世界知的所有権機関
国際事務局

PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類 6
C07D 239/26, A01N 43/54

A1

(11) 国際公開番号 WO 95/04725

(43) 国際公開日 1995年2月16日 (16.02.1995)

(21) 国際出願番号 PCT/JP94/01311
(22) 国際出願日 1994年8月9日(09. 08. 94)

(30) 優先権データ
特願平5/198328 1993年8月10日(10. 08. 93) JP
特願平5/273392 1993年11月1日(01. 11. 93) JP
特願平6/174575 1994年7月26日(26. 07. 94) JP

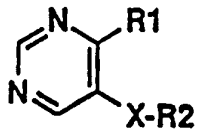
(71) 出願人(米国を除くすべての指定国について)
日産化学工業株式会社
(NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.)〔JP/JP〕
〒101 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1 Tokyo, (JP)
(72) 発明者;および
(75) 発明者/出願人(米国についてのみ)
佐藤 純(SATOW, Jun)〔JP/JP〕
近藤康夫(KONDO, Yasuo)〔JP/JP〕
工藤佳宏(KUDO, Yoshihiro)〔JP/JP〕
三ケ島 巧(MIKASHIMA, Takumi)〔JP/JP〕
〒274 千葉県船橋市坪井町722番地1
日産化学工業株式会社 中央研究所内 Chiba, (JP)
縄巻 勤(NAWAMAKI, Tsutomu)〔JP/JP〕
伊藤洋一(ITO, Yoichi)〔JP/JP〕
須藤和久(SUDO, Kazuhisa)〔JP/JP〕
中平国光(NAKAHIRA, Kunimitsu)〔JP/JP〕
渡辺重臣(WATANABE, Shigeomi)〔JP/JP〕
石川公広(ISHIKAWA, Kimihiro)〔JP/JP〕
〒349-02 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470
日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama, (JP)
(74) 代理人
弁理士 山本量三, 外(YAMAMOTO, Ryozo et al.)
〒101 東京都千代田区神田東松下町38番地 鳥本鋼業ビル
Tokyo, (JP)

(81) 指定国
AU, BG, BR, CA, CN, CZ, HU, KR, RU, SI, SK, UA, US, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).

添付公開書類 国際調査報告書

(54) Title : NOVEL PYRIMIDINE DERIVATIVE, HERBICIDE AND PLANT GROWTH REGULATOR

(54) 発明の名称 新規ピリミジン誘導体及び除草、植調剤



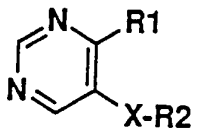
(I)

(57) Abstract

A novel pyrimidine derivative represented by general formula (I), wherein R1 represents C_1-C_6 haloalkyl, C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 cycloalkyl, etc.; R2 represents hydrogen, C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 cycloalkyl, etc.; X represents carbonyl or -C(R3)OH; and R3 represents hydrogen, C_1-C_6 alkyl, etc.

（５７）要約

式(I):



(I)

〔式中、R1はC_1-C_6ハロアルキル基、C_1-C_6アルキル基、C_3-C_6シクロアルキル基等を表し、R2は水素原子、C_1-C_6アルキル基、C_3-C_6シクロアルキル基等を表し、Xはカルボニル基または-C(R3)OH基(但し、R3は水素原子、C_1-C_6アルキル基等を表す。〕で表される新規ピリミジン誘導体。

情報としての用途のみ

ＰＣＴに基づいて公開される国際出願をパンフレット第一頁にＰＣＴ加盟国を同定するために使用されるコード

AM	アルメニア	DK	デンマーク	LI	リヒテンシュタイン	PT	ポルトガル
AT	オーストリア	EE	エストニア	LK	スリランカ	RO	ルーマニア
AU	オーストラリア	ES	スペイン	LR	リベリア	RU	ロシア連邦
BB	バルバドス	FI	フィンランド	LT	リトアニア	SD	スーダン
BE	ベルギー	FR	フランス	LU	ルクセンブルグ	SE	スウェーデン
BF	ブルギナ・ファソ	GA	ガボン	LV	ラトヴィア	SI	スロヴェニア
BG	ブルガリア	GB	イギリス	MC	モナコ	SK	スロヴァキア共和国
BJ	ベナン	GE	グルジア	MD	モルドバ	SN	セネガル
BR	ブラジル	GN	ギニア	MG	マダガスカル	SZ	スワジランド
BY	ベラルーシ	GR	ギリシャ	ML	マリ	TD	チャード
CA	カナダ	HU	ハンガリー	MN	モンゴル	TG	トーゴ
CF	中央アフリカ共和国	IE	アイルランド	MR	モーリタニア	TJ	タジキスタン
CG	コンゴー	IT	イタリー	MW	マラウイ	TT	トリニダード・トバゴ
CH	スイス	JP	日本	MX	メキシコ	UA	ウクライナ
CI	コート・ジボアール	KE	ケニア	NE	ニジェール	UG	ウガンダ
CM	カメルーン	KG	キルギスタン	NL	オランダ	US	米国
CN	中国	KP	朝鮮民主主義人民共和国	NO	ノルウェー	UZ	ウズベキスタン共和国
CZ	チェッコ共和国	KR	大韓民国	NZ	ニュー・ジーランド	VN	ヴィェトナム
DE	ドイツ	KZ	カザフスタン	PL	ポーランド		

明細書

新規ピリミジン誘導体及び除草、植調剤

技術分野

本発明は新規なピリミジン誘導体および該誘導体を有効成分として含有する除草剤及び植物成長調節剤に関するものである。また該誘導体は医･農薬の中間体としても有用である。

背景技術

ピリミジン環の2,6位に水素原子を持ち、4,6位に特定の置換基を導入した本願発明の化合物群が除草、植調作用を示すことは、従来全く知られていない。またこれらの化学構造は、ジャーナル･オブ･ヘテロサイクリック･ケミストリー(Journal of Heterocyclic Chemistry)20巻(1983年)649頁の文献に記載された3点の化合物、4-メチル-5-アセチルピリミジン、4-tert-ブチル-5-tert-ブチルカルボニルピリミジン、4-フェニル-5-ベンゾイルピリミジンが知られているのみである。

従来から、重要作物、例えばイネ、大豆、小麦、トウモロコシ、ワタ、ビート等を雑草から守り、これらの重要作物の生産性を高める為に多くの除草剤が実用化されてきた。これらの剤は、適用場面によって、畑作用、水田用、非耕地用の3つに大別することができる。さらに、各々の中で、薬の施用方法によって土壌混和処理型、発芽前土壌処理型、発芽後処理(茎葉処理)型等に分類することができる。

近年、世界的な人口増加に伴い、重要作物の生産性が各国の食糧経済に影響を与えることは明らかである。これらの変化に伴い、従来の農業形態が21世紀に向けて変化することは必至である。現に、農業従事者にとって、作物栽培時に障害となる雑草を経済的、かつ効率良く枯殺あるいは防除できる除草剤の開発は、以前に比べて増々必要となっている。

このような除草剤として以下のような条件を備えた薬剤の開発が切望されている。

低薬量で高い除草効果を有するもの(特に環境保護の観点からできるだけ低薬量散布によって雑草を枯殺することが必要である。)、適度な残効性を有するもの(近年、土壌残留の長い薬物が後作へ被害を与えることが問題となっており、散布後、適度な残効性を示すことが重要である。)、散布後、速やかに雑草を枯殺するもの(薬剤処理後、短い期間で次の作物の播種、移植が可能である。)、薬剤処理回数が少いもの(農業従事者にとって繁雑な雑草防除作業の回数をできるだけ少くすることは重要である。)、雑草防除対象が広範なもの(広葉雑草、イネ科雑草、多年生雑草など性質の異った雑草種に対して、1つの薬剤で、これらを防除できる薬剤が望ましい。)、施用方法が多いもの(土壌処理効果、茎葉処理効果などを併せ持つことにより、より強力な除草効果が得られる。)、作物に対して問題となる薬害を示さないもの(作物と雑草が混在するような耕地に於いて選択的に雑草だけを枯殺できるものが好ましい。)が望ましい。しかしながら、既存の除草剤はこれらの条件を全て満たしているものではない。

また、農業従事者にとって、作物栽培時に障害となる病害、害虫は優れた殺菌剤、殺虫剤によって効率良く防除される。しかしこれら有害生物以外の要因によって収量、品質等の低下を来す場合がある。例えばオオムギ、ライムギ、コムギ、イネ、トウモロコシ、大豆、棉などが収穫期に風や雨によって倒伏する場合である。これを防ぐのに最も安全かつ効率良い方法の一つに、これら作物の倒伏防止を図る為に節間伸長を抑制し、収量に全く影響を与えない矮化剤の開発が以前に比べて増々必要となっている。このような矮化剤として以下のような条件を備えた薬剤の開発が切望されている。

低薬量で高い矮化作用を有するもの(特に環境保護の観点から、できるだけ少量散布によって矮化作用を示すことが必要である。)、適度な残効性を有するもの(散布後、土壌残留が少いことが大切である。)、散布後、穏やかに作用を発現するもの(急激な作用発現は望ましくない。)、薬剤処理は基本的に1回が好ましい(農業従事者にとって繁雑な作業の回数を少くすることは重要である。)、施用方法が多いもの(土壌処理、茎葉処理、種子処理等を併せ持つことにより、作物に対して

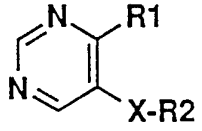
適切な施用法を選ぶことができる。)、植物の茎葉成長を抑制することにより、栄養分を茎葉部分よりも花あるいは実に回す事(収穫増につながる。)が望ましい。更に根に対して成育抑制効果が少ないものが良い。

一方、芝生の成長抑制、果樹類の徒長枝の抑制、観賞用植物の矮化による商品価値の向上、生垣の生育抑制、開花時期の調節などにも使用できることが望ましい。近年、非耕地などで雑草を全て枯殺すると、土壌の流亡を引き起こすため、草丈を抑制し、枯らさないようにすることが必要になってきている。

発明の開示

本発明者らは、このような状況に鑑み、新規ピリミジン誘導体の除草作用、および植物成長調節作用について鋭意検討した結果、下記式で示されるピリミジン誘導体が優れた除草作用および植物成長調節作用を有することを見い出し本発明を完成するにに至った。

即ち、本発明は、式(I):



(I)

〔式中、R1はC_1-C_6ハロアルキル基、C_1-C_6アルキル基、C_3-C_6シクロアルキル基、C_3-C_6ハロシクロアルキル基または任意に置換されていても良いフェニル基(但し、置換基はハロゲン原子、C_1-C_4アルキル基、C_1-C_4アルコキシ基、C_1-C_3ハロアルキル基、C_1-C_3ハロアルコキシ基またはフェニル基から選択される。)を表し、R2は水素原子、C_1-C_6アルキル基、C_3-C_6シクロアルキル基、C_3-C_6シクロアルキル(C_1-C_4)アルキル基、C_1-C_6ハロアルキル基、C_3-C_6ハロシクロアルキル基、C_3-C_8アルケニル基、C_3-C_8アルキニル基、C_1-C_2スルホニル(C_1-C_4)アルキル基、C_1-C_4アルキルチオ(C_3-C_6)シクロアルキル基、任意に置換されていても良いフェニル基(但し、置換基はハロゲン原子、C_1-C_4ア

ルキル基、C_1-C_4アルコキシ基、C_1-C_3ハロアルキル基、C_1-C_3ハロアルコキシ基またはフェニル基から選択される。)を表し、Xはカルボニル基または-C(R3)OH基(但し、R3は水素原子、C_1-C_6アルキル基、C_3-C_8アルケニル基、C_3-C_8アルキニル基または任意に置換されていても良いフェニル基(但し、置換基はハロゲン原子、C_1-C_4アルキル基、C_1-C_4アルコキシ基、C_1-C_3ハロアルキル基、C_1-C_3ハロアルコキシ基またはフェニル基から選択される。)を表す。(但し、炭素原子が光学活性炭素の場合は、ラセミ体及び単離されたそれぞれの2種の光学異性体の双方を包含する。)〕で表される新規ピリミジン誘導体(以下本発明化合物と称する。)及びそれらを有効成分として含有することを特徴とする除草剤及び植物成長調節剤である。

本発明化合物のあるものは畑地、非耕地用除草剤として、土壌処理、茎葉処理のいずれの処理方法に於いても、イヌホウズキ(Solanum nigrum)、チョウセンアサガオ(Datura stramonium)等に代表されるナス科(Solanaceae)雑草、イチビ(Abutilon theophrasti)、アメリカキンゴジカ(Sida spinosa)等に代表されるアオイ科(Malvaceae)雑草、マルバアサガオ(Ipomoea purpurea)等のアサガオ類(Ipomoea spps.)やヒルガオ類(Calystegia spps.)等に代表されるヒルガオ科(Convolvulaceae)雑草、イヌビユ(Amaranthus lividus)、アオビユ(Amaranthus retroflexus)等に代表されるヒユ科(Amaranthaceae)雑草、オナモミ(Xanthium pensylvanicum)、ブタクサ(Ambrosia artemisiaefolia)、ヒマワリ(Helianthus annuus)、ハキダメギク(Galinsoga ciliata)、セイヨウトゲアザミ(Cirsium arvense)、ノボロギク(Senecio vulgaris)、ヒメジョン(Erigeron annus)等に代表されるキク科(Compositae)雑草、イヌガラシ(Rorippa indica)、ノハラガラシ(Sinapis arvensis)、ナズナ(Capsella Bursapastoris)等に代表されるアブラナ科(Cruciferae)雑草、イヌタデ(Polygonum Blumei)、ソバカズラ(Polygonum convolvulus)等に代表されるタデ科(Polygonaceae)雑草、スベリヒユ(Portulaca oleracea)等に代表されるスベリヒユ科(Portulacaceae)雑草、シロザ(Chenopodium album)、コアカザ(Chenopodium ficifolium)、ホウキギ(Kochia

scoparia) 等に代表されるアカザ科(Chenopodiaceae)雑草、ハコベ(Stellaria media)等に代表されるナデシコ科(Caryophyllaceae)雑草、オオイヌノフグリ(Veronica persica) 等に代表されるゴマノハグサ科(Scrophulariaceae) 雑草、ツユクサ(Commelina communis) 等に代表されるツユクサ科(Commelinaceae)雑草、ホトケノザ(Lamium amplexicaule)、ヒメオドリコソウ(Lamium purpureum) 等に代表されるシソ科(Labiatae) 雑草、コニシキソウ(Euphorbia supina) 、オオニシキソウ(Euphorbia maculata) 等に代表されるトウダイグサ科(Euphorbiaceae) 雑草、ヤエムグラ(Galium spurium)、アカネ(Rubia akane)等に代表されるアカネ科(Rubiaceae) 雑草、スミレ(Viola mandshurica)等に代表されるスミレ科(Violaceae)雑草、アメリカツノクサネム(Sesbania exaltata)、エビスグサ(Cassia obtusifolia) 等に代表されるマメ科(Leguminosae)雑草等の広葉雑草(Broad-leaved weeds)

野生ソルガム(Sorgham bicolor)、オオクサキビ(Panicum dichotomiflorum)、ジョンソングラス(Sorghum halepense)、イヌビエ(Echinochloa crus-galli var. crus-galli)、ヒメイヌビエ(Echinochloa crus-galli var. praticola)、栽培ビエ(Echinochloa utilis)、メヒシバ(Digitaria adscendens)、カラスムギ(Avena fatua)、オヒシバ(Eleusine indica)、エノコログサ(Setaria viridis)、スズメノテッポウ(Alopecurus aegualis)等に代表されるイネ科雑草(Graminaceous weeds)、ハマスゲ(Cyperus rotundus, Cyperus esculentus) 等に代表されるカヤツリグサ科雑草(Cyperaceous weeds)等の各種畑地雑草(Cropland weeds) に低薬量で高い殺草力を有する。

又、水田用除草剤として湛水下の土壌処理及び茎葉処理のいずれの処理方法に於いても、ヘラオモダカ(Alisma canaliculatum)、オモダカ(Sagittaria trifolia)、ウリカワ(Sagittaria pygmaea) 等に代表されるオモダカ科(Alismataceae)雑草、タマガヤツリ(Cyperus difformis)、ミズガヤツリ(Cyperus serotinus)、ホタルイ(Scirpus juncoides)、クログワイ(Eleocharis kuroguwai)等に代表されるカヤツリグサ科(Cyperaceae) 雑草、アゼナ(Lindemia pyxidaria)等に代表されるゴマノハ

グサ科(Scrothulariaceae)雑草、コナギ(Monochoria vaginalis)等に代表されるミズアオイ科(Potenderiaceae)雑草、ヒルムシロ(Potamogeton distinctus)等に代表されるヒルムシロ科(Potamogetonaceae)雑草、キカシグサ(Rotala indica)等に代表されるミソハギ科(Lythraceae)雑草、タイヌビエ(Echinochloa oryzicola)、ヒメタイヌビエ(Echinochloa crus-galli var. formosensis)、イヌビエ(Echinochloa crus-galli var. crus-galli)雑草等、各種、水田雑草(Paddy weeds)に低薬量で高い殺草力を有する。

そして、重要作物であるイネ、コムギ、オオムギ、ソルゴー、落花生、トウモロコシ、大豆、棉、ビート等に対して高い安全性を有することを見いだした。

また本発明化合物のあるものは畑地、水田、非耕地用の植物成長調節剤として、土壌処理、茎葉処理、種子処理のいずれの処理方法においても、イヌホウズキ、チョウセンアサガオ、イチビ、アメリカキンゴジカ、マルバアサガオ、イヌビユ、アオビユ、オナモミ、ブタクサ、ヒマワリ、ハキダメギク、セイヨウトゲアザミ、ノボロギク、ヒメジョン、イヌガラシ、ノハラガラシ、ナズナ、イヌタデ、ソバカズラ、スベリヒユ、シロザ、コアカザ、ホウキギ、ハコベ、オオイヌノフグリ、ツユクサ、ホトケノザ、ヒメオドリコソウ、コニシキソウ、オオニシキソウ、ヤエムグラ、アカネ、スミレ、アメリカツノクサネム、エビスグサ、コセンダングサ等の広葉雑草、野生ソルガム、オオクサキビ、ジョンソングラス、イヌビエ、ブラックグラス、メヒシバ、カラスムギ、オヒシバ、エノコログサ、スズメノテッポウ等のイネ科雑草、ハマスゲ等のカヤツリグサ科雑草、ヘラオモダカ、オモダカ、ウリカワ、タマガヤツリ、ミズガヤツリ、ホタルイ、クログワイ、アゼナ、コナギ、ヒルムシロ、キカシグサ、タイヌビエ等の各種水田雑草の成長抑制、伸長抑制に使用でき、土壌侵食を招くこれら植物の枯死を伴うことなしに成長を抑制できる。

作物としてイネ、コムギ、オオムギ、ライムギ、トウモロコシ、ダイズ、ピーナッツ、ワタ、ヒマワリ、ビート、ジャガイモ、ナタネ、サトウキビ等の倒伏防止、伸長抑制、茎の強化、茎の肥大化、徒長防止、茎の短縮化、節間短縮な

どに使用でき、結果として作物の増収を助長したり、不良環境および病害虫に対する抵抗性の増大が期待できる。また芝生の成長抑制に使用でき、観賞用植物、室内用植物、庭園植物または温室植物を小型化するのに有用である。

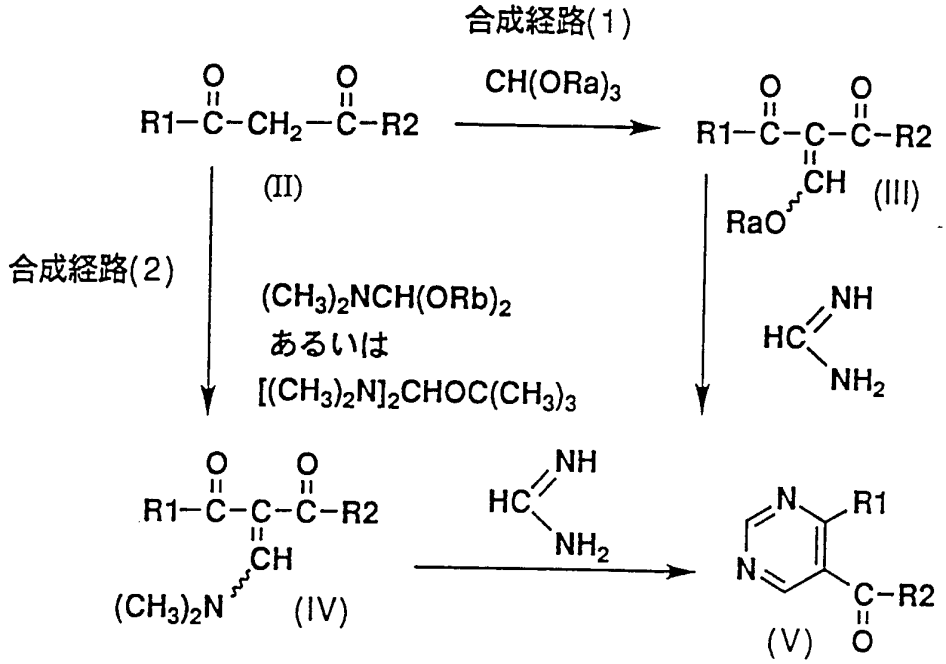
さらに木本植物の成長及び着花を抑制するために使用することができる。例えば生け垣の形を整えたり、果樹(例えばリンゴ、西洋ナシ、サクランボ、モモ、ブドウ、ナシ等)を形作るため、あるいは剪定の必要性を減少させるために使用できる。また開花時期の調節や、分枝の調節あるいは頂端優勢を破壊して腋芽の発達を促進させることが出来る。

近年、スギ、ヒノキ類の花粉が都市部の住民にアレルギーを引き起こすスギ花粉症が社会問題となっている。本剤を試用することにより原因となるスギ、ヒノキ類の発花形成及び着花を抑制、制御することができる。また低濃度で発芽前の植物種子に処理することにより、発芽を促進することができる。この際、出芽や伸長を抑制することがなく、初期生育促進作用を持つ。

従って、本発明化合物は、畑地、水田、芝生地、果樹園、牧草地その他非耕地の除草剤および植物成長調節剤の有効成分として用いることができる。以下に各製法について詳細に説明する。

本発明化合物は例えばスキーム1~3に示す方法によって合成できる。(スキーム1~3のR1~R3は前記と同様の意味を表し、Ra、RbはそれぞれC_1-C_3アルキル基を表し、MetはMg、Zn等の金属原子を表し、Halはハロゲン原子を表す。)

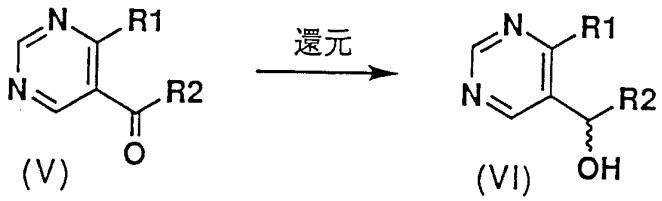
出発物質となる2,4-ジカルボニル化合物(II)は、D.P.N.Satchell, R.S.Satchell著, Saul Patai編のTheChemistry of the Carbonyl Group273頁(Wiley-Interscience出版1966年)、C.R.Hauser, B.E.Hudson, Jr.著のOrganic Reactions (John Wiley & Sons, Inc.出版1942年)第1巻266頁等に記載されている方法に準じて容易に合成できる。



(スキーム1)

(1)スキーム1の合成経路(1)は、2,4-ジカルボニル化合物(II)にオルトギ酸エステル誘導体を反応させて3-アルコキシメチレン-2,4-ジカルボニル誘導体(III)とし、これにホルムアミジン類を反応させ本発明化合物であるピリミジン誘導体(V)(X:C=Oの場合)を製造する方法を表す。

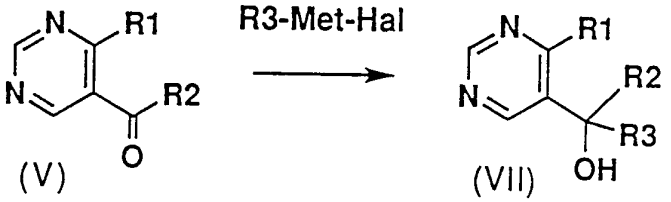
(2)スキーム1の合成経路(2)は、2,4-ジカルボニル化合物(II)にN,N-ジメチルホルムアミドジアルキルアセタール又はtert-ブトキシ-ビス(ジメチルアミノ)メタンを反応させて3-ジメチルアミノメチレン-2,4-ジカルボニル誘導体(IV)とし、これにホルムアミジン類を反応させ本発明化合物であるピリミジン誘導体(V)(X:C=Oの場合)を製造する方法を表す。



(スキーム2)

(3)スキーム2は、ピリミジン誘導体(V)(X:C=Oの場合)を適当な還元方法(例えば$NaBH_4$,BH_3等)あるいは不斉還元によって対応するアルコール(VI)(X:CH-OHの場合)を製造する方法を表す。

得られたアルコール(VI)がラセミ体の場合、必要に応じて、適当な不斉分割手段によって、それぞれの光学活性アルコールを得ることができる。



(スキーム3)

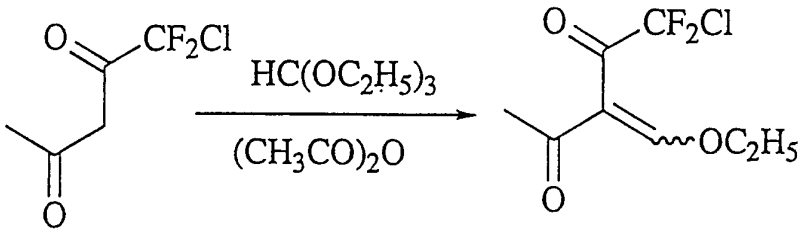
(4)スキーム3は、ピリミジン誘導体(V)をR3-Met-Hal(但し、R3が水素原子である場合を除く)と反応させ化合物(VII)を製造する方法を表す。

以下に本発明化合物および中間体の合成例を実施例として具体的に述べるが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

発明を実施するための最良の形態

〔実施例1〕

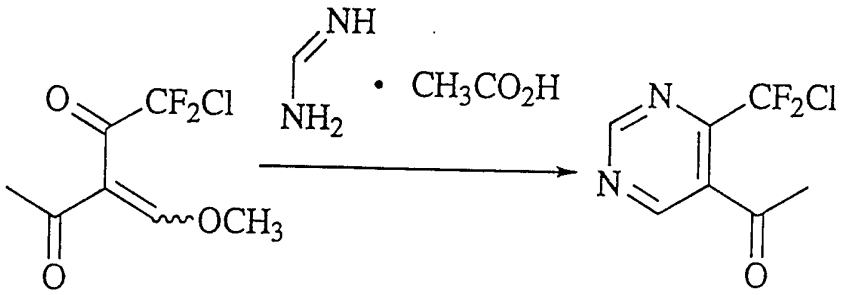
1-クロロ-1,1-ジフルオロ-3-エトキシメチレン-2,4-ペンタンジオン(化合物No.203)の合成



1-クロロ-1,1-ジフルオロ-2,4-ペンタンジオン50g、オルトギ酸エチルエステル60gおよび無水酢酸82gの混合溶液を撹拌しながら2時間還流した。次にジーンスターク装置(水分分離装置)を付けさらに4時間加熱還流しながら、約100mlの水を留去した。放冷後、減圧蒸留し、薄赤色の液体として32.2gの目的物を得た。沸点95-118℃/1.6mmHg。

〔実施例2〕

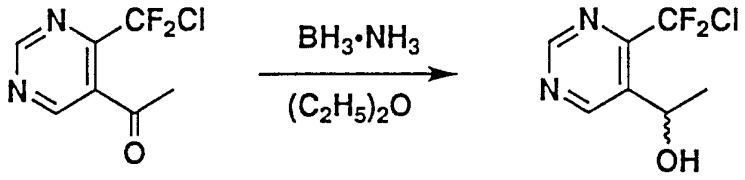
5-アセチル-4-クロロジフルオロメチルピリミジン(化合物No.1)の合成



乾燥エタノール50mlに氷冷下で金属ナトリウム0.9gを加えナトリウムエトキサイドを調製した。この溶液を撹拌しながら、真空ポンプで十分乾燥したホルムアミジン酢酸塩8.4gを加えた。次に1-クロロ-1,1-ジフルオロ-3-エトキシメチレン-2,4-ペンタンジオン8gをエタノール20mlに溶解した溶液を氷冷下で滴下した。滴下終了後、室温に戻した後、反応溶液を1.5時間加熱還流した。反応溶液を放冷し、水を加えエーテル抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣を減圧蒸留し、、カラムクロマトグラフィー(展開溶媒:$CHCl_3$)で精製し目的物2.5gを得た。沸点65-70℃/1.3mmHg, $n_D^{20.7}$1.4787

〔実施例3〕

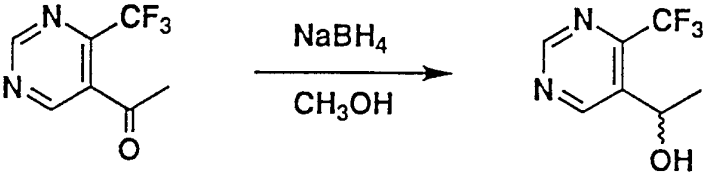
4-クロロジフロロメチル-5-(1-ヒドロキシエチル)ピリミジン(化合物No.101)の合成



5-アセチル-4-クロロジフルオロメチルピリミジン0.4gを乾燥ジエチルエーテル10mlに溶解し、氷冷下でボランアンモニア錯体を過剰量加え、室温で終夜撹拌を続けた。水を加えジエチルエーテルで抽出後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を減圧留去し、粘性液体として0.32gの目的物を得た。$n_D^{19.9}$1.4899

〔実施例4〕

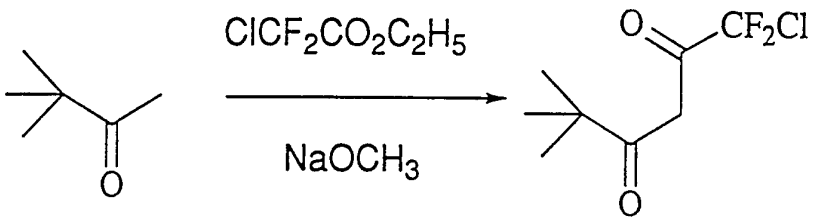
5-(1-ヒドロキシエチル)-4-トリフルオロメチルピリミジン(化合物No.102)の合成



5-アセチル-4-トリフルオロメチルピリミジン0.5gを乾燥メタノール10mlで溶解し、氷冷下で水素化ホウ素ナトリウム0.03gを加え30分撹拌した後、室温で終夜撹拌を続けた。反応終了後、溶媒を減圧留去し、クロロホルム/水の1対1混合溶媒40mlを加え、クロロホルム抽出を行なった。溶媒を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧留去し、カラムクロマトグラフィーで精製し0.2gの目的物を粘性液体として得た。$n_D^{19.9}$1.4549

〔実施例5〕

1-クロロ-1,1-ジフルオロ-5,5-ジメチル-2,4-ヘキサンジオンの合成(化合物No.301)の合成



ドライエーテル100ml中にナトリウムメトキシド7.1gを加え撹拌し、そこへクロロジフルオロ酢酸エチル20gを25mlのドライエーテルで稀釈した溶液を室温にて滴下した。さらにピナコロン12.5gを25mlのドライエーテルで稀釈した溶液を滴下し、室温で一晩撹拌した。次に前記反応溶液へ撹拌しながら氷酢酸8.4gを100mlの水で稀釈した溶液及び酢酸銅(II)23.6gを適量の水を加えて溶解した溶液をそれぞれ順次滴下した。滴下終了後、10分程撹拌してから減圧下でエーテルを留去した後、固体を濾別し、減圧乾燥後、6規定の塩酸100mlを加え、酢酸エチルで抽出した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去し、残渣を減圧蒸留して13gの目的物を得た。 (b.p. 54-57°C/5mmHg)

^{1}H-NMR δ(ppm)〔solvent〕;

1.24 (s, 9H, C(C$\underline{H}_3$)$_3$)

5.95 (s, 1H, enol olefin)

14.00 (br s, 1H, enol O$\underline{H}$)

〔$CDCl_3$〕

^{13}C-NMR δ(ppm)〔solvent〕;

27.2 (s, C(C$\underline{H}_3$)$_3$)

39.3 (s, $\underline{C}$(CH$_3$)$_3$)

90.0 (t, $\underline{J}_{F,C}$ =2Hz, ClCF$_2$C=$\underline{C}$)

120.3 (t, $\underline{J}_{F,C}$ =299Hz, $\underline{C}$F$_2$Cl)

180.3 (t, $\underline{J}_{F,C}$ =30Hz, ClCF$_2\underline{C}$=C)

202.2 (s, $\underline{C}$OC(CH$_3$)$_3$)

〔$CDCl_3$〕

^{19}F-NMR δ(ppm)〔solvent〕;

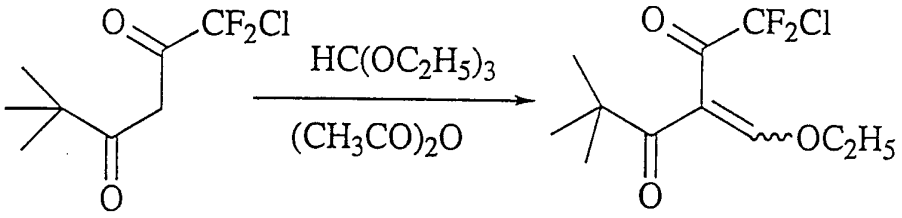
13.3 (s, 2F, $ClCF_2$)

(ref. CF_3CO_2H)

〔$CDCl_3$〕

〔実施例6〕

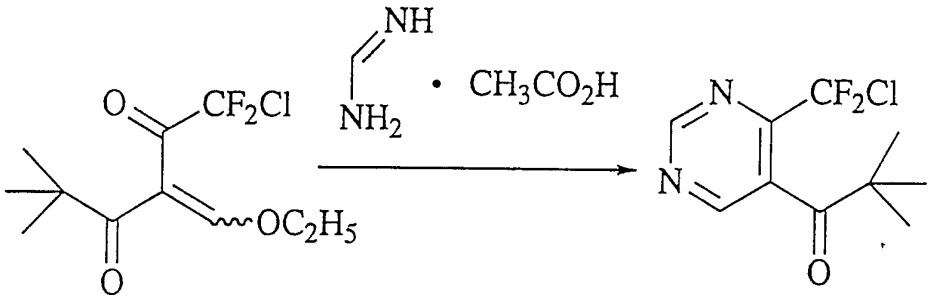
1-クロロ-1,1-ジフルオロ-5,5-ジメチル-3-エトキシメチレン-2,4-ヘキサンジオン(化合物No.204)の合成



無水酢酸50ml中に1-クロロ-1,1-ジフルオロ-5,5-ジメチル-2,4-ヘキサンジオン12.4g、オルトギ酸エチル12.4gを加え、2時間加熱還流した。溶媒を減圧留去後、残渣を減圧蒸留し、6.8gの目的物を得た。(b.p. 105-107°C/2mmHg)

〔実施例7〕

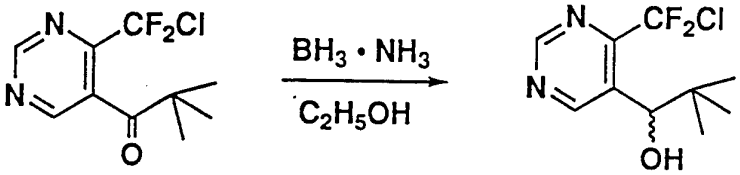
4-クロロジフルオロメチル-5-ピバロイルピリミジン(化合物No.3)の合成



ドライメタノール30ml中にナトリウムメトキシド0.7g、ホルムアミジン酢酸塩1.25gを加え室温で30分撹拌し、1-クロロ-1,1-ジフルオロ-5,5-ジメチル-3-エトキシメチレン-2,4-ヘキサンジオン3gをドライメタノール5mlで稀釈した溶液を滴下し、滴下終了後、2時間加熱還流した。溶媒を減圧留去後、水を加え酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣を薄層クロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン80%、酢酸エチル20%)で精製し、目的物0.6gを得た。$n_D^{20.0}$1.4675

[実施例8]

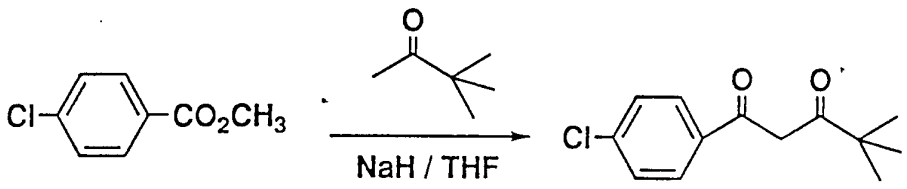
4-クロロジフルオロメチル-5-(2,2-ジメチル-1-ヒドロキシプロピル)ピリミジン(化合物No.103)の合成



エタノール50ml中に4-クロロジフルオロメチル-5-ピバロイルピリミジン1.5gを溶解し、ボランアンモニア錯体1gを加え室温で1時間攪拌した。溶媒を減圧留去した後、水を加え、クロロホルムで抽出を行った。抽出層を水洗し無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残留物を薄層クロマトグラフィー(展開溶媒:クロロホルム/酢酸エチル=7/3)で精製した。粘性液体の目的物1.1gを得た。$n_D^{19.8}$1.4623

[実施例9]

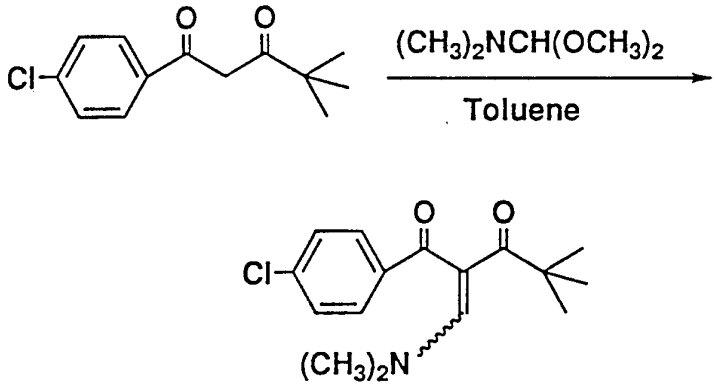
1-(4-クロロフェニル)-4,4-ジメチルペンタン-1,3-ジオン(化合物No.303)の合成



無水THF中に4-クロロ安息香酸メチル30gを溶解し、氷冷下で60%水素化ナトリウム16.9gを加えた。ピナコロン21.1gを滴下し50℃で6時間加熱攪拌を行った。水冷下水100mlを滴下し溶媒を減圧留去した。水200ml、6規定塩酸100mlを加え酢酸エチルで抽出した。抽出層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し(展開溶媒:クロロホルム/ヘキサン=2/8)、粘性液体の目的物43gを得た。 $n_D^{20.0}$1.5012

[実施例10]

1-(4-クロロフェニル)-4,4-ジメチル-2-(N,N-ジメチルアミノメチレン)-1,3-ペンタンジオン(化合物No.206)の合成

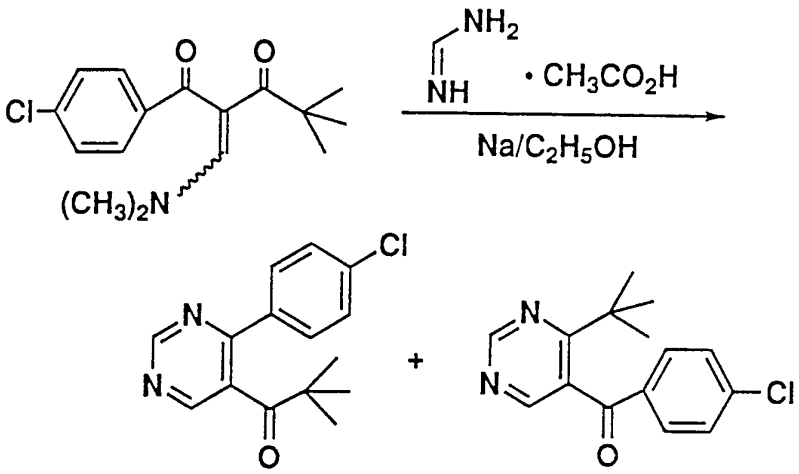


乾燥トルエン200ml中に1-(4-クロロフェニル)-4,4-ジメチル-1,3-ペンタンジオン17g、ジメチルホルムアミドジメチルアセタール18gを加え2時間加熱還流を行い、更に1時間メタノールの留去を行った。溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した(展開溶媒:クロロホルム/ヘキサン=6/4)。淡黄色固体の目的物13.7gを得た。

融点102-104℃

[実施例11]

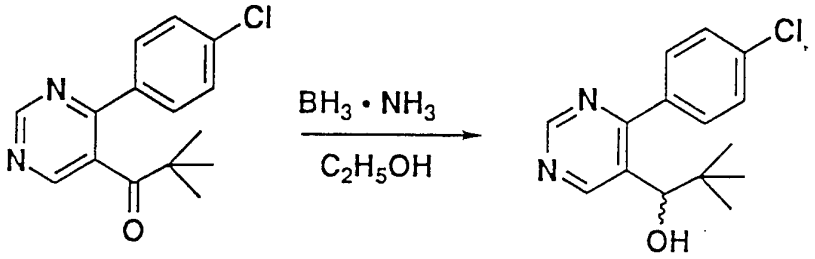
4-(4-クロロフェニル)-5-ピバロイルピリミジン及び4-t-ブチル-5-(4-クロロベンゾイル)ピリミジン(化合物No.5,6)の合成



無水エタノール150ml中に金属ナトリウム1g、ホルムアミジン酢酸塩3.3gを加え室温で15分間攪拌した。1-(4-クロロフェニル)-4,4-ジメチル-2-(N,N-ジメチルアミノメチレン)-1,3-ペンタンジオン8.5gを加え3時間加熱還流を行った。室温で水20ccを加え溶媒を減圧留去し、さらに水を加え酢酸エチルで抽出した。抽出層を水洗し無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残留物はシリカゲルカラムクロマトグラフィーで分離を行い(展開溶媒:酢酸エチル/ヘキサン=3/7)、4-t-ブチル-5-(4-クロロベンゾイル)ピリミジン(収量2.5g、融点75-77℃)、4-(4-クロロフェニル)-5-ピバロイルピリミジン(収量2.4g、$n_D^{20.1}$1.5784)を得た。

[実施例12]

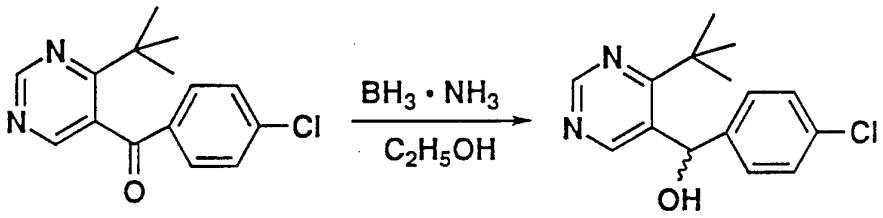
4-(4-クロロフェニル)-5-(2,2-ジメチル-1-ヒドロキシプロピル)ピリミジン(化合物No.104)の合成



エタノール20ml中に4-(4-クロロフェニル)-5-ピバロイルピリミジン1.2gを溶解し、ボランアンモニア錯体1.2gを加え室温で30分撹拌した。溶媒を減圧留去後、水を加え、クロロホルムで抽出を行った。抽出層を水洗し無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し粘性液体の目的物0.8gを得た。 $n_D^{20.2}$1.5575

[実施例13]

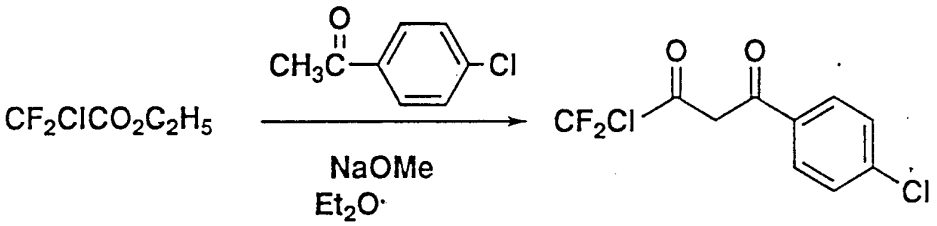
4-t-ブチル-5-〔(4-クロロフェニル)ヒドロキシメチル〕ピリミジン(化合物No.105)の合成



エタノール20ml中に4-t-ブチル-5-(4-クロロベンゾイル)ピリミジン1gを溶解し、ボランアンモニア錯体0.8gを加えた。50°-60℃で1時間加熱し、更に30分加熱還流を行った。溶媒を減圧留去後、水を加え、クロロホルムで抽出を行った。抽出層を水洗し無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し粘性液体の目的物0.6gを得た。 $n_D^{20.2}$1.5474

〔実施例14〕

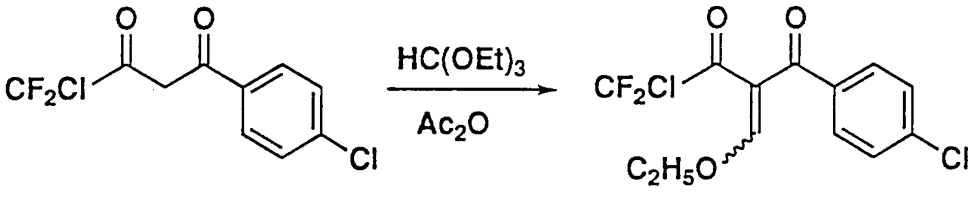
1-クロル-4-(4-クロルフェニル)-1,1-ジフルオロ-2,4-ブタンジオン(化合物No.318)の合成



ナトリウムメトキシド22.7g、乾燥エーテル300ml中にクロジフルオロ酢酸エチル38gを氷冷下で加えた。p-クロロアセトフェノン31gを氷冷下でゆっくり加えた。混合物を12時間室温で攪拌した。溶媒を減圧留去した。6規定塩酸150mlを氷冷下で加え、酢酸エチルで抽出した。抽出層を水洗し、溶媒を減圧留去した。得られた粗物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:クロロホルム)で精製し淡黄色粘性液体の目的物49.5gを得た。mp.50-51℃

〔実施例15〕

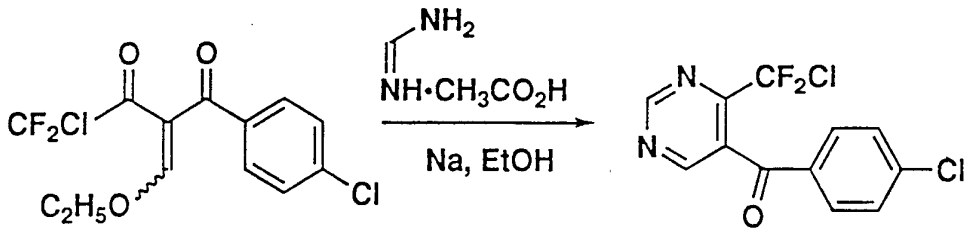
1-クロル-4-(4-クロルフェニル)-1,1-ジフルオロ-3-エトキシメチレン-2,4-ブタンジオンの合成



1-クロル-4-(4-クロロフェニル)-1,1-ジフルオロ-2,4-ブタンジオン49.5g、オルトギ酸エチル41.3g、無水酢酸57gの混合物を4日間加熱還流した。溶媒を減圧留去し、得られた60.4gの粗物をそのまま次の反応に利用した。

〔実施例16〕

5-(4-クロルベンゾイル)-4-クロルジフルオロメチルピリミジン(化合物No.20)の合成

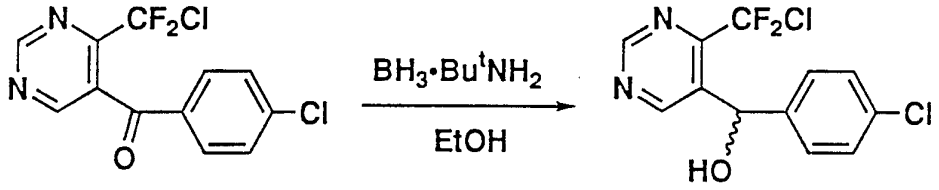


金属ナトリウム6g、乾燥エタノール500mlを混合しナトリウムエトキシド溶液を調製した。ホルムアミジン酢酸塩23.3gを加え、室温で15分攪拌した。1-クロル-4-(4-クロロフェニル)-1,1-ジフルオロ-3-エトキシメチレン-2,4-ブタンジオン(粗物)60.4gを氷冷下でゆっくり加えた。混合物を2時間加熱還流した。溶媒を減圧留去した。氷水300mlを加え酢酸エチルで抽出した。抽出層を水洗し溶媒を減圧留去した。

得られた粗物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:クロロホルム/ヘキサン=1/1)で精製し、淡黄色液状の目的物27gを得た。$n_D^{20.8}$1.5742

〔実施例17〕

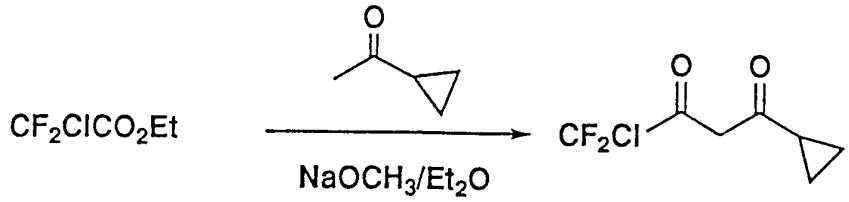
4-クロルジフルオロメチル-5-〔(4-クロルフェニル)ヒドロキシメチル〕ピリミジン(化合物No.119)の合成



5-(4-クロロベンゾイル)-4-クロロジフルオロメチルピリミジン12g、t-ブチルアミンボラン錯体6gをエタノール100ml中に加え、0℃で2時間攪拌した。アセトン20mlを加え、0℃で1時間攪拌した。溶媒を減圧留去し残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:クロロホルム)で精製し、淡黄色粘性液体の目的物11.1gを得た。$n_D^{20.3}$1.5563

〔実施例18〕

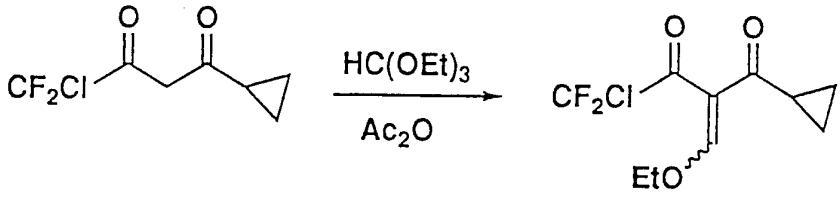
1-クロル-4-シクロヘキシル-1,1-ジフルオロ-2,4-ブタンジオン(化合物No.305)の合成



1リットルのエーテル中にナトリウムメトキシド74.8gを加え、0℃で撹拌しながらエチルクロルジフルオロアセテート200gの300mlエーテル溶液を滴下した。次にシクロプロピルメチルケトン106gの300mlエーテル溶液を前記反応溶液にゆっくり滴下し、滴下終了後、室温で8時間撹拌した。溶媒を減圧留去し、残渣に6規定塩酸300mlを加え酢酸エチルで抽出を行った。抽出層を水洗し溶媒を減圧留去し淡黄色液状の目的物235.9gを得た。$n_D^{20.6}$ 1.4788

〔実施例19〕

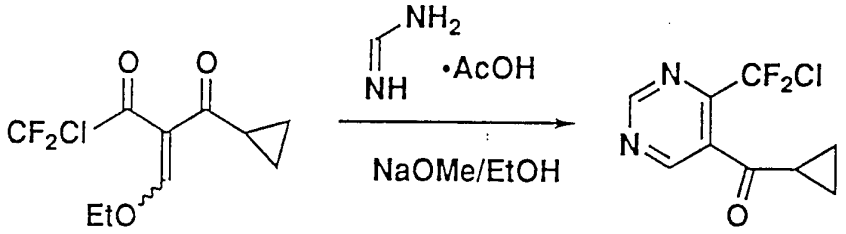
1-クロル-4-シクロヘキシル-3-エトキシメチレン-1,1-ジフルオロ-2,4-ブタンジオン(化合物No.207)の合成



1-クロル-4-シクロヘキシル-1,1-ジフルオロ-2,4-ブタンジオン235.9g、オルトギ酸エチル266.4g、無水酢酸367.2gの混合物を12時間加熱還流した。溶媒を減圧留去し280.3gの目的物(粗物)を得た。これをそのまま次の反応に用いた。一部を更に精製し屈折率を測定した。$n_D^{20.6}$ 1.4787

〔実施例20〕

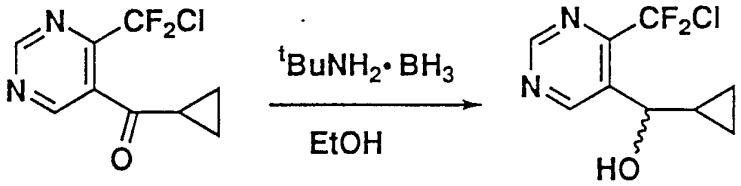
4-クロルジフロルメチル-5-シクロプロピルカルボニルピリミジン(化合物No.7)の合成



1リットルのエタノール中にナトリウムメトキシド71.9gを加え、次にホルムアミジン酢酸塩121.2gを加えた。その混合物に氷冷下、1-クロル-4-シクロヘキシル-3-エトキシメチレン-1,1-ジフルオロ-2,4-ブタンジオン280gをゆっくり滴下した。1時間加熱還流した後、溶媒を減圧留去し、残渣に水500mlを加え酢酸エチルで抽出を行った。抽出層の溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:クロロホルム/ヘキサン=1/1)で精製し、101gの目的物を得た。$n_D^{20.5}$ 1.4998

〔実施例21〕

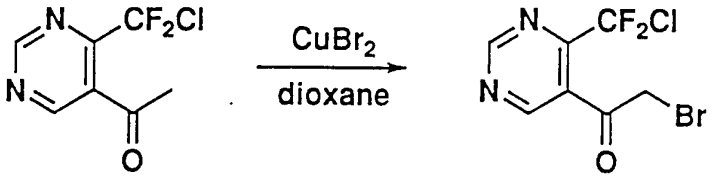
4-クロルジフロルメチル-5-(1-ヒドロキシ-シクロプロピルメチル)ピリミジン(化合物No.106)の合成



エタノール100ml中に4-クロルジフロルメチル-5-シクロプロピルカルボニルピリミジン70gを加え、更に水冷下でt-ブチルアミン・ボラン錯体15gを加え、室温で2時間撹拌した。次にアセトン30mlを加え室温で1時間撹拌した後、溶媒を減圧留去し、残渣に水100mlを加え酢酸エチルで抽出した。抽出層を水洗し、溶媒を減圧留去した。残渣を真空乾燥し45gの目的物を得た。$n_D^{20.5}$ 1.5020

〔実施例22〕

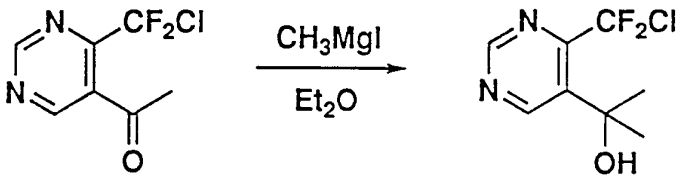
4-クロロジフルオロメチル-5-ブロモアセチルピリミジン(化合物No.11)の合成



5-アセチル-4-クロロジフルオロメチルピリミジン2.0g、臭化第2銅($CuBr_2$) 4.3g、乾燥ジオキサン20mlの混合物を室温で1日撹拌した。さらに還流下、1日撹拌した後、不溶物を口過で除去した。さらに不溶物を少量のクロロホルムで洗浄し、得られた口液を減圧留去した。得られた粗物を分取薄層クロマトグラフィー(展開溶媒:クロロホルム)で精製し640mgの目的物を淡黄色液体として得た。

〔実施例23〕

4-クロロジフルオロメチル-5-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)ピリミジン(化合物No.110)の合成

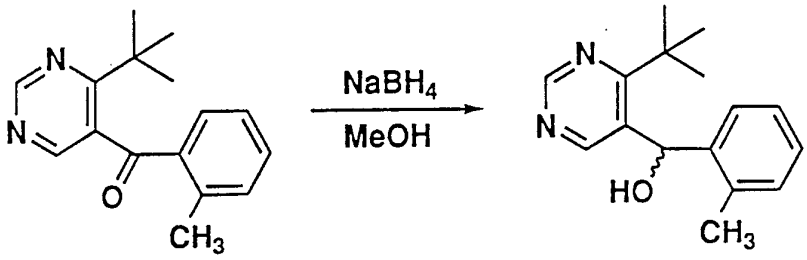


マグネシウム470mg、乾燥エチルエーテル5mlの混合物の中へ、沃化メチル2.76gをあらかじめ乾燥エチルエーテル15mlに溶かした溶液を滴下しながら反応混合物が穏やかに還流するように調節した。滴下後さらに45分間還流した。反応混合物を室温迄放冷し、この中へ5-アセチル-4-クロロジフルオロメチルピリミジン2gを、素早く滴下し、さらに1時間還流した。反応混合物を氷冷し、その中へ塩化アンモニウム飽和水溶液を滴下しながら撹拌した。デカンテーションによりエーテル層を分離し、分液ロート中で、飽和食塩水で3回洗浄した。有機層を無

水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。得られた粗物を分取薄層クロマトグラフィー(展開溶媒:クロロホルム)で3回展開し131mgの目的物を粘性液体として得た。$n_D^{20.6}$1.4982。

〔実施例24〕

4-tert-ブチル-5-〔(2-メチルフェニル)ヒドロキシメチル〕ピリミジン(化合物No.117)の合成

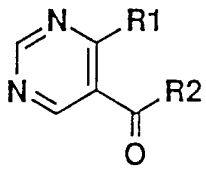


4-tert-ブチル-5-(2-メチルベンゾイル)ピリミジン1g、脱水メタノール20mlの混合物に水冷下、水素化ホウ素ナトリウム(92%純度)500mlを加え、2時間攪拌した。減圧下、溶媒を留去し、得られた混合物に、氷水、酢酸エチルエステルを入れ、攪拌下、濃塩酸でpHを1~2に調整した。有機層を飽和食塩水で2回洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し600mgの目的物を白色結晶として得た。

融点125~127℃。

前記実施例に準じて合成した本発明化合物の構造式、スペクトルデータおよび物性を前記実施例を含め第1-1、1-2表および第2-1、2-2表に示す。また中間体の構造と物性を第3-1、3-2表に示す。

〔第1-1表〕



化合物 No.	R 1	R 2
1	CF_2Cl	Me
2	CF_3	Me
3	CF_2Cl	Bu^{tert}
4	CF_2CF_3	Me
5	4 − Cl − Phenyl	Bu^{tert}
6	Bu^{tert}	4 − Cl − Phenyl
7	CF_2Cl	Pr^{cyclo}
8	2,4 − Cl_2 − Phenyl	Bu^{tert}
9	Bu^{tert}	2,4 − Cl_2 − Phenyl
10	CF_2Cl	Et
11	CF_2Cl	CH_2Br
12	4 − Cl − Phenyl	Pr^{cyclo}
13	CF_2Cl	Pr^{n}
14	CF_2Cl	Pr^{iso}
15	Bu^{tert}	4-MeO-Phenyl
16	Bu^{tert}	2-MeO-Phenyl
17	CF_2CF_2Cl	Me
18	Bu^{tert}	3-Me-Phenyl
19	Bu^{tert}	2-Me-Phenyl
20	CF_2Cl	4-Cl-Phenyl
21	CF_2Cl	2,4-Cl_2 -Phenyl
22	CF_2Br	Me
23	CF_2Cl	Phenyl
24	CF_2Cl	4 − F − Phenyl

化合物 No.	R 1	R 2
25	CF_2Cl	2－F－Phenyl
26	CF_2Cl	3－F－Phenyl
27	CF_2Cl	2－Cl－Phenyl
28	CF_2Cl	3－Cl－Phenyl
29	CF_2Cl	3，4－Cl_2－Phenyl
30	CHFCl	Pr^n
31	CF_2H	Pr^n
32	CF_2Cl	2-Me-Phenyl

〔第1-2表〕

化合物 No.	スペクトルデータ	物理的性質
1	^{1}H－NMR δ（ppm）〔solvent〕； 2．65（t，J＝1Hz，3H，COCH$_3$）， 8．90（s，1H）， 9．42（s，1H）， 〔CDCl$_3$〕 ^{13}C－NMR δ（ppm）〔solvent〕； 31．35（t，$J_{F.C}$＝2．7Hz，CO<u>C</u>H$_3$）， 122．99（t，$J_{F.C}$＝291Hz，<u>C</u>F$_2$Cl）， 131．26（s，pyrimidine ring，5位）， 155．07（t，$J_{F.C}$＝31Hz，pyrimidine ring，4位）， 156．91（s，pyrimidine ring，6位）， 159．20（s，pyrimidine ring，2位）， 197．69（s，<u>C</u>＝O）， 〔CDCl$_3$〕 ^{19}F－NMR δ（ppm）〔solvent〕； 24．0（s，2F，ClC<u>F</u>$_2$）， （ref．CF$_3$CO$_2$H）， 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{20.7}$1．4787， bp65－70℃／1．3mmHg

化合物 No.	スペクトルデータ	物理的性質
2	^{1}H－NMR δ（ppm）〔solvent〕； 2.68（s, 3H, COC<u>H</u>$_3$）， 9.07（s, 1H）， 9.48（s, 1H）， 〔CDCl$_3$〕 ^{13}C－NMR δ（ppm）〔solvent〕； 30.84（s, CO<u>C</u>H$_3$）， 120.34（q, <u>J</u>$_{F,C}$＝276Hz, <u>C</u>F$_3$）， 132.63（s, pyrimidine ring，5位）， 151.26（q, <u>J</u>$_{F,C}$＝37Hz, pyrimidine ring，4位）， 157.14（s, pyrimidine ring）， 159.42（s, pyrimidine ring）， 197.19（s, <u>C</u>＝O）， 〔CDCl$_3$〕	bp65－66℃／3.5mmHg
3	^{1}H－NMR δ（ppm）〔solvent〕； 1.28（s, 9H, C（C<u>H</u>$_3$）$_3$）， 8.75（s, 1H, pyrimidine）， 9.34（s, 1H, pyrimidine）， 〔CDCl$_3$〕 ^{13}C－NMR δ（ppm）〔solvent〕； 26.8（s, C（<u>C</u>H$_3$）$_3$），	

化合物 No.	スペクトルデータ	物理的性質

45.2 (s, C (CH_3)$_3$),
123.0 (t, $J_{F,C}$ = 291 Hz, ClCF$_2$),
130.1 (s, pyrimidine ring, 5位),
154.9 (t, $J_{F,C}$ = 31 Hz, pyrimidine ring, 4位),
155.2 (s, pyrimidine ring),
158.3 (s, pyrimidine ring),
207.2 (s, C=O),
〔$CDCl_3$〕

^{19}F-NMR δ (ppm) 〔solvent〕;
23.8 (s, 2F, ClCF$_2$),
(ref. CF_3CO_2H),
〔$CDCl_3$〕

$n_D^{20.0}$ 1.4675

4 ^{1}H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕;
2.60 (t, J = 1 Hz, 3H, COCH$_3$),
8.85 (s, 1H, Pyrimidine ring),
9.37 (s, 1H, Pyrimidine ring),
〔$CDCl_3$〕 $n_D^{20.1}$ 1.4335

5 ^{1}H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕;
0.97 (s, 9H, C (CH_3)$_3$),
7.46 (d, J = 9 Hz, 2H, Benzene ring),
7.65 (d, J = 9 Hz, 2H, Benzene ring),
8.56 (s, 1H, Pyrimidine ring),

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
5	9.30 (s, 1H, Pyrimidine ring),	
(続き)	[CDCl$_3$]	
	^{13}C-NMR δ (ppm) [solvent] ;	
	26.7 (s, C(<u>C</u>H$_3$)$_3$),	
	45.9 (s, <u>C</u>(CH$_3$)$_3$),	
	129.3 (s, Benzene ring <u>C</u>H),	
	130.6 (s, Benzene ring <u>C</u>H),	
	133.2 (s, Pyrimidine ring, 5位),	
	136.6 (s, Benzene ring),	
	137.2 (s, Benzene ring),	
	154.6 (s, Pyrimidine ring, 6位 <u>C</u>H),	
	158.4 (s, Pyrimidine ring, 2位 <u>C</u>H),	
	160.1 (s, Pyrimidine ring, 4位),	
	212.2 (s, <u>C</u>OC(CH$_3$)$_3$),	
	[CDCl$_3$]	$n_D^{20.1}$ 1.5784
6	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ;	
	1.33 (s, 9H, C(C<u>H</u>$_3$)$_3$),	
	7.49 (d, <u>J</u>=9Hz, 2H, Benzene ring),	
	7.77 (d, <u>J</u>=9Hz, 2H, Benzene ring),	
	8.42 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	9.24 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	[CDCl$_3$]	

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
6 (続き)	^{13}C-NMRδ (ppm) 〔solvent〕; 30.0 (s, C($\underline{C}H_3$)$_3$), 39.9 (s, $\underline{C}$(CH_3)$_3$), 129.4 (s, Benzene ring $\underline{C}$H), 131.5 (s, Benzene ring $\underline{C}$H), 131.5 (s, Pyrimidine ring, 5位), 135.4 (s, Benzene ring), 141.1 (s, Benzene ring), 155.2 (s, Pyrimidine ring, 6位), 158.1 (s, Pyrimidine ring, 2位 $\underline{C}$H), 174.4 (s, Pyrimidine ring, 4位 $\underline{C}$H), 194.7 (s, $\underline{C}$O), 〔$CDCl_3$〕	bp75～77℃
7	^{1}H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 1.11-1.47 (m, 4H, cyclopropane ring(methylene)) 2.10-2.50 (m, 1H, cyclopropane ring(methine)) 8.85 (s, 1H, pyrimidine ring) 9.32 (s, 1H, pyrimidine ring) 〔$CDCl_3$〕	$n_D^{20.5}$1.4998
8	^{1}H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 1.06 (s, 9H, C($C\underline{H}_3$)$_3$) 6.89～7.37 (m, 3H, Benzene ring) 8.67 (s, 1H, Pyrimidine ring)	

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
8	9.19(s, 1H, Pyrimidine ring)	
(続き)	〔CDCl$_3$〕	$n_D^{20.1}$ 1.5571
9	^{1}H-NMR δ(ppm)〔solvent〕;	
	1.35(s, 9H, C(C<u>H</u>$_3$)$_3$)	
	6.83～7.08(m, 2H, Benzene ring)	
	7.70～7.75(m, 1H, Benzene ring)	
	8.17(s, 1H, Pyrimidine ring)	
	9.01(s, 1H, Pyrimidine ring)	
	〔CDCl$_3$〕	mp 102-103℃
10	^{1}H-NMR δ(ppm)〔solvent〕;	
	1.23(t, <u>J</u>=7Hz, 3H, CH$_2$C<u>H</u>$_3$)	
	2.88(q, <u>J</u>=7Hz, 2H, C<u>H</u>$_2$CH$_3$)	
	8.77(s, 1H, Pyrimidine ring)	
	9.32(s, 1H, Pyrimidine ring)	
	〔CDCl$_3$〕	$n_D^{20.4}$ 1.4745
11	^{1}H-NMR δ(ppm)〔solvent〕;	
	4.30(s, 2H, C<u>H</u>$_2$Br)	
	8.90(s, 1H, Pyrimidine ring)	
	9.38(s, 1H, Pyrimidine ring)	
	〔CDCl$_3$〕	oil
12	^{1}H-NMR δ(ppm)〔solvent〕;	
	0.72～1.40(m, 4H, cyclo-propyl C<u>H</u>$_2$)	
	1.59～2.01(m, 1H, cyclo-propyl C<u>H</u>)	

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
12 (続き)	7.40 (d, J=9Hz, 2H, Benzene ring) 7.62 (d, J=9Hz, 2H, Benzene ring) 8.77 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.22 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔$CDCl_3$〕	mp. 110-112℃
13	^{1}H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 1.00 (t, J=7Hz, 3H, $CH_2CH_2C\underline{H}_3$) 1.74 (tq, J=7, 7Hz, 2H, $CH_2C\underline{H}_2CH_3$) 2.82 (t, J=7Hz, 2H, $C\underline{H}_2CH_2CH_3$) 8.77 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.33 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔$CDCl_3$〕	$n_D^{19.7}$ 1.4770
14	^{1}H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 0.97～1.46 (m, 4H, cyclo-propyl $C\underline{H}_2$) 2.00～2.42 (m, 1H, cyclo-propyl $C\underline{H}$) 8.84 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.29 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔$CDCl_3$〕	$n_D^{20.5}$ 1.4732
15	^{1}H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 1.16 (s, 9H, $C(C\underline{H}_3)_3$) 3.91 (s, 3H, $OC\underline{H}_3$) 7.00 (d, J=9Hz, 2H, Benzene ring) 7.83 (d, J=9Hz, 2H, Benzene ring)	

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
15 (続き)	8.47(s, 1H, Pyrimidine ring) 9.27(s, 1H, Pyrimidine ring) 〔CDCl$_3$〕	mp 91-93℃
16	^{1}H-NMR δ(ppm)〔solvent〕; 1.38(s, 9H, C(C<u>H</u>$_3$)$_3$) 3.60(s, 3H, OC<u>H</u>$_3$) 6.90～8.10(m, 4H, Benzene ring) 8.37(s, 1H, Pyrimidine ring) 9.19(s, 1H, Pyrimidine ring) 〔CDCl$_3$〕	mp 71-73℃
17	^{1}H-NMR δ(ppm)〔solvent〕; 2.61(t, <u>J</u>=1Hz, 3H, C<u>H</u>$_3$) 8.85(s, 1H, Pyrimidine ring) 9.41(s, 1H, Pyrimidine ring) 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{19.2}$ 1.4519
18	^{1}H-NMR δ(ppm)〔solvent〕; 1.34(s, 9H, C(C<u>H</u>$_3$)$_3$) 2.42(s, 3H, C<u>H</u>$_3$) 7.30～7.80(m, 4H, Benzene ring) 8.46(s, 1H, Pyrimidine ring)' 9.27(s, 1H, Pyrimidine ring) 〔CDCl$_3$〕	mp 98-100℃

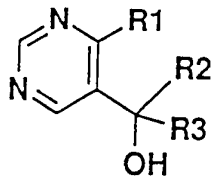
化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
19	^{1}H－NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 1.36 (s, 9H, C(C<u>H</u>$_3$)$_3$) 2.73 (s, 3H, C<u>H</u>$_3$) 6.80～7.80 (m, 4H, Benzene ring) 8.45 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.25 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔CDCl$_3$〕	mp 57－59℃
20	^{1}H－NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 7.51 (d, <u>J</u>＝9Hz, 2H, Benzene ring) 7.72 (d, <u>J</u>＝9Hz, 2H, Benzene ring) 8.88 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.50 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{20.8}$ 1.5742
21	^{1}H－NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 7.19～7.69 (m, 3H, Benzene ring) 8.78 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.36 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{20.5}$ 1.5837
22	^{1}H－NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 2.62 (s, 3H, C<u>H</u>$_3$) 8.79 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.32 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{19.9}$ 1.5069

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
23	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 7.34～7.84 (m, 5H, Benzene ring) 8.76 (s, 1H, Pyrimidine ring) 8.87 (s, 1H, Pyrimidine ring) [CDCl$_3$]	$n_D^{20.1}$ 1.5571
24	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 6.95～8.00 (m, 4H, Benzene ring) 8.82 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.43 (s, 1H, Pyrimidine ring) [CDCl$_3$]	mp 63-64℃
25	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 6.85-8.10 (m, 4H, Benzene ring) 8.75 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.34 (s, 1H, Pyrimidine ring) [CDCl$_3$]	$n_D^{20.8}$ 1.5468
26	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 7.10-7.82 (m, 4H, Benzene ring) 8.75 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.46 (s, 1H, Pyrimidine ring) [CDCl$_3$]	mp 40-42℃
27	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 7.17-7.76 (m, 4H, Benzene ring) 8.77 (s, 1H, Pyrimidine ring)	

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
27 (続き)	9.35 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔$CDCl_3$〕	$n_D^{19.8}$ 1.5612
28	^1H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 7.34-7.76 (m, 4H, Benzene ring) 8.79 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.39 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔$CDCl_3$〕	$n_D^{19.8}$ 1.5756
29	^1H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 7.37-7.91 (m, 3H, Benzene ring) 9.00 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.63 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔$CDCl_3$〕	mp 51-53℃
30	^1H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 1.01 (t, J=7Hz, 3H, $CH_2CH_2CH_3$) 1.77 (tq, J=7.7Hz, 2H, $CH_2CH_2CH_3$) 2.96 (t, J=7Hz, 2H, $CH_2CH_2CH_3$) 7.58 (d, J=50Hz, 1H, CHFCl) 9.05 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.30 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔$CDCl_3$〕	$n_D^{20.0}$ 1.5113

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
31	^{1}H−NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 1.00 (t, J=7Hz, 3H, $CH_2CH_2C\underline{H}_3$) 1.77 (tq, J=7.7Hz, 2H, $CH_2C\underline{H}_2CH_3$) 2.95 (t, J=7Hz, 2H, $C\underline{H}_2CH_2CH_3$)) 6.88 (t, J=53Hz, 1H, $C\underline{H}F_2$) 9.01 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.30 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔$CDCl_3$〕 $n_D^{19.8}$ 1.4830	
32	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent]; 2.67 (s, 3H, $C\underline{H}_3$) 7.10-7.45 (m, 4H, Benzene ring) 8.88 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.46 (s, 1H, Pyrimidine ring) [$CDCl_3$] $n_D^{20.4}$ 1.5588	

〔第2-1表〕



化合物 No.	R 1	R 2	R 3
1 0 1	CF_2Cl	Me	H
1 0 2	CF_3	Me	H
1 0 3	CF_2Cl	Bu^{tert}	H
1 0 4	4 − Cl − Phenyl	Bu^{tert}	H
1 0 5	Bu^{tert}	4 − Cl − Phenyl	H
1 0 6	CF_2Cl	Pr^{cyclo}	H
1 0 7	CF_2CF_3	Me	H
1 0 8	2,4− Cl_2 − Phenyl	Bu^{tert}	H
1 0 9	Bu^{tert}	2,4− Cl_2 − Phenyl	H
1 1 0	CF_2Cl	Me	Me
1 1 1	CF_2Cl	Pr^{n}	H
1 1 2	CF_2Cl	Et	H
1 1 3	4 − Cl − Phenyl	Pr^{cyclo}	H
1 1 4	CF_2Cl	Pr^{iso}	H
1 1 5	Bu^{tert}	4-MeO-Phenyl	H
1 1 6	Bu^{tert}	2-MeO-Phenyl	H
1 1 7	Bu^{tert}	2-Me-Phenyl	H
1 1 8	Bu^{tert}	3-Me-Phenyl	H
1 1 9	CF_2Cl	4-Cl-Phenyl	H
1 2 0	CF_2CF_2Cl	Me	H
1 2 1	CF_2Cl	2,4− Cl_2 − Phenyl	H
1 2 2	CF_2Br	Me	H
1 2 3	CF_2Cl	Phenyl	H
1 2 4	CF_2Cl	4 − F − Phenyl	H

化合物 No.	R 1	R 2	R 3
1 2 5	CF_2Cl	2 − F − Phenyl	H
1 2 6	CF_2Cl	2 − Cl − Phenyl	H
1 2 7	CF_2Cl	3 − Cl − Phenyl	H
1 2 8	CF_2Cl	3, 4 − Cl_2 − Phenyl	H
1 2 9	CF_2Cl	3 − F − Phenyl	H

〔第2-2表〕

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
101	^{1}H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 1.55 (d, J=6Hz, 3H, CH$_3$), 2.72 (br s, 1H, OH), 5.42 (qd, J=6, 2Hz, 1H, CH), 9.10 (s, 1H), 9.20 (s, 1H), 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{19.9}$ 1.4899
102	^{1}H-NMR. δ (ppm) 〔solvent〕; 1.55 (d, J=6Hz, 3H, CH$_3$), 2.95 (d, J=3Hz, 1H, OH), 5.1～5.6 (br m, 1H, CH), 9.20 (s, 1H), 9.27 (s, 1H), 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{19.9}$ 1.4549
103	MS (FAB+) m/z: 251 〔M+H〕$^+$, ^{1}H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 0.93～0.99 (m, 9H, C(CH$_3$)$_3$), 3.03～3.85 (br m, 1H, OH) 5.08 (s, 1H, CHOH), 9.21 (s, 1H, Pyrimidine ring), 9.25 (s, 1H, Pyrimidine ring), 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{19.8}$ 1.4623

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
104	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 0.71 (s, 9H, C(C<u>H</u>$_3$)$_3$), 2.92 (br, 1H, O<u>H</u>), 4.84 (s, 1H, C<u>H</u>OH), 7.32 (s, 4H, Benzene ring), 8.88 (s, 1H, Pyrimidine ring), 8.98 (s, 1H, Pyrimidine ring), [CDCl$_3$], MS (EI) <u>m</u>/<u>z</u> ; 276 (M^+, 41), 261 (13), 243 (8), 221 (base peak), 219 (99), 185 (73), 57 (95)	$n_D^{20.2}$1.5575
105	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 1.43 (s, 9H, C(C<u>H</u>$_3$)$_3$), 4.39 (br, 1H, O<u>H</u>), 6.41 (s, 1H, C<u>H</u>OH), 7.15 (s, 4H, Benzene ring), 8.30 (s, 1H, Pyrimidine ring), 8.76 (s, 1H, Pyrimidine ring), [CDCl$_3$]	$n_D^{20.2}$1.5474
106	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 0.49～0.74 (m, 4H, cyclopropane(methylene)) 1.23～1.44 (m, 4H, cyclopropane(methine)) 3.00 (br, 1H, O<u>H</u>),	

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
106 (続き)	4.70～4.89 (m, 1H, φCHOH) 9.11 (s, 1H, Pyrimidine ring), 9.19 (s, 1H, Pyrimidine ring), 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{20.5}$ 1.5020
107	^{1}H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 1.55 (d, J=6Hz, 3H, CH$_3$) 2.4～3.0 (br s, 1H, OH) 5.1～5.6 (m, 1H, CH) 9.12 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.22 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{20.1}$ 1.4347
108	^{1}H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 0.74 (s, 9H, C(CH$_3$)$_3$) 3.23 (br s, 1H, OH) 4.22 (s, 1H, φCH) 6.92～7.26 (m, 3H, Benzene ring) 8.85 (s, 1H, Pyrimidine ring) 8.97 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{19.6}$ 1.5554
109	^{1}H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 1.43 (s, 9H, C(CH$_3$)$_3$) 4.83 (br s, 1H, OH)	

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
109	6.45 (s, 1H, φCH)	
(続き)	6.76～7.27 (m, 3H, Benzene ring)	
	8.24 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	8.76 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	[$CDCl_3$]	$n_D^{19.8}$ 1.5464
110	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ;	
	1.78 (s, 6H, CH_3 ×2),	
	3.05 (br. s, 1H, OH)	
	9.17 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	9.32 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	[$CDCl_3$]	$n_D^{20.6}$ 1.4982
111	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ;	
	0.70～1.19 (m, 3H, CH_3)	
	1.19～2.00 (m, 4H, CHCH_2 CH_2 CH_3)	
	2.4～3.1 (br s, 1H, OH)	
	5.0～5.5 (m, 1H, CH)	
	9.09 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	9.12 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	[$CDCl_3$]	$n_D^{19.8}$ 1.4798
112	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ;	
	1.05 (t, J=7Hz, 3H, CH_2 CH_3)	
	1.74 (br q, J=7Hz, 2H, CHCH_2 CH_3)	

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
112	2.91 (d, J=3Hz, 1H, OH)	
(続き)	4.85～5.35 (m, 1H, CH)	
	9.06 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	9.10 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	[$CDCl_3$]	$n_D^{19.9}$ 1.4845
113	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ;	
	0.21～0.74 (m, 4H, cyclo-propyl CH_2)	
	0.94～1.46 (m, 1H, cyclo-propyl CH)	
	3.10 (br s, 1H, OH)	
	4.25 (d, J=7Hz, 1H, φCH)	
	7.33 (d, J=9Hz, 2H, Benzene ring)	
	7.51 (d, J=9Hz, 2H, Benzene ring)	
	8.96 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	9.01 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	[$CDCl_3$]	mp 142-144℃
114	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ;	
	0.99 (t, J=6Hz, 6H, $CH(CH_3)_2$)	
	2.00 (qq, J=6Hz, 1H, $CH(CH_3)_2$)	
	2.8～3.8 (br s, 1H, OH)	
	4.99 (br d, 1H, CHOH)	
	9.10 (s, 2H, Pyrimidine ring)	
	[$CDCl_3$]	$n_D^{19.8}$ 1.4822

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
115	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 1.41 (s, 9H, C(CH_3)$_3$) 3.78 (s, 3H, OCH_3) 4.80 (br s, 1H, OH) 6.48 (br s, 1H, CH) 6.84 (d, J=9Hz, 2H, Benzene ring) 7.20 (d, J=9Hz, 2H, Benzene ring) 8.58 (s, 1H, Pyrimidine ring) 8.88 (s, 1H, Pyrimidine ring) [$CDCl_3$]	mp 90-92℃
116	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 1.45 (s, 9H, C(CH_3)$_3$) 3.61 (br s, 1H, OH) 3.81 (s, 3H, OCH_3) 6.6～7.6 (m, 5H, CH+Benzene ring) 8.67 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.04 (s, 1H, Pyrimidine ring) [$CDCl_3$]	mp 102-104℃
117	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 1.36 (s, 9H, C(CH_3)$_3$) 2.34 (s, 3H, CH_3) 4.25 (br s, 1H, OH)	

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
117	6.56 (s, 1H, CH)	
(続き)	6.9～7.6 (m, 4H, Benzene ring)	
	8.63 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	8.90 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	[$CDCl_3$]	mp 125-127℃
118	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ;	
	1.43 (s, 9H, $C(CH_3)_3$)	
	2.30 (s, 3H, CH_3)	
	4.8～5.3 (m, 1H, OH)	
	6.45 (br s, 1H, CH)	
	6.8～7.5 (m, 4H, Benzene ring)	
	8.48 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	8.85 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	[$CDCl_3$]	$n_D^{21.5}$ 1.5574
119	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ;	
	3.40 (br s, 1H, OH)	
	6.34 (s, 1H, φCH)	
	7.29 (s, 4H, Benzene ring)	
	9.09 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	9.14 (s, 1H, Pyrimidine ring)	
	[$CDCl_3$]	$n_D^{20.3}$ 1.5563

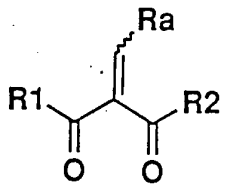
化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
120	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 1.53 (d, J=6Hz, 3H, CHC<u>H</u>$_3$) 2.62 (br s, 1H, O<u>H</u>) 5.07～5.58 (m, 1H, C<u>H</u>CH$_3$) 9.10 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.18 (s, 1H, Pyrimidine ring) [CDCl$_3$]	$n_D^{20.1}$ 1.4616
121	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 3.42 (br· d, J=5Hz, 1H, O<u>H</u>) 6.58 (d, J=5Hz, 1H, φC<u>H</u>) 7.30～7.45 (m, 3H, Benzene ring) 8.82 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.20 (s, 1H, Pyrimidine ring) [CDCl$_3$]	mp 141-142℃
122	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 1.57 (d, J=6Hz, 3H, CHC<u>H</u>$_3$) 3.12～3.78 (br s, 1H, O<u>H</u>) 5.41 (d, q, J=3, 6Hz, 1H, C<u>H</u>CH$_3$) 9.07 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.17 (s, 1H, Pyrimidine ring) [CDCl$_3$]	$n_D^{20.1}$ 1.5160

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
123	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 4.79～5.04 (m, 1H, OH) 6.23 (br s, 1H, φCH) 7.17 (br s, 5H, Benzene ring) 8.82 (s, 1H, Pyrimidine ring) 8.97 (s, 1H, Pyrimidine ring) [CDCl$_3$]	$n_D^{20.0}$ 1.5566
124	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 3.68 (d, J=6Hz, 1H, OH) 6.20～6.40 (m, 1H, CHOH) 6.90～7.53 (m, 4H, Benzene ring) 9.06 (s, 2H, Pyrimidine ring) [CDCl$_3$]	$n_D^{20.5}$ 1.5394
125	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 3.38-4.08 (br s, 1H, OH) 6.55 (s, 1H, CHOH) 6.68-7.58 (m, 4H, Benzene ring) 9.06 (s, 2H, Pyrimidine ring) [CDCl$_3$]	$n_D^{19.7}$ 1.5434
126	^{1}H-NMR δ (ppm) [solvent] ; 4.20-4.41 (br m, 1H, OH) 6.53-6.67 (m, 1H, CHOH)	

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
126 (続き)	7.12-7.56 (m, 4H, Benzene ring) 8.73 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.00 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔$CDCl_3$〕	$n_D^{20.5}$ 1.5378
127	^1H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 4.22-4.43 (br m, 1H, OH) 6.21-6.35 (m, 1H, CHOH) 7.06-7.35 (m, 4H, Benzene ring) 8.99 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.02 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔$CDCl_3$〕	$n_D^{19.8}$ 1.5402
128	^1H-NMR δ (ppm) 〔solvent〕; 3.10-3.50 (br m, 1H, OH) 6.23-6.32 (m, 1H, CHOH) 6.97-7.48 (m, 3H, Benzene ring) 8.98 (s, 1H, Pyrimidine ring) 9.10 (s, 1H, Pyrimidine ring) 〔$CDCl_3$〕	mp 66-68℃

化合物No.	スペクトルデータ	物理的性質
129	^{1}H-NMR δ(ppm)〔solvent〕; 3.40-3.80(br s, 1H, OH) 6.33(s, 1H, CHOH) 6.74-7.60(m, 4H, Benzene ring) 9.01(s, 1H, Pyrimidine ring) 9.09(s, 1H, Pyrimidine ring) 〔$CDCl_3$〕	$n_D^{19.7}$ 1.5438

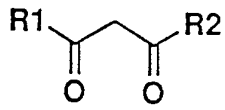
〔第3-1表〕



化合物No.	R1, R2, Ra；物理的性質
201	CF_3, Me, OMe；bp93－97℃／3．5Torr
202	CF_3, Me, OEt；bp82－83℃／0．2Torr
203	CF_2Cl, Me, OEt；bp95－118℃／1．6Torr
204	CF_2Cl, Bu^{tert}, OEt；bp105－107℃／2．0Torr
205	CF_2CF_3, Me, OEt；bp98 ℃／2．2Torr
206	4－Cl－Phenyl, Bu^{tert}, NMe_2；mp102－104℃
207	CF_2Cl, Pr^{cyclo}, OEt；$n_D^{20.6}$ 1.4787
208	2, 4－Cl_2－Phenyl, Bu^{tert}, NMe_2；$n_D^{19.9}$ 1.5437
209	4－Cl－Phenyl, Me, NMe_2；$n_D^{20.0}$ 1.5964
210	CF_2Cl, Et, OEt；bp117－120℃／2．3Torr
211	4－Cl－Phenyl, Pr^{cyclo}, NMe_2；mp37－39℃
212	4－MeO－Phenyl, Bu^{tert}, NMe_2；mp93－95℃
213	CF_2Cl, Pr^{iso}, OEt；bp105－115℃／1．7Torr
214	2－Me－Phenyl, Bu^{tert}, NMe_2；mp90－92℃
215	3－Me－Phenyl, Bu^{tert}, NMe_2；mp83－86℃
216	2－MeO－Phenyl, Bu^{tert}, NMe_2；mp109－112℃
217	CF_2CF_2Cl, Me, OEt；bp110－115℃／2．1Torr
218	CF_2Cl, 4－Cl－Phenyl, NMe_2；bp79－81℃
219	CF_2Cl, Phenyl, OEt；$n_D^{20.1}$ 1.5395
220	CF_2Cl, 4－F－Phenyl, OEt；$n_D^{20.9}$ 1.5233
221	CF_2Cl, 2－F－Phenyl, OEt；$n_D^{20.0}$ 1.3808

化合物No.	R1, R2, Ra ; 物理的性質
222	CF_2Cl, 3-F-Phenyl, OEt ; $n_D^{19.7}$ 1.4900
223	CF_2Cl, 2-Cl-Phenyl, OEt ; $n_D^{19.9}$ 1.5306
224	CF_2Cl, 3-Cl-Phenyl, OEt ; $n_D^{19.9}$ 1.5368
225	CF_2Cl, 3, 4-Cl_2-Phenyl, OEt ; $n_D^{19.9}$ 1.5578
226	CHFCl, Pr^n, OEt ; $n_D^{19.8}$ 1.4770
227	CF_2H, Pr^n, OEt ; $n_D^{19.9}$ 1.4580
228	CF_2Cl, 2-Me-Phenyl, OEt; $n_D^{20.3}$ 1.5350

〔第3-2表〕

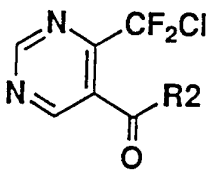
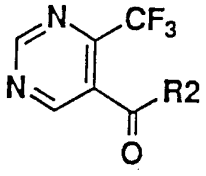


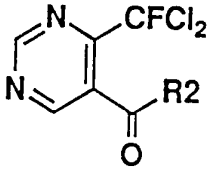
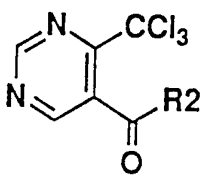
化合物No.	R1, R2；物理的性質
301	CF_2Cl, Bu^{tert}；bp54－57℃／5.0Torr
302	CF_2CF_3, Bu^{tert}；^{1}H-NMR δ(ppm)〔solvent〕；1.22(s,9H, t-Bu), 6.05(s, 1H, C<u>H</u>), 13.0～14.0(br s, 1H, O<u>H</u>, 〔$CDCl_3$〕 liquid.
303	4－Cl－Phenyl, Bu^{tert}；$n_D^{20.0}$ 1.5012
304	CF_2CF_3, Me；bp105－115℃
305	CF_2Cl, Pr^{cyclo}；$n_D^{20.6}$ 1.4788
306	2, 4－Cl_2－Phenyl, Bu^{tert}；$n_D^{19.9}$ 1.5690
307	CF_2Cl, Et；bp74－78℃／20Torr
308	CF_2Cl, Pr^n；bp84℃／17Torr
309	4－Cl－Phenyl, Pr^{cyclo}；mp73－75℃
310	CF_2Cl, Pr^{iso}；bp42－43℃／3.0Torr
311	4－MeO－Phenyl, Bu^{tert}；mp50－52℃
312	2－Me－Phenyl, Bu^{tert}；$n_D^{21.5}$ 1.4882
313	3－Me－Phenyl, Bu^{tert}；$n_D^{21.4}$ 1.5564
314	4－CF_3－Phenyl, Bu^{tert}；mp 55－58℃
315	2－F－Phenyl, Bu^{tert}；$n_D^{20.3}$ 1.5488
316	2－MeO－Phenyl, Bu^{tert}；$n_D^{20.4}$ 1.5622
317	2, 4－Cl_2－Phenyl, Me；mp30－31℃
318	CF_2Cl, 4－Cl－Phenyl；mp50－51℃

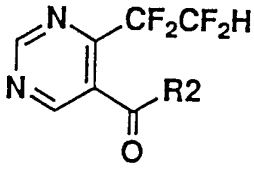
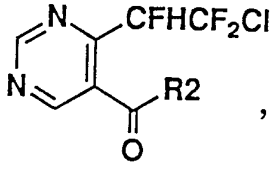
化合物No.	R1, R2；物理的性質
319	3-CF_3-Phenyl, Bu^{tert}；^{1}H-NMRδ(ppm)〔solvent〕；1.27(s,9H, t-Bu), 6.36(s, 1H, olefin), 7.30～8.40(m, 4H, benzene ring), 16.56(s, 1H, enol OH)〔$CDCl_3$〕liquid.
320	CF_2Cl, 1-Me-Pr^{cyclo}；bp59-63℃/2.0Torr
321	CF_2CF_2Cl, Me；bp120-128℃
322	CF_2Cl, 2, 4-Cl_2-Phenyl；$n_D^{21.7}$ 1.5828
323	CF_2Br, Me；bp100-105℃
324	CF_2Cl, 4-F-Phenyl；mp48-50℃
325	CF_2Cl, Phenyl；mp29-30℃
326	CF_2Cl, 2-F-Phenyl；$n_D^{19.9}$ 1.5554
327	CF_2Cl, 3-F-Phenyl；mp46-48℃
328	CF_2Cl, 2-Cl-Phenyl；$n_D^{19.9}$ 1.5630
329	CF_2Cl, 3-Cl-Phenyl；$n_D^{19.9}$ 1.5807
330	CF_2Cl, 3, 4-Cl_2-Phenyl；mp41-43℃
331	CHFCl, Pr^n；bp 94-100℃/20Torr
332	CF_2H, Pr^n；bp 74-76℃/20Torr
333	CF_2Cl, 2-Me-Phenyl；$n_D^{19.9}$ 1.5566

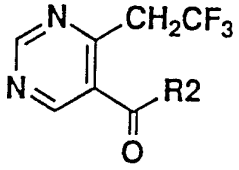
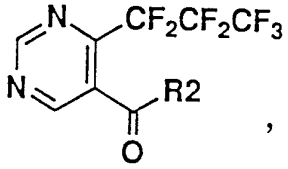
前記スキームあるいは実施例に準じて合成される本発明化合物を前記実施例で合成した化合物を含め、第4-1表、第4-2表、第4-3表に示すが、本発明は、これらによって限定されるものではない。

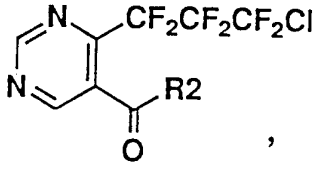
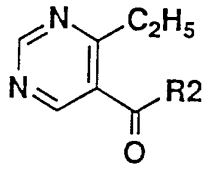
〔第4-1表〕

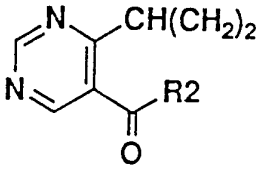
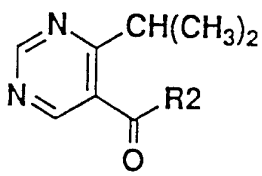

CF2Cl
N
N
R2
O
,

CF3
N
N
R2
O
,

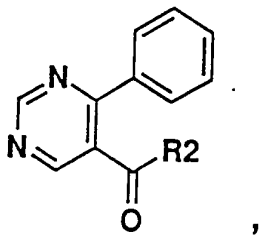

CFCl2
N
N
R2
O
,

CCl3
N
N
R2
O
,

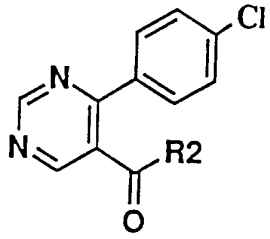

CF2CF2H
N
N
R2
O
,

CFHCF2Cl
N
N
R2
O
,

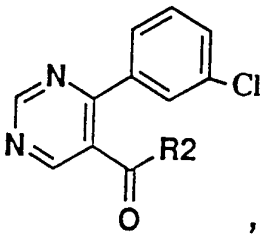

CH2CF3
N
N
R2
O
,

CF2CF2CF3
N
N
R2
O
,

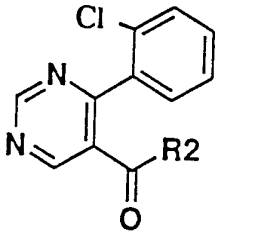

CF2CF2CF2Cl
N
N
R2
O
,

C2H5
N
N
R2
O
,

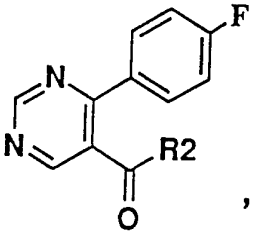

CH(CH2)2
N
N
R2
O
,

CH(CH3)2
N
N
R2
O
,

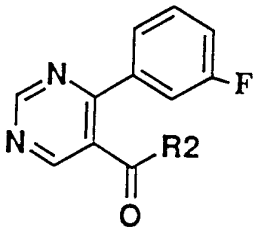

N
N
R2
O
,

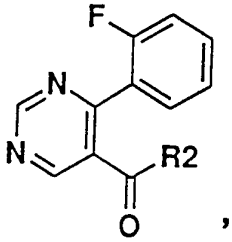

Cl
N
N
R2
O

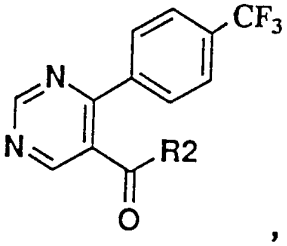

Cl
N
N
R2
O
,

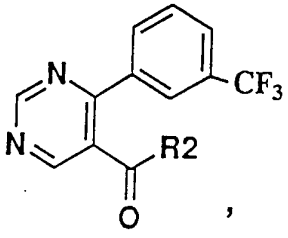

Cl
N
N
R2
O
,

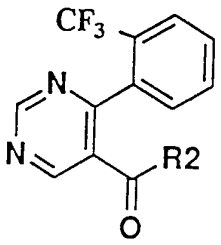

F
N
N
R2
O
,

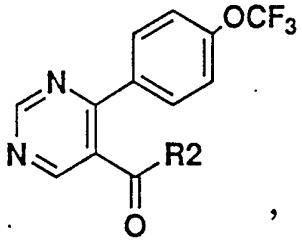
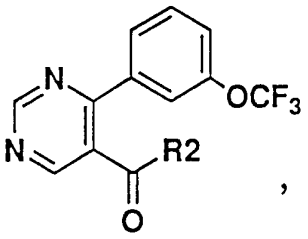

F
N
N
R2
O
,

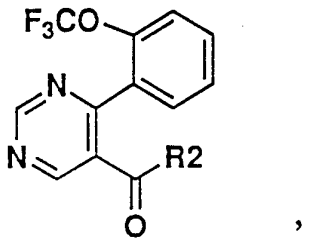
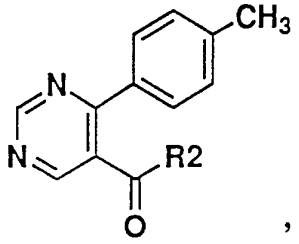

F
N
N
R2
O
,

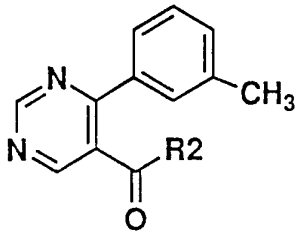
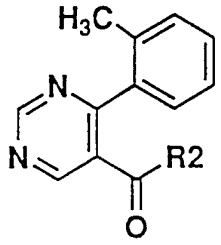

CF3
N
N
R2
O
,

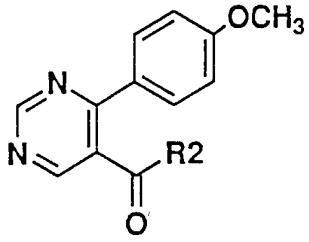
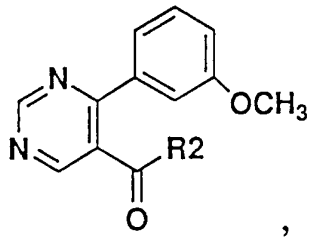

CF3
N
N
R2
O
,

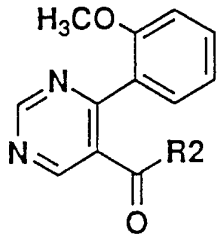
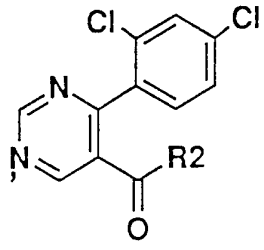

CF3
N
N
R2
O
,

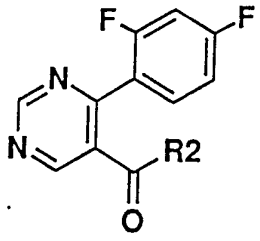

OCF3
N
N
R2
O
,

OCF3
N
N
R2
O
,


F3CO
N
N
R2
O
,

CH3
N
N
R2
O
,

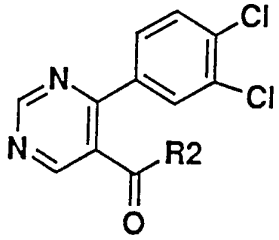

CH3
N
N
R2
O
,

H3C
N
N
R2
O
,


OCH3
N
N
R2
O
,

OCH3
N
N
R2
O
,

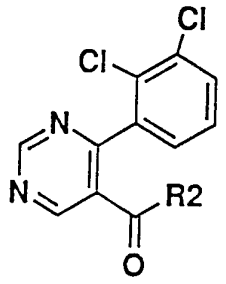

H3CO
N
N
R2
O
,

Cl
Cl
N
N
R2
O
,


F
F
N
N
R2
O

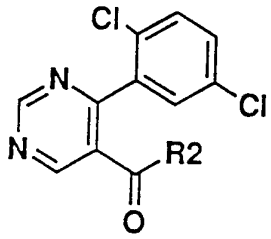
,


Cl
Cl
N
N
R2
O

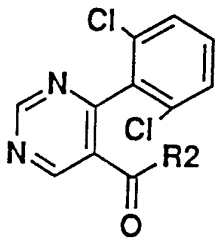
,


Cl
Cl
N
N
R2
O

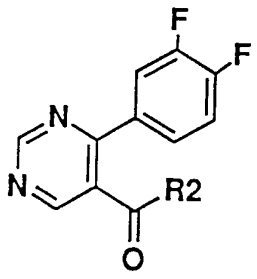
,


Cl
Cl
N
N
R2
O

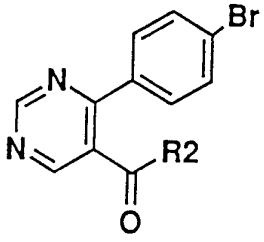
,


Cl
Cl
N
N
R2
O

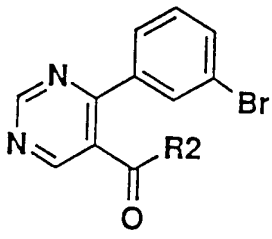
,


F
F
N
N
R2
O

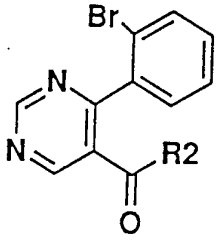
,


Br
N
N
R2
O

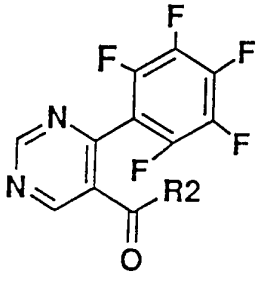
,


Br
N
N
R2
O

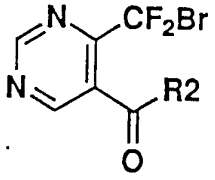
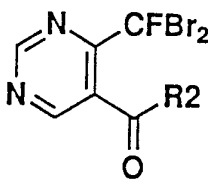
,

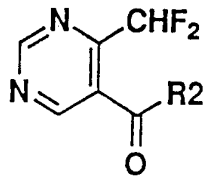
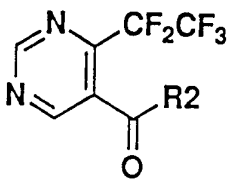

Br
N
N
R2
O

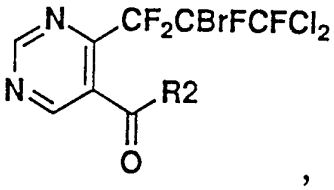
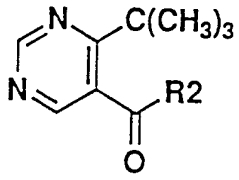
,

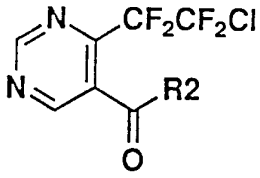
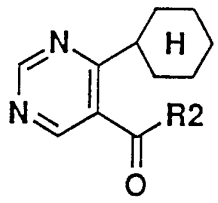

F
F
F
F
F
N
N
R2
O

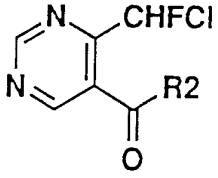
,

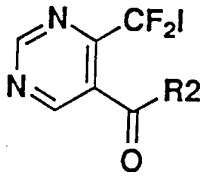

N
CF2Br
N
R2
O
,

N
CFBr2
N
R2
O
,


N
CHF2
N
R2
O
,

N
CF2CF3
N
R2
O
,

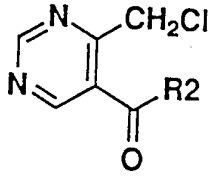

N
CF2CBrFCFCl2
N
R2
O
,

N
C(CH3)3
N
R2
O
,


N
CF2CF2Cl
N
R2
O
,

N
H
N
R2
O
,

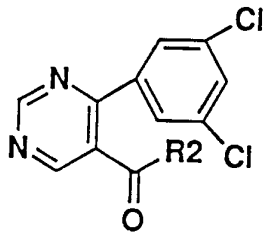

N
CHFCl
N
R2
O
,


N
CF2I
N
R2
O

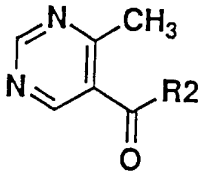
,


N
CH2Cl
N
R2
O

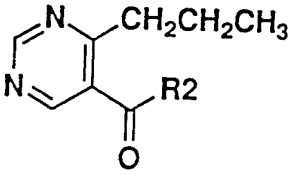
,


Cl
N
N
R2
Cl
O

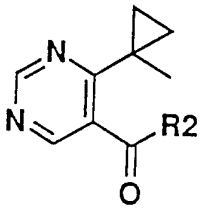
,


N
CH3
N
R2
O

,


N
CH2CH2CH3
N
R2
O

,

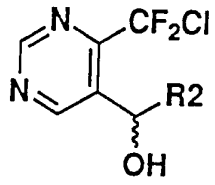

N
N
R2
O

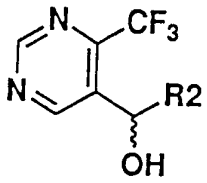
,

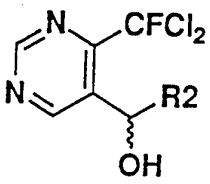
但し、式中のＲ２は以下から選択される。

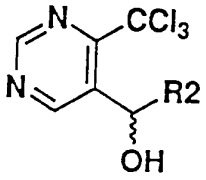
R2
Me, Et, Pr, Pr^{iso}, Pr^{cyclo}, Bu, Bu^{sec}, Bu^{iso}, Bu^{tert}, Bu^{cyclo}, Pn, Pn^{neo}, Pn^{iso}, Pn^{cyclo}, Hex, Hex^{cyclo}, C(Me)$_2$(CH$_2$F), CF_3, CH_2CF_3, Ph, 2-Cl-Ph, 3-Cl-Ph, 4-Cl-Ph, 2-F-Ph, 3-F-Ph, 4-F-Ph, 2-CF_3-Ph, 3-CF_3-Ph, 4-CF_3-Ph, 2-Me-Ph, 3-Me-Ph, 4-Me-Ph, 2-MeO-Ph, 3-MeO-Ph, 4-MeO-Ph, 2-CF_3O-Ph, 3-CF_3O-Ph, 4-CF_3O-Ph, 2-Br-Ph, 3-Br-Ph, 4-Br-Ph, 2, 4-Cl_2-Ph, 3, 4-Cl_2-Ph, 2, 6-Cl_2-Ph, 2-F-4-Cl-Ph, 2, 4-F_2-Ph, 3, 4-F_2-Ph, 2, 5-Cl_2-Ph, 2, 3-Cl_2-Ph, 2, 6-F_2-Ph, CH_2Br 3, 5-Cl_2-Ph, 2-Me-4-Cl-Ph, 2Me-4-F-Ph, 1-$MeSO_2$-Et, 1-Me-Pr^{cyclo}, 1-F-Pr^{cyclo}, 1-Cl-Pr^{cyclo}, 1-MeS-Pr^{cyclo}, 1-EtS-Pr^{cyclo}, CH_2Cl, CF(Me)$_2$, 1-Pr^{cyclo}-Et, $CH_2CH=CH_2$, $CH_2C\equiv CH$, CH(Me)C≡CH, C(Me)$_2$C≡CH, CH(Me)$CH=CH_2$, 4-Bu^{tert}-Ph, 3-Bu^{tert}-Ph, 2-Bu^{tert}-Ph, 2-Et-Ph, 3-Et-Ph, 4-Et-Ph, 2-Pr-Ph, 3-Pr-Ph, 4-Pr-Ph, 2-Bu-Ph, 3-Bu-Ph, 4-Bu-Ph, 2-EtO-Ph, 2-Pr^{iso}O-Ph, 2-PrO-Ph,

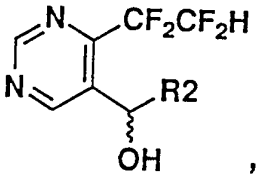
〔第4-2表〕

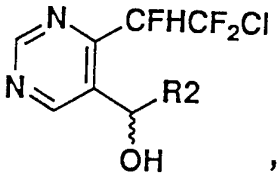

N
CF2Cl
N
R2
OH
,

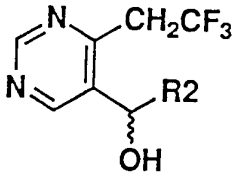

N
CF3
N
R2
OH
,

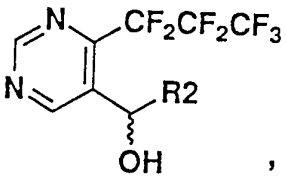

N
CFCl2
N
R2
OH
,

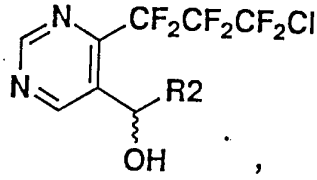

N
CCl3
N
R2
OH
,

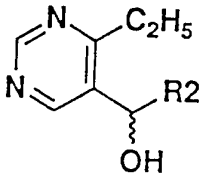

N
CF2CF2H
N
R2
OH
,

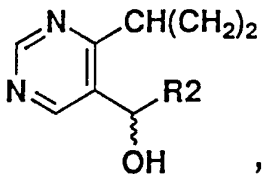

N
CFHCF2Cl
N
R2
OH
,

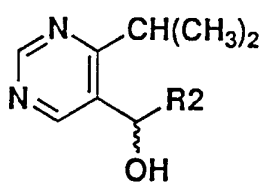

N
CH2CF3
N
R2
OH
,

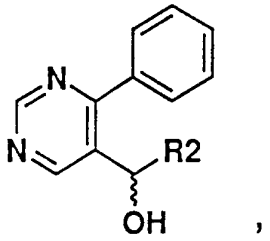

N
CF2CF2CF3
N
R2
OH
,

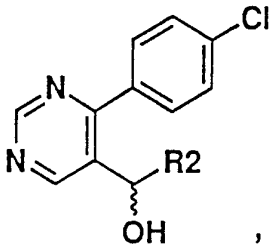

N
CF2CF2CF2Cl
N
R2
OH
,

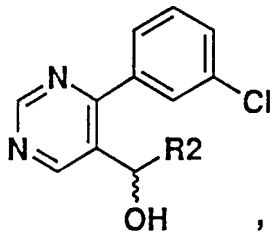

N
C2H5
N
R2
OH
,

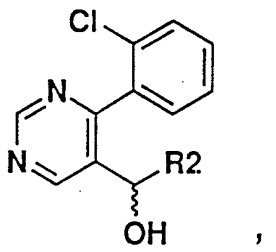

N
CH(CH2)2
N
R2
OH
,

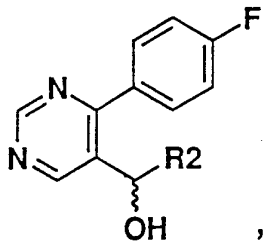

N
CH(CH3)2
N
R2
OH
,

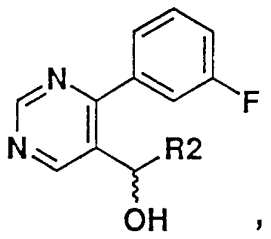

N
N
R2
OH
,

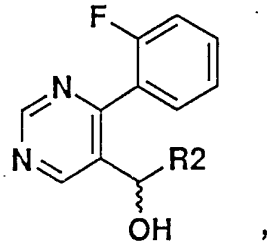

Cl
N
N
R2
OH
,

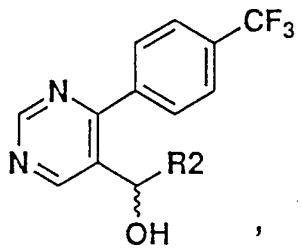

N
Cl
N
R2
OH
,

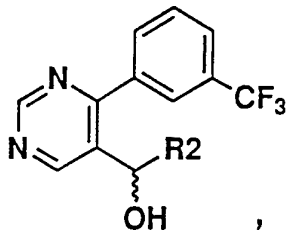

Cl
N
N
R2
OH
,

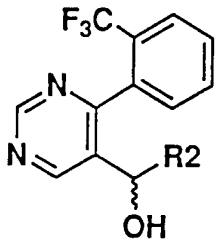

F
N
N
R2
OH
,

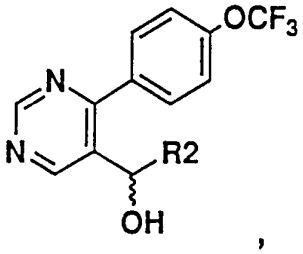

N
F
N
R2
OH
,

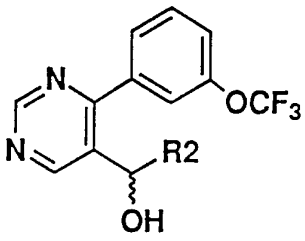

F
N
N
R2
OH
,

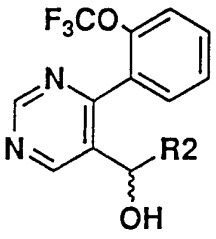

CF3
N
N
R2
OH
,

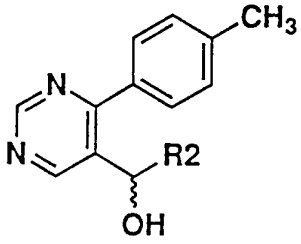

N
N
CF3
R2
OH
,

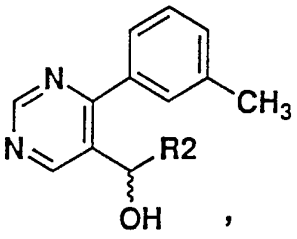

F3C
N
N
R2
OH
,

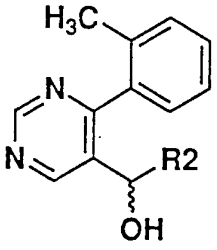

OCF3
N
N
R2
OH
,

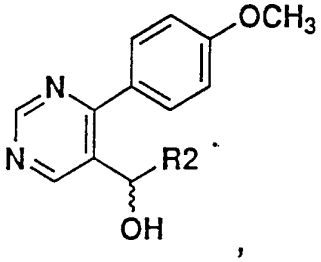

N
OCF3
N
R2
OH
,

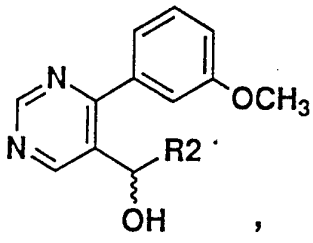

F3CO
N
N
R2
OH
,

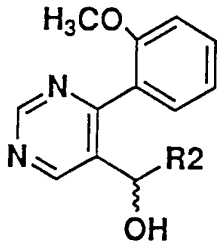

CH3
N
N
R2
OH
,

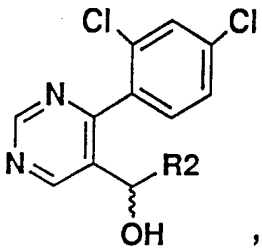

N
CH3
N
R2
OH
,

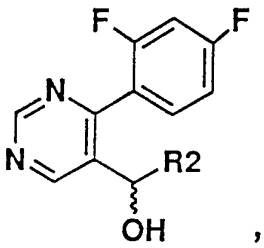

H3C
N
N
R2
OH
,

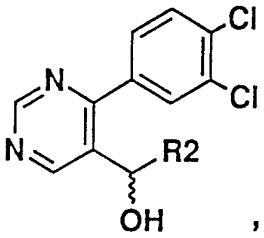

OCH3
N
N
R2
OH
,

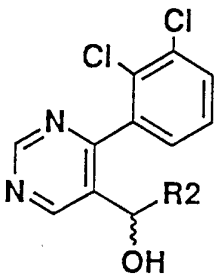

OCH3
N
N
R2
OH
,

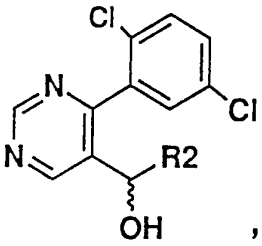

H3CO
N
N
R2
OH
,

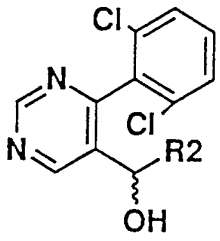

Cl
Cl
N
N
R2
OH
,

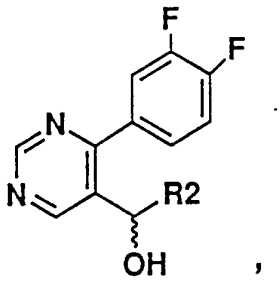

F
F
N
N
R2
OH
,

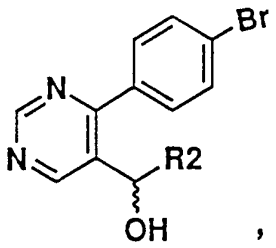

Cl
Cl
N
N
R2
OH
,

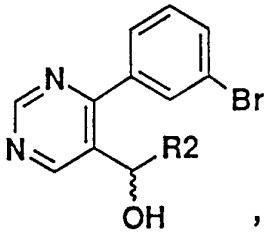

Cl
Cl
N
N
R2
OH
,

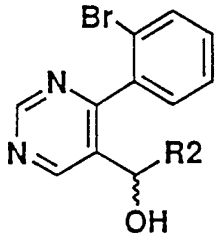

Cl
Cl
N
N
R2
OH
,

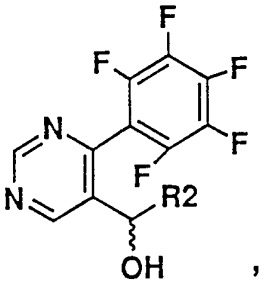

Cl
Cl
N
N
R2
OH
,

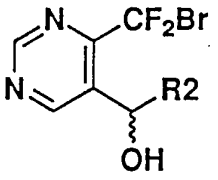

F
F
N
N
R2
OH
,

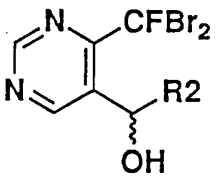

Br
N
N
R2
OH
,

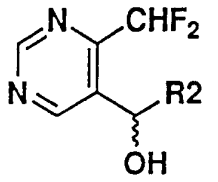

N
N
Br
R2
OH
,

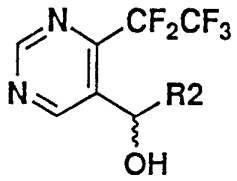

Br
N
N
R2
OH
,

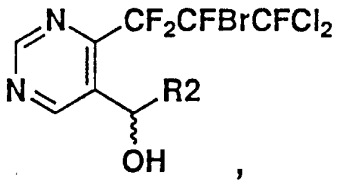

F
F
F
F
F
N
N
R2
OH
,

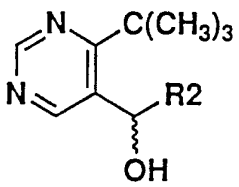

N
CF2Br
N
R2
OH
,

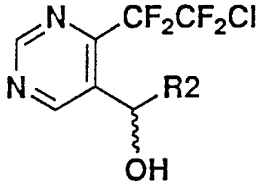

N
CFBr2
N
R2
OH
,

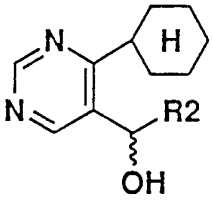

N
CHF2
N
R2
OH
,

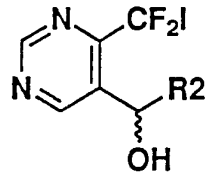

N
CF2CF3
N
R2
OH
,


N
CF2CFBrCFCl2
N
R2
OH
,

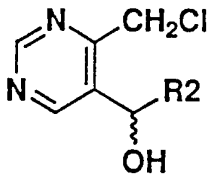

N
C(CH3)3
N
R2
OH
,


N
CF2CF2Cl
N
R2
OH
,

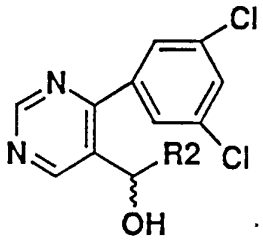

N
H
N
R2
OH
,


N
CF2I
N
R2
OH

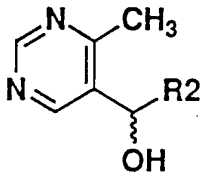
,


N
CH2Cl
N
R2
OH

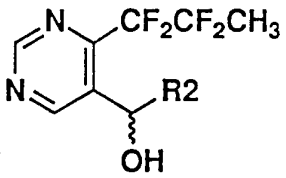
,


Cl
N
N
R2
Cl
OH

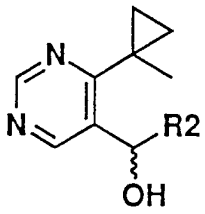
,


N
CH3
N
R2
OH

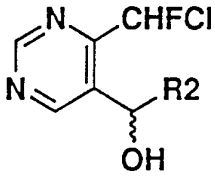
,


N
CF2CF2CH3
N
R2
OH

,


N
N
R2
OH

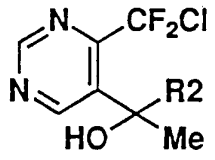
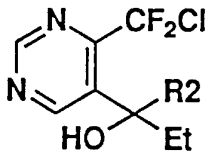
,

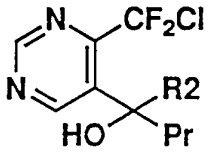
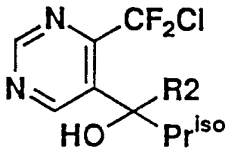

N
CHFCl
N
R2
OH

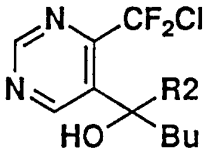
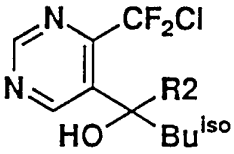
,

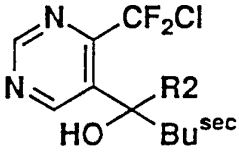
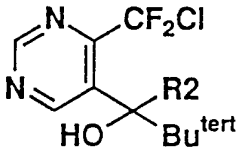
R 2
Me, Et, Pr, Pr^{iso}, Pr^{cyclo}, Bu, Bu^{sec}, Bu^{iso}, Bu^{tert}, Bu^{cyclo}, Pn, Pn^{neo}, Pn^{iso}, Pn^{cyclo}, Hex, Hex^{cyclo}, $C(Me)_2(CH_2F)$, CF_3, CH_2CF_3, Ph, 2-Cl-Ph, 3-Cl-Ph, 4-Cl-Ph, 2-F-Ph, 3-F-Ph, 4-F-Ph, 2-CF_3-Ph, 3-CF_3-Ph, 4-CF_3-Ph, 2-Me-Ph, 3-Me-Ph, 4-Me-Ph, 2-MeO-Ph, 3-MeO-Ph, 4-MeO-Ph, 2-CF_3O-Ph, 3-CF_3O-Ph, 4-CF_3O-Ph, 2-Br-Ph, 3-Br-Ph, 4-Br-Ph, 2, 4-Cl_2-Ph, 3, 4-Cl_2-Ph, 2, 6-Cl_2-Ph, 2-F-4-Cl-Ph, 2, 4-F_2-Ph, 3, 4-F_2-Ph, 2, 5-Cl_2-Ph, 2, 3-Cl_2-Ph, 2, 6-F_2-Ph, CH_2Br
3, 5-Cl_2-Ph, 2-Me-4-Cl-Ph, 2Me-4-F-Ph, 1-$MeSO_2$-Et, 1-Me-Pr^{cyclo}, 1-F-Pr^{cyclo}, 1-Cl-Pr^{cyclo}, 1-MeS-Pr^{cyclo}, 1-EtS-Pr^{cyclo}, CH_2Cl, $CF(Me)_2$, 1-Pr^{cyclo}-Et, $CH_2CH=CH_2$, $CH_2C\equiv CH$, $CH(Me)C\equiv CH$, $C(Me)_2C\equiv CH$, $CH(Me)CH=CH_2$, 4-Bu^{tert}-Ph, 3-Bu^{tert}-Ph, 2-Bu^{tert}-Ph, 2-Et-Ph, 3-Et-Ph, 4-Et-Ph, 2-Pr-Ph, 3-Pr-Ph, 4-Pr-Ph, 2-Bu-Ph, 3-Bu-Ph, 4-Bu-Ph, 2-EtO-Ph, 2-$Pr^{iso}O$-Ph, 2-PrO-Ph,

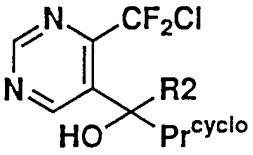
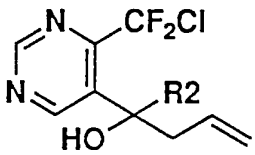
〔第4-3表〕

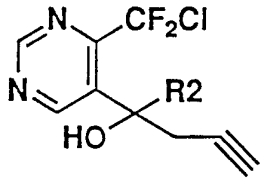

N
CF2Cl
N
R2
HO
Me
,

N
CF2Cl
N
R2
HO
Et
,

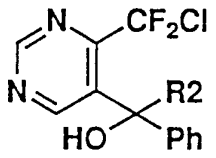

N
CF2Cl
N
R2
HO
Pr
,

N
CF2Cl
N
R2
HO
Priso
,

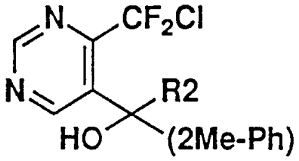

N
CF2Cl
N
R2
HO
Bu
,

N
CF2Cl
N
R2
HO
Buiso
,

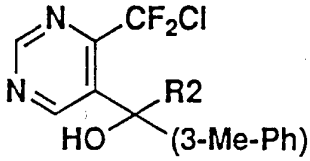

N
CF2Cl
N
R2
HO
Busec
,

N
CF2Cl
N
R2
HO
Butert
,

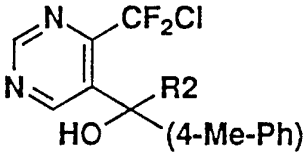

N
CF2Cl
N
R2
HO
Prcyclo
,

N
CF2Cl
N
R2
HO
,

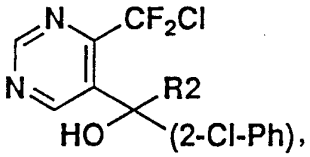

N
CF2Cl
N
R2
HO
,

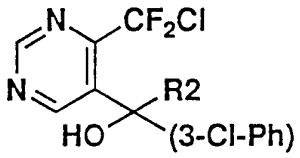

N
CF2Cl
N
R2
HO
Ph
,

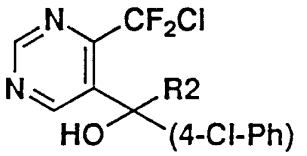

N
CF2Cl
N
R2
HO
(2Me-Ph)
,

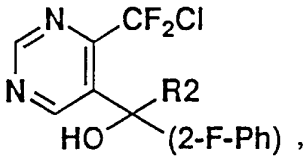

N
CF2Cl
N
R2
HO
(3-Me-Ph)
,

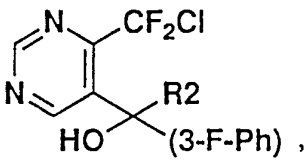

N
CF2Cl
N
R2
HO
(4-Me-Ph)
,

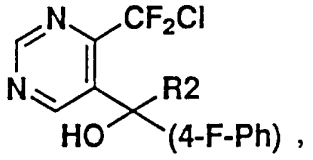

N
CF2Cl
N
R2
HO
(2-Cl-Ph)
,

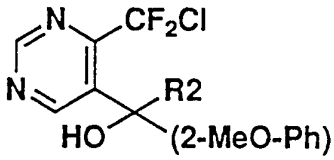

N
CF2Cl
N
R2
HO
(3-Cl-Ph)
,

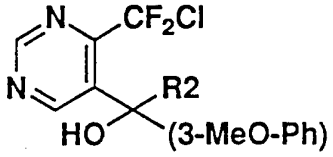

N
CF2Cl
N
R2
HO
(4-Cl-Ph)
,

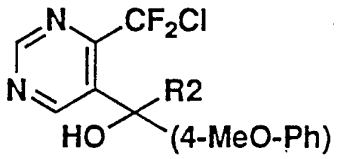

N
CF2Cl
N
R2
HO
(2-F-Ph)
,

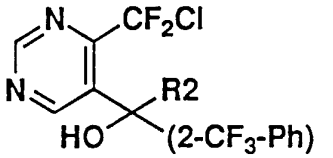

N
CF2Cl
N
R2
HO
(3-F-Ph)
,

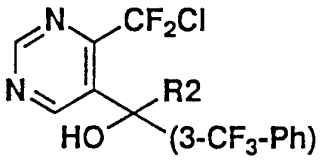

N
CF2Cl
N
R2
HO
(4-F-Ph)
,

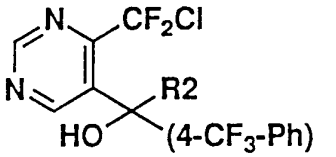

N
CF2Cl
N
R2
HO
(2-MeO-Ph)
,

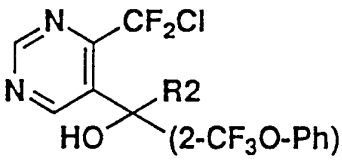

N
CF2Cl
N
R2
HO
(3-MeO-Ph)
,

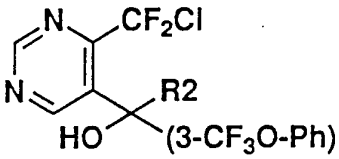

N
CF2Cl
N
R2
HO
(4-MeO-Ph)
,

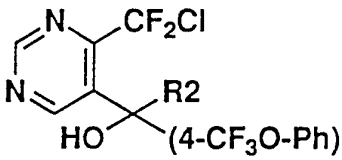

N
CF2Cl
N
R2
HO
(2-CF3-Ph)
,


N
CF2Cl
N
R2
HO
(3-CF3-Ph)
,


N
CF2Cl
N
R2
HO
(4-CF3-Ph)
,


N
CF2Cl
N
R2
HO
(2-CF3O-Ph)
,


N
CF2Cl
N
R2
HO
(3-CF3O-Ph)
,


N
CF2Cl
N
R2
HO
(4-CF3O-Ph)

R 2
Me, Et, Pr, Pr^{iso}, Pr^{cyclo}, Bu, Bu^{sec}, Bu^{iso}, Bu^{tert}, Bu^{cyclo}, Pn, Pn^{neo}, Pn^{iso}, Pn^{cyclo}, Hex, Hex^{cyclo}, $C(Me)_2(CH_2F)$, CF_3, CH_2CF_3, Ph, 2-Cl-Ph, 3-Cl-Ph, 4-Cl-Ph, 2-F-Ph, 3-F-Ph, 4-F-Ph, 2-CF_3-Ph, 3-CF_3-Ph, 4-CF_3-Ph, 2-Me-Ph, 3-Me-Ph, 4-Me-Ph, 2-MeO-Ph, 3-MeO-Ph, 4-MeO-Ph, 2-CF_3O-Ph, 3-CF_3O-Ph, 4-CF_3O-Ph, 2-Br-Ph, 3-Br-Ph, 4-Br-Ph, 2, 4-Cl_2-Ph, 3, 4-Cl_2-Ph, 2, 6-Cl_2-Ph, 2-F-4-Cl-Ph, 2, 4-F_2-Ph, 3, 4-F_2-Ph, 2, 5-Cl_2-Ph, 2, 3-Cl_2-Ph, 2, 6-F_2-Ph, CH_2Br
3, 5-Cl_2-Ph, 2-Me-4-Cl-Ph, 2Me-4-F-Ph, 1-$MeSO_2$-Et, 1-Me-Pr^{cyclo}, 1-F-Pr^{cyclo}, 1-Cl-Pr^{cyclo}, 1-MeS-Pr^{cyclo}, 1-EtS-Pr^{cyclo}, CH_2Cl, $CF(Me)_2$, 1-Pr^{cyclo}-Et, $CH_2CH=CH_2$, $CH_2C\equiv CH$, $CH(Me)C\equiv CH$, $C(Me)_2C\equiv CH$, $CH(Me)CH=CH_2$, 4-Bu^{tert}-Ph, 3-Bu^{tert}-Ph, 2-Bu^{tert}-Ph, 2-Et-Ph, 3-Et-Ph, 4-Et-Ph, 2-Pr-Ph, 3-Pr-Ph, 4-Pr-Ph, 2-Bu-Ph, 3-Bu-Ph, 4-Bu-Ph, 2-EtO-Ph, 2-$Pr^{iso}O$-Ph, 2-PrO-Ph,

但し、表中の記号は以下の意味を表す。

Ph：Phenyl

Me：CH_3

Et：C_2H_5

Pr, Pr^n：$CH_2CH_2CH_3$

Pr^{iso}：$CH(CH_3)_2$

Pr^{cyclo}：$CH(CH_2)_2$

Bu, Bu^n：$CH_2CH_2CH_2CH_3$

Bu^{sec}：$CH(CH_3)C_2H_5$

Bu^{iso}：$CH_2CH(CH_3)_2$

Bu^{tert}：$C(CH_3)_3$

Bu^{cyclo}：$CH(CH_2)_3$

Pn, Pn^n：$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$

Pn^{cyclo}：$CH(CH_2)_4$

Pn^{iso}：$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$

Pn^{neo}：$CH_2C(CH_3)_3$

Hex, Hex^n：$CH_2(CH_2)_4CH_3$

Hep, Hep^n：$CH_2(CH_2)_5CH_3$

Oct, Oct^n：$CH_2(CH_2)_6CH_3$

4-Cl-Ph：4-Cl-Phenyl

本発明化合物を除草剤及び植物成長調節剤として施用するにあたっては、一般には適当な担体、例えばクレー、タルク、ベントナイト、尿素、硫酸アンモニウム、クルミ粉、珪藻土、ホワイトカーボン等の固体担体あるいは水、アルコール類(イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール、ベンジルアルコール、フルフリルアルコール等)、芳香族炭化水素類(トルエン、キシレン、メチルナフタレン等)、エーテル類(アニソール等)、植物油(大豆油、綿実油等)、ケトン類(シクロヘキサノン、イソホロン等)、エステル類(酢酸ブチル等)、酸アミド類(N-メチルピロリドン等)またはハロゲン化炭化水素類(クロルベンゼン等)

などの液体担体と混用して適用することができ、所望により界面活性剤、乳化剤、分散剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、固結防止剤、安定剤などを添加し、液剤、乳剤、水和剤、ドライフロアブル剤、フロアブル剤、粉剤、粒剤等任意の剤型にて実用に供することができる。

また、本発明化合物は必要に応じて製剤または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤などと混合施用しても良い。

特に他の農薬と混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用によるスペクトラムの拡大や、より高い除草効果或いは植調効果が期待できる。この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。本発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック(Farm Chemicals Handbook)1994年版に記載されている化合物などがある。

本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、気象条件、製剤形態、土壌条件、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール(ha)当たり0.000001~10kg程度、好ましくは0.00001~5kg程度が適当である。但し、植物種子の発芽及び初期生育促進に使用する場合は有効成分濃度が、0.01~100ppbとなるように調整して使用するのが好ましい。

次に具体的に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

〔水和剤〕

本発明化合物-------0.1~80部

固体担体 ----------10~90部

界面活性剤 ---------- 1~10部

その他 ---------- 1~ 5部

その他として、例えば固結防止剤などがあげられる。

〔乳剤〕

本発明化合物-------0.1～30部

液体担体 ----------30～95部

界面活性剤 ---------- 5～15部

〔フロアブル剤〕

本発明化合物-------0.1～70部

液体担体 ----------15～65部

界面活性剤 ---------- 5～12部

その他 ---------- 5～30部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等があげられる。

〔粒状水和剤(ドライフロアブル剤)〕

本発明化合物-------0.1～90部

固体担体 ----------10～70部

界面活性剤 ---------- 1～20部

〔粒剤〕

本発明化合物-------0.0001～10部

固体担体 ----------90～99.9999部

その他 ----------0.1～10部

〔液剤〕

本発明化合物-------0.00001～30部

液体担体 ----------0.1～50部

水 ----------50～99.99部

その他 ----------0～10部

〔塗布剤〕

本発明化合物-------1～50部

液体担体 ----------30～95部

増粘剤 ----------5～50部

〔樹幹注入剤〕

本発明化合物-------0.01~30部

液体担体 ----------70~99.99部

〔配合例1〕水和剤

本発明化合物 No.5 ------50部

ジークライトPFP -------43部

(カオリン系クレー:ジークライト工業(株)商品名)

ソルポール5050 ---------- 2部

(アニオン性界面活性剤:東邦化学工業(株)商品名)

ルノックス1000C -------- 3部

(アニオン性界面活性剤:東邦化学工業(株)商品名)

カープレックス#80(固結防止剤)---- 2部

(ホワイトカーボン:塩野義製薬(株)商品名)

以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

〔配合例2〕乳剤

本発明化合物 No.24------ 3部

キシレン ----------76部

イソホロン ----------15部

ソルポール3005X -------- 6部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物:東邦化学工業(株)商品名)

以上を均一に混合して乳剤とする。

〔配合例3〕フロアブル剤

本発明化合物 No.103-----35部

アグリゾールS-711 -------- 8部

(非イオン性界面活性剤:花王(株)商品名)

ルノックス1000C ---------0.5部

(アニオン性界面活性剤:東邦化学工業(株)商品名)

1%ロドポール水 ----------20部

(増粘剤:ローン・プーラン社商品名)

エチレングリコール(凍結防止剤)---- 8部

水 ----------28.5部

以上を均一に混合して、フロアブル剤とする。

〔配合例4〕粒状水和剤(ドライフロアブル剤)

本発明化合物 No.111-----75部

イソバンNo.1 ----------10部

(アニオン性界面活性剤:クラレイソプレンケミカル(株)商品名)

バニレックスN ---------- 5部

(アニオン性界面活性剤:山陽国策パルプ(株)商品名)

カープレックス#80 ------10部

(ホワイトカーボン:塩野義製薬(株)商品名)

以上を均一に混合微粉砕してドライフロアブル剤とする。

〔配合例5〕粒剤

本発明化合物 No.123-----0.1部

ベントナイト ----------50.0部

タルク ----------44.9部

トキサノンGR-31A --------- 5部

(アニオン性界面活性剤:三洋化成工業(株)商品名)

以上を均一に混合粉砕した後、少量の水を加えて撹拌混合捏和し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤にする。

〔配合例6〕液剤

本発明化合物 No.101---------- 3部

1-メトキシ-2-プロパノール--- 20部

水 ---------- 77部

以上を混合して均一溶液とし、液剤にする。

〔配合例7〕液剤

本発明化合物 No.103----------0.0001部

1-メトキシ-2-プロパノール---- 1.0部

水 ----------98.9999 部

以上を混合して均一溶液とし、液剤にする。

〔配合例8〕塗布剤

本発明化合物 No.124 ----------10部

チクソゲルVP----------10部

(日産ガードラー触媒(株)商品名)

キシレン----------80部

〔配合例9〕塗布剤

本発明化合物 No.119 ----------15部

チクソゲルVP----------10部

(日産ガードラー触媒(株)商品名)

ハイゾール100----------75部

(日石化学 商品名)

〔配合例10〕樹幹注入剤

本発明化合物 No.114 ---------- 6部

イソプロパノール----------94部

〔配合例11〕樹幹注入剤

本発明化合物 No.106 ---------- 5部

エタノール----------95部

使用に際しては上記水和剤、乳剤、フロアブル剤、粒状水和剤は水で50~1000倍に希釈して、有効成分が1ヘクタール(ha)当たり0.000001~10kgになるように散布する。

次に、本発明化合物の除草剤及び植物成長調節剤としての有用性を以下の試験例において具体的に説明する。

〔試験例1〕湛水条件における雑草発生前処理による除草効果試験

1/5000アールのワグネルポット中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4cmの湛水条件とする。上記のポットにノビエ、ホタルイ、コナギ、キカシグサの種子、ウリカワ、ミズガヤツリの塊茎をそれぞれ混播した後、2葉期のイネを移植した。ポットを25~30℃の温室内に置いて植物を育成し、播種後1日目に水面へ所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を処理した。処理後3週間目に、各種雑草に対する除草効果及びイネに及ぼす影響について調査を行った。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を第5-1表に示す。

なお、各表中のNo.は実施例に記載した化合物No.に対応し、記号は次の意味を示す。

A:ノビエ、B:ホタルイ、C:コナギ、D:キカシグサ、E:ウリカワ、F:ミズガヤツリ、a:イネ

〔試験例2〕湛水条件における雑草発生後処理による除草効果試験

1/5000アールのワグネルポット中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4cmの湛水条件とする。ノビエ、ホタルイ、コナギ、キカシグサの種子をそれぞれ上記のポットに混播した。ポットを25~30℃の温室に置いて植物を育成し、播種後14日目に水面へ所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を処理した。処理後3週間目に、各種雑草に対する除草効果の調査を行った。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を第5-2表に示す。

なお、各表中のNo.は実施例に記載した化合物No.に対応し、記号は次の意味を示す。

A:ノビエ、B:ホタルイ、C:コナギ、D:キカシグサ

〔試験例3〕土壌処理による除草効果試験

縦33cm、横33cm、深さ8cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、ノビエ、エノコログサ、カラスムギ、ブラックグラス、イチビ、オナモミ、アオビユ、アサガオ、オオイヌノフグリ、ハコベ、イネ、トウモロコシ、コムギ、ダイズ、ワタ、ビートの種子を混播、約1.5cm覆土した後、所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を土壌表面へ均一に散布した。薬液散布後3週間目に各種雑草に対する除草効果及び作物に及ぼす影響について調査を行った。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を第5-3表に示す。

なお、各表中のNo.は実施例に記載した化合物No.に対応し、記号は次の意味を示す。

G:ノビエ、H:エノコログサ、I:カラスムギ、J:ブラックグラス、K:イチビ、L:オナモミ、M:アオビユ、N:アサガオ、O:オオイヌノフグリ、P:ハコベ、a:イネ、b:トウモロコシ、c:コムギ、d:ダイズ、e:ワタ、f:ビート

〔試験例4〕茎葉処理による除草効果試験

縦33cm、横33cm、深さ8cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、ノビエ、エノコログサ、カラスムギ、ブラックグラス、イチビ、オナモミ、アオビユ、アサガオ、オオイヌノフグリ、ハコベ、イネ、トウモロコシ、コムギ、ダイズ、ワタ、ビートの種子を混播、約1.5cm覆土した後、25~30℃の温室に置いて植物を14日間育成し、所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を茎葉部へ均一に散布した。薬液散布後3週間目に各種雑草に対する除草効果及び作物に及ぼす影響について調査を行った。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を第5-4表に示す。

なお、各表中のNo.は実施例に記載した化合物No.に対応し、記号は次の意味を示す。

G:ノビエ、H:エノコログサ、I:カラスムギ、J:ブラックグラス、K:イチビ、L:オナモミ、M:アオビユ、N:アサガオ、O:オオイヌノフグリ、P:ハコベ、a:イネ、b:トウモロコシ、c:コムギ、d:ダイズ、e:ワタ、f:ビート

〔試験例5〕茎葉処理による矮化効果試験

内径12cm,深さ11cmのプラスチック製ポットに殺菌した洪積土壌を入れ、イネ、コムギ、バミューダグラス、ベントグラスの種子をそれぞれポット別に播種し、約1cm覆土した。ポットを25~30℃の温室内に置いて植物を育成し、各種植物が1-2葉期に達した時、配合例に準じて調整した本発明化合物を、所定の割合の有効成分量で、各種植物の茎葉部全面に小型スプレーで均一に散布した。薬液散布後2週間目に各種雑草に対する矮化効果を調査した。調査は草丈及び葉齢を測定した。結果は第5-5表に示した。なお、各表中のNo.は実施例に記載した化合物No.に対応し、記号は次の意味を示す。

A:イネ、B:コムギ、C:バミューダグラス、D:ベントグラス

〔試験例6〕湛水条件における矮化効果試験

1/10,000アールのプラスチック製ポットに沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4cmの湛水条件とする。育苗箱で育成した約2葉期のイネをポットに移植し、このポットを25~30℃の温室内に置いてイネを育成し、イネが約3.5葉期に達した時、水面に所定の割合になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を処理した。薬液処理後2週間目に、イネに対する矮化効果を調査した。調査は草丈及び葉齢を測定した。結果は第5-6表に示した。なお、各表中のNo.は実施例に記載した化合物No.に対応し、記号は次の意味を示す。

E:イネ

[試験例7]茎葉処理による矮化効果試験

内径12cm、深さ11cmのプラスチック製ポットに殺菌した洪積土を入れ、バミューダグラス、ベントグラス、ダイズ、ワタ、コムギの種子をそれぞれポット別に播種し、約1cm覆土した。ポットを25~30℃の温室内に置いて植物を育成し、各種植物が1~2葉期に達したとき、有効成分が所定の割合となるように茎葉

部へ均一に散布した。散布の際の薬液は、配合例に準じて調製した本発明化合物を、小型スプレーで各種植物の茎葉部の全面に散布した。薬液散布後2週間目に各種植物に対する矮化効果を調査した。調査は、草丈及び葉齢を測定した。結果は第5-7表に表した。

なお、各表中のNo.は実施例に記載した化合物No.に対応し、記号は次の意味を示す。

A:バミューダグラス、B:ベントグラス、C:ダイズ、D:ワタ、E:コムギ

[試験例8] 茎葉処理による矮化効果試験

内径12cm、深さ11cmのプラスチック製ポットに殺菌した洪積土を入れ、バミューダグラス、ベントグラス、ダイズ、ワタ、コムギ、イネの種子をそれぞれポット別に播種し、約1cm覆土した。ポットを25~30℃の温室内に置いて植物を育成し、各種植物が1~2葉期に達したとき、有効成分が所定の割合となるように茎葉部へ均一に散布した。散布の際の薬液は、配合例に準じて調製した本発明化合物を、小型スプレーで各種植物の茎葉部の全面に散布した。薬液散布後2週間目に各種植物に対する矮化効果を調査した。調査は、草丈及び葉齢を測定した。結果は第5-8表に表した。

なお、各表中のNo.は実施例に記載した化合物No.に対応し、記号は次の意味を示す。

A:バミューダグラス、B:ベントグラス、C:ダイズ、D:ワタ、E:コムギF:イネ

〔第5-1表〕湛水条件における雑草発生前処理による除草効果試験

No.	薬量(g/a)	A	B	C	D	E	F	a
2	20	5	3	0	2	0	0	1
4	20	2	5	5	5	4	0	0
5	20	5	4	4	5	0	0	0
6	20	5	3	5	5	0	0	0
7	20	4	1	1	5	2	2	0
8	8.3	2	3	—	—	3	2	0
9	20	2	3	3	5	2	0	0
10	20	4	1	1	5	1	2	2
11	14.8	4	0	1	5	0	0	2
12	10	3	—	—	3	2	2	0
13	10	4	2	3	5	1	3	2
14	10	1	2	3	5	0	0	0
16	10	0	0	0	2	0	0	0
17	10	0	0	2	2	0	0	0
18	10	0	0	—	2	0	2	0
19	10	0	0	0	2	0	0	0
20	10	5	5	5	5	0	3	0
21	10	5	5	5	5	0	2	0
22	10	5	5	5	5	0	0	2
23	10	5	5	5	5	0	3	0
24	10	5	5	5	5	4	3	1
101	20	5	0	0	2	0	—	1

No.	薬量(g/a)	A	B	C	D	E	F	a
102	6.4	0	0	0	0	0	—	0
103	10	5	5	5	5	5	5	2
104	20	1	1	1	5	0	0	0
105	20	5	5	5	5	0	5	0
106	20	5	5	5	5	5	5	3
107	20	1	—	—	5	2	2	0
108	20	—	4	—	5	3	4	0
109	20	2	4	0	5	—	—	0
110	5.9	5	2	2	5	0	3	2
111	10	5	5	5	5	4	5	3
112	10	5	3	4	5	3	5	3
113	20	2	2	2	5	1	3	0
114	10	5	5	5	5	5	5	2
115	10	2	2	2	2	0	0	0
116	10	4	5	5	5	0	3	0
117	10	3	3	4	5	0	0	0
118	10	5	5	5	5	0	5	0
119	10	5	5	5	5	2	3	0
120	10	0	2	3	3	2	0	0
121	10	5	5	5	5	0	2	0
122	10	4	2	5	5	0	0	2
123	10	5	5	5	5	5	3	1
124	10	5	5	5	5	3	5	0

〔第5-2表〕湛水条件における雑草発生後処理による除草効果試験

No.	薬量(g/a)	A	B	C	D
2	20	4	0	0	0
4	20	0	4	4	0
5	20	0	0	3	5
7	20	1	1	1	3
8	8.3	2	—	—	5
9	20	0	0	1	2
10	20	4	1	1	3
11	14.8	4	2	3	3
12	10	2	—	—	—
13	10	4	2	—	5
14	10	2	1	4	4
16	10	0	0	2	1
18	10	0	0	2	0
19	10	0	0	2	2
20	10	5	3	5	4
21	10	3	0	5	4
22	10	0	0	2	2
23	10	5	5	5	5
24	10	5	5	5	5
101	20	4	0	0	0
103	10	5	5	5	5
104	20	0	0	2	5

No.	薬量(g/a)	A	B	C	D
105	20	5	5	5	5
106	20	4	4	5	3
108	20	3	4	0	5
109	20	3	4	0	5
110	5.9	3	1	1	2
111	10	5	3	5	4
112	10	4	2	3	5
113	20	1	2	2	4
114	10	4	3	5	5
116	10	4	2	5	3
117	10	2	0	3	4
118	10	4	0	3	2
119	10	5	2	5	4
120	10	1	0	0	0
121	10	5	0	4	4
122	10	3	2	3	3
123	10	5	4	5	5
124	10	5	5	5	5

〔第5-3表〕土壌処理による除草効果試験

No.	薬量 (g/a)	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	a	b	c	d	e	f
2	50	3	2	3	2	4	3	2	4	5	5	−	2	0	2	0	1
3	50	0	0	0	0	1	4	5	2	4	5	0	0	0	0	0	1
5	50	0	0	0	0	0	0	5	0	5	5	0	0	0	0	0	0
6	50	0	0	0	0	2	0	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0
7	50	3	0	0	3	5	3	5	3	5	5	1	0	0	2	0	4
8	20.8	0	0	0	0	2	0	5	0	3	3	0	0	0	0	0	0
9	50	0	0	2	0	4	4	5	0	4	3	0	0	0	0	0	1
10	50	5	4	0	0	5	4	5	4	5	5	2	1	0	1	2	3
11	37	5	4	3	3	4	4	5	4	5	5	3	2	0	0	0	1
13	25	0	1	0	0	1	0	5	2	4	4	0	0	0	0	0	0
14	25	0	0	0	0	0	0	4	0	0	3	0	0	0	0	0	1
16	25	0	0	0	2	0	0	5	0	5	4	0	0	0	0	0	2
18	25	0	0	−	−	0	0	4	0	0	3	0	0	0	0	0	0
19	25	0	0	−	−	0	0	5	0	2	3	0	0	−	0	0	0
20	25	5	4	0	2	0	0	5	0	5	5	0	0	0	0	0	2
21	25	0	0	0	0	0	0	5	0	5	5	0	0	0	0	0	0
22	25	4	3	3	3	2	4	5	4	5	5	2	1	0	0	1	2
23	25	0	0	0	0	0	0	5	2	5	5	0	0	0	0	1	3
24	25	5	4	3	5	0	3	5	3	5	5	1	0	2	0	0	5
101	50	5	−	4	4	5	4	5	4	5	5	−	2	1	3	2	2

No.	薬量 (g/a)	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	a	b	c	d	e	f
102	16	0	0	0	0	0	0	2	0	0	0	−	0	0	0	0	0
103	25	5	5	5	4	5	4	5	5	5	5	5	4	3	4	4	4
104	50	4	5	0	0	4	0	5	0	5	3	−	0	0	1	0	0
105	50	5	5	0	5	3	2	5	5	5	5	−	0	4	0	0	1
106	50	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	3	3	5	3	4
108	50	5	4	3	0	5	3	5	2	5	4	0	0	0	3	1	0
109	50	0	0	0	0	2	0	4	0	5	2	0	0	0	0	0	0
110	15	5	5	2	2	5	4	5	3	5	5	3	1	0	0	1	1
111	25	5	5	2	5	5	4	5	3	5	5	2	1	0	2	0	3
112	25	5	4	3	5	4	5	5	4	5	5	2	1	1	2	1	3
114	25	5	5	0	4	5	5	5	5	5	5	4	3	0	4	3	4
116	25	5	5	4	−	0	0	4	0	4	4	2	0	0	0	0	2
117	25	0	0	0	−	0	0	5	0	4	3	0	0	−	0	0	0
118	25	4	0	−	−	0	0	4	0	2	0	0	0	−	0	0	0
119	25	5	5	0	0	4	4	5	5	5	5	1	0	0	0	0	4
121	25	0	0	0	0	0	0	5	0	5	5	0	0	0	0	0	1
122	25	5	3	0	4	4	2	5	3	5	5	2	0	0	1	0	1
123	25	5	5	3	5	5	5	5	4	5	5	3	3	3	3	3	5
124	25	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	3	3	3	4	4

〔第5-4表〕茎葉処理による除草効果試験

No.	薬量 (g/a)	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	a	b	c	d	e	f
2	50	2	1	2	1	0	1	0	3	1	3	1	1	0	0	0	0
3	50	0	0	0	0	0	0	0	0	0	1	0	0	0	0	0	0
5	50	0	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0
7	50	3	0	0	0	1	1	1	2	2	2	0	0	0	0	0	0
8	21	0	0	0	2	0	0	0	0	3	4	0	0	0	0	0	0
9	50	3	0	4	3	1	0	5	0	2	5	0	0	0	0	0	1
10	50	0	3	0	1	3	3	2	2	2	4	0	0	1	0	0	0
11	37	4	4	1	4	3	3	4	5	3	4	1	1	0	1	0	0
12	25	1	0	0	0	2	0	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0
13	25	1	1	0	0	1	0	3	0	0	2	0	0	0	0	0	0
14	25	0	0	0	0	0	0	4	0	0	3	0	0	0	0	0	1
16	25	0	0	0	3	3	0	0	0	4	3	0	0	0	0	0	0
19	25	0	0	0	0	0	0	2	−	0	0	0	0	0	0	0	0
22	25	0	−	2	2	0	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	0
24	25	1	1	3	4	0	2	0	0	5	5	0	0	0	0	0	2
101	50	3	2	3	4	3	2	2	3	3	4	1	2	1	2	1	1
102	16	0	0	0	0	0	0	1	0	0	1	0	0	0	0	0	0
103	25	5	4	3	5	2	5	3	3	4	4	1	2	1	3	1	2
104	50	0	2	0	0	3	3	2	1	3	1	0	0	0	0	0	0
105	50	5	5	0	5	3	3	5	3	5	5	3	0	0	1	1	4

No.	薬量 (g/a)	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	a	b	c	d	e	f
106	50	4	3	5	5	4	5	3	5	5	4	4	1	3	3	0	3
108	50	3	3	3	4	2	0	2	0	4	4	0	0	1	0	0	1
109	50	3	2	0	0	0	0	3	2	3	4	0	0	0	0	0	0
110	15	3	5	2	3	3	1	3	3	3	4	1	1	1	0	0	0
111	25	4	4	3	3	3	3	3	4	3	3	1	1	1	2	1	0
112	25	4	4	3	3	3	2	3	4	3	3	1	1	1	1	1	0
114	25	4	5	4	4	4	5	4	5	4	4	1	2	0	3	1	2
116	25	4	3	0	3	3	5	3	5	5	3	0	0	0	1	0	1
117	25	0	0	0	2	0	0	0	—	5	0	0	0	0	0	0	0
118	25	5	0	0	4	4	0	4	—	3	0	1	0	0	0	0	0
119	25	5	3	0	4	3	2	4	3	5	5	4	1	2	2	1	3
121	25	0	0	0	0	0	0	0	0	4	4	0	0	0	0	0	2
122	25	2	2	0	3	0	2	2	4	0	3	1	0	2	0	0	0
123	25	3	3	3	4	3	2	2	1	5	5	2	2	1	1	0	2
124	25	5	4	2	4	3	3	3	2	5	5	3	3	1	2	1	2

〔第5-5表〕茎葉処理による矮化効果試験

化合物 No.	薬量 (g/a)	草丈 (cm) A	B	C	D	葉齢 (葉期) A	B	C	D
1	0.1	37	29	15	15	5.5	4.6	5.5	3.5
	0.4	30	28	15	14	5.0	4.6	5.5	3.5
	1.6	30	26	15	10	5.0	4.6	5.5	3.5
	6.3	25	25	12	8	5.2	4.5	6.0	3.8
	25	17	23	8	5	5.5	4.6	6.0	3.8
無処理区	−	36	30	17	15	5.5	4.6	5.5	3.5

〔第5-6表〕湛水条件における矮化効果試験

化合物 No.	薬量 (g/a)	草丈 (cm) E	葉齢 (葉期) E
1	0.01	51	5.7
	0.1	51	5.8
	1	47	5.6
	10	37	5.5
無処理区	−	53	5.5

〔第5-7表〕茎葉処理による矮化効果試験

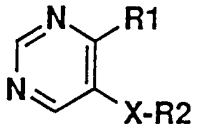
No.	薬量	草丈（cm）					葉齢（葉期）				
	(g/a)	A	B	C	D	E	A	B	C	D	E
101	1.6	14	4.5	41	22	24	5.5	3.5	4.5	2.1	5.0
	6.3	11	3	33	18	21	5.5	3.5	5.5	2.2	5.0
	25	3	1.5	22	13	20	5.5	3.5	4.0	2.0	4.8
無処理区	——	22	14	33	18	23	5.5	3.5	4.5	2.0	5.0

〔第5-8表〕茎葉処理による矮化効果試験

化合物 No.	薬量 (g/a)	草丈 (cm) A	B	C	D	E	F	葉齢（葉期） A	B	C	D	E	F
103	1.6	11	4	25	11	25	25	5.5	4.3	3.0	1.8	5.0	4.8
	6.3	6	3	15	9	22	20	5.3	2.5	3.0	1.2	5.0	4.5
無処理区	—	14	15	26	12	26	34	6.0	5.0	3.2	1.8	5.3	4.8

請求の範囲

1. 式(I):



(I)

〔式中、R1はC_1-C_6ハロアルキル基、C_1-C_6アルキル基、C_3-C_6シクロアルキル基、C_3-C_6ハロシクロアルキル基または任意に置換されていても良いフェニル基(但し、置換基はハロゲン原子、C_1-C_4アルキル基、C_1-C_4アルコキシ基、C_1-C_3ハロアルキル基、C_1-C_3ハロアルコキシ基またはフェニル基から選択される。)を表し、R2は水素原子、C_1-C_6アルキル基、C_3-C_6シクロアルキル基、C_3-C_6シクロアルキル(C_1-C_4)アルキル基、C_1-C_6ハロアルキル基、C_3-C_6ハロシクロアルキル基、C_3-C_8アルケニル基、C_3-C_8アルキニル基、C_1-C_2スルホニル(C_1-C_4)アルキル基、C_1-C_4アルキルチオ(C_3-C_6)シクロアルキル基、任意に置換されていても良いフェニル基(但し、置換基はハロゲン原子、C_1-C_4アルキル基、C_1-C_4アルコキシ基、C_1-C_3ハロアルキル基、C_1-C_3ハロアルコキシ基またはフェニル基から選択される。)を表し、Xはカルボニル基または-C(R3)OH基(但し、R3は水素原子、C_1-C_6アルキル基、C_3-C_8アルケニル基、C_3-C_8アルキニル基または任意に置換されていても良いフェニル基(但し、置換基はハロゲン原子、C_1-C_4アルキル基、C_1-C_4アルコキシ基、C_1-C_3ハロアルキル基、C_1-C_3ハロアルコキシ基またはフェニル基から選択される。)を表す。(但し、炭素原子が光学活性炭素の場合は、ラセミ体及び単離されたそれぞれの2種の光学異性体の双方を包含する。)〕で表される新規ピリミジン誘導体。

2. 請求項1記載の新規ピリミジン誘導体を含有する除草剤。

3. 請求項1記載の新規ピリミジン誘導体を含有する植物成長調節剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP94/01311

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl^6 C07D239/26, A01N43/54

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl^6 C07D239/26, A61K43/54

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAS ONLINE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	J. Heterocyclic Chem., Vol. 20, No. 3, (1983) Luisa Mosti, et al "Reaction of 2-Dimethylaminomethylene-1,3-diones with Dinucleophiles. III. Synthesis of 5-Acylpyrimidines and 7,8-Dihydroquinazolin-5(6H)-ones", P. 649-654, Compound IIa of Table I	X

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
September 22, 1994 (22. 09. 94)	October 11, 1994 (11. 10. 94)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP 94/01311

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））

Int. Cl[6] C07D239/26, A01N43/54

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））

Int. Cl[6] C07D239/26, A61K43/54

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

CAS ONLINE

C. 関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求の範囲の番号
X	J. Heterocyclic Chem., 第20巻, 第3号, (1983) Luisa Mosti, et al 「Reaction of 2-Dimethylaminomethylene-1,3-diones with Dinucleophiles. III. Synthesis of 5-Acylpyrimidines and 7,8-Dihydroquinazolin-5(6H)-ones」, p.649-654, Table IのCompound IIa	X

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー
「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献
「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日	国際調査報告の発送日
22.09.94	11.10.94

名称及びあて先
日本国特許庁(ISA/JP)
郵便番号100
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官（権限のある職員）
内藤伸一 印 4C 8615

電話番号 03-3581-1101 内線 3452