

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2004-107228

(P2004-107228A)

(43) 公開日 平成16年4月8日(2004.4.8)

(51) Int.Cl.<sup>7</sup>

C07D 487/04

A01N 43/90

F I

C O 7 D 487/04 1 4 4

C O 7 D 487/04 1 4 6

C O 7 D 487/04 1 4 7

A O 1 N 43/90 1 0 4

A O 1 N 43/90 1 0 5

テーマコード (参考)

4 C O 5 O

4 H O 1 1

審査請求 未請求 請求項の数 7 O L (全 42 頁)

(21) 出願番号 特願2002-269522 (P2002-269522)

(22) 出願日 平成14年9月17日 (2002.9.17)

(71) 出願人 000232623

日本農薬株式会社

東京都中央区日本橋1丁目2番5号

(72) 発明者 岸田 雅司

神奈川県横浜市青葉区鴨志田町1000番

地 三菱化学株式会社内

(72) 発明者 夏目 文嗣

神奈川県横浜市青葉区鴨志田町1000番

地 三菱化学株式会社内

(72) 発明者 川口 真二

神奈川県横浜市青葉区鴨志田町1000番

地 三菱化学株式会社内

Fターム(参考) 4C050 AA01 BB05 BB06 BB07 CC08

EE03 EE04 FF02 GG02 GG03

HH01

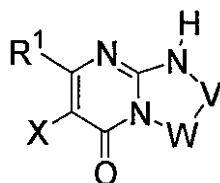
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 双環性ピリミジノン誘導体及びこれを有効成分とする除草剤

(57) 【要約】

【課題】 除草活性が高く、広い殺草スペクトルを有し、かつ、作物に対して安全性の高い除草剤を提供する。

【解決手段】 下記一般式 (I)



(式中、Xは水素原子又はハロゲン原子を、 $R^1$ はハロアルキル基を、 $-V-W-$ は $-(CR^2)=N-$ 、 $-N=(CR^2)-$ 、 $-(C=O)-(CR^2)=N-$ 、又は、 $-(CR^3)=(CR^2)-$ (式中、 $R^2$ は、1)水素原子、アルキル基等を、 $R^3$ はハロゲン原子を示す。)をそれぞれ示す。)

で表される双環性ピリミジノン誘導体及び／又はその互変異性体を有効成分とする除草剤。

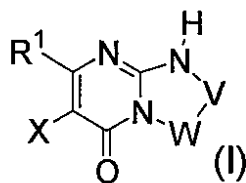
【選択図】 なし

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

下記一般式 (I)

## 【化 1】



10

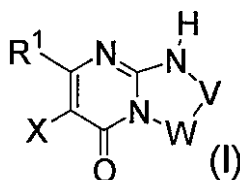
(式中、Xは水素原子又はハロゲン原子を示し、R<sup>1</sup>は、ハロアルキル基を示し、-V-W-は、1) -(CR<sup>2</sup>)=N-、2) -N=(CR<sup>2</sup>)-、3) -(C=O)-(CR<sup>2</sup>)=N-、又は、4) -(CR<sup>3</sup>)=(CR<sup>2</sup>)- (式中、R<sup>2</sup>は、1) 水素原子、2) 任意に置換されていても良い、アルキル基、アルケニル基、又は、アルキニル基、3) カルボキシ基、4) アルコキシカルボニル基、又は、5) フェニル基を示し、R<sup>3</sup>は、ハロゲン原子を示す。) のいずれかを示す。)

で表される双環性ピリミジノン誘導体及び／又はその互変異性体を有効成分とする除草剤。

## 【請求項 2】

下記一般式 (I)

## 【化 2】



20

(式中、Xは水素原子又はハロゲン原子を示し、R<sup>1</sup>は、ハロアルキル基を示し、-V-W-は、1) -(CR<sup>2</sup>)=N-、2) -N=(CR<sup>2</sup>)-、3) -(C=O)-(CR<sup>2</sup>)=N-、又は、4) -(CR<sup>3</sup>)=(CR<sup>2</sup>)- (式中、R<sup>2</sup>は、1) 水素原子、2) 任意に置換されていても良い、アルキル基、アルケニル基、又は、アルキニル基、3) カルボキシ基、4) アルコキシカルボニル基、又は、5) フェニル基を示し、R<sup>3</sup>は、ハロゲン原子を示す。ただし、-V-W-が、-(CR<sup>2</sup>)=N-であり、かつR<sup>2</sup>は、1) 水素原子、2) C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>のアルキル基、又は、3) C<sub>2</sub>のアルコキシカルボニル基である化合物、及び-V-W-が、-N=(CR<sup>2</sup>)-であり、かつR<sup>2</sup>は、1) 水素原子である化合物を除く。) で表される双環性ピリミジノン誘導体、及びその互変異性体。

30

## 【請求項 3】

一般式 (I) において、R<sup>1</sup>がトリフルオロメチル基であることを特徴とする請求項 2 記載の双環性ピリミジノン誘導体、及びその互変異性体。

40

## 【請求項 4】

一般式 (I) において、-V-W-が-(CR<sup>2</sup>)=N- (式中、R<sup>2</sup>は、1) 任意に置換されていても良いアルキル基、2) カルボキシ基、3) アルコキシカルボニル基、又は、4) フェニル基を示す。) であることを特徴とする請求項 2 又は 3 記載の双環性ピリミジノン誘導体、及びその互変異性体。

## 【請求項 5】

一般式 (I) において、-V-W-が-N=(CR<sup>2</sup>)- (式中、R<sup>2</sup>は任意に置換されていても良いアルキル基を示す。) であることを特徴とする請求項 2 又は 3 記載の双環

50

性ピリミジノン誘導体、及びその互変異性体。

【請求項 6】

一般式 (I) において、 $-V-W-$  が  $-(C=O)-(CR^2)=N-$  (式中、 $R^2$  は、1) 任意に置換されていても良いアルキル基、又は、2) アルコキシカルボニル基を示す。) であることを特徴とする請求項 2 又は 3 記載の双環性ピリミジノン誘導体、及びその互変異性体。

【請求項 7】

一般式 (I) において、 $-V-W-$  が  $-(CR^3)=(CR^2)-$  (式中、 $R^2$  は、1) 任意に置換されていても良いアルキル基、又は、2) フェニル基を示す。) であることを特徴とする請求項 2 又は 3 記載の双環性ピリミジノン誘導体、及びその互変異性体。 10

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は、双環性ピリミジノン誘導体を有効成分とする除草剤及び新規な双環性ピリミジノン誘導体、並びに、該誘導体の製造に有用な中間体に関する。

【0002】

【従来の技術】

従来より、重要な作物、例えばムギ、トウモロコシ、ダイズ、イネ等の栽培において、多くの除草剤が使用されている。望まれる除草剤の条件としては、低薬量で高い除草効果を有すること、広い殺草スペクトルを有すること、適度な残効性を有すること、及び作物に対して十分な安全性を有すること等が挙げられるが、既存の除草剤のうちの多くはこれらの条件を十分に満たしているとは言えないのが現状である。従来より、このような除草剤に関する諸問題を解決すべく様々な検討がなされてきている。 20

【0003】

また、双環性ピリミジノン骨格のうち、イミダゾピリミジンジオン骨格を有する化合物に除草活性があるとの報告がある (例えば特許文献 1 参照。 )。

一方、イミダゾピリミジン以外の双環性ピリミジノン骨格を有する化合物としては、例えばトリアゾロピリミジノン骨格を有する化合物の製造法や分析値が知られている (例えば非特許文献 1、2 及び 3 参照。 )。

【0004】

しかし、その生物活性の有無については全く知られていなかった。 30

【0005】

【特許文献 1】

特開 2000-264888 号公報

【非特許文献 1】

Journal of Heterocyclic Chemistry, vol. 21, p. 1537~1541 (1984)

【非特許文献 2】

Journal of Heterocyclic Chemistry, vol. 22, p. 1317~1322 (1985) 40

【非特許文献 3】

Journal of Chemical Research Synopses, p 392~393 (1997)

【0006】

【発明が解決しようとする課題】

本発明は、除草活性が高く、広い殺草スペクトルを有し、かつ、作物に対して安全性の高い除草剤を提供することを目的とする。

【0007】

【課題を解決するための手段】

本発明者らは、上記のごとき除草剤の課題を解決すべく双環性ピリミジノン誘導体の合成 50

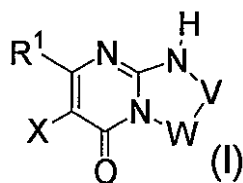
とその除草活性について鋭意検討を重ねた結果、下記一般式 (I) における  $R^1$  にハロアルキル基を持つ双環性ピリミジノン誘導体、特に  $R^1$  にトリフルオロメチル基を持つ双環性ピリミジノン誘導体が高い除草効果を有し、しかもいくつかの重要作物に対して十分な安全性を示すことを見出し、本発明を完成させるに至った。

【0008】

すなわち本発明の要旨は、下記一般式 (I)

【0009】

【化3】



10

【0010】

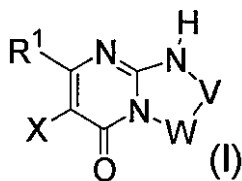
(式中、Xは水素原子又はハロゲン原子を示し、 $R^1$ は、ハロアルキル基を示し、 $-V-W-$ は、1)  $-(CR^2)=N-$ 、2)  $-N=(CR^2)-$ 、3)  $-(C=O)-(CR^2)=N-$ 、又は、4)  $-(CR^3)=(CR^2)-$  (式中、 $R^2$ は、1) 水素原子、2) 任意に置換されていても良い、アルキル基、アルケニル基、又は、アルキニル基、3) カルボキシル基、4) アルコキシカルボニル基、又は、5) フェニル基を示し、 $R^3$ は、ハロゲン原子を示す。)

20

のいずれかを示す。)

で表される双環性ピリミジノン誘導体及び／又はその互変異性体を有効成分とする除草剤、及び下記一般式 (I)

【化4】



30

(式中、Xは水素原子又はハロゲン原子を示し、 $R^1$ は、ハロアルキル基を示し、 $-V-W-$ は、1)  $-(CR^2)=N-$ 、2)  $-N=(CR^2)-$ 、3)  $-(C=O)-(CR^2)=N-$ 、又は、4)  $-(CR^3)=(CR^2)-$  (式中、 $R^2$ は、1) 水素原子、2) 任意に置換されていても良い、アルキル基、アルケニル基、又は、アルキニル基、3) カルボキシル基、4) アルコキシカルボニル基、又は、5) フェニル基を示し、 $R^3$ は、ハロゲン原子を示す。ただし、 $-V-W-$ が、 $-(CR^2)=N-$ であり、かつ  $R^2$ は、1) 水素原子、2)  $C_1 \sim C_2$  のアルキル基、又は、3)  $C_2$  のアルコキシカルボニル基である化合物、及び  $-V-W-$ が、 $-N=(CR^2)-$ であり、かつ  $R^2$ は、1) 水素原子である化合物を除く。) で表される双環性ピリミジノン誘導体、及びその互変異性体、並びに該誘導体の製造に有用な中間体に存する。

40

【0011】

【発明の実施の形態】

以下、本発明を詳細に説明する。

1. 双環性ピリミジノン誘導体

本発明に係わる双環性ピリミジノン誘導体、及びその互変異性体は、前記一般式 (I) で表され、通常、分子量が1,000以下、好ましくは、750以下のものである。

50

一般式 (I) において、

Xは、水素原子；あるいはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等のハロゲン原子であり、特に好ましくは水素原子である。

【0012】

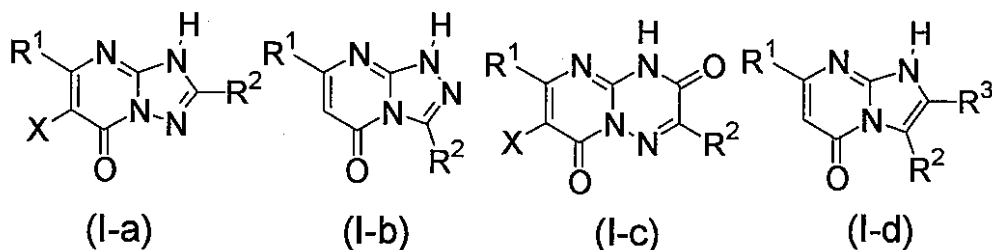
R<sup>1</sup> は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等のハロゲン原子で任意に置換されている、直鎖、分岐もしくは環状のアルキル基である。

上記 R<sup>1</sup> として好ましくは、炭素数3以下の低級ハロアルキル基が好ましく、特にトリフルオロメチル基が好ましい。

—V—W—は、分子全体として下記一般式 (I-a) ~ (I-d) で表されるような、

【0013】

【化5】



10

【0014】

—(C R<sup>2</sup>) = N—、—N = (C R<sup>2</sup>) —、—(C = O) — (C R<sup>2</sup>) = N—、又は、—(C R<sup>3</sup>) = (C R<sup>2</sup>) — (式中、R<sup>2</sup> は、水素原子；任意に置換されていても良い、直鎖、分岐もしくは環状のアルキル基、アルケニル基又は、アルキニル基（上記置換基としては、除草活性を有する限りにおいては特に限定されないが、具体的には、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アルコキシ基、アルコキシカルボニル基、アシルオキシ基、フェニル基等が挙げられる。）；カルボキシ基；アルコキシカルボニル基；あるいはフェニル基を示し、このうち好ましくは炭素数8以下のハロゲン原子で置換されていても良い低級アルキル基であり、特に好ましくは炭素数5以下のハロゲン原子で置換されていても良い低級アルキル基である。R<sup>3</sup> は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等のハロゲン原子を示す。) で表される基であり、このうち好ましくは—(C R<sup>2</sup>) = N— (ここで R<sup>2</sup> は、1) 任意に置換されていても良いアルキル基、2) カルボキシ基、3) アルコキシカルボニル基、又は、4) フェニル基である。)、—N = (C R<sup>2</sup>) — (ここで、R<sup>2</sup> は任意に置換されていても良いアルキル基である。)、—(C = O) — (C R<sup>2</sup>) = N— (ここで、R<sup>2</sup> は、1) 任意に置換されていても良いアルキル基、又は、2) アルコキシカルボニル基である。) 又は、—(C R<sup>3</sup>) = (C R<sup>2</sup>) — (ここで、R<sup>2</sup> は、1) 任意に置換されていても良いアルキル基、又は、2) フェニル基であり、R<sup>3</sup> はハロゲン原子である。) であり、より好ましくは—(C R<sup>2</sup>) = N—である。

20

30

上記置換基のうち、R<sup>2</sup> がフェニル基を含有する場合、そのフェニル基は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等のハロゲン原子；任意に置換されていても良いアルキル基（上記置換基としては、除草活性を有する限りにおいては特に限定されないが、具体的にはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等ハロゲン原子が挙げられる。）；O—R<sup>4</sup> (R<sup>4</sup> は、任意に置換されていても良いアルキル基（上記置換基としては、除草活性を有する限りにおいては特に限定されないが、具体的にはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等ハロゲン原子が挙げられる。）である。)；S(O)<sub>n</sub>—R<sup>6</sup> (R<sup>6</sup> は、任意に置換されていても良いアルキル基で（上記置換基としては、除草活性を有する限りにおいては特に限定されないが、具体的にはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等ハロゲン原子が挙げられる。）あり、nは0から2の整数である。)；ニトロ基；シアノ基；またはアルコキシカルボニル基から選ばれる同一のまたは異なる置換基で1-3置換されていてもよい。

40

【0015】

50

上記置換基の説明中に記載の、直鎖、分岐若しくは環状のアルキル基の具体例としては、例えば以下に示す置換基が挙げられる。

メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基、1-メチルブチル基、2-メチルブチル基、1-エチルプロピル基、1, 2-ジメチルプロピル基、1, 3-ジメチルプロピル基、ヘキシル基、イソヘキシル基、1-メチルペンチル基、2-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、1, 1-ジメチルブチル基、1, 2-ジメチルブチル基、1, 3-ジメチルブチル基、3, 3-ジメチルブチル基、1-エチルブチル基、2-エチルブチル基、1, 1, 2-トリメチルプロピル基、1-エチル-1-メチルプロピル基、1-エチル-2-メチルプロピル基；シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基；1-メチルシクロプロピル基、2-メチルシクロプロピル基、1, 2-ジメチルシクロプロピル基、1-エチルシクロプロピル基、2-エチルシクロプロピル基、1, 2, 3-トリメチルシクロプロピル基、2, 2, 3-トリメチルシクロプロピル基、1, 2, 2, 3-テトラメチルシクロプロピル基、1-メチルシクロブチル基、2-メチルシクロブチル基、3-メチルシクロブチル基、1, 2-ジメチルシクロブチル基、1, 3-ジメチルシクロブチル基、2, 3-ジメチルシクロブチル基、2, 2-ジメチルシクロブチル基、1-エチルシクロブチル基、2-エチルシクロブチル基、3-エチルシクロブチル基、1-メチルシクロペンチル基、2-メチルシクロペンチル基、3-メチルシクロペンチル基、1, 2-ジメチルシクロペンチル基、1, 3-ジメチルシクロペンチル基、1-エチルシクロペンチル基、1-メチルシクロヘキシル基、2-メチルシクロヘキシル基、3-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、1, 2-ジメチルシクロヘキシル基、1, 3-ジメチルシクロヘキシル基、1, 4-ジメチルシクロヘキシル基、2, 2-ジメチルシクロヘキシル基、2, 3-ジメチルシクロヘキシル基、2, 4-ジメチルシクロヘキシル基、3, 3-ジメチルシクロヘキシル基、4, 4-ジメチルシクロヘキシル基、1-エチルシクロヘキシル基；(シクロプロピル)メチル基、(シクロブチル)メチル基、(シクロペンチル)メチル基、(シクロヘキシル)メチル基、(シクロヘプチル)メチル基、2-(シクロプロピル)エチル基、2-(シクロブチル)エチル基、2-(シクロペンチル)エチル基、2-(シクロヘキシル)エチル基、3-(シクロプロピル)プロピル基、3-(シクロブチル)プロピル基、3-(シクロペンチル)プロピル基。

10

20

30

#### 【0016】

上記置換基の説明中に記載の、直鎖、分岐若しくは環状のアルケニル基の具体例としては、例えば以下に示す置換基が挙げられる。

ビニル基、アリル基、1-プロペニル基、イソプロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチルアリル基、2-メチルアリル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1-メチル-2-ブテニル基、1-メチル-3-ブテニル基、2-メチル-3-ブテニル基、3-メチル-2-ブテニル基、3-メチル-3-ブテニル基、1, 1-ジメチルアリル基、1-エチルアリル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基、4-メチル-3-ペンテニル基、1-プロピルアリル基、1-エチル-1-メチルアリル基；2-シクロプロペニル基、2-シクロブテニル基、2-シクロペンテニル基、3-シクロペンテニル基、2-シクロヘキセニル基、3-シクロヘキセニル基。

40

#### 【0017】

上記置換基の説明中に記載の、直鎖、分岐若しくは環状のアルキニル基の具体例としては、例えば以下に示す置換基が挙げられる。

エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、4-ペンチニル基、1-メチル-3-ブチニル基、1, 1-ジメチル-2-プロピニル基、1-ヘキシニル基、2-ヘキシニル基、3-ヘキシニル基、4-ヘキシニル基、5-ヘキシニル基。

50

## 【0018】

上記置換基の説明中に記載の、ハロゲン原子で置換された直鎖、分岐若しくは環状のアルキル基の具体例としては、例えば以下に示す置換基が挙げられる。

フルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、1-フルオロエチル基、2-フルオロエチル基、1-クロロエチル基、2-クロロエチル基、1-ブロモエチル基、2-ブロモエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル基、2, 2, 2-トリクロロエチル基、1-フルオロプロピル基、1-クロロプロピル基、1-ブロモプロピル基、2-フルオロプロピル基、2-クロロプロピル基、2-ブロモプロピル基、3-フルオロプロピル基、3-クロロプロピル基、3-ブロモプロピル基、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピル基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロピル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル基、4-フルオロブチル基、4-クロロブチル基、4-ブロモブチル基、2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ヘプタフルオロブチル基；2, 2, 3, 3-テトラフルオロシクロブチル基、2, 2-ジフルオロシクロペンチル基、4-クロロシクロヘキシル基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4-オクタフルオロブチル基。

10

## 【0019】

上記置換基の説明中に記載の、ハロゲン原子で置換された直鎖、分岐若しくは環状のアルケニル基の具体例としては、例えば以下に示す置換基が挙げられる。2-クロロアリル基、2-ブロモアリル基、3-クロロアリル基、3-ブロモアリル基、2, 3-ジクロロアリル基、3, 3-ジクロロアリル基、2-クロロ-2-ブテニル基、3-クロロ-2-ブ

20

## 【0020】

上記置換基の説明中に記載の、ハロゲン原子で置換された直鎖、分岐若しくは環状のアルキニル基の具体例としては、例えば以下に示す置換基が挙げられる。

4-クロロ-2-ブチニル基。

上記置換基の説明中に記載の、ヒドロキシル基で置換された直鎖、分岐若しくは環状のアルキル基の具体例としては、例えば以下に示す置換基が挙げられる。ヒドロキシメチル基、1-ヒドロキシエチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシプロピル基、1-ヒドロキシブチル基、1-ヒドロキシペンチル基、1-ヒドロキシヘキシル基。

## 【0021】

上記置換基の説明中に記載の、アルコキシ基で置換された直鎖、分岐若しくは環状のアルキル基の具体例としては、例えば以下に示す置換基が挙げられる。

メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロポキシメチル基、イソプロポキシメチル基、ブトキシメチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-プロポキシエチル基、2-イソプロポキシエチル基、2-ブトキシエチル基、3-メトキシプロピル基、4-メトキシブチル基、5-メトキシペンチル基；ジメトキシメチル基、ジエトキシメチル基、ジプロポキシメチル基、ジイソプロポキシメチル基、ジブトキシメチル基、ビス（ペンチルオキシ）メチル基、ビス（ヘキシルオキシ）メチル基エチレンジオキシメチル基、トリメチレンジオキシメチル基、テトラメチレンジオキシメチル基、ペンタメチレンジオキシメチル基、ヘキサメチレンジオキシメチル基、ベンジルオキシメチル基。

30

40

## 【0022】

上記置換基の説明中に記載の、アルコキシカルボニル基で置換された直鎖、分岐若しくは環状のアルキル基の具体例としては、例えば以下に示す置換基が挙げられる。

メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、プロポキシカルボニルメチル基、イソプロポキシカルボニルメチル基、ブトキシカルボニルメチル基、イソブトキシカルボニルメチル基、sec-ブトキシカルボニルメチル基、tert-ブトキシカルボニルメチル基、ペンチルオキシカルボニルメチル基、ヘキシルオキシカルボニルメチル基、2-（メトキシカルボニル）エチル基、2-（エトキシカルボニル）エチル基、2-（プロポキシカルボニル）エチル基、2-（イソプロポキシカルボニル）エチル基、2-（ブトキシカルボニル）エチル基、2-（イソブトキシカルボニル）エチル基、2-（sec-ブ

50

トキシカルボニル) エチル基、2-(*t*-ブトキシカルボニル) エチル基、2-(ペンチ  
ルオキシカルボニル) エチル基、2-(イソペンチルオキシカルボニル) エチル基、1-  
(メトキシカルボニル) エチル基、1-(エトキシカルボニル) エチル基、1-(プロポ  
キシカルボニル) エチル基、1-(イソプロポキシカルボニル) エチル基、1-(ブトキ  
シカルボニル) エチル基、1-(イソブトキシカルボニル) エチル基、1-(*s e c*-ブ  
トキシカルボニル) エチル基、1-(*t*-ブトキシカルボニル) エチル基、1-(ペンチ  
ルオキシカルボニル) エチル基、1-(イソペンチルオキシカルボニル) エチル基、3-  
(メトキシカルボニル) プロピル基、3-(エトキシカルボニル) プロピル基、3-(プロ  
ポキシカルボニル) プロピル基、3-(イソプロポキシカルボニル) プロピル基、3-  
(ブトキシカルボニル) プロピル基、1-(メトキシカルボニル) プロピル基、1-(エ  
トキシカルボニル) プロピル基、1-(プロポキシカルボニル) プロピル基、1-(イソ  
プロポキシカルボニル) プロピル基、1-(ブトキシカルボニル) プロピル基、1-(メ  
トキシカルボニル)-1-メチルエチル基、1-(エトキシカルボニル)-1-メチルエ  
チル基、1-メチル-1-(プロポキシカルボニル) エチル基、1-(イソプロポキシカ  
ルボニル)-1-メチルエチル基、1-(ブトキシカルボニル)-1-メチルエチル基、  
4-(メトキシカルボニル) ブチル基、4-(エトキシカルボニル) ブチル基、4-(プロ  
ポキシカルボニル) ブチル基、4-(イソプロポキシカルボニル) ブチル基。

10

**【0023】**

上記置換基の説明中に記載の、アシルオキシ基で置換された直鎖、分岐若しくは環状のアル  
キル基の具体例としては、例えば以下に示す置換基が挙げられる。アセチルオキシメチ  
ル基、1-(アセチルオキシ) エチル基、2-(アセチルオキシ) エチル基、1-(プロ  
ピオニルオキシ) エチル基、2-(プロピオニルオキシ) エチル基、2-(ブチリルオキ  
シ) エチル基、2-(イソブチリルオキシ) エチル基、2-(バレリルオキシ) エチル基  
、2-(イソバレリルオキシ) エチル基、2-(ピバロイルオキシ) エチル基、2-(ア  
クリロイルオキシ) エチル基、2-(プロピオロイルオキシ) エチル基、2-(メタクリ  
ロイルオキシ) エチル基、2-(クロトノイルオキシ) エチル基、3-(アセチルオキシ  
) プロピル基、4-(アセチルオキシ) ブチル基、5-(アセチルオキシ) ペンチル基。

20

**【0024】**

上記置換基の説明中に記載の、フェニル基で置換された直鎖、分岐若しくは環状のアルキ  
ル基の具体例としては、例えば以下に示す置換基が挙げられる。

30

ベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルプロピル基、  
3-フェニルプロピル基、1-メチル-1-フェニルエチル基、ジフェニルメチル基。

**【0025】**

上記置換基の説明に記載のアルコキシカルボニル基の具体例としては、例えば以下に示す  
置換基が挙げられる。

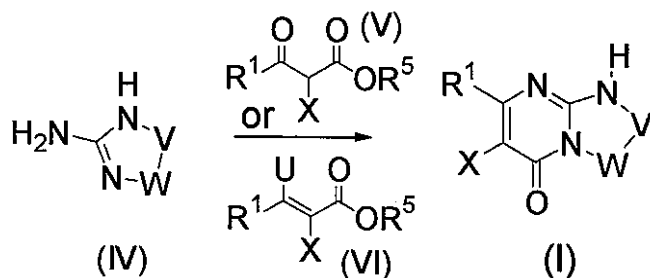
メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキ  
シカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、*s e c*-ブトキシ  
カルボニル基、*t*-ブトキシカルボニル基。

**2. 製造方法**

前記一般式(I)で表される本発明化合物は、例えば、下記製造法のいずれかに従って製  
造することができる。

40

**製造法(1)****【0026】****【化6】**



10

## 【0027】

(上記反応式中、X、R<sup>1</sup>、-V-W-は前記と同義を示す。R<sup>5</sup>は低級アルキル基を示す。Uはヒドロキシル基もしくはアミノ基を示す。)

本製造法は、化合物(IV)をβ-ケトエステル類(V)もしくはアミノクロトン酸エステル類(VI)と反応させて、双環性ピリミジノン類(I)へと変換させるものである。

## 【0028】

上記の反応は、塩基もしくは酸性試剤の存在下、無溶媒又は反応に不活性な溶媒中において、通常、-20~200℃、好ましくは-10~150℃の温度範囲で行われる。

上記塩基としては、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、ピコリン、ルチジン、コリジン、N,N-ジエチルアニリン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]-5-ノネン、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン等の含窒素有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム等のアルカリ金属又はアルカリ土類金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等のアルカリ金属炭酸水素化物；水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物等が挙げられる。塩基の使用量は、通常、化合物(IV)が1当量に対し、1~10当量、好ましくは1~3当量である。

20

## 【0029】

上記酸性試剤としては、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンスルホン酸、ピリジニウム p-トルエンスルホン酸等のブレンステッド酸；三塩化アルミニウム、三塩化ホウ素、三臭化ホウ素等のルイス酸等が挙げられる。使用される酸性試剤の量は、通常、化合物(IV)が1当量に対し、1~100当量である。

30

## 【0030】

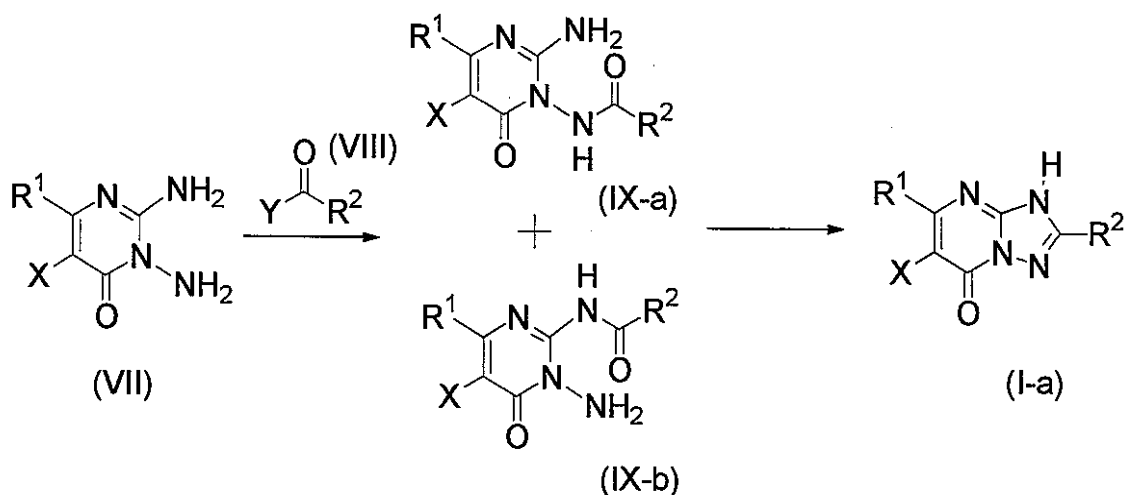
上記反応は溶媒中で行う事も可能であり、使用される適当な溶媒としては、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クメン等の芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の非プロトン性極性溶媒；水；及びこれらの2種以上の混合溶媒等が挙げられる。使用される溶媒の量は、通常、化合物(IV)の重量の100倍以内、好ましくは1~50倍である。

40

製造法(2)

## 【0031】

## 【化7】



10

## 【0032】

(上記反応式中、X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>は前記と同義を示す。YはOH基；フッ素原子や塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子；もしくはO(CO)R<sup>2</sup>で表される基を示す。)

本製造法は、置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)と、カルボン酸類(VIII)を反応させて酸アミド類(IX-a)もしくは(IX-b)へと変換し、つづ

20

## 【0033】

第一段階目の縮合反応は、上記カルボン酸類が酸ハロゲン化物もしくは酸無水物の時、通常は塩基の存在下もしくは非存在下、置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)と反応させることによって酸アミド類(IX-a)もしくは(IX-b)へと変換する。

カルボン酸類(VIII)がカルボン酸の時は下記(1-a)～(1-c)の操作を行うことによってカルボン酸類を活性化させた後に置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)と反応させることによって酸アミド類(IX-a)もしくは(IX-b)へと変換することがある。

30

(1-a)：カルボン酸類(VIII)を、塩化チオニル、三塩化リン、五塩化リン、塩化ホスホリル、ホスゲン等のハロゲン化剤により酸ハロゲン化物類とし、これを通常は塩基の存在下、置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)と反応させることによって酸アミド類(IX-a)もしくは(IX-b)へ変換する。

(1-b)：カルボン酸類(VIII)を通常は塩基の存在下、クロロギ酸アルキル、無水トリフルオロ酢酸等により混合酸無水物とし、これを通常は塩基の存在下、置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)と反応させることによって酸アミド類(IX-a)もしくは(IX-b)へ変換する。

(1-c)：カルボン酸類(VIII)と置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)を塩基の存在下又は非存在下、ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、N,N'-カルボニルジイミダゾール(CDI)、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(EDC)、アゾジカルボン酸ジエチル(DEAD)ートリフェニルホスフィン、N-アルキル-2-ハロゲノピリジニウム塩、ジフェニルホスホリルアジド、シアノホスホン酸ジエチル等の縮合剤の存在下に反応させることによって酸アミド類(IX-a)もしくは(IX-b)へ変換する。

40

## 【0034】

上記の反応は、無溶媒又は反応に不活性な溶媒中において、通常、-20～200℃、好ましくは-10～150℃の温度範囲で行われる。

上記の反応において、使用されるカルボン酸類(VIII)の量は、通常、化合物(VII)が1当量に対し、1～20当量、好ましくは1～5当量である。

50

上記の反応において塩基を使用する場合、適当な塩基としては、トリエチルアミン、N，N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、ピコリン、ルチジン、コリジン、N，N-ジエチルアニリン、4-（ジメチルアミノ）ピリジン、1，8-ジアザビシクロ〔5．4．0〕-7-ウンデセン、1，5-ジアザビシクロ〔4．3．0〕-5-ノネン、1，4-ジアザビシクロ〔2．2．2〕オクタン等の含窒素有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム等のアルカリ金属又はアルカリ土類金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等のアルカリ金属炭酸水素化物等が挙げられる。塩基の使用量は、通常、化合物（V I I）が1当量に対し、1～3当量、好ましくは1～2当量である。

#### 【0035】

10

上記の反応は溶媒中で行うのが好ましく、使用される適当な溶媒としては、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クメン等の芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1，2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；N，N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の非プロトン性極性溶媒；水；及びこれらの2種以上の混合溶媒等が挙げられる。

#### 【0036】

20

二段回目の環化反応は、無溶媒又は反応に不活性な溶媒中において、塩基の存在下もしくは非存在化、酸性試剤の存在下もしくは非存在下、通常、-20～200℃、好ましくは0～150℃の温度範囲で行われる。

上記塩基としては、トリエチルアミン、N，N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、ピコリン、ルチジン、コリジン、N，N-ジエチルアニリン、4-（ジメチルアミノ）ピリジン、1，8-ジアザビシクロ〔5．4．0〕-7-ウンデセン、1，5-ジアザビシクロ〔4．3．0〕-5-ノネン、1，4-ジアザビシクロ〔2．2．2〕オクタン等の含窒素有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム等のアルカリ金属又はアルカリ土類金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等のアルカリ金属炭酸水素化物；水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物等が挙げられる。塩基の使用量は、通常、酸アミド類（I X-a）もしくは（I X-b）が1当量に対し、1～3当量、好ましくは1～2当量である。

30

#### 【0037】

上記酸性試剤としては、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンスルホン酸、ピリジニウム p-トルエンスルホン酸等のブレンステッド酸；三塩化アルミニウム、三塩化ホウ素、三臭化ホウ素等のルイス酸等が挙げられる。使用される酸性試剤の量は、通常、酸アミド類（I X-a）もしくは（I X-b）が1当量に対し、1～100当量である。

#### 【0038】

40

上記反応は溶媒中で行う事も可能であり、使用される適当な溶媒としては、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クメン等の芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1，2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；N，N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の非プロトン性極性溶媒；水；及びこれらの2種以上の混合溶媒等が挙げられる。使用される溶媒の量は、通常、酸アミド類（I X-a）もしくは（I X-b）の重量の100倍以内

50

、好ましくは1～50倍である。

【0039】

なお、一段階目の反応で得られる酸アミド類（IX-a）もしくは（IX-b）は、これを単離精製してから二段階目の反応に用いても良いが、単離することなく二段階目の反応に進むことも可能である。

また、条件を選べば一段階目の反応条件で（I-a）を得ることも可能である。

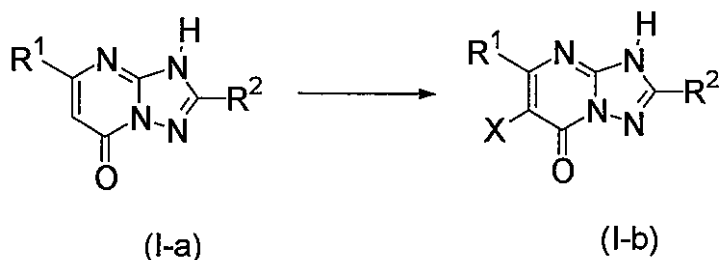
【0040】

上記原料である化合物（VII）は、例えば *Journal Heterocyclic Chemistry*, vol. 21, p. 1537, (1984) に記載の方法で合成することができる。

製造法（3）

【0041】

【化8】



10

20

【0042】

（上記反応式中、X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>は、前記と同義を示す。）

本製造法は、本発明化合物中のトリアゾロピリミジン類（I-a）をハロゲン化することによってトリアゾロピリミジン類（I-b）へ変換するものである。

上記反応は、無溶媒又は反応に不活性な溶媒中において、通常、-20～200℃、好ましくは-10～150℃の温度範囲で行われる。

【0043】

上記反応において、使用されるハロゲン化剤の量は、通常、トリアゾロピリミジン類（I-a）が1当量に対し、1～20当量、好ましくは1～5当量である。

上記反応において使用されるハロゲン化剤としては、CF<sub>3</sub>OF、N-フルオロピリジニウム塩類、塩素、臭素、N-クロロサクシンイミド、N-ブロモサクシンイミド、塩化スルフリル、5, 5-ジブロモ-2, 2-ジメチル-4, 6-ジオキソ-1, 3-ジオキサン等が挙げられる。

30

【0044】

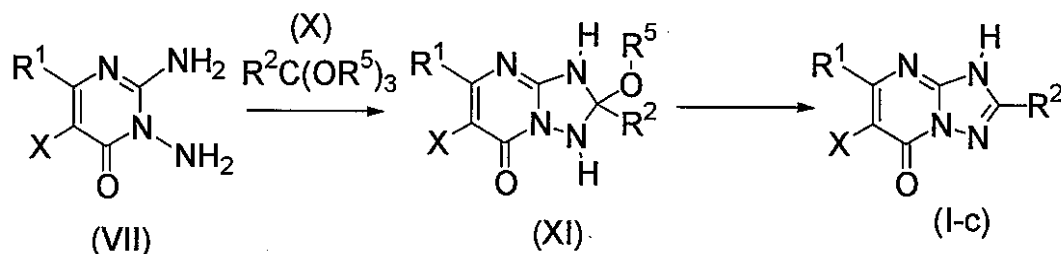
上記反応は溶媒中で行うのが好ましく、使用される適当な溶媒としては、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クメン等の芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の非プロトン性極性溶媒；水；及びこれらの2種以上の混合溶媒等が挙げられる。

40

製造法（4）

【0045】

【化9】



## 【0046】

10

(上記反応式中、X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>5</sup>は、前記と同義を示す。)

本製造法は、置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)と、オルトカルボン酸エステル類(X)を反応させて化合物(XI)へと変換し、つづく脱アルコール反応によって(I-c)へと変換させるものである。

第一段階目の反応は、酸性試剤の存在下無溶媒又は反応に不活性な溶媒中において、通常、-20~200℃、好ましくは-10~150℃の温度範囲で行われる。

## 【0047】

上記反応において、使用されるオルトカルボン酸類の量は、通常、置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)が1当量に対し、1~100当量、好ましくは1~20当量である。

20

上記酸性試剤としては、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンスルホン酸、ピリジニウム p-トルエンスルホン酸、等のブレンステッド酸；三塩化アルミニウム、三塩化ホウ素、三臭化ホウ素等のルイス酸等が挙げられる。使用される酸性試剤の量は、通常、置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)が1当量に対し、1~100当量である。

## 【0048】

上記反応は溶媒中で行う事も可能であり、使用される適当な溶媒としては、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クメン等の芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の非プロトン性極性溶媒；水；及びこれらの2種以上の混合溶媒等が挙げられる。使用される溶媒の量は、通常、置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)の重量の100倍以内、好ましくは1~50倍である。

30

## 【0049】

二段階目の脱アルコール反応は、無溶媒又は反応に不活性な溶媒中において、塩基の存在下もしくは非存在化、酸性試剤の存在下もしくは非存在下、通常、-20~200℃、好ましくは0~150℃の温度範囲で行われる。

40

上記塩基としては、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、ピコリン、ルチジン、コリジン、N,N-ジエチルアニリン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]-5-ノネン、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン等の含窒素有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム等のアルカリ金属又はアルカリ土類金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等のアルカリ金属炭酸水素化物；水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物等が挙げられる。塩基の使用量は、通常、化合物(XI)が1当量に対し、1~10当量、好ましくは1~3当量である。

50

## 【0050】

上記酸性試剤としては、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンスルホン酸、ピリジニウム p-トルエンスルホン酸等のブレンステッド酸；三塩化アルミニウム、三塩化ホウ素、三臭化ホウ素等のルイス酸等が挙げられる。使用される酸性試剤の量は、通常、化合物(X I)が1当量に対し、1～100当量である。

## 【0051】

上記反応は溶媒中で行う事も可能であり、使用される適当な溶媒としては、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クメン等の芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の非プロトン性極性溶媒；水；及びこれらの2種以上の混合溶媒等が挙げられる。使用される溶媒の量は、通常、化合物(X I)の重量の100倍以内、好ましくは1～50倍である。

10

## 【0052】

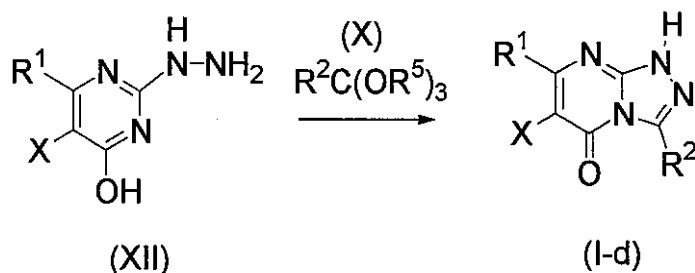
なお、一段階目の反応で得られる化合物(X I)は、これを単離精製してから二段階目の反応に用いても良いが、単離することなく二段階目の反応に進むことも可能である。また、条件を選べば一段階目の反応条件で(I-c)を得ることも可能である。

20

製造法(5)

## 【0053】

## 【化10】



30

## 【0054】

(上記反応式中、X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>5</sup>は、前記と同義を示す。)

本製造法は、化合物(X I I)と、オルトカルボン酸エステル類(X)を反応させて化合物(I-d)へと変換させるものである。

上記反応は、酸性試剤の存在下無溶媒又は反応に不活性な溶媒中において、通常、-20～200℃、好ましくは-10～150℃の温度範囲で行われる。

40

## 【0055】

上記反応において、使用されるオルトカルボン酸類の量は、通常、化合物(X I I)が1当量に対し、1～100当量、好ましくは1～20当量である。

上記酸性試剤としては、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンスルホン酸、ピリジニウム p-トルエンスルホン酸、等のブレンステッド酸；三塩化アルミニウム、三塩化ホウ素、三臭化ホウ素等のルイス酸等が挙げられる。使用される酸性試剤の量は、通常、化合物(X I I)が1当量に対し、1～100当量である。

## 【0056】

50

上記反応は溶媒中で行う事も可能であり、使用される適当な溶媒としては、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クメン等の芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の非プロトン性極性溶媒；水；及びこれらの2種以上の混合溶媒等が挙げられる。使用される溶媒の量は、通常、化合物(X I I)の重量の100倍以内、好ましくは1～50倍である。

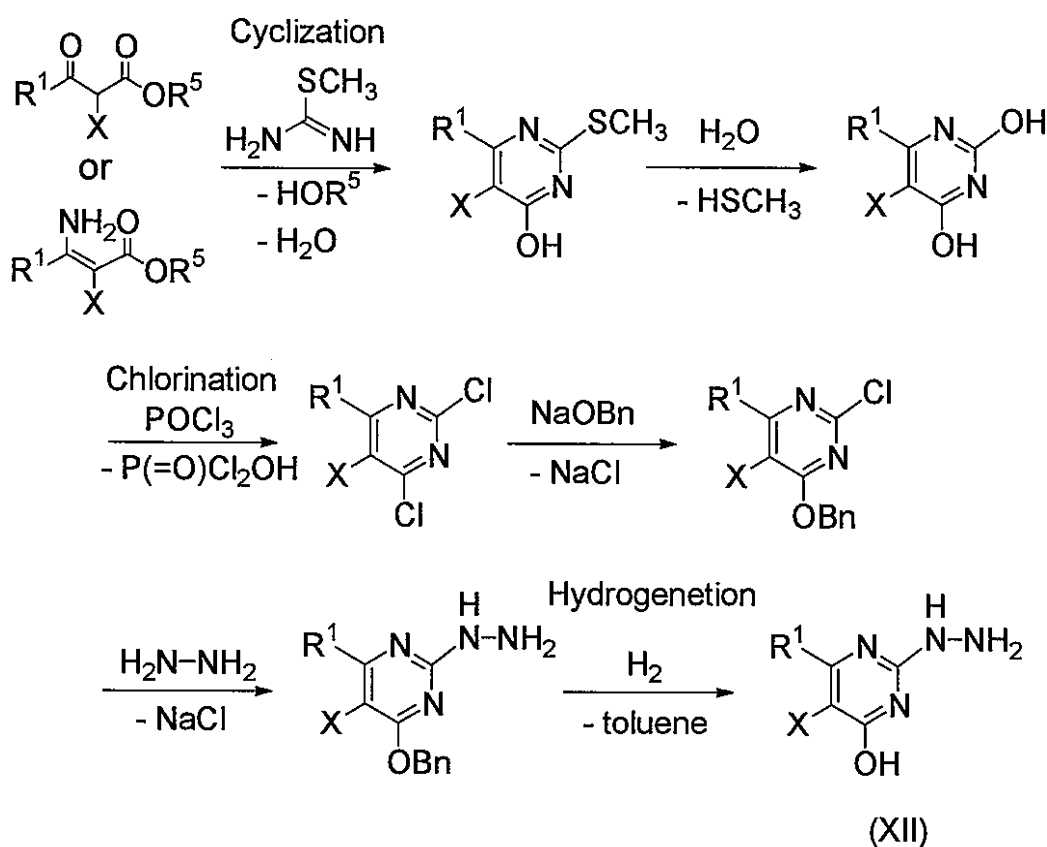
10

【0057】

化合物(X I I)は例えば以下の経路で合成する事が可能である。

【0058】

【化11】



20

30

【0059】

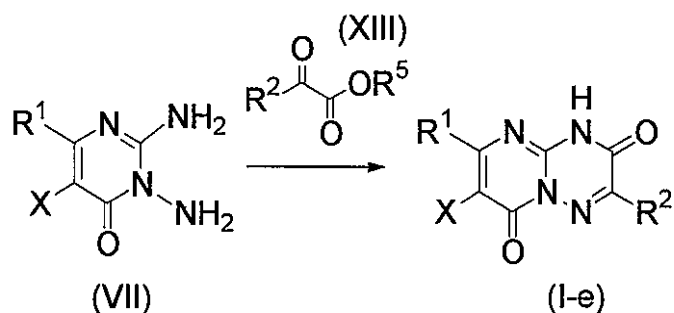
(上記反応式中、X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>5</sup>は、前記と同義を示す。Bnはベンジル基を示す。)

40

製造法(6)

【0060】

【化12】



10

## 【0061】

(上記反応式中、X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>5</sup>は、前記と同義を示す。)

本製造法は、置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)と、α-ケトエステル類(XIII)を反応させて化合物(I-e)へと変換させるものである。

上記反応は、酸性試剤の存在下無溶媒又は反応に不活性な溶媒中において、通常、-20～200℃、好ましくは-10～150℃の温度範囲で行われる。

## 【0062】

上記反応において、使用されるα-ケトエステル類(XIII)の量は、通常、置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)が1当量に対し、1～10当量、好ましくは1～3当量である。

20

上記酸性試剤としては、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンスルホン酸、ピリジニウム p-トルエンスルホン酸、等のブレンステッド酸；三塩化アルミニウム、三塩化ホウ素、三臭化ホウ素等のルイス酸等が挙げられる。使用される酸性試剤の量は、通常、置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)が1当量に対し、0.1～10当量である。

## 【0063】

上記反応は溶媒中で行う事も可能であり、使用される適当な溶媒としては、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クメン等の芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の非プロトン性極性溶媒；水；及びこれらの2種以上の混合溶媒等が挙げられる。使用される溶媒の量は、通常、置換2,3-ジアミノピリミジン-4-オン(VII)の重量の100倍以内、好ましくは1～50倍である。

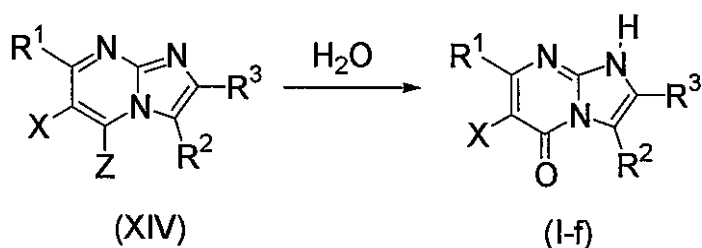
30

製造法(7)

## 【0064】

## 【化13】

40



## 【0065】

50

(上記反応式中、X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>は前記と同義を示す。Zは塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子を示す。)

本製造法は、イミダゾピリミジン(XIV)を加水分解して化合物(I-f)へと変換させるものである。

上記の反応は、塩基もしくは酸性試剤の存在下、無溶媒又は反応に不活性な溶媒中において、通常、-20~200℃、好ましくは-10~150℃の温度範囲で行われる。

#### 【0066】

上記の反応において、使用される水の量は、通常、イミダゾピリミジン(XIV)が1当量に対し、1~100当量、好ましくは1~10当量である。

上記塩基としては、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、ピコリン、ルチジン、コリジン、N,N-ジエチルアニリン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]-5-ノネン、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン等の含窒素有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム等のアルカリ金属又はアルカリ土類金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等のアルカリ金属炭酸水素化物；水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物等が挙げられる。塩基の使用量は、通常、イミダゾピリミジン(XIV)が1当量に対し、1~10当量、好ましくは1~3当量である。

#### 【0067】

上記酸性試剤としては、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンスルホン酸、ピリジニウム p-トルエンスルホン酸等のブレンステッド酸；三塩化アルミニウム、三塩化ホウ素、三臭化ホウ素等のルイス酸等が挙げられる。使用される酸性試剤の量は、通常、イミダゾピリミジン(XIV)が1当量に対し、1~100当量である。

#### 【0068】

上記反応は溶媒中で行う事も可能であり、使用される適当な溶媒としては、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クメン等の芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の非プロトン性極性溶媒；水；及びこれらの2種以上の混合溶媒等が挙げられる。使用される溶媒の量は、通常、イミダゾピリミジン(XIV)の重量の100倍以内、好ましくは1~50倍である。

#### 【0069】

化合物(XIV)は、前記製造法(1)の方法で合成することも可能であるが、R<sup>3</sup>が塩素原子等のハロゲン原子の時は、例えば以下の経路で合成する事もできる。

#### 【0070】

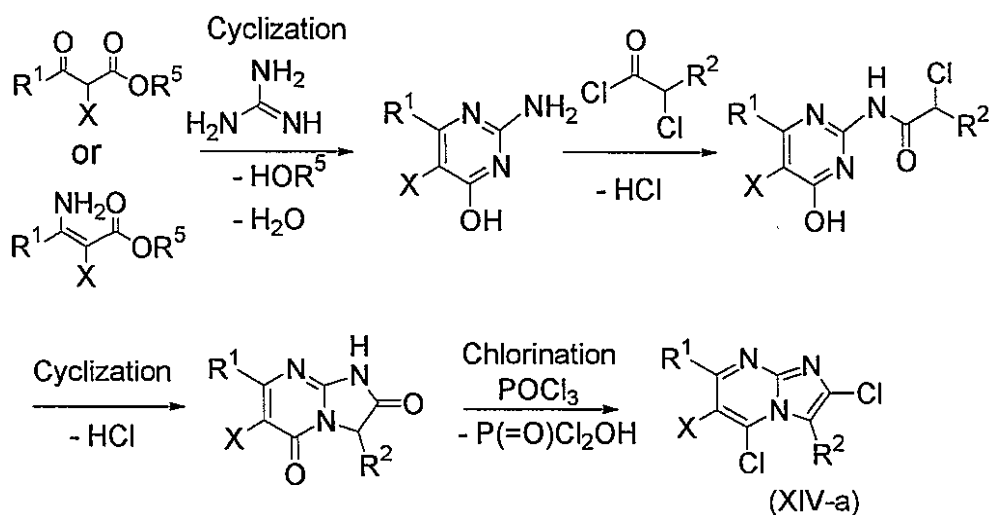
#### 【化14】

10

20

30

40



10

## 【0071】

(上記反応式中、X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>5</sup>は前記と同義を示す。)

本発明化合物には、その構造によっては、光学異性体、ジアステレオマー、幾何異性体等の異性体が存在する。本発明は、これらすべてを包含するものである。これらの各異性体は、公知の方法に準じて、混合物より単離するか、又は選択的に製造することにより得る

20

上記双環性ピリミジノン誘導体を除草剤として使用する場合、これらの各異性体を単独で使用しても、異性体の混合物として使用してもよい。

## 【0072】

## 3. 除草剤

上記双環性ピリミジノン誘導体を除草剤として使用する場合、原体をそのまま施用してもよいが、通常、適当な補助剤を用い、水和剤、粒剤、乳剤、フロアブル剤等の製剤の形態で使用する。製剤中の双環性ピリミジノン誘導体の含有量は、製剤形態によって異なるが、一般的には、例えば、水和剤では 1 - 90 重量%、粒剤では 0.1 - 30 重量%、乳剤では 1 - 50 重量%、フロアブル剤では 5 - 50 重量%が適当

30

## 【0073】

製剤の調製において使用される補助剤としては、例えば、カオリン、ベントナイト、タルク、珪藻土、ホワイต์カーボン、デンプン等の固体担体；水、アルコール類（メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、エチレングリコール等）、ケトン類（アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、イソホロン等）、エーテル類（ジエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ類等）、脂肪族炭化水素類（ケロシン、灯油等）、芳香族炭化水素類（ベンゼン、トルエン、キシレン、クメン、ソルベントナフサ、メチルナフタレン等）、ハロゲン化炭化水素類（ジクロロエタン、四塩化炭素、トリクロロベンゼン等）、酸アミド類（ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等）、エステル類（酢酸エチル、酢酸ブチル、脂肪酸グリセリンエステル類等）、ニトリル類（アセトニトリル等）等の溶媒；非イオン系界面活性剤（ポリオキシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル等）、カチオン系界面活性剤（アルキルジメチルベンジルアンモニウムクロリド、アルキルピリジニウムクロリド等）、アニオン系界面活性剤（アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、高級アルコール硫酸エステル塩等）、両性系界面活性剤（アルキルジメチルベタイン、ドデシルアミノエチルグリシン等）等の界面活性剤等が挙げられる。これらの固体担体、溶媒、界面活性剤等は、それぞれ必要に応じて 1 種または 2 種以上の混合物として使

40

50

用される。

#### 【0074】

双環性ピリミジノン誘導体を含む製剤を水で希釈して施用する場合、付着性や拡張性等を向上させ、除草効果を高めるために、散布液中に展着剤等の補助剤を添加してもよい。使用される展着剤等の補助剤としては、界面活性剤（前記の非イオン系界面活性剤、カチオン系界面活性剤、アニオン系界面活性剤、両性系界面活性剤）、パラフィン、ポリ酢酸ビニル、ポリアクリル酸塩、エチレングリコール、ポリエチレングリコール、クロップオイル（鉱物油、動植物油等）、液体肥料等が挙げられる。これらの補助剤は、必要に応じて2種以上を同時に使用してもよい。展着剤等の補助剤の使用量は、その種類によって異なるが、通常、散布液中に

10

0.01 - 5重量%を添加するのが適当である。また、補助剤の種類によっては、製剤中の成分としてあらかじめ添加しておくことも可能である。

#### 【0075】

本発明の除草剤の施用量は、化合物の構造や対象雑草、処理時期、処理方法、土壌の性質等の条件によって異なるが、通常、1ヘクタール当りの有効成分量としては2 - 2000グラム、好ましくは5 - 1000グラムの範囲が適当である。本発明の除草剤の対象雑草としては、畑地においては、例えば、シロザ、アカザ、イヌタデ、ハルタデ、イヌビユ、アオビユ、ハコベ、ホトケノザ、イチビ、オナモミ、マルバアサガオ、チョウセンアサガオ、セイヨウカラシナ、ヤエムグラ、セイヨウスミレ、オロシャギク、コセンダングサ等の広葉雑草、メヒシバ、オヒシバ、イヌビエ、エノコログサ等の狭葉雑草が

20

#### 【0076】

本発明の除草剤は、畑地および水田において、土壌処理、茎葉処理および湛水処理のいずれの処理方法によっても上記雑草を防除することが可能である。また、本発明の除草剤は、例えば、トウモロコシ、コムギ、オオムギ、イネ、ダイズ等の栽培作物に対し、土壌処理および茎葉処理のいずれにおいても影響が少なく、これらの作物の栽培において選択的除草剤として使用することが可能である。

#### 【0077】

30

本発明の除草剤は、同一分野に用いる殺虫剤、殺菌剤、植物成長調節剤等の他の農薬、および肥料等と混合施用することができる。また、除草効果をより安定化させるために他の除草剤と混合施用することもできる。本発明の除草剤と他の除草剤を混合施用する場合、両者の各々の製剤を施用時に混合してもよいが、あらかじめ両者の有効成分を含む製剤として施用してもよい。本発明の除草剤と好適に混合施用することができる除草剤としては、例えば以下のものが挙げられる。

#### 【0078】

有機リン系除草剤：

N - (ホスホノメチル) グリシンおよびその塩、

4 - [ヒドロキシ(メチル)ホスフィノイル] - DL - ホモアラニンおよびその塩、

40

4 - [ヒドロキシ(メチル)ホスフィノイル] - L - ホモアラニル - L - アラニル - L - アラニンおよびその塩、

O - エチル O - 6 - ニトロ - m - トリル sec - ブチルホスホロアミドチオエート、

S - [N - (4 - クロロフェニル) - N - イソプロピルカルバモイルメチル] O, O - ジメチルホスホロジチオエート、

O, O - ジイソプロピル S - 2 - (フェニルスルホニルアミノ) エチル ホスホロジチオエート、等。

#### 【0079】

カーバメート系除草剤：

2 - クロロアリル ジエチルジチオカーバメート、

50

S-2, 3-ジクロロアリル ジイソプロピルチオカーバメート、  
 S-2, 2, 3-トリクロロアリル ジイソプロピルチオカーバメート、  
 S-エチル ジプロピルチオカーバメート、  
 S-エチル ジイソブチルチオカーバメート、  
 S-ベンジル 1, 2-ジメチルプロピル (エチル) チオカーバメート、  
 S-4-クロロベンジル ジエチルチオカーバメート、  
 S-エチル パーヒドロアゼピン-1-チオカルボキシレート、  
 S-イソプロピル パーヒドロアゼピン-1-チオカルボキシレート、  
 S-1-メチル-1-フェニルエチル ピペリジン-1-チオカルボキシレート、  
 O-3-tert-ブチルフェニル 6-メトキシ-2-ピリジル (メチル) チオカーバメート 10  
 、  
 3-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル 3'-メチルフェニルカーバメート、  
 イソプロピル 3'-クロロフェニルカーバメート、  
 メチル (4-アミノフェニルスルホニル)カーバメート、等。

## 【0080】

ウレア系除草剤：

3-(3, 4-ジクロロフェニル)-1, 1-ジメチルウレア、  
 3-(3, 4-ジクロロフェニル)-1-メトキシ-1-メチルウレア、  
 1, 1-ジメチル-3-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]ウレア、  
 3-[4-(4-メトキシフェノキシ)フェニル]-1, 1-ジメチルウレア、 20  
 1-(1-メチル-1-フェニルエチル)-3-p-トリルウレア、  
 3-(4-イソプロピルフェニル)-1, 1-ジメチルウレア、  
 3-(5-tert-ブチルイソオキサゾール-3-イル)-1, 1-ジメチルウレア、  
 1-(5-tert-ブチル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-1, 3-ジメチルウ  
 レア、  
 1-(ベンゾチアゾール-2-イル)-1, 3-ジメチルウレア、等。

## 【0081】

アミド系除草剤：

2-クロロ-N-(ピラゾール-1-イルメチル)アセト-2', 6'-キシリジド、  
 2-クロロ-2', 6'-ジエチル-N-(メトキシメチル)アセトアニリド、 30  
 N-(ブトキシメチル)-2-クロロ-2', 6'-ジエチルアセトアニリド、  
 2-クロロ-2', 6'-ジエチル-N-(2-プロポキシエチル)アセトアニリド、  
 2-クロロ-N-(エトキシメチル)-6'-エチルアセト-ortho-トルイジド、  
 2-クロロ-6'-エチル-N-(2-メトキシ-1-メチルエチル)アセト-ortho-トル  
 イジド、  
 2-クロロ-N-(3-メトキシ-2-テニル)-2', 6'-ジメチルアセトアニリド  
 、  
 N-(クロロアセチル)-N-(2, 6-ジエチルフェニル)グリシン エチルエステル  
 、  
 2-クロロ-N-(2, 4-ジメチル-3-チエニル)-N-(2-メトキシ-1-メチ  
 ルエチル)アセトアミド、 40  
 3', 4'-ジクロロプロピオンアニリド、  
 2', 4'-ジフルオロ-2-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]ニコチンアニ  
 リド、  
 2-(1, 3-ベンゾチアゾール-2-イルオキシ)-N-メチルアセトアニリド、  
 4'-フルオロ-N-イソプロピル-2-(5-トリフルオロメチル-1, 3, 4-チア  
 ジアゾール-2-イルオキシ)アセトアニリド、  
 2-プロモ-N-(α, α-ジメチルベンジル)-3, 3-ジメチルブチルアミド、  
 N-[3-(1-エチル-1-メチルプロピル)イソオキサゾール-5-イル]-2, 6  
 -ジメトキシベンズアミド、等。 50

## 【0082】

ジニトロアニリン系除草剤：

2, 6-ジニトロ-N, N-ジプロピル-4-(トリフルオロメチル)アニリン、  
N-ブチル-N-エチル-2, 6-ジニトロ-4-(トリフルオロメチル)アニリン、  
2, 6-ジニトロ-N<sup>1</sup>, N<sup>1</sup>-ジプロピル-4-(トリフルオロメチル)-m-フェニ  
レンジアミン、  
4-(ジプロピルアミノ)-3, 5-ジニトロベンゼンスルホンアミド、  
N-sec-ブチル-4-t-ブチル-2, 6-ジニトロアニリン、  
N-(1-エチルプロピル)-2, 6-ジニトロ-3, 4-キシリジン、等。

## 【0083】

カルボン酸系除草剤：

(2, 4-ジクロロフェノキシ)酢酸およびその誘導体、  
(2, 4, 5-トリクロロフェノキシ)酢酸およびその誘導体、  
(4-クロロ-2-メチルフェノキシ)酢酸およびその誘導体、  
2-(2, 4-ジクロロフェノキシ)プロピオン酸およびその誘導体、  
2-(4-クロロ-2-メチルフェノキシ)プロピオン酸およびその誘導体、  
4-(2, 4-ジクロロフェノキシ)酪酸およびその誘導体、  
2, 3, 6-トリクロロ安息香酸およびその誘導体、  
3, 6-ジクロロ-2-メトキシ安息香酸およびその誘導体、  
3, 7-ジクロロキノリン-8-カルボン酸およびその誘導体、  
7-クロロ-3-メチルキノリン-8-カルボン酸およびその誘導体、  
3, 6-ジクロロピリジン-2-カルボン酸およびその誘導体、  
4-アミノ-3, 5, 6-トリクロロピリジン-2-カルボン酸およびその誘導体、  
(3, 5, 6-トリクロロ-2-ピリジルオキシ)酢酸およびその誘導体、  
(4-アミノ-3, 5-ジクロロ-6-フルオロ-2-ピリジルオキシ)酢酸およびその  
誘導体、  
(4-クロロ-2-オキソベンゾチアゾリン-3-イル)酢酸およびその誘導体、  
2-[4-(2, 4-ジクロロフェノキシ)フェノキシ]プロピオン酸およびその誘導体  
、  
2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルオキシ]フェノキシ]プロピオ  
ン酸およびその誘導体、  
2-[4-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルオキシ]フェノキ  
シ]プロピオン酸およびその誘導体、  
2-[4-(6-クロロ-1, 3-ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)フェノキシ]  
プロピオン酸およびその誘導体、  
2-[4-(6-クロロキノキサリン-2-イルオキシ)フェノキシ]プロピオン酸およ  
びその誘導体、  
2-[4-(4-シアノ-2-フルオロフェノキシ)フェノキシ]プロピオン酸およびそ  
の誘導体、等。

## 【0084】

フェノール系除草剤：

3, 5-ジプロモ-4-ヒドロキシベンゾニトリルおよびその誘導体、  
4-ヒドロキシ-3, 5-ジヨードベンゾニトリルおよびその誘導体、  
2-t-ブチル-4, 6-ジニトロフェノールおよびその誘導体、等。

シクロヘキサジオン系除草剤：

メチル 3-[1-(アリルオキシイミノ)ブチル]-4-ヒドロキシ-6, 6-ジメチ  
ル-2-オキソ-3-シクロヘキセン-1-カルボキシレートおよびその塩、  
2-[1-(エトキシイミノ)ブチル]-5-[2-(エチルチオ)プロピル]-3-ヒ  
ドロキシ-2-シクロヘキセン-1-オン、  
2-[1-(エトキシイミノ)ブチル]-3-ヒドロキシ-5-(チアン-3-イル)-

10

20

30

40

50

2-シクロヘキセン-1-オン、  
 2-[1-(エトキシイミノ)プロピル]-3-ヒドロキシ-5-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2-シクロヘキセン-1-オン、  
 5-(3-ブチル-2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2-[1-(エトキシイミノ)プロピル]-3-ヒドロキシ-2-シクロヘキセン-1-オン、  
 2-[1-(3-クロロアリルオキシイミノ)プロピル]-5-[2-(エチルチオ)プロピル]-3-ヒドロキシ-2-シクロヘキセン-1-オン、  
 2-[1-(3-クロロアリルオキシイミノ)プロピル]-3-ヒドロキシ-5-パーヒドロピラン-4-イル-2-シクロヘキセン-1-オン、  
 2-[2-クロロ-4-(メチルスルホニル)ベンゾイル]シクロヘキサ-1, 3-ジオン、等。

10

## 【0085】

ジフェニルエーテル系除草剤：

4-ニトロフェニル 2, 4, 6-トリクロロフェニル エーテル、  
 5-(2, 4-ジクロロフェノキシ)-2-ニトロアニソール、  
 2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル 3-エトキシ-4-ニトロフェニル  
 エーテル、

メチル 5-(2, 4-ジクロロフェノキシ)-2-ニトロベンゾエート、  
 5-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-2-ニトロ安息香酸およびその塩、

20

O-[5-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-2-ニトロベンゾイル]グリコール酸エチル、

エチル O-[5-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-2-ニトロベンゾイル]-DL-ラクテート、

5-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-N-(メチルスルホニル)-2-ニトロベンズアミド、

2-クロロ-6-ニトロ-3-フェノキシアニリン、等。

## 【0086】

スルホニルウレア系除草剤：

1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-3-メシル(メチル)スルファモイルウレア、

30

エチル 2-(4-クロロ-6-メトキシピリミジン-2-イルカルバモイルスルファモイル)ベンゾエート、

メチル 2-(4, 6-ジメチルピリミジン-2-イルカルバモイルスルファモイル)ベンゾエート、

メチル 2-[4, 6-ビス(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イルカルバモイルスルファモイル]ベンゾエート、

メチル 2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルバモイルスルファモイルメチル)ベンゾエート、

1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-3-(2-エトキシフェノキシスルホニル)ウレア、

40

1-[2-(シクロプロピルカルボニル)フェニルスルファモイル]-3-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)ウレア、

1-(2-クロロフェニルスルホニル)-3-(4-メトキシ-6-メチル-1, 3, 5-トリアジン-2-イル)ウレア、

メチル 2-(4-メトキシ-6-メチル-1, 3, 5-トリアジン-2-イルカルバモイルスルファモイル)ベンゾエート、

メチル 2-[4-メトキシ-6-メチル-1, 3, 5-トリアジン-2-イル(メチル)カルバモイルスルファモイル]ベンゾエート、

1-[2-(2-クロロエトキシ)フェニルスルホニル]-3-(4-メトキシ-6-メ

50

チル-1, 3, 5-トリアジン-2-イル) ウレア、  
 1-(4, 6-ジメトキシ-1, 3, 5-トリアジン-2-イル)-3-[2-(2-メ  
 トキシエトキシ)フェニルスルホニル] ウレア、  
 メチル 2-[4-エトキシ-6-(メチルアミノ)-1, 3, 5-トリアジン-2-イ  
 ルカルバモイルスルファモイル] ベンゾエート、  
 メチル 2-[4-(ジメチルアミノ)-6-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-  
 1, 3, 5-トリアジン-2-イルカルバモイルスルファモイル]-3-メチルベンゾエ  
 ート、  
 1-(4-メトキシ-6-メチル-1, 3, 5-トリアジン-2-イル)-3-[2-(  
 3, 3, 3-トリフルオロプロピル)フェニルスルホニル] ウレア、  
 メチル 3-(4-メトキシ-6-メチル-1, 3, 5-トリアジン-2-イルカルバモ  
 イルスルファモイル)チオフェン-2-カルボキシレート、  
 エチル 5-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルバモイルスルファモイル)  
 -1-メチルピラゾール-4-カルボキシレート、  
 メチル 3-クロロ-5-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルバモイルスル  
 ファモイル)-1-メチルピラゾール-4-カルボキシレート、  
 1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-3-[3-(トリフルオロメチル)  
 -2-ピリジルスルホニル] ウレア、  
 1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-3-[3-(エチルスルホニル)-  
 2-ピリジルスルホニル] ウレア、  
 2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルバモイルスルファモイル)-N, N  
 -ジメチルニコチンアミド、  
 メチル 2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルバモイルスルファモイル)  
 -6-トリフルオロメチルニコチネートおよびその塩、  
 1-(2-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリジン-3-イルスルホニル)-3-(4,  
 6-ジメトキシピリミジン-2-イル) ウレア、  
 1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-3-[2-(エチルスルホニル)イ  
 ミダゾ[1, 2-a]ピリジン-3-イルスルホニル] ウレア、等。

10

20

30

40

50

# 【0087】

ビピリジニウム系除草剤：

1, 1'-ジメチル-4, 4'-ビピリジニウム ジクロリド、  
 1, 1'-エチレン-2, 2'-ビピリジニウム ジブロミド、等。

ピラゾール系除草剤：

4-(2, 4-ジクロロベンゾイル)-1, 3-ジメチルピラゾール-5-イル トルエ  
 ン-4-スルホネート、  
 2-[4-(2, 4-ジクロロベンゾイル)-1, 3-ジメチルピラゾール-5-イルオ  
 キシ]アセトフェノン、  
 2-[4-(2, 4-ジクロロ-3-メチルベンゾイル)-1, 3-ジメチルピラゾール  
 -5-イルオキシ]-4'-メチルアセトフェノン、等。

# 【0088】

トリアジン系除草剤：

6-クロロ- $N^2$ ,  $N^4$ -ジエチル-1, 3, 5-トリアジン-2, 4-ジアミン、  
 6-クロロ- $N^2$ -エチル- $N^4$ -イソプロピル-1, 3, 5-トリアジン-2, 4-ジ  
 アミン、  
 2-[4-クロロ-6-(エチルアミノ)-1, 3, 5-トリアジン-2-イルアミノ]  
 -2-メチルプロピオニトリル、  
 $N^2$ ,  $N^4$ -ジエチル-6-(メチルチオ)-1, 3, 5-トリアジン-2, 4-ジアミ  
 ン、  
 $N^2$ - (1, 2-ジメチルプロピル)- $N^4$ -エチル-6-(メチルチオ)-1, 3, 5  
 -トリアジン-2, 4-ジアミン、

4-アミノ-6-tert-ブチル-3-(メチルチオ)-1, 2, 4-トリアジン-5(4H)-オン、等。

# 【0089】

イミダゾリノン系除草剤：

メチル 2-(4-イソプロピル-4-メチル-5-オキソ-2-イミダゾリン-2-イル)-4(5)-メチルベンゾエート、

2-(4-イソプロピル-4-メチル-5-オキソ-2-イミダゾリン-2-イル)ピリジン-3-カルボン酸およびその塩、

2-(4-イソプロピル-4-メチル-5-オキソ-2-イミダゾリン-2-イル)キノリン-3-カルボン酸およびその塩、

5-エチル-2-(4-イソプロピル-4-メチル-5-オキソ-2-イミダゾリン-2-イル)ピリジン-3-カルボン酸およびその塩、

2-(4-イソプロピル-4-メチル-5-オキソ-2-イミダゾリン-2-イル)-5-(メトキシメチル)ピリジン-3-カルボン酸およびその塩、等。

10

# 【0090】

その他の除草剤：

3-[2-クロロ-4-(メチルスルホニル)ベンゾイル]-2-(フェニルチオ)ビシクロ[3.2.1]-2-オクテン-4-オン、

2-[2-(3-クロロフェニル)-2, 3-エポキシプロピル]-2-エチルインダン-1, 3-ジオン、

1-メチル-3-フェニル-5-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-4-ピリドン、

3-クロロ-4-(クロロメチル)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ピロリジノン、

5-(メチルアミノ)-2-フェニル-4-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]フラン-3(2H)-オン、

4-クロロ-5-(メチルアミノ)-2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]ピリダジン-3(2H)-オン、

N, N-ジエチル-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニルスルホニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-カルボキサミド、

4-(2-クロロフェニル)-N-シクロヘキシル-N-エチル-4, 5-ジヒドロ-5-オキソテトラゾール-1-カルボキサミド、

N-[2, 4-ジクロロ-5-[4-(ジフルオロメチル)-4, 5-ジヒドロ-3-メチル-5-オキソ-1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル]フェニル]メタンスルホンアミド、

エチル 2-クロロ-3-[2-クロロ-5-[4-(ジフルオロメチル)-4, 5-ジヒドロ-3-メチル-5-オキソ-1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル]-4-フルオロフェニル]プロピオネート、

3-[4-クロロ-5-(シクロペンチルオキシ)-2-フルオロフェニル]-5-イソプロピリデン-1, 3-オキサゾリジン-2, 4-ジオン、

5-tert-ブチル-3-(2, 4-ジクロロ-5-イソプロポキシフェニル)-1, 3, 4-オキサジアゾール-2(3H)-オン、

エチル [2-クロロ-5-[4-クロロ-5-(ジフルオロメトキシ)-1-メチルピラゾール-3-イル]-4-フルオロフェノキシ]アセテート、

イソプロピル 5-(4-ブロモ-1-メチル-5-トリフルオロメチルピラゾール-3-イル)-2-クロロ-4-フルオロベンゾエート、

1-[4-クロロ-3-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシメチル)フェニル]-5-フェニル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド、

2-(2-クロロベンジル)-4, 4-ジメチルイソオキサゾリジン-3-オン、

5-シクロプロピル-4-[2-(メチルスルホニル)-4-(トリフルオロメチル)ベ

40

50

ンゾイル] イソオキサゾール、  
 S, S'-ジメチル 2-(ジフルオロメチル)-4-イソブチル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3, 5-ジカルボチオエート、  
 メチル 2-(ジフルオロメチル)-5-(4, 5-ジヒドロ-1, 3-チアゾール-2-イル)-4-イソブチル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-カルボキシレート、  
 2-クロロ-6-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イルチオ)安息香酸およびその塩、  
 メチル 2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-6-[1-(メトキシイミノ)エチル]ベンゾエート、  
 2, 6-ビス(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)安息香酸およびその塩、  
 5-ブロモ-3-sec-ブチル-6-メチルピリミジン-2, 4(1H, 3H)-ジオン、  
 3-t-ブチル-5-クロロ-6-メチルピリミジン-2, 4(1H, 3H)-ジオン、  
 3-シクロヘキシル-1, 5, 6, 7-テトラヒドロシクロペンタピリミジン-2, 4(3H)-ジオン、  
 イソプロピル 2-クロロ-5-[1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-3-メチル-2, 6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]ベンゾエート、  
 3-[1-(3, 5-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル]-3, 4-ジヒドロ-6-メチル-5-フェニル-2H-1, 3-オキサジン-4-オン、  
 1-メチル-4-イソプロピル-2-[(2-メチルフェニル)メトキシ]-7-オキサビシクロ[2.2.1]ヘプタン、  
 N-(4-クロロフェニル)-3, 4, 5, 6-テトラヒドロフタルイミド、  
 ペンチル [2-クロロ-4-フルオロ-5-(1, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1, 3-ジオキソ-2H-イソインドール-2-イル)フェノキシ]アセテート、  
 2-[7-フルオロ-3, 4-ジヒドロ-3-オキソ-4-(2-プロピニル)-2H-1, 4-ベンゾオキサジン-6-イル]-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-1H-イソインドール-1, 3(2H)-ジオン、  
 エチル 2-クロロ-3-[2-クロロ-5-(1, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1, 3-ジオキソ-2H-イソインドール-2-イル)フェニル]アクリレート、  
 2-[2, 4-ジクロロ-5-(2-プロピニルオキシ)フェニル]-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1, 2, 4-トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-3(2H)-オン、  
 メチル [[2-クロロ-4-フルオロ-5-[(テトラヒドロ-3-オキソ-1H, 3H-[1, 3, 4]チアジアゾロ[3, 4-a]ピリダジン-1-イリデン)アミノ]フェニル]チオ]アセテート、  
 N-(2, 6-ジフルオロフェニル)-5-メチル[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-2-スルホンアミド、  
 N-(2, 6-ジクロロ-3-メチルフェニル)-5, 7-ジメトキシ[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-2-スルホンアミド、  
 メチル 3-クロロ-2-(5-エトキシ-7-フルオロ[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-c]ピリミジン-2-イルスルホニルアミノ)ベンゾエート、  
 2, 3-ジヒドロ-3, 3-ジメチルベンゾフラン-5-イル エタンスルホネート 2-エトキシ-2, 3-ジヒドロ-3, 3-ジメチルベンゾフラン-5-イル メタンスルホネート、  
 3-イソプロピル-1H-2, 1, 3-ベンゾチアジアジン-4(3H)-オン 2, 2-ジオキシド、等。

【0091】

【実施例】

次に本発明の実施例を挙げて本発明をさらに具体的に説明するが、本発明はその要旨を越

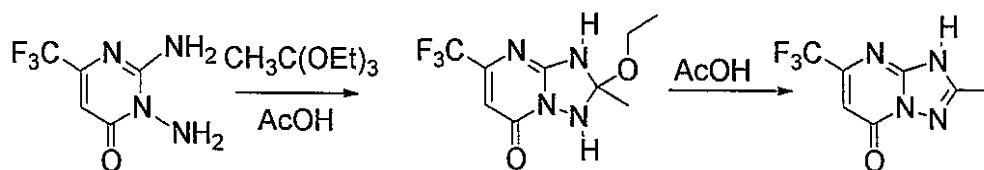
えない限り、以下の実施例に限定されるものではない。

#### 実施例 1

2-メチル-5-(トリフルオロメチル)-3H-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-オン

【0092】

【化15】



10

【0093】

25 mL のフラスコに 2,3-ジアミノ-6-(トリフルオロメチル)-3H-ピリミジン-4-オン (1.00 g)、オルト酢酸トリエチル (4 mL) 及び、酢酸 (7 mL) を添加して、1 時間加熱攪拌した後、室温に冷却し一晩放置した。反応混合物を減圧濃縮し、得られた粗生成物を酢酸エチルに溶解させて飽和重曹水、ついで飽和食塩水で洗浄した。得られた有機相を飽和硫酸ナトリウムで乾燥し、濾化後濃縮した。得られた粗結晶を濾別し、酢酸エチルで洗浄することによって、中間体である 2-エトキシ-2-メチル-5-トリフルオロメチル-2,3-ジヒドロ-1H-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-オン (0.30 g) を得た。得られた濾液を濃縮し、酢酸 (10 mL) を添加して、更に 10 時間加熱攪拌した。室温まで冷却して一晩放置後に、析出した結晶を濾別した。得られた結晶をヘキサンで洗浄後、乾燥させることによって標記化合物 (表-1、No. 1-2) を 0.29 g 得た。

20

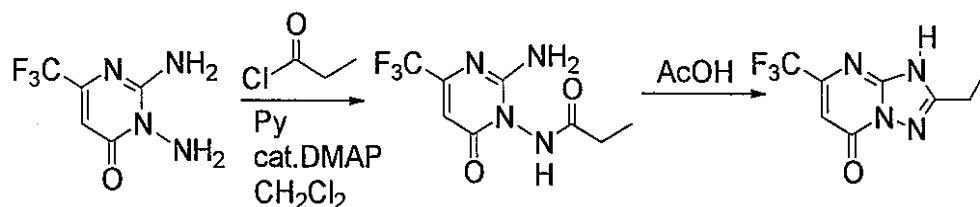
【0094】

#### 実施例 2

2-エチル-5-(トリフルオロメチル)-3H-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-オン

【0095】

【化16】



30

【0096】

50 mL のフラスコに 2,3-ジアミノ-6-(トリフルオロメチル)-3H-ピリミジン-4-オン (1.00 g)、ピリジン (0.49 g)、4,4-ジメチルアミノピリジン<DMAP> (0.06 g) の塩化メチレン (10 mL) 溶液に、攪拌下、塩化プロピオン (0.62 g) を滴下して室温で 6 時間攪拌させて 1 日放置した。反応混合物に 1 N 塩酸と酢酸エチルを添加して析出した結晶を濾別し、得られた結晶をヘキサンで洗浄し減圧乾燥することによって、中間体である N-[2-アミノ-6-オキソ-4-(トリフルオロメチル)-6H-ピリミジン-6-イル]プロピオンアミドを 0.90 g 得た。

40

【0097】

25 mL のフラスコに N-[2-アミノ-6-オキソ-4-(トリフルオロメチル)-6

50

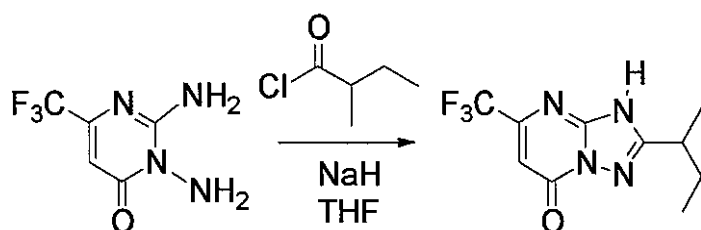
H-ピリミジン-6-イル] プロピオンアミド (0.50 g)、酢酸 (5 mL) を添加して環流下2日間かけて計24時間攪拌させた。反応混合物を濃縮後、酢酸エチルで再結晶を行って表記化合物 (表-1、No. 1-3) を0.11 g得た。

#### 実施例 3

2-(1-メチルプロピル)-5-(トリフルオロメチル)-3H-[1,2,4] トリアゾロ [1,5-a] ピリミジン-7-オン

【0098】

【化17】



10

【0099】

2,3-ジアミノ-6-(トリフルオロメチル)-3H-ピリミジン-4-オン (0.75 g) の THF (10 mL) 溶液に水素化ナトリウム (60% in mineral oil, 0.62 g) をゆっくり添加して室温にて30分攪拌させた。そこに、塩化 DL-2-メチルブチリル (1.16 g) を滴下して (激しく発熱、発泡)、2時間攪拌した。反応混合物に1N塩酸と酢酸エチルを添加した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過後濃縮した。得られた結晶を酢酸エチル、ヘキサンで洗浄後、濾別し、得られた結晶を乾燥させることによって、表記化合物 (表-1、No. 1-13) を0.44 g得た。

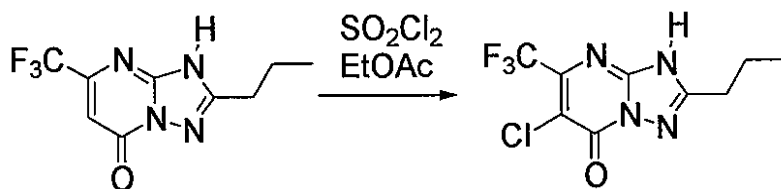
20

#### 実施例 4

6-クロロ-2-プロピル-5-(トリフルオロメチル)-3H-[1,2,4] トリアゾロ [1,5-a] ピリミジン-7-オン

【0100】

【化18】



30

【0101】

2-プロピル-5-(トリフルオロメチル)-3H-[1,2,4] トリアゾロ [1,5-a] ピリミジン-7-オン (0.19 g) の酢酸エチル (15 mL) 溶液に塩化スルフルリル (0.21 g) をゆっくり添加して室温にて1時間攪拌させた。反応混合物減圧濃縮して得られた結晶を酢酸エチル、ヘキサンで洗浄後、濾別し、得られた結晶を乾燥させることによって、標記化合物 (表-1、No. 1-5) を0.13 g得た。

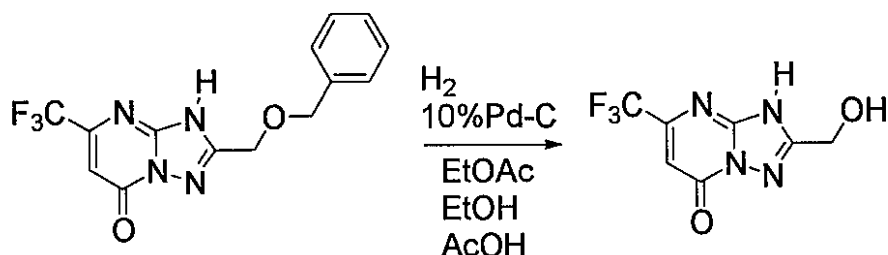
40

#### 実施例 5

2-(ヒドロキシメチル)-5-(トリフルオロメチル)-3H-[1,2,4] トリアゾロ [1,5-a] ピリミジン-7-オン

【0102】

【化19】



## 【0103】

10

100 mL のマーゲンに 2-（ベンジルオキシメチル）-5-（トリフルオロメチル）-3H-[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジン-7-オン（2.00 g）の酢酸エチル（20 mL）、エタノール（20 mL）溶液を添加して、そこに 10% Pd-C（200 mg）を添加し水素気流下室温で 6 時間攪拌させた。反応の進行が遅いので、酢酸（5 mL）を添加して 50 度に昇温し更に 3 時間攪拌させた。反応混合物を濾過して得られた濾液を減圧濃縮した。析出した結晶をエーテル-ヘキサン混合溶媒で懸濁洗浄後濾別し乾燥させることによって標記化合物（表-1、No. 1-30）を 1.28 g 得た。

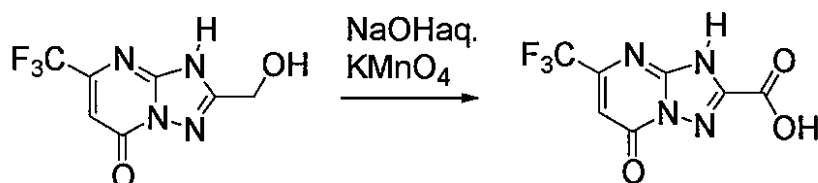
## 実施例 6

7-オキソ-5-（トリフルオロメチル）-3, 7-ジヒドロ-[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジン-2-カルボン酸

20

## 【0104】

## 【化20】



30

## 【0105】

100 mL のフラスコに水酸化ナトリウム水溶液（0.17 g の水酸化ナトリウムを 20 mL の水に溶解させて調整）を添加し、そこに 2-（ヒドロキシメチル）-5-（トリフルオロメチル）-3H-[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジン-7-オン（1.00 g）を添加し溶解させた。混合物を 50 度に昇温し、そこに、過マンガン酸カリウム（2.00 g）をゆっくり添加して、50 度で 3 時間加熱攪拌した。1 mL のエタノールを添加して 30 分攪拌することによって過剰の過マンガン酸カリウムを還元した。反応混合物をセライト濾過し、残渣をアセトンと水で洗浄した。濾液の水相を 10 mL ままで濃縮後、その濃縮液に濃塩酸（1.5 mL）を添加することによって酸性とし、酢酸エチルで 5 回抽出した。得られた有機相を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後濾別し濃縮した。得られた結晶を濾別後、エーテルで洗浄し乾燥させることによって標記化合物（表-1、No. 1-31）を白色結晶として 0.48 g 得た。

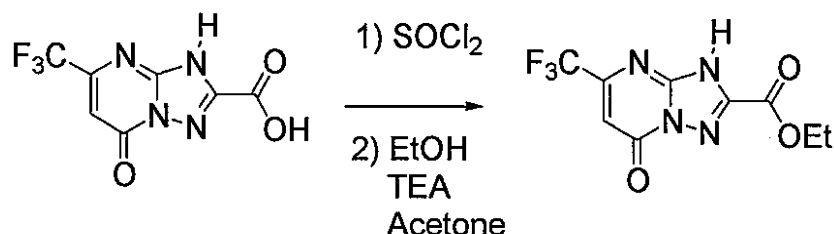
40

## 実施例 7

7-オキソ-5-（トリフルオロメチル）-3, 7-ジヒドロ-[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジン-2-カルボン酸 エチル

## 【0106】

## 【化21】



## 【0107】

25 mL のフラスコに 7-オキソ-5-(トリフルオロメチル)-3,7-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸 (0.30 g) と塩化チオニル (2 mL) を添加して 100 度にて 2 時間加熱攪拌させた。反応混合物にトルエン (4 mL) を添加して 120 度にて過剰の塩化チオニルと共に留去し、減圧乾燥させた。100 L のフラスコにトリエチルアミン (0.20 g) のエタノール (5 mL) 溶液を添加して、そこに先に得た酸クロリドのアセトン (5 mL) 懸濁溶液を 5 分かけてゆっくり滴下した。のち、室温で 30 分攪拌後 1 N 塩酸で処理して酢酸エチルで抽出した。得られた有機相を飽和重曹水で洗浄中に有機相から結晶が析出したのでそれを濾別して得られた結晶を水、アセトン、酢酸エチル、ついでヘキサンで洗浄後乾燥させることによって標記化合物 (表-1、No. 1-32) を白色結晶として 0.19 g 得た。

10

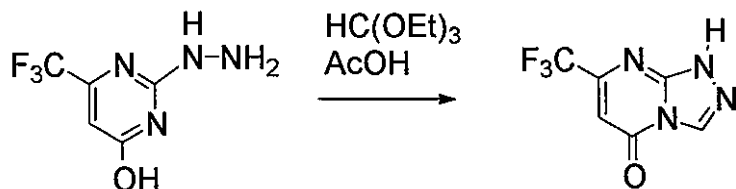
20

## 実施例 8

7-トリフルオロメチル-1H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリミジン-5-オン

## 【0108】

## 【化22】



30

## 【0109】

25 mL のフラスコに 2-ヒドラジノ-4-ヒドロキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン (0.19 g)、オルトギ酸トリエチル (2 mL)、酢酸 (4 mL) を添加して、6 時間加熱攪拌した。TLC にて新たなスポットを確認した後に、反応混合物を減圧濃縮し、得られた結晶にクロロホルムを添加して、結晶を濾別した。得られた結晶を乾燥させることによって、標記化合物 (表-1、No. 2-1) を白色結晶として 0.070 g 得た。

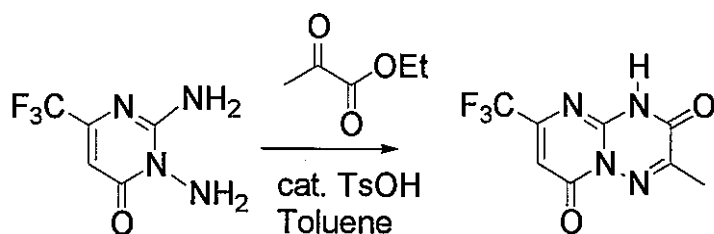
## 実施例 9

2-メチル-6-トリフルオロメチル-4H-ピリミド[1,2-b][1,2,4]トリアジン-3,8-ジオン

40

## 【0110】

## 【化23】



## 【0111】

10

2, 3-ジアミノ-6-トリフルオロメチル-3H-ピリミジン-4-オン (0.50 g)、ピルビン酸エチル (0.45 g)、トシル酸 (0.050 g) のトルエン (10 mL) 溶液を、加熱還流下8時間攪拌させた (一度、均一に溶解した後に結晶が析出してくる)。TLCで原料の消失を確認した後に、空冷し、析出した結晶を濾別して酢酸エチルで洗浄することによって標記化合物 (表-1、No. 3-1) を白色結晶として0.34 g得た。

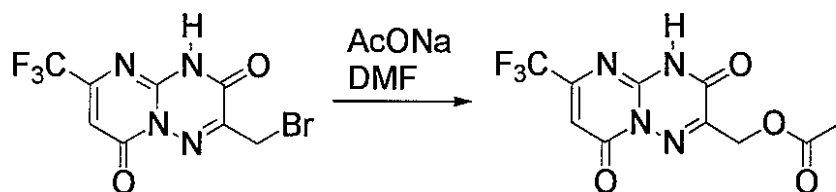
## 実施例10

酢酸 3, 8-ジオキソ-6-トリフルオロメチル-4, 8-ジヒドロ-3H-ピリミド [1, 2-b] [1, 2, 4] トリアジン-2-イルメチル

## 【0112】

20

## 【化24】



## 【0113】

30

2-ブロモメチル-6-トリフルオロメチル-4H-ピリミド [1, 2-b] [1, 2, 4] トリアジン-3, 8-ジオン (0.30 g)、酢酸ナトリウム (0.17 g) のDMF (5 mL) 溶液を、加熱下8時間攪拌させた。TLCで原料の消失を確認した後に、空冷し、1N塩酸を添加して酢酸エチルで抽出した。得られた有機相を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮することによって得られた結晶 (0.25 g) を、更にエーテルで懸濁洗浄後濾別し乾燥させることによって標記化合物 (表-1、No. 3-6) を白色結晶として0.16 g得た。

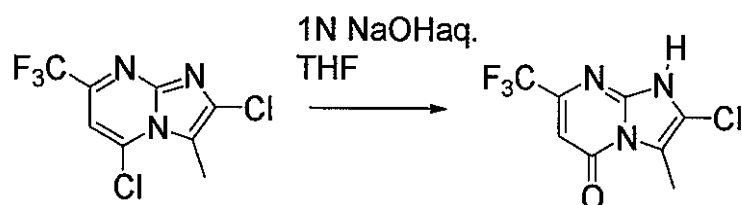
## 実施例11

2-クロロ-3-メチル-7-トリフルオロメチル-1H-イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン-5-オン

## 【0114】

40

## 【化25】



50

## 【0115】

100 mL のフラスコに 2, 5-ジクロロ-3-メチル-7-トリフルオロメチル-1H-イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン-5-オン (3.00 g)、THF (15 mL) を添加して、攪拌下 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 (15 mL) を滴下して室温で 1 時間攪拌させた。原料が残っていたので、更に 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 (15 mL) を滴下して室温で 1 時間攪拌させた。反応混合物に 1 N 塩酸 (40 mL) を添加して反応を終了させて、酢酸エチルで抽出した。得られた有機相を飽和食塩水で洗浄後無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後、減圧濃縮した。得られた粗結晶を少量の酢酸エチルとヘキサンで懸洗後、濾別して乾燥させることによって、標記化合物 (表-1、No. 4-1) を白色結晶として 2.32 g 得た。

10

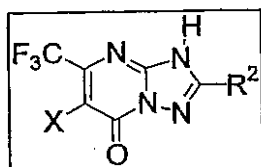
## 実施例 12

実施例 1～11 記載のいずれかの製法と同様にして、表-1 に記載の化合物を合成した。その物性データを表-2 に示す。

## 【0116】

## 【表 1】

表-1



| 化合物No. | R <sup>2</sup>                                     | X  |
|--------|----------------------------------------------------|----|
| 1-1    | H                                                  | H  |
| 1-2    | CH <sub>3</sub>                                    | H  |
| 1-3    | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | H  |
| 1-4    | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                      | H  |
| 1-5    | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                      | Cl |
| 1-6    | <i>i</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>            | H  |
| 1-7    | <i>o</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>            | H  |
| 1-8    | <i>o</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>            | Cl |
| 1-9    | C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | H  |
| 1-10   | <i>t</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>            | H  |
| 1-11   | <i>o</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>            | H  |
| 1-12   | <i>iso</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>          | H  |
| 1-13   | <i>sec</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>          | H  |
| 1-14   | C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>                     | H  |
| 1-15   | <i>o</i> -C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>           | H  |
| 1-16   | -CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | H  |
| 1-17   | -CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>   | H  |
| 1-18   | C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>                     | H  |
| 1-19   | <i>o</i> -C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>           | H  |
| 1-20   | C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>                     | H  |
| 1-21   | CF <sub>3</sub>                                    | H  |
| 1-22   | -(CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> H                 | H  |
| 1-23   | -(CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> H                 | Cl |
| 1-24   | -(CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> H                 | Br |
| 1-25   | -(CF <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> H                 | H  |
| 1-26   | -C(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | H  |
| 1-27   | -CH <sub>2</sub> Ph                                | H  |
| 1-28   | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Ph                | H  |
| 1-29   | -CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Ph               | H  |
| 1-30   | -CH <sub>2</sub> OH                                | H  |
| 1-31   | -CO <sub>2</sub> H                                 | H  |
| 1-32   | -CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | H  |
| 1-33   | 4-Cl-Ph                                            | H  |
| 1-34   | 2-CF <sub>3</sub> -Ph                              | H  |

10

20

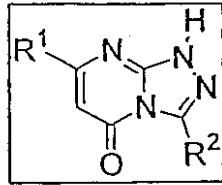
30

40

【 0 1 1 7 】

【 表 2 】

表一1(続き)



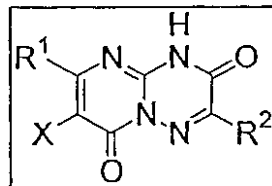
| 化合物No. | R <sup>2</sup>  | X |
|--------|-----------------|---|
| 2-1    | H               | H |
| 2-2    | CH <sub>3</sub> | H |

10

【0118】

【表3】

表一1(続き)



| 化合物No. | R <sup>2</sup>                                                    | X |
|--------|-------------------------------------------------------------------|---|
| 3-1    | CH <sub>3</sub>                                                   | H |
| 3-2    | <i>i</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                           | H |
| 3-3    | CF <sub>3</sub>                                                   | H |
| 3-4    | CH <sub>2</sub> Br                                                | H |
| 3-5    | CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | H |
| 3-6    | CH(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | H |
| 3-7    | CH <sub>2</sub> O(C=O)CH <sub>3</sub>                             | H |

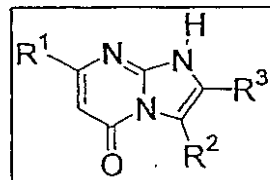
20

30

【0119】

【表4】

表一1(続き)



| 化合物No. | R <sup>2</sup>                          | R <sup>3</sup> | X |
|--------|-----------------------------------------|----------------|---|
| 4-1    | CH <sub>3</sub>                         | Cl             | H |
| 4-2    | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>           | Cl             | H |
| 4-3    | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>           | Cl             | H |
| 4-4    | <i>i</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | Cl             | H |
| 4-5    | Ph                                      | Cl             | H |

40

【0120】

50

【表 5】

表-2 物性表

| 化合物No. | 物性(熔点)                  | <sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ:                                                                                                 |
|--------|-------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 1-1    | 固体<br>(274.5 - 275.8°C) | 6.36 (1H, s), 8.82 (1H, s).                                                                                                                  |
| 1-2    | 固体<br>(>300°C)          | 2.41 (3H, s), 6.42 (1H, s).                                                                                                                  |
| 1-3    | 固体<br>(304.2 - 304.3°C) | 1.49 (3H, t, J = 7.6 Hz), 3.02 (2H, d, J = 7.6 Hz), 6.65 (1H, s).                                                                            |
| 1-4    | 固体<br>(262.6 - 263.1°C) | 1.10 (3H, t, J = 7.6 Hz), 1.90 (2H, tq, J = 7.6, 7.6 Hz), 2.92 (2H, t, J = 7.6 Hz), 6.60 (1H, s).                                            |
| 1-5    | 固体<br>(326.1 - 328.8°C) | 0.96 (3H, t, J = 7.6 Hz), 1.76 (2H, tq, J = 7.6, 7.6 Hz), 2.79 (2H, t, J = 7.6 Hz).                                                          |
| 1-6    | 固体<br>(269.2 - 269.3°C) | 1.54 (6H, d, J = 6.8 Hz), 3.35, (1H, sep, J = 6.8 Hz), 6.67 (1H, s).                                                                         |
| 1-7    | 固体<br>(302.9 - 303.9°C) | 1.05 - 1.09 (2H, m), 1.15 - 1.20 (2H, m), 2.10 - 2.17 (1H, m), 6.43 (1H, s).                                                                 |
| 1-8    | 固体<br>(>300°C)          | 1.03 - 1.08 (4H, m), 2.01 - 2.20 (1H, m).                                                                                                    |
| 1-9    | 固体<br>(156.9 - 157.4°C) | 0.91 (3H, t, J = 7.2 Hz), 1.34 (2H, tq, J = 7.2, 7.2 Hz), 1.68 (2H, tt, J = 7.6, 7.2 Hz), 2.63 (2H, t, J = 7.6 Hz), 5.84 (1H, s).            |
| 1-10   | 固体<br>(328.8 - 328.9°C) | 1.39 (9H, s), 6.48 (1H, s).                                                                                                                  |
| 1-11   | 固体<br>(308.1 - 309.0°C) | 1.91 - 1.98 (1H, m), 2.03 - 2.16 (1H, m), 2.35 - 2.42 (4H, m), 3.72 (1H, qui, J = 1.2, 8.4 Hz).                                              |
| 1-12   | 固体<br>(181.0 - 181.1°C) | 0.97 (6H, d, J = 6.4 Hz), 2.05 - 2.20 (1H, m), 2.68 (2H, d, J = 7.6 Hz), 6.45 (1H, s).                                                       |
| 1-13   | 固体<br>(176.1 - 177.8°C) | 0.88 (3H, t, J = 7.2 Hz), 1.31 (3H, d, J = 7.2 Hz), 1.62 - 1.82 (2H, m), 2.91 - 3.00 (1H, m).                                                |
| 1-14   | 固体<br>(231.7 - 231.8°C) | 0.88 (3H, t, J = 7.2 Hz), 1.30 - 1.36 (4H, m), 1.70 - 1.79 (2H, m), 2.80 (2H, t, J = 7.6 Hz).                                                |
| 1-15   | 固体<br>(260.0 - 261.2°C) | 1.63 - 1.92 (6H, m), 2.03 - 2.11 (2H, m), 3.27 (1H, qui, J = 8.0 Hz), 6.44 (1H, s).                                                          |
| 1-16   | 固体<br>(121.1 - 123.8°C) | 0.89 (3H, t, J = 7.2 Hz), 1.25 - 1.32 (2H, m), 1.31 (3H, d, J = 6.8 Hz), 1.53 - 1.65 (1H, m), 1.69 - 1.78 (1H, m), 3.00 - 3.06 (1H, m), 6.47 |
| 1-17   | 固体<br>(221.2 - 223.0°C) | 0.77 (6H, t, J = 7.6 Hz), 1.58 - 1.75 (4H, m), 2.50 - 2.57 (1H, m), 5.84 (1H, s).                                                            |
| 1-18   | 固体<br>(219.9 - 222.6°C) | 0.87 (3H, t, J = 7.2 Hz), 1.25 - 1.40 (6H, m), 1.73 (2H, tt, J = 7.2, 7.2 Hz), 2.80 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.47 (1H, s).                       |

10

20

30

【0 1 2 1】

【表 6】

表一2 物性表(続き)

| 化合物No. | 物性(融点)                  | <sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ:                                                                                       |
|--------|-------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 1-19   | 固体<br>(257.8 - 258.2°C) | 1.23 - 1.44 (3H, m), 1.51 - 1.61 (2H, m), 1.66 - 1.73 (1H, m), 1.75 - 7.83 (2H, m), 2.87 (1H, tt, J = 3.6, 11.2 Hz), 6.46 (1H, s). |
| 1-20   | 固体<br>(199.6 - 200.0°C) | 0.86 (3H, t, J = 7.2 Hz), 1.23 - 1.38 (10H, m), 1.74 (2H, tt, J = 7.6, 7.6 Hz), 2.79 (2H, t, J = 7.6 Hz), 6.46 (1H, s).            |
| 1-21   | 固体<br>(160.9 - 161.3°C) | 6.02 (1H, s), 9.73 (1H, br).                                                                                                       |
| 1-22   | 固体<br>(97.4 - 99.2°C)   | 5.83 (1H, s), 6.69 (1H, tt, J = 51.6, 5.6 Hz).                                                                                     |
| 1-23   | 無定型固体                   | 6.72 (1H, tt, J = 51.6, 5.6 Hz).                                                                                                   |
| 1-24   | 無定型固体                   | 6.96 (1H, tt, J = 51.6, 5.6 Hz).                                                                                                   |
| 1-25   | 固体<br>(181.9 - 184.6°C) | 6.09 (1H, s), 7.11 (1H, tt, J = 50.4, 5.6 Hz).                                                                                     |
| 1-26   | 無定型固体                   | 1.93 (3H, s), 6.00 (1H, s).                                                                                                        |
| 1-27   | 固体<br>(257.4 - 257.5°C) | 4.21 (2H, s), 6.46 (1H, s), 7.25 - 7.38 (5H, m).                                                                                   |
| 1-28   | 固体<br>(289.0 - 290.7°C) | 3.05 - 3.17 (4H, m), 6.47 (1H, s), 7.19 - 7.35 (5H, m).                                                                            |
| 1-29   | 固体<br>(202.9 - 203.0°C) | 4.62 (2H, s), 4.74 (2H, s), 6.45 (1H, s), 7.30 - 7.40 (5H, m).                                                                     |
| 1-30   | 固体<br>(229.0 - 230.8°C) | 1.91 (1H, s), 4.67 (2H, s), 6.47 (1H, s).                                                                                          |
| 1-31   | 固体<br>(237.3 - 239.5°C) | 6.31 (1H, s).                                                                                                                      |
| 1-32   | 固体<br>(>350°C)          | 1.34 (3H, t, J = 7.6 Hz), 4.35 (2H, q, J = 7.6 Hz), 5.99 (1H, s).                                                                  |
| 1-33   | 固体<br>(292.0 - 294.0°C) | 6.00 (1H, s), 7.43 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.94 (2H, d, J = 8.4 Hz).                                                                  |
| 1-34   | 固体<br>(278.3 - 278.4°C) | 6.20 (1H, s), 7.78 - 7.92 (3H, m), 8.21 (1H, d, J = 7.6 Hz).                                                                       |
| 2-1    | 固体<br>(185.4 - 187.2°C) | 6.18 (1H, s), 9.11 (1H, s).                                                                                                        |
| 2-2    | 固体<br>(>300°C)          | 6.29 (1H, sr), 2.84 (3H, s).                                                                                                       |

10

20

30

【0122】

【表7】

表-2 物性表(続き)

| 化合物No. | 物性(融点)                  | <sup>1</sup> H-NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ:                                                                          |
|--------|-------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 3-1    | 固体<br>(292.2 - 293.3°C) | 2.32 (3H, s), 6.72 (1H, s).                                                                                           |
| 3-2    | 固体<br>(292.2 - 293.3°C) | 1.22 (6H, d, J = 6.8 Hz), 3.26 (1H, sep, J = 6.8 Hz), 6.72 (1H, s).                                                   |
| 3-3    | 固体<br>(>350°C)          | 6.20 (1H, s)                                                                                                          |
| 3-4    | 固体<br>(250°C dec.)      | 4.59 (2H, s), 6.76 (1H, s)                                                                                            |
| 3-5    | 固体<br>(146.2 - 147.5°C) | 1.16 (3H, t, J = 7.2 Hz), 1.43 (3H, d, J = 7.2 Hz), 4.04 (1H, q, J = 7.2 Hz), 4.11 (2H, q, J = 7.2 Hz), 6.75 (1H, s). |
| 3-6    | 固体<br>(226.1 - 227.5°C) | 1.33 (3H, t, J = 7.2 Hz), 4.41 (2H, q, J = 7.2 Hz), 6.79 (1H, s).                                                     |
| 3-7    | 固体<br>(220.9 - 221.7°C) | 2.12 (3H, s), 5.16 (2H, s), 6.72 (1H, s).                                                                             |
| 4-1    | 固体<br>(246.1 - 247.8°C) | 2.73 (3H, s), 6.35 (1H, s).                                                                                           |
| 4-2    | 固体<br>(218.7 - 219.8°C) | 1.31 (3H, t, J = 7.6 Hz), 3.15 (2H, q, J = 7.6 Hz), 6.39 (1H, s).                                                     |
| 4-3    | 固体<br>(185.9 - 187.5°C) | 0.89 (3H, t, J = 7.2 Hz), 1.65 (2H, tq, J = 7.2, 7.2 Hz), 2.97 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.18 (1H, s).                     |
| 4-4    | 固体<br>(205.0 - 206.5°C) | 1.44 (6H, d, J = 6.8 Hz), 4.23 (1H, br), 6.37 (1H, s).                                                                |
| 4-5    | 固体<br>(239.0 - 240.4°C) | 3.05 - 3.17 (4H, m), 6.47 (1H, s), 7.19 - 7.35 (5H, m).                                                               |

10

20

30

40

50

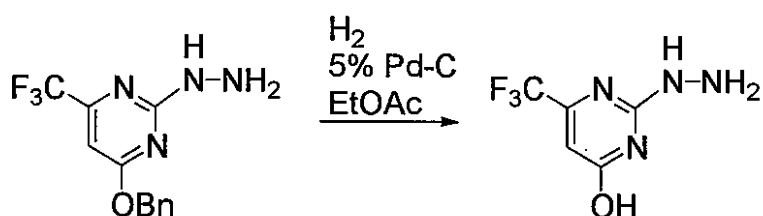
実施例 8 の原料である 7-トリフルオロメチル-1H-[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリミジン-5-オンは下記参考例 1-3 の方法で合成した。

## 参考例 1

2-ヒドラジノ-4-ヒドロキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン

【0123】

【化26】



【0124】

50 mL のマージンに 4-ベンジルオキシ-2-ヒドラジノ-6-トリフルオロメチルピリミジン (1.00 g)、酢酸エチル (12 mL)、そして 5% Pd-C (0.050 g) を添加し、水素気流下室温で 7 時間攪拌した。TLC にて原料の消失を確認した後に、反応混合物を濾過し、残渣を酢酸エチル、THF、アセトンで洗浄した。濾液を濃縮して標記化合物を 0.54 g 得た。

【0125】

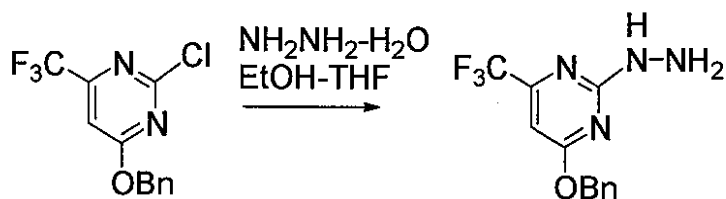
<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ: 5.96 (1H, s), 9.34 (1H, s).

## 参考例 2

4-ベンジルオキシ-2-ヒドラジノ-6-トリフルオロメチルピリミジン

【0126】

【化27】



10

【0127】

300 mLのフラスコに4-ベンジルオキシ-2-クロロ-6-トリフルオロメチルピリミジン (4.53 g)、エタノール (50 mL)、THF (50 mL)の混合物にヒドラジン水和物 (0.94 g) をゆっくり添加して室温で1時間攪拌した。TLCにて目的物の生成を確認して、反応混合物を減圧濃縮した。濃縮残渣に酢酸エチルと水を添加して、有機層を飽和食塩水で洗浄して、無水硫酸ナトリウムで乾燥させて濾過後減圧濃縮した。得られた粗生成物を濃縮後山善のGR400 (自動カラムクロマトグラフィー装置、カラム37×150 mm、流量20 mL/min, 展開溶媒/ヘキサン: 酢酸エチル 25%—Gradient—> 35%で精製して標記化合物を3.00 g得た。

20

【0128】

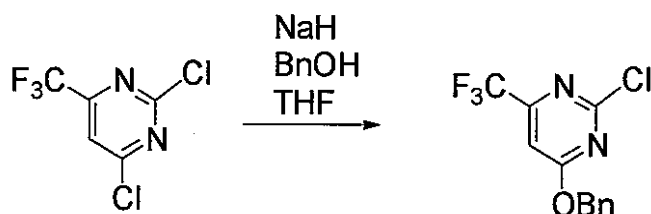
$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 3.97 (2H, br), 5.40 (2H, s), 6.39 (1H, s), 6.46 (1H, s), 7.33 – 7.42 (5H, m).

参考例3

4-ベンジルオキシ-2-クロロ-6-トリフルオロメチルピリミジン

【0129】

【化28】



30

【0130】

200 mLのフラスコにベンジルアルコール (6.76 g)、THF (60 mL)を添加して0℃に冷却した。その混合物に水素化ナトリウム (60% in mineral oil, 1.33 g) をゆっくり添加して室温で1時間攪拌した。

40

300 mLの4口フラスコに2,4-ジクロロ-6-トリフルオロメチルピリミジン (6.00 g)、THF (60 mL)を添加して2℃に冷却した。そこに先に調整したベンジルアルコールのナトリウム塩のTHF溶液をを内温2–5℃に保ちながら10分かけてゆっくり添加した。後に0℃で30分、室温で1時間攪拌した。TLCにて目的物の生成を確認して、飽和塩化ナトリウム水溶液を添加後、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄して、無水硫酸ナトリウムで乾燥させて濾過後減圧濃縮した。得られた粗生成物を濃縮後山善のGR400 (自動カラムクロマトグラフィー装置、カラム50×150 mm、流量20 mL/min, 展開溶媒/ヘキサン: 酢酸エチル 2%—Gradient—> 5%で精製して標記化合物を4.95 g得た。

【0131】

50

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 5.50 (2H, s), 7.03 (1H, s), 6.46 (1H, s), 7.36 – 7.47 (5H, m).

実施例 11 の原料である 2, 5-ジクロロ-3-メチル-7-トリフルオロメチル-1H-イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン-5-オンは下記参考例 4 の方法で合成した。

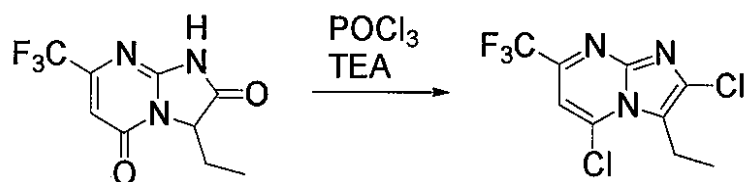
参考例 4

2, 5-ジクロロ-3-エチル-7-トリフルオロメチル-1H-イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン-5-オン

【0132】

【化29】

10



【0133】

100 mL のフラスコに 3-エチル-7-トリフルオロメチル-1H-イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン-2, 5-ジオン (2.30 g)、オキシ塩化リン (12.5 mL) を仕込み、攪拌下トリエチルアミン (0.94 g) を滴下して、バス温度 100 度で 9 時間加熱攪拌した。室温まで冷却後、反応混合物を 125 mL の氷水にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄後無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後、減圧濃縮した。得られた粗結晶をエーテルで懸洗後、濾別して乾燥させることによって、標記化合物を 1.22 g 得た。

m. p. 106.8 – 107.5 °C

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.31 (3H, t,  $J = 7.6$  Hz), 3.15 (2H, q,  $J = 7.6$  Hz), 6.39 (1H, s).

30

参考例 4 と同様の方法で、下記化合物を得た。分析値を記す。

2, 5-ジクロロ-3-メチル-7-トリフルオロメチル-1H-イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン-5-オン

m. p. 177.0 – 178.0 °C

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 2.90 (3H, s), 7.24 (1H, s).

2, 5-ジクロロ-3-プロピル-7-トリフルオロメチル-1H-イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン-5-オン

m. p. 68.6 – 69.9 °C

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.04 (3H, t,  $J = 7.6$  Hz), 1.76 (2H, tq,  $J = 7.6, 7.6$  Hz), 3.25 (2H, t,  $J = 7.6$  Hz), 7.28 (1H, s). 2, 5-ジクロロ-3-イソプロピル-7-トリフルオロメチル-1H-イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン-5-オン

40

m. p. 90.6 – 90.7 °C

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 1.54 (6H, d,  $J = 7.2$  Hz), 4.39 (1H, br), 7.26 (1H, s).

2, 5-ジクロロ-3-フェニル-7-トリフルオロメチル-1H-イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン-5-オン

m. p. 239.0 – 240.4 °C

50

<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ: 5.68 (1H, s), 6.58 (1H, s), 7.28 – 7.30 (2H, m), 7.42 – 7.46 (3H, m).

なお、参考例4の原料である3-エチル-7-トリフルオロメチル-1H-イミダゾ[1,2-a]ピリミジン-2,5-ジオンやその類縁体の合成法は、例えばJP2000/264888号公報に記載されている。

#### 【0134】

次に、本発明化合物の製剤例を示す。なお、以下に「部」、「%」とあるのは、それぞれ「重量部」、「重量%」を意味する。

#### 製剤例 1 水和剤

表-1 記載の双環性ピリミジノン誘導体 40部、カープレックス#80 (商標名、塩野義製薬社) 20部、カオリンクレ (商標名、土屋カオリン社) 35部、および高級アルコール硫酸エステル系界面活性剤ソルポール8070 (商標名、東邦化学社) 5部を配合した後、均一に混合粉碎して、有効成分 40%を含有する水和剤を得た。

#### 【0135】

#### 製剤例 2 乳剤

表-1 記載の双環性ピリミジノン誘導体 5部を芳香族炭化水素系溶剤ソルベッソー200 (商標名、エクソン化学社) 45部および N, N-ジメチルアセトアミド 40部からなる混合溶媒に溶解させた後、これにポリオキシエチレン系界面活性剤ソルポール3005X (商標名、東邦化学社) 10部を加えて溶解させ、有効成分 5%を含有する乳剤を得た。

#### 【0136】

#### 製剤例 3 乳剤

表-1 記載の双環性ピリミジノン誘導体 10部を芳香族炭化水素系溶剤ソルベッソー200 (商標名、エクソン化学社) 40部および N, N-ジメチルアセトアミド 40部からなる混合溶媒に溶解させた後、これにポリオキシエチレン系界面活性剤ソルポール3005X (商標名、東邦化学社) 10部を加えて溶解させ、有効成分 10%を含有する乳剤を得た。

#### 【0137】

#### 製剤例 4 フロアブル剤

表-1 記載の双環性ピリミジノン誘導体 10部にルノックス1000C (商標名、東邦化学社) 5部、カープレックス#80D (商標名、塩野義製薬社) 3部、エチレングリコール 8部、および水 54部を加えて混合分散させた。このスラリー状混合物をダイノームル (商標名、WAB社) で湿式粉碎した後、別にあらかじめ混合溶解しておいたキサンタンガム 1%水溶液 20部を加えて均一に混合し、有効成分 10%を含有するフロアブル剤を得た。

#### 【0138】

#### 製剤例 5 粒剤

表-1 記載の双環性ピリミジノン誘導体 1部、クレ (日本タルク社製) 43部、ベントナイト (豊順洋行社製) 55部、およびサクシネート系界面活性剤エヤロールCT-1 (商標名、東邦化学社) 1部を配合し、混合粉碎した後、水 20部を加えて混和した。更にこれ押し出し造粒機を用いて直径 0.6mm の穴から押し出し、60℃で2時間乾燥した後、1 – 2mm の長さに切断して、有効成分 1%を含有する粒剤を得た。

#### 【0139】

次に、本発明の除草剤の試験例を示す。

#### 試験例1：畑地茎葉処理試験

面積200cm<sup>2</sup>の樹脂製バットに洪積性埴壌土の畑土壌を充填し、施肥後、イヌビエ、セイヨウカラシナ及びマルバアサガオを播種し、均一に覆土を行った。その後、温室で栽培管理を続け、供試雑草の生育葉令が1.0～2.0葉期に達した時、製剤例1により得

10

20

30

40

50

た双環性ピリミジノン誘導体を有効成分とする水和剤を水で希釈調整し、有効成分量の処理薬量が1アール当たり10gとなるように所定量を小型動力加圧噴霧器で均一に噴霧処理した。その後、温室内で栽培管理を続け、薬剤処理後21日目に除草効果について調査を行った。その結果を表-3に示した（表-3の化合物No. は表-1の化合物No. に対応する。）。

【0140】

なお、除草効果の評価は、下記式によって求め、下記の基準による除草効果係数で表した。以下、表-3の試験結果の記載は本係数にて記載する。

【0141】

【式1】

10

$$\left(1 - \frac{\text{処理区における雑草の地上部生体重}}{\text{無処理区における雑草の地上部生体重}}\right) \times 100 = Y(\%)$$

【0142】

【表8】

20

| 除草効果係数 | Y(%)     |
|--------|----------|
| 0      | 0 ~ 5    |
| 1      | 6 ~ 30   |
| 2      | 31 ~ 50  |
| 3      | 51 ~ 70  |
| 4      | 71 ~ 90  |
| 5      | 91 ~ 100 |

【0143】

【表9】

30

表 3 畑地茎葉処理試験結果

| 供試化合物<br>No. | 有効成分<br>g/a | 除草効果 |         |         |
|--------------|-------------|------|---------|---------|
|              |             | イヌビエ | セイウカラシナ | マルバアサガオ |
| 1-2          | 10          | 4    | 5       | 5       |
| 1-3          | 10          | 3    | 4       | 5       |
| 1-7          | 10          | 4    | 5       | 5       |
| 1-8          | 10          | 2    | 5       | 5       |
| 1-9          | 10          | 3    | 5       | 5       |
| 1-21         | 10          | 4    | 5       | 5       |
| 1-22         | 10          | 3    | 5       | 5       |
| 1-24         | 10          | 3    | 5       | 5       |
| 2-1          | 10          | 3    | 4       | 3       |
| 2-2          | 10          | 4    | 3       | 5       |
| 3-1          | 10          | 3    | 5       | 5       |
| 3-2          | 10          | 4    | 5       | 5       |
| 4-1          | 10          | 4    | 5       | 5       |

40

50

【0144】

【発明の効果】

本発明によれば、高い除草効果を示し、かつ、重要作物に対して十分な安全性を示す除草剤として有用な化合物を得ることが出来る。

---

フロントページの続き

Fターム(参考) 4H011 AB01 BB09 DA02 DA15 DA16 DD03