

1. 一種一般式 (I) 所代表之化合物，



式中， R^1 為一可經 C_{1-6} 烷基取代之咪唑基、異噁唑基、異噁唑啉基、噁二唑基、呋喃基、噻唑基、三唑基或噻唑烷基，或 CHO 或 CH_2OH ； R^2 為 C_{1-6} 烷基， R^3 為氫原子； R^4 為氫原子、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基或苯基； R^5 為氫原子、一可經 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基取代之 C_{1-6} 烷基或 C_{2-6} 鏈烯基、或一可經鹵素取代之苄基； A 為 (1) $-CH_2ON=C(R^7)-$ [R^7 為氫原子、 C_{1-6} 烷基或氰基] 或 (3) $-CH=NO C(R^9)(R^{10})-$ [R^9 與 R^{10} 各獨立地代表氫原子或 C_{1-6} 烷基]； B 為氧原子或 NR^{11} (R^{11} 為 C_{1-6} 烷基)；波線 (~) 代表 E 體、Z 體或其混合物之任何配置。

2. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R^1 係一可經



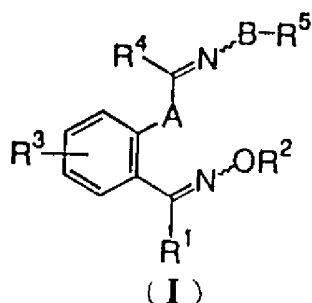
六、申請專利範圍

第 86104446 號「 α -烷氧亞胺苄基衍生物及以其為有效成分之農藥」專利案

(89 年 6 月 1 日修正)

六 申請專利範圍：

1. 一種一般式 (I) 所代表之化合物，



式中， R^1 為一可經 C_{1-6} 烷基取代之咪唑基、異噁唑基、異噁唑啉基、噁二唑基、呋喃基、噻唑基、三唑基或噻唑烷基，或 CHO 或 CH_2OH ； R^2 為 C_{1-6} 烷基， R^3 為氫原子； R^4 為氫原子、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基或苯基； R^5 為氫原子、一可經 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基取代之 C_{1-6} 烷基或 C_{2-6} 鏈烯基、或一可經鹵素取代之苄基； A 為 (1) $-CH_2ON=C(R^7)-$ [R^7 為氫原子、 C_{1-6} 烷基或氰基] 或 (3) $-CH=NO C(R^9)(R^{10})-$ [R^9 與 R^{10} 各獨立地代表氫原子或 C_{1-6} 烷基]； B 為氧原子或 NR^{11} (R^{11} 為 C_{1-6} 烷基)；波線 (~) 代表 E 體、Z 體或其混合物之任何配置。

2. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R^1 係一可經

六、申請專利範圍

- C₁₋₆ 烷基取代之異噁唑-3-基、異噁唑-4-基、異噁唑-5-基、2-異噁唑烷-3-基、2-異噁唑烷-5-基、咪唑-1-基、咪唑-2-基、1,3,4-噁二唑-2-基、呋喃-2-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1H-1,2,4-三唑-1-基、噻唑烷-2-基或噁唑-5-基，或 CHO 或 CH₂OH。
3. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R¹ 為咪唑-1-基、1-甲基咪唑-2-基、異噁唑-3-基、3-甲基異噁唑-5-基、5-甲基異噁唑-3-基、2-異噁唑烷-3-基、1,3,4-噁二唑-2-基、CHO 或 CH₂OH。
4. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R² 為甲基。
5. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R⁴ 為氫原子、甲基、乙基、甲氧羰基、乙氧羰基或苯基。
6. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R¹ 為異噁唑-3-基、R² 為甲基及 R³ 為氫；R¹ 為 2-異噁唑烷-3-基、R² 為甲基及 R³ 為氫；R¹ 為 5-甲基異噁唑-3-基、R² 為甲基及 R³ 為氫；R¹ 為 3-甲基異噁唑-5-基、R² 為甲基而 R³ 為氫；R¹ 為咪唑-1-基，R² 為甲基及 R³ 為氫；R¹ 為噻唑烷-2-基，R² 為甲基及 R³ 為氫；R¹ 為 1,3,4-噁二唑-2-基，R² 為甲基及 R³ 為氫；R¹ 為 CHO，R² 為甲基及 R³ 為氫；R¹ 為 CH₂OH，R² 為甲基及 R³ 為氫。
7. 一種含有如申請專利範圍第 1 至 6 項中任一項之化合物為有效成分之殺真菌劑。