

327596

3275 16

公告本

申請日期	83 年 9 月 5 日
案 號	83108165
類 別	07D 281/10 A01N 21/32 281/80

A4
C4

327596

(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	經取代之異噁唑類化合物，彼之製備方法，含彼之組成物，以及彼充作安全劑上之用途
	英 文	Substituted isoxazolines, process for their preparation, composition containing them, and their use as safeners
二、發明 創作人	姓 名	(1) 洛瑟·威姆 Willms, Lothar (2) 克勞斯·鮑爾 Bauer, Klaus (3) 赫曼·畢玲加 Bieringer, Hermann
	國 籍	(1) 德國 (2) 德國 (3) 德國
	住、居所	(1) 德國赫夫翰·康尼斯坦娜街五十九號 Königsteiner Straße 59, D-65719 Hofheim, Germany (2) 德國漢奧 D 六三四五六多納街五三 D 號 Doorner Straße 53d, D-63456 Hanau, Germany (3) 德國艾普斯登·易奇恩路二十六號 Eichenweg 26, D-65817 Eppstein, Germany
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 一一三五〇九 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

327596

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大類：
IPC分類：

A6
B6

本案已向：

國(地區) 申請專利, 申請日期: 案號: , 有 無主張優先權
 德國 1993年9月16日 P 43 31 448.1 無主張優先權

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)

本發明關於農作物保護產品的技術領域，特別是將活性物質與解毒劑組合，用於農作物中對抗有害的植物以保護有用的植物是非常合適的。

當使用處理植物的產品時，特別是除草劑，對於所處理的植物是會造成不必要的傷害，大部分除草劑與有些重要之農作物植物是無法完全共存（選擇的），所以除草劑應用的範圍相當受到限制，這就是有時無法使用除草劑的原因，或者使用除草劑的比例過低，以致於無法擔保有對抗有害植物所需要的除草劑活性。例如下文描述用於除草劑之物質種類（A）至（K），大部分在足夠選擇性下是無法使用於玉蜀黍、米、穀類上。對植物有害的副作用在農作物上明顯的，特別是當這些除草劑使用於後期萌發，最好能避免或降低此種植物毒害性。

將除草劑與化合物結合，會降低除草劑對於農作物的植物毒害性，且相對的不會降低對抗有害植物的除草活性，這點是已知的，而所結合的成分稱為安全劑或解毒劑。

使用 5 - 苯基異噁唑啉 - 1 和 5 - 苯基異噁唑啉 - 3 - 羧基衍生物，作為除草劑之安全劑，從一系列的胺基甲酸酯、硫胺基甲酸酯、鹵乙醯替苯胺、苯氧基苯氧基烷羧酸衍生物、磺醯基尿素等等，均已揭示於 EP - A - 5 0 9 4 3 3 (CA - A - 2 0 6 5 9 8 3)。

EP - A - 5 2 0 3 7 1 (CA - A - 2 0 7 2 2 2 9) 提及，尤其是 5 - 烷基 - 異噁唑啉 - 1 及 - 異噁唑啉 - 3 - 羧基衍生物，對於某一範圍內之除草劑

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

五、發明說明(2)

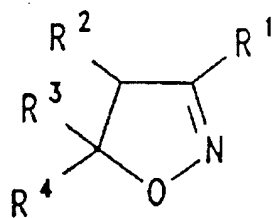
種類，可以作為安全劑。

W O 9 2 / 0 3 0 5 3 (C A - A -
2 0 8 9 6 5 1) 描述經取代的 3 - 芳基異噁唑啉 - 3 -
異噁唑啉 - 5 - 羧基衍生物用於一些除草劑上作為安全劑
。 W O 9 1 / 1 8 9 0 7 (U S - A - 5 3 3 2 7 1 5
) 描述甲矽烷基 - 取代的異噁唑啉、異噁唑、異噁唑啉和
異噁唑作為農作物保護劑。

最後 W O 9 1 / 0 8 2 0 2 (U S - A -
5 3 1 4 8 6 3) 描述 5 - 苄基 - 取代的異噁唑啉衍生物
具有保護農作物的特性。

讓人感到驚訝的，源自下面的化學式 (I) 之 5, 5 -
一二取代的異噁唑啉衍生物之化合物，非常適合用於保護
農作物植物，以對抗激烈化學品的損害作用，特別是除草
劑。

適合用於保護農作物植物，以對抗激烈農業化學品的
損害作用的異噁唑啉之化學式 (I)

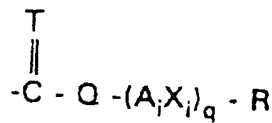
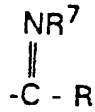
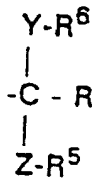
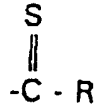
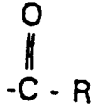


(I)

其中

R¹ 是羧基、甲醯基或他種醯基，或所提及 3 種基團之衍
生物，宜為下列化學式之基團

五、發明說明(3)



或



其中 R, R^T, R⁵, R⁶, R⁷, Y, T, Z, Q,

A_i, X_i 及 q, 會於下文進一步定義,

R² 是氫、鹵素, C₁-C₁₈-烷基, C₃-C₈-環烷基, C₂-C₈-烯基, C₂-C₈-炔基, C₁-C₁₈-烷氧基, C₁-C₈-烯氧基, C₂-C₈-炔氧基, C₁-C₁₈-烷硫基, C₂-C₈-烯硫基, 而後 9 種基團之任一種是未經取代的或經由選自鹵素、硝基、氰基、C₁-C₄-烷氧基及 (C₁-C₄-烷氧基) 羰基之一或多種基團所取代, 或者 R² 是 (C₁-C₈-烷氧基) 羰基,

R³ 和 R⁴ 彼此間無關, 且 R³ 和 R⁴ 是

脂族基, 阿脂族基或有 1 至 30 個碳原子之未經取代

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

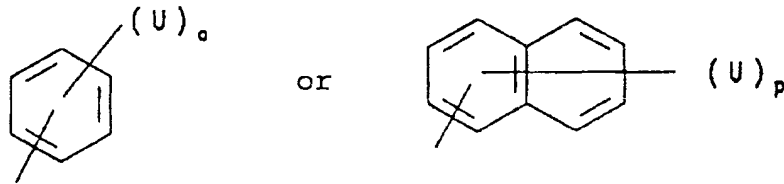
裝

訂

線

五、發明說明(4)

的或被 1 或多個官能基取代的雜阿脂族基，而該官能基例如 $C_1 - C_{18}$ - 烷基、 $C_3 - C_{12}$ - 環烷基、 $C_2 - C_8$ - 烯基或 $C_2 - C_8$ - 炔基，或者是芳族基或未經取代的或經取代的雜芳族基，例如未經取代的或經取代的苯基、萘基或雜芳基，宜為下列化學式之基團



其中

(U) 彼此間無關，是相同或不同的基團，該基團是氫、鹵素、氰基、硝基、胺基或 $C_1 - C_8$ - 鹵烷基、 $C_1 - C_8$ - 鹵烷氧基、 $C_1 - C_8$ - 烷基、 $C_1 - C_8$ 烷氧基、— ($C_1 - C_4$ - 烷基) 胺基、二 - ($C_1 - C_4$ - 烷基) 胺基、 $C_1 - C_8$ - 烷硫基或 $C_1 - C_8$ - 烷基 - 磺醯基、後 8 種基團之任一種，是未經取代的或被 1 或多種，宜為 3 種，相同或不同的取代基取代，該取代基選自鹵素， $C_1 - C_8$ - 鹵烷氧基、硝基、氰基、羥基、 $C_1 - C_8$ - 烷氧基和其中 1 或多個，最多至 3 個較佳， CH_2 基被氧取代之 $C_1 - C_8$ - 烷氧基、 $C_1 - C_8$ - 烷硫基、 $C_1 - C_6$ - 烷亞硫醯基、 $C_1 - C_6$ - 烷基磺醯基、 C_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(5)

- C₈- 烯硫基、C₂-C₈- 炔硫基、C₂-C₈- 烯氧基、C₂-C₈- 炔氧基、C₃-C₇- 環烷基、C₃-C₇- 環烷氧基，一- 及二- (C₁-C₄- 烷基) 胺基以及 (C₁-C₈ 烷氧基) 羰基，但宜為氫、鹵素、C₁-C₆- 鹵烷基 (例如三氟甲基)、C₁-C₆- 鹵烷氧基 (例如二氟甲氧基)、C₁-C₆- 烷基、C₁-C₆- 烷氧基、C₁-C₆- 烷硫基、C₁-C₆- 烷基磺醯基、硝基、胺基、(C₁-C₂- 烷基) 胺基、二- (C₁-C₂- 烷基) 胺基或氰基，及

o 是 1 至 5 之整數，宜為 1 至 3，及

p 是 1 至 7 之整數，宜為 1 至 3，

或宜為選自含有呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡啶基、噻啶基、噁啶基、吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、喹啶基、喹啉基之單環或雙環雜芳基，其中每一種均是未經取代的或被 1 或多個，宜為 1 至 3 個，所提過之 U 基團所取代，

R 是氫或脂族基、芳族基、雜芳族基、阿脂族基或有 1 至 30 個碳原子之雜阿脂族基，該雜阿脂族基是未經取代的或被 1 至多個官能基取代，例如 R 是氫基、C₁-C₁₈- 烷基、C₃-C₁₂- 環烷基、C₂-C₈- 烯基、或 C₂-C₈- 炔基、雜環基、苯基或雜芳基，

後 7 種基團之任一種，彼此間無關，且是未經取代的或被 1 或多種基團取代，而該基團係選自鹵素、氰基、硫基、硝基、羥基、C₁-C₈- 烷基 (僅限於環狀

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(6)

基之情況)、 C_1-C_8 -鹵烷基、 C_1-C_8 -烷氧基、 C_2-C_8 -烯氧基、 C_2-C_8 -炔氧基、 C_1-C_8 -鹵烷氧基、 C_1-C_8 -烷硫基、 C_2-C_8 -烯硫基、 C_2-C_8 -環硫基、 C_3-C_7 -環烷基、 C_3-C_7 -環烷氧基、化學式為 $-NR^*R^{**}$ 、 $-CO-NR^*R^{**}$ 和 $-O-CO-NR^*R^{**}$ 的基團，

其中後3種基團中的 R^* 和 R^{**} ，彼此間無關，而 R^* 和 R^{**} 是氫、 C_1-C_8 -烷基、 C_2-C_8 -烯基、 C_2-C_8 -炔基、苄基、苯基或經取代的苯基、或含有氮之3-至8-員的雜環，該雜環可以有最多至2個選自N、O及S之雜原子，且可以被 C_1-C_4 -烷基取代，

以及(C_1-C_8 -烷氧基)羰基、(C_1-C_8 -烷氧基)-硫羰基、(C_2-C_8 -烯氧基)羰基、(C_1-C_8 -烷硫基)羰基、(C_2-C_8 -烯硫基)羰基、(C_2-C_8 -炔硫基)羰基、(C_2-C_8 -炔氧基)羰基、甲醯基、(C_1-C_8 -烷基)羰基、(C_2-C_8 -烯基)羰基、(C_2-C_8 -炔基)羰基、 C_1-C_4 -烷基胺基、 C_1-C_4 -烷氧基胺基、(C_1-C_8 -烷基)羰基胺基、(C_2-C_8 -烯基)羰基胺基、(C_2-C_8 -炔基)羰基胺基、(C_1-C_8 -烷氧基)羰基胺基、(C_2-C_8 -烯氧基)羰基胺基、(C_2-C_8 -炔氧基)羰基胺基、(C_1-C_8 -烷基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(7)

) 胺基 - 羰基 - 胺基、(C₁ - C₆ - 烷基) 羰氧基 (未經取代的或被鹵素、NO₂、C₁ - C₄ - 烷氧基取代，或者任意經取代之苯基取代)，以及 (C₂ - C₆ - 烯基) 羰氧基、(C₂ - C₆ - 炔基) 羰氧基、(C₁ - C₈ - 烷氧基) 羰氧基、(C₂ - C₈ - 烯氧基) 羰氧基、(C₂ - C₈ - 炔氧基) - 羰氧基、C₁ - C₈ - 烷基磺醯基、苯基、苯基 - C₁ - C₆ - 烷氧基、苯基 - (C₁ - C₆ - 烷氧基) 羰基、苯氧基、苯氧基 - C₁ - C₆ - 烷氧基、苯氧基 - (C₁ - C₆ - 烷氧基) 羰基、苯氧基羰基、苯基羰氧基、苯基羰基胺基、苯基 - (C₁ - C₆ - 胺基) 羰基胺基及苯基 - (C₁ - C₆ - 烷基) 羰氧基，

後 11 種基團是未經取代或在苯環上被 1 或多種選自鹵素、C₁ - C₄ - 烷基、C₁ - C₄ - 烷氧基、C₁ - C₄ - 鹵氧基、C₁ - C₄ - 鹵烷氧基及硝基之基團所取代，

以及化學式為 $-SiR'_{3}$ 、 $-O-SiR'_{3}$ 、 $(R')_{3}Si-C_{1}-C_{6}-$ 烷氧基、 $-CO-O-NR'_{2}$ 、 $-O-N=CR'_{2}$ 、 $-N=CR'_{2}$ 、 $O-NR'_{2}$ 、 $-CH(OR')_{2}$ 及 $-O-(CH_{2})_{m}-CH(OR')_{2}$ 之基團，

其中化學式中的 R' 彼此間並無關，而 R' 是氫、C₁ - C₄ - 烷基或苯基，而該苯基是未經取代的或經單基或多基取代的，而該取代基是選自鹵素、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(8)

C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -鹵烷基、 C_1-C_4 -鹵烷氧基及硝基，或成對的話，是 C_2-C_6 -伸烷基鏈，而m是0至6間，以及化學式為 $R''-O-CH-R''-CH(O-R'')$ - C_1-C_6 -烷氧基之經取代的烷氧基，其中 R'' 彼此間無關，而 R'' 是 C_1-C_4 -烷基或一起為 C_1-C_6 -伸烷基，而 R''' 是氫或 C_1-C_4 -烷基， R^T 是化學式為 $-CO-R$ ， $-CS-R$ ， $-NR^fR^g$ ， $-N=CR^hR^i$ 或 $SiR^aR^bR^c$ 之基團， R 之意義如前所述， R^f 、 R^g 、 R^h 及 R^i 彼此間無關，而 R^f 、 R^g 、 R^h 和 R^i 是氫、 C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -炔基、苄基、苯基或經取代之苯基，或 R^f 和 R^g 一起與氮原子形成5或6員雜環，該雜環可以額外含有至多2個選自N，O和S之雜原子，並且可以被 C_1-C_4 -烷基取代，及 R^a 、 R^b 及 R^c 彼此間無關， R^a 、 R^b 及 R^c 是 C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_2-C_4 -炔基、苯基或經取代之苯基， Y 和 Z 彼此間無關，且 Y 和 Z 是不同氧化程度之氧和硫，宜為S，SO或SO₂，或者類似 R^5 或 R^6 定義之 $-NR^e$ 、 R^e ， R^5 和 R^6 是相同或不相同，但彼此間無關。 R^5 和 R^6 是氫、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基或(C_1-C_4 -烷基)羰基，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(9)

後 4 種基團之任一種是未經取代的或經由 1 或多個取代基取代，該取代基選自鹵素、 C_1-C_8 -鹵烷氧基、硝基、氰基、羥基、 C_1-C_8 -烷氧基及其中 1 至多個，最多至 3 個較佳，彼此間不直接相連之 CH_2 基被氧取代之 C_1-C_8 -烷氧基，以及 C_1-C_8 -烷硫基、 C_1-C_6 -烷基磺醯基、 C_2-C_8 -烯硫基、 C_2-C_8 -炔硫基、 C_2-C_8 -烯氧基、 C_2-C_8 -炔氧基、 C_3-C_7 -環烷基、 C_3-C_7 -環烷氧基及胺基、一-和二- (C_1-C_4 -烷基) 胺基或

甲 醯基或 $SiR^aR^bR^c$ ，

其中 R^a 、 R^b 和 R^c 彼此間無關， R^a 、 R^b 和 R^c 是 C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_2-C_4 -炔基或未經取代或經取代之苯基，或

C_3-C_8 -環烷基、 C_3-C_8 -環烯基、環上原子有 3 至 7 個之雜環、芳基、雜芳基或芳基羰基，

後 6 種基團之任一種是未經取代的或被 1 或多個基團取代，該基團係選自 C_1-C_8 -烷基、鹵素、 C_1-C_8 -鹵烷氧基、硝基、氰基、羥基、 C_1-C_8 -烷氧基及其中 1 或多個，最多至 3 個較佳，彼此間不直接相連之 CH_2 基被氧取代之 C_1-C_8 -烷氧基，以及 C_1-C_8 -烷硫基、 C_1-C_6 -烷基磺醯基、 C_2-C_8 -烯硫基、 C_2-C_8 -炔硫基、 C_2-C_8 -烯氧基、 C_2-C_8 -炔氧基、 C_3-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(10)

C_7 -環烷基、 C_3-C_7 -環烷氧基及胺基、——
和二-(C_1-C_4 -烷基)胺基，或者

R^5 和 R^6 一起是 C_2-C_4 -申烷基鏈或 C_2-C_4 -伸烯基
鏈，其是未經取代的或被選自甲基、乙基、甲氧基、
乙氧基及鹵素之1或2個基團所取代

R^7 是氫、 C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_2-C_4 -
-炔基、未經取代的或經取代的 C_6-C_{12} -芳基或
雜芳基、苄基、 C_1-C_4 -烷氧基、酸氧基(諸如(
 C_1-C_4 -烷基)羧氧基及未經取代的或經取代的苯
基羧氧基)、或羥基、 $-NH-CO-NH_2$ ，
 $-NH-CS-NH_2$ ，一及二-(C_1-C_4 -烷基
)胺基、醯基胺基、(C_1-C_4 -烷基)磺醯基胺基
、 C_6-C_{12} -芳氧基、雜芳氧基、芳基磺醯基胺基
或芳基胺基，

後4種基團中之芳基或雜芳基是未經取代的或被1
或多個基團取代，該基團選自鹵素、硝基、(C_1 -
 C_4)烷基、(C_1-C_4)烷氧基、(C_1-C_4 -
)-鹵烷基及(C_1-C_4)-鹵烷氧基，

T是O、S、 NR^8 、 $N-OR^8$ 或 $N-O$ -醯基，

Q是O或S，

q是0至4間的整數，

i是連續的數字，當q不是0時，i是1至q之所有
整數，而q之意義如前所述，

X_i 彼此間無關，是O、S、 NR^9 或

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (11)



A_i 彼此間無關，而 A_i 是未經取代或經取代之 $C_1 - C_6$ - 伸烷基、 $C_2 - C_6$ - 伸烯基、 $C_2 - C_6$ - 伸炔基、 $C_3 - C_6$ - 環伸烷基、 $C_3 - C_6$ - 環伸烯基、雜伸環基、伸芳基或雜伸芳基，以及

R^8 和 R^9 彼此間無關，是 H、 $C_1 - C_4$ - 烷基、 $C_2 - C_4$ - 烯基、 $C_2 - C_4$ - 炔基、 $C_3 - C_6$ - 環烷基、 $C_3 - C_6$ - 環烯基、雜環基、芳基或雜芳基。

化學式 (2) 中及下文中，烷基，烷氧基，鹵烷基、鹵烷氧基、烷基胺基及烷硫基，以及在碳架子中相對應之未經取代及 / 或經取代之基團，可以是直鏈或支鏈，除非特別聲明，否則對這些基團而言，其碳架子含有 1 至 4 個碳原子，而在未飽和基時則為 2 至 4 個碳原子較佳。烷基，也包括併合的意義，諸如烷氧基、鹵烷基等等，例如甲基、乙基、正或異丙基、正、異、第三或 2 - 丁基、戊基、己基 (諸如正己基、異己基及 1, 3 - 二甲基丁基)、庚基，(諸如：正庚基、1 - 甲基己基及 1, 4 - 二甲基戊基)；烯基和炔基係為未飽和基，且對應於烷基；烯基的例子有：烯丙基、1 - 甲基丙 - 2 - 烯 - 1 - 基、2 - 甲基丙 - 2 - 烯 - 1 - 基、丁 - 2 - 烯 - 1 - 基、丁 - 3 - 烯 - 1 - 基、1 - 甲基 - 丁 - 3 - 烯 - 1 - 基及 1 - 甲基丁 - 2 - 烯 - 1 - 基；炔基的例子有：炔丙基、丁 - 2 - 炔 - 1 - 基、丁 - 3 - 炔 - 1 - 基、1 - 甲基 - 丁 - 3

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (12)

— 炔 — 1 — 基。鹵素為氟、氯、溴或碘，宜為氟、氯或溴，特別是氟或氯，鹵烷基、— 烯基及— 炔基是指烷基、烯基或炔基部分或全部被鹵素取代，例如 $C F_3$ ， $C H F_2$ ， $C H_2 F$ ， $C F_3 C F_2$ ， $C H_2 F C H C l$ ， $C C l_3$ ， $C H C l_2$ ， $C H_2 C H_2 C l$ ；而鹵烷氧基，例如， $O C F_3$ ， $O C H F_2$ ， $O C H_2 F$ ， $C F_3 C F_2 O$ ， $O C H_2 C F_3$ 。同樣的情況適用於被鹵素取代之鹵烯基或其他基團。

芳基的例子有：苯基、萘基、四氫萘基、蒽基、蒽滿基、戊搭烯基、芴基等等，而芳基以苯基較好；芳氧基中之氧與所提及之芳基相對應較好，特別是苯氧基。

雜芳氧基中的雜芳基，例如：吡啶基、嘧啶基、噁吡基、吡嗪基、噻吩基、噻吡基、噁唑基、呋喃基、吡咯基、吡唑基及咪唑基，也包括雙環或多環芳族或阿脂族化合物，例如喹啉基、苯並噁唑基等等。

經取代的芳基、芳氧基、雜芳基或經取代之雙環基團含有芳族部分，例如來自未經取代之基本骨架之經取代之基團，其取代基，例如，1 或多個，宜為 1，2 或 3 個，且該取代基係選自鹵素、烷基、鹵烷基、烷氧基、鹵烷氧基、羥基、胺基、硝基、氰基、烷氧基羰基、烷基羰基、甲醯基、胺基甲醯、— 一及二烷基胺基羰基、— 一及二烷基胺基、烷基亞磺醯基及烷基磺醯基，而以含有 1 至 4 個碳原子較佳，特別是 1 或 2 個碳原子。通常地，較佳的取代基選自含有鹵素（例如氟及氯）、 $C_1 - C_4$ - 烷基（宜

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

五、發明說明(13)

為甲基或乙基)、 C_1-C_4 -鹵烷基(宜為三氟甲基)、 C_1-C_4 -烷氧基(宜為甲氧基或乙氧基)、 C_1-C_4 -鹵烷氧基、硝基及氰基。特別好的取代基是甲基、甲氧基及氟。

任意經取代的苯基，例如苯基是未經取代的或一或多取代基，最多至三取代基較佳，而該取代基為相同或不同的，係選自鹵素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 $(C_1-C_4$ -鹵烷基)、 (C_1-C_4) -鹵烷氧基及硝基，例如 o-、m-及 p-甲苯基、二甲基苯基、2-、3-及 4-氟苯基，2-、3-及 4-三氟-及三氟苯基，2,4-、3,5-、2,5-及 2,3-二氟苯基，及 o-、m-及 p-甲氧基苯基。

上文描述的 3 至 7 雜環基，宜源自苯，其中至少一個 CH 被 N 取代及/或至少 2 個相鄰的 CH 對被 NH、S 及/或 O 取代，該基團可以是苯並-熔融，且視情況有部分或全部氫化，並均稱為雜環基。特別適合的基團，諸如環氧乙基、吡咯烷基、哌啶基、二噁戊基、吡啶基、嗎啉基、呋喃基、四氫呋喃基、吡啶基、喹啉基、嘧啶基、吡庚因基、三唑基、噁噁基及嘧唑基。

鹽基，例如甲鹽基、烷基羧基(諸如 $(C_1-C_4$ 烷基)羧基)、苯基羧基，而該苯基羧基中苯環亦可被取代，例如所提及過之苯基或烷氧基羧基、苯氧基羧基、芳氧基羧基、烷基磺鹽基及其他有機酸之基團的情況。

羧基衍生物是典型的酸衍生物之基團，例如鹽、酯、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (14)

硫酯、醯胺、硫胺、脘及脞。甲醯基衍生物及醯基衍生物，特別是指類似羰基之衍生物，諸如乙縮醛、硫乙縮醛、硫縮酮、亞胺、硫甲醯基、硫醯基等等。

化學式 (2) 的一些化合物包括不可分離之一或多個不對稱碳原子或雙鍵，有立體異構物是可能的，而立體異構物是由其特定的空間形狀來定義的，諸如鏡像異構物、非對映立體異構物、E 和 Z 異構物及他們的混合物，不管如何，這些均包含於化學式 (I) 中。

來自羧酸之化學式 (I) 的化合物，可以形成鹽類，其中的基團 R 是被農業上適合的陽離子之對應物所取代，這些鹽類的例子有金屬鹽類，特別是鹼金屬 (Na, K) 鹽類或鹼土金屬鹽類，但也可以是胺鹽或有機胺的鹽類，以及含有銦或鎂離子為陽離子之鹽類。

特別適合形成鹽類為金屬及有機氮鹼，特別是季銨鹼。適合用來形成鹽類之可能的金屬有鹼土金屬，諸如鎂或鈣，而鹼金屬更好，諸如鋰，特別是，鉀和鈉。

適合用於形成鹽類之氮鹼的例子是第一、第二或第三、脂族及芳族胺，且這些胺化合物在經基上可隨意地羥基化，諸如甲基胺、乙基胺、丙基胺、異丙基胺、4 種異構丁基胺、二甲基胺、二乙基胺、二丙基胺、二異丙基胺、二正丁基胺、吡咯烷、哌啶、嗎啉、三甲基胺、三乙基胺、三丙基胺、奎寧環、吡啶、喹啉、異喹啉，以及甲氧胺、乙氧胺、丙氧胺、二甲氧胺、二乙氧胺或三乙氧胺。

季銨鹼的例子是四烷基銨陽離子，其中烷基彼此間無

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

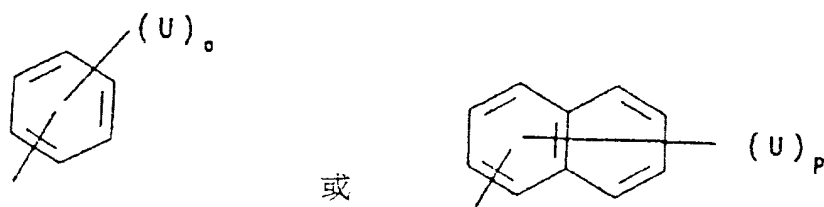
五、發明說明 (15)

關，且是直鏈或分支的 $C_1 - C_6$ -烷基，諸如四甲基銨陽離子、四乙基銨陽離子或三甲基乙基銨陽離子，及進一步的三甲基苄基銨陽離子、三乙基苄基銨陽離子以及三甲基-2-羥基乙基銨陽離子。

特別適合作為鹽類之形成者是銨陽離子以及二和三烷基銨陽離子，其中烷基彼此間無關，且是直鏈或支鏈的 ($C_1 - C_6$)-烷基，該支鏈 ($C_1 - C_6$)-烷基可以任意被羥基取代的，而銨陽離子以及二和二烷基銨陽離子，例如二甲基銨陽離子、三甲基銨陽離子、三乙基銨陽離子、二(2-羥基乙基)銨陽離子及三(2-羥基乙基)-銨陽離子。

化學式 (2) 的化合物及其鹽類中，特別感到興趣的是其中

R^2 是氫、 $C_1 - C_4$ -烷基、 $C_1 - C_4$ -烷氧基或 $C_5 - C_6$ -環烷基，以及基團 R^3 和 R^4 中至少一者為下式之基團



其中

(U) 是相同或不同的基團，且彼此間無關。(U) 是氫、鹵素 (諸如氟、氯、溴和碘)、氰基、硝基

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (16)

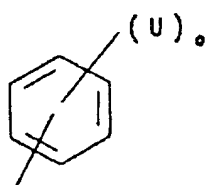
、胺基、 C_1-C_4 -鹵烷基、 C_1-C_4 -鹵烷氧基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 $-(C_1-C_4-烷基)$ 胺基、 $二-(C_1-C_4-烷基)$ 胺基、 C_1-C_4 -烷硫基或 C_1-C_4 -烷基磺基，

o 是 1 至 3 之整數及

p 是 1 至 3 之整數，或

R^3 和 R^4 彼此間無關， R^3 和 R^4 是單環或雙環雜芳基，其係選自呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡啶基、噻啶基、噁啶基、吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、嗒嗪基及喹啉基之基團，且任一種基團均是未經取代或被上文之 1 至 3 個基團取代。

特別好的情況是下式中的基團 R^3 和 R^4 是相同或不同的



U 和 o 的意義與上文相同。

其他的化學式 (I) 之化合物及其鹽類，特別感到興趣的為其中

R 是氫、 C_1-C_8 -烷基、 C_4-C_7 -環烷基、 C_2-C_8 -烯基或 C_2-C_8 -炔基、雜環基、苯基或雜芳基，後 7 種基團彼此間無關，是未經取代或經 1 或多個基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(17)

團所取代，該基團係選自鹵素、氟基、硫基、硝基、羥基、 C_1-C_4 -烷基（僅限於環狀基團的情況）、 C_1-C_4 -鹵烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_2-C_4 -烯氧基、 C_2-C_4 -炔氧基、 C_1-C_4 -鹵烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_2-C_4 -烯硫基、 C_2-C_4 -炔硫基、 C_5-C_6 -環烷基、 C_5-C_6 -環烷氧基、胺基、一及二-（ C_1-C_4 -烷基）胺基、（ C_1-C_6 -烷氧基）羰基，以及化學式為 SiR^1_3 、 $-O-NR^1_2$ 、 $-O-N=C R^1_2$ 、 $-N=C R^1_2$ 之基團，其中 R^1 彼此間無關，且是氫、 C_1-C_2 -烷基或苯基或，成對的話，為 C_2-C_5 -伸烷基鏈。

或

化合物，其中

R^T 是化學式 $-CO-R$ 、 $-NR^fR^g$ 或 $-N=C R^hR^i$ 之基團，而 R 、 R^f 、 R^g 、 R^h 及 R^i 之意義如前所述。

R 宜為氫、 C_1-C_8 -烷基、 C_5-C_6 -環烷基、 C_2-C_8 -烯基或 C_2-C_8 -炔基，而後 4 種基團彼此間無關，且是未經取代或被一或多個基團所取代，該基團係選自鹵素、氟基、硝基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_5-C_6 -環烷氧基、一及二-（ C_1-C_4 -烷基）胺基，化學式為 $-SiR^1_3$ 、 $-O-NR^1_2$ 、 $-N=C R^1_2$ 之基團，其中上述化學式中的 R^1 彼此間無關，且是氫、 C_1-C_2 -烷基或苯基或，成對的話，為 C_2-C_5 -伸烷基鏈。

R^T 宜為 $-CO-R$ （ R 的意義如上所述），或者為

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

五、發明說明 (18)

$-N R^f R^g$ 或 $-N = C R^h R^i$ ，其中

R^f 和 R^g 彼此間無關，且為 H、 C_1-C_2 -烷基、苄基或
苯基或，與氮原子相連，為吡咯烷-1-基、哌
啶-1-基、嗎啉-4-基、哌嗪-1-基或咪
唑-1-基，或

R^h 和 R^i 彼此間無關，係為 H、 C_1-C_2 -烷基、苄基或
苯基。

提過之化學式 (I) 之其他化合物及其鹽類，特別感到興
趣的為其中

R^5 和 R^6 係相同或不同，且彼此間無關，而 R^5 和 R^6 是氫
、 C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -炔基、 C_5-C_6
-環烷基或 C_5-C_6 -環烯基，

及其他化合物，其中

R^7 是氫、 C_1-C_4 -烷基、苯基、苄基、羥基、
 $NH-CO-NH_2$ 、 $-NH$ -芳基或 C_1-C_4
-烷氧基。

所提過之化學式 (I) 之其他化合物及其鹽類，被特別感
到興趣者為其中

T 是 O、S 或 $N R^8$ ，宜為 O 或 $N R^8$ ，

Q 是 O 或 S，宜為 O，

q 是 0 至 4 的整數

i 是連續整數，在 q 不等於 0 時，i 為 1 至 q 的所
有整數，而 q 的意義如上所述，

X_1 為 O、S、 $N R^9$ 或 $N - (A_1 X_1)_q - R$ ，且

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (19)

彼此間無關

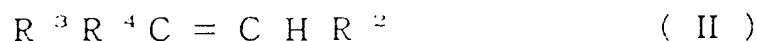
A_i 為未經取代或經取代之 C₁-C₄-伸烷基、C₂-C₄-伸烯基、C₅-C₆-環伸烷基、宜為 C₁-C₄-伸烷基，而 A_i 彼此間無關，

R⁸和 R⁹為 H、C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基或 C₅-C₆-環烷基。

本發明同時關於一種保護農作物植物（宜為穀類、稻米、玉蜀黍、大豆或甜菜）的方法，以對抗農作物保護產品中對植物有害的副作用，而該農作物保護產品諸如除草劑、殺蟲劑及殺菌劑。此保護農作物的方法包含施用有效化學式（I）中至少一種化合物或其鹽類於植物上、植物的種子上或耕種的土地上，且是在加入有效物質之前、之後或同時加入。

此外，本發明關於使用化學式（I）之化合物或其鹽類，用以保護農作物植物以對抗農作物保護產品中對植物有害的副作用，而該農作物保護產品諸如除草劑、殺蟲劑及殺菌劑。

本發明也關於製備化學式（I）之化合物及其鹽類之方法，該方法包括化學式（II）之化合物



，其中 R²、R³ 及 R⁴ 之意義如化學式（I）所示，與化學式（III）的腈氧化物反應

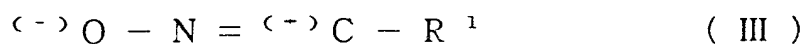
（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

五、發明說明 (20)



其中 R^1 的意義如化學式 (I) 所示。

此反應，例如，在有機溶劑下進行，較適合的溶劑為非極性至些微極性之有機溶劑，例如醚，諸如二乙基醚或四氫呋喃 (T H F) 。

化學式 (II) 及 (III) 之起始化合物已知於文獻 (cf. J. Org. Chem. 25, 1160 (1960) ; J. Am. Chem. Soc. 46, 791 (1924) 其中所引的參考資料) 或者可以類似已知化合物而加以製備。化學式 (III) 之腈氫化物的製備，通常地，是在原處取 2 - 鹵 - 2 - 肟基醋酸 (衍生物) 或 - 乙醛 (衍生物) 或 2 - 鹵 - 2 - 肟基酮與鹼 (例如有機胺鹼) 作用，並立即與已存在反應混合物中之化學式 (II) 中之化合物直接反應，此反應宜在溫度 - 15 °C 至溶劑之沸點間進行，特別是在室溫下進行。

下文在提及化學式 (I) 之化合物時，同時包括彼之鹽類，除非有特別加以聲明。

化學式 (I) 之化合物能降低或避免農作物保護產品 (諸如除草劑、殺蟲劑及殺菌劑) 對植物有害的副作用，此會發生當這些活性的物質用於有用植物的農作物上時，而化學式 (I) 之化合物在傳統上稱為解毒劑或安全劑。

爲了與農作物保護產品之活性物質一起使用，本發明

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (21)

化學式 (I) 之化合物可以與該活性物質同時使用或者任何適合的使用順序，然後化學式 (I) 之化合物能夠降低，或完全抵補，這些活性物質對農作物之有害的副作用，並且不會影響這些活性物質對抗有害植物或昆蟲或黴菌。使用多數的農作物保護產品會造損害，例如使用多數的除草劑或除草劑與殺蟲劑或殺菌劑一起使用，同時也會降低這些活性物質的活性或完全抵銷了，所以本發明可以相當地擴大傳統農作物保護產品的應用範疇。

會損害到植物的殺蟲劑 (指殺蟲劑本身或與除草劑一起作用) 有：

殺蟲性的製劑，諸如有機磷酸酯，例如 Tevbufos (® Couuter)、Fonofos (® Dyfonate)、Phovate (® Thimet)、Chlopyrifos (® Reldan) 及其他相關的活性物質；胺甲酸酯殺蟲劑，諸如，例如 Carbofuran (® Furadan) 及其他；和擬除蟲菊酯殺蟲劑，諸如，例如，Tefluthrin (® Fovce)、deltemethrin (® Decis) 及 tralomethrin (® Scout) 及其他；和其他不同作用機構之殺蟲性組合物。

除草劑施用於農作物上，其對植物有害之副作用可以經由化學式 (I) 之化合物而降低，這些除草劑，例如，選自胺甲酸酯、硫胺基甲酸酯、鹵乙醯替苯胺，經取代之苯氧基 -、羧氧基 - 及苯氧氧基苯氧基羧酸衍生物，以及雜芳氧基苯氧基烷羧酸衍生物 (諸如喹啉氧基 -、喹噁啉氧基 -、吡啶氧基 -、苯並噁唑氧基 - 及苯並噻唑氧基苯

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (22)

氧基烷羧酸酯)、環己二酮衍生物、咪唑啉酮、嘧啶氧基吡啶羧酸衍生物、嘧啶氧基苯甲酸衍生物、磺醯基尿素、三唑並嘧啶磺醯胺衍生物及 S - (N - 芳基 - N - 烷基胺甲醯基甲基) 二硫磷酸酯。宜將苯氧基苯氧基 - 及雜芳氧基苯氧基羧酸之酯類及鹽類，以及磺醯基尿素、咪唑啉酮和除草劑，再加上 A L S 抑制劑 (丙酮醇醋酸酯合酶抑制劑) 一起使用，如此可加寬作用的光譜，例如苯特龍 (bentazone)、塞耐啉 (cyanazine)、阿卓啉 (atrazine)、溴苯氟、麥草畏 (dicamba) 及其他葉片 - 作用之除草劑。

根據本發明，適合與安全劑合併使用之除草劑有：

A) (C₁ - C₄) 烷基、(C₂ - C₄) 烯基及 (C₃ - C₄) 炔基苯氧基苯氧基 - 及雜芳氧基苯氧基羧酸酯形式的除草劑，諸如

A 1) 苯氧基苯氧基 - 和苄氧基苯氧基羧酸衍生物，例如
 甲基 2 - (4 - (2, 4 - 二氯苯氧基) 苯氧基) 丙酸酯
 (diclofop - 甲基)

2 - (4 - (4 - 溴 - 2 - 氯苯氧基) 苯氧基) 丙酸甲酯
 (參考 D E - A - 2 6 0 1 5 4 8)，

2 - (4 - (4 - 溴 - 2 - 氯苯氧基) 苯氧基) 丙酸甲酯
 (參考 U S - A - 4 8 0 8 7 5 0)，

2 - (4 - (2 - 氯 - 4 - 三氟甲基苯氧基) 苯氧基) 丙酸甲酯 (參考 D E - A - 2 4 3 3 0 6 7)，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (23)

2 - (4 - (2 - 氟 - 4 - 三氟甲基苯氧基) 苯氧基) 丙酸甲酯 (參考 U S - A - 4 8 0 8 7 5 0) ,

2 - (4 - (2 , 4 - 二氟苄基) 苯氧基) 丙酸甲酯 (參考 D E - A - 2 4 1 7 4 8 7) ,

4 - (4 - (4 - 三氟甲基苯氧基) 苯氧基) 戊 - 2 - 酸乙酯 ,

2 - (4 - (4 - 三氟甲基苯氧基) 苯氧基) 丙酸甲酯 (參考 D E - A - 2 4 3 3 0 6 7) ,

A 2) ' 單核 ' 雜芳氧基苯氧基烷羧酸衍生物 , 例如

2 - (4 - (3 , 5 - 二氯吡啶基 - 2 - 氧) 苯氧基) 丙酸甲酯 (參考 E P - A - 2 9 2 5) ,

2 - (4 - (3 , 5 - 二氯吡啶基 - 2 - 氧) 苯氧基) 丙酸炔丙酯 (參考 E P - A - 3 1 1 4) ,

2 - (4 - (3 - 氯 - 5 - 三氟甲基 - 2 - 吡啶氧基) 苯氧基) 丙酸甲酯 (參考 E P - A - 3 8 9 0) ,

2 - (4 - (3 - 氯 - 5 - 三氟甲基 - 2 - 吡啶氧基) 苯氧基) 丙酸乙酯 (參考 E P - A - 3 8 9 0) ,

2 - (4 - (5 - 氯 - 3 - 氟 - 2 - 吡啶氧基) 苯氧基) 丙酸炔丙酯 (參考 E P - A - 1 9 1 7 3 6) ,

2 - (4 - (5 (三氟甲基 - 2 - 吡啶氧基) 苯氧基) 丙酸丁酯 (fluazifopbutyl) ,

A 3) ' 雙核 ' 雜芳氧基苯氧基烷羧酸衍生物 , 例如

2 - (4 - (6 - 氯 - 2 - 喹啉氧基) 苯氧基) 丙酸甲酯及乙酯 (quizaloflop - 甲基及乙基)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (24)

2 - (4 - (6 - 氯 - 2 - 噻嘧啉氧基) 苯氧基) 丙酸甲酯 (參考 J. Pest. Sci. Vol. 10, 61 (1985)) ,

2 - (4 - (6 - 氯 - 2 - 噻嘧啉氧基) 苯氧基) 丙酸及 2 - 異亞丙基胺氧基乙酯 (propaquizafop 及它的酯類) ,

2 - (4 - (6 - 氯苯並噁唑 - 2 - 氧基) 苯氧基) 丙酸乙酯 (fenoxaprop - 乙基) , 它的 D (+) 異構物 (fenoxaprop - P - 乙基)

2 - (4 - (6 - 氯苯噻唑 - 2 - 氧基) 苯氧基) 丙酸乙酯 (參考 DE - A - 2640730) ,

2 - (4 - (6 - 氯噻嘧啉氧基) 苯甲基) 丙酸四氫呋喃 - 2 - 基甲酯 (參考 EP - A 323 727) ,

B) 來自磺醯基尿素系列之除草劑，諸如，嘧啶 - 或三嗪基胺基羰基 [苯吡啶 - 、吡啶 - 、噻吩 - 及 (胺基磺醯基) - 烷基胺基] 磺醯胺。在嘧啶環或三嗪環上較佳之取代基為烷氧基、烷基、鹵烷氧基、鹵烷基、鹵素或二甲基胺基，所有結合之取代基彼此間均無關是可能的。在苯、吡啶、吡啶、噻吩或 (烷基磺醯基) 烷基胺基部分之取代基宜為烷基、烷氧基、鹵素、硝基、烷氧基羰基、胺基羰基、烷基胺基羰基、二烷基胺基羰基、烷基、烷基磺醯基、鹵烷氧基、鹵烷基、烷基羰基、烷氧基烷基、(烷磺醯基) 烷基胺基。適合的磺醯基尿素的例子有：

五、發明說明(25)

B 1) 苯基及苄基磺醯基尿素以及相關的化合物，例如
1 - (2 - 氯苯基磺醯基) - 3 - (4 - 甲氧基 - 6 - 甲
基 - 1 , 3 , 5 - 三嗪 - 2 - 基) 尿素 (chlorosulfuron
) ,

1 - (2 - 乙氧基羰基苯基磺醯基) - 3 - (4 - 氯 - 6
- 甲氧基嘧啶 - 2 - 基) 尿素 (chlorimuron - 乙基) ,

1 - (2 - 甲氧基苯基磺醯基) - 3 - (4 - 甲氧基 - 6
- 甲基 - 1 , 3 , 5 - 三嗪 - 2 - 基) 尿素 (
metsulfuron - 甲基) ,

1 - (2 - 氯乙氧基 - 苯基磺醯基) - 3 - (4 - 甲氧基
- 6 - 甲基 - 1 , 3 , 5 - 三嗪 - 2 - 基) 尿素 (
triasulfuron) ,

1 - (2 - 甲氧基羰基 - 氯苯基磺醯基) - 3 - (4 , 6
- 二甲基 - 嘧啶 - 2 - 基) 尿素 (sulfometuron - 甲基) ,

1 - (2 - 甲氧基羰基苯基磺醯基) - 3 - (4 - 甲氧基
- 6 - 甲基 - 1 , 3 , 5 - 三嗪 - 2 - 基) - 3 - 甲基尿
素 (tribenuron - 甲基) ,

1 - (2 - 甲氧基羰基苄基磺醯基) - 3 - (4 , 6 - 二
甲基 - 嘧啶 - 2 - 基) 尿素 (bensulfuron - 甲基) ,

1 - (2 - 甲氧基羰基苯基磺醯基) - 3 - (4 , 6 - 雙
- (二氟甲氧基 - 嘧啶 - 2 - 基) 尿素 (primisulfuron
- 甲基) ,

3 - (4 - 乙基 - 6 - 甲氧基 - 1 , 3 , 5 - 三嗪 - 2 -
基) - 1 - (2 , 3 - 二氯 - 1 , 1 - 二酮基 - 2 - 甲基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (26)

苯並 [b] 噻吩 - 7 - 磺醯基) 尿素 (參考 E P - A - 7 9 6 8 3) ,

3 - (4 - 乙氧基 - 6 - 乙基 - 1 , 3 , 5 - 三噻 - 2 - 基) - 1 - (2 , 3 - 二氫 - 1 , 1 - 二酮基 - 2 - 甲基

苯並 [b] 噻吩 - 7 - 磺醯基) 尿素 (參考 E P - A - 7 9 6 8 3) ,

3 - (4 - 甲氧基 - 6 - 甲基 - 1 , 3 , 5 - 三噻 - 2 - 基) - 1 - (2 - 甲氧基羰基 - 5 - 碘苯基磺醯基) 尿素 (參考 W O 9 2 / 1 3 8 4 5)

B 2) 噻噁基磺醯基尿素, 例如 1 - (2 - 甲氧基羰硫基苯 - 3 - 基) - 3 - (4 - 甲氧基 - 6 - 甲基 - 1 , 3 , 5 - 三噻 - 2 - 基) 尿素 (thifensulfuron - 甲基) ,

B 3) 吡唑基磺醯基尿素, 例如

1 - (4 - 乙氧基羰基 - 1 - 甲基吡唑 - 5 - 基 - 磺醯基) - 3 - (4 , 6 - 二甲氧基嘧啶 - 2 - 基) 尿素 (pyrazolsulfuron - 甲基) ,

3 - 氣 - 5 - (4 , 6 - 二甲氧基嘧啶 - 2 - 基) 胺甲醯基胺磺醯基) - 1 - 甲基 - 吡唑 - 4 - 羧酸甲酯 (參考 E P 2 8 2 6 1 3) ,

5 - (4 , 6 - 二甲基嘧啶 - 2 - 基) 胺甲醯基胺磺醯基) - 1 - (2 - 吡啶基) 吡唑 - 4 - 羧酸甲酯 (NC-330, see Brighton Crop Prot. Conference - Weeds - 1991, Vol. 1, 45 et seq.) ,

B 4) 二胺磺衍生物, 例如

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

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 (27)

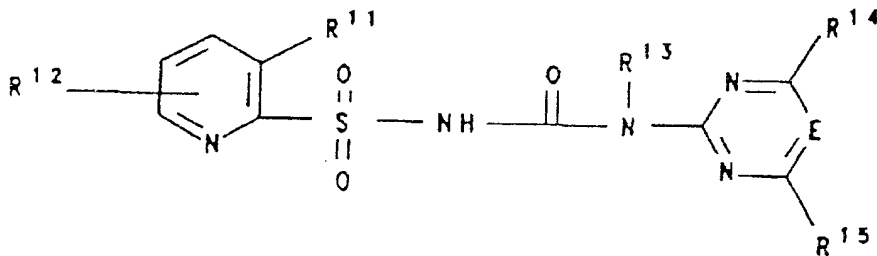
3 - (4 , 6 - 二甲氧基嘧啶 - 2 - 基) - 1 - (N - 甲基 - N - 甲基 - 磺醯基胺磺醯基) 尿素 (anidosulruron) 及結構異構物 (see EP-A-0 1 3 1 2 5 8 and Z.

Pfl. Krankh, Pfl. Schutz 1 9 9 0 , Special Issue XII , 4 8 9 - 4 9 7) ,

B 5) 吡啶基磺醯基尿素，例如

1 - (3 - N , N - 二甲基胺基羰基吡啶 - 2 - 基 - 磺醯基) - 3 - (4 , 6 - 二甲氧基嘧啶 - 2 - 基) 尿素 (nicosulruron) ,

1 - (3 - 乙基磺醯基吡啶 - 2 - 基磺醯基) - 3 - (4 , 6 - 二甲氧基 - 嘧啶 - 2 - 基) 尿素 (DPX-E 9 6 3 6 , see Brighton Crop Prot. Conf. - Weeds - 1989, p 23 et seq.) , 吡啶基磺醯基尿素，如同描述於 D E - A - 4 0 0 0 5 0 3 及 D E - A - 4 0 3 0 5 7 7 者，宜為化學式為下式者



其中

E 是 C H 或 N , 宜為 C H

R¹¹ 是磺或 N R¹⁶ R¹⁷ ,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(28)

R^{12} 是 H、鹵素、氟基、 C_1-C_3 -烷基、 C_1-C_3 -烷氧基、 C_1-C_3 -鹵烷基、 C_1-C_3 -鹵烷氧基、 C_1-C_3 -烷硫基、(C_1-C_3 -烷氧基)、 C_1-C_3 -烷基、(C_1-C_3 -烷氧基)羰基、—或二—(C_1-C_3 -烷基)胺基、 C_1-C_3 -烷基亞磺醯基或—磺醯基、

$SO_2-NR^aR^b$ 或 $CO-NR^aR^b$ ，特別是氫，

R^a 和 R^b 彼此間無關，且為 H、 C_1-C_3 -烷基、 C_1-C_3 -烯基、 C_1-C_3 -炔基或一起為—(CH_2)₄—、—(CH_2)₅—或 (CH_2)₂-O—(CH_2)₂-，

R^{13} 是 H 或 CH_3 ，

R^{14} 是鹵素、 C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -烷氧基、 C_1-C_2 -鹵烷基(宜為 CF_3)、 C_1-C_2 -鹵烷氧基(宜為 $OCHF_2$ 或 OCH_2CF_3)，

R^{15} 是 C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -鹵烷氧基(宜為 $OCHF_2$)，或 C_1-C_2 -烷氧基，及

R^{16} 是 C_1-C_4 -烷基及

R^{17} 是 C_1-C_4 -烷基磺醯基或

R^{16} 和 R^{17} 一起是化學式—(CH_2)₃ SO_2 —或—(CH_2)₄ SO_2 —之鏈

例如 3-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-(3-N-甲基磺醯基-N-甲基胺基吡啶-2-基)磺醯基尿素，或其鹽類，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

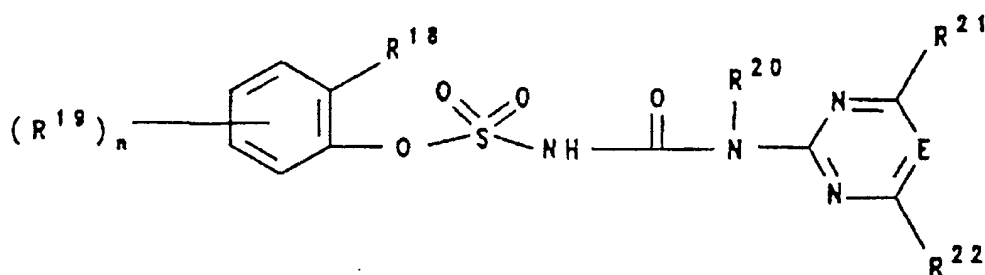
裝

訂

線

五、發明說明 (29)

B 6) 烷氧基苯氧基磺醯基尿素，如同在 E P - A - 0 3 4 2 5 6 9 所描述的，宜為化學式為下式者



其中

E 是 C H 或 N ，宜為 C H ，

R¹⁸ 是乙氧基、丙氧基或異丙氧基，

R¹⁹ 是氫、鹵素、N O₂、C F₃、C N、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷硫基或 (C₁-C₃-烷氧基) 羰基，宜在苯環上第 6 的位置上，

n 是 1、2 或 3，宜為 1，

R²⁰ 是氫、C₁-C₄-烷基或 C₃-C₄-烯基，

R²¹和 R²²彼此間無關，且是鹵素、C₁-C₂-烷基、C₁-C₂-烷氧基、C₁-C₂-鹵烷基、C₁-C₂-鹵烷氧基或 (C₁-C₂-烷氧基) - C₁-C₂-烷基，宜為 O C H₃ 或 C H₃，例如 3 - (4, 6 - 二甲氧基嘧啶 - 2 - 基) - 1 - (2 - 乙氧基苯氧基) 磺醯基尿素，或其鹽類，

以及其他相關之磺醯基尿素之衍生物和其混合物，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (30)

C) 氯乙醯替苯胺除草劑，諸如

N - 甲氧基甲基 - 2 , 6 - 二乙基氯乙醯替苯胺 (alachlor) ,

N - (3 ' - 甲氧基丙 - 2 ' - 基) - 2 - 甲基 - 6 - 乙基氯乙醯替苯胺 (metolachlor) ,

N - (2 , 6 - 二甲基) - N - (3 - 甲基 - 1 , 2 , 4 - 噁二唑 - 5 - 基 - 甲基) 氯乙醯替苯胺 ,

N - (2 , 6 - 二甲基苯基) - N - (1 - 吡啶基甲基) 氯乙醯胺 (metazachlor) ,

D) 硫胺甲酸酯，諸如

N , N - 二丙基硫胺甲酸 S - 乙酯 (E P T C) 或

N , N - 二異丁基硫胺甲酸 S - 乙酯 (butylate)

E) 環己二酮衍生物，諸如

3 - (1 - 烯丙氧基亞胺基丁基) - 4 - 羥基 - 6 , 6 - 二甲基 - 2 - 酮基環己 - 3 - 烯羧酸甲酯 (alloxydim)

,

2 - (1 - 乙氧基亞胺基丁基) - 5 - (2 - 乙基硫丙基) - 3 - 羥基 - 環己 - 2 - 烯 - 1 - 酮 (sethoxymid) ,

2 - (1 - 乙氧基亞胺基丁基) - 5 - (2 - 苯基硫丙基) - 3 - 羥基 - 環己 - 2 - 烯 - 1 - 酮 (cloproxymid)

,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (31)

2 - (1 - (3 - 氯烯丙氧基) 亞胺基丁基) - 5 - [2 - (乙硫基) - 丙基] - 3 - 羥基環己 - 2 - 烯 - 1 - 酮 ,

2 - (1 - (3 - 氯烯丙氧基) 亞胺基丙基) - 5 - [2 - (乙硫基) - 丙基] - 3 - 羥基環己 - 2 - 烯 - 1 - 酮 (clethodim) ,

2 - (1 - 乙氧基亞胺基) 丁基) - 3 - 羥基 - 5 - (噻噁 - 3 - 基) 環己 - 2 - 烯酮 (cycloxydim) , 或

2 - (1 - 乙氧基亞胺基丙基) - 5 - (2 , 4 , 6 - 三甲基苯基) - 3 - 羥基環己 - 2 - 烯 - 1 - 酮 (tralkoxydim) ,

F) 2 - (4 - 烷基 - 5 - 酮基 - 2 - 咪唑啉 - 2 - 基) 苯甲酸衍生物或 2 - (4 - 烷基 - 5 - 酮基 - 2 - 咪唑啉 - 2 - 基) 雜芳基羧酸衍生物 , 諸如 , 例如 , 2 - (4 - 異丙基 - 4 - 甲基 - 5 - 酮基 - 2 - 咪唑啉 - 2 - 基) - 5 - 甲基苯甲酸甲酯及

2 - (4 - 異丙基 - 4 - 甲基 - 5 - 酮基 - 2 - 咪唑啉 - 2 - 基) - 4 - 甲基苯甲酸 (imazamethabenz) ,

5 - 乙基 - 2 - (4 - 異丙基 - 4 - 甲基 - 5 - 酮基 - 2 - 咪唑啉 - 2 - 基) 吡啶 - 3 - 羧酸 (imazethapyr) ,

2 - (4 - 異丙基 - 4 - 甲基 - 5 - 酮基 - 2 - 咪唑啉 - 2 - 基) 喹啉 - 3 - 羧酸 (imazaquin) ,

2 - (4 - 異丙基) - 4 - 甲基 - 5 - 酮基 - 2 - 咪唑啉 - 2 - 基) 吡啶 - 3 - 羧酸 (imazapyr) ,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (32)

5 - 甲基 - 2 - (4 - 異丙基 - 4 - 甲基 - 5 - 酮基 - 2 - 咪唑啉 - 2 - 基) 吡啶 - 3 - 羧酸 (imazethamethapyr) ,

G) 三唑並嘧啶磺醯胺衍生物，例如

N - (2 , 6 - 二氟苯基) - 7 - 甲基 - 1 , 2 , 4 - 三唑並 - (1 , 5 - c) 嘧啶 - 2 - 磺醯胺 (flumetsulam) ,

N - (2 , 6 - 二氯 - 3 - 甲基苯基) - 5 , 7 - 二甲氧基 - 1 , 2 , 4 - 三唑並 - (1 , 5 - c) - 嘧啶 - 2 - 磺醯胺 ,

N - (2 , 6 - 二氟苯基) - 7 - 氟 - 5 - 甲氧基 - 1 , 2 , 4 - 三唑並 - (1 , 5 - c) - 嘧啶 - 2 - 磺醯胺 ,

N - (2 , 6 - 二氯 - 3 - 甲基苯基) - 7 - 氯 - 5 - 甲氧基 - 1 , 2 , 4 - 三唑並 - (1 , 5 - c) - 嘧啶 - 2 - 磺醯胺) ,

N - (2 - 氯 - 6 - 甲氧基羰基) - 5 , 7 - 二甲基 - 1 , 2 , 4 - 三唑並 (1 , 5 - c) - 嘧啶 - 2 - 磺醯胺) ,

(參考，例如，EP - A - 3 4 3 7 5 2 , US - 4 9 8 8 8 1 2)

H) 苯甲醯基環己二酮衍生物，例如

2 - (2 - 氯 - 4 - 甲基磺醯基苯甲醯基 (- 環己烷 - 1

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (33)

， 3 - 二 酮 (S C - 0 0 5 1 ， 參 考 E P - A - 1 3 7 9 6 3) ，

2 - (2 - 硝 基 苯 甲 醯 基) - 4 ， 4 - 二 甲 基 - 環 己 烷 - 1 ， 3 - 二 酮 (參 考 E P - A - 2 7 4 6 3 4) ，

2 - (2 - 硝 基 - 3 - 甲 基 磺 醯 基 苯 甲 醯 基) - 4 ， 4 - 二 甲 基 環 己 烷 - 1 ， 3 - 二 酮 (參 考 W O - 9 1 / 1 3 5 4 8) ，

J) 嘧 啶 氧 基 嘧 啶 羧 酸 衍 生 物 或 嘧 啶 氧 基 苯 甲 酸 衍 生 物 ， 例 如

3 - (4 ， 6 - 二 甲 氧 基 嘧 啶 - 2 - 基) 氧 吡 啶 - 2 - 羧 酸 苄 酯 (E P - A - 2 4 9 7 0 7) ，

3 - (4 ， 6 - 二 甲 氧 基 嘧 啶 - 2 - 基) 氧 吡 啶 - 2 - 羧 酸 甲 酯 (E P - A - 2 4 9 7 0 7) ，

2 ， 6 - 雙 [(4 ， 6 - 二 甲 氧 基 嘧 啶 - 2 - 基) 氧] 苯 甲 酸 (E P - A 3 2 1 8 4 6) ，

2 ， 6 - 雙 [(4 ， 6 - 二 甲 氧 基 嘧 啶 - 2 - 基) 氧] 苯 甲 酸 1 - 乙 氧 基 羧 基 乙 酯 (E P - A 4 7 2 1 1 3) ， 及

K) S (N - 芳 基 - N - 烷 基 胺 甲 醯 基 甲 基) 二 硫 磷 酸 酯 ， 諸 如 S - [N - (4 - 氯 苯 基) - N - 異 丙 基 胺 甲 醯 基 甲 基] 二 硫 磷 酸 O ， O - 二 甲 酯 (anilofos) 。

上 述 除 草 劑 ， 從 A 至 K 之 種 類 是 專 家 所 熟 知 的 ， 且 照

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (34)

例地是描述於 "The Pesticide Manual", British Crop Protection Council, 9th Edition 1 9 9 1, 或 8th Edition 1 9 8 7, 或描述於 "Agricultural Chemicals Book II, Herbicides", 由 W.T. Thompson 所著, Thompson 出版物, Fresno CA, USA 1 9 9 0 或描述於 "Farm Chemicals Handbook '90", Meister Publishing Company, Willoughby OH, USA 1 9 9 0。Imazethamethapyr 已知記載於 Weed Techn. 1 9 9 1, Vol. 5, 4 3 0 - 4 3 8。

除草劑之活性物質及提過之安全劑可以一起使用 (以已混合好之形式或在桶內加以混合) , 或者以合適的順序, 一個接一個使用。安全劑: 除草劑的重量比例可以在很寬的範圍內改變, 但此範圍宜為 1 : 1 0 至 1 0 : 1, 特別是 1 : 1 0 至 5 : 1。除草劑和安全劑在每一種情況下之理想使用量, 是由除草劑和安全劑之類形以及將被處理植物之本質來加以決定, 且在每一種個別情況, 可先以合適的先期測試來加以決定。類似的比例是可以考慮的, 當安全劑與其他農作物保護產品之活性物質 (諸如殺蟲劑或殺蟲劑 / 除草劑的結合物) 一起使用。

安全劑主要用於穀類農作用 (小麥、裸麥、大麥、燕麥) 稻米、玉蜀黍、蘆粟, 但也使用於棉花及大豆上, 特別是穀類、稻米及玉蜀黍。

本發明化學式 (I) 之安全劑與含有磺醯基尿素及 / 或咪唑啉酮之除草劑, 或含有苯氧基苯氧基 - 和雜芳氧基

五、發明說明 (35)

苯氧基烷羧酸衍生物之除草劑結合使用，是特別好的。

一些結構類型的除草劑，是不可用於穀類及／或玉蜀黍和稻米上，或者並沒有足夠的選擇性，而當這些除草劑與本發明的安全劑結合後，並用於穀類、玉蜀黍和稻米上，是可以得到出色的選擇性的。

根據化學式 (I) 之安全劑的特性，可以將其用於農作物植物之種子的預處理上 (種子處理 (seed dressing))，或播種前混合於種子內，或在植物萌發前後與除草劑一起使用。萌發前之處理包括播種前耕作土地的處理及播種時耕作土地的處理，但此時農作物植物還未開始生長，而化學式 (I) 之安全劑與除草劑一起使用，特別是後期萌發處理方式較佳，以桶子混合或已混合好之形式均可以。

根據徵兆及使用的除草劑，安全劑使用的比例的範圍很寬，慣例上每公頃土地活性物質使用為 0 . 0 0 1 至 5 公斤間，宜為 0 . 0 0 5 至 0 . 5 公斤間。

本發明也關於保護農作物植物，以對抗對植物有害之副作用之方法，係使用農藥，而以除草劑較佳，並包括使用有效量之化學式 (I) 之化合物至植物上、植物的種子上或耕種前後之土地上，或同時與農藥或除草劑使用。

本發明也關於農作物保護產品，其包含化學式 (I) 之活性物質及慣用組成物輔助劑，以及農藥 (宜為除草劑) 組成物，其包含化學式 (I) 之活性物質，以及農藥或除草劑及組成物輔助劑，該輔助劑是農作物保護領域慣用

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (36)

的。

化學式 (I) 之化合物及其與 1 或多種可於不同方式結合之除草劑之組合物，是由生物及／或理化變數加以決定的，下列之變數適用於公式上：可濕性粉末 (W P)、可乳化濃縮液 (E C)、水溶性粉末 (S P)、水溶性濃縮液 (S L)、濃縮乳膠 (E W) (諸如油在水中及水在油中之乳液、噴溶液或乳液)、膠囊懸浮液 (C S)、以油或水為主之分散液 (S C)、懸浮乳液、懸浮濃縮物、灰粒 (D P)、與油互溶之溶液 (O L)、經處理之種子產物、微粒之顆粒 (G R)、噴淋顆粒、經塗覆之顆粒及吸附顆粒、應用於土壤或施撒之顆粒、水溶性顆粒 (S G)、水分散性顆粒 (W G)、U L V 組成物、微膠囊及蠟。

這些形式的組成物在理論上是已知的，且已描述於，例如，Winnacker-Kuchler, "Chemische Technologie" ; [Chemical Technology], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Edition, 1986; Wade van Valkenburg, "pesticide Formulations", Marcel Dekker N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London。

組成物中所需要的輔助劑，諸如惰性物質、表面活性劑、溶劑及其他添加劑，均是已知的並已描述於，例如，Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carrers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (37)

J.; H.v.Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; Marsden, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schonfeldt, "Grenzflächenaktive Athylenoxidaddukte" [Surface-Active Ethylene Oxide Adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Kuchler "Chemische Technologie" [Chemical Technology], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Edition, 1986。

與其他農藥上之活性物質、肥料及／或生長調節劑之結合，也可以以這些組成物為基礎，加以製備，例如已事先混合好了或在桶子內加以混合。

可濕性粉末是均勻分散於水中之製劑，除了活性物質外，也含有濕潤劑，例如聚氧乙基化之烷基酚、聚氧乙基化之脂肪族醇及脂肪族胺、脂肪族醇聚乙二醇醚硫酸酯、磺酸烷基酯或磺酸烷基芳基酯，以及分散劑，例如廿四磺酸鈉、2，2'-二羧甲烷-6，6'-二磺酸鈉、二丁基羧磺酸鈉或其他油鹽基甲基胺乙磺酸鈉，此外並加入稀釋劑或惰性物質。

可乳化濃縮液之製備是將活性物質溶解於有機溶劑中

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (38)

，例如丁醇、環己醇、二甲基甲醯胺、二甲苯或其他高沸點之芳族化合物或烴類，同時加入一或多種乳化劑。可以使用之乳化劑有：烷基芳基磺酸鈣，諸如十二烷苯磺酸鈣，或非離子性乳化劑，諸如脂肪酸聚乙二醇酯、烷基芳基聚乙二醇醚、脂肪族醇聚乙二醇醚、氧化丙烯氧化乙烯縮合產物（例如分段共聚體）、烷基聚醚、山梨糖醇酐脂肪酸酯、聚氧化乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯或聚氧化乙烯山梨糖醇酯。

灰粒之製得係將活性物質與被仔細分割過之固態物質一起碾磨，該固態物質例如滑石、天然白土，諸如高嶺土、膨潤土及葉蠟石，或矽藻土。

顆粒之製備，係將活性物質噴淋至吸附的、粒狀的惰性物質，或以黏合劑使活性物質濃縮物附著於載體之表面，該載體諸如沙、高嶺石或粒狀的惰性物質，而黏合劑則例如聚乙烯醇、聚丙烯酸鈉或其他的礦物油。適用的活性物質也可以用製備肥粒顆粒之習用方法製成粒狀，若合適的話，可以與肥料一起製成混合物形式。

通常地，農藥化學製劑含有化學式 (I) (解毒劑) 之活性物質或解毒劑 / 除草劑之活性物質混合物為 0 . 1 至 9 9 % 重，特別是 0 . 1 至 9 5 % 重，含有固態或液態添加劑為 1 至 9 9 . 9 % 重，特別是 5 至 9 9 . 8 % 重，以及含有表面活化劑。至 2 5 % 重，特別是 0 . 1 至 2 5 % 重。

可濕性粉末中活性物質的濃度，例如，約為 1 0 至

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (39)

90%重，剩餘含量至100%包含習用組成物成分。在可乳化濃縮物中，活性物質的濃度約為1至80%重。灰粒之組成物中，約含1至20%重之活性物質，可噴淋溶液約含0.2至20%重之活性物質。在顆粒中的情形，諸如水分散性顆粒，其活性物質含量部分是與活性化合物為液態或固態有關，而水分散性顆粒通常含有10至90%重間之活性物質。

此外，若合適的話，所提及之活性物質組成物包含黏合劑、濕潤劑、分散劑、乳化劑、浸透劑、溶劑、填料或載，而在每一種情況都是習用的。

若合適的話，將市售之組成物，以習知方式稀釋，例如可濕性粉末、可乳化濃縮物、分散體及水分散性顆粒之情形，使用水。製備灰粒、顆粒及可噴淋溶液，在使用前，習慣上不會以其他惰性物質加以稀釋。解毒劑使用比率視外界條件而改變，諸如，尤其，溫度、濕度及所使用農藥或除草劑之本質。

下文實施例係用來說明本發明：

A：組成物實施例

a) 灰粒之製備，是將10重量份之化學式(I)之化合物，或除草劑與化學式(I)化合物之混合活性物質；與作為惰性物質之90重量份之滑石混合，並以錘磨機將此混合物磨碎。

b) 可以分散於水中之可濕性粉末之製備，是將25重量份之化學式(I)之化合物，或除草劑與化學式(I)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (40)

-) 的安全劑之混合活性物質，與作為惰性物質之 6 4 重量份之含有高嶺土石英，1 0 重量份之木質磺酸鉀以及作為濕潤劑和分散劑之 1 重量份之油鹼基甲基牛安磺鹼鈉混合，並將此混合物在固定盤式磨機磨碎。
- c) 可以分散於水中之分散性濃縮物之製備，是將 2 0 重量份之化學式 (I) 之化合物，或除草劑與化學式 (I) 的安全劑之混合活性物質，與 6 重量份之烷基酚聚乙二醇醚 (^RTriton X 2 7 0) ， 3 重量份之異十三醇聚乙二醇醚 (8 E O) 以及 7 1 重量份之石蠟礦物油 (例如沸點範圍約 2 5 5 至 2 7 7 °C 以上) 混合，並將此混合物以球磨機碾磨至大小比 5 微米小。
- d) 可乳化性濃縮物之製備，是將 1 5 重量份之化學式 (I) 之化合物，或除草劑與化學式 (I) 的安全劑之混合活性物質，與作為 7 5 重量份之環己酮以及作為乳化劑之 1 0 重量份之乙氧基化之壬基酚混合。
- e) 水分散性顆粒之製備，是將 7 5 重量份之化學式 (I) 之化合物，或除草劑與化學式 (I) 的安全劑之混合活性物質，與 1 0 重量份之木質磺酸鈣，
1 0 重量份之木質磺酸鈣，
5 重量份之十二烷基硫酸鈉，
3 重量份之聚乙烯醇以及
7 重量份之高嶺土混合，
並將此混合物以固定盤式磨機碾磨，之後製得之粉末在流化床中噴灑作為顆粒化液體之水，以使粉末顆粒

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (41)

化。

f) 水分散性顆粒之製備，是將

2.5 重量份之化學式 (I) 之化合物

或除草劑與化學式 (I) 的安全劑之混合
活性物質，

5 重量份之 2, 2'-二苯甲烷-6, 6'-二磺
酸鈉，

2 重量份之油醯基甲基牛胺磺醯鈉，

1 重量份之聚乙烯醇

1.7 重量份之碳酸鈉以及

5.0 重量份之水，

以膠體磨機均勻化及預先磨碎，之後將此混合物以珠
磨機碾磨，並以單一物質噴嘴之噴灑塔，將產生之
懸浮液霧化及乾燥。

B. 製備實施例

1. 5, 5-二苯基-2-異噁唑啉-3-羧酸乙酯

13.52 克 (0.075 莫耳) 之 1, 1-二苯基

乙烯與 5.06 克 (0.05 莫耳) 之三乙基胺，在

0 °C 下溶解於 200 毫升之醚中，之後並將溶解於

100 毫升之醚中的 2-氯-2-脲基醋酸乙酯逐滴

加入，約歷時 2 小時，並在室溫中攪拌 1 小時，之後

加入 100 毫升之水，所得之混合物以醚來萃取。經

MgSO₄ 乾燥後，醚亦已蒸餾掉，剩下之餘渣在矽

五、發明說明(42)

膠塔中純化(溶析液中:正庚烷:醋酸乙酯=8:2),如此可製得12.7克(理論上86%)的產品,其熔點為78至81°C。

下文中表1之化合物是以類似實施例1之方法或實施例1前之方法製得。

表1中之縮寫:

Me: 甲基

BU: 丁基

i-, s-, t-, c- 烷基 = 異-, 第二-, 第三或環- 烷基。

M.P. = 熔點(以°C表示)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

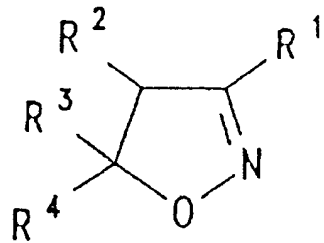
裝

訂

線

五、發明說明 (43)

表 1 :



Ex.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	M. p.
2	-COOCH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	122-124°C
3	-COO-n-C ₃ H ₇	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	64-66°C
4	-COO-n-C ₄ H ₉	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
5	-COO-n-C ₅ H ₁₁	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
6	-COO ⁻ Na ⁺	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	210-212°C (Z)
7	-COO ⁻ N(CH ₃) ₄ ⁺	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	116°C (Z)
8	-COOCH ₂ CH ₂ Cl	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	70°C
9	-COOCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
10	-COO-i-C ₃ H ₇	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
11	-COO-i-C ₄ H ₉	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
12	-COO-s-C ₄ H ₉	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
13	-COO-C(CH ₃) ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
14	-COO-n-C ₆ H ₁₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
15	-COO-n-C ₈ H ₁₇	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
16	-COOCH ₂ SCH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
17	-COOCH ₂ -CH=CH ₂	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	55-57°C
18	-COOH	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	85-90°C
19	-COOC ₂ H ₅	CH ₃	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	

五、發明說明 (44)

Ex.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	M. p.
20	-COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
21	-COO-n-C ₄ H ₉	cyclo-C ₃ H ₄	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
22	-COOCH ₃	cyclo-C ₆ H ₁₁	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
23	-COOC ₂ H ₅	-CH ₂ -CH=CH ₂	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	82°C
24	-COOC ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ CN	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
25	-COO-C ₂ H ₅	-COOC ₂ H ₅	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
26	-COOC ₂ H ₅	-OC ₂ H ₅	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
27	-COOC ₂ H ₅	-S-CH ₃	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
28	-COOCH ₃	-CH ₂ COOCH ₃	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
29	-COOCH ₂ C ₆ H ₅	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
30	-COOC ₆ H ₅	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
31	-COOCH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
32	-COOC ₂ H ₅	H	2-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	
33	-COOC ₂ H ₅	H	3-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	油
34	-COOC ₂ H ₅	H	4-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	油
35	-COOC ₂ H ₅	H	2-F-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	
36	-COOC ₂ H ₅	H	3-F-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	
37	-COOC ₂ H ₅	H	4-F-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	油
38	-COOC ₂ H ₅	H	4-Cl-C ₆ H ₄	4-Cl-C ₆ H ₄	油
39	-COOC ₂ H ₅	H	4-Cl-C ₆ H ₄	2-Cl-C ₆ H ₄	
40	-COOC ₂ H ₅	H	4-Cl-C ₆ H ₄	3-Cl-C ₆ H ₄	
41	-COOC ₂ H ₅	H	4-Br-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	
42	-COOC ₂ H ₅	H	4-Br-C ₆ H ₄	4-Cl-C ₆ H ₄	油
43	-COOC ₂ H ₅	H	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	油

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (45)

Ex.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	M.p.
44	-COOC ₂ H ₅	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	
45	-COOC ₂ H ₅	H	4-CH ₃ C ₆ H ₄	4-Cl-C ₆ H ₄	油
46	-COOC ₂ H ₅	H	2,4-di-Cl-C ₆ H ₃	C ₆ H ₅	油
47	-COOC ₂ H ₅	H	3,4-di-Cl-C ₆ H ₃	C ₆ H ₅	油
48	-COOC ₂ H ₅	H	2,5-di-Cl-C ₆ H ₃	C ₆ H ₅	
49	-COOC ₂ H ₅	H	3,5-di-Cl-C ₆ H ₃	C ₆ H ₅	
50	-COOC ₂ H ₅	H	2,6-di-Cl-C ₆ H ₃	C ₆ H ₅	
51	COOC ₂ H ₅	H	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	
52	COOC ₂ H ₅	H	4-CN-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	
53	COOC ₂ H ₅	H	4-COOCH ₃ -C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	
54	COOC ₂ H ₅	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	120°C
55	COO-n-C ₃ H ₇	H	4-F-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	油
56	COO-n-C ₃ H ₇	H	4-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	油
57	COO-n-C ₄ H ₉	H	4-F-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	油
58	COO-n-C ₄ H ₉	H	4-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	油
59	COO-n-C ₅ H ₁₁	H	4-F-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	油
60	COO-n-C ₅ H ₁₁	H	4-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	油
61	COO-n-C ₆ H ₁₃	H	4-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	油
62	COO-CH ₂ CH ₂ Cl	H	4-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	油
63	COO-CH ₂ CH ₂ - OCH ₃	H	4-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	
64	COOCH(CH ₃)- CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	4-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	
65	COO-CH ₂ C ₆ H ₅	H	4-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	
66	COOH	H	4-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	86-87°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(46)

Ex.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	M.p.
67	COO ⁻ Na ⁺	H	4-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	
68	COO ⁻ K ⁺	H	4-F-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	
69	COOC ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	CH ₃	油
70	COOCH ₃	H	C ₆ H ₅	CH ₃	
71	COOC ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	CH(CH ₃) ₂	
72	COOC ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	C(CH ₃) ₃	油
73	COOC ₂ H ₅	H	4-Cl-C ₆ H ₄	C(CH ₃) ₃	
74	COO-n-C ₃ H ₇	H	C ₆ H ₅	C(CH ₃) ₃	
75	COO-n-C ₄ H ₉	H	C ₆ H ₅	C(CH ₃) ₃	
76	COO-n-C ₅ H ₁₁	H	C ₆ H ₅	C(CH ₃) ₃	
77	COO-n-C ₆ H ₁₃	H	C ₆ H ₅	C(CH ₃) ₃	
78	COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C ₆ H ₅	C(CH ₃) ₃	
79	COO-C ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	CH ₂ C(CH ₃) ₃	
80	COO-C ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	
81	COOC ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	cyclo-C ₅ H ₉	油
82	COOC ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	cyclo-C ₆ H ₁₁	油
83	COOC ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	cyclo-C ₃ H ₅	油
84	COO-n-C ₃ H ₇	H	C ₆ H ₅	cyclo-C ₆ H ₁₁	
85	COO-n-C ₄ H ₉	H	C ₆ H ₅	cyclo-C ₆ H ₁₁	
86	COO-n-C ₅ H ₁₁	H	C ₆ H ₅	cyclo-C ₆ H ₁₁	
87	-COOC ₂ H ₅	H	cyclo-C ₆ H ₁₁	CH ₃	
88	-COOC ₂ H ₅	H	cyclo-C ₆ H ₁₁	C(CH ₃) ₃	
89	-COOC ₂ H ₅	H	cyclo-C ₆ H ₁₁	cyclo-C ₆ H ₁₁	
90	-COOC ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	2-pyridyl	

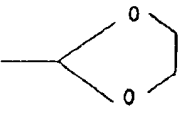
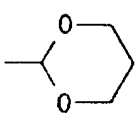
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(47)

Ex.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	M.p.
91	-COOC ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	3-pyridyl	油
92	-COOC ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	4-pyridyl	油
93	-COOC ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	2-thienyl	油
94	-COOC ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	3-thienyl	油
95	-COOC ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	2-Cl-3-pyridyl	油
96	-COOC ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅	6-Cl-3-pyridyl	
97	-COOC ₂ H ₅	H	4-Cl-C ₆ H ₄	3-pyridyl	
98	-COOC ₂ H ₅	H	3-Cl-C ₆ H ₄	3-pyridyl	
99	-COOC ₂ H ₅	H	2-Cl-C ₆ H ₄	3-pyridyl	
100	-COOH	H	C ₆ H ₅	3-pyridyl	
101	-COCH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
102	-COCH ₃	H	C ₆ H ₅	cyclo-C ₆ H ₁₁	
103	-CHO	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
104	-CHO	H	C ₆ H ₅	cyclo-C ₆ H ₁₁	
105	-CHO	H	C ₆ H ₅	C(CH ₃) ₃	
106	-CH(OCH ₃) ₂	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
107	-CH(OC ₂ H ₅) ₂	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
108		H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
109		H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
110	-C(OCH ₃) ₂ CH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	

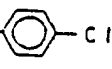
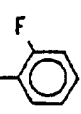
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (48)

Ex.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	M. p.
111	-COCF ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
112	-COCF ₃	H	C ₆ H ₅	C(CH ₃) ₃	
113	-COCF ₃	H	C ₆ H ₅	cyclo-C ₆ H ₁₁	
114	-COCCl ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
115	-COCHCl ₂	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
116	-COCHCl ₂	H	C ₆ H ₅	C(CH ₃) ₃	
117	-COCHCl ₂	H	C ₆ H ₅	cyclo-C ₆ H ₁₁	
118	-COCHF ₂	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
119	-COCHF ₂	H	C ₆ H ₅	3-pyridyl	
120	-COO- CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
121	-COOH	H	4-F-C ₆ H ₄	4-F-C ₆ H ₄	130-134°C
122	-COOH	H	4-F-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	135-140°C
123	-COOC ₂ H ₅	H	-COOCH(CH ₃)- C ₂ H ₅	C ₆ H ₅	油
124	-CONH-  -Cl	H	-C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	212-215°C
125	-COOC ₂ H ₅	H	-COOC ₂ H ₅	C ₆ H ₅	油
126	-COOCH ₂ COOC ₂ H ₅	H	-C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
127	-CH ₂ -C≡CH	H	-C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
128	-COOCH ₂ - 	H	-C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
129	-COOCH(C ₂ H ₅) ₂	H	-C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
130	-COOCH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	-4-F-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	油

(請先閱讀背面之注意事項再為本頁)

裝

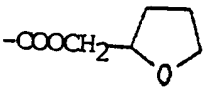
訂

線

85. 6. 28 修正
年 月 日 補充

A7
B7

五、發明說明 (49)

Ex.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	M.p.
131		H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
132	-COOC ₄ H ₉ (n)	H	-C ₆ H ₅	-2-CH ₂ C ₆ H ₄	油
133	-COOCH ₂ - CH ₂ OC ₂ H ₅	H	-C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	油
134	-COOC ₂ H ₅	H	4-F-C ₆ H ₄	4-F-C ₆ H ₄	油
135	-COOC ₄ H ₉ (n)	H	4-F-C ₆ H ₄	4-F-C ₆ H ₄	油
136	-CON(CH ₃) ₂	H	-C ₆ H ₅	-C ₆ H ₅	105-107°C
137	-CONHCH ₃	H	-C ₆ H ₅	-C ₆ H ₅	110-112°C
138	-CONH ₂	H	-C ₆ H ₅	-C ₆ H ₅	185-187°C
139	-COOCH ₂ CH ₂ OH	H	-C ₆ H ₅	-C ₆ H ₅	102-103°C
140	-COOC ₂ H ₅	H	-4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	-4-F-C ₆ H ₄	135-140°C
141	CO ₂ Et	H	4-NMe ₂ -C ₆ H ₄	C ₆ H ₄	油
142	CO ₂ Et	H	4-F-C ₆ H ₄	2-F-C ₆ H ₄	油
143	CO ₂ Et	H	4-Cl-C ₆ H ₄	4-t-Bu-C ₆ H ₄	86°C
144	CO ₂ Et	H	4-F-C ₆ H ₄	2-Cl-C ₆ H ₄	油
145	CO ₂ Et	H	4-F-C ₆ H ₄	2,3,4-Cl ₃ - C ₆ H ₂	88°C
146	CO ₂ Et	H	4-F-C ₆ H ₄	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	油 ¹⁾
147	CO ₂ Et	H	2,4-F ₂ -C ₆ H ₃	C ₆ H ₅	油
148	CO ₂ Et	H	4-F-C ₆ H ₄	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	油 ²⁾
149	CO ₂ Et	H	4-F-2-Cl-C ₆ H ₃	C ₆ H ₅	油
150	CO ₂ Et	H	4-Cl-2-F-C ₆ H ₃	C ₆ H ₅	油

Ex. 146, 148 之折射率：

¹⁾ n_D²⁰ = 1,5493 ²⁾ n_D³⁰ = 1,5530

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (50)

C. 生物上之實施例

將小麥、大麥或稻米之種子放入塑膠罐內裝有多沙之壤質土內，該植物在溫室內生長，直到有 3 至 4 個葉子時，連續用本發明化合物和除草劑，處理後期萌發，所使用之除草劑和化學式 (I) 之化合物是水溶性之懸浮液或乳液，而使用之比例為水 / 公頃 (已轉化過) 之 3 0 0 1，處理後之 3 - 4 星期，以目視法記下由所使用之除草劑所造成之任何形式的損害，同時特別要考慮持續不變的生長抑制，而評估之方式是與未處理之對照組比較後以百分比表示。

一些試驗結果列於表 2、3 及 4。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (51)

表 2 : 在大麥中安全劑的功効

產 品 除 草 劑 / 安 全 劑	用 量 比 例 (kg a.i./ha)	在 HOVU% 中 之 除 草 活 性
	0.2	80
H ₁ +No.1	0.2+1.25	60
H ₁ +No.2	0.2+1.25	60
H ₁ +No.6	0.2+1.25	20
H ₁ +No.17	0.2+1.25	20
H ₁ +No.4	0.2+1.25	20
H ₁ +No.3	0.2+1.25	30
H ₁ +No.7	0.2+1.25	37

H₁ = Fenoxaprop-P-ethyl

HOVU = Hordeum vulgare (大麥)

No. = B 項中安全劑的實例號碼 (化學上之實施例)

五、發明說明 (52)

表 3 : 在稻米中安全劑之功效

產 品 除草劑 / 安全劑	用 量 比 例 (kg a.i./ha)	在 %ORSA 中之 除草活性
H ₁	0.3	75
H ₁ +No.1	0.3+1.25	60
H ₁ +No.2	0.3+1.25	70
H ₁ +No.6	0.3+1.25	70
H ₁ +No.17	0.3+1.25	70
H ₁ +No.4	0.3+1.25	65
H ₁ +No.3	0.3+1.25	20
H ₁ +No.7	0.3+1.25	70

H₂ = Fenoxaprop-P-ethyl

O R S A = Oryza sativa (稻米)

五、發明說明 (53)

表 4 : 在玉蜀黍中安全劑之功效

產 品 除草劑 / 安全劑	用 量 比 例 (kg a. i. / ha)	在 %ZEMV 中 之 除 草 活 性
H ₂	0.075	70
H ₂ +No.1	0.075+1.25	20
H ₂ +No.2	0.075+1.25	30
H ₂ +No.6	0.075+1.25	50
H ₂ +No.17	0.075+1.25	70
H ₂ +No.4	0.075+1.25	30
H ₂ +No.3	0.075+1.25	40
H ₂ +No.7	0.075+1.25	30

H₂ = 3-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-(3-N-甲基磺
基-N-甲基胺基吡啶-2-基)磺醯基尿素

Z E M V = Zea mays (玉蜀黍)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (54)

實施例 2

將在塑膠罐之玉蜀黍植物置於溫室中成長，直到其長到 4 - 葉子階段或 6 - 葉子階段時，以含有除草劑和本發明化學式 (I) 之化合物之桶內混合物處理，噴灑於正在生長中之植物之製劑的使用比例為水 / 公頃之 3 0 0 1，處理後 4 星期，記下該植物之植物毒害性，而損害程度是與對處理對照組比較後加以決定的。

表 5 和 6 之試驗結果，顯示本發明化合物在避免植物受到損害上，是非常有功效的。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (55)

表 5 : 本發明化合物在玉蜀黍植物之功效

物質	用量比例		在玉蜀黍中之除草活性 (以 % 表示)	
			4-葉子階段	6-葉子階段
除草劑 / 安全劑	kg AS/ha			
H ₂	0.200		77	83
	0.100		70	73
	0.050		63	60
	0.025		33	40
H ₂ +No.1	0.200	0.200	5	10
	0.100	0.100	0	0
	0.050	0.050	0	0
	0.025	0.025	0	0
H ₂ +No.3	0.200	0.200	40	0
	0.100	0.100	20	0
	0.050	0.050	0	0
	0.025	0.025	0	0

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (56)

物質	用量比例		在玉蜀黍中之除草活性 (以%表示)	
			4-葉子階段	6-葉子階段
除草劑 / 安全劑	kg	AS/ha		
H ₂ +No. 17	0.200	0.200	20	10
	0.100	0.100	10	0
	0.050	0.050	0	0
	0.025	0.025	0	0
H ₂ +No. 6	0.200	0.200	27	30
	0.100	0.100	7	20
	0.050	0.050	0	10
	0.025	0.025	0	0
H ₂ +No. 7	0.200	0.200	20	33
	0.100	0.100	0	20
	0.050	0.050	0	0
	0.025	0.025	0	0
H ₂ +No. 4	0.200	0.200	20	0
	0.100	0.100	0	0
	0.050	0.050	0	0
	0.025	0.025	0	0

H₂ = 3 - (4 , 6 - 二甲氧基嘧啶 - 2 - 基) - 1 -
 (3 - N - 甲基磺醯基 - N - 甲基胺基吡啶 - 2
 - 基) 磺醯基尿素

(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 6：本發明化合物在玉蜀黍植物之功效

物質	用量比例		在玉蜀黍中之除草活性 (以%表示)	
			4-葉子階段	6-葉子階段
除草劑 / 安全劑	kg AS/ha			
H ₃	0.200		90	88
	0.100		80	80
	0.050		75	80
	0.025		60	65
H ₃ +No.3	0.200	0.200	5	10
	0.100	0.100	0	0
	0.050	0.050	0	0
	0.025	0.025	0	0
H ₃ +No.4	0.200	0.200	10	15
	0.100	0.100	0	10
	0.050	0.050	0	0
	0.025	0.025	0	0
H ₃ +No.7	0.200	0.200	20	25
	0.100	0.100	0	10
	0.050	0.050	0	0
	0.025	0.025	0	0

H₃ = 3 - (4 - 甲氧基 - 6 - 甲基 - 1, 3, 5 - 三
 嗪 - 2 - 基) - 1 - (2 - 甲氧基羰基) - 5 -
 磺苯基磺醯基) 尿素

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

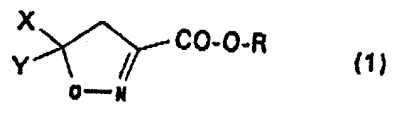
訂

線

實驗報告

下表 A 所列化合物 A 1 至 A 21 及 V 1 至 V 21 在一些農作物之保護特性依序加以分述 (本案: 中華民國專利申請案 83108165)。

表 A: 化學式 (I) 之測試化合物



安全劑	R	X	Y	參考
A1	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	本案實施例 1
A2	n-C ₃ H ₇	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	本案實施例 3
A3	Na	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	本案實施例 6
A4	CH ₂ CH=CH ₂	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	本案實施例 1 7
A5	n-C ₄ H ₉	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	本案實施例 4
A6	C ₂ H ₅	4-F-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	本案實施例 3 7
A7	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	本案實施例 3 4
A8	2-C ₄ H ₉	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	本案實施例 1 2
A9	i-C ₄ H ₉	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	本案實施例 1 1
A10	n-C ₈ H ₁₇	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	本案實施例 1 4
A11	n-C ₃ H ₇	4-Cl-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	本案實施例 5 6
A12	CH ₂ CH ₂ OH	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	本案實施例 1 3 9
A14	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	本案實施例 1 3 3
A15	2-C ₄ H ₉	4-F-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅	本案實施例 1 3 0
A16	CH ₂ C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	本案實施例 2 9
A17	CH ₂ COOC ₂ H ₅	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	本案實施例 1 2 6
A18	C ₂ H ₅	2,4-F ₂ -C ₆ H ₃	C ₆ H ₅	本案實施例 1 4 7
A19	C ₂ H ₅	4-F-C ₆ H ₄	2-CH ₃ -C ₆ H ₅	本案實施例 1 4 8
A20	C ₂ H ₅	3,4-F ₂ -C ₆ H ₃	C ₆ H ₅	本案申請專利範圍所涵蓋者
A21	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅	c-C ₃ H ₅	本案申請專利範圍所涵蓋者
V1	C ₂ H ₅	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	實施例 4 1, CA-A-2065983
V2	CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	實施例 4 0, CA-A-2065983
V3	C ₂ H ₅	4-CH ₃ -C ₆ H ₅	H	實施例 151, CA-A-2065983
V4	H	4-Cl-C ₆ H ₅	H	實施例 2 7, CA-A-2065983
V5	H	4-F-C ₆ H ₅	H	CA-A-2065983 所申請者
V6	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₅	H	實施例 1 5 1, CA-A-2065983
V7	CH ₃	2,4-F ₂ -C ₆ H ₃	H	實施例 1 2 4, CA-A-2065983
V8	CH ₃	C ₆ H ₅	H	實施例 2, CA-A-2065983
V9	C ₂ H ₅	2,4-F ₂ -C ₆ H ₃	H	實施例 1 2 5, CA-A-2065983
V10	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	實施例 2 8, CA-A-2065983
V11	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H	實施例 2 9, CA-A-2065983

(續表 A)

安全劑	R	X	Y	參考
V12	2-C ₇ H ₁₅	C ₆ H ₅	H	FCA-A-2065983所申請者
V13	n-C ₄ H ₉	C ₆ H ₅	H	實施例 6, CA-A-2065983
V14	H	C ₆ H ₅ CH ₂	H	實施例 3, WO 91/08202
V15	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂	H	實施例 4 7, WO 91/08202
V16	C ₂ H ₅	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂	H	實施例 2 4, WO 91/08202
V17	H	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂	H	實施例 4 9, WO 91/08202
V18	C ₂ H ₅	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂	H	實施例 7 0, WO 91/08202
V19	C ₂ H ₅	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂	H	實施例 9 3, WO 91/08202
V20	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂	H	實施例 2, WO 91/08202
V21	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅ CH ₂	H	實施例 1, WO 91/08202

註：

化合物 V 1 至 V 1 3 係被加拿大專利公告號 CA - A - 2 0 6 5 9 8 3 所包含
 化合物 V 1 4 至 V 2 1 係被 WO 9 1 / 0 8 2 0 2 所包含

測試情況及結果

1. 玉蜀黍 (= Zea mays = ZEAMA) 之安全劑測試

玉蜀黍種植於溫室內含有壟母質砂土之塑膠瓶內，直到達到 4 - 葉階段，然後將除草劑 H 施用於一些玉蜀黍上，並將含有除草劑 H 及一量些表 A 中某一化合物的桶混合物施用於另一些玉蜀黍上，但用量比例不同 (見下表 1)，除草劑及桶混合物灑於生長中之玉蜀黍係使用水條不量 3 0 0 l / h a。處理完後，將塑膠瓶置於溫室並維持良好生長條度。處理完後 4 週，評估處理過玉蜀黍與未處理過者比較下之毒害程度。玉蜀黍之損害率以 0 - 1 0 0 % 表示，即 0 % 代表玉蜀黍未受損害，而 1 0 0 % 代表玉蜀黍被全部殺害。結果摘述於下表 1。

表 1：表 A 化合物在作為玉蜀黍安全劑上之效果

化合物	用量	除草劑損害作用 (以%表示)
除草劑 / 安全劑	kg a.i./ha	ZEAMA
H	0,200	77
	0,100	70
	0,050	63
	0,025	33
H + A1	0,200 + 0,200	5
	0,100 + 0,100	0
	0,050 + 0,050	0
	0,025 + 0,025	0
H + A2	0,200 + 0,200	40
	0,100 + 0,100	20
	0,050 + 0,050	0
	0,025 + 0,025	0
H + A3	0,200 + 0,200	27
	0,100 + 0,100	7
	0,050 + 0,050	0
	0,025 + 0,025	0
H + A4	0,200 + 0,200	20
	0,100 + 0,100	0
	0,050 + 0,050	0
	0,025 + 0,025	0
H + A5	0,200 + 0,200	20
	0,100 + 0,100	0
	0,050 + 0,050	0
	0,025 + 0,025	0
H + A6	0,200 + 0,200	5
	0,100 + 0,100	0
	0,050 + 0,050	0
	0,025 + 0,025	0
H + A7	0,200 + 0,200	15
	0,100 + 0,100	0
	0,050 + 0,050	0
	0,025 + 0,025	0
H + A8	0,200 + 0,200	20
	0,100 + 0,100	5
	0,050 + 0,050	0
	0,025 + 0,025	0

化合物	用量		除草劑損害作用 (以%表示)
除草劑 / 安全劑	kg a.i./ha		ZEAMA
H + A9	0,200	+ 0,200	10
	0,100	+ 0,100	5
	0,050	+ 0,050	0
	0,025	+ 0,025	0
H + A10	0,200	+ 0,200	25
	0,100	+ 0,100	10
	0,050	+ 0,050	0
	0,025	+ 0,025	0
H + A11	0,200	+ 0,200	25
	0,100	+ 0,100	15
	0,050	+ 0,050	0
	0,025	+ 0,025	0
H + A12	0,200	+ 0,200	30
	0,100	+ 0,100	10
	0,050	+ 0,050	0
	0,025	+ 0,025	0
H + A13	0,200	+ 0,200	15
	0,100	+ 0,100	5
	0,050	+ 0,050	0
	0,025	+ 0,025	0
H + A14	0,200	+ 0,200	30
	0,100	+ 0,100	15
	0,050	+ 0,050	0
	0,025	+ 0,025	0
H + A15	0,200	+ 0,200	10
	0,100	+ 0,100	5
	0,050	+ 0,050	0
	0,025	+ 0,025	0
H + A16	0,200	+ 0,200	40
	0,100	+ 0,100	15
	0,050	+ 0,050	0
	0,025	+ 0,025	0
H + A17	0,200	+ 0,200	30
	0,100	+ 0,100	10
	0,050	+ 0,050	0
	0,025	+ 0,025	0

化合物	用量	除草劑損害作用 (以%表示)
除草劑 / 安全劑	kg a.i./ha	ZEAMA
H + V1	0,200 + 0,200	80
	0,100 + 0,100	70
	0,050 + 0,050	60
	0,025 + 0,025	35
H + V2	0,200 + 0,200	85
	0,100 + 0,100	75
	0,050 + 0,050	60
	0,025 + 0,025	40
H + V3	0,200 + 0,200	80
	0,100 + 0,100	75
	0,050 + 0,050	60
	0,025 + 0,025	30
H + V4	0,200 + 0,200	75
	0,100 + 0,100	70
	0,050 + 0,050	60
	0,025 + 0,025	35
H + V5	0,200 + 0,200	80
	0,100 + 0,100	70
	0,050 + 0,050	63
	0,025 + 0,025	30

表 1 縮寫意義見下表 2

2 玉蜀黍 (= Zea mays = ZEAMA) 安全劑測試的第二種情況

玉蜀黍種植於溫室內含有壩母質砂土之塑膠瓶內，直到達到 3-葉階段，然後將除草劑 H 施用於一些壩母質砂土之塑膠瓶上，並含有除草劑 H 及玉蜀黍。處理完後 4 週，評估處理過玉蜀黍之損害率以 0-100% 表示，而 100% 代表玉蜀黍被全部殺害。結果摘述於下表 2。

表 2：表 A 化合物在作為玉蜀黍安全劑上之效果

除草劑 / 安全劑	用量 (kg a.i./ha)	對玉蜀黍 (ZEAMA) 之損害
H	0,1	80
H + A1	0,1 + 1,25	15
H + A2	0,1 + 1,25	10
H + A6	0,1 + 1,25	15
H + A18	0,1 + 1,25	20
H + A19	0,1 + 1,25	5
H + A20	0,1 + 1,25	20
H + A21	0,1 + 1,25	20
H + V6	0,1 + 1,25	70
H + V7	0,1 + 1,25	65
H + V8	0,1 + 1,25	50
H + V19	0,1 + 1,25	60
H + V20	0,1 + 1,25	60
H + V21	0,1 + 1,25	60

表 1 及 2 中縮寫：

H	=	3-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-1-[3-(N-甲磺醯基-N-甲胺基)-吡啶-2-基-磺醯基]尿素
安全劑	=	見表 A
a. i.	=	活性成分

2 水稻 (=Oryza sativa= ORYSA) 之安全劑測試

將水稻種植於含有礫母質砂土之塑膠瓶內，並加水至水表面高於砂土 2 公分，將塑膠瓶置於溫室內並維持良好生長條件至水稻達到 3-葉階段，然後將除草劑 H' 施用於一些水稻上，並將含有除草劑 H' 及一些表 A 中某一化合物的桶混合物施用於另一些水稻上，但用量比例不同（見下表 3），除草劑及桶混合物灑於生長中之水稻係使用水量 300 l / ha。處理完後，將塑膠瓶置於溫室並維持良好生長條件，處理完後 4 週，評估處理過水稻與未處理過者比較下之毒害程度。水稻之損害率以 0 - 100 % 表示，即 0 % 代表水稻未受損害，而 100 % 代表水稻被全部殺害。結果摘述於下表 3。

表 3：施用於水稻上之安全劑效果

除草劑／安全劑	用量 (kg a.i./ha)	水稻(ORYSA)上之損害
H'	0,3	80
H' + A1	0,3 + 1,25	10
H' + A2	0,3 + 1,25	20
H' + A6	0,3 + 1,25	15
H' + A18	0,3 + 1,25	0
H' + A19	0,3 + 1,25	30
H' + A20	0,3 + 1,25	30
H' + A21	0,3 + 1,25	0
H' + V1	0,3 + 1,25	80
H' + V2	0,3 + 1,25	75
H' + V3	0,3 + 1,25	80
H' + V4	0,3 + 1,25	85
H' + V5	0,3 + 1,25	80
H' + V6	0,3 + 1,25	85
H' + V7	0,3 + 1,25	80
H' + V8	0,3 + 1,25	70
H' + V9	0,3 + 1,25	85
H' + V10	0,3 + 1,25	75
H' + V11	0,3 + 1,25	80
H' + V12	0,3 + 1,25	70
H' + V13	0,3 + 1,25	75
H' + V14	0,3 + 1,25	80
H' + V15	0,3 + 1,25	65
H' + V16	0,3 + 1,25	80
H' + V17	0,3 + 1,25	75
H' + V18	0,3 + 1,25	70
H' + V19	0,3 + 1,25	85
H' + V20	0,3 + 1,25	85
H' + V21	0,3 + 1,25	80

表 3 之縮寫：

H' = Fenoxaprop-乙基(俗名)
 安全劑 = 見表 A
 a. i. = 活性成分

85.10.19 修正
年 月 日 補充

附件 1 (a) : 第 83108165 號專利申請案

中文補充實驗數據

民國 85 年 10 月 呈

實施例中，油之化合物之折射率數據如下：

實施例	折射率 _{n_D²⁵}
4	1.5639
5	1.5690
9	1.5542
11	1.5781
12	1.5894
13	1.5725
14	1.5730
15	1.5790
16	1.5635
29	1.5826
30	1.5853

實施例	折射率 n_D^{25}
33	1.5717
34	1.5682
37	1.5592
38	1.5737
42	1.5650
43	1.5715
45	1.5756
46	1.5828
47	1.5535
55	1.5688
56	1.5675
57	1.5552
58	1.5710
59	1.5675
60	1.5730
61	1.5690
62	1.5635
69	1.5642
72	1.5610
81	1.5565
82	1.5620
83	1.5655
91	1.5825
92	1.5730
93	1.5695
94	1.5800
95	1.5725
120	1.5640
123	1.5815
125	1.5645
126	1.5738
127	1.5883
128	1.5710
129	1.5685
130	1.5480
131	1.5500
132	1.5635
133	1.5700
134	1.5590
135	1.5614
141	1.5480
142	1.5538
144	1.5582

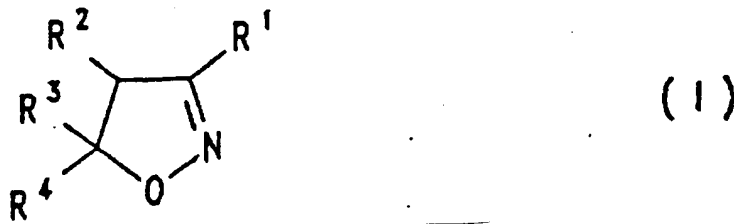
327596

實施例	折射率 n_D^{25}
147	1.5662
149	1.5540
150	1.5488

四、中文發明摘要 (發明之名稱：

經取代之異噁唑類化合物，彼之製備方法，含彼之組成物，以及彼充作安全劑上之用途

化學式 (I) 之化合物是適合作為農作物植物之農藥 (宜為除草劑) 之安全劑，



其中

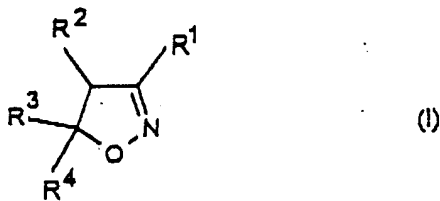
R¹ 是 COOR、CONH₂、CONHCH₃、CON(CH₃)₂ 或 CONH-(4-氯苯基) 之羧基 (衍生物)，

R 是氫、陽離子、C₁-C₈-烷基、C₃-C₈-環烷基、C₂-C₈-烯基、C₂-C₈炔基、苯基，而後五基團係未經取代或經選自鹵素、羥基、C₁-C₄-烷基

英文發明摘要 (發明之名稱：

Substituted isoxazolines, process for their preparation, compositions containing them, and their use as safeners.

Compounds of the formula (I)



in which

R¹ is a carboxyl (derivative) group of the formula -CO-OR, CONH₂, CONHCH₃, CON(CH₃)₂ or CONH-(4-chlorophenyl),

R is hydrogen, a cation, C₁-C₈-alkyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, phenyl, each of the last-mentioned 5 radicals being unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, hydroxyl, C₁-C₄-alkyl, the latter only in the case of cyclic radicals, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio and (C₁-C₄-alkoxy)-carbonyl, or is benzyl which is unsubstituted or substituted by one or more halogen atoms, or is tetrahydrofuryl,

R² is hydrogen, C₁-C₄-alkyl or C₂-C₄-alkenyl.

(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:)

(此只在環狀基的情況下)、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基及(C_1-C_4 -烷氧基)-羰基中之一或多個基團取代之，或者為苄基(其係未經取代或經一或多個鹵素取代之)，或者為四氫糖基，

R^2 是氫、 C_1-C_4 -烷基或 C_2-C_4 -烯基，

R^3 是 C_3-C_8 -環烷基或者苯基(其係未經取代或經選自鹵素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -鹵烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_8 -環烷基、單-及二-(C_1-C_4 -烷基)-胺基及(C_1-C_4 -烷氧基)-羰基中之一或多個基團取代之)，

R^4 是未經取代或經選自鹵素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -鹵烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_8 -環烷基、單及二-(C_1-C_4 -烷基)-胺基及(C_1-C_4 -烷氧基)-羰基中之一或多個基團取代之苯基，或者是吡啶基或噻吩基，

該化合物可以用申請專利範圍第4項之方法，從烯類(II)和腈氧化物(III)來加以製備。

英文發明摘要(發明之名稱:)

R^3 is C_3-C_8 -cycloalkyl, or is phenyl which is unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -haloalkyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_3-C_8 -cycloalkyl, mono- and di-(C_1-C_4 -alkyl)-amino and (C_1-C_4 -alkoxy)-carbonyl,

R^4 is phenyl which is unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -haloalkyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_3-C_8 -cycloalkyl, mono- and di-(C_1-C_4 -alkyl)-amino and (C_1-C_4 -alkoxy)-carbonyl, or is pyridyl or thienyl,

are suitable as safeners for pesticides, preferably herbicides, in crop plants. The compounds can be prepared from alkenes (II) and nitrile oxides (III) by the process of claim 4.

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

紙

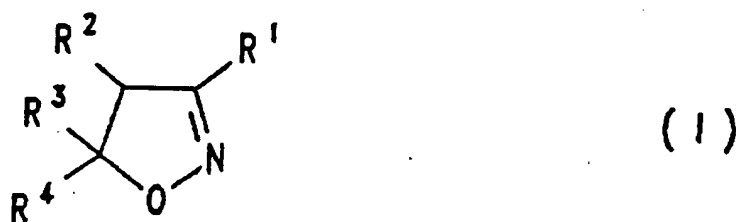
六、申請專利範圍

附件 1 : 第 83108165 號 專利 申請 案

中文 申請 專利 範圍 修正 本

民國 86 年 5 月 修正

1. 一種化學式 (I) 之化合物



其中

R^1 是 $COOR$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHCH_3$ 、
 $CON(CH_3)_2$ 或 $CONH-(4-氯苯基)$ 之羧
 基 (衍生物)，

R 是 氫、陽離子、 C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_8 -環烷基
 、 C_2-C_8 -烯基、 C_2-C_8 炔基、苯基，而後五基
 團係未經取代或經選自鹵素、羥基、 C_1-C_4 -烷基
 (此只在環狀基的情況下)、 C_1-C_4 -烷氧基、
 C_1-C_4 -烷硫基及 (C_1-C_4 -烷氧基) - 羰基中
 之一或多個基團取代之，或者為苄基 (其係未經取代
 或經一或多個鹵素取代之)，或者為四氫糖基，

R^2 是 氫、 C_1-C_4 -烷基或 C_2-C_4 -烯基，

R^3 是 C_3-C_8 -環烷基或者苯基 (其係未經取代或經選
 自鹵素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -鹵烷基、 C_1

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

六、申請專利範圍

— C₄— 烷氧基、C₃— C₈— 環烷基、單— 及二— (C₁— C₄— 烷基) — 胺基及 (C₁— C₄— 烷氧基) — 羰基中之一或多個基團取代之)，

R⁴ 是未經取代或經選自鹵素、C₁— C₄— 烷基、C₁— C₄— 鹵烷基、C₁— C₄— 烷氧基、C₃— C₈— 環烷基、單及二— (C₁— C₄— 烷基) — 胺基及 (C₁— C₄— 烷氧基) — 羰基中之一或多個基團取代之苯基，或者是吡啶基或噻吩基。

2. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中

R¹ 是 C O O R 之羧基（衍生物），

R 氫、陽離子、C₁— C₄— 烷基、C₂— C₄— 烯基、C₂— C₄— 炔基、C₁— C₄— 鹵烷基、羥基— C₁— C₄— 烷基、C₁— C₄— 烷氧基— C₁— C₄— 烷基、C₁— C₄— 烷硫基— C₁— C₄— 烷基或苯基（其係未經取代或經選自鹵素、羥基、C₁— C₄— 烷基、C₁— C₄— 烷氧基、C₁— C₄— 烷硫基及 (C₁— C₄— 烷氧基) — 羰基中之一或多個基團取代之)，或者是苄基或四氫糖基，

R² 是氫，

R³ 是未經取代或經選自鹵素、C₁— C₄— 烷基、C₁— C₄— 鹵烷基、C₁— C₄— 烷氧基、二— (C₁— C₄— 烷基) — 胺基及 (C₁— C₄— 烷氧基) — 羰基中之一或多個基團取代之苯基，

R⁴ 是未經取代或經選自鹵素、C₁— C₄— 烷基、C₁—

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

六、申請專利範圍

C₄-鹵烷基及 C₁-C₄-烷氧基中之一或多個基團取代之苯基。

3. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中

R¹ 是 C O O R 所示之基團，

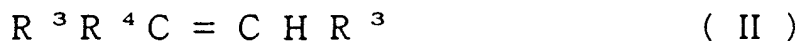
R 是氫、離陽子、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-鹵烷基、羥基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基，或者未經取代或經鹵素取代之苯基，或者是苄基，

R² 是氫，

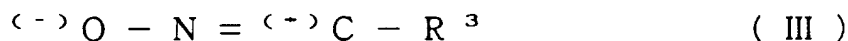
R³ 是未經取代或經選自鹵素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基及 (C₁-C₄-烷氧基)-羰基中之一或多個基團取代之苯基，

R⁴ 是未經取代或經選自鹵素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-鹵烷基及 C₁-C₄-烷氧基中之一或多個基團取代之苯基。

4. 製備如申請專利範圍第 1 項之化學式 (I) 之化合物之方法，其包含化學式 (II) 之化合物



與化學式 (III) 之腈氧化物反應



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

六、申請專利範圍

其中，在化學式（Ⅲ）中之 R^2 ， R^3 和 R^4 之定義和化學式（Ⅰ）之化合物中的定義一樣，而化學式（Ⅲ）中之 R^1 和化學式（Ⅰ）中之定義一樣。

5. 一種農作物保護產品，其包含作為安全劑之如申請專利範圍第1項之化學式（Ⅰ）之化合物，以及慣常用於農作物保護上之組成物輔助劑。

6. 一種農作物保護產品，其包含至少一種農藥以及作為安全劑之至少一種如申請專利範圍第1項之化學式（Ⅰ）之化合物。

7. 一種保護農作物植物以對抗農作物保護產品（農藥）中活性物質毒害副作用的方法，其包含使用有效量之至少一種如申請專利範圍第1項之化學式（Ⅰ）之化合物於植物上、植物的種子上或所耕種的土地上，且是在使用農藥前、後或與農藥同時使用。

8. 如申請專利範圍第1項之化學式（Ⅰ）之化合物，其是作為安全劑，以保護農作物植物對抗農作物保護產品（農藥）中活性物質的毒害副作用。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線