(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(51) Int. Cl.[6]
C07D 239/26
A01N 43/54

(45) 공고일자 2002년11월08일
(11) 등록번호 10-0338856
(24) 등록일자 2002년05월20일

(21) 출원번호 10-1996-0700690
(22) 출원일자 1996년02월09일
번역문제출일자 1996년02월09일
(86) 국제출원번호 PCT/JP1994/01311
(86) 국제출원일자 1994년08월09일
(81) 지정국 국내특허 : 오스트레일리아 불가리아 브라질 캐나다 중국 체코 헝가리 대한민국 슬로바키아 우크라이나 미국 슬로베니아 EA 유라시아특허 : 러시아
EP 유럽특허 : 오스트리아 벨기에 스위스 리히텐슈타인 사이프러스 독일 덴마크 스페인 핀랜드 프랑스 영국 그리스 아일랜드 이탈리아 룩셈부르크 모나코 네덜란드 포르투칼 스웨덴

(65) 공개번호 특1996-0703868
(43) 공개일자 1996년08월31일
(87) 국제공개번호 WO 1995/04725
(87) 국제공개일자 1995년02월16일

(30) 우선권주장 93-198328 1993년08월10일 일본(JP)
93-273392 1993년11월02일 일본(JP)
94-174575 1994년07월26일 일본(JP)

(73) 특허권자 닛산 가가쿠 고교 가부시키 가이샤
일본 도쿄도지요다구 간다니시키쵸 3쵸메 7반지1
(72) 발명자 사또우 준
일본국 지바껭 후나바시시 쓰보이죠 722반찌 1 닛산가가꾸고오교 가부시끼가이샤 쥬오 겡뀨쇼 나이
곤도 야스오
일본국 지바껭 후나바시시 쓰보이죠 722반찌 1 닛산가가꾸고오교 가부시끼가이샤 쥬오 겡뀨쇼 나이
구도 요시히로
일본국 지바껭 후나바시시 쓰보이죠 722반찌 1 닛산가가꾸고오교 가부시끼가이샤 쥬오 겡뀨쇼 나이
미까시마 다꾸미
일본국 지바껭 후나바시시 쓰보이죠 722반찌 1 닛산가가꾸고오교 가부시끼가이샤 쥬오 겡뀨쇼 나이
나와마끼 쓰또무
일본국 사이따마껭 미나미사이따마군 시라오까마찌 오아자시라오까 1470 닛산가가꾸고오교 가부시끼가이샤 세이브쓰까가꾸겡뀨쇼 나이
이또 요이찌
일본국 사이따마껭 미나미사이따마군 시라오까마찌 오아자시라오까 1470 닛산가가꾸고오교 가부시끼가이샤 세이브쓰까가꾸겡뀨쇼 나이
스도 가즈히사
일본국 사이따마껭 미나미사이따마군 시라오까마찌 오아자시라오까 1470 닛산가가꾸고오교 가부시끼가이샤 세이브쓰까가꾸겡뀨쇼 나이
나까히라 구니미쓰
일본국 사이따마껭 미나미사이따마군 시라오까마찌 오아자시라오까 1470 닛산가가꾸고오교 가부시끼가이샤 세이브쓰까가꾸겡뀨쇼 나이
와따나베 시게오미
일본국 사이따마껭 미나미사이따마군 시라오까마찌 오아자시라오까 1470 닛산가가꾸고오교 가부시끼가이샤 세이브쓰까가꾸겡뀨쇼 나이
이시까와 기미히로
일본국 사이따마껭 미나미사이따마군 시라오까마찌 오아자시라오까 1470 닛산가가꾸고오교 가부시끼가이샤 세이브쓰까가꾸겡뀨쇼 나이
(74) 대리인 윤여범, 특허법인코리아나

심사관 : 장진아

(54) 신규한피리미딘유도체,제초제및식물성장조절제

명세서

기술분야

<1> 본 발명은 신규한 피리미딘 유도체, 및 당해 유도체를 유효성분 으로 함유하는 제조체 및 식물 성장 조절제에 관한 것이다. 또한 유도체는 의약 및 농약의 중간체로서도 유용하다.

배경기술

<2> 2-및 6-위치에서 수소 원자를 갖고 4-및 5-위치에 특정의 치환기가 도입된 피리미딘 고리를 함유하는 본 발명의 화합물군이 제초 및 식물 성장 조절 작용을 보인다는 것은 전혀 공지되어 있지 않다. 또한, 이의 화학구조의 어느 것도 (Journal of Heterocyclic Chemistry) Vol. 20(1983) P. 649 의 문헌에 기재된 3 개의 화합물, 4-메틸-5-아세틸피리미딘, 4-t-부틸-5-t-부틸카르보닐피리미딘 및 4-페닐-5-벤조일피리미딘의 구조를 제외하고는 공지된 것은 없다.

<3> 벼, 대두, 소맥, 옥수수, 면화 및 사탕무우와 같은 중요 작물을 보호하고, 이들의 생산성을 증대시키기위하여, 많은 제초제가 지금까지 실용화 되었다. 이런 제초제는 적용 장소에 따라 대략 3개의 범주, 즉, 전(畑)지용, 수전용, 비경지용으로 나눌수 있다. 또한, 각각의 범주는 사용 방법에 따라, 토양 혼화처리형, 발아전토양처리형, 발아후처리(경엽처리)형등으로 분류할 수 있다.

<4> 최근의 세계적인인구의 증가로, 중요 작물의 생산성은 각국의 식량경제에 영향을 미칠것이다. 이러한 변화는 21 세기를 향한 종래의 농업 형태의 변화를 필연적으로 수반할 것이다. 실제로, 경작물의 성장에 유해한 잡초를 경제적 및 효과적으로 죽이거나 조절할 수 있는 제초제의 개발이 이전보다 훨씬 농업 종사자에 중요해지고 있다.

<5> 상기와같은 제초제로, 하기의 조건을 충족시키는 약제를 개발하는 것이 바람직하다.

<6> 저약량으로 고제초효과를 갖는 약제(환경 보호 관점에서 가능한한 저약량으로 잡초를 죽이는 것이 필요하다), 적정의 잔류 활성을 갖는 약제 (최근, 토양 잔류 약물의 후작에 대한 피해의 문제가 제기되었기 때문에, 살포후 적정한 잔류 활성을 보이는 것이 중요하다), 산포후 잡초를 신속히 죽이는 약제 (약제 처리후, 단기간에 다음 작물을 파종하거나 이식이 가능하다), 빈번한 약제 처리가 불필요한 약제 (농업종사자에게는 번잡한 잡초방제 작업의 회수를 줄이는 것이 중요하다), 잡초방제대상이 광범위한 약제 (광업 잡초, 포아풀 잡초, 다년생 잡초와 같은 각각 다른 성질을 갖는 다양한 잡초를 방제할수 있는 약제가 바람직하다), 시용 방법이 다양한 약제 (더 강한 제초효과를 토양 처리 효과, 엽처리 효과등을 조합하여 얻을 수 있다) 및 작물에 대해 문제가 되는 어떠한 약해도 보이지 않는 약제(작물이 잡초와 혼재하는 경작지에서, 선택적으로 잡초를 죽일 수 있는 제초제가 바람직하다)가 바람직하다. 그런나, 상기의 모든 조건을 충족시키는 제초제는 존재하지 않는다.

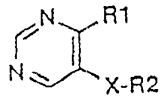
<7> 한편, 작물 재배시 농업종사자에게 장해가 되는 병해 및 충해는 우수한 살균제 및 살충제로 효과적으로 방제된다. 그러나, 상기의 유해 생물이외에 수량 및 품질등의 저하를 가져오는 요인이 존재한다. 예로서, 보리, 호밀, 소맥, 벼, 옥수수, 대두, 면화의 수확시의 바람 또는 비에의한 쓰러짐등이다. 가장 쉽고 효과적인 예방 방법중의 하나는 상기의 작물이 쓰러지는 것을 방지하기위하여 절간 신장을 억제하는 것이므로 수량에 영향을 끼치지않는 성장 지연제의 개발이 이전보다 더 필요로하고 있다. 이러한 성장 지연제로, 하기의 조건을 충족시키는 약제를 개발하는 것이 바람직하다.

<8> 저약량으로 높은 왜소화작용을 갖는 약제(특히 환경 보호관점에서, 가능한한 저약량에서 왜소화 작용을 보이는 것이 필요하다), 적정한 잔류 효과를 갖는 약제(산포후 토양중의 잔류량이 적은것이 중요하다), 산포후 온건하게 작용을 발현하는 약제(갑작스런 작용은 바람직하지않다), 약제 처리는 기본적으로 1회가 바람직하다 (농업 종사자에게는 번잡한 작업의 회수를 줄이는 것이 중요하다), 시용 방법이 다양한 약제 (토양 처리, 경영처리, 종자 처리등으로부터 작물에 대한 적절한 시용 방법을 선택하는 것이 가능하다), 경엽부분보다는 꽃이나 과일에 영양분을 전류시키기 위하여 경엽의 성장을 억제하는 것이 바람직하다(이는 수확의 증가를 가져온다). 또한, 뿌리에대해 성장 지연 효과가 작은 약제가 바람직하다.

<9> 한편, 지생 (芝生)의 정장 억제, 과수류의 도장지(徒長枝)의 억제, 고 상품가치를 위한 관상수의 왜소화, 생원 (生洹)의 생육억제 및 개화시기의 조절등에도 사용될수 있는 것이 바람직하다. 비경작지에서의 잡초의 완전한 고살은 토양의 유실을 야기하기 때문에, 최근에는 잡초길이의 조절 및 잡초를 고사시키는 것을 피하는 것이 필요하다.

<10> 발명의 개시

<11> 본 발명자는 상기의 상황하에서 신규의 피리미딘 유도체의 제초 작용 및 식물 성장조절 작용에 대한 광범위한 연구를 행하였다. 그 결과, 하기식의 피리미딘 유도체는 주목할만한 제초 작용 및 식물 성장 억제 작용을 보이는 것을 발견하였다. 본 발명은 이런한 발견에 기초하여 이루어졌다. 즉, 본 발명은 하기식 (I)의 신규의 피리미딘 유도체를 제공한다 (이후로 본 발명의 화합물로 칭함) :



(I)

<13> [식중, R1는 C_1-C_6 할로알킬기, C_1-C_6 알킬기, C_3-C_6 시클로알킬기, C_3-C_6 할로시클로알킬기 또는 임의로 치환된 페닐기 (단, 치환기는 할로겐원자, C_1-C_4 알킬기, C_1-C_4 알콕시기, C_1-C_3 할로알킬기, C_1-C_3 할로알콕시기 및 페닐기로 구성된 군으로부터 선택한다)이고, R2는 수소 원자, C_1-C_6알킬기, C_3-C_6 시클로알킬기, C_3-C_6 시클로알킬(C_1-C_4)알킬기, C_1-C_6 할로알킬기, C_3-C_6 할로시클로알킬기, C_3-C_8 알케닐기, C_3-C_8

알키닐기, C_1-C_2 술포닐(C_1-C_4)알킬기, C_1-C_4 알킬티오(C_3-C_6)시클로알킬기 또는 임의로 치환된 페닐기(단, 치환기는 할로겐원자, C_1-C_4 알킬기, C_1-C_4 알콕시기, C_1-C_3 할로알킬기, C_1-C_3 할로알콕시기 및 페닐기로 구성된 군으로 부터 선택한다)이며, X는 카르보닐기 또는 -C(R3)OH (단, R3은 수소원자, C_1-C_6 알킬기, C_3-C_8 알케닐기, C_3-C_8 알키닐기 또는 임의로 치환된 페닐기(단, 치환기는 할로겐 원자, C_1-C_4 알킬기, C_1-C_4 알콕시기, C_1-C_3 할로알킬기, C_1-C_3 할로알콕시기 또는 페닐기로 구성된 군으로부터 선택한다)이다) (탄소 원자가 광학활성 탄소원자인 경우, 라세메이트 및 단리된 2 종의 광학 이성질체의 쌍방을 포함한다)]. 또한 본 발명은 본 발명의 화합물을 함유하는 제초제 및 식물 성장 조절제를 제공한다.

<14> 본 발명의 화합물의 몇몇은 전지 및 비경지용 제초제로서, 토양 처리 또는 경엽 처리중의 어느 처리방법에 있어서도 까마중(Solanum nigrum) 및 독말풀 (Datura stramonium) 로 대표되는 가지과 잡초 (Solanaceae), 벨비트리프. (Abutilon theophrasti) 및 프리클리 시다 (Sida spinosa) 로 대표되는 아욱과 잡초 (Malvaceae), 커먼 모닝글로리 (Ipomoea purpurea) 및 서양 엉거시 (Calystegia spps.) 를 포함하는 나팔꽃 (Ipmoea spps.) 으로 대표되는 메과꽃잡초 (Convolvulaceae), 개비름 (Amaranthus lividus) 및 털비름(Amaranthus retroflexus) 으로 대표되는 비름과 잡초 (Amaranthaceae), 커먼 코클버 (Xanthium pensylvanicum), 돼지풀 (Ambrosia artemisiaefolia), 해바라기 (Helianthus annuus), 헤어리 갈린소가 (Galinsoga ciliata), 크리핑 티스틀 (Cirsium arvense), 커먼 그라운드셀 (Senecio vulgaris) 및 일년생 개망초 (Erigeron annus) 로 대표되는 국화과 잡초(Compositae), 개갓냉이 (Rorippa indica), 케드락 (Sinapis arvensis) 및 냉이 (Capsella Bursapastioris) 로 대표되는 크루시퍼러스과 잡초 (Cruciferae), 포숨부 노트위드 (Polygonum Blumei) 및 나도닭의덩굴 (Polygonum convolvulus) 로 대표되는 폴리고나숴스과 잡초 (Polygonaceae), 쇠비름(Portulaca oleracea) 으로 대표되는 쇠비름과 잡초 (Portulacaceae), 흰명아주(Chenopodium album), 좀명아주 (Chenopodium ficifolium) 및 댑싸리 (Kochia scoparia) 로 대표되는 명아주과 잡초 (Chenopodiaceae), 별꽃(Stellaria media) 으로 대표되는 캐리요필라숴스과 잡초 (Caryophyllaceae), 큰개불알풀 (Veronica persica)로 대표되는 현삼과 잡초 (Scrophulariaceae), 닭의장풀 (Commelina communis) 로 대표되는 닭의장풀과 잡초(Commelinaceae), 광대나물(Lamium amplexicaule) 및 레드 데드네틀 (Lamium purpureum) 로 대표되는 꿀풀과 잡초 (Labiatae), 애기땅빈대 (Euphorbia supina) 및 큰땅빈대(Euphorbia maculata) 로 대표되는 대극과 잡초 (Euphorbiaceae), 갈퀴덩쿨(Galium spurium) 및 꼭두서니 (Rubia akane)로 대표되는 꼭두서니과 잡초 (Rubiaceae), 제비꽃 (Viola mandshurica) 으로 대표되는 제비꽃과 잡초(Violaceae), 헴세스바니아 (Sesbaniaexaltata) 및 시클포드 (Cassia obtusifolia) 로 대표되는 레구미러스과 잡초 (Leguminosae) 와 같은 광업 잡초, 및 수수 (Sorgham bicolor), 미국개기장 (Panicum dichotomiflorum), 존슨그래스 (Sorghum halepense), 강피 (Echinochloa crus - galli var. crus - galli), 돌피 (Echinochloa crus - galli var. praticola), 반야드그래스 (작물)(Echinochloa utilis), 바랭이 (Digitaria adscendens), 메귀리 (Avena fatua), 왕바랭이 (Eleusine indica), 강아지풀 (Setaria viridis), 및 뚝새풀(Alopecurus aegualis) 로 대표되는 포아풀과 잡초, 및 향부자 (Cyperus rotundus, Cyperus esculentus) 로 대표되는 사초과 잡초에 저약량으로 높은 제초력을 보인다.

<15> 또한, 본 발명의 화합물은 수전용 제초제로서, 침수하의 토양처리 또는 경엽처리중의 어느 처리 방법에 있어서도 택사 (Alisma canaliculatum), 벗풀 (Sagittaria trifolia) 및 올미 (Sagittaria pygmaea)로 대표되는 택사과 잡초 (Alismataceae), 알방동사니 (Cyperus difformis), 너도방동사니 (Cyperus serotinus), 올챙이고랭이 (Scirpus juncoides) 및 올방개(Eleocharis kuroguwai) 로 대표되는 사초과 잡초 (Cyperaceae), 폴스 핌퍼넬 (Lindemia pyxidaria)로 대표되는 현삼과 잡초 (Scrothulariaceae), 물달개비 (Monochoria vaginalis) 로 대표되는 포텐데리아숴스과 잡초 (Potenderiaceae), 가래 (Potamogeton distinctus) 로 대표되는 가래과 잡초(Potamogetonaceae), 마디꽃 (Rotala indica), 강피 (Echinochloa oryzicola), 반야드그래스 (Echinochloa crus - galli var. formosensis) 및 피 (Echinochloa crus - galli var. crus - galli) 로 대표되는 부처꽃과 잡초 (Lythraceae) 와 같은 여러 논 잡초에 저약량으로 높은 제초력을 보인다.

<16> 또한, 본 발명의 화합물은 벼, 소맥, 보리, 사탕수수, 땅콩, 옥수수, 대두 및 면화 및 사탕무우와 같은 중요 작물에 대해 고수준의 안정성을 갖는 것을 발견하였다.

<17> 본 발명의 화합물의 몇몇은 전지, 수전 또는 비경지용의 식물 성장 조절제로서, 토양처리, 경영처리, 또는 종자처리중의 어느 처리 방법에 있어서도 까마중, 독말풀, 벨비트리프, 프리클리 시다, 커먼 모닝글로리, 개비름, 털비름, 커먼 커클버, 돼지풀, 해바라기, 헤어리 갈린소가, 크리핑 티스틸, 커먼 그라운드셀, 일년생 개망초, 개갓냉이, 케드락, 냉이, 포숨부 노트위드, 나도닭의덩굴, 쇠비름, 흰명아주, 좀명아주, 댑싸리, 별꽃, 큰개불알풀, 닭의장풀, 광대나물, 레드 데드네틀, 애기땅빈대, 큰땅빈대, 갈퀴덩쿨, 꼭두서니, 제비꽃, 헴세스바니아, 시클포드 및 헤어리 베거틱스와 같은 광엽 잡초, 수수, 미국개기장, 존슨그래스, 피, 블랙그래스, 바랭이, 메귀리, 왕바랭이, 강아지풀 및 뚝새풀과 같은 포아풀과 잡초, 향부자와 같은 사초과 잡초, 택사, 벗풀, 올미, 알방동사니, 너도알방동사니, 올챙이고랭이, 올방개, 폴스 핌퍼넬, 물달개비, 가래, 마디꽃, 피와 같은 각종 수전 잡초의 성장 또는 신장을 억제하고, 토양 침적을 초래할 수도 있는 식물의 완전한 고사없이 상기 잡초의 성장을 억제하기위하여 사용할 수 있다.

<18> 본 발명의 화합물은 벼, 소맥, 보리, 호밀, 옥수수, 대두, 땅콩, 면화, 해바라기, 사탕무우, 감자, 평지 및 사탕수수등과 같은 작물의 쓰러짐 방지, 신장 억제, 줄기 강화, 줄기 비대화, 도장방지, 줄기 단축화 및 절간 단축화에 사용할수 있고, 따라서 수확량이 증가하고 불량환경 및 병충해에 대해 저항성이 개선되리라 기대된다. 추가로 본 발명의 화합물은 지생성장의 억제에 사용할 수 있고, 관상용 식물, 실내용 식물, 정원 식물 또는 온실 식물의 소형화에 유용하다.

<19> 본 발명의 화합물은 목본 식물의 성장 및 착화를 억제하는데 사용할 수 있다. 예로서, 울타리의 성형된 상태로의 유지, 과실수 (예로서, 사과, 배, 체리, 복숭아, 포도 및 서양배) 형태의 조절 및 가지치기의 필요성을 감소시키는데 사용된다. 또한, 본 발명의 화합물은 개화시기의 조절, 분지의 조절 또는 정단(頂端) 우세를 파괴하여 액아(腋芽)의 발달 촉진에 사용할 수 있다.

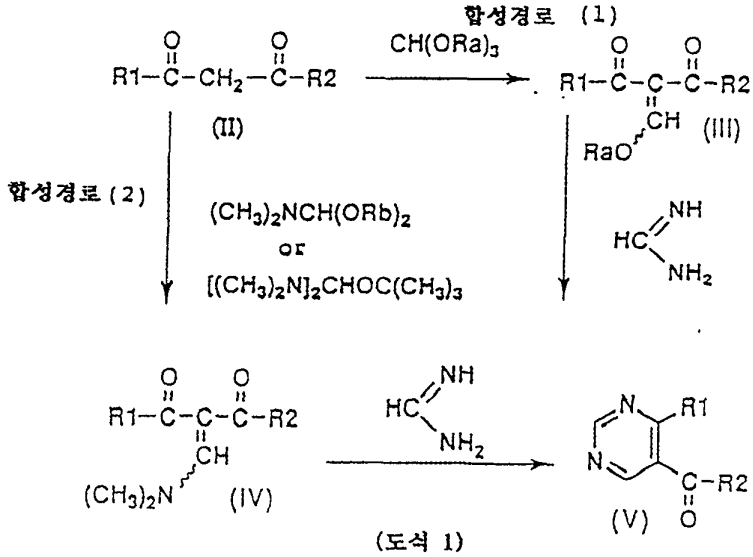
<20> 최근에, 삼목 및 노송 나무의 화분이 도시 주민의 알러지를 유발하는 화분증이 사회적 문제가 되

고있다. 본 발명의 화합물의 사용으로 화분증의 원인인 삼목 및 노송 나무의 발화 형성 및 착화를 억제하는 것이 가능하다. 저농도에서의 발아전의 종자 처리는 발아를 촉진시킬 수 있다. 이런 경우에서는, 발아 또는 신장의 억제 없이 초기 생육 촉진 작용을 갖는다.

<21> 그러므로, 본 발명의 화합물은 전지, 수전, 지생지, 과수원, 목초지 및 기타 비경지용 제초제 및 식물 성장 조절제의 유효 성분으로 사용될 수 있다. 이하에서, 이들을 제조하기위한 각종의 방법을 상세히 설명할 것이다.

<22> 본 발명의 화합물은 하기 도식 1 내지 3 으로 나타낸 방법으로 합성할 수 있다 (반응 도식 1 내지 3에서, R1 내지 R3은 전술한 바와 같고, 각각의 Ra 및 Rb 는 C_1-C_3 알킬기이고, Met는 Mg 또는 Zn 과 같은 금속 원자이며, Hal 은 할로겐 원자이다).

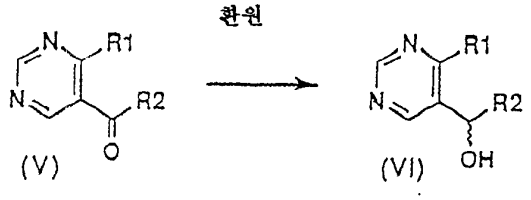
<23> 출발 물질인 2,4-디카르보닐 화합물 (II) 은 D.P.N.Satchell, R.S.Satchell 저, Saul Patai 편의 The Chemistry of the Carbonyl Group, p273 (Wiley-interscience 출판 1966 년), C.R.Hauser 및 B.E.Hudson, Jr. 저의 Organic Reactions (John Wiley & Sons, Inc., 출판 1942 년) 제 1 권 p266 등에 기재된 방법에 따라 쉽게 합성할 수 있다.



(도식 1)

<25> (1) 도식 1 의 합성 경로 (1) 은 2,4-디카르보닐 화합물 (II) 을 오르토포름 에스테르 유도체와 반응시키고, 이어서 생성된 3-알콕시 메틸렌-2,4-디카르보닐 유도체 (III)을 포름아미딘과 반응시키는 것을 특징으로 하는 본 발명의 피리미딘 유도체(V) (X:C=0 인경우)를 제조하는 방법을 나타낸다.

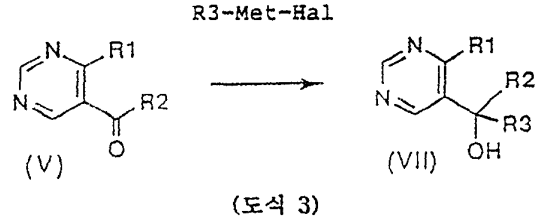
<26> (2) 도식 1 의 합성 경로 (2) 는 2,4-디카르보닐 화합물 (II) 을 N,N-디메틸포름아미드 디알킬아세탈 또는 t-부톡시-비스(디메틸아미노)메탄과 반응시키고, 이어서 생성된 3-디메틸아미노메틸렌-2,4-디카르보닐 유도체 (IV)을 포름아미딘과 반응시키는 것을 특징으로하는 본 발명의 피리미딘 유도체 (V) (X:C=0 인경우) 를 제조하는 방법을 나타낸다.



(도식 2)

<28> (3) 도식 2 는 피리미딘 유도체 (V) (X:C=0 인경우) 를 적합한 환원 방법 (예, $NaBH_4$ 또는 BH_3) 또는 부제 환원으로 대응하는 알코올 (VI)(X:CH-OH 인경우) 으로 전환시키는 방법을 나타낸다.

<29> 생성된 알코올 (VI)이 라세미체인 경우, 필요하다면, 적당한 부제분할수단으로 각각의 광학활성 알코올을 수득할 수 있다.



(도식 3)

<31> (4) 도식 3 은 피리미딘 유도체 (V) 와 R3-Met-Hal (단 R3 이 수소원자인 경우은 제외한다)을 반

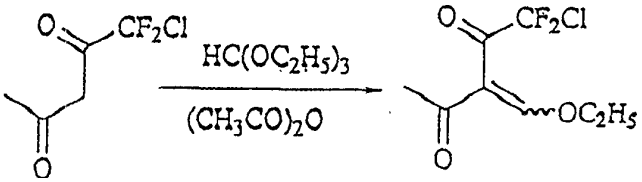
응시키는것을 특징으로하는 화합물(VII) 제조 방법을 나타낸다.

<32> 이하에 본 발명의 화합물 및 이의 중간체의 합성을 실시예를 참조로하여 상세히 기술할 것이다. 그러나, 본 발명은 결코 하기와 같은 실시예로 한정되지 않는다.

<33> 본 발명의 양태의 최선의 형태

<34> 실시예 1

<35> 1-클로로-1,1-디플루오로-3-에톡시메틸렌-2,4-펜탄디온의 합성 (화합물 번호 203)

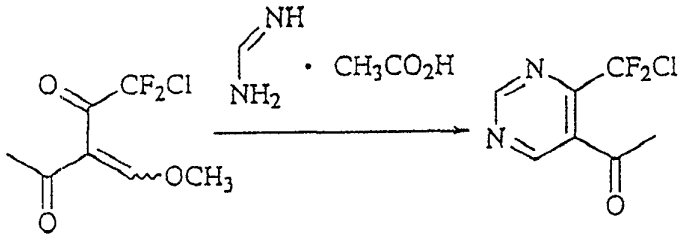


<37> 1-클로로-1,1-디플루오로-2,4-펜탄디온 50g, 에틸 오르토포름에이트 60g및 무수 아세트산 82g의 혼합 용액을 교반하면서 2 시간동안 환류시킨다. 딘-스탁 장치 (수분 분리장치)를 부착한후, 용액을 추가로 4 시간더 환류시켜 약 100 ml 의 물을 제거한다. 이것을 방치하여 냉각 시킨후, 감압 증류하여 담적색 액체로 32.2 g 의 목적물을 수득한다.

<38> 비등점 95-118℃/1.6 mmHg.

<39> 실시예 2

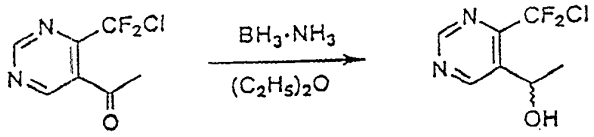
<40> 5-아세틱-4-클로로디플루오로메틸피리미딘의 합성 (화합물 번호 1)



<42> 50 ㎖의 건조 에탄올에, 금속 나트륨 0.9 g을 빙냉하에서 가하여 나트륨 에톡시드를 제조한다. 이 용액에, 진공 펌프로 충분히 건조된 포름아미딘 아세테이트 8.4 g을 교반하면서 가한다. 이어서, 1-클로로-1,1-디플루오로-3-에톡시메틸렌-2,4-펜탄디온 8 g 을 에탄올 20 ㎖ 에 용해시킨 용액을 빙냉하에서 적가한다. 적가후, 반응 용액을 실온으로 되돌린후, 반응 용액을 1.5 시간동안 가열환류시킨다. 반응 용액을 방치하여 냉각시킨후, 물을 가하고, 에테르 추출을 행한다. 에테르 층을 무수 황산나트륨으로 건조시키고, 용매를 감압하에서 증류 제거시킨다. 잔류물을 감압 증류시킨후, 컬럼 크로마토그래피 (전개용매 : $CHCl_3$) 로 정제하여 2.5 g 의 목적물을 수득한다. 비등점 65-70℃/1.3mmHg, $n_D^{20.7}$ 1.4787.

<43> 실시예 3

<44> 4-클로로디플루오로메틸-5-(1-히드록시에틸)피리미딘의 합성 (화합물 번호 101)

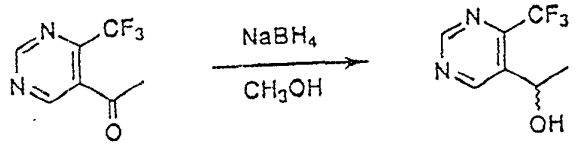


<46> 5-아세틸-4-클로로디플루오로메틸피리딘 0.4 g 을 건조 디에틸 에테르 10 ㎖애 용해시킨후, 빙냉하에서 보란 암모니아 착물을 과잉량으로 가하고, 혼합물을 실온에서 밤새워 교반한다. 물을 가한후, 디에틸 에테르로 추출한다. 에테르 층을 무수 환산나트륨으로 건조시키고, 용매를 감압하에서 증류 제거하여 점성액체로 0.32 g 의 목적물을 수득한다.

<47> $n_D^{19.9}$ 1.4899.

<48> 실시예 4

<49> 5-(1-히드록시에틸)-4-트리플루오로메틸피리미딘의 합성 (화합물 번호 102)

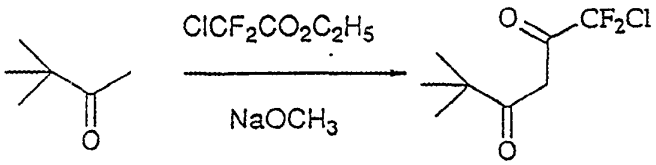


<51> 5-아세틸-4-트리플루오로메틸피리미딘 0.5 g 을 건조 메탄올 10 ㎖ 에 용해시킨다. 수소화 붕소나트륨 0.03 g 을 가하고, 혼합물을 빙냉하에서 30 분간 교반한후, 추가로 실온에서 밤새워 교반한다. 반

응의 종결 후, 용매를 증류 제거하고, 클로로포름/물의 1:1 용매 혼합물 40 ㎖를 가하여, 클로로포름으로 추출한다. 클로로포름층을 무수 황산나트륨으로 건조시키고, 용매를 감압하에서 증류 제거한다. 컬럼 크로마토그래피로 정제하여, 점성액체로 0.2 g 의 목적물을 수득한다. $n_D^{19.9}$ 1.4549.

<52> 실시예 5

<53> 1-클로로-1,1-디플루오로-5,5-디메틸-2,4-헥산디온의 합성 (화합물 번호 301)



<55> 나트륨 메톡시드 7.1 g을 건조 에테르 100 ㎖에 가하고, 혼합물을 교반한다. 건조 에테르 25 ㎖로 희석시킨 에틸 클로로디플루오로아세테이트 20 g의 용액을 실온에서 적가한다. 추가로, 건조 에테르 25 ㎖로 희석시킨 피나콜론 12.5 g의 용액을 적가하고, 혼합물을 실온에서 밤새워 교반한다. 이어서, 반응용액에, 100 ㎖의 물로 희석된 빙상 결정 아세트산 8.4 g의 용액 및 구리(II) 아세테이트 23.6 g을 적당량의 수중에 용해시킨 용액을 연속적으로 적가한다. 적가후 약 10분간 교반한다. 이어서, 에테르를 감압하에서 증류 제거하고 고형물을 여과제거한다. 감압 건조후, 6 N 염산 100 ㎖를 가하고, 에틸 아세테이트로 추출한다. 에틸 아세테이트 층을 무수 황산나트륨으로 건조시키고, 용매를 감압하에서 증류 제거한다. 이어서, 잔류물을 감압 증류하여 13 g의 목적물을 수득한다. (비등점 54-57℃/5 ㎜Hg)

^{1}H-NMR δ (ppm)[용매] ;

1.24(s, 9H, C(C<u>H</u>$_3$)$_3$)

5.95(s, 1H, 에놀 올레핀)

14.00(br s, 1H, 에놀 O<u>H</u>)

[$CDCl_3$]

^{13}C-NMR δ (ppm)[용매] ;

27.2(s, C(<u>C</u>H_3)$_3$)

39.3(s, <u>C</u>(CH_3)$_3$)

90.0(t, $J_{F,C}$ =2Hz, $ClCF_2C$=<u>C</u>)

120.3(t, $J_{F,C}$ =299Hz, <u>C</u>F_2Cl)

180.3(t, $J_{F,C}$ =30Hz, $ClCF_2$<u>C</u>=C)

202.2(s, <u>C</u>O$C(CH_3)_3$)

[$CDCl_3$]

^{19}F-NMR δ (ppm)[용매] ;

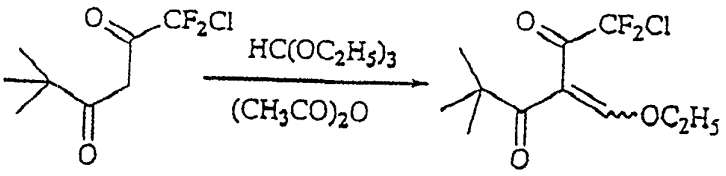
13.3(s, 2F, $ClCF_2$)

(참조. CF_3CO_2H)

[$CDCl_3$]

<58> <u>실시예 6</u>

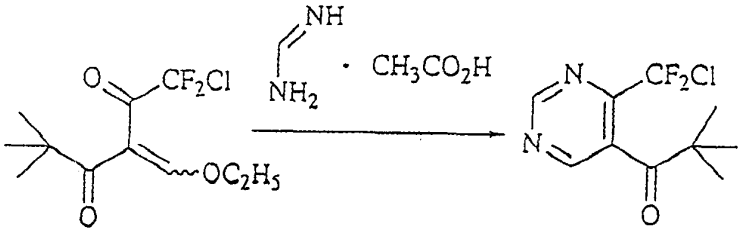
<59> 1-클로로-1,1-디플루오로-5,5-디메틸-3-에톡시메틸렌-2,4-헥산디온의 합성 (화합물 번호 204)



<61> 1-클로로-1,1-디플루오로-5,5-디메틸-2,4-헥산디온 12.4 g 및 에틸 오르토포름에이트 12.4 g 을 무수 아세트산 50 ㎖ 에 가하고, 혼합물을 가열하에서 2 시간동안 환류시킨다. 용매를 감압하에서 증류 제거한후, 잔류물을 감압 증류시켜 6.8 g의 목적물을 수득한다 (비등점 105-107℃/2㎜Hg)

<62> <u>실시예 7</u>

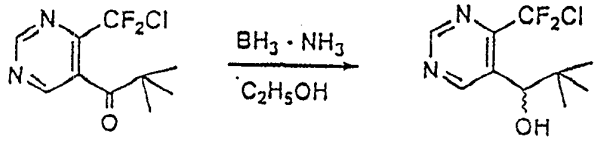
<63> 4-클로로디플루오로메틸-5-피발로일피리미딘의 합성 (화합물 번호 3)



<65> 나트륨 메톡시드 0.7 g 및 포름아미딘 아세테이트 1.25 g 을 건조 메탄올 30 ㎖ 에 가하고, 혼합물을 실온에서 30분간 교반한다. 5 ㎖ 의 건조 메탄올로 희석시킨 1-클로로-1,1-디플루오로-5,5-디메틸-3-에톡시메틸렌-2,4-헥산디온 3 g의 용액을 적가한후, 혼합물을 가열하에서 2시간동안 환류시킨다. 용매를 감압하에서 증류제거하고, 물을 가한후, 에틸 아세테이트로 추출한다. 에틸 아세테이트 층을 무수 황산나트륨으로 건조시키고, 용매를 감압하에서 증류제거시킨다. 잔류물을 박층 크로마토그래피 (전개용매 : 헥산 80%, 에틸 아세테이트 20 %) 로 정제하여 0.6 g 의 목적물을 수득한다. $n_D^{20.0}$ 1.4675

<66> 실시예 8

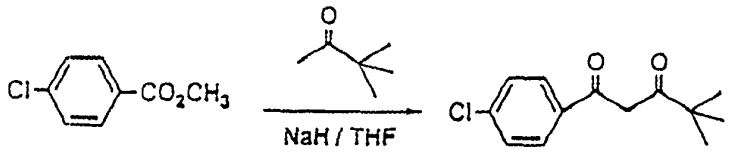
<67> 4-클로로디플루오로메틸-5-(2,2-디메틸-1-히드록시프로필)퍼리미딘의 합성 (화합물 번호 103)



<69> 4-클로로디플루오로메틸-5-피발로일피리미딘 1.5 g 을 에탄올 50㎖ 에 용해시킨후, 보론 암모니아 착물 1 g 을 가하고, 혼합물을 실온에서 1 시간동안 교반한다. 용매를 감압하에서 증류 제거한후, 물을 가하고 클로로포름으로 추출한다. 추출층을 물로 세척한후, 무수 황산나트륨으로 건조시킨다. 용매를 감압하에서 증류제거시키고, 잔류물을 박층 크로마토그래피 (전개용매 : 클로로포름/에틸 아세테이트 =7/3) 로 정제하여 점성 액체로 1.1 g 의 목적물을 수득한다. $n_D^{19.8}$ 1.4623

<70> 실시예 9

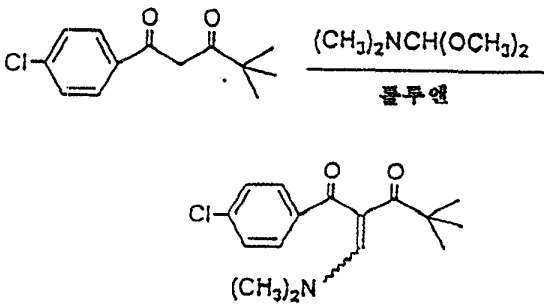
<71> 1-(4-클로로페닐)-4,4-디메틸펜탄-1,3-디온의 합성 (화합물 번호 303)



<73> 메틸 4-클로로벤조에이트 30 g을 무수 THF 중에 용해시키고, 60% 나트륨 히드라이드 16.9 를 빙냉하에서 가한다. 피나콜론 21.1 g을 적가하고, 혼합물을 50℃ 가열하에서 6시간동안 교반한다. 이어서, 물 100 ㎖ 를 빙냉하에서 적가하고, 용매를 감압하에서 증류 제거한다. 여기에, 물 200 ㎖ 및 6 N 염산 100 ㎖ 를 가하고, 이어서 에틸 아세테이트로 추출한다. 추출층을 무수 황산나트륨으로 건조시키고, 용매를 감압하에서 증류 제거시킨다. 잔류물을 실리카 겔 컬럼 크로마토그래피(전개 용매 : 클로로포름/헥산 = 2/8) 로 정제하여 점성액체로 43 g 의 목적물을 수득한다. $n_D^{20.0}$ 1.5012

<74> 실시예 10

<75> 1-(4-클로로페닐)-4,4-디메틸-2-(N,N-디메틸아미노메틸렌)-1,3-펜탄디온의 합성 (화합물 번호 206)

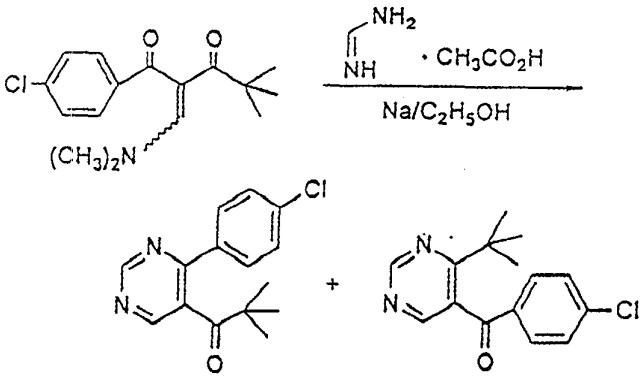


<77> 1-(4-클로로페닐)-4,4-디메틸-1,3-펜탄디온 17 g 및 디메틸포름아미드 디메틸아세탈 18 g 을 200 ㎖ 의 건조 톨루엔에 가하고, 혼합물을 가열하에서 2 시간동안 환류시킨후, 메탄올을 1시간에 걸쳐 증류제거한다.

<78> 용매를 증류 제거하고, 잔류물을 실리카 겔 크로마토그래피 (전개 용매 : 클로로포름/헥산 =6/4)로 정제하여 담황색 고형물로 13.7 g 의 목적물을 수득한다 융점 102-104℃

<79> 실시예 11

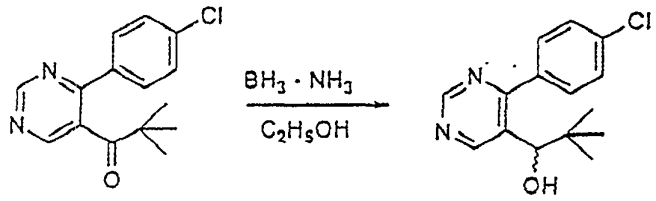
<80> 4-(4-클로로페닐)-5-피발로일피리미딘 및 4-t-부틸-5-(4-클로로벤조일)피리미딘의 합성 (화합물 번호 5 및 6)



<82> 금속 나트륨 1 g 및 포름아미딘 아세테이트 3.3 g을 150 ㎖ 의 순수 에탄올에 가하고, 혼합물을 실온에서 15 분간 교반한다. 여기에, 1-(4-클로로페닐)-4,4-디메틸-2-(N,N-디메틸아미노메틸렌)-1,3-펜탄디온 8.5 g 을 가하고, 혼합물을 가열하에서 3 시간동안 환류시킨다. 물 20 cc 를 실온에서 가하고, 이어서 용매를 감압하에서 증류 제거시킨다. 추가로 물을 가한후, 에틸 아세테이트로 추출한다. 추출층을 물로 세척하고 무수 황산나트륨으로 건조시킨다. 용매를 감압하에서 증류제거시키고, 잔류물을 실리카겔 컬럼 크로마토그래피 (전개 용매 : 에틸 아세테이트/헥산 = 3/7) 로 분리하여 4-t-부틸-5-(4-클로로벤조일)피리미딘 (수율 : 2.5 g, 융점 : 75-77℃) 및 4-(4-클로로페닐)-5-피발로일피리미딘을 수득한다 (수율 2.4 g, $n_D^{20.1}$ 1.5784)

<83> 실시예 12

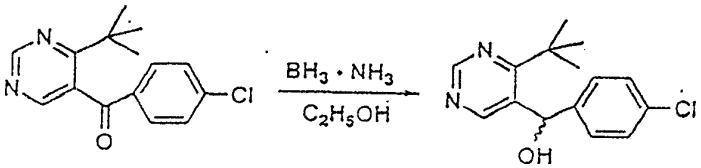
<84> 4-(4-클로로페닐)-5-(2,2-디메틸-1-히드록시프로필)피리미딘의 합성 (화합물 번호 104)



<86> 4-(4-클로로페닐)-5-피발로일피리미딘 1.2 g 을 에탄올 20㎖ 에 용해시킨후, 보란 암모니아 착물 1.2 g을 가하고, 혼합물을 실온에서 30 분간 교반한다. 용매를 감압하에서 증류 제거한후, 물을 가하고 클로로포름으로 추출한다. 추출층을 물로 세척하고 무수 황산나트륨으로 건조시킨다. 용매를 증류제거시켜 점성 액체로 0.8 g의 목적물을 수득한다. $n_D^{20.2}$ 1.5575

<87> 실시예 13

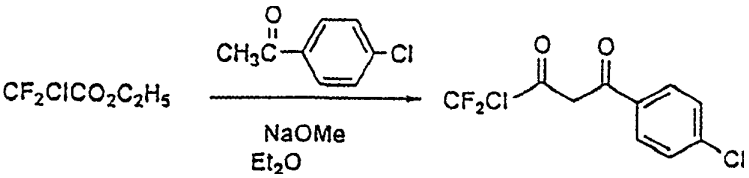
<88> 4-t-부틸-5-[(4-클로로페닐)히드록시메틸]피리미딘의 합성 (화합물 번호 105)



<90> 4-t-부틸-5-(4-클로로벤조일)피리미딘 1 g 을 20 ㎖ 의 에탄올에 용해시키고, 보란 암모니아 착물 0.8 g을 가한다. 혼합물을 50-60℃에서 1 시간동안 가열하고, 추가로 가열하에서 30분동안 환류시킨다. 용매를 감압하에서 증류제거시킨후, 물을 가하고 클로로포름으로 추출한다. 추출층을 물로 세척하고, 무수 황산나트륨으로 건조시킨다. 용매를 감압하에서 증류제거시키고 점성액체로 0.6 g의 목적물을 수득한다. $n_D^{20.2}$ 1.5474

<91> 실시예 14

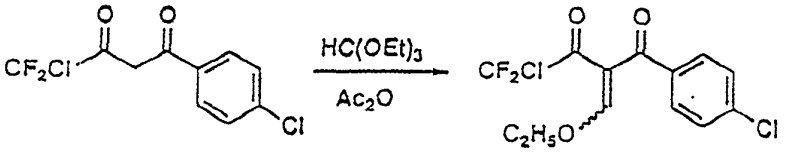
<92> 1-클로로-4-(4-클로로페닐)-1,1-디플루오로-2,4-부탄디온의 합성 (화합물 번호 318)



<94> 에틸 클로로디플루오로아세테이트 38 g 을 나트륨 메톡시드 22.7 g 및 건조 에테르300 ㎖에 빙냉하에서 가한다. 여기에 p-클로로아세토페논 31 g을 빙냉하에서 서서히 가한다. 혼합물을 실온에서 12 시간동안 교반한다. 용매를 증류제거한다. 6 N염산 150 ㎖를 빙냉하에서 가하고, 에틸 아세테이트로 추출한다. 추출층을 물로 세척하고, 용매를 증류제거한다. 생성된 조 생성물을 실리카 겔 컬럼크로마토그래피 (전개 용매 : 클로로포름) 으로 정제하여 담황색 점성액체로 49.5 g 의 목적물을 수득한다. 융점 50-51℃

<95> 실시예 15

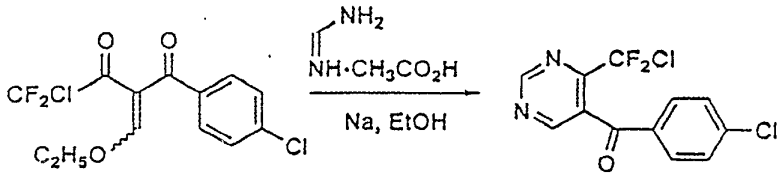
<96> 1-클로로-4-(4-클로로페닐)-1,1-디플루오로-3-에톡시메틸렌-2,4-부탄디온의 합성



<98> 1-클로로-4-(4-클로로페닐)-1,1-디플루오로-2,4-부탄디온 49.5 g, 에틸 오르토포름에이트 41.3 g 및 무수 아세트산 57 g의 혼합물을 가열하에서 4일 동안 환류시킨다. 용매를 증류 제거하여 60.4 g의 조 생성물을 수득하고, 이를 다음 반응에서 직접 사용한다.

<99> 실시예 16

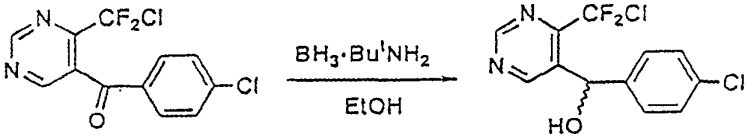
<100> 5-(4-클로로벤조일)-4-클로로디플루오로메틸피리미딘의 합성 (화합물 번호 20)



<102> 금속 나트륨 6 g 및 건조 에탄올 500 ㎖를 혼합하여 나트륨 에톡시드 용액을 제조한다. 포름아미딘 아세테이트 23.3 g을 용액에 가하고, 혼합물을 실온에서 15분간 교반한다. 1-클로로-4-(4-클로로페닐)-1,1-디플루오로-3-에톡시메틸렌-2,4-부탄디온 (조 생성물) 60.4 g 을 빙냉하에서 서서히 가한다. 혼합물을 가열하에서 2시간동안 환류시킨다. 용매를 감압하에서 증류 제거시킨다. 빙수 300 ㎖를 가한후, 에틸 아세테이트로 추출한다. 추출층을 물로 세척하고, 용매를 감압하에서 증류 제거한다. 생성된 조 생성물을 실리카 겔 컬럼 크로마토그래피 (전개 용매 : 클로로포름/헥산 = 1/1) 로 정제하여 담황색 액체로 27 g 의 목적물을 수득한다. $n_D^{20.7}$ 1.5742

<103> 실시예 17

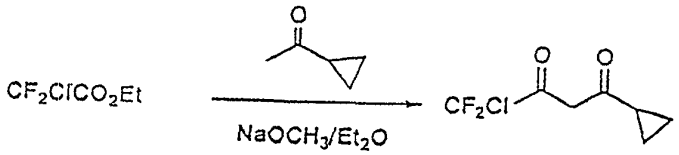
<104> 4-클로로디플루오로메틸-5-[(4-클로로페닐)히드록시메틸]피리미딘의 합성 (화합물 번호 119)



<106> 5-(4-클로로벤조일)-4-클로로디플루오로메틸피리미딘 12 g 및 t-부틸아민 보란 착물 6 g을 100 ㎖의 에탄올에 가하고, 생성된 혼합물을 0℃에서 2시간 동안 교반한다. 이어서, 여기에 아세톤 20 ㎖를 가하고, 혼합물을 0℃에서 1시간동안 교반한다. 용매를 감압하에서 증류 제거하고, 잔류물을 실리카 겔 컬럼 크로마토그래피 (전개 용매 : 클로로포름)으로 정제하여 담황색 점성액체로 11.1 g의 목적물을 수득한다. $n_D^{20.3}$ 1.5563

<107> 실시예 18

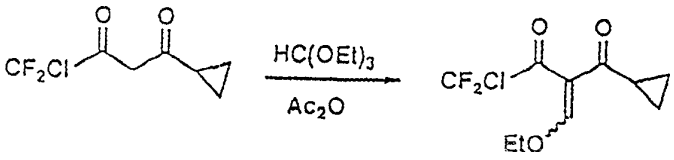
<108> 1-클로로-4-시클로헥실-1,1-디플루오로-2,4-부탄디온의 합성 (화합물 번호 305)



<110> 나트륨 메톡시드 74.8 g을 1 ℓ 의 에테르에 가하고, 여기에 에틸 클로로디플루오로아세테이트 200 g 을 에테르 300 ㎖에 용해시킨 용액을 교반하의 0℃에서 적가한다. 이어서, 시클로프로필 메틸 케톤 106 g을 에테르 300 ㎖에 용해시킨 용액을 반응 용액에 서서히 가한후, 혼합물을 실온에서 8 시간동안 교반한다. 용매를 감압하에서 증류제거하고, 6 N 염산 300 ㎖을 잔류물에 가하고, 에틸 아세테이트로 추출한다. 추출층을 물로 세척하고, 용매를 감압하에서 증류 제거하여 담황색 액체로 235.9 g 의 목적물을 수득한다. $n_D^{20.6}$ 1.4788

<111> 실시예 19

<112> 1-클로로-4-시클로헥실-3-에톡시메틸렌-1,1-디플루오로-2,4-부탄디온의 합성 (화합물 번호 207)

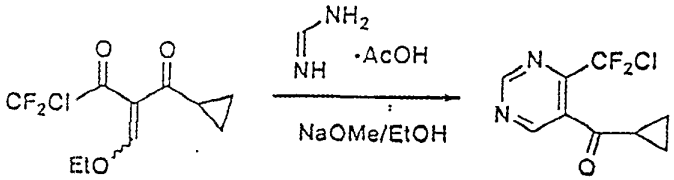


<114> 1-클로로-4-시클로헥실-1,1-디플루오로-2,4-부탄디온 235.9g, 에틸 오르토포름에이트 266.4 g 및 무수 아세트산 367.2 g 의 혼합물을 가열하에서 12 시간동안 환류시킨다. 용매를 감압하에서 증류제거시켜 280.3g의 목적물(조 생성물)을 수득하고, 이를 다음반응에서 직접 사용한다. 조 생성물의 일부를 추가로 정제하여 굴절율을 측정한다.

<115> $n_D^{20.6}$ 1.4787

<116> 실시예 20

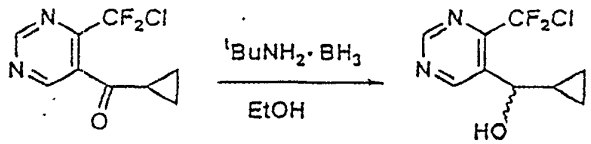
<117> 4-클로로디플루오로메틸-5-시클로프로필카르보닐피리미딘의 합성 (화합물 번호 7)



<119> 나트륨 메톡시드 71.9 g 을 1 ℓ 의 에탄올에 가한후, 포름아미딘 아세테이트 121.2 g 을 가한다. 생성된 혼합물에, 1-클로로-4-시클로헥실-3-에톡시메틸렌-1,1-디플루오로-2,4-부탄디온 280 g 을 빙냉하에서 서서히 적가한다. 혼합물을 가열하에서 1시간동안 환류시키고, 용매를 감압하에서 증류 제거시킨다. 500 ㎖의 물을 잔류물에 가하고, 에틸 아세테이트로 추출한다. 추출층중의 용매를 감압하에서 증류제거시키고, 잔류물을 실리카 겔 컬럼 크로마토그래피 (전개 용매 : 클로로포름/헥산 =1/1) 로 정제하여 101 g 의 목적물을 수득한다. $n_D^{20.5}$ 1.4998

<120> 실시예 21

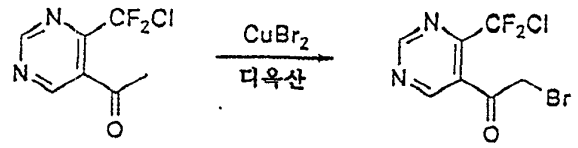
<121> 4-클로로디플루오로메틸-5-(1-히드록시-시클로프로필메틸)퍼리미딘의 합성 (화합물 번호 106)



<123> 4-클로로디플루오로메틸-5-시클로프로필카르보닐피리미딘 70 g 을 에탄올 100 ㎖에 가한후, 빙냉하에서 t-부틸아민 보란 착물 15 g 을 추가로 가하고 혼합물을 실온에서 2 시간동안 교반한다. 아세톤 30 ㎖를 가한후, 혼합물을 실온에서 1시간동안 교반하고, 용매를 감압하에서 증류 제거시킨다. 100 ㎖의 물을 잔류물에 첨가하고, 에틸 아세테이트로 추출한다. 추출층을 물로 세척하고, 용매를 감압하에서 증류제거한다. 잔류물을 감압하에서 건조하여 45 g 의 목적물을 수득한다. $n_D^{20.5}$ 1.5020

<124> 실시예 22

<125> 4-클로로디플루오로메틸-5-브로모아세틸피리미딘의 합성 (화합물 번호 11)

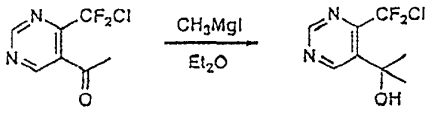


<127> 5-아세틸-4-클로로디플루오로메틸피리미딘 2.0 g, 브롬화 제이구리($CuBr_2$) 4.3 g 및 건조 디옥산 20 ㎖의 혼합물을 실온에서 1 일간 교반한후, 환류하에서 1일더 교반한다. 이어서, 불용물은 여과제거하여 소량의 클로로포름으로 세척하고, 이렇게 수득한 여과물을 감압하에서 증류시킨다. 생성된 조 생성물을 분취 박층 크로마토그래피(전개 용매 : 클로로포름) 로 정제하여 담황색 액체로 640 mg 의 목적물을

수득한다.

<128> 실시예 23

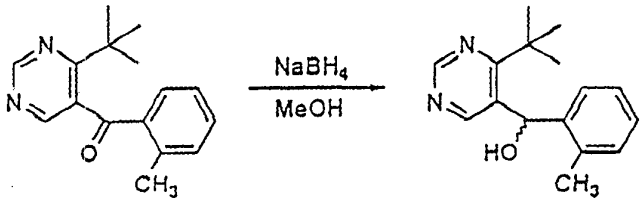
<129> 4-클로로디플루오로메틸-5-(1-히드록시-1-메틸에틸)피리미딘의 합성 (화합물번호 110)



<131> 마그네슘 470 mg 및 건조 에틸 에테르 5 ml의 혼합물에, 메틸 요오드화물 2.76 g 을 건조 에틸 에테르 15 ml 에 용해시킨 용액을 적가하면서 반응 혼합물이 적절하게 환류되도록 조절한다. 적가후, 추가로 45 분간 환류시킨다. 반응 혼합물을 방치하여 실온으로 냉각시킨후, 여기에 5-아세틸-4-클로로디플루오로메틸피리미딘 2 g을 신속히 적가하고, 반응 혼합물을 1 시간 더 환류시킨다. 반응 혼합물을 얼음으로 냉각시키고, 여기에 암모니아 클로라이드의 포화수용액을 가하면서 교반한다. 에테르 층을 기울여 분리하고 분리 깔대기에서 포화 식염수로 3회 세정한다. 유기층을 무수 황산나트륨으로 건조시키고, 용매를 증류 제거시킨다. 생성된 조 생성물을 3회 분취 박층 크로마토그래퍼 (전개 용매 : 클로로포름) 시켜, 131 mg 의 목적물을 점성 액체로 수득한다. $n_D^{20.6}$ 1.4982

<132> 실시예 24

<133> 4-t-부틸-5-[(2-메틸페닐)히드록시메틸]퍼리미딘의 합성 (화합물 번호 117)

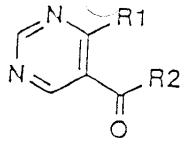


<135> 수소화 붕소 나트륨 (순도 92%) 500 ml 를 4-t-부틸-5-(2-메틸벤조일)피리미딘 1 g 및 건조 메탄올 20 ml의 혼합물에 빙냉하에서 가하고, 생성된 혼합물을 2시간동안 교반한다. 용매를 감압하에서 증류 제거하고, 생생된 혼합물에, 빙수 및 에틸 아세테이트를 가하고, pH를 교반하면서 진한 염산으로 1 내지 2 수준으로 조정한다. 유기층을 포화 식염수로 2회 세정한후, 무수 황산나트륨으로 건조시킨다. 용매를 감압하에서 증류 제거시키고 백색 결정으로 600 mg 의 목적물을 수득한다.

<136> 융점 125-127℃

<137> 전기 실시예에 준하여 합성한 본발명 화합물의 구조식, 스펙트럼 데이타 및 물성을 전기 실시예에서 합성한 화합물을 포함하여 표 1-1, 1-2, 2-1 및 2-2에 나타내었다. 이들의 중간체의 구조 및 물성을 표3-1 및 3-2 에 나타내었다.

<138> 표 1-1



화합물 번호	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 - 페닐	Bu^{tert}
6	Bu^{tert}	4 - Cl - 페닐
7	CF_2Cl	Pr^{시클로}
8	2,4 - Cl_2 - 페닐	Bu^{tert}
9	Bu^{tert}	2,4 - Cl_2 - 페닐
10	CF_2Cl	Et
11	CF_2Cl	CH_2Br
12	4 - Cl - 페닐	Pr^{시클로}
13	CF_2Cl	Pr^{a}
14	CF_2Cl	Pr^{iso}
15	Bu^{tert}	4-MeO- 페닐
16	Bu^{tert}	2-MeO- 페닐
17	CF_2CF_2Cl	Me
18	Bu^{tert}	3-Me- 페닐
19	Bu^{tert}	2-Me- 페닐
20	CF_2Cl	4-Cl- 페닐
21	CF_2Cl	2,4-Cl_2 - 페닐
22	CF_2Br	Me
23	CF_2Cl	페닐
24	CF_2Cl	4 - F - 페닐

화합물 번호	R 1	R 2
25	CF_2Cl	2-F-페닐
26	CF_2Cl	3-F-페닐
27	CF_2Cl	2-Cl-페닐
28	CF_2Cl	3-Cl-페닐
29	CF_2Cl	3, 4-Cl_2-페닐
30	CHFCl	Pr^a
31	CF_2H	Pr^a
32	CF_2Cl	2-Me-페닐

표 1 - 2

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
1	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 2.65 (t, J=1Hz, 3H, COCH$_3$), 8.90 (s, 1H), 9.42 (s, 1H), 〔CDCl$_3$〕 ^{13}C-NMR δ (ppm) [용매]; 31.35 (t, $J_{F,C}$=27Hz, COCH$_3$), 122.99 (t, $J_{F,C}$=291Hz, CF$_2$Cl), 131.26 (s, 피리미딘 고리, 5-위치), 155.07 (t, $J_{F,C}$=31Hz, 피리미딘 고리, 4-위치), 156.91 (s, 피리미딘 고리, 6-위치), 159.20 (s, 피리미딘 고리, 2-위치), 197.69 (s, C=O), 〔CDCl$_3$〕 ^{19}F-NMR δ (ppm) [용매]; 24.0 (s, 2F, ClCF$_2$), (ref. CF$_3$CO$_2$H), 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{20.1}$ 1.4787, bp 65-70℃/1.3mmHg

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
2	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 2.68 (s, 3H, COCH$_3$), 9.07 (s, 1H), 9.48 (s, 1H), (CDCl$_3$) ^{13}C-NMR δ (ppm) [용매], 30.84 (s, COCH$_3$), 120.34 (q, $J_{F,C}$ = 276Hz, CF$_3$), 132.63 (s, 피리미딘 고리, 5-위치), 151.26 (q, $J_{F,C}$ = 37Hz, 피리미딘 고리, 4-위치), 157.14 (s, 피리미딘 고리), 159.42 (s, 피리미딘 고리), 197.19 (s, C=O), (CDCl$_3$)	bp 65-66℃/3.5mmHg
3	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 1.28 (s, 9H, C(CH$_3$)$_3$), 8.75 (s, 1H, 피리미딘), 9.34 (s, 1H, 피리미딘), (CDCl$_3$) ^{13}C-NMR δ (ppm) [용매]; 26.8 (s, C(CH$_3$)$_3$),	

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
	45.2 (s, C(CH$_3$)$_3$), 123.0 (t, $J_{F,C}$ = 291Hz, ClCF$_2$), 130.1 (s, 피리미딘 고리, 5 - 위치), 154.9 (t, $J_{F,C}$ = 31Hz, 피리미딘 고리, 4 - 위치), 155.2 (s, 피리미딘 고리), 158.3 (s, 피리미딘 고리), 207.2 (s, C=O), 〔CDCl$_3$〕 ^{19}F-NMR δ (ppm) [용매]; 23.8 (s, 2F, ClCF$_2$), (ref. CF$_3$CO$_2$H), 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{20.0}$ 1.4675
4	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 2.60 (t, J=1Hz, 3H, COCH$_3$), 8.85 (s, 1H, 피리미딘 고리), 9.37 (s, 1H, 피리미딘 고리), 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{20.1}$ 1.4335
5	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 0.97 (s, 9H, C(CH$_3$)$_3$), 7.46 (d, J=9Hz, 2H, 벤젠고리), 7.65 (d, J=9Hz, 2H, 벤젠 고리), 8.56 (s, 1H, 피리미딘 고리)	

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
5	9.30(s, 1H, 피리미딘 고리),	
(계속)	(CDCl$_3$)	
	^{13}C-NMR δ(ppm) [용매];	
	26.7(s, C(CH$_3$)$_3$),	
	45.9(s, C(CH$_3$)$_3$),	
	129.3(s, 벤젠고리 CH),	
	130.6(s, 벤젠고리 CH),	
	133.2 (s, 피리미딘 고리, 5-위치),	
	136.6 (s, 벤젠고리),	
	137.2 (s, 벤젠고리),	
	154.6 (s, 피리미딘 고리, 6-위치, CH),	
	158.4 (s, 피리미딘 고리, 2-위치, CH),	
	160.1 (s, 피리미딘 고리, 4-위치),	
	212.2(s, COC(CH$_3$)$_3$),	
	(CDCl$_3$)	$n_D^{20.1}$ 1.5784
6	^{1}H-NMR δ(ppm) [용매];	
	1.33(s, 9H, C(CH$_3$)$_3$),	
	7.49(d, J=9Hz, 2H, 벤젠고리),	
	7.77(d, J=9Hz, 2H, 벤젠고리),	
	8.42(s, 1H, 피리미딘 고리)	
	9.24(s, 1H, 피리미딘 고리)	
	(CDCl$_3$)	

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
6	^{13}C-NMR δ (ppm) [용매] ;	
(계속)	30.0 (s, C(CH$_3$)$_3$),	
	39.9 (s, C(CH$_3$)$_3$),	
	129.4 (s, 벤젠고리 CH),	
	131.5 (s, 벤젠고리 CH),	
	131.5 (s, 피리미딘 고리, 5 - 위치)	
	135.4 (s, 벤젠고리),	
	141.1 (s, 벤젠고리),	
	155.2 (s, 피리미딘 고리, 6 - 위치),	
	158.1 (s, 피리미딘 고리, 2 - 위치, CH)	
	174.4 (s, 피리미딘 고리, 4 - 위치, CH)	
	194.7 (s, CO),	
	[CDCl$_3$]	bp 75~77℃
7	^1H-NMR δ (ppm) [용매] ;	
	1.11-1.47 (m, 4H, 시클로프로판 고리(메틸렌))	
	2.10-2.50 (m, 1H, 시클로프로판 고리 (메틴))	
	8.85 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	9.32 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	[CDCl$_3$]	$n_D^{20.5}$ 1.4998
8	^1H-NMR δ (ppm) [용매] ;	
	1.06 (s, 9H, C(CH$_3$)$_3$)	
	6.89~7.37 (m, 3H, 벤젠고리)	
	8.67 (s, 1H, 피리미딘 고리)	

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
8	9.19 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
(계속)	[CDCl$_3$]	$n_D^{23.1}$ 1.5571
9	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매];	
	1.35 (s, 9H, C(C<u>H</u>$_3$)$_3$)	
	6.83~7.08 (m, 2H, 벤젠고리)	
	7.70~7.75 (m, 1H, 벤젠고리)	
	8.17 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	9.01 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	[CDCl$_3$]	mp 102-103℃
10	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매];	
	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, 피리미딘 고리)	
	9.32 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	[CDCl$_3$]	$n_D^{23.4}$ 1.4745
11	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매];	
	4.30 (s, 2H, C<u>H</u>$_2$Br)	
	8.90 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	9.38 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	[CDCl$_3$]	오일
12	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매];	
	0.72~1.40 (m, 4H, 시클로-프로필 C<u>H</u>$_2$)	
	1.59~2.01 (m, 1H, 시클로-프로필 C<u>H</u>)	

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
12	7.40 (d, J=9Hz, 2H, 벤젠고리)	
(계속)	7.62 (d, J=9Hz, 2H, 벤젠고리)	
	8.77 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	9.22 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	($CDCl_3$)	mp. 110-112℃
13	^1H-NMR δ (ppm) [용매];	
	1.00 (t, J=7Hz, 3H, $CH_2CH_2CH_3$)	
	1.74 (tq, J=7, 7Hz, 2H, $CH_2CH_2CH_3$)	
	2.82 (t, J=7Hz, 2H, $CH_2CH_2CH_3$)	
	8.77 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	9.33 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	($CDCl_3$)	$n_D^{19.7}$ 1.4770
14	^1H-NMR δ (ppm) [용매];	
	0.97~1.46 (m, 4H, 시클로-프로필 CH_2)	
	2.00~2.42 (m, 1H, 시클로-프로필 CH)	
	8.84 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	9.29 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	($CDCl_3$)	$n_D^{20.5}$ 1.4732
15	^1H-NMR δ (ppm) [용매];	
	1.16 (s, 9H, $C(CH_3)_3$)	
	3.91 (s, 3H, OCH_3)	
	7.00 (d, J=9Hz, 2H, 벤젠고리)	
	7.83 (d, J=9Hz, 2H, 벤젠고리)	

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
15 (계속)	8.47 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.27 (s, 1H, 피리미딘 고리) 〔CDCl$_3$〕	mp 91-93℃
16	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 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, 벤젠고리) 8.37 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.19 (s, 1H, 피리미딘 고리) 〔CDCl$_3$〕	mp 71-73℃
17	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 2.61 (t, <u>J</u>=1Hz, 3H, C<u>H</u>$_3$) 8.85 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.41 (s, 1H, 피리미딘 고리) 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{19.3}$ 1.4519
18	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 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, 벤젠고리) 8.46 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.27 (s, 1H, 피리미딘 고리) 〔CDCl$_3$〕	mp 98-100℃

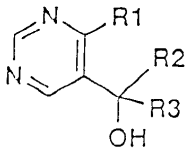
화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
19	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매] ; 1.36 (s, 9H, C(C<u>H</u>$_3$)$_3$) 2.73 (s, 3H, C<u>H</u>$_3$) 6.80~7.80 (m, 4H, 벤젠고리) 8.45 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.25 (s, 1H, 피리미딘 고리) [CDCl$_3$]	mp 57-59℃
20	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매] ; 7.51 (d, <u>J</u>=9Hz, 2H, 벤젠고리) 7.72 (d, <u>J</u>=9Hz, 2H, 벤젠고리) 8.88 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.50 (s, 1H, 피리미딘 고리) [CDCl$_3$]	$n_D^{20.3}$ 1.5742
21	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매] ; 7.19~7.69 (m, 3H, 벤젠고리) 8.78 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.36 (s, 1H, 피리미딘 고리) [CDCl$_3$]	$n_D^{20.5}$ 1.5837
22	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매] ; 2.62 (s 3H, C<u>H</u>$_3$) 8.79 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.32 (s, 1H, 피리미딘 고리) [CDCl$_3$]	$n_D^{19.3}$ 1.5069

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
23	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매], 7.34~7.84 (m, 5H, 벤젠고리) 8.76 (s, 1H, 피리미딘 고리) 8.87 (s, 1H, 피리미딘 고리) 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{20.1}$ 1.5571
24	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 6.95~8.00 (m, 4H, 벤젠고리) 8.82 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.43 (s, 1H, 피리미딘 고리) 〔CDCl$_3$〕	mp 63-64℃
25	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 6.85-8.10 (m, 4H, 벤젠고리) 8.75 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.34 (s, 1H, 피리미딘 고리) 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{20.3}$ 1.5468
26	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 7.10-7.82 (m, 4H, 벤젠고리) 8.75 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.46 (s, 1H, 피리미딘 고리) 〔CDCl$_3$〕	mp 40-42℃
27	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 7.17-7.76 (m, 4H, 벤젠고리) 8.77 (s, 1H, 피리미딘 고리)	

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
27	9.35 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
(계속)	(CDCl$_3$) $n_D^{19.3}$ 1.5612	
28	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매];	
	7.34-7.76 (m, 4H, 벤젠고리)	
	8.79 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	9.39 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	(CDCl$_3$) $n_D^{19.3}$ 1.5756	
29	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매],	
	7.37-7.91 (m, 3H, 벤젠고리)	
	9.00 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	9.63 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	(CDCl$_3$)	mp 51-53℃
30	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매];	
	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, 피리미딘 고리)	
	9.30 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	(CDCl$_3$) $n_D^{20.0}$ 1.5113	

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
.31	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매] ; 1.00 (t, J=7Hz, 3H, $CH_2CH_2CH_3$) 1.77 (tq, J=7.7Hz, 2H, $CH_2CH_2CH_3$) 2.95 (t, J=7Hz, 2H, $CH_2CH_2CH_3$)) 6.88 (t, J=53Hz, 1H, CHF_2) 9.01 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.30 (s, 1H, 피리미딘 고리) [CDCl$_3$] $n_D^{20.3}$ 1.4830	
32	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매] ; 2.67 (s, 3H, CH_3) 7.10-7.45 (m, 4H, 벤젠고리) 8.88 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.46 (s, 1H, 피리미딘 고리) [$CDCl_3$] $n_D^{20.4}$ 1.5588	

표 2 - 1



화합물 번호	R1	R2	R3
101	CF_2Cl	Me	H
102	CF_3	Me	H
103	CF_2Cl	Bu^{tert}	H
104	4-Cl-페닐	Bu^{tert}	H
105	Bu^{tert}	4-Cl-페닐	H
106	CF_2Cl	$Pr^{시클로}$	H
107	CF_2CF_3	Me	H
108	2,4-Cl_2-페닐	Bu^{tert}	H
109	Bu^{tert}	2,4-Cl_2-페닐	H
110	CF_2Cl	Me	Me
111	CF_2Cl	Pr^{i}	H
112	CF_2Cl	Et	H
113	4-Cl-페닐	$Pr^{시클로}$	H
114	CF_2Cl	Pr^{iso}	H
115	Bu^{tert}	4-MeO-페닐	H
116	Bu^{tert}	2-MeO-페닐	H
117	Bu^{tert}	2-Me-페닐	H
118	Bu^{tert}	3-Me-페닐	H
119	CF_2Cl	4-Cl-페닐	H
120	CF_2CF_2Cl	Me	H
121	CF_2Cl	2,4-Cl_2-페닐	H
122	CF_2Br	Me	H
123	CF_2Cl	페닐	H
124	CF_2Cl	4-F-페닐	H

화합물 번호	R 1	R 2	R 3
1 2 5	C F ₂ C l	2 - F - 페닐	H
1 2 6	C F ₂ C l	2 - C l - 페닐	H
1 2 7	C F ₂ C l	3 - C l - 페닐	H
1 2 8	C F ₂ C l	3 , 4 - C l ₂ - 페닐	H
1 2 9	C F ₂ C l	3 - F - 페닐	H

표 2 - 2

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
101	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 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) [용매]; 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) [용매]; 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, 퍼리미딘 고리) 9.25 (s, 1H, 퍼리미딘 고리) [CDCl$_3$]	n$_D^{19.9}$ 1.4623

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
104	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 0.71 (s, 9H, C(CH$_3$)$_3$), 2.92 (br, 1H, OH), 4.84 (s, 1H, CHOH), 7.32 (s, 4H, 벤젠고리), 8.88 (s, 1H, 피리미딘 고리), 8.98 (s, 1H, 피리미딘 고리), 〔CDCl$_3$〕, MS (EI) m/z; 276 (M$^+$, 41), 261 (13), 243 (8), 221 (기본 피크), 219 (99), 185 (73), 57 (95)	$n_D^{20.2}$ 1 5575
105	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 1 43 (s, 9H, C(CH$_3$)$_3$), 4.39 (br, 1H, OH), 6.41 (s, 1H, CHOH), 7 15 (s, 4H, 벤젠고리), 8.30 (s, 1H, 피리미딘 고리), 8.76 (s, 1H, 피리미딘 고리), 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{20.2}$ 1 5474
106	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 0.49~0.74 (m, 4H, 시클로프로판 (메틸렌)) 1.23~1.44 (m, 4H, 시클로프로판 (메틴)) 3 00 (br, 1H, OH),	

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
106	4.70~4.89 (m, 1H, φCHOH)	
(계속)	9.11 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	9.19 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	(CDCl$_3$)	$n_D^{20.5}$ 1.5020
107	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매] ;	
	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, 피리미딘 고리)	
	9.22 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	(CDCl$_3$)	$n_D^{22.1}$ 1.4347
108	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매] ;	
	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, 벤젠고리)	
	8.85 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	8.97 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	(CDCl$_3$)	$n_D^{19.5}$ 1.5554
109	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매] ;	
	1.43 (s, 9H, C(CH$_3$)$_3$)	
	4.83 (br s, 1H, OH)	

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
109 (계속)	6.45 (s, 1H, φCH) 6.76~7.27 (m, 3H, 벤젠고리) 8.24 (s, 1H, 피리미딘 고리) 8.76 (s, 1H, 피리미딘 고리) (CDCl3)	nD 19.3 1.5464
110	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 1.78 (s, 6H, CH3 ×2), 3.05 (br. s, 1H, OH) 9.17 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9 32 (s, 1H, 피리미딘 고리) (CDCl3)	nD 20.5 1.4982
111	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매], 0.70~1.19 (m, 3H, CH3) 1 19~2.00 (m, 4H, CHCH: CH: CH2) 2 4~3.1 (br s, 1H, OH) 5.0~5.5 (m, 1H, CH) 9.09 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.12 (s, 1H, 피리미딘 고리) (CDCl3)	nD 19.3 1.4798
112	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 1 05 (t, J=7Hz, 3H, CH: CH3) 1.74 (br q, J=7Hz, 2H, CHCH: CH2)	

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
112 (계속)	2.91 (d, J=3Hz, 1H, OH) 4.85~5.35 (m, 1H, CH) 9.06 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.10 (s, 1H, 피리미딘 고리) (CDCl3)	$n_D^{19.7}$ 1.4845
113	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 0.21~0.74 (m, 4H, 시클로-프로필 CH_2) 0.94~1.46 (m, 1H, 시클로-프로필 CH) 3.10 (br. s, 1H, OH) 4.25 (d, J=7Hz, 1H, φCH) 7.33 (d, J=9Hz, 2H, 벤젠고리) 7.51 (d, J=9Hz, 2H, 벤젠고리) 8.96 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.01 (s, 1H, 피리미딘 고리) (CDCl3)	mp 142-144℃
114	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 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, 피리미딘 고리) (CDCl3)	$n_D^{19.3}$ 1.4822

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
115	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 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, 벤젠고리) 7.20 (d, J=9Hz, 2H, 벤젠고리) 8.58 (s, 1H, 피리미딘 고리) 8.88 (s, 1H, 피리미딘 고리) [CDCl$_3$]	mp 90-92℃
116	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 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÷ 벤젠고리) 8.67 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.04 (s, 1H, 피리미딘 고리) [CDCl$_3$]	mp 102-104℃
117	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 1.36 (s, 9H, C(CH$_3$)$_3$) 2.34 (s, 3H, CH$_3$) 4.25 (br s, 1H, OH)	

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
117	6.56 (s, 1H, CH)	
(계속)	6.9~7.6 (m, 4H, 벤젠고리)	
	8.63 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	8.90 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	(CDCl$_3$)	mp 125-127℃
118	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매];	
	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, 벤젠고리)	
	8.48 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	8.85 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	(CDCl$_3$)	$n_D^{21.5}$ 1.5574
119	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매];	
	3.40 (br s, 1H, OH)	
	6.34 (s, 1H, φCH)	
	7.29 (s, 4H, 벤젠고리)	
	9.09 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	9.14 (s, 1H, 피리미딘 고리)	
	(CDCl$_3$)	$n_D^{20.3}$ 1.5563

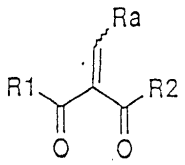
화합물 번호.	스펙트럼 데이타	물리적 성질
120	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 1.53 (d, J=6Hz, 3H, CHCH$_3$) 2.62 (br s, 1H, OH) 5.07~5.58 (m, 1H, CHCH$_3$) 9.10 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.18 (s, 1H, 피리미딘 고리) [CDCl$_3$]	$n_D^{20.1}$ 1.4616
121	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 3.42 (br·d, J=5Hz, 1H, OH) 6.58 (d, J=5Hz, 1H, φCH) 7.30~7.45 (m, 3H, 벤젠고리) 8.82 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.20 (s, 1H, 피리미딘 고리) [CDCl$_3$]	mp 141-142℃
122	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 1.57 (d, J=6Hz, 3H, CHCH$_3$) 3.12~3.78 (br s, 1H, OH) 5.41 (d, q, J=3, 6Hz, 1H, CHCH$_3$) 9.07 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.17 (s, 1H, 피리미딘 고리) [CDCl$_3$]	$n_D^{20.1}$ 1.5160

화합물 번호.	스펙트럼 데이타.	물리적 성질
123	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 4.79~5.04 (m, 1H, OH) 6.23 (br s, 1H, φCH) 7.17 (br s, 5H, 벤젠고리) 8.82 (s, 1H, 피리미딘 고리) 8.97 (s, 1H, 피리미딘 고리) (CDCl$_3$)	$n_D^{23.9}$ 1.5566
124	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 3.68 (d, J=6Hz, 1H, OH) 6.20~6.40 (m, 1H, CHOH) 6.90~7.53 (m, 4H, 벤젠고리) 9.06 (s, 2H, 피리미딘 고리) (CDCl$_3$)	$n_D^{23.5}$ 1.5394
125	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 3.38-4.08 (br s, 1H, OH) 6.55 (s, 1H, CHOH) 6.68-7.58 (m, 4H, 벤젠고리) 9.06 (s, 2H, 피리미딘 고리) (CDCl$_3$)	$n_D^{19.7}$ 1.5434
126	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 4.20-4.41 (br m, 1H, OH) 6.53-6.67 (m, 1H, CHOH)	

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
126 (계속)	7.12-7.56 (m, 4H, 벤젠고리) 8.73 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.00 (s, 1H, 피리미딘 고리) 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{23.5}$ 1.5378
127	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 4.22-4.43 (br m, 1H, OH) 6.21-6.35 (m, 1H, CHOH) 7.06-7.35 (m, 4H, 벤젠고리) 8.99 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.02 (s, 1H, 피리미딘 고리) 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{19.8}$ 1.5402
128	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 3.10-3.50 (br m, 1H, OH) 6.23-6.32 (m, 1H, CHOH) 6.97-7.48 (m, 3H, 벤젠고리) 8.98 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.10 (s, 1H, 피리미딘 고리) 〔CDCl$_3$〕	mp 66-68℃

화합물 번호	스펙트럼 데이타	물리적 성질
129	^{1}H-NMR δ (ppm) [용매]; 3.40-3.80 (br s, 1H, OH) 6.33 (s, 1H, CHOH) 6.74-7.60 (m, 4H, 벤젠고리) 9.01 (s, 1H, 피리미딘 고리) 9.09 (s, 1H, 피리미딘 고리) 〔CDCl$_3$〕	$n_D^{19.7}$ 1.5438

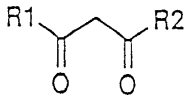
표 3 - 1



화합물 번호.	R1, R2, Ra , 물리적 성질
201	CF_3, Me, OMe ; bp 93-97℃/3.5 토르
202	CF_3, Me, OEt ; bp 82-83℃/0.2 토르
203	CF_2Cl, Me, OEt ; bp 95-118℃/1.6 토르
204	CF_2Cl, Bu^{ttt}, OEt ; bp 105-107℃/2.0 토르
205	CF_2CF_3, Me, OEt , bp 98 ℃/2.2 토르
206	4-Cl-페닐 , Bu^{ttt}, NMe_2 , mp 102-104℃
207	CF_2Cl, $Pr^{시클로}$, OEt , $n_D^{20.5}$ 1.4787
208	2, 4-Cl_2-페닐 , Bu^{ttt}, NMe_2 ; $n_D^{19.9}$ 1.5437
209	4-Cl-페닐 , Me, NMe_2 ; $n_D^{20.3}$ 1.5964
210	CF_2Cl, Et, OEt ; bp 117-120℃/2 3 토르
211	4-Cl-페닐 , $Pr^{시클로}$, NMe_2 ; mp 37-39℃
212	4-MeO-페닐 , Bu^{ttt}, NMe_2 ; mp 93-95℃
213	CF_2Cl, Pr^{i} , OEt ; bp 105-115℃/1.7 토르
214	2-Me-페닐 , Bu^{ttt}, NMe_2 ; mp 90-92℃
215	3-Me-페닐 , Bu^{ttt}, NMe_2 ; mp 83-86℃
216	2-MeO-페닐 , Bu^{ttt}, NMe_2 ; mp 109-112℃
217	CF_2CF_2Cl, Me, OEt ; bp 110-115℃/2.1 토르
218	CF_2Cl, 4-Cl-페닐 , NMe_2 ; bp 79-81℃
219	CF_2Cl, 페닐 , OEt ; $n_D^{20.1}$ 1.5395
220	CF_2Cl, 4-F-페닐 , OEt ; $n_D^{20.9}$ 1.5233
221	CF_2Cl, 2-F-페닐 , OEt ; $n_D^{20.3}$ 1.3808

화합물 번호.	R1, R2, Ra ; 물리적 성질
222	CF_2Cl, 3-F-페닐, OEt; $n_D^{19.7}$ 1.4900
223	CF_2Cl, 2-Cl-페닐, OEt; $n_D^{19.9}$ 1.5306
224	CF_2Cl, 3-Cl-페닐, OEt; $n_D^{19.9}$ 1.5368
225	CF_2Cl, 3, 4-Cl_2-페닐, OEt, $n_D^{19.3}$ 1.5578
226	CHFCl, Pr^n, OEt, $n_D^{19.3}$ 1.4770
227	CF_2H, Pr^n, OEt; $n_D^{19.9}$ 1.4530
228	CF_2Cl, 2-Me-페닐, OEt; $n_D^{20.3}$ 1.5350

표 3 - 2

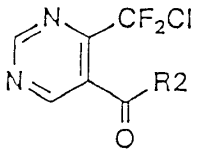
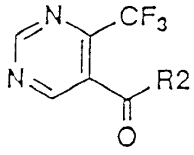


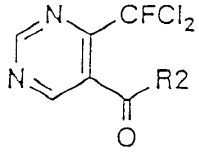
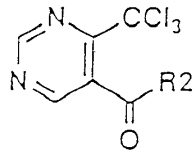
화합물 번호.	R1, R2 ; 물리적 성질
301	CF_2Cl, Bu^{tert}; bp 54-57℃/5 0 토르
302	CF_2CF_3, Bu^{tert}; ^1H-NMR δ (ppm) [용매] ;) ; 1 22(s, 9H, t-Bu), 6.05(s, 1H, C<u>H</u>), 13.0~14.0(br s, 1H, O<u>H</u>, 〔$CDCl_3$〕 액체 .
303	4-Cl-페닐, Bu^{tert}; $n_D^{20.0}$ 1.5012
304	CF_2CF_3, Me; bp 105-115℃
305	CF_2Cl, $Pr^{시클로}$; $n_D^{20.5}$ 1.4788
306	2, 4-Cl_2-페닐, Bu^{tert}; $n_D^{19.9}$ 1.5690
307	CF_2Cl, Et, bp 74-78℃/20 토르
308	CF_2Cl, Pr^n ; bp 84℃/17 토르
309	4-Cl-페닐, $Pr^{시클로}$; mp 73-75℃
310	CF_2Cl, Pr^{iso} ; bp 42-43℃/3. 0 토르
311	4-MeO-페닐, Bu^{tert}; mp 50-52℃
312	2-Me-페닐, Bu^{tert}; $n_D^{21.5}$ 1.4882
313	3-Me-페닐, Bu^{tert}; $n_D^{21.4}$ 1 5564
314	4-CF_3-페닐, Bu^{tert}; mp 55-58℃
315	2-F-페닐, Bu^{tert}; $n_D^{20.3}$ 1.5488
316	2-MeO-페닐, Bu^{tert}; $n_D^{20.4}$ 1.5622
317	2, 4-Cl_2-페닐, Me; mp 30-31℃
318	CF_2Cl, 4-Cl-페닐 ; mp 50-51℃

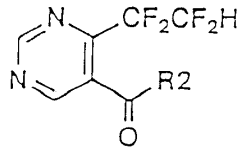
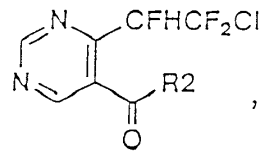
화합물 번호.	R1, R2 ; 물리적 성질
319	3-CF_3-페닐, Bu^{tert}; ^{1}H-NMR δ (ppm) (용매), 1.27(s, 9H, t-Bu), 6.36(s, 1H, 올레핀), 7.30~8.40(m, 4H, 벤젠고리), 16.56(s, 1H, 에놀 OH) ($CDCl_3$) 액체
320	$CF_2ClCH_2Me-Pr^{시클로}$; bp 59-63℃/2.0 토르
321	CF_2CF_2ClMe; bp 120-128℃
322	CF_2Cl, 2,4-Cl_2-페닐, $n_D^{21.7}$ 1.5823
323	CF_2BrMe; bp 100-105℃
324	CF_2Cl, 4-F-페닐; mp 48-50℃
325	CF_2Cl, 페닐; mp 29-30℃
326	CF_2Cl, 2-F-페닐, $n_D^{19.9}$ 1.5554
327	CF_2Cl, 3-F-페닐; mp 46-48℃
328	CF_2Cl, 2-Cl-페닐; $n_D^{19.9}$ 1.5630
329	CF_2Cl, 3-Cl-페닐; $n_D^{19.9}$ 1.5807
330	CF_2Cl, 3,4-Cl_2-페닐; mp 41-43℃
331	$CHFClPr^n$; bp 94-100℃/20 토르
332	CF_2HPr^n; bp 74-76℃/20 토르
333	CF_2Cl, 2-Me-페닐; $n_D^{19.9}$ 1.5566

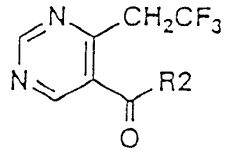
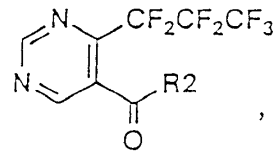
<170> 표 4-1, 4-2 및 4-3는 전기의 실시예에서 합성한 화합물을 포함하여, 전술한 도식 및 실시예에 따라 합성할 수 있는 본 발명의 화합물을 나타낸다. 그러나, 본 발명은 상기의 특정 실시예에 의해 결코 한정되지 않는다.

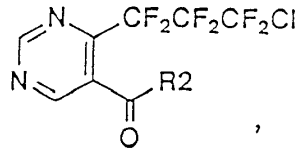
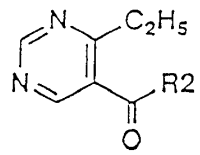
표 4 - 1

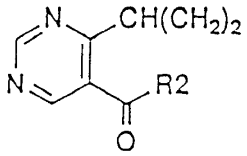
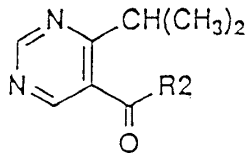

CF2Cl
N
N
R2
O
;

CF3
N
N
R2
O
,

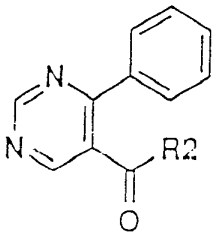
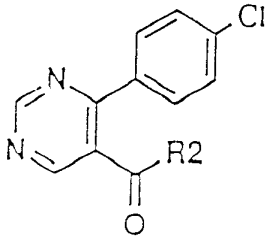
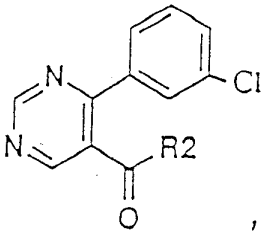
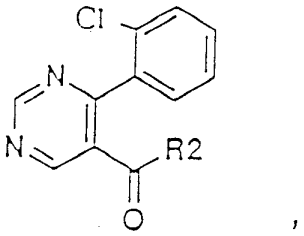
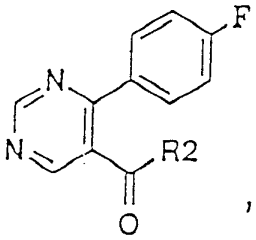
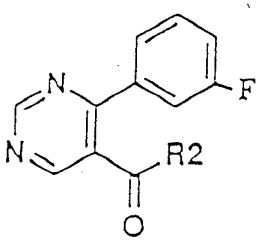
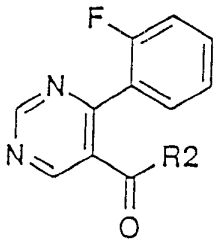
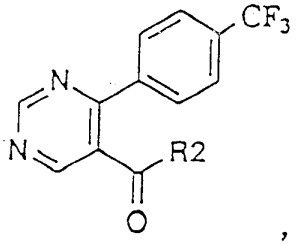
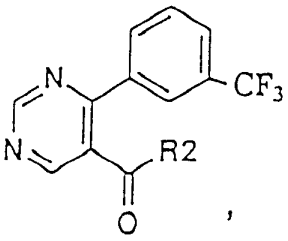
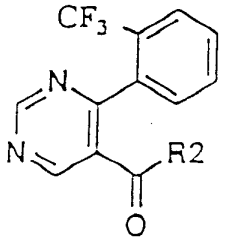

CFCl2
N
N
R2
O
,

CCl3
N
N
R2
O
,

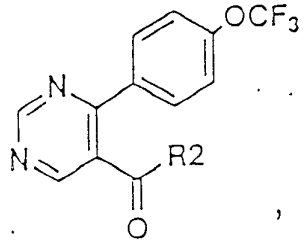
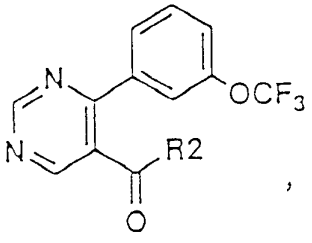

CF2CF2H
N
N
R2
O
,

CFHCF2Cl
N
N
R2
O
,

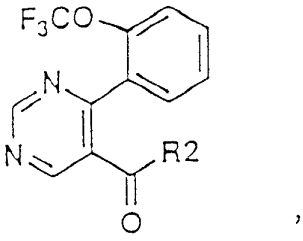
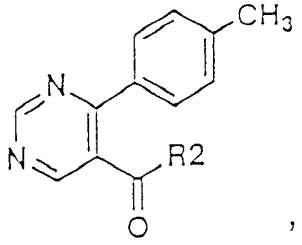

CH2CF3
N
N
R2
O
,

CF2CF2CF3
N
N
R2
O
,

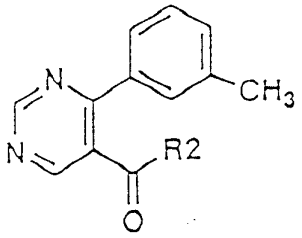
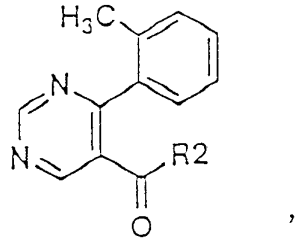

CF2CF2CF2Cl
N
N
R2
O
,

C2H5
N
N
R2
O
,

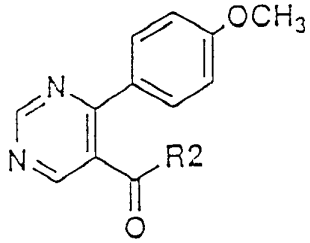
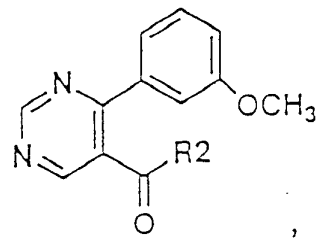

CH(CH2)2
N
N
R2
O
,

CH(CH3)2
N
N
R2
O
,

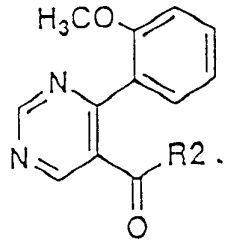
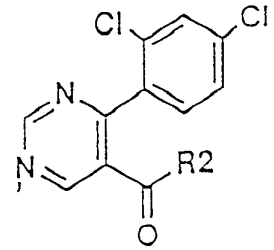

N
N
R2
O
,

Cl
N
N
R2
O

N
Cl
N
R2
O
,

Cl
N
N
R2
O
,

F
N
N
R2
O
,

N
F
N
R2
O
,

F
N
N
R2
O
,

CF3
N
N
R2
O
,

N
CF3
N
R2
O
,

CF3
N
N
R2
O
,

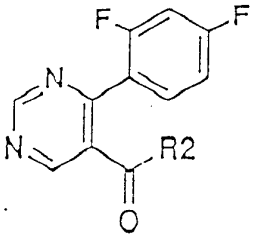
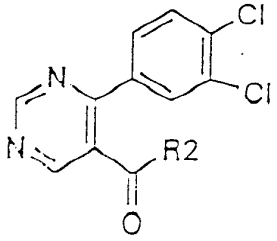
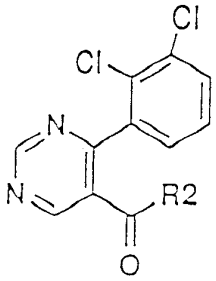
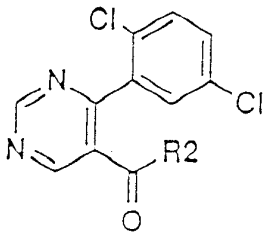
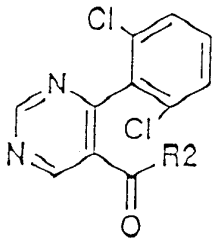
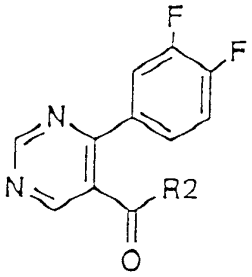
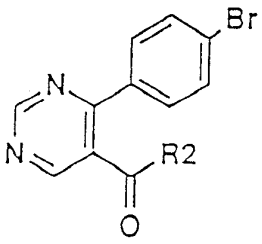
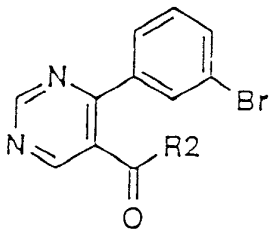
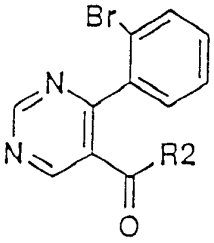
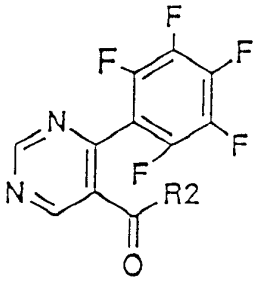

OCF3
N
N
R2
O
,

N
OCF3
N
R2
O
,

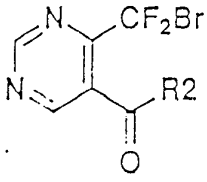
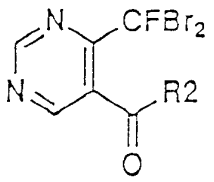

F3CO
N
N
R2
O
,

CH3
N
N
R2
O
,

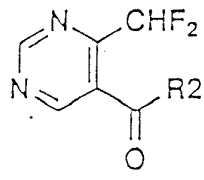
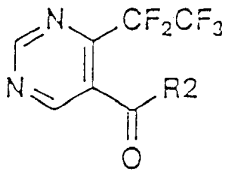

N
CH3
N
R2
O
,

H3C
N
N
R2
O
,

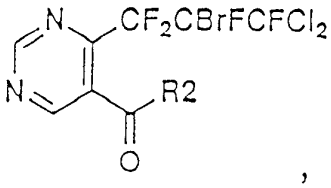
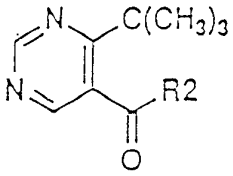

OCH3
N
N
R2
O
,

N
OCH3
N
R2
O
,

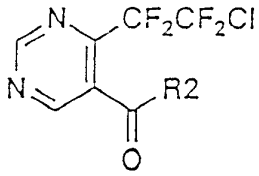
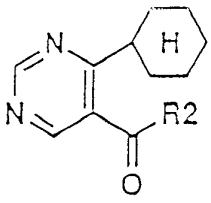

H3CO
N
N
R2
O
,

Cl
Cl
N
N
R2
O
,

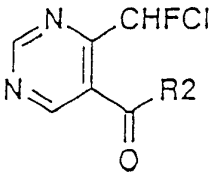

F
F
N
N
R2
O
,

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
,

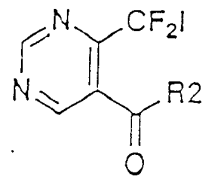

N
CF2Br
N
R2
O
,

N
CFBr2
N
R2
O
,


N
CHF2
N
R2
O
,

N
CF2CF3
N
R2
O
,

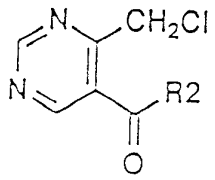

N
CF2CBrFCFCl2
N
R2
O
,

N
C(CH3)3
N
R2
O
,


N
CF2CF2Cl
N
R2
O
,

N
H
N
R2
O
,

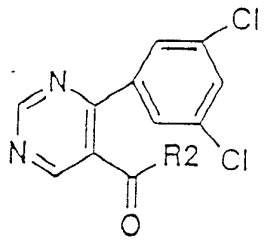

N
CHFCl
N
R2
O
.
,


N
CF2I
N
R2
O

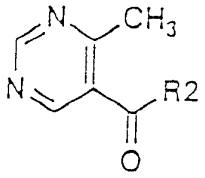
,


N
CH2Cl
N
R2
O

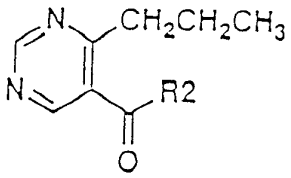
,


Cl
N
N
R2
Cl
O

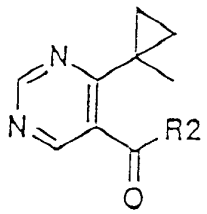
,


N
CH3
N
R2
O

,


N
CH2CH2CH3
N
R2
O

,

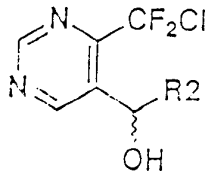

N
N
R2
O

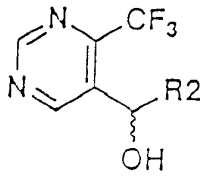
,

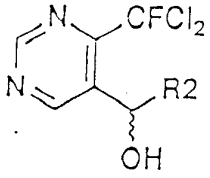
R2 는 하기의 군으로부터 선택된다.

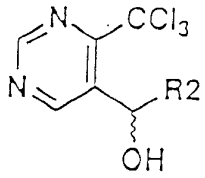
R 2
Me, Et, Pr, Pr^{i}, Pr^{시클로}, Bu, Bu^{s}, Bu^{i}, Bu^{t}, Bu^{시클로}, Pn, Pn^{s}, Pn^{i}, Pn^{시클로}, Hex, Hex^{시클로}, C(Me)$_2$(CH$_2$F), CF$_3$, CH$_2$CF$_3$, Ph, 2-Cl-Ph, 3-Cl-Ph, 4-Cl-Ph, 2-F-Ph, 3-F-Ph, 4-F-Ph, 2-CF$_3$-Ph, 3-CF$_3$-Ph, 4-CF$_3$-Ph, 2-Me-Ph, 3-Me-Ph, 4-Me-Ph, 2-MeO-Ph, 3-MeO-Ph, 4-MeO-Ph, 2-CF$_3$O-Ph, 3-CF$_3$O-Ph, 4-CF$_3$O-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$_2$Br 3,5-Cl$_2$-Ph, 2-Me-4-Cl-Ph, 2Me-4-F-Ph, 1-MeSO$_2$-Et, 1-Me-Pr^{시클로}, 1-F-Pr^{시클로}, 1-Cl-Pr^{시클로}, 1-MeS-Pr^{시클로}, 1-EtS-Pr^{시클로}, CH$_2$Cl, CF(Me)$_2$, 1-Pr^{시클로}-Et, CH$_2$CH=CH$_2$, CH$_2$C≡CH, CH(Me)C≡CH, C(Me)$_2$C≡CH, CH(Me)CH=CH$_2$, 4-Bu^{t}-Ph, 3-Bu^{t}-Ph, 2-Bu^{t}-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^{i}O-Ph, 2-PrO-Ph,

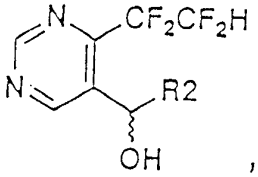
표 4 - 2

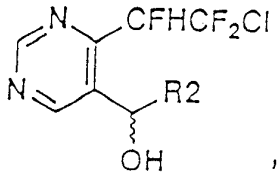

CF2Cl
N
N
R2
OH
,

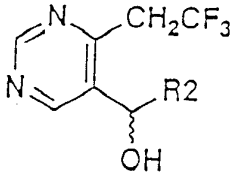

CF3
N
N
R2
OH
,

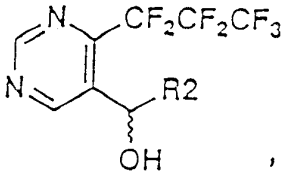

CFCl2
N
N
R2
OH
,

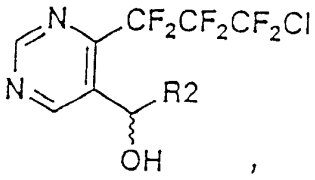

CCl3
N
N
R2
OH
,

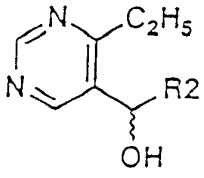

CF2CF2H
N
N
R2
OH
,

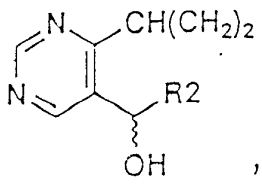

CFHCF2Cl
N
N
R2
OH
,

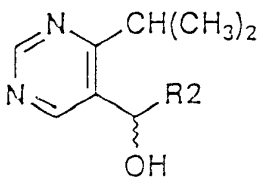

CH2CF3
N
N
R2
OH
,

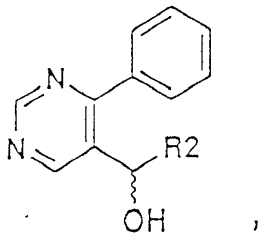

CF2CF2CF3
N
N
R2
OH
,

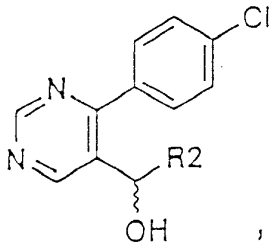

CF2CF2CF2Cl
N
N
R2
OH
,

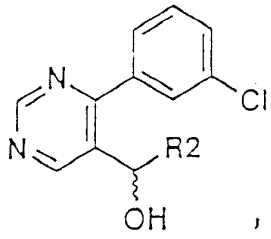

C2H5
N
N
R2
OH
,

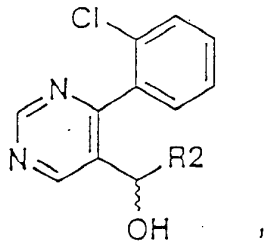

CH(CH2)2
R2
OH
,

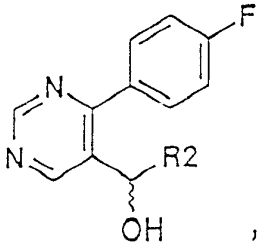

CH(CH3)2
R2
OH
,

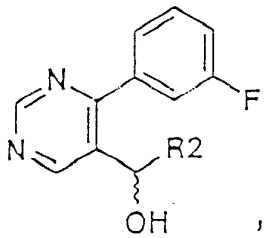

R2
OH
,

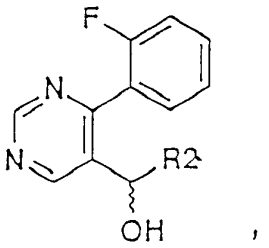

Cl
R2
OH
,

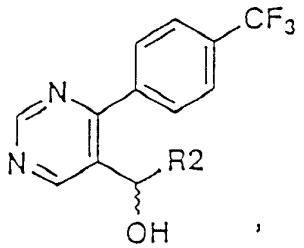

Cl
R2
OH
,

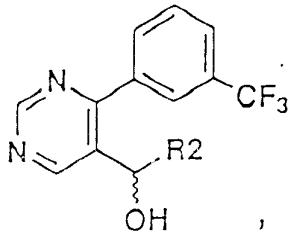
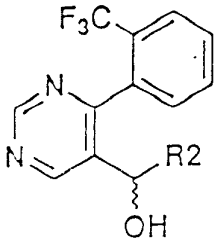
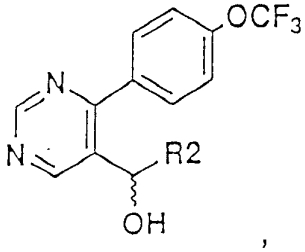
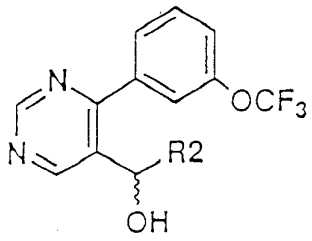
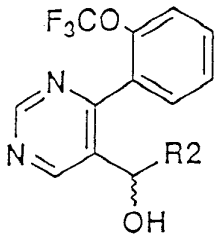
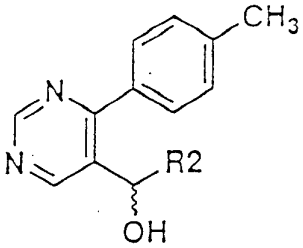
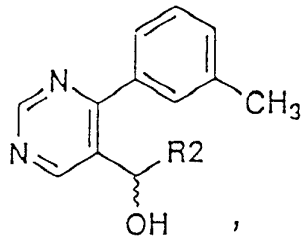
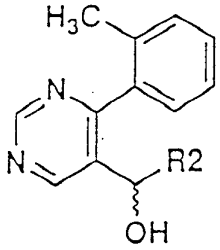
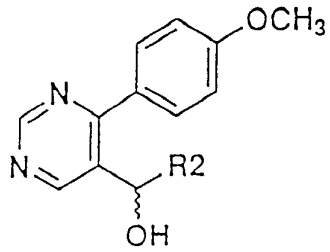

Cl
R2
OH
,

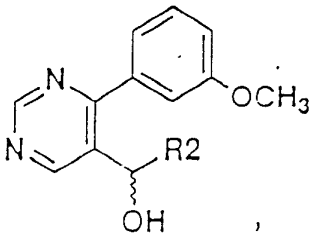

F
R2
OH
,

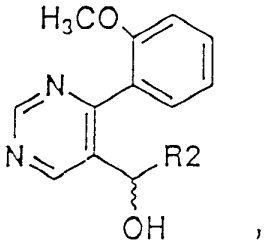

F
R2
OH
,

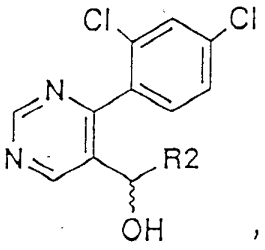

F
R2
OH
,

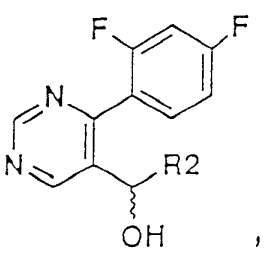

CF3
R2
OH
,

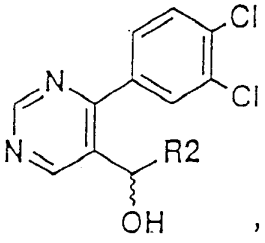

N
N
CF3
R2
OH
,

F3C
N
N
R2
OH
,

OCF3
N
N
R2
OH
,

OCF3
N
N
R2
OH
,

F3CO
N
N
R2
OH
,

CH3
N
N
R2
OH
,

N
N
CH3
R2
OH
,

H3C
N
N
R2
OH
,

OCH3
N
N
R2
OH
,

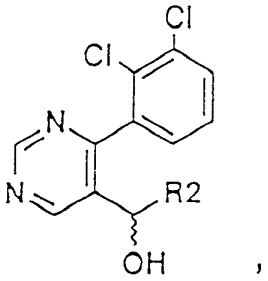

OCH3
N
N
R2
OH
,

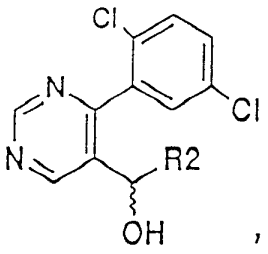

H3CO
N
N
R2
OH
,

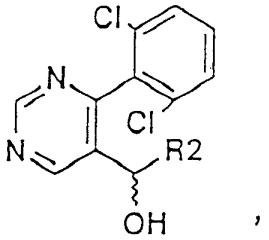

Cl
Cl
N
N
R2
OH
,

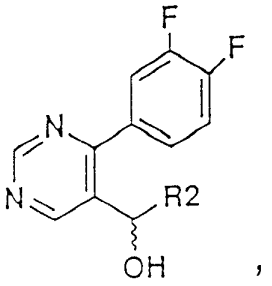

F
F
N
N
R2
OH
,

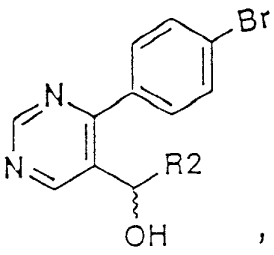

Cl
Cl
N
N
R2
OH
,

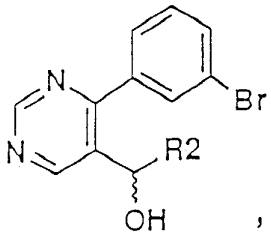

Cl
Cl
N
N
R2
OH
,

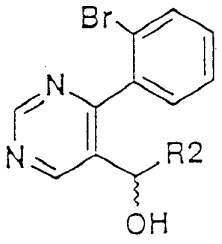

Cl
Cl
N
N
R2
OH
,

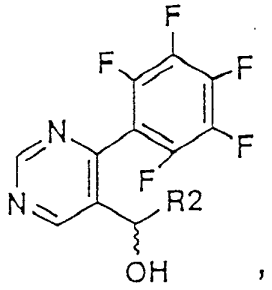

Cl
Cl
N
N
R2
OH
,

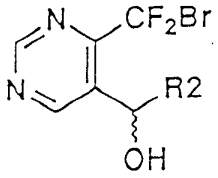
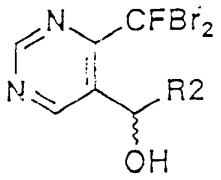

F
F
N
N
R2
OH
,

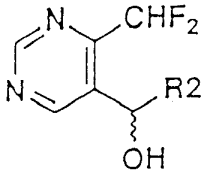
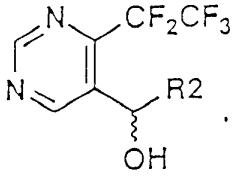

Br
N
N
R2
OH
,

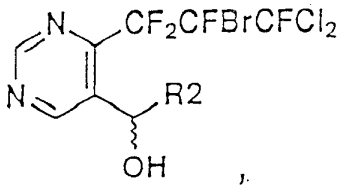
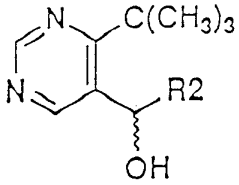

N
Br
N
R2
OH
,

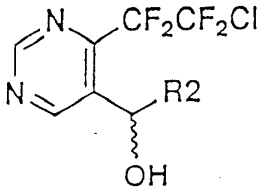
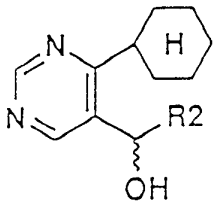

Br
N
N
R2
OH
,

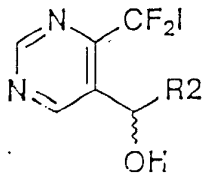
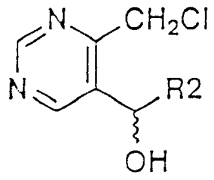
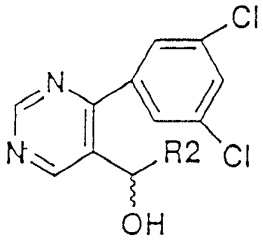

F
F
F
F
F
N
N
R2
OH
,


N
CF2Br
N
R2
OH
,

N
CFBr2
N
R2
OH
,


N
CHF2
N
R2
OH
,

N
CF2CF3
N
R2
OH
,

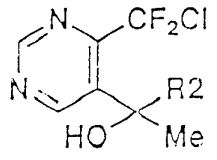
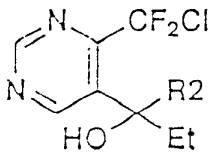

N
CF2CFBrCFCl2
N
R2
OH
,

N
C(CH3)3
N
R2
OH
,

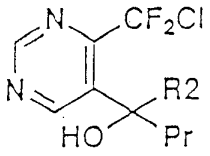
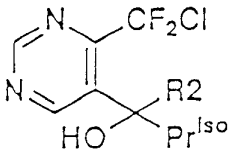

N
CF2CF2Cl
N
R2
OH
,

N
H
N
R2
OH
,

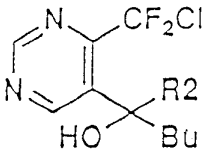
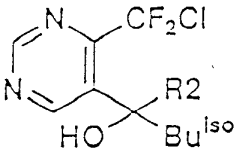




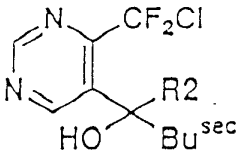
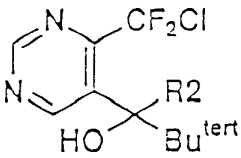
R 2
Me, Et, Pr, Pr^{iso}, Pr^{시클로}, Bu, Bu^{sec}, Bu^{iso}, Bu^{tert}, Bu^{시클로}, Pn, Pn^{neo}, Pn^{iso}, Pn^{시클로}, Hex, Hex^{시클로}, C(Me)$_2$(CH$_2$F), CF$_3$, CH$_2$CF$_3$, Ph, 2-Cl-Ph, 3-Cl-Ph, 4-Cl-Ph, 2-F-Ph, 3-F-Ph, 4-F-Ph 2-CF$_3$-Ph, 3-CF$_3$-Ph, 4-CF$_3$-Ph, 2-Me-Ph, 3-Me-Ph, 4-Me-Ph, 2-MeO-Ph, 3-MeO-Ph, 4-MeO-Ph, 2-CF$_3$O-Ph, 3-CF$_3$O-Ph, 4-CF$_3$O-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$_2$Br
3,5-Cl$_2$-Ph, 2-Me-4-Cl-Ph, 2Me-4-F-Ph, 1-MeSO$_2$-Et, 1-Me-Pr^{시클로}, 1-F-Pr^{시클로}, 1-Cl-Pr^{시클로}, 1-MeS-Pr^{시클로}, 1-EtS-Pr^{시클로}, CH$_2$Cl, CF(Me)$_2$, 1-Pr^{시클로}-Et, CH$_2$CH=CH$_2$, CH$_2$C≡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,

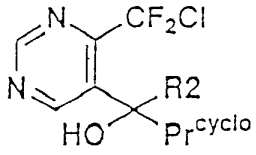
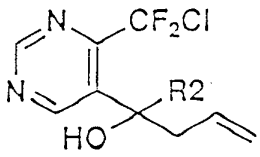
표 4 - 3

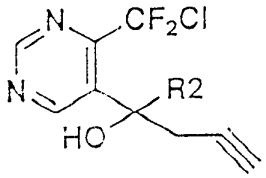

CF2Cl
R2
HO
Me
,

CF2Cl
R2
HO
Et
,

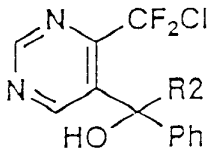

CF2Cl
R2
HO
Pr
,

CF2Cl
R2
HO
Priso
,

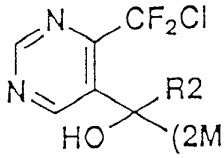

CF2Cl
R2
HO
Bu
,

CF2Cl
R2
HO
Buiso
,

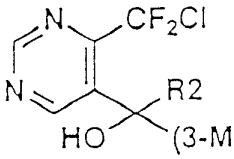

CF2Cl
R2
HO
Busec
,

CF2Cl
R2
HO
Butert
,

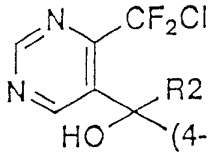

CF2Cl
R2
HO
Prcyclo
,

CF2Cl
R2
HO
,

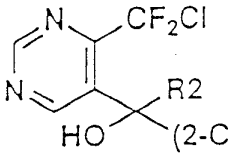

N
CF2Cl
N
R2
HO
,

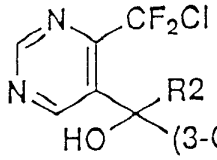

N
CF2Cl
N
R2
HO
Ph
,

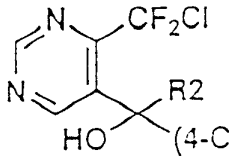

N
CF2Cl
N
R2
HO
(2Me-Ph)
,

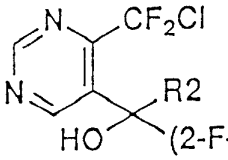

N
CF2Cl
N
R2
HO
(3-Me-Ph)
,

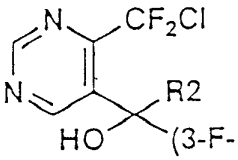

N
CF2Cl
N
R2
HO
(4-Me-Ph)
,

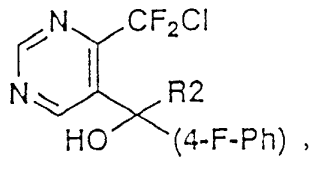

N
CF2Cl
N
R2
HO
(2-Cl-Ph)
,

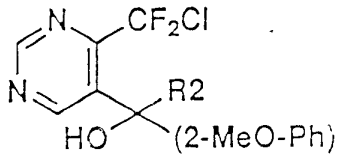

N
CF2Cl
N
R2
HO
(3-Cl-Ph)
,

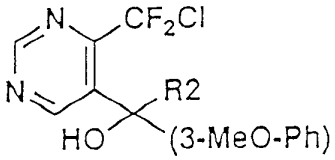

N
CF2Cl
N
R2
HO
(4-Cl-Ph)
,

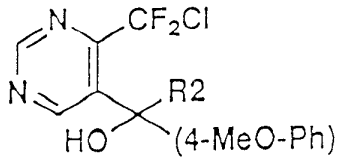

N
CF2Cl
N
R2
HO
(2-F-Ph)
,

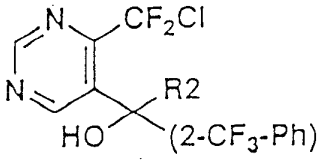

N
CF2Cl
N
R2
HO
(3-F-Ph)
,

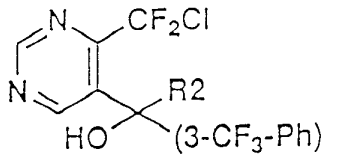

CF2Cl
N
N
R2
HO
(4-F-Ph)
,

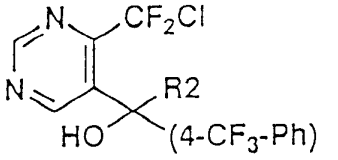

CF2Cl
N
N
R2
HO
(2-MeO-Ph)
,

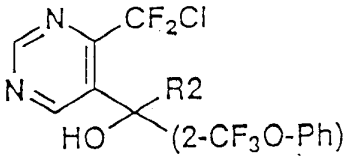

CF2Cl
N
N
R2
HO
(3-MeO-Ph)
,

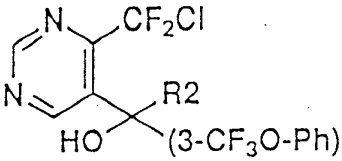

CF2Cl
N
N
R2
HO
(4-MeO-Ph)
,

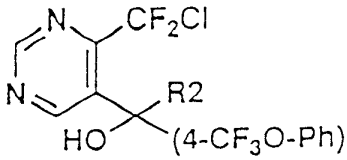

CF2Cl
N
N
R2
HO
(2-CF3-Ph)
,


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


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


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


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


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

R 2
Me, Et, Pr, Pr^{i}, Pr^{시클로}, Bu, Bu^{s}, Bu^{i}, Bu^{t}, Bu^{시클로}, Pn, Pn^{s}, Pn^{i}, Pn^{시클로}, Hex, Hex^{시클로}, C(Me)$_2$(CH$_2$F), CF$_3$, CH$_2$CF$_3$, 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$_3$O-Ph, 3-CF$_3$O-Ph, 4-CF$_3$O-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$_2$Br 3, 5-Cl$_2$-Ph, 2-Me-4-Cl-Ph, 2Me-4-F-Ph, 1-MeSO$_2$-Et, 1-Me-Pr^{시클로}, 1-F-Pr^{시클로}, 1-Cl-Pr^{시클로}, 1-MeS-Pr^{시클로}, 1-EtS-Pr^{시클로}, CH$_2$Cl, CF(Me)$_2$, 1-Pr^{시클로}-Et, CH$_2$CH=CH$_2$, CH$_2$C≡CH, CH(Me)C≡CH, C(Me)$_2$C≡CH, CH(Me)CH=CH$_2$, 4-Bu^{t}-Ph, 3-Bu^{t}-Ph, 2-Bu^{t}-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^{i}O-Ph, 2-PrO-Ph,

표에서의 기호는 하기의 의미를 갖는다.

Ph 페닐

Me : CH_3

Et : C_2H_5

Pr, Pr^n : $CH_2CH_2CH_3$

Pr^{i} : $CH(CH_3)_2$

Pr^{시클로} : $CH(CH_2)_2$

Bu, Bu^n : $CH_2CH_2CH_2CH_3$

Bu^{s} : $CH(CH_3)C_2H_5$

Bu^{i} : $CH_2CH(CH_3)_2$

Bu^{t} : $C(CH_3)_3$

Bu^{시클로} : $CH(CH_2)_2$

Pn, Pn^n : $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$

Pn^{시클로} : $CH(CH_2)_2$

Pn^{i} : $CH_2CH_2CH(CH_3)_2$

Pn^{t} : $CH_2C(CH_3)_3$

Hex, Hex^n : $CH_2(CH_2)_3CH_3$

Hep, Hep^n : $CH_2(CH_2)_4CH_3$

Oct, Oct^n : $CH_2(CH_2)_5CH_3$

4-Cl-Ph : 4-Cl-페닐

<191> 본 발명의 화합물을 제초제 또는 식물 성장 조절제로 사용하는 경우, 통상적으로는 적당한 담체와 혼합하는데, 고체 담체의 예로는 점토, 탈크, 벤토나이트, 우레아, 황산 암모늄, 호두분말, 규조토 또는 백색 카본, 또는 액체 담체로는 물, 알코올 (예, 이소프로판올, 부탄올, 에틸렌 글리콜, 벤질 알코올 또는 푸르푸릴 알코올), 방향족 탄화수소 (예, 톨루엔, 크실렌 또는 메틸나프탈렌), 에테르 (예, 아니졸), 식물유 (예, 대두유 또는 면실유), 케톤 (예, 시클로히사논 또는 이소포론), 에스테르 (예,부릴 아세테이트), 산 아미드 (에, N-메틸피롤리돈) 또는 할로겐화 탄화수소 (예, 클로로벤젠) 을 들 수 있다. 원한다면, 계면 활성제, 유화제, 분산제, 침투제, 전착제, 중점제, 동결방지제, 고결방지제, 안정제등을 첨가하여 액제, 유제, 수화제, 건조 유동제, 유동제, 분제 또는 입제등과 같은 임의의 제형으로 제조할 수 있다.

<192> 또한, 경우에 따라, 본 발명의 화합물은 제제의 제조시 또는 살포시 다른 종류의 제초제, 각종 살충제, 진드기 살충제, 살선충제, 살균제, 식물성장조절제, 공력제, 비료, 토양개량제와 혼합할 수 있다.

<193> 특히, 본 발명의 화합물의 기타 농약과의 혼합 사용은 사용량의 감소에 의한 낮은 비용, 혼합 약제의 상승작용에의한 더 넓은 범위 및 더 높은 제초 효과 또는 식물 성장 조절 효과를 기대할 수 있다. 이런 경우, 본 발명의 화합물은 복수의 공지된 농약과 동시에 조합할 수 있다. 본 발명의 화합물과 혼합하여 사용할 수 있는 농약은 예컨대, (Farm Chemicals Handbook) 1994년판에 기재되어있는 화합물일 수 있다.

<194> 본 발명 화합물의 사용량은 적용 장소, 시용 시기, 시용 방법, 기상조건, 제제 형태, 토양조건, 재배작물등에 따라 다르다. 그러나, 통상적으로는 유효 성분의 양으로 0.000001 내지 10 Kg/ha , 바람직하게는 0.00001 내지 5 Kg/ha정도가 적당하다. 그러나, 본 발명의 화합물을 식물 종자의 발아 또는 초기 생육 촉진을 위해 사용하는 경우, 유효 성분 농도를 사용전에 0.01 내지 100 ppb의 수준으로 조정하는 것이 바람직하다.

<195> 이제, 본 발명 화합물의 배합예를 나타낼 것이다. 그러나, 본 발명은 이와 같은 구체적인 예들로 한정되지않는다. 하기의 배합예에서 "부" 는 중량부를 의미한다.

<196> [수화제]

본 발명의 화합물	0.1-80 부
고체담체	10-90 부
계면활성제	1-10 부
기타	1-5 부

<199> 기타의 것의 예로는 고결방지제를 들 수 있다.

[유제]

본 발명의 화합물	0.1-30 부
액체담체	30-95 부
계면활성제	5-15 부

[유동제]

본 발명의 화합물	0.1-70 부
액체담체	15-65 부
계면활성제	5-12 부
기타	5-30 부

<201> 기타의 것의 예로는 동결방지제 및 중점제를 들수 있다.

[입상 수화제(건조 유동제)]

본 발명의 화합물	0.1-90 부
고체담체	10-70 부
계면활성제	1-20 부

[입제]

본 발명의 화합물	0.0001-10 부
고체담체	90-99.9999 부
기타	0.1-10 부

[액제]

본 발명의 화합물	0.00001-30 부
액체담체	0.1-50 부
물	50-99.99 부
기타	0-10 부

[도포제]

본 발명의 화합물	1-50 부
액체담체	30-95 부
증점제	5-50 부

[수간주입제]

본 발명의 화합물	0.01-30 부
액체담체	70-99.99 부

[배합예 1] 수화제

본 발명의 화합물 번호 5	50 부
지크리트 PFP	43 부

(카올린계 점토, 지크리트 공업(주)상품명)

소르폴 5050	2 부

(음이온성 계면활성제, 토호화학공업(주)상품명)

루녹스 1000C	3 부

(음이온성 계면활성제, 토호화학공업(주)상품명)

카플렉스 #80 (고결방지제)	2 부

(백색 카본, 시오노기제약(주)상품명)

<206> 상기의 성분을 균일하게 분쇄 혼합하여 수화제를 제조한다.

[배합예 2] 유제

본 발명의 화합물 번호 24	3 부
크실렌	76 부
이소포론	15 부
소르폴 3005X	6 부
(비이온성 계면활성제 및 음이온성 계면활성제의 혼합물, 토호화학공업(주)상표명)	

<208> 상기의 성분을 균일하게 혼합하여 유제를 제조한다.

[배합예3] 유동제

본 발명의 화합물 번호 103	35 부
아그리졸 S-711	8 부

<210> (비이온성 계면활성제, 카오(주)상표명)

루녹스 1000C	0.5 부
(음이온성 계면활성제, 토호화학공업(주)상표명)	
1% 로도폴수 (水)	20 부
(증점제, 롱-뿔랑사상품명)	
에틸렌 글리콜 (동결 방지제)	8 부
물	28.5 부

<212> 상기의 성분을 균일하게 혼합하여 유동제를 제조한다.

<213> [배합예 4] 입상수화제 (건조유동제)

본 발명의 화합물 번호 111	75 부
이소반 번호 1	10 부
(음이온성 계면활성제, 쿠라라이 이소프렌화학(주)상품명)	
바닐렉스 N	5 부

<215> (음이온성 계면활성제, 산요-고꾸사꾸 펄프(주)상품명)

카플렉스 #80 10 부

<217> (백색 카본, 시오노기 제약(주)상품명)

<218> 상기의 성분을 균일하게 분쇄 혼합하여 건조 유동제를 제조한다.

<219> [배합예 5] 입제

본 발명의 화합물 번호 123 0.1 부

벤토나이트 50.0 부

탈크 44.9 부

톡사논 GR-31A 5 부

<221> (음이온성 계면활성제, 산요화학공업(주)상품명)

<222> 상기의 성분을 균일하게 혼합분쇄하고, 소량의 물을 가한후, 혼합물을 교반 혼합하여, 압출식 과립화 기계로 과립화시킨후, 건조시켜 과립을 수득한다.

<223> [배합예 6] 액제

본 발명의 화합물 번호 101 3 부

1-메톡시-2-프로판올 20 부

물 77 부

<225> 상기의 성분을 균일한 용액으로 하여 액제를 수득한다.

<226> [배합예 7] 액제

본 발명의 화합물 번호 103 0.0001 부

1-메톡시-2-프로판올 1.0 부

물 98.9999 부

<228> 상기의 성분을 균일한 용액으로 혼합하여 액제를 수득한다.

<229> [배합예 8] 도포제

본 발명의 화합물 번호 124 10 부

틱소겔 VP 10 부

<231> (닛산 가들라 촉매(주)상품명)

크실렌 80 부

<233> [배합예 9] 도포제

본 발명의 화합물 번호 119 15 부

틱소겔 VP 10 부

<235> (닛산 가들라 촉매(주)상품명)

하이졸 100 75 부

<237> (니세끼 화학(주)상품명)

<238> [배합예 10] 수간주입제

본 발명의 화합물 번호 114	6 부
이소프로판올	94 부

<240> [배합예 11] 수간주입제

본 발명의 화합물 번호 106	5 부
에탄올	95 부

<242> 상기수화제, 유제, 유동제 및 입상 수화제는 사용전 물로 50 내지 1,000 배 희석하고, 유효 성분의 양은 0.000001 내지 10 Kg/ha 의 양으로 사용한다.

<243> 이제, 제초제 및 식물 성장 조절제로서의 본 발명의 화합물의 유용성을 하기의 시험예를 참조로 하여 상세히 설명할것이다.

<244> [시험예 1] 침수조건에서의 잡초발생전처리에 의한 제초효과시험

<245> 1/5000 a의 와그너 포트에 충적토를 넣고, 물과 혼합하여 수심 4cm의 침수 상태를 만든다. 피, 애기부들, 물달개비 및 마디꽃의 종자, 일본 리본 와파토 및 다년생 플래트 세지의 괴경을 포트에 심는다. 이어서, 2 엽기의 벼 묘종을 포트에 이식한다. 포트를 25 내지 30℃ 온도의 온실에 두고, 식물을 육성한다. 파종 1 일후, 배합예에 따라 제조된 본 발명의 화합물을 소정량으로 수면에 처리한다. 처리 3 주후, 각종 잡초에 대한 제초 효과 및 벼에 대한 영향을 0은 효과가 없고, 5는 완전한 고사를 의미하는 5 등급의 기준에 따라 측정한다. 결과를 표5-1에 나타내었다. 표5-1중의 각각의 화합물번호는 실시예의 화합물 번호에 대응되며, 표5-1의 기호는 하기의 의미를 찾는다.

<246> A : 피, B : 애기부들, C : 물달개비, D : 마디꽃, E : 일본 리본 와파토, F : 다년생 플래트 세지, a : 벼.

<247> [시험예 2] 침수조건에서의 잡초발생후 처리에의한 제초효과 시험

<248> 1/5000 a의 와그너 포트에 충적토를 넣고, 물과 혼합하여 수심 4cm의 침수 상태를 만든다. 상기의 각각의 포트에 피, 애기부들, 물달개비 및 마디꽃의 종자를 파종하고, 포트를 25 내지 30℃ 온도의 온실에 두고, 식물을 육성한다. 파종 14일후, 배합예에 따라 조제된 본 발명의 화합물을 소정량으로 수면에 처리한다. 처리 3주후, 각종 잡초에 대한 제초 효과를 조사하여 0 은 효과가 없고, 5 는 완전한 고사를 의미하는 5등급의 기준으로 측정한다. 결과를 표5-2에 나타내었다. 표5-2의 각각의 화합물 번호는 실시예 화합물 번호에 대응되며, 표5-2의 기호는 하기의 의미를 갖는다.

<249> A : 피, B : 애기부들, C : 물달개비, D : 마디꽃.

<250> [시험예 3] 토양처리에서의 제초효과 시험

<251> 가로 33cm,세로 33 cm 및 높이 8 cm의 플라스틱 박스에 홍적토를 채우고, 피, 강아지풀, 메귀러, 블랙그래스, 벨비트리프, 커먼 코클버, 털비름, 나팔꽃, 큰개불알풀, 별꽃, 벼, 옥수수, 소맥, 대두, 면화 및 사탕 무우의 종자를 파종하고 이위에 약 1.5 cm 두께로 흙을 덮은후, 배합예에 따라 제조한 본 발명의 화합물을 소정량으로 토양의 표면에 균일하게 산포한다. 처리 3주후, 각각의 잡초에 대한 제초효과 및 작물에 대한 영향을 조사하여 0 은 효과가 없고, 5 는 완전한 고사를 의미하는 5 등급을 기준으로 하여 측정한다. 그 결과를 표 5-3에 나타낸다.

<252> 표5-3의 각각의 화합물 번호는 실시예의 화합물의 번호에 대응하고, 표 5-3 의 기호는 하기의 의미를 갖는다.

<253> G : 피, H : 강아지풀, I : 메귀리, J : 블랙그래스, K : 벨비트리프, L : 커먼 코클버, M : 털비름, N : 과꽃, O : 큰개불알풀, P : 별꽃, a : 벼, b : 옥수수, c : 소맥, d : 대두, e : 면화, f : 사탕무우.

<254> [시험예 4] 경영처리에서의 제초효과 시험

<255> 가로 33cm, 세로 33 cm 및 높이 8 cm의 플라스틱 박스에 살균된 홍적토를 채우고, 피, 강아지풀, 메귀리, 블랙그래프, 벨비트리프, 커먼 코클버, 털비름, 나팔꽃, 큰개불알꽃, 별꽃, 벼, 옥수수, 소맥, 대두, 면화 및 사탕무우의 종자를 파종하고 이위에 약1.5 cm 두께로 흙을 덮는다. 박스를 25 내지 30℃의 온실내에 두고 14일간 식물을 육성하고, 배합예에 따라 제조한 본 발명의 화합물을 소정량으로 경엽에 균일하게 산포한다. 처리 3주후, 각각의 잡초에 대한 제초효과 및 각각의 작물에 대한 영향을 0 은 효과가 없고, 5 는 완전한 고사를 의미하는 5 등급을 기준으로하여 측정한다. 이 결과를 표5-4에 나타내었다.

<256> 표 5-4의 각각의 화합물 번호은 실시예의 화합물의 번호에 대응하고, 표 5-4 의 기호는 하기의 의미를 갖는다.

<257> G : 피, H : 강아지풀, I : 메귀리, J : 블랙그래스, K : 벨비트리프, L : 커먼 코클버, M : 털비름, N : 나팔꽃, O : 큰개불알꽃, P : 별꽃, a : 벼, b : 옥수수, c : 소맥, d : 대두, e : 면화, f : 사탕무우.

<258> [시험예 5] 경엽처리에서의 왜소화 효과시험

<259> 내직경 12 cm 및 높이 11 cm의 플라스틱 포트에 살균된 홍적토를 채우고, 벼, 소맥, 버뮤다그래스 또는 벤트그래스의 종자를 각각의 포트에 파종한후, 약1 cm 두께로 흙으로 덮는다. 포트를 25 내지 30℃의 온실에 두고 식물을 육성한다. 각각의 식물이 1 또는 2 엽기로 자랐을 때, 배합예에 따라 제조한 본 발명의 화합물을 소정량의 유효성분으로 경엽부전면에 균일하게 산포한다. 처리 2주후, 각각의 잡초에 대한 왜소화 효과를 식물의 길이 및 식물의 명령을 측정하여 조사한다. 결과를 표 5-5에 나타내었다. 표 5-5의 각각의 화합물 번호는 실시예의 화합물의 번호에 대응하며, 표 5-5의 기호는 하기의 의미를 갖는다.

<260> A : 벼, B : 소맥, C : 버뮤다그래스, D : 벤트그래스

<261> [시험예 6] 침수조건에서의 왜소화 효과시험

<262> 1/10000 a의 플라스틱 포트에 충적토를 채우고, 물을 혼합하여 수심 4 cm의 침수 상태를 만든다. 육종 박스에서 기른 약 2 엽기의 벼 묘종을 포트에 이식하고, 포트를 25 내지 30℃의 온실에 두고 벼를 육성한다. 벼가 약 3.5 엽기가 되었을때, 배합예에 따라 제조한 본 발명의 화합물을 소정량으로 수면엔 처리한다. 처리 2주후, 벼에 대한 왜소화 효과를 식물의 길이 및 명령을 측정하여 조사한다. 결과를 표 5-6에 나타내었다. 표 5-6의 각각의 화합물 번호는 실시예의 화합물의 번호에 대응하며, 표5-6의 기호는 하기의 의미를 갖는다.

<263> E : 벼

<264> [시험예 7] 경업처리에서의 왜소화 효과시험

<265> 내경 12 cm 및 높이 11 cm의 플라스틱 포트를 살균된 홍적토로 채우고, 버뮤다그래스, 벤트그래스, 대두, 면화 또는 소맥의 종자를 각각의 포트에 파종하고 흙으로 약1 cm 두께로 덮는다. 포트를 25 내지 30℃의 온실에두고 식물을 육성한다. 각각의 식물이 1 또는 2 엽기로 자랐을때, 유효 성분이 경영에 소정량으로 산포되도록 산포한다. 산포액은 배합예에 따라 본 발명의 화합물을 배합 제조하여, 소형분무기로 각각의 식물의 경엽 전표면에 살포한다. 처리 2주후, 각각의 식물에 대한 왜소화 효과를 식물의 길이 및 엽령을 측정하여 조사한다. 결과를 표 5-7 에 나타내었다.

<266> 표 5-7의 각각의 번호는 실시예의 화합물의 번호에 대응하고, 표 5-7 의 기호는 하기의 의미를 갖는다.

<267> A : 버뮤다그래스, B : 벤트그래스, C : 대두, D : 면화, E : 소맥.

<268> [시험예 8] 경영처리에서의 왜소화 효과시험

<269> 내경 12 cm 및 높이 11 cm의 플라스틱 포트를 살균된 홍적토로 채우고, 버뮤다그래스, 벤트그래스, 대두, 면화, 소맥 또는 벼의 종자를 각각의 포트에 파종하고, 흙으로 약 1 cm 두께로 덮는다. 포트를 25 내지 30℃ 의 온실에두고 식물을 육성한다. 각각의 식물이 1 또는 2 엽기로 자랐을때, 유효 성분이 경엽에 소정량으로 산포되도록 균일하게 산포한다. 산포액은 배합예에 따라 본발명의 화합물을 배합 제조하여, 소형분무기로 각각의 식물의 경영 전표면에 산포한다. 처리 2주후, 각각의 식물에 대한 왜소화 효과를 식물의 길이 및 명령을 측정하여 조사한다. 결과를 표 5-8에 나타내었다.

<270> 표 5-8의 각각의 번호는 실시예의 화합물의 번호에 대응하고, 표 5-8 의 기호는 하기의 의미를 갖는다.

<271> A : 버뮤다그래스, B : 벤트그래스, C : 대두, D : 면화, E : 소맥, F : 벼.

표 5 - 1

침수조건에서의 잡초발생전처리에 의한 제초효과시험

번호	약량 (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

번호	약량 (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

표 5 - 2

침수조건에서의 잡초발생후처리에 의한 제초효과시험

번호	약량 (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	14.3	4	2	3	3
12	10	2	—	—	—
13	10	4	2	—	5
14	10	2	1	4	4
15	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

번호	약량 (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

표 5 - 3

토양처리에 의한 제초 효과시험

번호	약량 (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

번호	약량 (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
115	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

표 5 - 4

경엽처리에 의한 제초 효과시험

번호	약량 (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

번호	약량 (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

<280> 표 5 - 5 경영처리에서의 왜소화 효과시험

화합물 번호	약량 (g/a)	초장(cm)				엽령(엽기)			
		A	B	C	D	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
비처리 구역	-	36	30	17	15	5.5	4.6	5.5	3.5

<282> 표 5 - 6 침수조건에서의 왜소화 효과시험

화합물 번호	약량 (g/a)	초장(cm) E	엽령(엽기) E
1	0.01	51	5.7
	0.1	51	5.8
	1	47	5.6
	10	37	5.5
비처리구역	-	53	5.5

<284> 표 5 - 7 경엽처리에서의 왜소화 효과시험

화합물 번호	약량 (g/a)	초장(cm)					엽령(엽기)				
		A	B	C	D	E	A	B	C	D	E
	1.6	14	4.5	41	22	24	5.5	3.5	4.5	2.1	5.0
101	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
비처리 구역	-	22	14	33	18	23	5.5	3.5	4.5	2.0	5.0

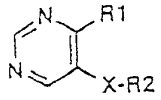
<286> 표 5- 8 경영처리에서의 왜소화 효과시험

화합물 번호	약량 (g/a)	초장(cm)						엽령(엽기)					
		A	B	C	D	E	F	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
비처리 구역	-	14	15	26	12	26	34	6.0	5.0	3.2	1.8	5.3	4.8

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기식(I)의 신규의 피리미딘 유도체 ;



(I)

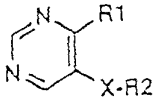
[식 중, R1 는 C_1-C_6 할로알킬기, C_1-C_6 알킬기, C_3-C $_6$ 시클로알킬기, C_3-C_6 할로시클로알킬기 또는 임의로 치환된 페닐기 (단, 치환기는 할로겐원자, C_1-C_4 알킬기, C_1-C_4 알콕시기, C_1-C_3 할로알킬기 및 C_1-C $_3$ 할로알콕시기로 구성된 군으로부터 선택한다.) 이고,

R2 는 수소 원자, C_1-C_6 알킬기, C_3-C_6 시클로알킬기, C_3 -C_6 시클로알킬 (C_1-C_4)알킬기, C_1-C_6 할로알킬기, C_3-C_6 할로시클로알킬기, C_3-C_8 알케닐기, C_3-C_8 알키닐기, C_1-C_2 술포닐(C_1-C_4)알킬기, C_1-C_4 알킬티오(C_3-C_6)시클로알킬기 또는 임의로 치환된 페닐기 (단, 치환기는 할로겐원자, C_1-C_4 알킬기, C_1-C_4 알콕시기, C_1-C_3 할로알킬기 및 C_1-C_3 할로알콕시기로 구성된 군으로 부터 선택한다.) 이며,

X 는 카르보닐기(X 가 카르보닐기인 경우, R1 및 R2 가 동시에 메틸기, iso-프로필기 또는 페닐기인 경우를 제외함), 또는 -C(R3)OH (단, R3 은 수소원자. C_1-C_6 알킬기, C_3-C_8 알케닐기, C_3-C_8 알키닐기 또는 임의로 치환된 페닐기이다 (단, 치환기는 할로겐 원자, C_1-C_4 알킬기, C_1-C_4 알콕시기, C_1 -C_3 할로알킬기 및 C_1-C_3 할로알콕시기로 구성된 군으로부터 선택한다.) (탄소 원자가 광학 활성 탄소 원자인 경우, 라세메이트 및 단리된 2종의 광학 이성질체의 쌍방을 포함한다.)].

청구항 2

하기식 (I)의 피리미딘 유도체를 함유하는 제초제:



(I)

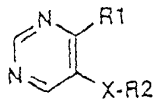
[식 중, R1 는 C_1-C_6 할로알킬기, C_1-C_6 알킬기, C_3-C $_6$ 시클로알킬기, C_3-C_6 할로시클로알킬기 또는 임의로 치환된 페닐기 (단, 치환기는 할로겐원자, C_1-C_4 알킬기, C_1-C_4 알콕시기, C_1-C_3 할로알킬기 및 C_1-C $_3$ 할로알콕시기로 구성된 군으로부터 선택한다.) 이고,

R2 는 수소 원자, C_1-C_6 알킬기, C_3-C_6 시클로알킬기, C_3 -C_6 시클로알킬 (C_1-C_4)알킬기, C_1-C_6 할로알킬기, C_3-C_6 할로시클로알킬기, C_3-C_8 알케닐기, C_3-C_8 알키닐기, C_1-C_2 술포닐(C_1-C_4)알킬기, C_1-C_4 알킬티오(C_3-C_6)시클로알킬기 또는 임의로 치환된 페닐기 (단, 치환기는 할로겐원자, C_1-C_4 알킬기, C_1-C_4 알콕시기, C_1-C_3 할로알킬기 및 C_1-C_3 할로알콕시기로 구성된 군으로 부터 선택한다.) 이며,

X 는 카르보닐기 또는 -C(R3)OH (단, R3 은 수소원자, C_1-C_6 알킬기, C_3-C_8 알케닐기, C_3-C_8 알키닐기 또는 임의로 치환된 페닐기이다 (단, 치환기는 할로겐 원자, C_1-C_4 알킬기, C_1-C_4 알콕시기, C_1-C_3 할로알킬기 및 C_1-C_3 할로알콕시기로 구성된 군으로부터 선택한다.) (탄소 원자가 광학 활성 탄소 원자인 경우, 라세메이트 및 단리된 2종의 광학 이성질체의 쌍방을 포함한다.)].

청구항 3

하기식 (I)의 피리미딘 유도체를 함유하는 식물 성장 조절제.



(I)

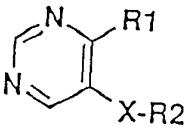
[식 중, R1 는 C_1-C_6 할로알킬기, C_1-C_6 알킬기, C_3-C_6 시클로알킬기, C_3-C_6 할로시클로알킬기 또는 임의로 치환된 페닐기 (단, 치환기는 할로겐원자, C_1-C_4 알킬기, C_1-C_4 알콕시기, C_1-C_3 할로알킬기 및 C_1-C_3 할로알콕시기로 구성된 군으로부터 선택한다.) 이고,

R2 는 수소 원자, C_1-C_6 알킬기, C_3-C_6 시클로알킬기, C_3-C_6 시클로알킬 (C_1-C_4)알킬기, C_1-C_6 할로알킬기, C_3-C_6 할로시클로알킬기, C_3-C_8 알케닐기, C_3-C_8 알키닐기, C_1-C_2 술포닐(C_1-C_4)알킬기, C_1-C_4 알킬티오(C_3-C_6)시클로알킬기 또는 임의로 치환된 페닐기 (단, 치환기는 할로겐원자, C_1-C_4 알킬기, C_1-C_4 알콕시기, C_1-C_3 할로알킬기 및 C_1-C_3 할로알콕시기로 구성된 군으로부터 선택한다.) 이며,

X 는 카르보닐기 또는 -C(R3)OH (단, R3 은 수소원자, C_1-C_6 알킬기, C_3-C_8 알케닐기, C_3-C_8 알키닐기 또는 임의로 치환된 페닐기이다 (단, 치환기는 할로겐 원자, C_1-C_4 알킬기, C_1-C_4 알콕시기, C_1-C_3 할로알킬기 및 C_1-C_3 할로알콕시기로 구성된 군으르부터 선택한다.) (탄소 원자가 광학 활성 탄소 원자인 경우, 라세메이트 및 단리된 2종의 광학 이성질체의 쌍방을 포함한다.)].

요약

하기식 (I) 의 신규한 피리미딘 유도체 :



(I)

(식중, R1는 C_1-C_6 할로알킬기, C_1-C_6 알킬기, C_3-C_6 시클로알킬기등 이고, R2는 수소원자, C_1-C_6 알킬기, C_3-C_6 시클로알킬기등이며, X 는 카르보닐기 또는 -C(R3)OH (식중, R3 은 수소원자, C_1-C_6 알킬기등이다.) 이다.).