

## 새로운 Pyridylimidazolinone 유도체의 합성과 제조활성

전동주 · 장해성 · 황인택 · 김대황\*

한국화학연구소

**요약** : Imidazolinone 계열 제초제의 골간지를 변화시킨 새로운 구조, 즉, pyridine의 3번 위치의 carboxyl기 대신에 *N*-(2-hydroxyethyl)- $\alpha$ -dicarbonylamide기를 도입한 화합물들(2) 및 *N*-ethoxycarbonylthioamide기 및 *N*-benzoylthioamide기와 같은 산도가 높은 thioamide기를 도입한 화합물들(3)을 합성하여, 그 것들의 제조활성을 9종의 초종에 대하여 잡초 발아 전 토양처리와 발아 후 경엽처리를 통하여 조사하였다. 이들의 제조활성은 전체적으로 광엽에 대한 제조활성보다 화본과 잡초에 대한 제조활성이 강하게 나타났다. *N*-(2-hydroxyethyl)- $\alpha$ -dicarbonylamide기를 도입한 화합물들(2)은 대부분 250 g/ha의 약량에서 강한 제조활성을 나타냈으며, 특히 화합물 2a는 발아 후 경엽처리 효과가 가장 강하여 대상초종 모두를 90% 이상 방제하였다. *N*-ethoxycarbonylthioamide기를 도입한 화합물(3a)은 시험초종의 대부분에 대하여 비교적 강한 제조활성을 나타냈으나, *N*-benzoylthioamide기를 도입한 화합물(3b)은 화본과 잡초는 물론 광엽잡초에 대한 제조활성이 거의 나타나지 않았다.(1999년 9월 10일 접수, 1999년 9월 30일 수리)

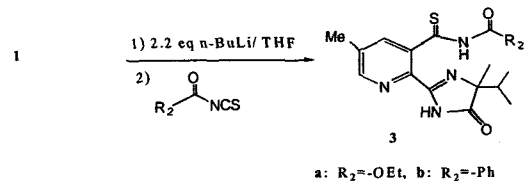
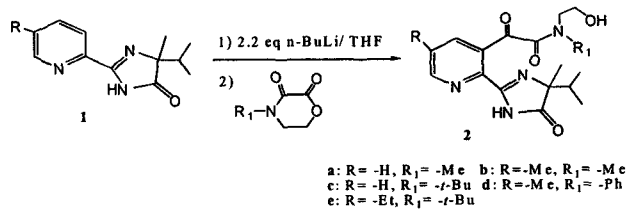
**Key words** : imidazolinone, herbicide, hydroxydiketoamide, *N*-ethoxycarbonyl-thioamide, *N*-benzoylthioamide.

Imidazolinone계 제초제는 1970년대에 발견되어 1980년대에 개발된 제초제로써, sulfonylurea계 제초제처럼 식물의 아미노산의 생합성 과정의 ALS(Acetolactate synthase)라는 효소를 저해하므로, ALS 효소가 없는 동물에는 거의 해가 없으며, 단위면적 당 약제의 사용량도 비교적 낮은 장점이 있다(Lander, 1994). 지금까지 imidazolinone 유도체에 대하여 유용한 화합물들이 많이 연구 개발되어 있으며, 상품화되어 실제 사용되고 있는 것들도 몇 가지가 알려져 있는데, 그것들의 구조적인 주요 특징을 살펴보면 아래와 같다. Pyridine이나 quinoline의 2번 위치에 methyl과 isopropyl기가 붙어있는 imidazolinone기가 치환되어 있는 것이 고효능을 나타내는데 필수적이며, pyridine의 3번 위치에 산도가 높은 carboxyl기가 붙어있는 것이 중요한 것으로 알려져 있다. 또한, 4번 위치에 치환기가 붙어있으면 활성이 감소하며, 5번 위치에 methyl 혹은 ethyl기를 도입하면 선택성이 좋아지는 것으로 보고되어 있다(Shaner와 O'Connor, 1991).

본 연구에서는 pyridine의 3번 위치의 carboxyl기 대신에 *N*-(2-hydroxyethyl)- $\alpha$ -dicarbonylamide기를 도입한 화합물들(Scheme 1의 화합물 2) 및 *N*-ethoxycarbonylthioamide기 및 *N*-benzoylthioamide기를 도입한 화합물들(Scheme 1의 화합물 3)을 합성하여 그 것들의 제조활성을 시험하였는데, 그와 같은 화합물을 목적물로 선택한 이유

는 다음과 같다. 본 연구실에서는 pyridine의 3번 위치에 carboxyl기 대신에  $\alpha$ -dicarbonylamide기를 도입하여 이 화합물들이 옥수수에 선택성을 가진 뛰어난 활성을 나타낸다는 것을 발견한 바가 있다(Kim 등, 1990).

이와 같이  $\alpha$ -dicarbonylamide기를 도입한 이유는 식물의 대사과정 중에  $\alpha$ -dicarbonylamide기가 분해되어 carboxyl기가 생성되어 살초효과가 나타나기를 기대한 것이다. 이와 같은 연구결과를 바탕으로 *N*-(2-hydroxyethyl)- $\alpha$ -dicarbonylamide기를 도입한 유도체들을 목적물로 선택하였는데, 그 이유는 분자의 극성 증가, 수소결합에 의한 물에 대한 용해도의 증가, 또는 히드록시기에 의한 neighboring effect에 의하여  $\alpha$ -dicarbonylamide기의 가수



For 1, 2, and 3, R = -H, -Me, -Et; R<sub>1</sub> = -Me, -Ph, -*i*-Bu; R<sub>2</sub> = -Ph, -OEt

Scheme 1

\*연락처자

분해가 촉진될 가능성도 고려하였다. 또한, 무엇보다도 분자가 안정하고 우리가 고안한 새로운 방법에 의하여 쉽게 합성이 가능하리라고 예상되었기 때문이었다. 화합물 3과 같은 thioamide기를 도입한 이유는 그 것들의 산도가 높아 carboxyl기와 비슷한 제조효과가 나타나기를 기대한 것이다.

출발물질인 pyridylimidazolinones(1)은 기존에 알려진 방법으로(Shaner와 O'Connor, 1991), cyclic oxamates는 aminoalcohol과 dimethylxalate로부터 문헌에 알려진 방법에 의하여 합성할 수 있었다(Imada 등, 1996; Rink and Jakobiecades, 1964). 화합물 1을 잘 건조한 THF에 녹이고 질소 기류 하에서 -78 °C 까지 냉각시킨 다음, 2.2 당량의 *n*-BuLi을 서서히 넣었다. 같은 온도에서 30분 간 반응시킨 다음, cyclic oxamate를 THF에 녹인 용액을 서서히 주입시키고 cooling bath를 제거하여 실온까지 반응시켰다. 반응액을 얼음물로 냉각시키고 묽은 염산으로 중화하고, 유기용매를 이용하여 유기물을 추출한 다음, 실리카 젤 크로마토그래피를 이용하거나 재결정하여 목적물인 *N*-(2-hydroxyethyl)- $\alpha$ -dicarbonylamide기를 도입한 유도체들(2)을 높은 수율로 얻을 수 있었다. 또한, 화합물 3은 친전자체를 cyclic oxamate대신에 isothiocyanate 유도체들을 사용하여 화합물 2의 합성과 같은 방법으로 합성하였다.

위와 같이 얻어진 화합물 2 및 3 유도체들의 제조효과를 아래와 같은 방법으로 시험하였다 (조광연 등, 1998). 표면적 350 cm<sup>2</sup> 사각포트에 풍건 마쇄한 발토양을 일정량

씩 담고 파종구를 만들어 준비된 잡초종자를 파종 복토 (0.5~1.0cm)하였다. 파종종자는 종류별로 휴면각성 및 보관방법이 다르지만 모두 발아력이 70 % 이상인 것을 사용하였으며, 파종량은 종자의 크기와 발아력을 고려하여 조절하였다. 사용한 잡초종자는 수수(*Sorghum bidentice*), 돌피(*Echinochloa crusgalli*), 개밀(*Agropyron smithii*), 바랭이(*Digitaria sanguinalis*), 미국개기장(*Panicum decompositum*), 까마중(*Solanum nigrum*), 자귀풀(*Aeschynomene indica*), 어저귀(*Abutilon theophrasti*), 도꼬마리 (*Xanthium strumarium*) 등이었다(Faust, 1985). 준비된 포트를 온실에서 관수 생육시키면서 약제를 처리하였는데, 처리시기는 파종 후 1일에 발아 전 토양처리(pre), 10 일에 발아 후 경엽처리(post)로 구분하였고, 처리량은 0.25 kg/ha 단위농도의 약 액을 4 ml/100 cm<sup>2</sup> 비율로 토양표면 또는 식물체의 잎에 분무 처리하였다. 처리 액은 원제를 용매(acetone)와 계면활성제(tween-20)로 용해 희석한 유제를 처리하였고, 제조효과는 약제 처리 3주 후 증상 및 약효-약해 기준표에 의한 달관조사를 하였다. 무방제의 경우를 0, 완전방제의 경우를 100으로하여 11등급으로 각각의 제조활성을 평가하는데, 70 이상의 등급을 가지면 실제적으로 그 식물에 대하여 제조효과가 있는 것으로 인정하였다.

실험 초종의 선발은 세계 5대 작물 재배지에서 공통적으로 발생하거나, 작물별로 방제하기 어려운 잡초들을 대상으로 하였는데, 화본과 잡초 5종과 광엽잡초 4종으로 모두 9 종이였다(Holm 등, 1991). 수수는 작물이지만 생육형

Table 1. Plant response screening report of 2 and 3 at a rate of 0.25 kg/ha in pre- and post-emergence

Comp.	pre/post	SORBI <sup>a)</sup>	ECHCG <sup>b)</sup>	AGRSM <sup>c)</sup>	DIGSA <sup>d)</sup>	PANDI <sup>e)</sup>	SOLNI <sup>f)</sup>	AESIN <sup>g)</sup>	ABUTH <sup>h)</sup>	XANSI <sup>i)</sup>
2a	pre	100	100	70	65	80	100	0	70	0
	post	90	100	90	90	100	100	100	100	100
2b	pre	100	80	60	80	100	90	0	90	0
	post	100	10	15	0	90	100	0	70	0
2c	pre	90	100	90	75	80	100	0	70	0
	post	70	60	40	10	20	100	0	10	0
2d	pre	100	70	40	50	90	100	0	70	0
	post	100	60	50	10	90	100	0	80	0
2e	pre	80	15	0	0	100	100	0	50	0
	post	70	10	20	0	0	40	0	0	0
3a	pre	100	70	50	35	80	10070	0	50	100
	post	100	65	30	0	90		0	45	90
3b	pre	20	10	0	0	10	15	0	40	0
	post	0	15	0	0	0	0	0	0	0

a)Common sorghum, b)Barnyardgrass, c)Wheatgrass, d)Large crabgrass, e)Fall panicum, f)Black nightshade, g)Indian jointvetch, h)Velvetleaf, i)Cocklebur

태와 습성이 존슨그래스와 유사하여 대응하였고, 돌피와 바랭이는 밀, 보리 및 옥수수 등의 화본과 작물 재배지는 물론 콩과 목화 등 세계 5대 작물 재배지에서 공통적으로 문제가 되고 있다. 개밀은 밀과 보리 재배지에서 가장 문제가 되는 잡초이며, 미국개기장은 옥수수는 물론 콩 및 목화 재배지에서도 우점하는 초종이다. 광엽잡초로서 까마중과 어저귀 등은 콩, 목화, 옥수수 재배지에서, 자귀풀은 콩과 목화 재배지에서, 도꼬마리는 모든 작물 재배지에서 문제가 되고 있다. 이들을 대상으로 합성 화합물 9개의 제조활성을 온실조건에서 잡초 발아 전 토양처리와 발아 후 경엽처리를 통하여 조사한 결과(Table 1) 이들의 제조활성은 전체적으로 광엽에 대한 제조활성보다 화본과 잡초에 대한 제조활성이 강하게 나타났다. Hydroxydiketoamide가 치환된 화합물들 중, 화합물 2a는 잡초 발아 전 토양처리 효과보다 발아 후 경엽처리 효과가 강하게 나타났지만 2b는 반대로 잡초 발아 후 경엽처리 효과보다 발아 전 토양처리 효과가 강하게 나타났다. 기타 화합물들은 처리시기와 방법에 따른 제조효과의 변동이 없었다. 시험 화합물 중에서는 화합물 2a의 발아 후 경엽처리 효과가 가장 강하여 대상초종 모두를 90 % 이상 방제하여 비 선택성 제초제로서의 가능성을 가지고 있었다. 또한 화합물 2a를 모핵화합물로 하여 유도체를 합성할 경우 특정 화합물이 작물에 대한 선택성을 수반한다면 유력한 신규 제초제 후보 화합물로 선발될 수 있을 것이다.

N-Ethoxycarbonylthioamide기를 도입한 화합물(3a)은 시험초종의 대부분에 대하여 비교적 강한 제조활성을 나타냈으나, N-benzoylthioamide기를 도입한 화합물(3b)은 처리시기와 방법에 관계없이 화본과 잡초는 물론 광엽잡초에 대한 제조활성이 거의 나타나지 않았다.

처리한 화합물에 대하여 공통적으로 감수성인 초종은 수수, 미국개기장, 까마중 등이었으며, 내성을 지닌 초종은 자귀풀과 도꼬마리 등이었다. 위와 같이 신규 합성화합물들의 제조활성은 기존 imidazolinone계 제초제들에 비하여 우수한 편은 아니지만, 기존 imidazolinone계 제초제의 pyridine의 3번 위치의 carboxyl기 대신에 hydroxydiketoamide, 혹은 N-ethoxycarbonylthioamide기를 도입하여도 문제잡초에 대하여 강한 활성을 나타낸다는 사실을 발견하였다. 이와 같은 결과를 바탕으로 새로운 치환기를 도입하여 유도체를 합성한다면 기존 제초제들보다 다양한 작물에 대한 선택성을 보유하면서 문제잡초를 효과적으로 방제할 수 있는 화합물을 선발할 수 있을 것이다.

## 인용문헌

Lander, D. W (1994) Herbicides inhibiting branched-chain amino acid biosynthesis-recent developments.

pp.83~115, In Recent studies of imidazolinone herbicides and related compounds (ed. J. Stetter). Springer-Verlag, New York.

Shaner, D. L. and S. L. O'Connor (1991) The imidazolinone herbicides. CRC Press, London.

김대황, 류재욱, 장해성, 전동주, 황인택 (1990) 신규한 2-(2-이미다졸린-2-일)-3-(아미노옥소아세틸)-피리딘 유도체와 그 염. 대한민국 특허 90-002649.

Imada, Y., Y. Mitsue, K. Ike, K. Washizuka, and S. I. Murahashi (1996) Palladium-catalyzed double and single carbonylations of  $\beta$ -aminoalcohols. Selective synthesis of morpholine-2,3-diones and oxazolidin-2-ones and applications for synthesis of  $\alpha$ -oxo carboxylic acids. Bull. Chem. Soc. Jpn., 69:2079~2090.

Rink, M. and H. Jakobieedes (1964) Synthesis of dioxaindolizidine, dioxoquinolizidine, and dioxazabicycloundecane derivatives. Arch. Pharm. 297:632~638. [CA.62:548d]

조광연 등 (1998) 신농약 효능검사 및 기반기술 연구. pp. 901 과학기술부 선도기술개발사업 2단계 최종보고서.

Faust, W. (1985) Important Weeds of the World (Scientific and Common Names, and WSSA/WSSJ Approved Computer Codes). Published by the Agrochemical Division of Bayer AG, Leverkusen, Federal Republic of Germany.

Holm, L. G., D. L. Plucknett, J. V. Pancho, and J. P. Herberger (1991) The World's Worst Weeds. Distribution and biology. p. 609 Krieger Publishing Company, Malabar, Florida, USA.

## Spectral Data:

3-[N-(2-hydroxyethyl)-N-methylaminooxoacetyl]-2-(4-isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)pyridine (2a):  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  9.31 (1H, brs,  $\text{D}_2\text{O}$  exchangeable, -NH), 8.55 (1H, dd,  $J=5$  Hz, 2 Hz, Ar), 8.01 (1H, dd,  $J=8$  Hz, 2 Hz, Ar), 7.57 (1H, dd,  $J=8$  Hz, 5 Hz, Ar), 4.81 - 3.00 (4H, m,  $-(\text{CH}_2)_2$ ), 3.06 (3H, s,  $-\text{CH}_3$ ), 2.15 (1H, septet,  $J=7$  Hz, CH), 1.46 (3H, s,  $-\text{CH}_3$ ), 1.10 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ), 0.91 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ).

MS (70eV)  $m/z$  (rel. intensity) 347 ( $M^+$ , 29.3), 262 (61.60, 245 (23.8), 244 (100), 217 (41.9), 216 (61.3), 174 (35.5), 148 (60.5), 147 (26.9), 131 (42.1), 105 (39.1).

3-[N-(2-hydroxyethyl)-N-methylaminooxoacetyl]-2-(4-isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-5-methylpyridine (2b):  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  9.15 (1H, brs,  $\text{D}_2\text{O}$  exchangeable, -NH), 8.36 (1H, s, Ar), 7.73 (1H, s, Ar),

4.88 - 3.01 (4H, m,  $-(\text{CH}_2)_2-$ ), 3.05 (3H, s,  $-\text{CH}_3$ ), 2.39 (3H, s,  $-\text{CH}_3$ ), 2.10 (1H, septet,  $J=7$  Hz, CH), 1.47 (3H, s,  $-\text{CH}_3$ ), 1.12 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ), 0.89 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ).

MS (70eV)  $m/z$  (rel. intensity) 361 ( $M^+$ , 29.3), 277 (14.6), 276 (94.0), 275 (23.3), 258 (100), 257 (27.0), 231 (49.6), 230 (57.2), 229 (18.8), 216 (20.2), 215 (12.8), 189 (18.8), 188 (31.8), 162 (33.9), 161 (21.6), 145 (17.5), 119 (24.8), 118 (24.1), 117 (14.0).

3-[*N-tert-butyl-N*-(2-hydroxyethyl)aminooxoacetyl]-2-(4-isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)pyridine (**2c**):  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  9.13 (1H, brs,  $\text{D}_2\text{O}$  exchangeable,  $-\text{NH}$ ), 8.43 (1H, dd,  $J=5$  Hz, 2 Hz, Ar), 7.90 (1H, dd,  $J=8$  Hz, 2 Hz, Ar), 7.29 (1H, dd,  $J=8$  Hz, 5 Hz, Ar), 4.63 - 3.32 (4H, m,  $-(\text{CH}_2)_2-$ ), 2.03 (1H, septet,  $J=7$  Hz, CH), 1.44 (9H, s, *t*-Bu), 1.37 (3H, s,  $-\text{CH}_3$ ), 1.06 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ), 0.84 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ).

MS (70eV)  $m/z$  (rel. intensity) 390 ( $M^+ + 2$ , 10.3), 389 ( $M^+ + 1$ , 38.3), 331 (36.6), 286 (7.6), 263 (9.3), 262 (51.5), 246 (14.5), 245 (12.0), 218 (13.4), 217 (55.6), 202 (32.4), 175 (21.5), 174 (32.2), 149 (12.9), 148 (18.2), 131 (29.5), 105 (35.1), 57 (100).

3-[*N*-(2-hydroxyethyl)-*N*-phenylaminooxoacetyl]-2-(4-isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-5-methylpyridine (**2d**):  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  9.11 (1H, brs,  $\text{D}_2\text{O}$  exchangeable,  $-\text{NH}$ ), 8.26 (1H, s, Ar), 7.79 (1H, s, Ar), 7.38 - 7.09 (5H, m, Ar), 4.85 - 3.72 (4H, m,  $-(\text{CH}_2)_2-$ ), 2.32 (3H, s,  $-\text{CH}_3$ ), 2.07 (1H, septet,  $J=7$  Hz, CH), 1.37 (3H, s,  $-\text{CH}_3$ ), 1.06 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ), 0.85 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ).

MS (70 eV)  $m/z$  (rel. intensity) 423 ( $M^+ + 1$ , 32.9), 304 (7.9), 288 (8.0), 287 (16.70), 286 (29.4), 277 (9.9), 276 (64.9), 259 (8.0), 258 (37.4), 231 (23.6), 230 (29.4), 214 (11.6), 191 (10.1), 188 (32.5), 187 (23.1), 162 (34.6), 145 (35.2), 137 (48.6), 118 (55.4), 106 (100).

3-[*N-tert-butyl-N*-(2-hydroxyethyl)aminooxoacetyl]-2-(4-iso

propyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-5-ethylpyridine (**2e**):  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=2$  Hz, Ar), 8.35 (1H, brs,  $\text{D}_2\text{O}$  exchangeable,  $-\text{NH}$ ), 7.82 (1H, d,  $J=2$  Hz, Ar), 4.74 - 3.10 (4H, m,  $-(\text{CH}_2)_2-$ ), 2.71 (2H, q,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_2-$ ), 2.04 (1H, septet,  $J=7$  Hz, CH), 1.49 (9H, s, *t*-Bu), 1.42 (3H, s,  $-\text{CH}_3$ ), 1.20 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ), 0.89 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ).

MS (70 eV)  $m/z$  (rel. intensity) 417 ( $M^+ + 1$ , 12.2), 360 (10.7), 359 (46.0), 358 (8.2), 291 (11.0), 290 (65.0), 289 (10.6), 274 (7.4), 273 (11.7), 245 (44.2), 244 (22.3), 230 (28.1), 202 (30.6), 133 (33.9), 57 (100).

3-(*N*-ethoxycarbonylamino)thiocarbonyl-2-(4-isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-5-methylpyridine (**3a**):

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.50 (1H, d,  $J=2$  Hz, Ar), 7.66 (1H, d,  $J=2$  Hz, Ar), 5.26 (1H, brs,  $\text{D}_2\text{O}$  exchangeable,  $-\text{NH}$ ), 4.39 (2H, q,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_2-$ ), 2.43 (3H, s,  $-\text{CH}_3$ ), 2.01 (1H, m,  $-\text{CH}$ ), 1.36 (3H, s,  $-\text{CH}_3$ ), 1.36 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ), 0.88 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ).

MS (70eV)  $m/z$  (rel. intensity) 346 (23.3), 345 (20.6), 306 (14.4), 305 (76.6), 304 (81.9), 303 (43.4), 302 (12.5), 299 (15.8), 288 (24.5), 275 (23.2), 273 (18.5), 261 (54.8), 260 (100), 258 (26.9), 246 (10.7), 245 (11.0), 244 (14.6), 232 (65.8), 215 (30.2), 188 (34.8), 187 (38.4).

3-(*N*-phenylcarbonylamino)thiocarbonyl-2-(4-isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-5-methylpyridine (**3b**):

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  9.29 (1H, brs,  $\text{D}_2\text{O}$  exchangeable,  $-\text{NH}$ ), 8.56 (1H, d,  $J=2$  Hz, Ar), 8.11 - 7.15 (8H, m,  $\text{D}_2\text{O}$  exchangeable,  $-\text{NH}$ , Ar), 2.47 (3H, s,  $-\text{CH}_3$ ), 1.81 (1H, m,  $-\text{CH}$ ), 0.97 (3H, s,  $-\text{CH}_3$ ), 0.66 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ), 0.45 (3H, d,  $J=7$  Hz,  $-\text{CH}_3$ ).

MS (70eV)  $m/z$  (rel. intensity) 394 ( $M^+$ , 5.7), 351 (11.5), 350 (10.6), 336 (38.2), 335 (16.8), 307 (21.6), 306 (100), 293 (51.6), 292 (52.1), 288 (11.4), 272 (16.1), 264 (42.90), 263 (11.8), 250 (19.1), 244 (13.7), 223 (67.4), 222 (14.9), 195 (9.8), 175 (16.5).

---

**Synthesis of new pyridylimidazolinones and their herbicidal effects**

Dong Ju Jeon, Hae Sung Chang, In Taek Hwang, and Dae-Whang Kim\*(*Korea Research Institute of Chemical Technology, P. O. Box 107, Yusong-Ku, Taejeon 305-600, Korea*)

**Abstract** : New series of pyridylimidazolinones substituted with *N*-(2-hydroxyethyl)- $\alpha$ -dicarbonylamide group, *N*-ethoxycarbonylthioamide and *N*-benzoylthioamide group in place of carboxyl group at 3-position of pyridine were prepared, and their herbicidal effects were tested(*in vivo*) in upland conditions. Most of pyridylimidazolinones substituted with hydroxydiketoamide and *N*-ethoxycarbonylthioamide group at 3-position of pyridine showed good herbicidal effects at a rate of 250 g/ha, while pyridylimidazolinone substituted with *N*-benzoylthioamide group showed no herbicidal effects.

---

\*Corresponding author (Fax : +82-42-861-0307, E-mail : djeon@pado.kRICT.re.kr)