(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2011년03월09일
(11) 등록번호 10-1020522
(24) 등록일자 2011년03월02일

(51) Int. Cl.
C07C 235/38 (2006.01) *C07C 259/06* (2006.01)
C07C 243/22 (2006.01) *A01N 37/28* (2006.01)
(21) 출원번호 10-2005-7006167
(22) 출원일자(국제출원일자) 2003년10월09일
심사청구일자 2008년10월08일
(85) 번역문제출일자 2005년04월08일
(65) 공개번호 10-2005-0062609
(43) 공개일자 2005년06월23일
(86) 국제출원번호 PCT/EP2003/011218
(87) 국제공개번호 WO 2004/033413
국제공개일자 2004년04월22일
(30) 우선권주장
0223665.1 2002년10월10일 영국(GB)
(56) 선행기술조사문헌
JP03005451 A
JP03106856 A
전체 청구항 수 : 총 11 항

(73) 특허권자
신젠타 파티서페이션즈 아게
스위스 4058 바젤 슈바르츠발달레 215
(72) 발명자
람베르트 클레멘스
스위스 체하-4058 바젤 슈바르츠발트알레 215
첼러 마르틴
스위스 체하-4333 뮌히빌렌 브라이텐로흐 5
(74) 대리인
이범래, 장훈

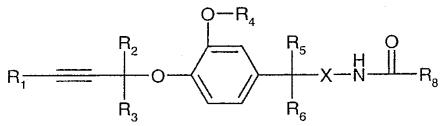
심사관 : 이지민

(54) 식물병원성 미생물을 억제하기 위한 신규 프로파길에테르 유도체

(57) 요 약

본 발명은 화학식 I의 4-프로파길옥시-벤질 유도체, 이의 광학 이성체 및 당해 이성체들의 혼합물에 관한 것이다.

화학식 I



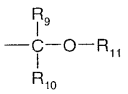
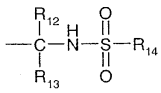
위의 화학식 I에서,

R_1은 수소, 임의로 치환된 알킬, 임의로 치환된 사이클로알킬 또는 임의로 치환된 아릴이고,

R_2, R_3, R_5, R_6 및 R_7은 각각 서로 독립적으로 수소 또는 임의로 치환된 알킬이고,

R_4는 임의로 치환된 알킬이고,

X는 O 또는 N-R_7이고,

R_8은 그룹  또는  (여기서, R_9는 임의로 치환된 아릴 또는 임의로 치환된 헤테로아릴이고, R_{10} 및 R_{11}은 각각 독립적으로 수소, 임의로 치환된 알킬, 임의로 치환된 알케닐 또는 임의로 치환된 알키닐이고, R_{12}는 임의로 치환된 알킬, 임의로 치환된 사이클로알킬, 임의로 치환된 아릴 또는 임의로 치환된 헤테로아릴이고, R_{13}은 수소 또는 임의로 치환된 알킬, 알케닐 또는 알키닐이고, R_{14}는 임의로 치환된 알킬 또는 임의로 치환된 아미노이다)이다.

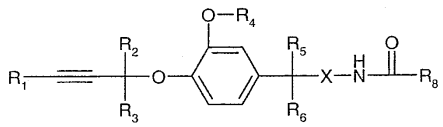
이들 화합물은 유용한 식물 보호 특성을 지니고 있으며, 식물병원성 미생물, 특히 진균류에 의한 식물의 감염을 억제 또는 예방하기 위한 실제적인 농업 분야에 유리하게 이용될 수 있다.

특허청구의 범위

청구항 1

화학식 I의 화합물, 이의 광학 이성체 또는 당해 이성체들의 혼합물.

화학식 I



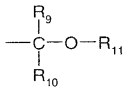
위의 화학식 I에서,

R_1은 수소, C_1-C_8-알킬 또는 페닐이고, 여기서, 페닐은 치환되지 않거나 C_1-C_8-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, C_1-C_8-할로알킬, C_1-C_8-알콕시, C_1-C_8-할로알콕시, C_1-C_8-알킬티오, C_1-C_8-할로알킬티오, C_1-C_8-알킬설포닐, 할로겐, 시아노 및 니트로를 포함하는 그룹으로부터 선택된 1 내지 3개의 치환체에 의해 치환되고,

R_2, R_3, R_5 및 R_6은 각각 서로 독립적으로 수소 또는 C_1-C_6-알킬이고,

R_4는 C_1-C_6-알킬이고,

X는 O이고,

R_8은 그룹  이고, 여기서, R_9는 치환되지 않거나 C_1-C_8-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, C_1-C_8-할로알킬, C_1-C_8-알콕시, C_1-C_8-할로알콕시, C_1-C_8-알킬티오, C_1-C_8-할로알킬티오, C_1-C_8-알킬설포닐, 할로겐, 시아노, 니트로 및 C_1-C_8-알콕시카보닐을 포함하는 그룹으로부터 선택된 1 내지 3개의 치환체에 의해 각각 치환된 페닐, 1,3-바이페닐 또는 1,4-바이페닐이고, R_{10}은 수소 또는 C_1-C_8-알킬이고, R_{11}은 수소, C_1-C_8-알킬, C_1-C_8-할로알킬, C_3-C_8-알케닐 또는 C_3-C_8-알키닐이다.

청구항 2

제1항에 있어서, R_{11}이 C_3-C_8-알키닐인 화합물.

청구항 3

제1항에 있어서, R_1이 수소 또는 C_1-C_6-알킬이고, R_2, R_3, R_5 및 R_6이 수소이고, R_4가 메틸이고, R_9가 치환되지 않거나 C_1-C_6-알킬, C_1-C_6-할로알킬, C_1-C_6-알콕시, C_1-C_6-할로알콕시, C_1-C_6-알킬티오, C_1-C_6-할로알킬티오, 할로겐, 시아노, 니트로 및 C_1-C_6-알콕시카보닐로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 3개의 치환체에 의해 치환된 페닐이고, R_{10}이 수소이고, R_{11}이 수소 또는 C_2-C_6-알키닐인 화합물.

청구항 4

제1항에 있어서,

N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-페닐-2-프로프-2-이닐옥시-아세트아미드,

N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-페닐-2-프로프-2-이닐옥시-아세트아미드,

2-(4-클로로-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드,

2-(4-클로로-페닐)-N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-프로프-2-이닐옥시-아세트아미드,

2-(4-클로로-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드,

2-(4-클로로-페닐)-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-프로프-2-이닐옥시-아세트아미드,

2-(4-브로모-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드,

2-(4-브로모-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드 및

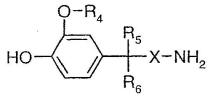
2-(3,4-디클로로-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드를 포함하는 그룹으로부터 선택되는 화합물.

청구항 5

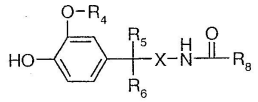
화학식 II의 산 또는 화학식 II의 산의 카복시-활성화 유도체를 화학식 III의 아민과 반응시켜 화학식 IV의 중간체 페놀을 수득하고, 상기 화학식 IV의 중간체 페놀을 화학식 V의 화합물과 반응시켜 제1항에 따르는 화학식 I의 화합물을 수득함을 포함하는, 제1항에 따르는 화학식 I의 화합물의 제조방법.

화학식 II

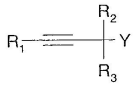
화학식 III



화학식 IV



화학식 V



위의 화학식 II 내지 V에서,

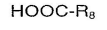
R_1, R_2, R_3, R_4, R_5, R_6, R_8 및 X는 화학식 I에 대해 정의한 바와 같고,

Y는 할라이드 및 설폰산 에스테르로부터 선택되는 이탈 그룹이다.

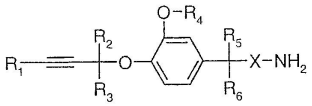
청구항 6

화학식 VI의 화합물을 화학식 II의 산 또는 화학식 II의 산의 카복시-활성화 유도체와 반응시켜 제1항에 따르는 화학식 I의 화합물을 수득함을 포함하는, 제1항에 따르는 화학식 I의 화합물의 제조방법.

화학식 II



화학식 VI



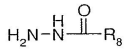
위의 화학식 II 및 VI에서,

R_1, R_2, R_3, R_4, R_5, R_6, R_8 및 X는 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다.

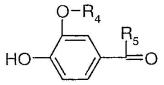
청구항 7

화학식 VIII의 화합물을 화학식 VII의 산 하이드라지드와 반응시키고, 화학식 IX의 중간체 아실하이드라존을 수소화시켜 화학식 IVa의 화합물을 수득함을 포함하는, 제1항에 따르는 화학식 I의 화합물의 제조방법.

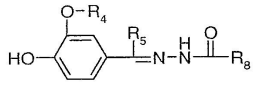
화학식 VII



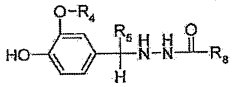
화학식 VIII



화학식 IX



화학식 IVa



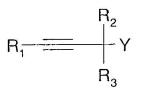
위의 화학식 VII, VIII, IX 및 IVa에서,

R_4, R_5 및 R_8은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다.

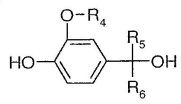
청구항 8

화학식 X의 페놀을 화학식 V의 화합물과 반응시켜 화학식 XI의 중간체 알콜을 수득하고, 상기 화학식 XI의 중간체 알콜을 화학식 XII의 화합물로 변환시키고, 화학식 XII의 화합물을 화학식 XIII의 화합물과 반응시켜 화학식 XIV의 N-알콕시이미드를 수득하고, 화학식 XIV의 N-알콕시이미드를 메틸아민 및 부틸아민으로 이루어진 그룹으로부터 선택되는 아민 유도체, 또는 하이드라진, 하이드라진 수화물 및 메틸하이드라진으로 이루어진 그룹으로부터 선택되는 하이드라진 유도체와 반응시켜 화학식 VIa의 화합물을 수득함을 포함하는, 제1항에 따르는 화학식 I의 화합물의 제조방법.

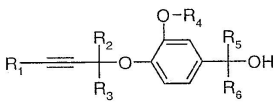
화학식 V



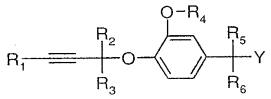
화학식 X



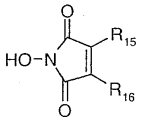
화학식 XI



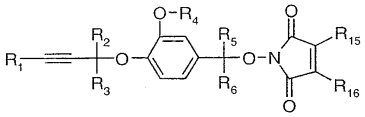
화학식 XII



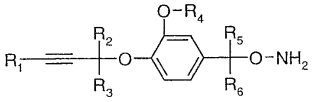
화학식 XIII



화학식 XIV



화학식 VIa



위의 화학식 V, X, XI, XII, XIII, XIV 및 VIa에서,

R_1, R_2, R_3, R_4, R_5 및 R_6은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같고,

R_{15} 및 R_{16}은 수소, 할로겐, 메틸 또는 어닐링된 벤젠 환의 부분이고,

Y는 할라이드 및 설폰산 에스테르로부터 선택되는 이탈 그룹이다.

청구항 9

활성 성분으로서의 제1항에 따르는 화학식 I의 화합물을 담체와 함께 포함하는, 식물병원성 미생물을 억제하고 당해 미생물로부터 보호하기 위한 조성물.

청구항 10

삭제

청구항 11

활성 성분으로서의 제1항에 따르는 화학식 I의 화합물 또는 제9항에 따르는 조성물을 식물, 식물의 일부분 또는 이의 서식지에 적용함을 포함하여, 식물병원성 미생물에 의한 농작물의 감염(infestation)을 억제하거나 예방하는 방법.

청구항 12

제11항에 있어서, 식물병원성 미생물이 진균류 유기체인 방법.

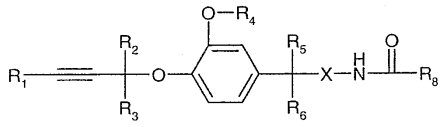
명 세 서

[0001] 본 발명은 화학식 I의 신규한 프로파길에테르 유도체에 관한 것이다. 본 발명은 당해 물질의 제조방법 및 하나 이상의 당해 화합물을 활성 성분으로서 포함하는 농약 조성물에 관한 것이다. 본 발명은 또한 당해 조성물의 제조방법, 및 식물병원성 미생물, 특히 진균류에 의한 식물의 감염(infestation)을 억제 또는 예방하기 위한 당해 화합물 또는 조성물의 용도에 관한 것이다.

[0002] 특정한 아미노산 카바메이트, 만델산 유도체 및 알콕스이미노산 유도체는 식물 파괴 진균류를 억제하기 위해 제안되어 왔다(예를 들면, 유럽 공개특허공보 제398072호, 국제 공개공보 제WO 94/29267호 및 제WO 96/17840호). 그러나, 이러한 제제들의 작용은 모든 농업 요건 면에서 만족스럽지 않았다. 놀랍게도, 화학식 I의 화합물 구조에 의해, 높은 수준의 활성을 갖는 새로운 종류의 살미생물제가 밝혀져 왔다.

[0003] 본 발명은 화학식 I의 프로파길에테르 유도체, 이의 광학 이성체 및 당해 이성체들의 혼합물에 관한 것이다.

화학식 I

[0004] 

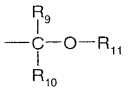
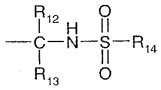
[0005] 위의 화학식 I에서,

[0006] R_1은 수소, 임의로 치환된 알킬, 임의로 치환된 사이클로알킬 또는 임의로 치환된 아릴이고,

[0007] R_2, R_3, R_5, R_6 및 R_7은 각각 서로 독립적으로 수소 또는 임의로 치환된 알킬이고,

[0008] R_4는 임의로 치환된 알킬이고,

[0009] X는 O 또는 N-R_7이고,

[0010] R_8은 그룹  또는  (여기서, R_9는 임의로 치환된 아릴 또는 임의로 치환된 헤테로아릴이고, R_{10} 및 R_{11}은 각각 독립적으로 수소, 임의로 치환된 알킬, 임의로 치환된 알케닐 또는 임의로 치환된 알키닐이고, R_{12}는 임의로 치환된 알킬, 임의로 치환된 사이클로알킬, 임의로 치환된 아릴 또는 임의로 치환된 헤테로아릴이고, R_{13}은 수소 또는 임의로 치환된 알킬, 알케닐 또는 알키닐이고, R_{14}는 임의로 치환된 알킬 또는 임의로 치환된 아미노이다)이다.

[0011] 위의 정의에서, 아릴은 페닐, 나프틸, 안트라세닐, 펜안트레닐 등의 방향족 탄화수소 환을 포함하며, 페닐이 바람직하다.

[0012] 헤테로아릴은 하나 이상의 산소, 질소 또는 황 원자가 환 구성원으로서 존재하는 모노-, 바이- 또는 트리사이클릭 시스템을 포함하는 방향족 환 시스템이다. 전형적으로, 헤테로아릴은 질소, 산소 및 황으로부터 선택된 1 내지 4개의 동일하거나 상이한 헤테로원자를 포함하며, 산소 및 황 원자의 수는 통상 1을 초과하지 않는다. 예로는, 푸릴, 티에닐, 피롤릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 이소티아졸릴, 옥사졸릴, 이소옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 티아디아졸릴, 트리아졸릴, 테트라졸릴, 피리딜, 피리다지닐, 피리미디닐, 피라지닐, 트리아지닐, 테트라지닐, 인돌릴, 벤조티오페닐, 벤조푸라닐, 벤즈이미다졸릴, 인다졸릴, 벤조트리아졸릴, 벤조티아졸릴, 벤조옥사졸릴, 퀴놀리닐, 이소퀴놀리닐, 프탈라지닐, 퀴노옥살리닐, 퀴나졸리닐, 신놀리닐 및 나프티리디닐이다.

[0013] 위의 아릴 및 헤테로아릴 그룹은 하나 이상의 동일하거나 상이한 치환체를 포함할 수 있다. 통상, 3개 이하의 치환체가 동시에 존재한다. 아릴 또는 헤테로아릴 그룹의 치환체의 예로는 알킬, 알케닐, 알키닐, 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 페닐 및 페닐알킬이며, 선행 그룹 모두는 하나 이상의 동일하거나 상이한 할로겐 원자: 알콕시; 알케닐옥시; 알키닐옥시; 알콕시알킬; 할로알콕시, 알킬티오; 할로알킬티오; 알킬설포닐; 포밀; 알카노일; 하이드록시; 할로겐; 시아노; 니트로; 아미노; 알킬아미노; 디알킬아미노; 카복실; 알콕시카보닐; 알케닐옥시카보닐; 또는 알키닐옥시카보닐을 수반할 수 있다.

[0014] 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 알키닐 또는 사이클로알킬 그룹은 할로겐, 알킬, 알콕시, 알킬티오, 니트로, 시아노, 하이드록시, 머캅토, 알킬카보닐 또는 알콕시카보닐로부터 선택된 하나 이상의 치환체를 수반할 수 있다. 바람직하게는, 치환체의 수는 할로겐을 제외한 3개 미만이며, 알킬 그룹은 과할로겐화될 수 있다. 상기 정의에서, "할로겐" 또는 접두어 "할로"에는 불소, 염소, 브롬 및 요오드가 포함된다.

[0015] 알킬, 알케닐 및 알키닐 라디칼은 직쇄 또는 측쇄일 수 있다. 이는 또한, 기타 알킬-, 알케닐- 또는 알키닐-함

유 그룹의 알킬, 알케닐 또는 알키닐 부분에도 적용된다.

[0016] 언급된 탄소 원자의 수에 따라서, 알킬 그 자체 또는 또 다른 치환체의 일부로서의 알킬은, 예를 들면, 메틸, 에틸, 프로필, 부틸, 펜틸, 헥실, 헵틸, 옥틸, 노닐, 데실, 운데실, 도데실 및 이들의 이성체, 예를 들면, 이소프로필, 이소부틸, 3급 부틸 또는 2급 부틸, 이소펜틸 또는 3급 펜틸인 것으로 인지되어야 한다.

[0017] 사이클로알킬은, 언급된 탄소 원자의 수에 따라, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로헵틸 또는 사이클로옥틸이다.

[0018] 언급된 탄소 원자의 수에 따라, 알케닐은 특정 그룹으로서 또는 기타 그룹의 구조적 원소로서, 예를 들면, 에테닐, 알릴, 1-프로페닐, 부텐-2-일, 부텐-3-일, 펜텐-1-일, 펜텐-3-일, 헥센-1-일, 4-메틸-3-펜테닐 또는 4-메틸-3-헥세닐인 것으로 인지되어야 한다.

[0019] 기타 그룹의 구조적 구성원으로서 또는 하나의 그룹으로서의 알키닐은, 예를 들면, 에티닐, 프로핀-1-일 ($-CH_2-C\equiv CH$), 프로프-2-이닐 ($-C(CH_3)\equiv CH$), 부틴-1-일 ($-CH_2-CH_2-C\equiv CH$), 부틴-2-일 ($-CH_2-C\equiv C-CH_3$), 1-메틸-2-부티닐 ($-CH(CH_3)-C\equiv C-CH_3$), 헥신-1-일 ($-[CH_2]_4-C\equiv CH$), 1-에틸-2-부티닐 ($-CH(CH_2-CH_3)-C\equiv C-CH_3$) 또는 옥틴-1-일이다.

[0020] 할로알킬 그룹은 하나 이상의 (동일하거나 상이한) 할로겐 원자를 함유할 수 있으며, 예를 들면, CH_2Cl, $CHCl_2$, CCl_3, CH_2F, CHF_2, CF_3, CH_2CH_2Br, C_2Cl_5, C_2F_5, CH_2Br, $CHClBr$, CF_3CH_2 등을 나타낼 수 있다.

[0021] 화학식 I의 화합물 내에 하나 이상의 비대칭 탄소 원자가 존재한다는 것은 해당 화합물이 광학 이성체성 형태 및 에난티오머성 형태로 존재할 수 있음을 의미한다. 가능한 지방족 C=C 이중 결합의 존재로 인해, 기하 이성체가 존재할 수도 있다. 화학식 I은 가능한 모든 이성체성 형태 및 이의 혼합물을 포괄한다.

[0022] 화학식 I의 화합물의 바람직한 아그룹은

[0023] R_1이 수소, 알킬, 사이클로알킬, 페닐 또는 나프틸(여기서, 페닐 및 나프틸은 알킬, 알케닐, 알키닐, 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 페닐 및 페닐알킬을 포함하는 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 임의로 치환될 수 있으며, 이들 모든 그룹은 하나 또는 수 개의 할로겐; 알콕시, 알케닐옥시, 알키닐옥시; 알콕시알킬; 할로알콕시; 알킬티오; 할로알킬티오; 알킬설포닐; 포밀; 알카노일; 하이드록시; 할로겐; 시아노; 니트로; 아미노; 알킬아미노; 디알킬아미노; 카복시; 알콕시카보닐; 알케닐옥시카보닐 또는 알키닐옥시카보닐에 의해 치환될 수 있다)이거나,

[0024] R_1이 수소, C_1-C_8-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬, 페닐 또는 나프틸(여기서, 페닐 및 나프틸은 C_1-C_8-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, C_1-C_8-할로알킬, C_1-C_8-알콕시, C_1-C_8-할로알콕시, C_1-C_8-알킬티오, C_1-C_8-할로알킬티오, C_1-C_8-알킬설포닐, 할로겐, 시아노 및 니트로를 포함하는 그룹으로부터 선택된 1 내지 3개의 치환체에 의해 임의로 치환될 수 있다)이거나,

[0025] R_1이 수소, C_1-C_6-알킬 또는 C_3-C_6-사이클로알킬이거나,

[0026] R_2 및 R_3이 수소 또는 C_1-C_6-알킬이거나,

[0027] R_2 및 R_3이 수소이거나,

[0028] R_4가 C_1-C_6-알킬이거나,

[0029] R_5 및 R_6이 수소 또는 C_1-C_6-알킬이거나,

[0030] R_5 및 R_6이 수소이고,

[0031] X가 산소, 또는 질소이고, 이때, 질소는 수소 또는 C_1-C_8-알킬에 의해 임의로 치환되거나,

[0032] R_8이 $C(R_9R_{10})$-OR_{11}이고,

[0033] R_9가 알킬, 알케닐, 알키닐, 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 페닐 및 페닐알킬을 포함하는 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 각각 임의로 치환된 아릴 또는 헤테로아릴이고, 이들 모든 그룹은 하나 또는 수 개의 할로겐;

알콕시, 알케닐옥시, 알키닐옥시; 알콕시알킬; 할로알콕시; 알킬티오; 할로알킬티오; 알킬설포닐; 포밀; 알카노일; 하이드록시; 할로겐; 시아노; 니트로; 아미노; 알킬아미노; 디알킬아미노; 카복시; 알콕시카보닐; 알케닐옥시카보닐 또는 알키닐옥시카보닐에 의해 치환될 수 있다)이거나,

[0034] R_9가 C_1-C_8-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, C_1-C_8-할로알킬, C_1-C_8-알콕시, C_1-C_8-할로알콕시, C_1-C_8-알킬티오, C_1-C_8-할로알킬티오, C_1-C_8-알킬설포닐, 할로겐, 시아노, 니트로 및 C_1-C_8-알콕시카보닐을 포함하는 그룹으로부터 선택된 1 내지 3개의 치환체에 의해 각각 임의로 치환된 페닐, 나프틸, 1,3-바이페닐 또는 1,4-바이페닐이거나,

[0035] R_9가 C_1-C_6-알킬, C_1-C_6-할로알킬, C_1-C_6-알콕시, C_1-C_6-할로알콕시, C_1-C_6-알킬티오, C_1-C_6-할로알킬티오, 할로겐, 시아노, 니트로 및 C_1-C_6-알콕시카보닐을 포함하는 그룹으로부터 선택된 1 내지 3개의 치환체에 의해 각각 임의로 치환된 페닐, 나프틸, 1,3-바이페닐 또는 1,4-바이페닐이거나,

[0036] R_{10}이 수소, C_1-C_8-알킬, C_1-C_8-할로알킬, C_3-C_8-알케닐 또는 C_3-C_8-알키닐이거나,

[0037] R_{10}이 수소 또는 C_1-C_6-알킬이거나,

[0038] R_{10}이 수소이거나,

[0039] R_{11}이 수소, C_1-C_8-알킬, C_1-C_8-할로알킬, C_3-C_8-알케닐 또는 C_3-C_8-알키닐이거나,

[0040] R_{11}이 수소, C_1-C_8-알킬, C_3-C_8-알케닐 또는 C_3-C_8-알키닐이거나,

[0041] R_{11}이 수소, C_1-C_6-알킬 또는 C_3-C_6-알키닐이거나,

[0042] R_{12}가 C_1-C_8-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬, 페닐 또는 나프틸(여기서, 페닐 및 나프틸은 C_1-C_8-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, C_1-C_8-할로알킬, C_1-C_8-알콕시, C_1-C_8-할로알콕시, C_1-C_8-알킬티오, C_1-C_8-할로알킬티오, C_1-C_8-알킬설포닐, 아릴, 할로겐, 시아노 및 니트로를 포함하는 그룹으로부터 선택된 1 내지 3개의 치환체에 의해 임의로 치환될 수 있다)이거나,

[0043] R_{12}가 C_1-C_6-알킬 또는 C_3-C_6-사이클로알킬이거나,

[0044] R_{13}이 수소, C_1-C_8-알킬, C_1-C_8-할로알킬, C_3-C_8-알케닐 또는 C_3-C_8-알키닐이거나,

[0045] R_{13}이 수소 또는 C_1-C_6-알킬이거나,

[0046] R_{13}이 수소이거나,

[0047] R_{14}가 C_1-C_8-알킬, C_1-C_8-할로알킬, C_1-C_8-알킬아미노 또는 C_1-C_8-디알킬아미노이거나,

[0048] R_{14}가 C_1-C_8-알킬 또는 C_1-C_8-디알킬아미노인 화합물이다.

[0049] 화학식 I의 화합물의 한 가지 바람직한 아그룹은

R_{10}이 수소 또는 알킬이고,

[0050] X가 산소이고,

[0051] R_8이 $-C(R_9R_{10})-OR_{11}$이고,

[0052] R_{11}이 수소 또는 알키닐이거나,

[0053] X가 산소이고,

[0054] R_8이 $-C(R_{12}R_{13})NH-SO_2-R_{14}$이고,

[0055] R_{12}가 알킬 또는 측쇄 알킬인 화합물로 이루어진다.

[0056] 화학식 I의 화합물의 추가로 바람직한 아그룹은

[0057] R_1이 수소, 알킬, 사이클로알킬, 페닐 또는 나프틸(여기서, 페닐 및 나프틸은 알킬, 알케닐, 알키닐, 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 페닐 및 페닐알킬을 포함하는 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 임의로 치환될 수 있으며, 이들 모든 그룹은 하나 또는 수 개의 할로겐; 알콕시, 알케닐옥시, 알키닐옥시; 알콕시알킬; 할로알콕시; 알킬티오; 할로알킬티오; 알킬설포닐; 포밀; 알카노일; 하이드록시; 할로겐; 시아노; 니트로; 아미노; 알킬아미노; 디알킬아미노; 카복시; 알콕시카보닐; 알케닐옥시카보닐 또는 알키닐옥시카보닐에 의해 치환될 수 있다)이고, R_4가 알킬이고, R_8이 그룹 $-C(R_9R_{10})-OR_{11}$이고, R_9가 알킬, 알케닐, 알키닐, 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 페닐 및 페닐알킬을 포함하는 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 각각 임의로 치환된 아릴 또는 헤테로아릴이고, 이들 모든 그룹은 하나 또는 수 개의 할로겐; 알콕시, 알케닐옥시, 알키닐옥시; 알콕시알킬; 할로알콕시; 알킬티오; 할로알킬티오; 알킬설포닐; 포밀; 알카노일; 하이드록시; 할로겐; 시아노; 니트로; 아미노; 알킬아미노; 디알킬아미노; 카복시; 알콕시카보닐; 알케닐옥시카보닐 또는 알키닐옥시카보닐에 의해 치환될 수 있고, R_{11}이 수소, 알킬 또는 알키닐이거나, R_8이 그룹 $-C(R_{12}R_{13})NH-SO_2-R_{14}$(여기서, R_{14}는 알킬 또는 알킬아미노이다)이거나,

[0058] R_1이 수소, C_1-C_8-알킬 또는 C_3-C_8-사이클로알킬이고, R_2, R_3, R_5 및 R_6이 수소이고, R_4가 C_1-C_6-알킬이고, R_9가 C_1-C_8-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, C_1-C_8-할로알킬, C_1-C_8-알콕시, C_1-C_8-할로알콕시, C_1-C_8-알킬티오, C_1-C_8-할로알킬티오, C_1-C_8-알킬설포닐, 할로겐, 시아노, 니트로 및 C_1-C_8-알콕시카보닐을 포함하는 그룹으로부터 선택된 1 내지 3개의 치환체에 의해 각각 임의로 치환된 페닐, 나프틸, 1,3-바이페닐 또는 1,4-바이페닐이고, R_{10}이 수소 또는 C_1-C_4-알킬이고, R_{11}이 수소, C_1-C_8-알킬 또는 C_2-C_8-알키닐이고, R_{12}가 C_1-C_8-알킬, C_3-C_6-사이클로알킬, C_3-C_8-알케닐 또는 C_3-C_8-알키닐, 페닐 또는 벤질(여기서, 페닐 및 벤질은 C_1-C_8-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, C_1-C_8-할로알킬, C_1-C_8-알콕시, C_1-C_8-할로알콕시, C_1-C_8-알킬티오, C_1-C_8-할로알킬티오, C_1-C_8-알킬설포닐, 할로겐, 시아노, 니트로 및 C_1-C_8-알콕시카보닐을 포함하는 그룹으로부터 선택된 1 내지 3개의 치환체에 의해 임의로 치환될 수 있다)이고, R_{13}이 수소 또는 C_1-C_4-알킬이고, R_{14}가 C_1-C_6-알킬, C_1-C_6-모노알킬아미노 또는 C_1-C_6-디알킬아미노이거나,

[0059] R_1이 수소 또는 C_1-C_6-알킬이고, R_2, R_3, R_5 및 R_6이 수소이고, R_4가 메틸 또는 에틸이고, R_9가 C_1-C_6-알킬, C_1-C_6-할로알킬, C_1-C_6-알콕시, C_1-C_6-할로알콕시, C_1-C_6-알킬티오, C_1-C_6-할로알킬티오, 할로겐, 시아노, 니트로 및 C_1-C_6-알콕시카보닐을 포함하는 그룹으로부터 선택된 1 내지 3개의 치환체에 의해 각각 임의로 치환된 페닐 또는 나프틸이고, R_{10} 및 R_{13}이 각각 수소이고, R_{11}이 수소 또는 C_2-C_6-알키닐이고, R_{12}가 C_2-C_6-알킬 또는 C_3-C_6-사이클로알킬이고, R_{14}가 C_1-C_6-알킬 또는 C_1-C_6-디알킬아미노인 화합물이다.

[0060] 바람직한 개개의 화합물은 다음과 같다:

[0061] 2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-페닐-아세트아미드,

[0062] N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-페닐-2-프로프-2-이닐옥시-아세트아미드,

[0063] 2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-페닐-아세트아미드,

[0064] N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-페닐-2-프로프-2-이닐옥시-아세트아미드,

[0065] 2-(4-클로로-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드,

[0066] 2-(4-클로로-페닐)-N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-프로프-2-이닐옥시-아세트아미드,

[0067] 2-(4-클로로-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드,

[0068] 2-(4-클로로-페닐)-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-프로프-2-이닐옥시-아세트아미드,

[0069] 2-(4-브로모-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드,

[0070] 2-(4-브로모-페닐)-N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-프로프-2-이닐옥시-아세트아미드,

[0071] 2-(4-브로모-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드,

[0072] 2-(4-브로모-페닐)-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-프로프-2-이닐옥시-아세트아미드,

[0073] 2-(3,4-디클로로-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드,

[0074] 2-(3,4-디클로로-페닐)-N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-프로프-2-이닐옥시-아세트아미드,

[0075] 2-(3,4-디클로로-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드,

[0076] 2-(3,4-디클로로-페닐)-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-2-프로프-2-이닐옥시-아세트아미드,

[0077] (S)-2-메틸설포닐아미노-N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-3-메틸-부티르아미드,

[0078] (S)-2-메틸설포닐아미노-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-3-메틸-부티르아미드,

[0079] (S)-N-{4-[3-(4-클로로-페닐)-프로프-2-이닐옥시]-3-메톡시-벤질옥시}-2-메틸설포닐아미노-3-메틸-부티르아미드,

[0080] (S)-2-에틸설포닐아미노-N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-3-메틸-부티르아미드,

[0081] (S)-N-{4-[3-(4-클로로-페닐)-프로프-2-이닐옥시]-3-메톡시-벤질옥시}-2-N,N'-디메틸아미노-설포닐아미노-3-메틸-부티르아미드,

[0082] 2-(4-에틸-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드,

[0083] 2-(4-에틸-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드,

[0084] (S)-2-에틸설포닐아미노-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-3-메틸-부티르아미드,

[0085] (S)-N-{4-[3-(4-클로로-페닐)-프로프-2-이닐옥시]-3-메톡시-벤질옥시)-2-에탄설포닐아미노-3-메틸-부티르아미드,

[0086] 하이드록시-페닐-아세트산 N'-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0087] 페닐-프로프-2-이닐옥시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0088] 하이드록시-페닐-아세트산 N'-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0089] 페닐-프로프-2-이닐옥시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0090] (4-클로로-페닐)-하이드록시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0091] (4-클로로-페닐)-프로프-2-이닐옥시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0092] (4-클로로-페닐)-하이드록시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0093] (4-클로로-페닐)-프로프-2-이닐옥시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0094] (4-브로모-페닐)-하이드록시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0095] (4-브로모-페닐)-프로프-2-이닐옥시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0096] (4-브로모-페닐)-하이드록시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0097] (4-브로모-페닐)-프로프-2-이닐옥시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0098] (3,4-디클로로-페닐)-하이드록시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0099] (3,4-디클로로-페닐)-프로프-2-이닐옥시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0100] (3,4-디클로로-페닐)-하이드록시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0101] (3,4-디클로로-페닐)-프로프-2-이닐옥시-아세트산 N'-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드,

[0102] N-{(S)-1-[N'-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지노카보닐]-2-메틸-프로필}-메틸설폰아미드,

[0103] N-{(S)-1-[N'-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지노카보닐]-2-메틸-프로필}-메틸설폰아미드,

[0104] N-[(S)-1-(N'-{4-[3-(4-클로로-페닐)-프로프-2-이닐옥시]-3-메톡시-벤질}-하이드라지노카보닐)-2-메틸-프로필]-메틸설폰아미드,

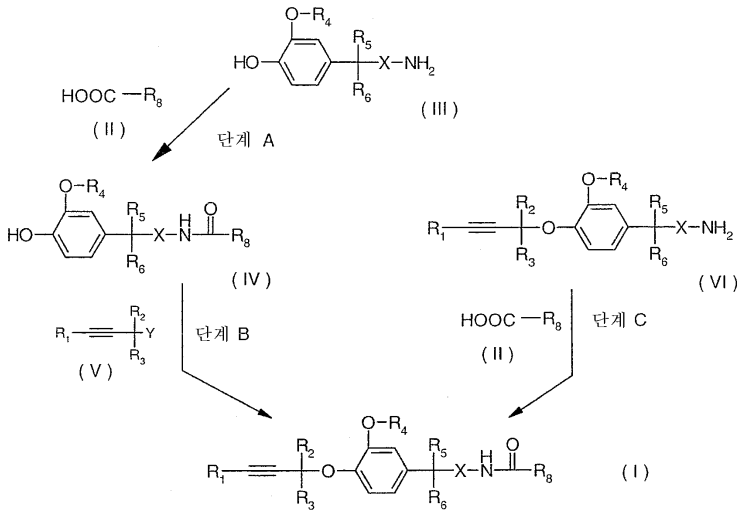
[0105] N-{(S)-1-[N'-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지노카보닐]-2-메틸-프로필}-에틸설폰아미드,

[0106] N-{(S)-1-[N'-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지노카보닐]-2-메틸-프로필}-에틸설폰아미드 및

[0107] N-[(S)-1-(N'-{4-[3-(4-클로로-페닐)-프로프-2-이닐옥시]-3-메톡시-벤질}-하이드라지노카보닐)-2-메틸-프로필]-에틸설폰아미드.

[0108] 화학식 I의 프로파길에테르 유도체는 반응식 1 내지 3의 과정 중의 어느 하나에 따라 수득할 수 있다:

반응식 1



[0109]

[0110] 단계 A: 화학식 II의 산 또는 화학식 II의 산의 카복시-활성화 유도체(여기서, R_8은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다)를 임의로 염기의 존재하에 및 임의로 불활성 용매의 존재하에 화학식 III의 아미노 유도체(여기서, R_4, R_5, R_6 및 X는 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다)와 반응시킨다.

[0111] 본 발명의 목적을 위해, 화학식 II의 산의 카복시-활성화 유도체는 활성화 카복실 그룹, 예를 들면, 산 할라이드, 예를 들면, 산 클로라이드; 대칭 또는 혼합 무수물, 예를 들면, O-알킬카보네이트와의 혼합 무수물; 활성화 에스테르, 예를 들면, p-니트로페닐에스테르 또는 N-하이드록시석신이미드에스테르 뿐만 아니라 축합제를 이용하여 동일계에서 형성된 화학식 II의 산의 활성화 형태, 예를 들면, 디사이클로헥실카보디이미드, 카보닐디이미다졸, 벤조트리아졸-1-일옥시-트리스(디메틸아미노)포스포늄 헥사플루오로포스페이트, O-벤조트리아졸-1-일-N,N,N',N'-비스(펜타메틸렌)우로늄 헥사플루오로포스페이트, O-벤조트리아졸-1-일-N,N,N',N'-비스(테트라메틸렌)우로늄 헥사플루오로포스페이트, O-벤조트리아졸-1-일-N,N,N',N'-테트라메틸우로늄 헥사플루오로포스페이트 또는 벤조트리아졸-1-일옥시-트리피롤리디노포스포늄 헥사플루오로포스페이트를 갖는 화학식 II의 화합물의 모든 유도체를 포함한다. 화학식 II의 산의 혼합 무수물은 화학식 II의 산을 임의로 유기 또는 무기 염기, 예를 들면, 3급 아민, 예를 들면, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필-에틸아민, 피리딘, N-메틸-피페리딘 또는 N-메틸-모르폴린의 존재하에 클로로포름산 에스테르, 예를 들면, 클로로포름산 알킬에스테르, 예를 들면, 에틸 클로로포르메이트 또는 이소부틸 클로로포르메이트와 반응시킴으로써 제조할 수 있다.

[0112] 본 반응은 바람직하게는 방향족, 비방향족 또는 할로겐화 탄화수소, 예를 들면, 클로로-탄화수소, 예를 들면, 디클로로메탄 또는 톨루엔; 케톤, 예를 들면, 아세톤; 에스테르, 예를 들면, 에틸 아세테이트; 아미드, 예를 들면, N,N-디메틸포름아미드; 니트릴, 예를 들면, 아세토니트릴; 또는 에테르, 예를 들면, 디에틸에테르, 3급 부틸-메틸에테르, 디옥산 또는 테트라하이드로푸란 또는 물 등의 불활성 용매 속에서 수행한다. 이들 용매의 혼합물을 사용할 수도 있다. 당해 반응은 임의로 유기 또는 무기 염기, 예를 들면, 3급 아민, 예를 들면, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필-에틸아민, 피리딘, N-메틸-피페리딘 또는 N-메틸-모르폴린, 예를 들면, 금속 수산화물 또는 금속 탄산염, 바람직하게는 알칼리 수산화물 또는 알칼리 탄산염, 예를 들면, 수산화리튬, 수산화나트륨 또는 수산화칼륨의 존재하에 -80 내지 +150℃, 바람직하게는 -40 내지 +40℃의 온도 범위에서 수행한다.

[0113] 단계 B: 화학식 I의 화합물은 화학식 IV의 페놀(여기서, R_4, R_5, R_6, R_8 및 X는 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다)을 화학식 V의 화합물[여기서, R_1, R_2 및 R_3은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같고, Y는 이탈 그룹, 예를 들면, 할라이드(예: 클로라이드 또는 브로마이드) 또는 설폰산 에스테르(예: 토실레이트, 메실레이트 또는 트리플레이트)이다]과 반응시킴으로써 최종 생성물로서 제조될 수 있다.

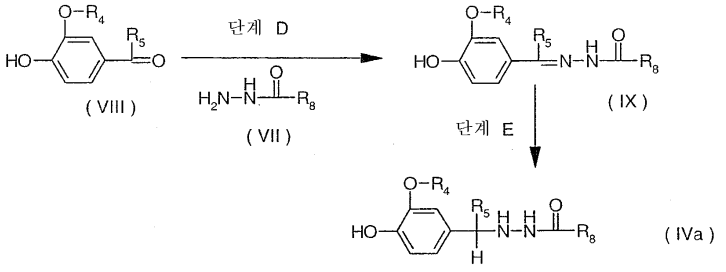
[0114] 당해 반응은 유리하게는 방향족, 비방향족 또는 할로겐화 탄화수소, 예를 들면, 클로로탄화수소, 예를 들면, 디클로로메탄 또는 톨루엔; 케톤, 예를 들면, 아세톤 또는 2-부탄온; 에스테르, 예를 들면, 에틸 아세테이트; 에테르, 예를 들면, 디에틸에테르, 3급 부틸-메틸에스테르, 디옥산 또는 테트라하이드로푸란; 아미드, 예를 들면, N,N-디메틸포름아미드; 니트릴, 예를 들면, 아세토니트릴; 알코올, 예를 들면, 메탄올, 에탄올, 이소프로판올, n-부탄올 또는 3급 부탄올; 설폭사이드, 예를 들면, 디메틸설폭사이드, 또는 물 등의 불활성 용매 속에서 수행한다. 이들 용매의 혼합물을 사용할 수도 있다. 당해 반응은 임의로 유기 또는 무기 염기, 예를 들면, 3급 아민, 예를 들면, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필-에틸아민, 피리딘, N-메틸-피페리딘 또는 N-메틸-모르폴린, 예를 들면, 금속 수산화물, 금속 탄산염 또는 금속 알콕사이드, 바람직하게는 알칼리 수산화물, 알칼리 탄산염 또는 알칼리 알콕사이드, 예를 들면, 수산화리튬, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 나트륨 메톡사이드, 칼륨 메톡사이드, 나트륨 에톡사이드, 칼륨 에톡사이드, 나트륨 3급 부톡사이드 또는 칼륨 3급 부톡사이드의 존재하에 -80 내지 +200℃, 바람직하게는 0 내지 +120℃의 온도 범위에서 수행한다.

[0115] 단계 C:

[0116] 연속 단계 A 및 B에 대한 대안으로, 화학식 II의 산 또는 화학식 II의 산의 카복시-활성화 유도체(여기서, R_8은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다)를 임의로 염기의 존재하에 및 임의로 희석 불활성 용매의 존재하에 단계 A에 대해 정의한 바와 동일한 조건하에 화학식 VI의 아미노 유도체(여기서, R_1, R_2, R_3, R_4, R_5, R_6 및 X는 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다)와 반응시킨다.

반응식 2

[0117] 화학식 IV의 중간체의 제조실시예(여기서, X는 질소이고, R_6은 수소이다)



[0118]

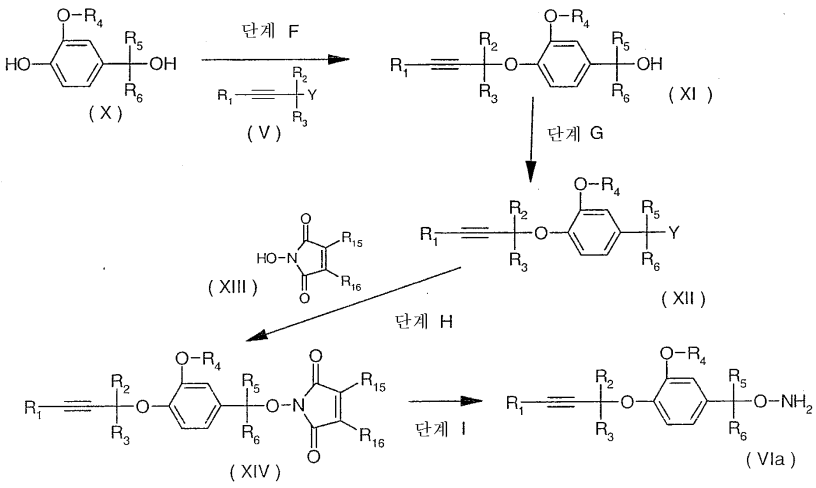
[0119] 단계 D: 화학식 VII의 산 하이드라지드(여기서, R_8은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다)를 화학식 VIII의 카보닐 화합물(여기서, R_4 및 R_5는 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다)과 반응시킨다. 반응은 표준 하이드라존 형성과 상응하며 유리하게는 공비 증발물을 형성할 수 있는 불활성 용매 속에서 수행된다. 반응은 무기산, 예를 들면, 염산, 황산 또는 유기산, 예를 들면, 포름산 또는 아세트산의 존재로 인해 추가로 촉매처리될 수 있다. 물은 축합 반응 도중에 제거되며, 이는 바람직하게는 공비 증류에 의해, 예를 들면, 딘-스타크 트랩(Dean-Stark trap)을 사용하여 반응 혼합물로부터 연속해서 분리된다. 이러한 목적에 적합한 용매는 방향족 탄화수소, 예를 들면, 벤젠, 톨루엔 및 크실렌 또는 염소화 탄화수소, 예를 들면, 메틸렌 클로라이드 또는 클로로포름을 포함한다.

[0120] 단계 E: 화학식 IX의 아실하이드라존(여기서, R_4, R_5 및 R_8은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다)을 적합한 촉매, 예를 들면, 탄소상 로듐, 탄소상 백금 또는 탄소상 팔라듐의 존재하에 환원제, 예를 들면, 수소 또는 하

이드라진과 반응시키거나, 금속 하이드라이드, 예를 들면, 수소화붕소나트륨, 수소화시아노붕소나트륨 또는 리튬 알루미늄하이드라이드를 사용하여 환원 변환시켜 그 자체로 공지된 조건하에 화학식 IVa의 화합물(여기서, R_4, R_5 및 R_8은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다)로 환원시킨다[참조: K. Shanker et al., Arch. Pharm. (Weinheim), 317, 890 (1984)]. 수소화 반응은 바람직하게는 에스테르, 예를 들면, 에틸 아세테이트; 아미드, 예를 들면, N,N-디메틸포름아미드; 또는 카복실산, 예를 들면, 아세트산 등의 용매 속에서 수행되며; 금속 수소화물을 사용한 변환은 바람직하게는 에테르, 예를 들면, 디에틸에테르, 3급 부틸-메틸에테르, 디옥산 또는 테트라하이드로푸란; 알콜, 예를 들면, 메탄올 또는 에탄올 등의 용매 속에서 수행된다. 이들 용매 혼합물을 사용할 수도 있다. 또한, 수소화 반응은 대기 압력 내지 120bar의 압력, 바람직하게는 1 내지 80bar의 압력 범위에서 수행될 수 있다.

반응식 3

[0121] 화학식 VI의 중간체의 제조실시예(X=O)

[0122] 

[0123] 단계 F: 화학식 X의 페놀(여기서, R_4, R_5 및 R_6은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다)을 반응식 1 중의 단계 B에 대해 정의한 바와 동일한 조건하에 화학식 V의 화합물[여기서, R_1, R_2 및 R_3은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같고, Y는 이탈 그룹, 예를 들면, 할라이드(예: 클로라이드 또는 브로마이드) 또는 설폰산 에스테르(예: 토실레이트, 메실레이트 또는 트리플레이트)이다]과 반응시킨다.

[0124] 단계 G: 화학식 XI의 알콜(여기서, R_1, R_2, R_3, R_4, R_5 및 R_6은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다)을 화학식 XII의 화합물[여기서, R_1, R_2, R_3, R_4, R_5 및 R_6은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같고, Y는 이탈 그룹, 예를 들면, 할라이드(예: 클로라이드 또는 브로마이드) 또는 설폰산 에스테르(예: 토실레이트, 메실레이트 또는 트리플레이트)이다]로 변환시킨다. 반응은 화학식 XI의 화합물을, 예를 들면, 염산, 브롬화수소, 사브롬화인 또는 티오닐 클로라이드를 반응물로서 사용하여 할라이드로 전환시키고; 메실 클로라이드 또는 토실 클로라이드를 반응물로서 사용하여 설폰산 에스테르로 전환시킴으로써 달성될 수 있다.

[0125] 단계 H: 화학식 XII의 화합물(여기서, R_1, R_2, R_3, R_4, R_5 및 R_6은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같다)을 N-알콕시이미드의 형성에 대해 그 자체로 공지된 조건하에 화학식 XIII의 화합물(여기서, R_{15} 및 R_{16}은 수소, 할로겐, 메틸 또는 어닐링된 벤젠 환 부분이다)과 반응시킨다[참조: G. L. Verdine et al., J. Am. Chem. Soc., 123, 398 (2001)].

[0126] 단계 I: 화학식 XIV의 화합물(여기서, R_1, R_2, R_3, R_4, R_5 및 R_6은 화학식 I에 대해 정의한 바와 같고, R_{15} 및 R_{16}은 수소, 할로겐, 메틸 또는 어닐링된 벤젠 부분이다)을 N-알콕시이미드의 절단에 대해 그 자체로 공지된 조건하에 아민 유도체, 예를 들면, 메틸아민, 부틸아민 또는 하이드라진 유도체, 예를 들면, 하이드라진, 하이드라진 수화물 또는 메틸하이드라진과 반응시킨다[참조: M. P. Kirkup, Tetrahedron Lett., 30, 6809 (1989)].

[0127] 화학식 I의 화합물은 실온에서 오일 또는 고체이고, 저장소에서 주위 온도에서 저장되는 경우 일반적으로 안정하다. 이들 화합물은 유용한 살미생물 특성으로 인해 공지된 화합물의 화학 부류로부터 식별된다. 이들은 식물병원성 또는 식물-파괴 미생물을 예방적 및 치료적으로 억제하는 농업 분야 또는 관련 분야에 사용될 수 있다. 본 발명에 따르는 화학식 I의 화합물은 저농도에서도 현저한 살미생물 활성, 특히 살진균류 활성을 나타낼 뿐만 아니라 특히 식물에 널리 허용됨을 특징으로 한다.

[0128] 놀랍게도, 당해 화학식 I의 화합물이 실제 목적을 위해, 식물병원성 미생물, 특히 진균류를 억제하는 데 있어서 매우 유리한 살생물 스펙트럼을 나타낸다는 사실이 본 발명에 의해 밝혀졌다. 이들 화합물은 극히 유리한 치료적 및 예방적 특성을 지니고 있으며, 수 많은 농작물의 보호에 사용된다. 당해 화학식 I의 화합물을 사용하여, 각종의 유용한 농작물 또는 이러한 농작물의 일부분(열매, 꽃, 잎, 줄기, 괴경, 뿌리)에 발생되는 식물병원성 미생물을 억제시키거나 파괴시킬 수 있지만, 나중에 성장하는 상기 식물의 일부분 역시, 예를 들면, 식물병원성 진균류로부터 지속적으로 보호된다.

[0129] 화학식 I의 신규한 화합물은 특정 속의 진균류 강 편지 임페르펙티(*Fungi imperfecti*)[예: 세르코스포라(*Cercospora*)], 바시디오마이세테스(*Basidiomycetes*)[예: 푸치니아(*Puccinia*)] 및 아스코마이세테스(*Ascomycetes*)[예: 에리시페(*Erysiphe*) 및 벤투리아(*Venturia*)] 및 특히, 오오마이세테스(*Oomycetes*)[예: 플라스모파라(*Plasmopara*), 페로노스포라(*Peronospora*), 피티움(*Phythium*) 및 피토프토라(*Phytophthora*)]에 대해 유효한 것으로 입증되었다. 따라서, 이들 화합물은 식물 보호에 있어, 식물병원성 진균류 억제용 조성물에 유용한 부가를 나타낸다. 당해 화학식 I의 화합물은 드레싱으로서 종자(열매, 괴경, 알곡) 및 식물 삽목을 진균류 감염으로부터 또는 토양 내에서 발생되는 식물병원성 진균류에 대항하여 보호하는데 사용될 수 있다.

[0130] 본 발명은 또한 활성 성분으로서 화학식 I의 화합물을 포함하는 조성물, 특히 식물 보호용 조성물, 및 농업 분야 또는 관련 분야에 있어서의 이의 용도에 관한 것이다.

[0131] 또한, 본 발명에는 활성 성분을 본원에 기재된 물질 또는 물질 그룹 중의 하나 이상과 균질하게 혼합시키는, 상기 조성물의 제조방법이 포함된다. 또한, 신규한 화학식 I의 화합물 또는 신규한 조성물을 적용함을 특징으로 하는, 식물의 처리방법이 포함된다.

[0132] 본 발명의 범주 내에서 보호하고자 하는 표적 농작물은, 예를 들면, 다음 식물 종을 포함한다: 시리얼(밀, 보리, 호밀, 귀리, 벼, 옥수수, 당밀 및 관련 종); 비트(사탕 무 및 마초 무); 이과, 핵과 및 연과(사과, 배, 플럼, 복숭아, 아몬드, 체리, 딸기, 나무딸기 및 검은 딸기); 콩과 식물(콩, 편두, 완두, 대두); 오일 식물(평지, 겨자, 양귀비, 올리브, 해바라기, 코코넛, 피마자유 식물, 코코아 빈, 땅콩); 박과 식물(서양 호박, 오이, 메론); 섬유 식물(면, 아마, 대마, 황마); 밀감속 식물(오렌지, 레몬, 포도, 만다린); 야채류(시금치, 상추, 아스파라거스, 양배추, 당근, 양파, 토마토, 감자, 파프리카); 녹나무과(lauraceae)(아보카도, 시나몬, 장뇌), 및 담배, 너트, 커피, 사탕 수수, 차, 후추, 덩굴, 호프, 바나나 및 천연 고무 식물과 같은 식물, 및 장식용 식물.

[0133] 화학식 I의 화합물은 통상적으로, 조성물 형태로 사용되고, 기타 활성 성분과 동시에 또는 연속해서, 처리하고자 하는 영역 또는 식물에 적용할 수 있다. 이들 기타 활성 성분은 비료, 미량영양소 공여체, 또는 식물 성장에 영향을 미치는 기타 제제일 수 있다. 또한, 경우에 따라, 제형 기술 분야에 통상적으로 사용되고 있는 추가의 담체, 계면활성제 또는 기타 적용-증진용 보조제와 함께, 선택적인 제초제 또는 살충제, 살진균제, 살세균제, 살선충제, 살패제(또는 이들 몇몇 제제의 혼합물을 사용할 수 있다.

[0134] 당해 화학식 I의 화합물은 예비제조된 조성물 속에서 또는 소위 탱크 혼합물로서 기타 살진균제와 혼합할 수 있는데, 이로써 몇몇의 경우에는, 예상치 못한 상승 활성이 나타날 수 있다. 이러한 목적에 특히 적합한 혼합 성분에는, 예를 들면, 아졸, 예를 들면, 아자코나졸, BAY 14120, 비테르타놀, 브로무코나졸, 크립로코나졸, 디페노코나졸, 디니코나졸, 에폭시코나졸, 펜부코나졸, 플루퀸코나졸, 플루실라졸, 플루트리아폴, 헥사코나졸, 이마잘릴, 이미벤코나졸, 이프코나졸, 메트코나졸, 미클로부타닐, 퍼푸라조에이트, 펜코나졸, 피리페녹스, 프로클로라즈, 프로피코나졸, 시메코나졸, 테부코나졸, 테트라코나졸, 프리아디메폰, 트리아디메놀, 트리플루미졸, 트리티코나졸; 피리미디닐 카비놀, 예를 들면, 안시미돌, 페나리몰, 누아리몰; 2-아미노-피리미딘, 예를 들면, 부피리메이트, 디메티리몰, 에티리몰; 모르폴린, 예를 들면, 도데모르프, 펜프로피딘, 펜프로피모르프, 스피록사민,

트리데모르프; 아닐리노피리미딘, 예를 들면, 시프로디닐, 메파니피림, 피리메타닐; 피롤, 예를 들면, 펜피클로닐, 플루디옥소닐; 페닐아미드, 예를 들면, 베날락실, 푸랄락실, 메타락실, R-메타락실, 오푸라세, 옥사딕실; 벤즈이미다졸, 예를 들면, 베노밀, 카벤다짐, 데바카르브, 푸베리다졸, 티아벤다졸; 디카복스이미드, 예를 들면, 클로졸리네이트, 디클로졸린, 이프로디온, 미클로졸린, 프로시미돈, 빈클로졸린; 카복스아미드, 예를 들면, 카복신, 펜푸람, 플루톨라닐, 메프로닐, 옥시카복신, 티플루자미드; 구아니딘, 예를 들면, 구아자틴, 도딘, 이민옥타딘; 스트로빌루린, 예를 들면, 아족시스트로빈, 크레속신-메틸, 메토미노스트로빈, SSF-129, 트리플록시스트로빈, 피콕시스트로빈, BAS 500F(제안명 피라클로스트로빈), BAS 520; HEC 5725(제안 통상명 플루옥사스트로빈), 오리사스트로빈(제안 통상명), 디티오카바메이트, 예를 들면, 페르밤, 만코제브, 마네브, 메티람, 프로피넵, 티람, 지넵, 지람; N-할로메틸티오테트라하이드로프탈이미드, 예를 들면, 캅타폴, 캅탄, 디클로플루아니드, 플루오로미드, 폴펫, 톨릴플루아니드; Cu-화합물, 예를 들면, 보르도 혼합물, 수산화구리, 옥시염화구리, 황산구리, 산화구리, 만쿠퍼, 옥신-구리; 니트로페놀-유도체, 예를 들면, 디노캅, 니트로탈-이소프로필; 오가노-p-유도체, 예를 들면, 에디펜포스, 이프로벤포스, 이소프로티올란, 포스디펜, 피라조포스, 톨클로포스-메틸; 기타 각종 물질, 예를 들면, 아시벤졸라-S-메틸, 아닐라진, 벤티아발리카르브, 블라스티시딘-S, 신노메티오네이트, 클로로넵, 클로로탈로닐, 시플루페나미드, 시목사닐, 디클론, 디클로메진, 디클로란, 디에토펜카르브, 디메토모르프, SYP-L190(제안명: 플루모르프 또는 플로모를린), 디티아논, 에타복삼, 데트리디아졸, 파목사돈, 페나미돈, 페녹사닐, 펜틴, 페림존, 플루아지남, 플루술파미드, 펜헥사미드, 포세틸-알루미늄, 히멕사졸, 이프로발리카르브, IKF-916(시아조파미드), 카수가마이신, 메타술포카르브, 메트라페논, 보스칼리드(니코비펜), 펜시쿠론, 프탈리드, 폴리옥신, 프로베나졸, 프로파모카르브, 피로퀼론, 퀴녹시펜, 퀸토젠, 황, 트리아족시드, 트리사이클라졸, 트리포린, 발리다마이신, 족사미드(RH7281)가 포함된다.

[0135] 적합한 담체 및 계면활성제는 고체 또는 액체일 수 있고, 제형 기술 분야에 통상적으로 이용되고 있는 물질에 상응하는데, 예를 들면, 천연 또는 재생 무기질 물질, 용매, 분산제, 습윤제, 점착제, 증점제, 결합제 또는 비료이다. 이러한 담체 및 부가제는, 예를 들면, 국제 공개공보 제WO 95/30651호에 기재되어 있다.

[0136] 당해 화학식 I의 화합물, 또는 하나 이상의 당해 화합물을 포함하는 농약 조성물의 바람직한 적용방법은 잎에 적용(잎 적용)하는 것이며, 이러한 적용 횟수와 비율은 해당 병원균에 의한 감염 위험성에 따라서 결정된다. 당해 화학식 I의 화합물은 또한 알곡을 해당 활성 성분의 액상 제형으로 함침시키거나 이들 알곡을 고형 제형으로 피복시킴으로써 종자 알곡에 적용할 수 있다(피복).

[0137] 당해 화학식 I의 화합물은 변형되지 않은 형태로 사용되거나 바람직하게는 제형 기술 분야에 통상적으로 이용되고 있는 보조제와 함께 사용되고, 이러한 목적을 위해 공지된 방법으로, 예를 들면, 유화성 농축제, 피복 가능한 페이스트제, 직접적으로 분무 가능하거나 희석 가능한 액제, 묽은 유제, 습윤성 산제, 가용성 산제, 분진, 과립제로 유리하게 제형화시키고, 예를 들면, 중합체 물질 중에 피복화함으로써 제형화시킨다. 이들 조성물의 성질을 이용함에 따라, 분무, 분사, 분진, 산포, 피복 또는 주입과 같은 적용 방법을 의도하는 목적물과 주요 환경에 따라 선택한다.

[0138] 유리한 적용 비율은 통상 1헥타르(ha)당 활성 성분(a.i.) 1g 내지 2kg, 바람직하게는 10g 내지 1kg a.i./ha, 특히 25 내지 750g a.i./ha이다. 종자 드레싱으로서 사용되는 경우, 종자 1kg 당 활성 성분 0.001 내지 1.0g의 비율이 유리하게 사용된다.

[0139] 화학식 I의 화합물(들)[활성 성분(들)]과, 경우에 따라, 고형 또는 액상 보조제를 포함하는 제형, 즉 조성물, 제제 또는 혼합물은 공지된 방식으로, 예를 들면, 활성 성분을 증량제, 예를 들면, 용매, 고형 담체 및, 경우에 따라, 계면활성 화합물(계면활성제)과 균질하게 혼합 및/또는 연마함으로써 제조된다.

[0140] 제형 기술 분야에 통상적으로 사용되는 추가의 계면활성제는 당업자에게 공지되어 있거나 관련 기술 문헌에 보고되어 있다.

[0141] 당해 농약 조성물은 통상 화학식 I의 화합물 0.01 내지 99중량%, 바람직하게는 0.1 내지 95중량%, 고형 또는 액상 보조제 99.99 내지 1중량%, 바람직하게는 99.9 내지 5중량% 및 계면활성제 0 내지 25중량%, 바람직하게는 0.1 내지 25중량%를 포함한다.

[0142] 시판품은 바람직하게는 농축제로서 제형화되며, 최종 사용자는 통상 묽은 제형을 이용할 것이다.

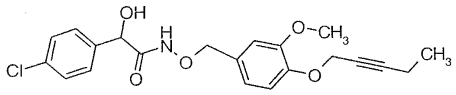
[0143] 당해 조성물은 또한 추가의 성분, 예를 들면, 안정화제, 소포제, 점도 조절제, 결합제 및 점착제 뿐만 아니라 비료 또는 특정 효과를 획득하기 위한 기타 활성 성분을 포함할 수 있다.

[0144] 다음 실시예는 위에서 언급한 발명을 예시하는 것이며, 어떠한 방식으로든 본 발명의 범위를 제한하지 않는다.

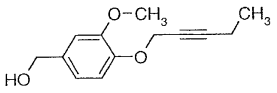
온도는 ℃이다.

[0145] 제조실시예:

[0146] 실시예 A1.1: 2-(4-클로로-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드

[0147] 

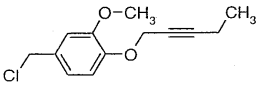
[0148] (a) (3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-페닐)-메탄올

[0149] 

[0150] 나트륨 메톡사이드(메탄올 중의 5.4M 용액 36ml, 0.20mol)를 메탄올 250ml 중의 4-하이드록시메틸-2-메톡시-페놀(25g, 0.16mol) 용액에 가한다. 펜티닐 클로라이드(18.5g, 0.18mol)를 가하고, 혼합물을 4시간 동안 환류시켜 가열한다. 용매를 증발시킨 후, 잔사를 에틸 아세테이트에 용해시키고, 물과 염수로 세척한다. 유기층을 황산마그네슘으로 건조시키고, 증발시킨다. 잔사를 실리카 겔(에틸 아세테이트/헥산 1:2)에서 섬광 크로마토그라피하여 (3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-페닐)-메탄올을 황색 오일로서 수득한다.

[0151] ^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300 MHz): 1.12 (t, 3H, Me), 2.20 (q, 2H, CH_2), 3.84 (s, 3 H, OMe), 4.58 (s, 2H, CH_2OH), 4.69 (d, 2H, $OCH_2C{\equiv}C$), 6.82-7.01 (m, 3H, ar).

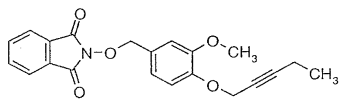
[0152] (b) 4-클로로메틸-2-메톡시-1-펜트-2-이닐옥시-벤젠

[0153] 

[0154] 디옥산 450ml 중의 (3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-페닐)-메탄올(27g, 0.12mol) 용액을 진한 염산 240ml에 적가한다. 반응 혼합물을 실온에서 1.5시간 동안 교반한다. 후속적으로, 이를 물에 부어 넣고, 에틸 아세테이트로 추출한다. 합한 유기상을 염수로 세척하고, 황산마그네슘으로 건조시킨 다음, 진공하에 증발시켜 4-클로로메틸-2-메톡시-1-펜트-2-이닐옥시-벤젠을 황색 오일로서 수득한다.

[0155] ^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300 MHz): 1.11 (t, 3H, Me), 2.21 (q, 2H, CH_2), 3.88 (s, 3 H, OMe), 4.57 (s, 2H, CH_2Cl), 4.72 (d, 2H, OCH2C≡C), 6.90-6.99 (m, 3H, ar).

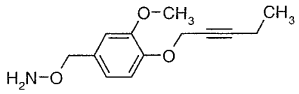
[0156] c) 2-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-이소인돌-1,3-디온

[0157] 

[0158] 4-클로로메틸-2-메톡시-1-펜트-2-이닐옥시-벤젠(28g, 0.12mol) 및 N-하이드록시프탈이미드(19.5g, 0.12mol)를 N,N-디메틸포름아미드 180ml에 용해시킨다. 반응 혼합물을 +70℃로 가열하고, 수산화칼륨(메탄올 중의 5M 용액 24ml, 0.12mol)을 동일한 온도에서 가한다. 반응을 +70℃에서 1시간 동안 교반하고, 후속적으로 동일한 온도로 냉각시킨 다음, 물에 부어 넣는다. 혼합물을 추가로 1시간 동안 교반하고, 여과한다. 생성된 결정을 물로 세척하고, 메탄올/아세톤(8:1)로부터 재결정화하여 2-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-이소인돌-1,3-디온을 무색 결정으로서 수득한다.

[0159] ^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300 MHz): 1.09 (t, 3H, Me), 2.19 (q, 2H, CH_2), 3.90 (s, 3H, OMe), 4.72 (d, 2H, OCH2C≡C), 5.18 (s, 2H, CH_2ON), 6.97-7.82 (m, 7H, ar).

[0160] (d) O-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질)-하이드록실아민

[0161] 

[0162] 2-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-이소인돌-1,3-디온(27g, 74mmol)을 메탄올 500ml와 N,N-디메틸포름아미드 50ml와의 혼합물에 현탁시킨다. 이 혼합물을 +60℃로 가열한 후, 하이드라진 수화물(8.5g, 0.17mol)을 가한다. 반응을 +60℃에서 3시간 동안 교반하고, 후속적으로 실온으로 냉각시킨다. 진한 염산 28ml와 물 80ml와의 혼합물을 가하여 생성된 현탁액을 산성화한다. 이어서, 이를 여과하여 침전물을 제거하고, 고체를 물/메탄올로 세척한다. 여액을 진공하에 최초 용적의 삼분의 일로 진공하에 농축시킨다. 수산화나트륨(18g, 물 90ml 중의 mol)을 잔사에 가하고, 이 혼합물을 디에틸 에테르로 추출한다. 합한 유기층을 물과 염수로 세척하고, 황산마그네슘으로 건조시킨 다음, 증발시켜 O-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질)- 하이드록실아민을 황색 오일로서 수득한다.

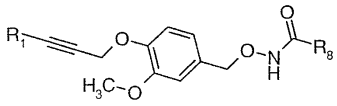
[0163] ^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300 MHz): 1.10 (t, 3H, Me), 2.21 (q, 2H, CH_2), 3.88 (s, 3 H, OMe), 4.65 (d, 2H, OCH_2C≡C), 4.73 (s, 2H, CH_2ON), 6.83-7.01 (m, 3H, ar).

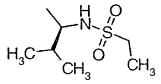
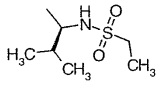
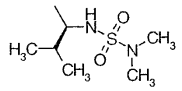
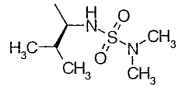
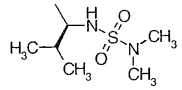
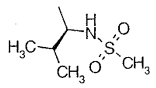
[0164] (e) O-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질)-하이드록실아민(5.0g, 21mmol)과 N-에틸디이소프로필아민[휘니그(Hunig's base), 5.5g, 42mmol]을 N,N-디메틸포름아미드 60ml에 용해시킨다. 4-클로로-DL-말레산(4.1g, 22mmol)과 (벤조트리아졸-1-일옥시)-트리스-(디메틸아미노)-포스포늄 헥사플루오로포스페이트[BOP, 카스트로 시약(Castro's reagent), 10g, 23mmol]를 연속해서 가하고, 혼합물을 16시간 동안 교반한다. 혼합물을 얼음/물에 부어 넣은 후, 이를 에틸 아세테이트로 추출한다. 합한 유기층을 염수로 세척하고, 황산마그네슘으로 건조시킨 다음, 감압하에 증발시킨다. 잔류하는 오일을 실리카 겔(에틸 아세테이트/헥산(4:6))에서 크로마토그라피로 정제하여 2-(4-클로로-페닐)-2-하이드록시-N-(3-메톡시-4-펜트-2-이닐옥시-벤질옥시)-아세트아미드를 황색 수지로서 수득한다.

[0165] ^{1}H-NMR (CDCl, 300 MHz): 1.12 (t, 3H, Me), 2.19 (q, 2H, CH_2), 3.83 (s, 3 H, OMe), 4.69-4.78 (m, 4H, OCH_2C≡C, CH_2ON), 5.03 (s, 1 H, CHOH), 6.72-7.33 (m, 7H, ar).

[0166] 위에서 언급한 실시예 A1.1에 따라, 표 A1에 기재한 화합물을 수득한다.

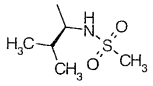
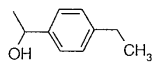
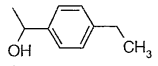
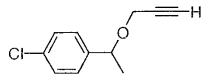
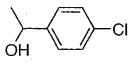
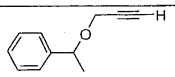
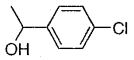
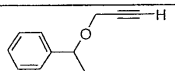
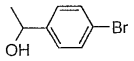
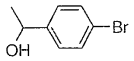
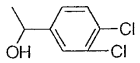
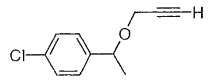
표 A1a



No.	R_1	R_8	물리화학적 데이타
A1.01	4-Cl-Ph-		융점 99-102
A1.02	H		융점 142-145
A1.03	4-Cl-Ph-		융점 149-151
A1.04	H-		오일
A1.05	CH_3-CH_2-		융점 96-98
A1.06	CH_3-CH_2-		융점 132-133

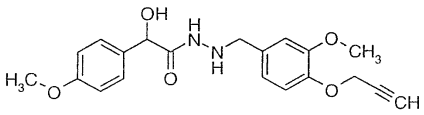
[0167]

표 A1b

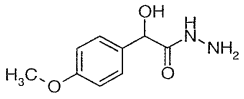
A1.07	4-Cl-Ph-		융점 147-150
A1.08	H-		오일
A1.09	CH_3-CH_2-		오일
A1.10	CH_3-CH_2-		오일
A1.11	H-		오일
A1.12	CH_3-CH_2-		오일
A1.13	CH_3-CH_2-		오일
A1.14	H-		융점 118-120
A1.15	H-		오일
A1.16	CH_3-CH_2-		오일
A1.17	CH_3-CH_2-		오일
A1.18	H-		융점 125-127

[0168]

[0169] 실시예 A2.1: 하이드록시-(4-메톡시-페닐)-아세트산 N'-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드

[0170] 

[0171] (a) 하이드록시-(4-메톡시-페닐)-아세트산 하이드라지드

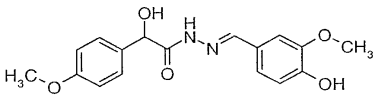
[0172] 

[0173] 메탄올 300ml 중의 하이드록시-(4-메톡시-페닐)-아세트산(45g, 0.25mol) 용액에 실온에서 진한 황산 30방울을 가하고, 생성된 혼합물을 4시간 동안 환류시켜 가열한다. 후속적으로, 혼합물을 냉각시키고, 진공하에 증발시킨다. 잔사를 물에 용해시키고, 에틸 아세테이트로 추출한다. 합한 유기층을 염수로 세척하고, 황산마그네슘으로 건조시킨 다음, 증발시킨다. 잔사인 하이드록시-(4-메톡시-페닐)-아세트산 메틸 에스테르를 디에틸 에테르 350ml에 용해시킨다. 하이드라진 일수화물(47ml, 0.95mol)을 실온에서 적가하고, 혼합물을 1시간 동안 교반한다. 반응 혼합물을 물에 부어 넣고, 에틸 아세테이트로 추출한다. 합한 유기층을 염수로 세척하고, 황산마그네슘으로 건조시킨 다음, 건조시키고, 잔류하는 하이드록시-(4-메톡시-페닐)-아세트산 하이드라지드를 충분히

정제하여 다음 단계에서 직접 사용한다.

[0174] ^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300 MHz) : 3.79 (s, 3 H, OMe), 4.92 (d, 1H, CHOH), 5.91 (d, 1H, OH), 6.92 (d, 2H, AR), 7. 36 (d, 2H, ar).

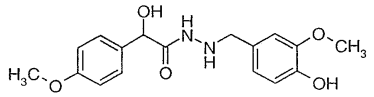
[0175] (b) 하이드록시-(4-메톡시-페닐)-아세트산[1-(4-하이드록시-3-메톡시-페닐)-메트-(E)-일리덴-하이드라지드

[0176] 

[0177] 바닐린(23g, 0.15mol)을 실온에서 에탄올 300ml 중의 하이드록시-(4-메톡시-페닐)-아세트산 하이드라지드(30g, 0.15mol) 용액에 가한다. 이 혼합물을 4시간 동안 환류시켜 가열한 후, 반응물을 물에 부어 넣고, 에틸 아세테이트로 추출한다. 합한 유기층을 염수로 세척한 다음, 황산마그네슘으로 건조시키고, 증발시킨다. 잔사인 하이드록시-(4-메톡시-페닐)-아세트산 [1-(4-하이드록시-3-메톡시-페닐)-메트-(E)-일리덴]-하이드라지드를 충분히 정제하여 다음 단계에서 직접 사용한다.

[0178] ^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300 MHz) : 3.72 (s, 3 H, OMe), 3.80 (s, 3 H, OMe), 4.99 (s, 1 H, CHOH), 6.21 (d, 1 H, CH=N), 6.79-7.42 (m, 7H, ar).

[0179] (c) 하이드록시-(4-메톡시-페닐)-아세트산 N'-(4-하이드록시-3-메톡시-벤질)-하이드라지드

[0180] 

[0181] 에탄올 500ml 중의 하이드록시-(4-메톡시-페닐)-아세트산 [1-(4-하이드록시-3-메톡시-페닐)-메트-(E)-일리덴]-하이드라지드(21g, 63mmol) 용액을 5% 목탄상 팔라듐 혼합물(10.5g)과 수소를 촉매로서 사용하여 대기압하에 수소화한다. 반응물을 실온에서 6시간 동안 교반한다. 후속적으로, 혼합물을 아르곤하에 여과하고, 용매를 증발시켜 하이드록시-(4-메톡시-페닐)-아세트산 N'-(4-하이드록시-3-메톡시-벤질)-하이드라지드를 무색 타르로서 수득한다.

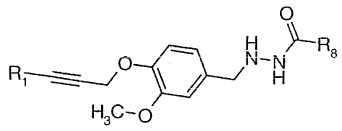
[0182] ^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300 MHz) : 3.56 (s, 3 H, OMe), 3.63 (s, 3 H, OMe), 3.71 (d, 2H, CH_2N), 4.73 (s, 1 H, CHOH), 6.55-6.19 (m, 7H, ar).

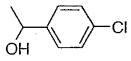
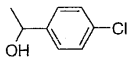
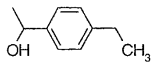
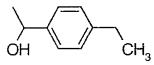
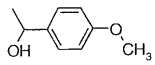
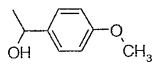
[0183] (d) 톨루엔(2.1g, 14.5mmol) 중의 80% 프로파길 브로마이드 용액을 디클로로메탄 35ml 중의 하이드록시-(4-메톡시-페닐)-아세트산 N'-(4-하이드록시-3-메톡시-벤질)-하이드라지드(4.0g, 12mmol), 30% 수산화나트륨 용액(3.5ml, 14.5mmol) 및 촉매량의 테트라부틸암모늄 브로마이드의 혼합물에 실온에서 서서히 가한다. 반응물을 +40℃에서 16시간 동안 교반한다. 후속적으로, 혼합물을 증발시키고, 잔사를 물과 디클로로메탄으로 희석시킨다. 상을 분리시키고, 수성상을 디클로로메탄으로 3회 추출한다. 합한 유기상을 염수로 세척하고, 황산나트륨으로 건조시킨 다음, 증발시킨다. 잔류하는 오일을 실리카 겔(에틸 아세테이트/헥산 7:3)에서 크로마토그라피로 정제하여 하이드록시-(4-메톡시-페닐)-아세트산 N'-(3-메톡시-4-프로프-2-이닐옥시-벤질)-하이드라지드를 수득한다.

[0184] ^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300 MHz) 2.35 (dt, 1H, C≡CH), 3.79 (s, 3 H, OMe), 3.82 (s, 3 H, OMe), 3.91 (d, 2H, CH_2N), 4.78 (d, 2H, $OCH_2C{\equiv}C$), 4.93 (s, 1 H, CHOH), 6.70-7.26 (m, 7H, ar).

[0185] 위에서 언급한 실시예 A2.1에 따라, 표 A2에 기재한 화합물을 수득한다.

표 A2

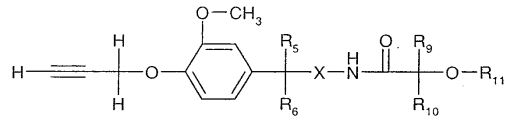


No.	R_1	R_8	물리화학적 데이타
A2.01	H		오일
A2.02	CH_3-CH_2-		오일
A2.03	H		오일
A2.04	CH_3-CH_2-		오일
A2.05	H		오일
A2.06	CH_3-CH_2-		오일
A2.07	H		오일
A2.08	CH_3-CH_2-		오일

[0186]

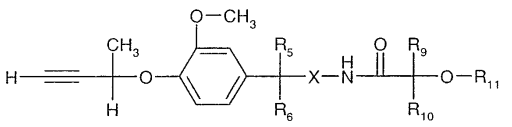
[0187] 위의 실시예와 유사하게, 표 1 내지 30의 화합물을 수득한다. Ph는 페닐이다.

[0188] 표 1: 화학식 I.1의 화합물

[0189]  (I.1)

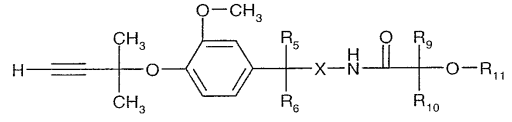
[0190] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_9, R_{10}, R_{11} 및 X의 조합은 표 A의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0191] 표 2: 화학식 I.2의 화합물

[0192]  (I.2)

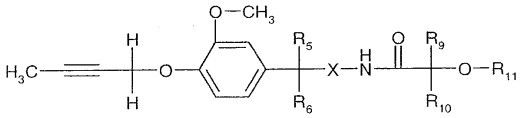
[0193] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_9, R_{10}, R_{11} 및 X의 조합은 표 A의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0194] 표 3: 화학식 I.3의 화합물

[0195]  (I.3)

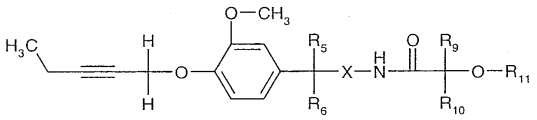
[0196] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_9, R_{10}, R_{11} 및 X의 조합은 표 A의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0197] 표 4: 화학식 I.4의 화합물

[0198]  (I.4)

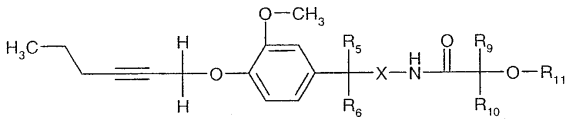
[0199] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_9, R_{10}, R_{11} 및 X의 조합은 표 A의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0200] 표 5: 화학식 I.5의 화합물

[0201]  (I.5)

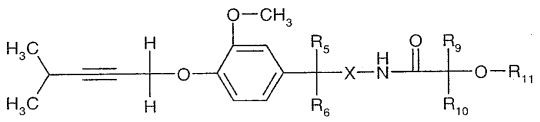
[0202] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_9, R_{10}, R_{11} 및 X의 조합은 표 A의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0203] 표 6: 화학식 I.6의 화합물

[0204]  (I.6)

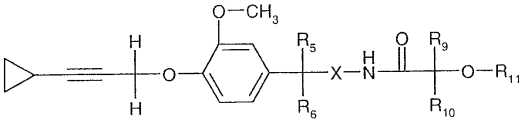
[0205] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_9, R_{10}, R_{11} 및 X의 조합은 표 A의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0206] 표 7: 화학식 I.2의 화합물

[0207]  (I.7)

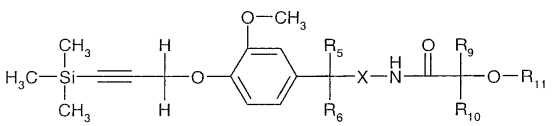
[0208] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_9, R_{10}, R_{11} 및 X의 조합은 표 A의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0209] 표 8: 화학식 I.8의 화합물

[0210]  (I.8)

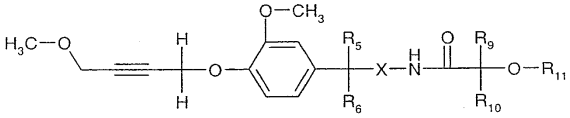
[0211] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_9, R_{10}, R_{11} 및 X의 조합은 표 A의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0212] 표 9: 화학식 I.9의 화합물

[0213]  (I.9)

[0214] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_9, R_{10}, R_{11} 및 X의 조합은 표 A의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0215] 표 10: 화학식 I.10의 화합물

[0216] 

(I.10)

[0217] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_9, R_{10}, R_{11} 및 X의 조합은 표 A의 1개의 줄 각각에 상응한다.

표 Aa

(Ph는 페닐이다):

[0218]

No.	R_5	R_6	X	R_9	R_{10}	R_{11}
001	H	H	O	Ph	H	H
002	H	H	O	Ph	H	CH_3
003	H	H	O	Ph	H	CH_2CH_3
004	H	H	O	Ph	H	$CH_2C\equiv CH$
005	CH_3	H	O	Ph	H	$CH_2C\equiv CH$
006	H	H	O	Ph	CH_3	$CH_2C\equiv CH$
007	H	H	NH	Ph	H	H
008	H	H	NH	Ph	H	CH_3
009	H	H	NH	Ph	H	CH_2CH_3
010	H	H	NH	Ph	H	$CH_2C\equiv CH$
011	CH_3	H	NH	Ph	H	$CH_2C\equiv CH$
012	H	H	NH	Ph	CH_3	$CH_2C\equiv CH$
013	H	H	NCH_3	Ph	H	H
014	H	H	NCH_3	Ph	H	CH_3
015	H	H	NCH_3	Ph	H	CH_2CH_3
016	H	H	NCH_3	Ph	H	$CH_2C\equiv CH$
017	CH_3	H	NCH_3	Ph	H	$CH_2C\equiv CH$

표 Ab

[0219]

018	H	H	NCH_3	Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
019	H	H	O	4-F-Ph	H	H
020	H	H	O	4-F-Ph	H	CH_3
021	H	H	O	4-F-Ph	H	CH_2CH_3
022	H	H	O	4-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
023	CH_3	H	O	4-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
024	H	H	O	4-F-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
025	H	H	NH	4-F-Ph	H	H
026	H	H	NH	4-F-Ph	H	CH_3
027	H	H	NH	4-F-Ph	H	CH_2CH_3
028	H	H	NH	4-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
029	CH_3	H	NH	4-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
030	H	H	NH	4-F-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
031	H	H	NCH_3	4-F-Ph	H	H
032	H	H	NCH_3	4-F-Ph	H	CH_3
033	H	H	NCH_3	4-F-Ph	H	CH_2CH_3
034	H	H	NCH_3	4-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
035	CH_3	H	NCH_3	4-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
036	H	H	NCH_3	4-F-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
037	H	H	O	4-Cl-Ph	H	H
038	H	H	O	4-Cl-Ph	H	CH_3
039	H	H	O	4-Cl-Ph	H	CH_2CH_3
040	H	H	O	4-Cl-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
041	CH_3	H	O	4-Cl-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
042	H	H	O	4-Cl-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
043	H	H	NH	4-Cl-Ph	H	H
044	H	H	NH	4-Cl-Ph	H	CH_3
045	H	H	NH	4-Cl-Ph	H	CH_2CH_3
046	H	H	NH	4-Cl-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
047	CH_3	H	NH	4-Cl-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
048	H	H	NH	4-Cl-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
049	H	H	NCH_3	4-Cl-Ph	H	H
050	H	H	NCH_3	4-Cl-Ph	H	CH_3
051	H	H	NCH_3	4-Cl-Ph	H	CH_2CH_3
052	H	H	NCH_3	4-Cl-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
053	CH_3	H	NCH_3	4-Cl-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
054	H	H	NCH_3	4-Br-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
055	H	H	O	4-Br-Ph	H	H
056	H	H	O	4-Br-Ph	H	CH_3
057	H	H	O	4-Br-Ph	H	CH_2CH_3
058	H	H	O	4-Br-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
059	CH_3	H	O	4-Br-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
060	H	H	O	4-Br-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$

표 Ac

061	H	H	NH	4-Br-Ph	H	H
062	H	H	NH	4-Br-Ph	H	CH_3
063	H	H	NH	4-Br-Ph	H	CH_2CH_3
064	H	H	NH	4-Br-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
065	CH_3	H	NH	4-Br-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
066	H	H	NH	4-Br-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
067	H	H	NCH_3	4-Br-Ph	H	H
068	H	H	NCH_3	4-Br-Ph	H	CH_3
069	H	H	NCH_3	4-Br-Ph	H	CH_2CH_3
070	H	H	NCH_3	4-Br-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
071	CH_3	H	NCH_3	4-Br-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
072	H	H	NCH_3	4-Br-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
073	H	H	O	4-CH_3-Ph	H	H
074	H	H	O	4-CH_3-Ph	H	CH_3
075	H	H	O	4-CH_3-Ph	H	CH_2CH_3
076	H	H	O	4-CH_3-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
077	CH_3	H	O	4-CH_3-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
078	H	H	O	4-CH_3-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
079	H	H	NH	4-CH_3-Ph	H	H
080	H	H	NH	4-CH_3-Ph	H	CH_3
081	H	H	NH	4-CH_3-Ph	H	CH_2CH_3
082	H	H	NH	4-CH_3-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
083	CH_3	H	NH	4-CH_3-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
084	H	H	NH	4-CH_3-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
085	H	H	NCH_3	4-CH_3-Ph	H	H
086	H	H	NCH_3	4-CH_3-Ph	H	CH_3
087	H	H	NCH_3	4-CH_3-Ph	H	CH_2CH_3
088	H	H	NCH_3	4-CH_3-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
089	CH_3	H	NCH_3	4-CH_3-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
090	H	H	NCH_3	4-CH_3-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
091	H	H	O	4-CH_3CH_2-Ph	H	H
092	H	H	O	4-CH_3CH_2-Ph	H	CH_3
093	H	H	O	4-CH_3CH_2-Ph	H	CH_2CH_3
094	H	H	O	4-CH_3CH_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
095	CH_3	H	O	4-CH_3CH_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
096	H	H	O	4-CH_3CH_2-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
097	H	H	NH	4-CH_3CH_2-Ph	H	H
098	H	H	NH	4-CH_3CH_2-Ph	H	CH_3
099	H	H	NH	4-CH_3CH_2-Ph	H	CH_2CH_3
100	H	H	NH	4-CH_3CH_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
101	CH_3	H	NH	4-CH_3CH_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
102	H	H	NH	4-CH_3CH_2-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$

[0220]

표 Ad

103	H	H	NCH_3	4-CH_3CH_2-Ph	H	H
104	H	H	NCH_3	4-CH_3CH_2-Ph	H	CH_3
105	H	H	NCH_3	4-CH_3CH_2-Ph	H	CH_2CH_3
106	H	H	NCH_3	4-CH_3CH_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
107	CH_3	H	NCH_3	4-CH_3CH_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
108	H	H	NCH_3	4-CH_3CH_2-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
109	H	H	O	4-CF_3-Ph	H	H
110	H	H	O	4-CF_3-Ph	H	CH_3
111	H	H	O	4-CF_3-Ph	H	CH_2CH_3
112	H	H	O	4-CF_3-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
113	CH_3	H	O	4-CF_3-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
114	H	H	O	4-CF_3-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
115	H	H	NH	4-CF_3-Ph	H	H
116	H	H	NH	4-CF_3-Ph	H	CH_3
117	H	H	NH	4-CF_3-Ph	H	CH_2CH_3
118	H	H	NH	4-CF_3-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
119	CH_3	H	NH	4-CF_3-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
120	H	H	NH	4-CF_3-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
121	H	H	NCH_3	4-CF_3-Ph	H	H
122	H	H	NCH_3	4-CF_3-Ph	H	CH_3
123	H	H	NCH_3	4-CF_3-Ph	H	CH_2CH_3
124	H	H	NCH_3	4-CF_3-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
125	CH_3	H	NCH_3	4-CF_3-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
126	H	H	NCH_3	4-CF_3-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
127	H	H	O	4-CH_3O-Ph	H	H
128	H	H	O	4-CH_3O-Ph	H	CH_3
129	H	H	O	4-CH_3O-Ph	H	CH_2CH_3
130	H	H	O	4-CH_3O-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
131	CH_3	H	O	4-CH_3O-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
132	H	H	O	4-CH_3O-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
133	H	H	NH	4-CH_3O-Ph	H	H
134	H	H	NH	4-CH_3O-Ph	H	CH_3
135	H	H	NH	4-CH_3O-Ph	H	CH_2CH_3
136	H	H	NH	4-CH_3O-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
137	CH_3	H	NH	4-CH_3O-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
138	H	H	NH	4-CH_3O-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
139	H	H	NCH_3	4-CH_3O-Ph	H	H
140	H	H	NCH_3	4-CH_3O-Ph	H	CH_3
141	H	H	NCH_3	4-CH_3O-Ph	H	CH_2CH_3
142	H	H	NCH_3	4-CH_3O-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
143	CH_3	H	NCH_3	4-CH_3O-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
144	H	H	NCH_3	4-CH_3O-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$

[0221]

표 Ae

145	H	H	O	4-CF_3O-Ph	H	H
146	H	H	O	4-CF_3O-Ph	H	CH_3
147	H	H	O	4-CF_3O-Ph	H	CH_2CH_3
148	H	H	O	4-CF_3O-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
149	CH_3	H	O	4-CF_3O-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
150	H	H	O	4-CF_3O-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
151	H	H	NH	4-CF_3O-Ph	H	H
152	H	H	NH	4-CF_3O-Ph	H	CH_3
153	H	H	NH	4-CF_3O-Ph	H	CH_2CH_3
154	H	H	NH	4-CF_3O-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
155	CH_3	H	NH	4-CF_3O-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
156	H	H	NH	4-CF_3O-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
157	H	H	NCH_3	4-CF_3O-Ph	H	H
158	H	H	NCH_3	4-CF_3O-Ph	H	CH_3
159	H	H	NCH_3	4-CF_3O-Ph	H	CH_2CH_3
160	H	H	NCH_3	4-CF_3O-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
161	CH_3	H	NCH_3	4-CF_3O-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
162	H	H	NCH_3	4-CF_3O-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
163	H	H	O	3,4-Cl_2-Ph	H	H
164	H	H	O	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_3
165	H	H	O	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_2CH_3
166	H	H	O	3,4-Cl_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
167	CH_3	H	O	3,4-Cl_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
168	H	H	O	3,4-Cl_2-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
169	H	H	NH	3,4-Cl_2-Ph	H	H
170	H	H	NH	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_3
171	H	H	NH	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_2CH_3
172	H	H	NH	3,4-Cl_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
173	CH_3	H	NH	3,4-Cl_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
174	H	H	NH	3,4-Cl_2-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
175	H	H	NCH_3	3,4-Cl_2-Ph	H	H
176	H	H	NCH_3	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_3
177	H	H	NCH_3	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_2CH_3
178	H	H	NCH_3	3,4-Cl_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
179	CH_3	H	NCH_3	3,4-Cl_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
180	H	H	NCH_3	3,4-Cl_2-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
181	H	H	O	3,4-F_2-Ph	H	H
182	H	H	O	3,4-F_2-Ph	H	CH_3
183	H	H	O	3,4-F_2-Ph	H	CH_2CH_3
184	H	H	O	3,4-F_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
185	CH_3	H	O	3,4-F_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
186	H	H	O	3,4-F_2-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$

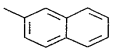
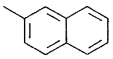
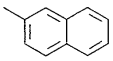
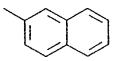
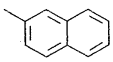
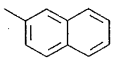
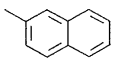
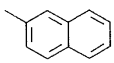
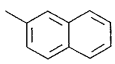
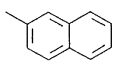
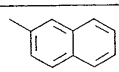
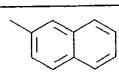
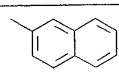
[0222]

표 Af

187	H	H	NH	3,4-F_2-Ph	H	H
188	H	H	NH	3,4-F_2-Ph	H	CH_3
189	H	H	NH	3,4-F_2-Ph	H	CH_2CH_3
190	H	H	NH	3,4-F_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
191	CH_3	H	NH	3,4-F_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
192	H	H	NH	3,4-F_2-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
193	H	H	NCH_3	3,4-F_2-Ph	H	H
194	H	H	NCH_3	3,4-F_2-Ph	H	CH_3
195	H	H	NCH_3	3,4-F_2-Ph	H	CH_2CH_3
196	H	H	NCH_3	3,4-F_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
197	CH_3	H	NCH_3	3,4-F_2-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
198	H	H	NCH_3	3,4-F_2-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
199	H	H	O	3-Cl-4-F-Ph	H	H
200	H	H	O	3-Cl-4-F-Ph	H	CH_3
201	H	H	O	3-Cl-4-F-Ph	H	CH_2CH_3
202	H	H	O	3-Cl-4-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
203	CH_3	H	O	3-Cl-4-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
204	H	H	O	3-Cl-4-F-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
205	H	H	NH	3-Cl-4-F-Ph	H	H
206	H	H	NH	3-Cl-4-F-Ph	H	CH_3
207	H	H	NH	3-Cl-4-F-Ph	H	CH_2CH_3
208	H	H	NH	3-Cl-4-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
209	CH_3	H	NH	3-Cl-4-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
210	H	H	NH	3-Cl-4-F-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
211	H	H	NCH_3	3-Cl-4-F-Ph	H	H
212	H	H	NCH_3	3-Cl-4-F-Ph	H	CH_3
213	H	H	NCH_3	3-Cl-4-F-Ph	H	CH_2CH_3
214	H	H	NCH_3	3-Cl-4-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
215	CH_3	H	NCH_3	3-Cl-4-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
216	H	H	NCH_3	3-Cl-4-F-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
217	H	H	O	4-Cl-3-F-Ph	H	H
218	H	H	O	4-Cl-3-F-Ph	H	CH_3
219	H	H	O	4-Cl-3-F-Ph	H	CH_2CH_3
220	H	H	O	4-Cl-3-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
221	CH_3	H	O	4-Cl-3-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
222	H	H	O	4-Cl-3-F-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
223	H	H	NH	4-Cl-3-F-Ph	H	H
224	H	H	NH	4-Cl-3-F-Ph	H	CH_3
225	H	H	NH	4-Cl-3-F-Ph	H	CH_2CH_3
226	H	H	NH	4-Cl-3-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
227	CH_3	H	NH	4-Cl-3-F-Ph	H	$CH_2C{\equiv}CH$
228	H	H	NH	4-Cl-3-F-Ph	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$

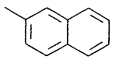
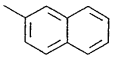
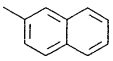
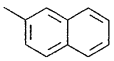
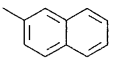
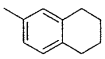
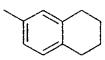
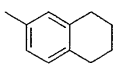
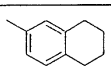
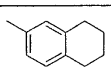
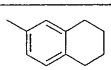
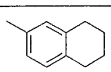
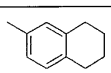
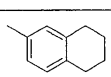
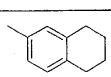
[0223]

표 Ag

229	H	H	NCH_3	4-Cl-3-F-Ph	H	H
230	H	H	NCH_3	4-Cl-3-F-Ph	H	CH_3
231	H	H	NCH_3	4-Cl-3-F-Ph	H	CH_2CH_3
232	H	H	NCH_3	4-Cl-3-F-Ph	H	$CH_2C\equiv CH$
233	CH_3	H	NCH_3	4-Cl-3-F-Ph	H	$CH_2C\equiv CH$
234	H	H	NCH_3	4-Cl-3-F-Ph	CH_3	$CH_2C\equiv CH$
235	H	H	O		H	H
236	H	H	O		H	CH_3
237	H	H	O		H	CH_2CH_3
238	H	H	O		H	$CH_2C\equiv CH$
239	CH_3	H	O		H	$CH_2C\equiv CH$
240	H	H	O		CH_3	$CH_2C\equiv CH$
241	H	H	NH		H	H
242	H	H	NH		H	CH_3
243	H	H	NH		H	CH_2CH_3
244	H	H	NH		H	$CH_2C\equiv CH$
245	CH_3	H	NH		H	$CH_2C\equiv CH$
246	H	H	NH		CH_3	$CH_2C\equiv CH$
247	H	H	NCH_3		H	H

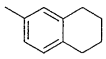
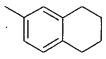
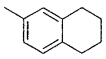
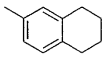
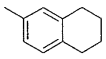
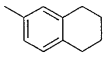
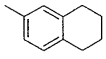
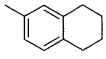
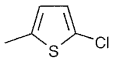
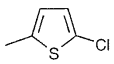
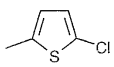
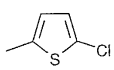
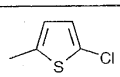
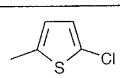
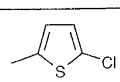
[0224]

표 Ah

248	H	H	NCH_3		H	CH_3
249	H	H	NCH_3		H	CH_2CH_3
250	H	H	NCH_3		H	$CH_2C{\equiv}CH$
251	CH_3	H	NCH_3		H	$CH_2C{\equiv}CH$
252	H	H	NCH_3		CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
253	H	H	O		H	H
254	H	H	O		H	CH_3
255	H	H	O		H	CH_2CH_3
256	H	H	O		H	$CH_2C{\equiv}CH$
257	CH_3	H	O		H	$CH_2C{\equiv}CH$
258	H	H	O		CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
259	H	H	NH		H	H
260	H	H	NH		H	CH_3
261	H	H	NH		H	CH_2CH_3
262	H	H	NH		H	$CH_2C{\equiv}CH$

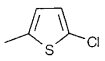
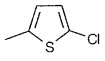
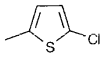
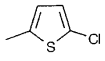
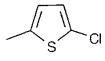
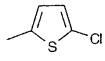
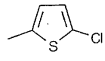
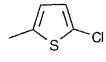
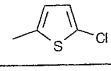
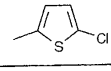
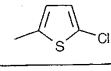
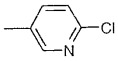
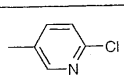
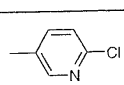
[0225]

표 Ai

253	CH_3	H	NH		H	$CH_2C\equiv CH$
264	H	H	NH		CH_3	$CH_2C\equiv CH$
265	H	H	NCH_3		H	H
266	H	H	NCH_3		H	CH_3
267	H	H	NCH_3		H	CH_2CH_3
268	H	H	NCH_3		H	$CH_2C\equiv CH$
269	CH_3	H	NCH_3		H	$CH_2C\equiv CH$
270	H	H	NCH_3		CH_3	$CH_2C\equiv CH$
271	H	H	O		H	H
272	H	H	O		H	CH_3
273	H	H	O		H	CH_2CH_3
274	H	H	O		H	$CH_2C\equiv CH$
275	CH_3	H	O		H	$CH_2C\equiv CH$
276	H	H	O		CH_3	$CH_2C\equiv CH$
277	H	H	NH		H	H

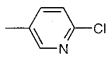
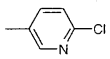
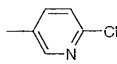
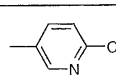
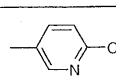
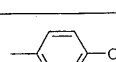
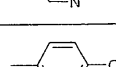
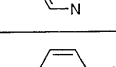
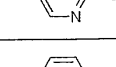
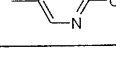
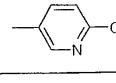
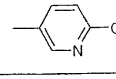
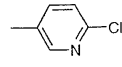
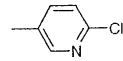
[0226]

표 Aj

278	H	H	NH		H	CH_3
279	H	H	NH		H	CH_2CH_3
280	H	H	NH		H	$CH_2C{\equiv}CH$
281	CH_3	H	NH		H	$CH_2C{\equiv}CH$
282	H	H	NH		CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
283	H	H	NCH_3		H	H
284	H	H	NCH_3		H	CH_3
285	H	H	NCH_3		H	CH_2CH_3
286	H	H	NCH_3		H	$CH_2C{\equiv}CH$
287	CH_3	H	NCH_3		H	$CH_2C{\equiv}CH$
288	H	H	NCH_3		CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
289	H	H	O		H	H
290	H	H	O		H	CH_3
291	H	H	O		H	CH_2CH_3
292	H	H	O		H	$CH_2C{\equiv}CH$

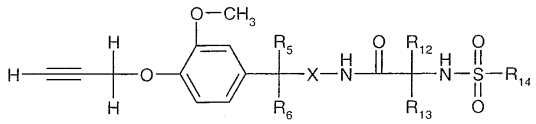
[0227]

표 Ak

293	CH_3	H	O		H	$CH_2C{\equiv}CH$
294	H	H	O		CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
295	H	H	NH		H	H
296	H	H	NH		H	CH_3
297	H	H	NH		H	CH_2CH_3
298	H	H	NH		H	$CH_2C{\equiv}CH$
299	CH_3	H	NH		H	$CH_2C{\equiv}CH$
300	H	H	NH		CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$
301	H	H	NCH_3		H	H
302	H	H	NCH_3		H	CH_3
303	H	H	NCH_3		H	CH_2CH_3
304	H	H	NCH_3		H	$CH_2C{\equiv}CH$
305	CH_3	H	NCH_3		H	$CH_2C{\equiv}CH$
306	H	H	NCH_3		CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$

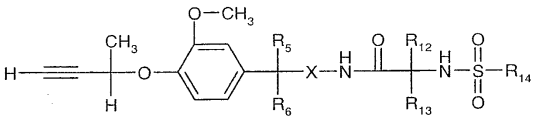
[0228]

[0229] 표 11: 화학식 I.11의 화합물

[0230]  (I.11)

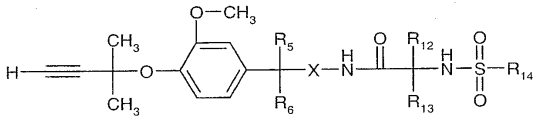
[0231] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0232] 표 12: 화학식 I.12의 화합물

[0233]  (I.12)

[0234] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

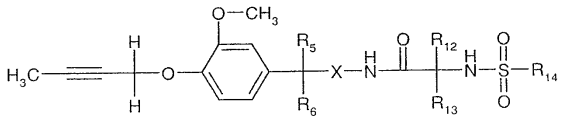
[0235] 표 13: 화학식 I.13의 화합물

[0236] 

(I.13)

[0237] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

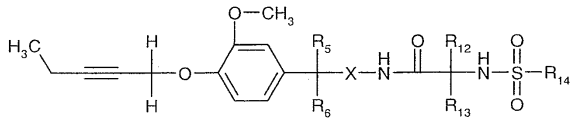
[0238] 표 14: 화학식 I.14의 화합물

[0239] 

(I.14)

[0240] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

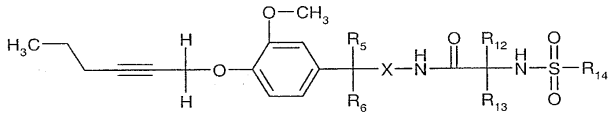
[0241] 표 15: 화학식 I.15의 화합물

[0242] 

(I.15)

[0243] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

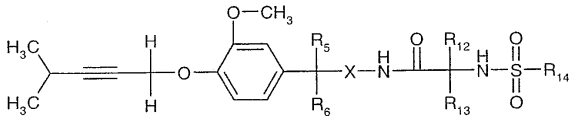
[0244] 표 16: 화학식 I.16의 화합물

[0245] 

(I.16)

[0246] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

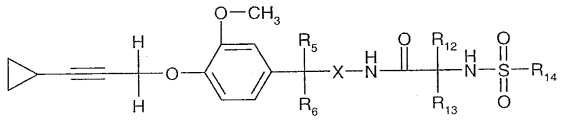
[0247] 표 17: 화학식 I.17의 화합물

[0248] 

(I.17)

[0249] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

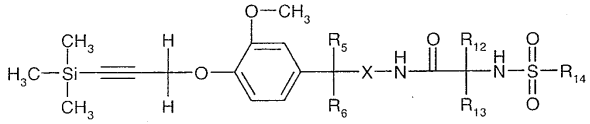
[0250] 표 18: 화학식 I.18의 화합물

[0251] 

(I.18)

[0252] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

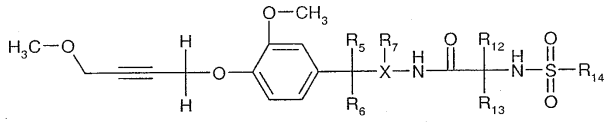
[0253] 표 19: 화학식 I.19의 화합물

[0254] 

(I.19)

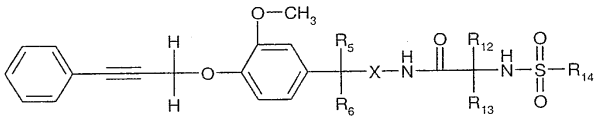
[0255] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0256] 표 20: 화학식 I.20의 화합물

[0257]  (I.20)

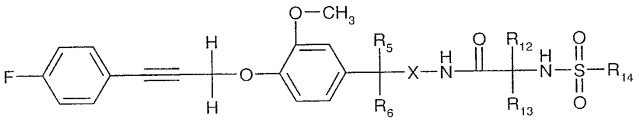
[0258] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0259] 표 21: 화학식 I.21의 화합물

[0260]  (I.21)

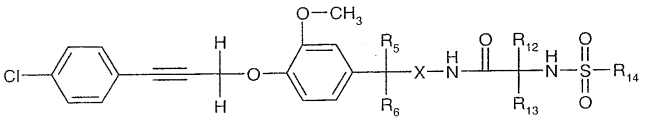
[0261] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0262] 표 22: 화학식 I.22의 화합물

[0263]  (I.22)

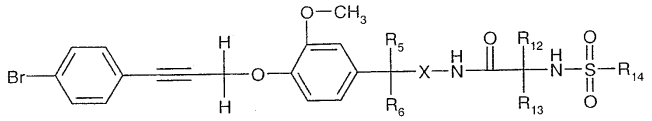
[0264] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0265] 표 23: 화학식 I.23의 화합물

[0266]  (I.23)

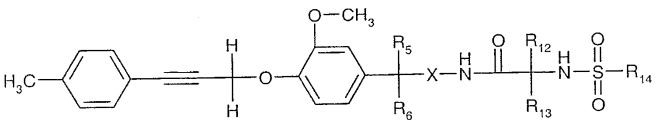
[0267] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0268] 표 24: 화학식 I.24의 화합물

[0269]  (I.24)

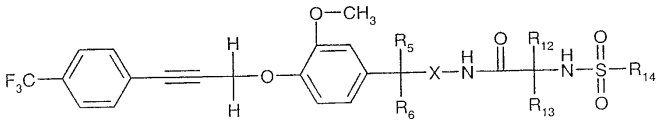
[0270] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0271] 표 25: 화학식 I.25의 화합물

[0272]  (I.25)

[0273] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

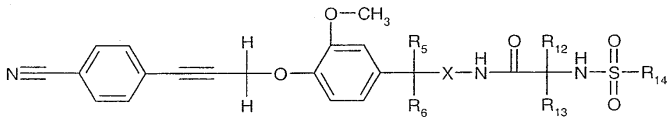
[0274] 표 26: 화학식 I.26의 화합물

[0275] 

(I.26)

[0276] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

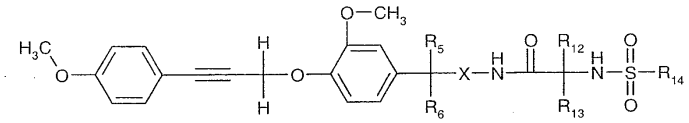
[0277] 표 27: 화학식 I.27의 화합물

[0278] 

(I.27)

[0279] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

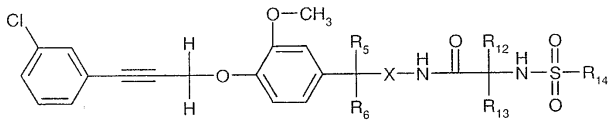
[0280] 표 28: 화학식 I.28의 화합물

[0281] 

(I.28)

[0282] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

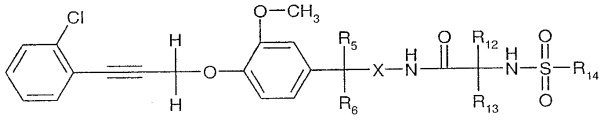
[0283] 표 29: 화학식 I.29의 화합물

[0284] 

(I.29)

[0285] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

[0286] 표 30: 화학식 I.30의 화합물

[0287] 

(I.30)

[0288] 위의 화학식에서, 그룹 R_5, R_6, R_{12}, R_{13}, R_{14} 및 X의 조합은 표 B의 1개의 줄 각각에 상응한다.

표 Ba

(Ph는 페닐이다):

No.	R_5	R_6	X	R_{12}	R_{13}	R_{14}
001	H	H	O	CH_3	H	CH_3
002	H	H	O	CH_3	H	CH_2CH_3
003	H	H	O	CH_3	H	$N(CH_3)_2$
004	CH_3	H	O	CH_3	H	CH_3
005	CH_3	H	O	CH_3	H	CH_2CH_3
006	CH_3	H	O	CH_3	H	$N(CH_3)_2$
007	H	H	NH	CH_3	H	CH_3
008	H	H	NH	CH_3	H	CH_2CH_3
009	H	H	NH	CH_3	H	$N(CH_3)_2$
010	CH_3	H	NH	CH_3	H	CH_3
011	CH_3	H	NH	CH_3	H	CH_2CH_3
012	CH_3	H	NH	CH_3	H	$N(CH_3)_2$
013	H	H	NCH_3	CH_3	H	CH_3
014	H	H	NCH_3	CH_3	H	CH_2CH_3
015	H	H	NCH_3	CH_3	H	$N(CH_3)_2$
016	CH_3	H	NCH_3	CH_3	H	CH_3
017	CH_3	H	NCH_3	CH_3	H	CH_2CH_3
018	CH_3	H	NCH_3	CH_3	H	$N(CH_3)_2$
019	H	H	O	CH_2CH_3	H	CH_3
020	H	H	O	CH_2CH_3	H	CH_2CH_3
021	H	H	O	CH_2CH_3	H	$N(CH_3)_2$
022	CH_3	H	O	CH_2CH_3	H	CH_3
023	CH_3	H	O	CH_2CH_3	H	CH_2CH_3
024	CH_3	H	O	CH_2CH_3	H	$N(CH_3)_2$
025	H	H	NH	CH_2CH_3	H	CH_3
026	H	H	NH	CH_2CH_3	H	CH_2CH_3
027	H	H	NH	CH_2CH_3	H	$N(CH_3)_2$
028	CH_3	H	NH	CH_2CH_3	H	CH_3
029	CH_3	H	NH	CH_2CH_3	H	CH_2CH_3
030	CH_3	H	NH	CH_2CH_3	H	$N(CH_3)_2$
031	H	H	NCH_3	CH_2CH_3	H	CH_3
032	H	H	NCH_3	CH_2CH_3	H	CH_2CH_3
033	H	H	NCH_3	CH_2CH_3	H	$N(CH_3)_2$
034	CH_3	H	NCH_3	CH_2CH_3	H	CH_3
035	CH_3	H	NCH_3	CH_2CH_3	H	CH_2CH_3
036	CH_3	H	NCH_3	CH_2CH_3	H	$N(CH_3)_2$
037	H	H	O	$CH_2CH_2CH_3$	H	CH_3
038	H	H	O	$CH_2CH_2CH_3$	H	CH_2CH_3
039	H	H	O	$CH_2CH_2CH_3$	H	$N(CH_3)_2$

[0289]

표 Bb

040	CH_3	H	O	$CH_2CH_2CH_3$	H	CH_3
041	CH_3	H	O	$CH_2CH_2CH_3$	H	CH_2CH_3
042	CH_3	H	O	$CH_2CH_2CH_3$	H	$N(CH_3)_2$
043	H	H	NH	$CH_2CH_2CH_3$	H	CH_3
044	H	H	NH	$CH_2CH_2CH_3$	H	CH_2CH_3
045	H	H	NH	$CH_2CH_2CH_3$	H	$N(CH_3)_2$
046	CH_3	H	NH	$CH_2CH_2CH_3$	H	CH_3
047	CH_3	H	NH	$CH_2CH_2CH_3$	H	CH_2CH_3
048	CH_3	H	NH	$CH_2CH_2CH_3$	H	$N(CH_3)_2$
049	H	H	NCH_3	$CH_2CH_2CH_3$	H	CH_3
050	H	H	NCH_3	$CH_2CH_2CH_3$	H	CH_2CH_3
051	H	H	NCH_3	$CH_2CH_2CH_3$	H	$N(CH_3)_2$
052	CH_3	H	NCH_3	$CH_2CH_2CH_3$	H	CH_3
053	CH_3	H	NCH_3	$CH_2CH_2CH_3$	H	CH_2CH_3
054	CH_3	H	NCH_3	$CH_2CH_2CH_3$	H	$N(CH_3)_2$
055	H	H	O	$CH(CH_3)_2$	H	CH_3
056	H	H	O	$CH(CH_3)_2$	H	CH_2CH_3
057	H	H	O	$CH(CH_3)_2$	H	$N(CH_3)_2$
058	CH_3	H	O	$CH(CH_3)_2$	H	CH_3
059	CH_3	H	O	$CH(CH_3)_2$	H	CH_2CH_3
060	CH_3	H	O	$CH(CH_3)_2$	H	$N(CH_3)_2$
061	H	H	NH	$CH(CH_3)_2$	H	CH_3
062	H	H	NH	$CH(CH_3)_2$	H	CH_2CH_3
063	H	H	NH	$CH(CH_3)_2$	H	$N(CH_3)_2$
064	CH_3	H	NH	$CH(CH_3)_2$	H	CH_3
065	CH_3	H	NH	$CH(CH_3)_2$	H	CH_2CH_3
066	CH_3	H	NH	$CH(CH_3)_2$	H	$N(CH_3)_2$
067	H	H	NCH_3	$CH(CH_3)_2$	H	CH_3
068	H	H	NCH_3	$CH(CH_3)_2$	H	CH_2CH_3
069	H	H	NCH_3	$CH(CH_3)_2$	H	$N(CH_3)_2$
070	CH_3	H	NCH_3	$CH(CH_3)_2$	H	CH_3
071	CH_3	H	NCH_3	$CH(CH_3)_2$	H	CH_2CH_3
072	CH_3	H	NCH_3	$CH(CH_3)_2$	H	$N(CH_3)_2$
073	H	H	O	C_3H_5-cycl	H	CH_3
074	H	H	O	C_3H_5-cycl	H	CH_2CH_3
075	H	H	O	C_3H_5-cycl	H	$N(CH_3)_2$
076	CH_3	H	O	C_3H_5-cycl	H	CH_3
077	CH_3	H	O	C_3H_5-cycl	H	CH_2CH_3
078	CH_3	H	O	C_3H_5-cycl	H	$N(CH_3)_2$
079	H	H	NH	C_3H_5-cycl	H	CH_3
080	H	H	NH	C_3H_5-cycl	H	CH_2CH_3
081	H	H	NH	C_3H_5-cycl	H	$N(CH_3)_2$
082	CH_3	H	NH	C_3H_5-cycl	H	CH_3

[0290]

표 Bc

[0291]

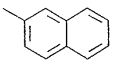
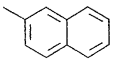
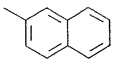
083	CH_3	H	NH	C_3H_5-cycl	H	CH_2CH_3
084	CH_3	H	NH	C_3H_5-cycl	H	$N(CH_3)_2$
085	H	H	NCH_3	C_3H_5-cycl	H	CH_3
086	H	H	NCH_3	C_3H_5-cycl	H	CH_2CH_3
087	H	H	NCH_3	C_3H_5-cycl	H	$N(CH_3)_2$
088	CH_3	H	NCH_3	C_3H_5-cycl	H	CH_3
089	CH_3	H	NCH_3	C_3H_5-cycl	H	CH_2CH_3
090	CH_3	H	NCH_3	C_3H_5-cycl	H	$N(CH_3)_2$
091	H	H	O	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	CH_3
092	H	H	O	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	CH_2CH_3
093	H	H	O	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	$N(CH_3)_2$
094	CH_3	H	O	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	CH_3
095	CH_3	H	O	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	CH_2CH_3
096	CH_3	H	O	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	$N(CH_3)_2$
097	H	H	NH	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	CH_3
098	H	H	NH	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	CH_2CH_3
099	H	H	NH	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	$N(CH_3)_2$
100	CH_3	H	NH	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	CH_3
101	CH_3	H	NH	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	CH_2CH_3
102	CH_3	H	NH	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	$N(CH_3)_2$
103	H	H	NCH_3	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	CH_3
104	H	H	NCH_3	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	CH_2CH_3
105	H	H	NCH_3	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	$N(CH_3)_2$
106	CH_3	H	NCH_3	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	CH_3
107	CH_3	H	NCH_3	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	CH_2CH_3
108	CH_3	H	NCH_3	$CHCH_3(CH_2CH_3)$	H	$N(CH_3)_2$
109	H	H	O	Ph	H	CH_3
110	H	H	O	Ph	H	CH_2CH_3
111	H	H	O	Ph	H	$N(CH_3)_2$
112	CH_3	H	O	Ph	H	CH_3
113	CH_3	H	O	Ph	H	CH_2CH_3
114	CH_3	H	O	Ph	H	$N(CH_3)_2$
115	H	H	NH	Ph	H	CH_3
116	H	H	NH	Ph	H	CH_2CH_3
117	H	H	NH	Ph	H	$N(CH_3)_2$
118	CH_3	H	NH	Ph	H	CH_3
119	CH_3	H	NH	Ph	H	CH_2CH_3
120	CH_3	H	NH	Ph	H	$N(CH_3)_2$
121	H	H	NCH_3	Ph	H	CH_3
122	H	H	NCH_3	Ph	H	CH_2CH_3
123	H	H	NCH_3	Ph	H	$N(CH_3)_2$
124	CH_3	H	NCH_3	Ph	H	CH_3

표 Bd

[0292]

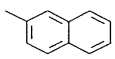
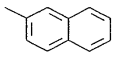
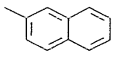
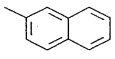
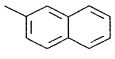
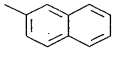
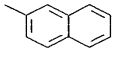
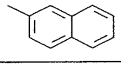
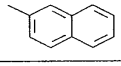
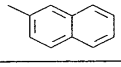
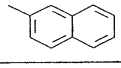
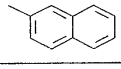
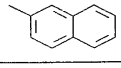
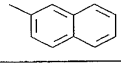
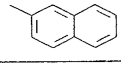
125	CH_3	H	NCH_3	Ph	H	CH_2CH_3
126	CH_3	H	NCH_3	Ph	H	$N(CH_3)_2$
127	H	H	O	4-CH_3-Ph	H	CH_3
128	H	H	O	4-CH_3-Ph	H	CH_2CH_3
129	H	H	O	4-CH_3-Ph	H	$N(CH_3)_2$
130	CH_3	H	O	4-CH_3-Ph	H	CH_3
131	CH_3	H	O	4-CH_3-Ph	H	CH_2CH_3
132	CH_3	H	O	4-CH_3-Ph	H	$N(CH_3)_2$
133	H	H	NH	4-CH_3-Ph	H	CH_3
134	H	H	NH	4-CH_3-Ph	H	CH_2CH_3
135	H	H	NH	4-CH_3-Ph	H	$N(CH_3)_2$
136	CH_3	H	NH	4-CH_3-Ph	H	CH_3
137	CH_3	H	NH	4-CH_3-Ph	H	CH_2CH_3
138	CH_3	H	NH	4-CH_3-Ph	H	$N(CH_3)_2$
139	H	H	NCH_3	4-CH_3-Ph	H	CH_3
140	H	H	NCH_3	4-CH_3-Ph	H	CH_2CH_3
141	H	H	NCH_3	4-CH_3-Ph	H	$N(CH_3)_2$
142	CH_3	H	NCH_3	4-CH_3-Ph	H	CH_3
143	CH_3	H	NCH_3	4-CH_3-Ph	H	CH_2CH_3
144	CH_3	H	NCH_3	4-CH_3-Ph	H	$N(CH_3)_2$
145	H	H	O	4-Br-Ph	H	CH_3
146	H	H	O	4-Br-Ph	H	CH_2CH_3
147	H	H	O	4-Br-Ph	H	$N(CH_3)_2$
148	CH_3	H	O	4-Br-Ph	H	CH_3
149	CH_3	H	O	4-Br-Ph	H	CH_2CH_3
150	CH_3	H	O	4-Br-Ph	H	$N(CH_3)_2$
151	H	H	NH	4-Br-Ph	H	CH_3
152	H	H	NH	4-Br-Ph	H	CH_2CH_3
153	H	H	NH	4-Br-Ph	H	$N(CH_3)_2$
154	CH_3	H	NH	4-Br-Ph	H	CH_3
155	CH_3	H	NH	4-Br-Ph	H	CH_2CH_3
156	CH_3	H	NH	4-Br-Ph	H	$N(CH_3)_2$
157	H	H	NCH_3	4-Br-Ph	H	CH_3
158	H	H	NCH_3	4-Br-Ph	H	CH_2CH_3
159	H	H	NCH_3	4-Br-Ph	H	$N(CH_3)_2$
160	CH_3	H	NCH_3	4-Br-Ph	H	CH_3
161	CH_3	H	NCH_3	4-Br-Ph	H	CH_2CH_3
162	CH_3	H	NCH_3	4-Br-Ph	H	$N(CH_3)_2$
163	H	H	O	4-Cl-Ph	H	CH_3
164	H	H	O	4-Cl-Ph	H	CH_2CH_3
165	H	H	O	4-Cl-Ph	H	$N(CH_3)_2$
166	CH_3	H	O	4-Cl-Ph	H	CH_3

표 Be

167	CH_3	H	O	4-Cl-Ph	H	CH_2CH_3
168	CH_3	H	O	4-Cl-Ph	H	$N(CH_3)_2$
169	H	H	NH	4-Cl-Ph	H	CH_3
170	H	H	NH	4-Cl-Ph	H	CH_2CH_3
171	H	H	NH	4-Cl-Ph	H	$N(CH_3)_2$
172	CH_3	H	NH	4-Cl-Ph	H	CH_3
173	CH_3	H	NH	4-Cl-Ph	H	CH_2CH_3
174	CH_3	H	NH	4-Cl-Ph	H	$N(CH_3)_2$
175	H	H	NCH_3	4-Cl-Ph	H	CH_3
176	H	H	NCH_3	4-Cl-Ph	H	CH_2CH_3
177	H	H	NCH_3	4-Cl-Ph	H	$N(CH_3)_2$
178	CH_3	H	NCH_3	4-Cl-Ph	H	CH_3
179	CH_3	H	NCH_3	4-Cl-Ph	H	CH_2CH_3
180	CH_3	H	NCH_3	4-Cl-Ph	H	$N(CH_3)_2$
181	H	H	O	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_3
182	H	H	O	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_2CH_3
183	H	H	O	3,4-Cl_2-Ph	H	$N(CH_3)_2$
184	CH_3	H	O	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_3
185	CH_3	H	O	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_2CH_3
186	CH_3	H	O	3,4-Cl_2-Ph	H	$N(CH_3)_2$
187	H	H	NH	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_3
188	H	H	NH	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_2CH_3
189	H	H	NH	3,4-Cl_2-Ph	H	$N(CH_3)_2$
190	CH_3	H	NH	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_3
191	CH_3	H	NH	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_2CH_3
192	CH_3	H	NH	3,4-Cl_2-Ph	H	$N(CH_3)_2$
193	H	H	NCH_3	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_3
194	H	H	NCH_3	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_2CH_3
195	H	H	NCH_3	3,4-Cl_2-Ph	H	$N(CH_3)_2$
196	CH_3	H	NCH_3	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_3
197	CH_3	H	NCH_3	3,4-Cl_2-Ph	H	CH_2CH_3
198	CH_3	H	NCH_3	3,4-Cl_2-Ph	H	$N(CH_3)_2$
199	H	H	O		H	CH_3
200	H	H	O		H	CH_2CH_3
201	H	H	O		H	$N(CH_3)_2$

[0293]

표 Bf

202	CH_3	H	O		H	CH_3
203	CH_3	H	O		H	CH_2CH_3
204	CH_3	H	O		H	$N(CH_3)_2$
205	H	H	NH		H	CH_3
206	H	H	NH		H	CH_2CH_3
207	H	H	NH		H	$N(CH_3)_2$
208	CH_3	H	NH		H	CH_3
209	CH_3	H	NH		H	CH_2CH_3
210	CH_3	H	NH		H	$N(CH_3)_2$
211	H	H	NCH_3		H	CH_3
212	H	H	NCH_3		H	CH_2CH_3
213	H	H	NCH_3		H	$N(CH_3)_2$
214	CH_3	H	NCH_3		H	CH_3
215	CH_3	H	NCH_3		H	CH_2CH_3
216	CH_3	H	NCH_3		H	$N(CH_3)_2$

[0294]

[0295] 제형은, 모든 유용한 목적을 위해 이의 전문이 참고로 인용된, 예를 들면, 국제 공개공보 제WO 95/30651호에 기재된 바와 유사하게 제조할 수 있다.

[0296] 생물학적 실시예

[0297] D-1: 덩쿨 상의 플라스모파라 비티콜라(*Plasmopara viticola*)(노균병)에 대한 작용

[0298] 5주생 포도 묘목 구테델(Getedel)을 분무실에서 제형화된 시험 화합물로 처리한다. 적용 1일 후, 포자낭 현탁액(sporangia suspension)(4 $\times 10^4$ 포자낭/ml)을 시험 식물의 보다 낮은 잎 쪽에 분무시켜 포도 식물에 접종한다. 온실에서 95% 상대 습도 및 +21℃에서 6일 동안 배양한 후, 질병 발생을 평가한다.

[0299] 표 1 내지 30의 화합물은 덩쿨 상의 플라스모파라 비티콜라에 대해 우수한 살진균 작용을 나타낸다. 화합물 1.004, 1.040, 5.004, 5.037, 5.040, 5.091, 23.055 및 23.056은 200ppm에서 당해 시험에서 진균류 감염을 80% 이상 억제시키며, 동일한 조건하에 처리되지 않은 대조군 식물은 식물병원성 진균류에 의해 80% 초과 감염된 것으로 나타났다.

[0300] D-2: 토마토 식물 상의 피토프토라(역병)에 대한 작용

[0301] 3주생 토마토 식물 로터 그놈(Roter Gnom)을 분무실에서 제형화된 시험 화합물로 처리한다. 적용 2일 후, 포자낭 현탁액(2 $\times 10^4$ 포자낭/ml)을 시험 식물에 분무시켜 식물을 접종한다. 성장실에서 95% 상대 습도 및 +18℃에

서 4일 동안 배양한 후, 질병 발생을 평가한다.

[0302] 표 1 내지 30의 화합물은 진균류 감염에 대한 우수한 장기 지속 효과를 나타낸다. 화합물 1.004, 1.040, 1.055, 1.091, 5.004, 5.037, 5.040, 5.055, 5.091, 5.163, 23.055, 23.056 및 23.057은 200ppm에서 당해 시험에서 진균류 감염을 80% 이상 억제시키며, 동일한 조건하에 처리되지 않은 대조군 식물은 식물병원성 진균류에 의해 80% 초과 감염된 것으로 나타났다.

[0303] D-3: 감자 식물 상의 피토프토라(역병)에 대한 작용

[0304] 5주생 감자 식물(Bintje 변종)을 분무실에서 제형화된 시험 화합물로 처리한다. 적용 2일 후, 포자낭 현탁액(14×10^4 포자낭/ml)을 시험 식물에 분무시켜 식물을 접종한다. 성장실에서 95% 상대 습도 및 +18℃에서 4일 동안 배양한 후, 질병 발생을 평가한다.

[0305] 표 1 내지 30의 화합물을 사용하여 진균류 감염을 효과적으로 억제한다. 화합물 1.040, 5.004, 5.040 및 23.055는 200ppm에서 당해 시험에서 진균류 감염을 80% 이상 억제시키며, 동일한 조건하에 처리되지 않은 대조군 식물은 식물병원성 진균류에 의해 80% 초과 감염된 것으로 나타났다.