



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2022-0070430
(43) 공개일자 2022년05월31일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
C07D 409/04 (2006.01) A01N 43/58 (2006.01)
(52) CPC특허분류
C07D 409/04 (2013.01)
A01N 43/58 (2013.01)
(21) 출원번호 10-2022-7007869
(22) 출원일자(국제) 2022년09월23일
심사청구일자 없음
(85) 번역문제출일자 2022년03월08일
(86) 국제출원번호 PCT/JP2020/035682
(87) 국제공개번호 WO 2021/060236
국제공개일자 2021년04월01일
(30) 우선권주장
JP-P-2019-174532 2019년09월25일 일본(JP)

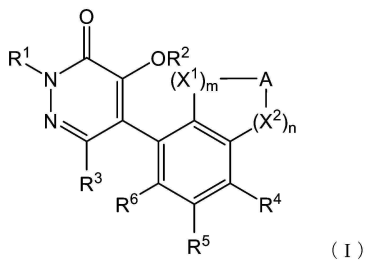
(71) 출원인
닛뽕소다 가부시키키가이샤
일본 도쿄도 지요다구 오테마찌 2초메 2방 1고
(72) 발명자
미하라 켄
(250-0280) 일본국 가나가와켄 오다와라시 다카다
345 닛뽕소다 가부시키키가이샤 오다와라 연구소 내
이케다 요지
(250-0280) 일본국 가나가와켄 오다와라시 다카다
345 닛뽕소다 가부시키키가이샤 오다와라 연구소 내
(뒷면에 계속)
(74) 대리인
정영선

전체 청구항 수 : 총 3 항

(54) 발명의 명칭 피리다진 화합물 및 제조제

(57) 요약

식 (I)로 나타내는 화합물 또는 그의 염, 및 이들로부터 선택되는 적어도 하나를 유효 성분으로서 함유하는 제조제에 관한 것이다. 식 (I) 중, R¹은 치환 또는 무치환 C1~6 알킬기 등, R²는 H, 치환 또는 무치환 C1~6 알킬기 등, R³은 H, 치환 또는 무치환 C1~6 알킬기 등, R⁴는 할로게노기, 치환 또는 무치환 C1~6 알킬기 등, R⁵는 수소 원자 또는 할로게노기, R⁶은 H 또는 할로게노기, A는 치환 또는 무치환 C1~4 알킬렌기, 치환 또는 무치환 C2~3 알케닐렌기, 또는 치환 또는 무치환 C1~2 알킬렌옥시 C1~2 알킬렌기, X¹은 O 또는 설폰닐기, X²는 산소 원자, 설페닐기 등, m은 0 또는 1, n은 0 또는 1을 나타내고, 또한 m+n=1 또는 2이며, 또한 A가 치환 또는 무치환 메틸렌기인 경우, m+n=2이다.



(72) 발명자

다키 유키나

(250-0280) 일본국 가나가와켄 오다와라시 다카다
345 닛뵙소다 가부시키키가이샤 오다와라 연구소 내

가토 카즈시게

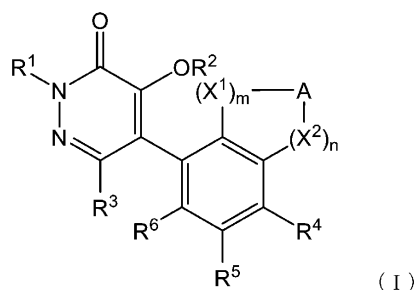
(250-0280) 일본국 가나가와켄 오다와라시 다카다
345 닛뵙소다 가부시키키가이샤 오다와라 연구소 내

명세서

청구범위

청구항 1

식 (I)로 나타내는 화합물 또는 그의 염:



식 (I) 중,

R^1 은 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알킬닐기, 또는 치환 또는 무치환의 C3~6 시클로알킬기를 나타내고,

R^2 는 수소 원자, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알킬닐기, R^a -CO-로 나타내는 기, R^a O-CO-로 나타내는 기, R^a NH-CO-로 나타내는 기, R^a N-CO-로 나타내는 기, R^a -SO₂-로 나타내는 기, R^a -CO-O-CR^b₂-로 나타내는 기, 또는 R^a O-CO-O-CR^b₂-로 나타내는 기를 나타내며,

R^a 는 각각 독립적으로, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알킬닐기, 치환 또는 무치환의 C3~6 시클로알킬기, 치환 또는 무치환의 페닐기, 치환 또는 무치환의 나프틸기, 또는 치환 또는 무치환의 5~6원 헤테로시클릴기를 나타내고,

R^b 는 각각 독립적으로, 수소 원자 또는 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기를 나타내며,

R^3 은 수소 원자, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알킬닐기, 또는 치환 또는 무치환의 C3~6 시클로알킬기를 나타내고,

R^4 는 할로게노기, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C1~6 알콕시기, 치환 또는 무치환의 페닐기, 치환 또는 무치환의 나프틸기, 치환 또는 무치환의 5~6원 헤테로아릴기, 또는 시아노기를 나타내며,

R^5 는 수소 원자 또는 할로게노기를 나타내고,

R^6 은 수소 원자 또는 할로게노기를 나타내며,

A는 치환 또는 무치환의 C1~4 알킬렌기, 치환 또는 무치환의 C2~3 알케닐렌기, 또는 치환 또는 무치환의 C1~2 알킬렌옥시 C1~2 알킬렌기를 나타내고,

X^1 은 산소 원자 또는 설포닐기를 나타내며,

X^2 는 산소 원자, 설페닐기, 설피닐기, 설포닐기, -S(=NR^c)-로 나타내는 기, 또는 -S(=O)(=NR^c)-로 나타내는 기를 나타내고,

R^c 는 각각 독립적으로, 수소 원자, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 페닐기, 치환 또는 무치환의 나프틸기, 또는 시아노기를 나타내며,

m은 0 또는 1을 나타내고, n은 0 또는 1을 나타내며, 또한

m과 n의 합은 1 또는 2이고, 또한 A가 치환 또는 무치환의 메틸렌기인 경우, m과 n의 합은 2이다.

청구항 2

제 1 항의 화합물 및 그의 염으로 이루어지는 군으로부터 선택되는 적어도 하나를 유효 성분으로서 함유하는 제초제.

청구항 3

유용 식물에 있어서의 단자엽류 및/또는 쌍자엽류의 잡초를 방제하는 방법으로서, 제 1 항의 화합물 또는 그의 염, 또는 상기 화합물을 함유하는 제초제를, 상기 잡초 및/또는 상기 식물 및/또는 그의 자리에 사용하는 공정을 포함하는 방법.

발명의 설명

기술 분야

[0001] 본 발명은 피리다진 화합물 및 이를 유효 성분으로서 함유하는 제초제에 관한 것이다.

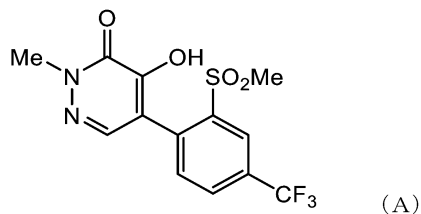
[0002] 본원은 2019년 9월 25일에 일본에 출원된 일본 특허출원 2019-174532호에 기초하여 우선권을 주장하고, 그 내용을 여기에 원용한다.

배경 기술

[0003] 농원에 작물의 재배에 있어서, 잡초의 방제를 위해, 제초제를 사용하는 경우가 있다. 제초제의 유효 성분으로서 지금까지 다양한 화합물이 제안되어 있다.

[0004] 예를 들면, 특허문헌 1은 식 (A)로 나타내는 피리다진 화합물 등을 개시하고 있다.

화학식 1



[0005]

선행기술문헌

특허문헌

[0006] (특허문헌 0001) W02013/050421

발명의 내용

해결하려는 과제

[0007] 제초제는 잡초의 방제 효과가 우수할 뿐만 아니라, 작물에 대해 약해가 적을 것, 환경에 잔류되기 어려우며, 또한 환경을 오염시키지 않을 것 등이 요구된다.

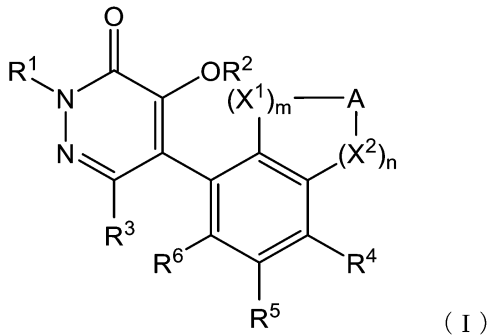
[0008] 본 발명의 과제는 저약량으로도 확실한 잡초 방제 효과를 나타내고, 작물에 대한 약해가 적으며, 또한 환경에 대한 안전성이 높은, 제초제의 유효 성분으로서 유용한 신규 피리다진 화합물 및 제초제를 제공하는 것이다.

과제의 해결 수단

[0009] 상기 과제를 달성하기 위해 검토한 결과, 이하의 형태를 포함하는 본 발명을 완성하기에 이르렀다.

[0010] [1] 식 (I)로 나타내는 화합물 또는 그의 염.

화학식 2



[0011]

[0012] 식 (I) 중,

[0013] R^1 은 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알키닐기, 또는 치환 또는 무치환의 C3~6 시클로알킬기를 나타내고,

[0014] R^2 는 수소 원자, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알키닐기, R^a -CO-로 나타내는 기, R^a O-CO-로 나타내는 기, R^a NH-CO-로 나타내는 기, R^a N-CO-로 나타내는 기, R^a -SO₂-로 나타내는 기, R^a -CO-O-CR₂^b-로 나타내는 기, 또는 R^a O-CO-O-CR₂^b-로 나타내는 기를 나타내며,

[0015] R^a 는 각각 독립적으로, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알키닐기, 치환 또는 무치환의 C3~6 시클로알킬기, 치환 또는 무치환의 페닐기, 치환 또는 무치환의 나프틸기, 또는 치환 또는 무치환의 5~6원 헤테로시클릴기를 나타내고,

[0016] R^b 는 각각 독립적으로, 수소 원자 또는 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기를 나타내며,

[0017] R^3 은 수소 원자, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알키닐기, 또는 치환 또는 무치환의 C3~6 시클로알킬기를 나타내고,

[0018] R^4 는 할로게노기, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C1~6 알콕시기, 치환 또는 무치환의 페닐기, 치환 또는 무치환의 나프틸기, 치환 또는 무치환의 5~6원 헤테로아릴기, 또는 시아노기를 나타내며,

[0019] R^5 는 수소 원자 또는 할로게노기를 나타내고,

[0020] R^6 은 수소 원자 또는 할로게노기를 나타내며,

[0021] A는 치환 또는 무치환의 C1~4 알킬렌기, 치환 또는 무치환의 C2~3 알케닐렌기, 또는 치환 또는 무치환의 C1~2 알킬렌옥시 C1~C2 알킬렌기를 나타내고,

[0022] X^1 은 산소 원자 또는 설포닐기를 나타내며,

[0023] X^2 는 산소 원자, 설페닐기, 설피닐기, 설포닐기, -S(=NR^c)-로 나타내는 기, 또는 -S(=O)(=NR^c)-로 나타내는 기를 나타내고,

[0024] R^c 는 각각 독립적으로, 수소 원자, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 페닐기, 치환 또는 무치환의 나프틸기, 또는 시아노기를 나타내며,

- [0025] m은 0 또는 1을 나타내고, n은 0 또는 1을 나타내며, 또한,
- [0026] m과 n의 합은 1 또는 2이고, 또한 A가 치환 또는 무치환의 메틸렌기인 경우, m과 n의 합은 2이다.
- [0027] [2] 상기 [1]에 기재된 화합물 및 그의 염으로 이루어지는 군으로부터 선택되는 적어도 하나를 유효 성분으로서 함유하는 제초제.
- [0028] [3] 유용 식물에 있어서의 단자엽류 및/또는 쌍자엽류의 잡초를 방제하는 방법으로서, 상기 [1]에 기재된 화합물 또는 그의 염, 또는 상기 화합물을 함유하는 제초제를, 상기 잡초 및/또는 상기 식물 및/또는 그의 자리에 사용하는 공정을 포함하는 방법.

발명의 효과

- [0029] 본 발명의 피리다진 화합물은, 저약량으로도 확실한 잡초 방제 효과를 나타내고, 작물에 대한 약해가 적으며, 또한 환경에 대한 안전성이 높기 때문에, 제초제의 유효 성분으로서 유용하다. 본 발명의 제초제는 농원에 작물의 재배에 있어서, 잡초의 방제를 위해 안심하고 사용할 수 있다.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

- [0030] 본 발명의 피리다진 화합물(이하, 간단히 하기 위해 「본 발명 화합물」이라고 하는 경우가 있다)은, 식 (I)로 나타내는 화합물(화합물 (I)라고 하는 경우가 있다) 또는 화합물 (I)의 염이다. 화합물 (I)은, 수화물, 각종 용매화물, 결정다형 등도 포함된다. 화합물 (I)은, 부제 탄소, 이중 결합 등에 기초하는 입체이성체나, 호변이성체가 존재할 수 있다. 이러한 이성체 및 이들의 혼합물은 모두 본 발명의 기술적 범위에 포함된다.
- [0031] 본 명세서에 있어서 사용되는 「무치환(unsubstituted)」의 용어는, 모핵이 되는 기반인 것을 의미한다. 「치환」이라는 기체가 없고 모핵이 되는 기의 명칭만으로 기재하고 있을 때는, 특별한 사정이 없는 한 「무치환」의 의미이다.
- [0032] 한편, 「치환(substituted)」의 용어는, 모핵이 되는 기 중 어느 하나의 수소 원자가, 모핵과 동일 또는 상이한 구조의 기(치환기)로 치환되어 있는 것을 의미한다. 따라서, 「치환기」는, 모핵이 되는 기에 결합한 다른 기이다. 치환기는 1개여도 되고, 2개 이상이어도 된다. 2개 이상의 치환기는 동일해도 되고, 상이해도 된다.
- [0033] 「C1~6」 등의 용어는, 모핵이 되는 기의 탄소 원자수가 1~6개 중인 것을 나타내고 있다. 이 탄소 원자수에는, 치환기 중에 있는 탄소 원자의 수를 포함하지 않는다. 예를 들면, 치환기로서 에톡시기를 갖는 부틸기는, C2 알콕시 C4 알킬기로 분류한다.
- [0034] 「치환기」는 화학적으로 허용되고, 본 발명의 효과를 갖는 한에 있어서 특별히 제한되지 않는다. 이하에 「치환기」가 될 수 있는 기를 예시한다.
- [0035] 메틸기, 에틸기, n-프로필기, i-프로필기, n-부틸기, s-부틸기, i-부틸기, t-부틸기, n-펜틸기, n-헥실기 등의 C1~6 알킬기;
- [0036] 비닐기, 1-프로페닐기, 2-프로페닐기(알릴기), 1-부테닐기, 2-부테닐기, 3-부테닐기, 1-메틸-2-프로페닐기, 2-메틸-2-프로페닐기 등의 C2~6 알케닐기;
- [0037] 에티닐기, 1-프로피닐기, 2-프로피닐기, 1-부티닐기, 2-부티닐기, 3-부티닐기, 1-메틸-2-프로피닐기 등의 C2~6 알키닐기;
- [0038] 시클로프로필기, 시클로부틸기, 시클로펜틸기, 시클로헥실기 등의 C3~6 시클로알킬기;
- [0039] 페닐기, 나프틸기;
- [0040] 벤질기, 페네틸기 등의 페닐 C1~6 알킬기;
- [0041] 3~6원 헤테로시클릴기;
- [0042] 3~6원 헤테로시클릴 C1~6 알킬기;
- [0043] 수산기;
- [0044] 메톡시기, 에톡시기, n-프로폭시기, i-프로폭시기, n-부톡시기, s-부톡시기, i-부톡시기, t-부톡시기 등의 C1~6 알콕시기;

- [0045] 비닐옥시기, 알릴옥시기, 프로페닐옥시기, 부테닐옥시기 등의 C2~6 알케닐옥시기;
- [0046] 에틸닐옥시기, 프로파르길옥시기 등의 C2~6 알킬닐옥시기;
- [0047] 페녹시기, 나프톡시기;
- [0048] 벤질옥시기, 페네틸옥시기 등의 페닐 C1~6 알콕시기;
- [0049] 티아졸릴옥시기, 피리딜옥시기 등의 5~6원 헤테로아릴옥시기;
- [0050] 티아졸릴메틸옥시기, 피리딜메틸옥시기 등의 5~6원 헤테로아릴 C1~6 알킬옥시기;
- [0051] 포르밀기;
- [0052] 아세틸기, 프로피오닐기 등의 C1~6 알킬카르보닐기;
- [0053] 포르밀옥시기;
- [0054] 아세틸옥시기, 프로피오닐옥시기 등의 C1~6 알킬카르보닐옥시기;
- [0055] 벤조일기;
- [0056] 메톡시카르보닐기, 에톡시카르보닐기, n-프로폭시카르보닐기, i-프로폭시카르보닐기, n-부톡시카르보닐기, t-부톡시카르보닐기 등의 C1~6 알콕시카르보닐기;
- [0057] 메톡시카르보닐옥시기, 에톡시카르보닐옥시기, n-프로폭시카르보닐옥시기, i-프로폭시카르보닐옥시기, n-부톡시카르보닐옥시기, t-부톡시카르보닐옥시기 등의 C1~6 알콕시카르보닐옥시기;
- [0058] 카르복실기;
- [0059] 플루오로기, 클로로기, 브로모기, 요오드기 등의 할로게노기;
- [0060] 클로로메틸기, 클로로에틸기, 트리플루오로메틸기, 1,2-디클로로-n-프로필기, 2,2,2-트리플루오로에틸기, 1-플루오로-n-부틸기 등의 C1~6 할로알킬기;
- [0061] 2-클로로-1-프로페닐기, 2-플루오로-1-부테닐기 등의 C2~6 할로알케닐기;
- [0062] 4,4-디클로로-1-부티닐기, 4-플루오로-1-펜티닐기, 5-브로모-2-펜티닐기 등의 C2~6 할로알킬기;
- [0063] 트리플루오로메톡시기, 2,2,2-트리플루오로에톡시기, 2,3-디클로로부톡시기 등의 C1~6 할로알콕시기;
- [0064] 2-클로로프로페닐옥시기, 3-브로모부테닐옥시기 등의 C2~6 할로알케닐옥시기;
- [0065] 클로로아세틸기, 트리플루오로아세틸기, 트리클로로아세틸기 등의 C1~6 할로알킬카르보닐기;
- [0066] 아미노기;
- [0067] 메틸아미노기, 디메틸아미노기, 디에틸아미노기 등의 C1~6 알킬 치환 아미노기;
- [0068] 아닐리노기, 나프틸아미노기;
- [0069] 벤질아미노기, 페네틸아미노기 등의 페닐 C1~6 알킬아미노기;
- [0070] 포르밀아미노기;
- [0071] 아세틸아미노기, 프로파노일아미노기, 부티릴아미노기, i-프로필카르보닐아미노기 등의 C1~6 알킬카르보닐아미노기;
- [0072] 메톡시카르보닐아미노기, 에톡시카르보닐아미노기, n-프로폭시카르보닐아미노기, i-프로폭시카르보닐아미노기 등의 C1~6 알콕시카르보닐아미노기;
- [0073] 아미노카르보닐기, 디메틸아미노카르보닐기, 페닐아미노카르보닐기, N-페닐-N-메틸아미노카르보닐기 등의 무치환 또는 치환기를 갖는 아미노카르보닐기;
- [0074] 이미노메틸기, (1-이미노)에틸기, (1-이미노)-n-프로필기 등의 이미노 C1~6 알킬기;
- [0075] N-히드록시-이미노메틸기, (1-(N-히드록시)-이미노)에틸기, (1-(N-히드록시)-이미노)프로필기, N-메톡시-이미노메틸기, (1-(N-메톡시)-이미노)에틸기 등의 치환 또는 무치환의 N-히드록시이미노 C1~6 알킬기;

- [0076] 아미노카르보닐옥시기;
- [0077] 에틸아미노카르보닐옥시기, 디메틸아미노카르보닐옥시기 등의 C1~6 알킬 치환 아미노카르보닐옥시기;
- [0078] 메르캅토기;
- [0079] 메틸티오기, 에틸티오기, n-프로필티오기, i-프로필티오기, n-부틸티오기, i-부틸티오기, s-부틸티오기, t-부틸티오기 등의 C1~6 알킬티오기;
- [0080] 트리플루오로메틸티오기, 2,2,2-트리플루오로에틸티오기 등의 C1~6 할로알킬티오기;
- [0081] 페닐티오기;
- [0082] 티아졸릴티오기, 피리딜티오기 등의 5~6원 헤테로아릴티오기;
- [0083] 메틸설퍼닐기, 에틸설퍼닐기, t-부틸설퍼닐기 등의 C1~6 알킬설퍼닐기;
- [0084] 트리플루오로메틸설퍼닐기, 2,2,2-트리플루오로에틸설퍼닐기 등의 C1~6 할로알킬설퍼닐기;
- [0085] 페닐설퍼닐기;
- [0086] 티아졸릴설퍼닐기, 피리딜설퍼닐기 등의 5~6원 헤테로아릴설퍼닐기;
- [0087] 메틸설퍼닐기, 에틸설퍼닐기, t-부틸설퍼닐기 등의 C1~6 알킬설퍼닐기;
- [0088] 트리플루오로메틸설퍼닐기, 2,2,2-트리플루오로에틸설퍼닐기 등의 C1~6 할로알킬설퍼닐기;
- [0089] 페닐설퍼닐기;
- [0090] 티아졸릴설퍼닐기, 피리딜설퍼닐기 등의 5~6원 헤테로아릴설퍼닐기;
- [0091] 메틸설퍼닐옥시기, 에틸설퍼닐옥시기, t-부틸설퍼닐옥시기 등의 C1~6 알킬설퍼닐옥시기;
- [0092] 트리플루오로메틸설퍼닐옥시기, 2,2,2-트리플루오로에틸설퍼닐옥시기 등의 C1~6 할로알킬설퍼닐옥시기;
- [0093] 트리메틸실릴기, 트리에틸실릴기, t-부틸디메틸실릴기 등의 트리 C1~6 알킬 치환 실릴기;
- [0094] 트리페닐실릴기;
- [0095] 펜타플루오로실파닐기;
- [0096] 시아노기; 니트로기;
- [0097] 또한, 이들 「치환기」는, 상기 치환기 중 어느 하나의 수소 원자가, 상이한 구조의 기로 치환되어 있어도 된다. 그 경우의 「치환기」로는, C1~6 알킬기, C1~6 할로알킬기, C1~6 알콕시기, C1~6 할로알콕시기, 할로게노기, 시아노기, 니트로기 등을 들 수 있다.
- [0098] 또한, 상기 「3~6원 헤테로시클릴기」란, 질소 원자, 산소 원자, 및 황 원자로 이루어지는 군으로부터 선택되는 1~4개의 헤테로 원자를 고리의 구성 원자로서 포함하는, 3원 고리, 4원 고리, 5원 고리, 또는 6원 고리의 기를 말한다. 헤테로시클릴기는, 단환 및 다환 중 어느 것이어도 된다. 다환 헤테로시클릴기는, 적어도 하나의 고리가 헤테로환이면, 나머지 고리가 포화 치환, 불포화 치환, 또는 방향환 중 어느 것이어도 된다. 「3~6원 헤테로시클릴기」로는, 3~6원 포화 헤테로시클릴기, 5~6원 헤테로아릴기, 5~6원 불포화 헤테로시클릴기 등을 들 수 있다.
- [0099] 3~6원 포화 헤테로시클릴기로는, 아지리디닐기, 에폭시기, 아제티디닐기, 피롤리디닐기, 테트라히드로푸라닐기, 디옥소라닐기, 테트라히드로피라닐기, 피페리딘기, 피페라지닐기, 모르폴리닐기, 디옥사닐기 등을 들 수 있다.
- [0100] 5~6원 불포화 헤테로시클릴기로는, 피롤리닐기, 디히드로푸라닐기, 이미다졸리닐기, 피라졸리닐기, 옥사졸리닐기, 이소옥사졸리닐기, 티아졸리닐기, 이소티아졸리닐기, 디히드로피라닐기, 디히드로옥사지닐기 등을 들 수 있다.
- [0101] 5원 헤테로아릴기로는, 피롤릴기, 푸릴기, 티에닐기, 이미다졸릴기, 피라졸릴기, 옥사졸릴기, 이소옥사졸릴기, 티아졸릴기, 이소티아졸릴기, 트리아졸릴기, 옥사디아졸릴기, 티아디아졸릴기, 테트라졸릴기 등을 들 수 있다.

- [0102] 6원 헥테로아틸기로는, 피리딜기, 피라지닐기, 피리미디닐기, 피리다지닐기, 트리아지닐기 등을 들 수 있다.
- [0103] $[R^1]$
- [0104] R^1 은 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알키닐기, 또는 치환 또는 무치환의 C3~6 시클로알킬기를 나타낸다.
- [0105] R^1 에 있어서의 「C1~6 알킬기」는, 직쇄여도 되고, 분기쇄여도 된다. R^1 에 있어서의 「C1~6 알킬기」로는, 메틸기, 에틸기, n-프로필기, n-부틸기, n-펜틸기, n-헥실기, i-프로필기, i-부틸기, s-부틸기, t-부틸기, i-펜틸기, 네오펜틸기, 2-메틸부틸기, i-헥실기 등을 들 수 있다.
- [0106] R^1 에 있어서의 「C2~6 알케닐기」로는, 비닐기, 1-프로페닐기, 2-프로페닐기, 1-부테닐기, 2-부테닐기, 3-부테닐기, 1-메틸-2-프로페닐기, 2-메틸-2-프로페닐기, 1-펜테닐기, 2-펜테닐기, 3-펜테닐기, 4-펜테닐기, 1-메틸-2-부테닐기, 2-메틸-2-부테닐기, 1-헥세닐기, 2-헥세닐기, 3-헥세닐기, 4-헥세닐기, 5-헥세닐기 등을 들 수 있다.
- [0107] R^1 에 있어서의 「C2~6 알키닐기」로는, 에티닐기, 1-프로피닐기, 2-프로피닐기, 1-부티닐기, 2-부티닐기, 3-부티닐기, 1-메틸-2-프로피닐기, 2-메틸-3-부티닐기, 1-펜티닐기, 2-펜티닐기, 3-펜티닐기, 4-펜티닐기, 1-메틸-2-부티닐기, 2-메틸-3-펜티닐기, 1-헥시닐기, 1,1-디메틸-2-부티닐기 등을 들 수 있다.
- [0108] R^1 에 있어서의 「C1~6 알킬기」, 「C2~6 알케닐기」, 또는 「C2~6 알키닐기」상의 치환기로서, 플루오로기, 클로로기, 브로모기, 요오드기 등의 할로게노기; 수산기; 메톡시기, 에톡시기, n-프로폭시기, i-프로폭시기, n-부톡시기, s-부톡시기, i-부톡시기, t-부톡시기 등의 C1~6 알콕시기; 2-클로로-n-프로폭시기, 2,3-디클로로부톡시기, 트리플루오로메톡시기 등의 C1~6 할로알콕시기; 페닐기, 나프틸기; 4-클로로페닐기, 4-트리플루오로메틸페닐기, 4-트리플루오로메톡시페닐기 등의 할로게노기 치환, C1~6 할로알킬기 치환, 또는 C1~6 할로알콕시기 치환의 페닐기; 할로게노기 치환, C1~6 할로알킬기 치환, 또는 C1~6 할로알콕시기 치환의 나프틸기; 또는 시아노기가 바람직하다.
- [0109] R^1 에 있어서의 「C3~6 시클로알킬기」로는, 시클로프로필기, 시클로부틸기, 시클로펜틸기, 시클로헥실기 등을 들 수 있다.
- [0110] R^1 에 있어서의 「C3~8시클로알킬기」상의 치환기로서, 플루오로기, 클로로기, 브로모기, 요오드기 등의 할로게노기; 메틸기, 에틸기, n-프로필기, i-프로필기, n-부틸기, s-부틸기, i-부틸기, t-부틸기, n-펜틸기, n-헥실기 등의 C1~6 알킬기; 클로로메틸기, 클로로에틸기, 트리플루오로메틸기, 1,2-디클로로-n-프로필기, 1-플루오로-n-부틸기 등의 C1~6 할로알킬기; 수산기; 메톡시기, 에톡시기, n-프로폭시기, i-프로폭시기, n-부톡시기, s-부톡시기, i-부톡시기, t-부톡시기 등의 C1~6 알콕시기; 2-클로로-n-프로폭시기, 2,3-디클로로부톡시기, 트리플루오로메톡시기 등의 C1~6 할로알콕시기; 또는 시아노기가 바람직하다.
- [0111] 본 발명에 있어서는, R^1 은 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 또는 치환 또는 무치환의 C3~6 시클로알킬기인 것이 바람직하다.
- [0112] C1~6 알킬기상의 치환기는, 할로게노기 또는 C1~6 알콕시기가 바람직하다.
- [0113] $[R^2]$
- [0114] R^2 는 수소 원자, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알키닐기, R^a -CO-로 나타내는 기, R^a O-CO-로 나타내는 기, R^a NH-CO-로 나타내는 기, R^a N-CO-로 나타내는 기, R^a -SO₂-로 나타내는 기, R^a -CO-O-CR₂^b-로 나타내는 기, 또는 R^a O-CO-O-CR₂^b-로 나타내는 기를 나타낸다.
- [0115] R^2 에 있어서의 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알키닐기의 구체예로는, R^1 에 있어서 예시한 것과 동일한 것을 들 수 있다.

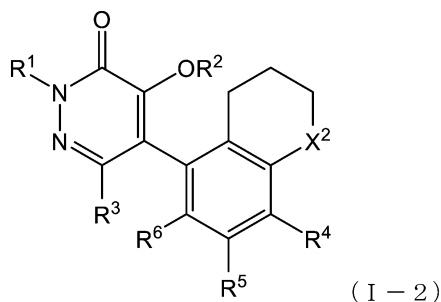
- [0116] R^2 에 있어서의 「 R^a -CO-로 나타내는 기」, 「 R^a NH-CO-로 나타내는 기」, 「 R^a_2 N-CO-로 나타내는 기」, 「 R^a -SO₂-로 나타내는 기」, 「 R^a -CO-O-CR^b₂-로 나타내는 기」, 또는 「 R^a O-CO-O-CR^b₂-로 나타내는 기」 중, R^a 는 각각 독립적으로, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알키닐기, 치환 또는 무치환의 C3~6 시클로알킬기, 치환 또는 무치환의 페닐기, 치환 또는 무치환의 나프틸기, 또는 치환 또는 무치환의 5~6원 헤테로시클릴기를 나타낸다.
- [0117] R^a 에 있어서의 「C1~6 알킬기」로는, 메틸기, 에틸기, n-프로필기, n-부틸기, n-펜틸기, n-헥실기, i-프로필기, i-부틸기, s-부틸기, t-부틸기, i-펜틸기, 네오펀틸기, 2-메틸부틸기, i-헥실기 등을 들 수 있다.
- [0118] R^a 에 있어서의 「C2~6 알케닐기」로는, 비닐기, 1-프로페닐기 등을 들 수 있다.
- [0119] R^a 에 있어서의 「C2~6 알키닐기」로는, 에티닐기, 1-프로피닐기 등을 들 수 있다.
- [0120] R^a 에 있어서의 「C1~6 알킬기」, 「C2~6 알케닐기」, 또는 「C2~6 알키닐기」 상의 치환기로는, 플루오로기, 클로로기, 브로모기, 요오드기 등의 할로게노기; 수산기; 메톡시기, 에톡시기, n-프로폭시기, i-프로폭시기, n-부톡시기, s-부톡시기, i-부톡시기, t-부톡시기 등의 C1~6 알콕시기; 2-클로로-n-프로폭시기, 2,3-디클로로부톡시기, 트리플루오로메톡시기 등의 C1~6 할로알콕시기; 시클로프로필기, 시클로부틸기, 시클로펜틸기, 시클로헥실기 등의 C3~6 시클로알킬기; 페닐기, 나프틸기; 4-클로로페닐기, 4-트리플루오로메틸페닐기, 4-트리플루오로메톡시페닐기 등의 할로게노기 치환, C1~6 할로알킬기 치환, 또는 C1~6 할로알콕시기 치환의 페닐기; 할로게노기 치환, C1~6 할로알킬기 치환, 또는 C1~6 할로알콕시기 치환의 나프틸기; 또는 시아노기가 바람직하다.
- [0121] R^a 에 있어서의 「C3~6 시클로알킬기」로는, 시클로프로필기, 시클로부틸기, 시클로펜틸기, 시클로헥실기 등을 들 수 있다.
- [0122] R^a 에 있어서의 「5~6원 헤테로시클릴기」란, 질소 원자, 산소 원자, 및 황 원자로 이루어지는 군으로부터 선택되는 1, 2, 3, 또는 4개의 헤테로 원자를 고리의 구성 원자로서 포함하는 5원 고리 또는 6원 고리의 기이다. 헤테로 원자가 2개 이상일 때, 이들은 동일해도 되고, 상이해도 된다. 「5~6원 헤테로시클릴기」로는, 5~6원 포화 헤테로시클릴기, 5~6원 헤테로아릴기, 5~6원 불포화 헤테로시클릴기 등을 들 수 있다.
- [0123] 5~6원 포화 헤테로시클릴기로는, 피롤리딘기, 테트라히드로푸라닐기, 디옥소라닐기, 테트라히드로피라닐기, 피페리딘기, 피페라지닐기, 모르폴리닐기, 디옥사닐기 등을 들 수 있다.
- [0124] 5원 불포화 헤테로시클릴기로는, 피롤리닐기, 디히드로푸라닐기, 이미다졸리닐기, 피라졸리닐기, 옥사졸리닐기, 이소옥사졸리닐기, 티아졸리닐기, 이소티아졸리닐기 등을 들 수 있다.
- [0125] 6원 불포화 헤테로시클릴기로는, 디히드로피라닐기, 디히드로옥사지닐기 등을 들 수 있다.
- [0126] 5원 헤테로아릴기로는, 피롤릴기, 푸릴기, 티에닐기, 이미다졸릴기, 피라졸릴기, 옥사졸릴기, 이소옥사졸릴기, 티아졸릴기, 이소티아졸릴기, 트리아졸릴기, 옥사디아졸릴기, 티아디아졸릴기, 테트라졸릴기 등을 들 수 있다.
- [0127] 6원 헤테로아릴기로서, 피리딘기, 피라지닐기, 피리미디닐기, 피리다지닐기, 트리아지닐기 등을 들 수 있다.
- [0128] R^a 에 있어서의 「C3~6 시클로알킬기」, 「페닐기」, 「나프틸기」, 또는 「5~6원 헤테로시클릴기」 상의 치환기로는, 플루오로기, 클로로기, 브로모기, 요오드기 등의 할로게노기; 메틸기, 에틸기, n-프로필기, i-프로필기, n-부틸기, s-부틸기, i-부틸기, t-부틸기, n-펜틸기, n-헥실기 등의 C1~6 알킬기; 클로로메틸기, 클로로에틸기, 트리플루오로메틸기, 1,2-디클로로-n-프로필기, 1-플루오로-n-부틸기 등의 C1~6 할로알킬기; 수산기; 메톡시기, 에톡시기, n-프로폭시기, i-프로폭시기, n-부톡시기, s-부톡시기, i-부톡시기, t-부톡시기 등의 C1~6 알콕시기; 2-클로로-n-프로폭시기, 2,3-디클로로부톡시기, 트리플루오로메톡시기 등의 C1~6 할로알콕시기; 페닐기, 나프틸기; 4-클로로페닐기, 4-트리플루오로메틸페닐기, 4-트리플루오로메톡시페닐기 등의 할로게노기 치환, C1~6 할로알킬기 치환, 또는 C1~6 할로알콕시기 치환의 페닐기, 할로게노기 치환, C1~6 할로알킬기 치환, 또는 C1~6 할로알콕시기 치환의 나프틸기; 또는 시아노기가 바람직하다.
- [0129] R^2 에 있어서의 「 R^a -CO-로 나타내는 기」의 구체예로는, 아세틸기 등을 들 수 있다.

- [0130] R^2 에 있어서의 「 R^aO-CO -로 나타내는 기」의 구체예로는, 메톡시카르보닐기, 에톡시카르보닐기 등을 들 수 있다.
- [0131] R^2 에 있어서의 「 R^aNH-CO -로 나타내는 기」의 구체예로는, N-메틸아미노카르보닐기, N-(i-프로필)아미노카르보닐기 등을 들 수 있다.
- [0132] R^2 에 있어서의 「 R^a_2N-CO -로 나타내는 기」의 구체예로는, N,N-디메틸아미노카르보닐기, N-(i-프로필)-N-메틸아미노카르보닐기 등을 들 수 있다.
- [0133] R^2 에 있어서의 「 R^a-SO_2 -로 나타내는 기」의 구체예로는, 메탄설폰닐기 등을 들 수 있다.
- [0134] R^2 에 있어서의 「 $R^a-CO-O-CR^b_2$ -로 나타내는 기」 또는 「 $R^aO-CO-O-CR^b_2$ -로 나타내는 기」 중, R^b 는 각각 독립적으로, 수소 원자 또는 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기를 나타낸다.
- [0135] R^b 에 있어서의 「C1~6 알킬기」의 구체예는, R^a 에 있어서 예시한 것과 동일한 것을 들 수 있다. R^b 에 있어서의 「C1~6 알킬기」상의 치환기의 구체예에 대해서도, R^a 에 있어서 예시한 것과 동일한 것을 들 수 있다.
- [0136] R^2 에 있어서의 「 $R^a-CO-O-CR^b_2$ -로 나타내는 기」의 구체예로는, 아세톡시메틸기, 이소프로필카르보닐옥시메틸기, 1-아세톡시에틸기, 1-이소프로필카르보닐옥시에틸기 등을 들 수 있다.
- [0137] R^2 에 있어서의 「 $R^aO-CO-O-CR^b_2$ -로 나타내는 기」의 구체예로는, 메톡시카르보닐옥시메틸기, 이소프로필옥시카르보닐옥시메틸기, 1-(메틸옥시카르보닐옥시)에틸기, 1-(이소프로필옥시카르보닐옥시)에틸기 등을 들 수 있다.
- [0138] 본 발명에 있어서는, R^2 는 수소 원자, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, R^a-CO -로 나타내는 기, R^aO-CO -로 나타내는 기, R^a-SO_2 -로 나타내는 기, $R^a-CO-O-CR^b_2$ -로 나타내는 기, 또는 $R^aO-CO-O-CR^b_2$ -로 나타내는 기인 것이 바람직하다.
- [0139] R^a 는 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 페닐기, 또는 치환 또는 무치환의 5~6원 헤테로시클릴기인 것이 바람직하다.
- [0140] R^b 는 수소 원자 또는 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기인 것이 바람직하다.
- [0141] R^2 에 있어서의 「C1~6 알킬기」상의 치환기로는, 할로게노기, C1~6 알콕시기, C1~6 할로알콕시기, 페닐기; 할로게노기 치환, C1~6 할로알킬기 치환, 또는 C1~6 할로알콕시기 치환의 페닐기; 또는 시아노기가 바람직하다. 특히, C1~6 알콕시기, 페닐기; 또는 할로게노기 치환, C1~6 할로알킬기 치환, 또는 C1~6 할로알콕시기 치환의 페닐기가 바람직하다.
- [0142] [R^3]
- [0143] R^3 은 수소 원자, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알키닐기, 또는 치환 또는 무치환의 C3~6 시클로알킬기를 나타낸다.
- [0144] R^3 에 있어서의 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알케닐기, 치환 또는 무치환의 C2~6 알키닐기, 또는 치환 또는 무치환의 C3~6 시클로알킬기의 구체예로는, R^1 에 있어서 예시한 것과 동일한 것을 들 수 있다.
- [0145] 본 발명에 있어서는, R^3 은 수소 원자, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 또는 치환 또는 무치환의 C3~6 시클로알킬기인 것이 바람직하다.
- [0146] C1~6 알킬기상의 치환기는 할로게노기가 바람직하다.
- [0147] C3~6 시클로알킬기상의 치환기는 할로게노기 또는 C1~6 알킬기가 바람직하다.

- [0148] $[R^4]$
- [0149] R^4 는 할로게노기, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C1~6 알콕시기, 치환 또는 무치환의 페닐기, 치환 또는 무치환의 나프틸기, 치환 또는 무치환의 5~6원 헤테로아릴기, 또는 시아노기를 나타낸다.
- [0150] R^4 에 있어서의 「할로게노기」로는, 플루오로기, 클로로기, 브로모기, 요오드기 등을 들 수 있다.
- [0151] R^4 에 있어서의 「C1~6 알킬기」는 직쇄여도 되고, 분기쇄여도 된다. R^4 에 있어서의 「C1~6 알킬기」로는, 메틸기, 에틸기, n-프로필기, n-부틸기, n-펜틸기, n-헥실기, i-프로필기, i-부틸기, s-부틸기, t-부틸기, i-펜틸기, 네오펜틸기, 2-메틸부틸기, i-헥실기 등을 들 수 있다.
- [0152] R^4 에 있어서의 「C1~6 알콕시기」로는, 메톡시기, 에톡시기, n-프로폭시기, n-부톡시기, n-펜틸옥시기, n-헥실옥시기, i-프로폭시기, i-부톡시기, s-부톡시기, t-부톡시기, i-헥실옥시기 등을 들 수 있다.
- [0153] R^4 에 있어서의 「C1~6 알킬기」 또는 「C1~6 알콕시기」 상의 치환기로서, 플루오로기, 클로로기, 브로모기, 요오드기 등의 할로게노기; 수산기; 메톡시기, 에톡시기, n-프로폭시기, i-프로폭시기, n-부톡시기, s-부톡시기, i-부톡시기, t-부톡시기 등의 C1~6 알콕시기; 2-클로로-n-프로폭시기, 2,3-디클로로부톡시기, 트리플루오로메톡시기 등의 C1~6 할로알콕시기; 페닐기, 나프틸기; 4-클로로페닐기, 4-트리플루오로메틸페닐기, 4-트리플루오로메톡시페닐기 등의 할로게노기 치환, C1~6 할로알킬기 치환, 또는 C1~6 할로알콕시기 치환의 페닐기; 할로게노기 치환, C1~6 할로알킬기 치환, 또는 C1~6 할로알콕시기 치환의 나프틸기; 또는 시아노기가 바람직하다.
- [0154] R^4 에 있어서의 「5~6원 헤테로아릴기」는, 질소 원자, 산소 원자, 및 황 원자로 이루어지는 군으로부터 선택되는 1, 2, 3, 또는 4개의 헤테로 원자를 고리의 구성 원자로서 포함하는 5원 방향환 또는 6원 방향환의 기이다. 헤테로 원자가 2개 이상일 때, 이들은 동일해도 되고, 상이해도 된다.
- [0155] 5원 헤테로아릴기로는, 피롤릴기, 푸릴기, 티에닐기, 이미다졸릴기, 피라졸릴기, 옥사졸릴기, 이소옥사졸릴기, 티아졸릴기, 이소티아졸릴기, 트리아졸릴기, 옥사디아졸릴기, 티아디아졸릴기, 테트라졸릴기 등을 들 수 있다.
- [0156] 6원 헤테로아릴기로는, 피리딜기, 피라지닐기, 피리미디닐기, 피리다지닐기, 트리아지닐기 등을 들 수 있다.
- [0157] R^4 에 있어서의 「페닐기」, 「나프틸기」, 또는 「5~6원 헤테로아릴기」 상의 치환기로서, 플루오로기, 클로로기, 브로모기, 요오드기 등의 할로게노기; 메틸기, 에틸기, n-프로필기, i-프로필기, n-부틸기, s-부틸기, i-부틸기, t-부틸기, n-펜틸기, n-헥실기 등의 C1~6 알킬기; 클로로메틸기, 클로로에틸기, 트리플루오로메틸기, 1,2-디클로로-n-프로필기, 1-플루오로-n-부틸기 등의 C1~6 할로알킬기; 수산기; 메톡시기, 에톡시기, n-프로폭시기, i-프로폭시기, n-부톡시기, s-부톡시기, i-부톡시기, t-부톡시기 등의 C1~6 알콕시기; 2-클로로-n-프로폭시기, 2,3-디클로로부톡시기, 트리플루오로메톡시기 등의 C1~6 할로알콕시기; 또는 시아노기가 바람직하다.
- [0158] 본 발명에 있어서는, R^4 는 할로게노기, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 C1~6 알콕시기, 또는 시아노기가 바람직하다.
- [0159] C1~6 알킬기 또는 C1~6 알콕시기 상의 치환기는, 할로게노기가 바람직하다.
- [0160] $[R^5, R^6]$
- [0161] R^5 는 수소 원자 또는 할로게노기를 나타낸다.
- [0162] R^6 은 수소 원자 또는 할로게노기를 나타낸다. R^6 은 수소 원자가 바람직하다.
- [0163] [A]
- [0164] A는 치환 또는 무치환의 C1~4 알킬렌기, 치환 또는 무치환의 C2~3 알케닐렌기, 또는 치환 또는 무치환의 C1~2 알킬렌옥시 C1~C2 알킬렌기를 나타낸다.
- [0165] 「C1~4 알킬렌기」로는, 메틸렌기, 디메틸렌기, 트리메틸렌기, 테트라메틸렌기 등을 들 수 있다.

- [0166] 「C2~3 알케닐렌기」로는, 비닐렌기(-CH=CH-), 프로페닐렌기(-CH=CH-CH₂-, -CH₂-CH=CH-)등을 들 수 있다.
- [0167] 「C1~2 알킬렌옥시 C1~C2 알킬렌기」로는, 메틸렌옥시메틸렌기(-CH₂-O-CH₂-), 메틸렌옥시디메틸렌기(-CH₂-O-CH₂CH₂-), 디메틸렌옥시메틸렌기(-CH₂CH₂-O-CH₂-), 디메틸렌옥시디메틸렌기(-CH₂CH₂-O-CH₂CH₂-) 등을 들 수 있다.
- [0168] 「C1~4 알킬렌기」, 「C2~3 알케닐렌기」, 또는 「C1~2 알킬렌옥시 C1~C2 알킬렌기」 상의 치환기로는, 플루오로기, 클로로기, 브로모기, 요오드기 등의 할로게노기; 메틸기, 에틸기, n-프로필기, i-프로필기, n-부틸기, s-부틸기, i-부틸기, t-부틸기 등의 C1~6 알킬기; 클로로메틸기, 클로로에틸기, 트리플루오로메틸기, 1,2-디클로로-n-프로필기, 1-플루오로-n-부틸기 등의 C1~6 할로알킬기; 수산기; 메톡시기, 에톡시기, n-프로폭시기, i-프로폭시기, n-부톡시기, s-부톡시기, i-부톡시기, t-부톡시기 등의 C1~6 알콕시기; 2-클로로-n-프로폭시기, 2,3-디클로로부톡시기, 트리플루오로메톡시기 등의 C1~6 할로알콕시기; 메톡시메틸기 등의 C1~6 알콕시 C1~6 알킬기; 페닐기, 나프틸기; 4-클로로페닐기, 4-트리플루오로메틸페닐기, 4-트리플루오로메톡시페닐기 등의 할로게노기 치환, C1~6 할로알킬기 치환, 또는 C1~6 할로알콕시기 치환의 페닐기; 할로게노기 치환, C1~6 할로알킬기 치환, 또는 C1~6 할로알콕시기 치환의 나프틸기; 또는 시아노기를 들 수 있다.
- [0169] 본 발명에 있어서는, A는 치환 또는 무치환의 C1~4 알킬렌기가 바람직하다.
- [0170] C1~4 알킬렌기 상의 치환기로는, C1~6 알킬기 또는 할로게노기가 바람직하다.
- [0171] [X¹, X², R^c, m, n]
- [0172] X¹은 산소 원자 또는 설폰닐기를 나타낸다.
- [0173] X²는 산소 원자, 설페닐기, 설피닐기, 설폰닐기, -S(=NR^c)-로 나타내는 기, 또는 -S(=O)(=NR^c)-로 나타내는 기를 나타낸다.
- [0174] R^c는 각각 독립적으로, 수소 원자, 치환 또는 무치환의 C1~6 알킬기, 치환 또는 무치환의 페닐기, 치환 또는 무치환의 나프틸기, 또는 시아노기를 나타낸다. R^c에 있어서의 「C1~6 알킬기」의 구체예로는, R^a에 있어서 예시한 것과 동일한 것을 들 수 있다.
- [0175] m은 0 또는 1을 나타내고, n은 0 또는 1을 나타낸다. m과 n의 합은 1 또는 2이다. A가 치환 또는 무치환의 메틸렌기인 경우, m과 n의 합은 2이다.
- [0176] 본 발명에 있어서는, X¹은 산소 원자 또는 설폰닐기가 바람직하고, X²는 산소 원자, 설페닐기, 또는 설폰닐기가 바람직하다.
- [0177] 본 발명에 있어서는, A가 트리메틸렌기이고, m이 0이며, 또한 n이 1인, 식 (I-2)로 나타내는 화합물이 바람직하다.

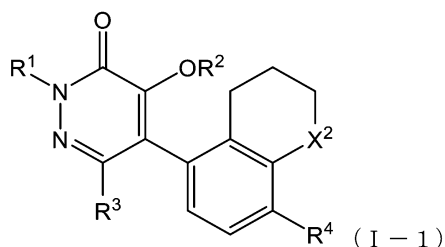
화학식 3



- [0178]
- [0179] 식 (I-2) 중, X², R¹~R⁶은, 식 (I) 중의 이들과 동일한 의미를 나타낸다.

[0180] 본 발명에 있어서는, A가 트리메틸렌기이며, R^5 와 R^6 이 수소 원자이고, m이 0이며, 또한 n이 1인, (식 (I-1))로 나타내는 화합물이 더욱 바람직하다.

화학식 4



[0181]

[0182] 식 (I-1) 중, X^2 , $R^1 \sim R^4$ 는 식 (I) 중의 이들과 동일한 의미를 나타낸다.

[0183] [염]

[0184] 화합물 (I)의 염으로는, 리튬, 나트륨, 칼륨 등의 알칼리 금속의 염; 칼슘, 마그네슘 등의 알칼리 토류 금속의 염; 철, 구리 등의 전이 금속의 염; 암모늄염; 트리에틸아민, 트리부틸아민, 피리딘, 히드라진 등의 유기 염기의 염; 등을 들 수 있다.

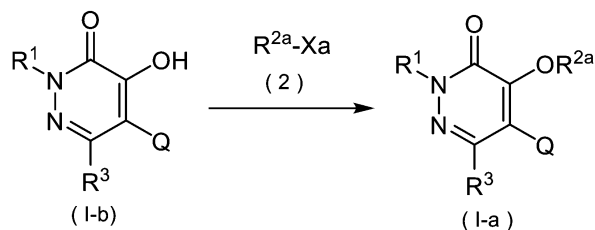
[0185] 화합물 (I) 또는 화합물 (I)의 염의 구조는, NMR 스펙트럼, IR 스펙트럼, MS 스펙트럼 등으로 결정할 수 있다.

[0186] 화합물 (I)은 그 제조 방법에 따라 특별히 한정되지 않는다. 또한, 화합물 (I)의 염은, 화합물 (I)로부터 공지된 방법에 의해 얻을 수 있다. 화합물 (I)은, 예를 들면, 특허문헌 1에 기재된 제법에 따라 얻어지는 화합물을 그 제조 중간체로서 사용하고, 실시예 등에 기재한 방법에 의해 제조할 수 있다.

[0187] (반응 스킴 1)

[0188] 예를 들면, 화합물 (I) 중, R^2 가 수소 원자 또는 저급 알킬기 이외인 화합물(식 (I-a)의 화합물)은, 이하의 반응 스킴 1에 나타나는 바와 같이, 식 (I-b)의 화합물로부터 조제될 수 있다. 한편, 식 (I-b)는 화합물 (I) 중, R^2 가 수소 원자인 화합물을 나타낸다. 식 (I-a) 및 식 (I-b) 중의 기호는 식 (I) 중의 이들과 동일한 의미를 나타낸다. 식 (2) 중의 Xa 는 클로로기, 브로모기 등의 할로게노기를 나타낸다. 식 (2) 중의 R^{2a} 는 수소 원자 또는 저급 알킬기 이외의 R^2 를 나타낸다.

화학식 5



[0189]

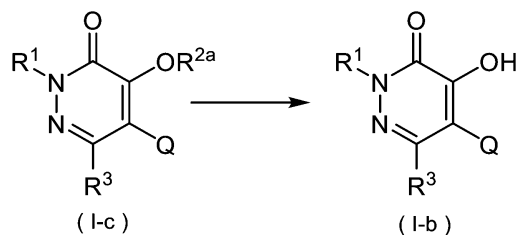
[0190] 식 (I-a)의 화합물은, 바람직한 염기(예를 들면, 탄산칼륨 등의 무기 염기)의 존재하, 식 (I-b)의 화합물과, 식 (2)의 화합물을 반응시킴으로써 조제될 수 있다.

[0191] (반응 스킴 2)

[0192] 식 (I-b)의 화합물은 이하의 반응 스킴 2에 나타나는 바와 같이, 식 (I-c)의 화합물로부터 조제될 수 있다. 한편, 식 (I-c) 중의 기호는 식 (I) 중의 이들과 동일한 의미를 나타낸다. R^{2a} 는 저급 알킬기, 예를 들면 메틸기를

나타낸다. 이하 R^{2a} 는 동일한 의미를 나타낸다.

화학식 6



[0193]

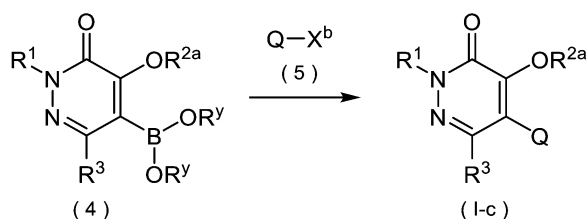
[0194] 식 (I-b)의 화합물은, 식 (I-c)의 화합물을 모르폴린과 함께 가열함으로써 조제될 수 있다.

[0195] (반응 스킴 3)

[0196] 식 (I-c)의 화합물은, 이하의 반응 스킴 3에 나타내는 바와 같이, 식 (4)의 화합물과 식 (5)의 화합물을 축합시킴으로써 조제될 수 있다.

[0197] 한편, 식 (4) 중의 기호는 식 (I) 중의 이들과 동일한 의미를 나타낸다. R^y 는 저급 알킬기, 예를 들면 메틸기, 에틸기 등을 나타낸다. 또한, R^y 끼리가 결합하여, 1,3,2-디옥사보로란 고리를 형성해도 된다. 식 (5) 중의 Q는 식 (I) 중의 치환기 R^4 를 갖는 벤젠 고리 부분을 의미한다. X^b 는 할로게노기를 나타낸다.

화학식 7



[0198]

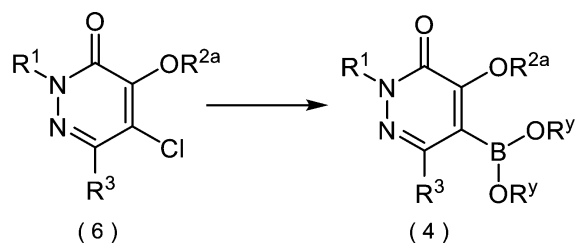
[0199] 식 (I-c)의 화합물은, 바람직한 염기(예를 들면, 인산칼륨 또는 불화세슘 등의 무기 염기), 금속 촉매(예를 들면, $Pd(OAc)_2$ 등의 팔라듐 촉매) 및 경우에 따라, 리간드(예를 들면, 포스핀 리간드)의 존재하, 식 (4)의 화합물과 식 (5)의 화합물을 반응시킴으로써 조제될 수 있다.

[0200] 금속 촉매 및 리간드는 미리 형성된 착체(예를 들면, 비스(트리페닐포스핀)팔라듐디클로라이드 또는 [1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센]팔라듐디클로라이드디클로로메탄 부가물 등의 팔라듐/포스핀 착체)로서 첨가될 수 있다.

[0201] (반응 스킴 4)

[0202] 식 (4)의 화합물은 이하의 반응 스킴 4에 나타내는 바와 같이, 식 (6)의 화합물로부터 조제될 수 있다. 한편, 식 (6) 중의 기호는 식 (I) 중의 이들과 동일한 의미를 나타낸다.

화학식 8



[0203]

[0204]

식 (4)의 화합물은 바람직한 염기(예를 들면, 인산칼륨 또는 불화세슘 등의 무기 염기), 금속 촉매(예를 들면, $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$, $(\text{Pd}(\text{OAc})_2$ 등의 팔라듐 촉매) 및 경우에 따라, 리간드(예를 들면, 포스핀 리간드)의 존재하, 식 (6)의 화합물과, 보론산 또는 보론산의 에스테르, 예를 들면, 비스(피나콜라토)디보론을 반응시킴으로써 조제될 수 있다.

[0205]

금속 촉매 및 리간드는 미리 형성된 착체(예를 들면, 비스(트리페닐포스핀)팔라듐디클로라이드 또는 [1,1-비스(디페닐포스피노)페로센]팔라듐디클로라이드디클로로메탄 부가물 등의 팔라듐/포스핀 착체)로서 첨가될 수 있다.

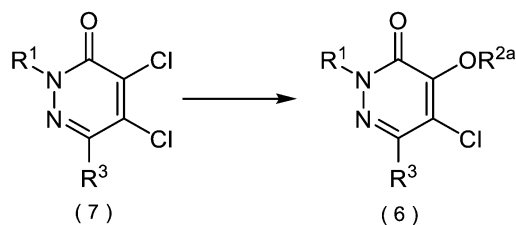
[0206]

(반응 스킴 5)

[0207]

식 (6)의 화합물은 이하의 반응 스킴 5에 나타내는 바와 같이, 식 (7)의 화합물로부터 조제될 수 있다. 한편, 식 (7) 중의 기호는 식 (I) 중의 이들과 동일한 의미를 나타낸다.

화학식 9



[0208]

[0209]

식 (6)의 화합물은 식 (7)의 화합물을 바람직한 금속 알콕사이드, 예를 들면 나트륨메톡사이드와 반응시킴으로써 조제될 수 있다.

[0210]

식 (7)의 화합물은 공지의 방법에 의해 조제될 수 있다.

[0211]

(반응 스킴 3A)

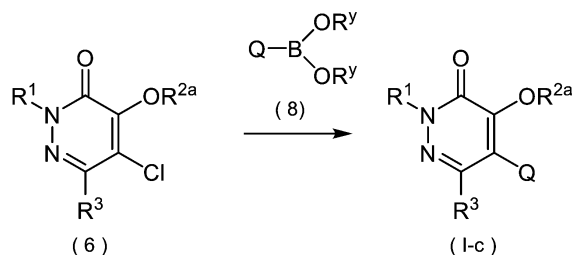
[0212]

식 (I-c)의 화합물은 이하의 반응 스킴 3A에 나타내는 바와 같이, 식 (6)의 화합물과 식 (8)의 화합물을 축합시킴으로써 조제될 수 있다.

[0213]

식 (8) 중의 Q는 식 (I) 중의 치환기 R^4 를 갖는 벤젠 고리 부분을 의미한다. X^b 는 할로게노기를 나타낸다. R^y 는 저급 알킬기, 예를 들면 메틸기, 에틸기 등을 나타낸다. 또한, R^y 끼리가 결합하여, 1,3,2-디옥사보로란 고리를 형성해도 된다.

화학식 10



[0214]

[0215] 식 (I-c)의 화합물은 바람직한 염기(예를 들면, 인산칼륨 또는 불화세슘 등의 무기 염기), 금속 촉매(예를 들면, Pd(OAc)₂ 등의 팔라듐 촉매) 및 경우에 따라, 리간드(예를 들면, 포스핀 리간드)의 존재하, 식 (6)의 화합물과 식 (8)의 화합물을 반응시킴으로써 조제될 수 있다.

[0216] 금속 촉매 및 리간드는 미리 형성된 착체(예를 들면, 비스(트리페닐포스핀)팔라듐디클로라이드 또는 [1,1-비스(디페닐포스피노)페로센]팔라듐디클로라이드디클로로메탄 부가물 등의 팔라듐/포스핀 착체)로서 첨가될 수 있다.

[0217] 본 발명 화합물은 발농사 조건에서, 토양 처리, 경엽 처리 중 어느 방법에서도 높은 제초 활성을 나타낸다.

[0218] 본 발명 화합물은 각종 밭 잡초에 유효하고, 옥수수, 밀 등의 작물에 선택성을 나타내는 경우가 있다.

[0219] 본 발명의 제초제는 화합물 (I) 및 화합물 (I)의 염으로 이루어지는 군으로부터 선택되는 적어도 하나를 유효 성분으로서 함유하는 것이다.

[0220] 즉, 본 발명의 양태의 하나는, 화합물 (I) 및 그의 염으로 이루어지는 군으로부터 선택되는 적어도 하나를 유효 성분으로서 함유하는 제초제이다.

[0221] 본 발명의 제초제는 발농사 조건에서, 토양 처리, 경엽 처리 중 어느 방법에서도 높은 제초 활성을 나타낸다.

[0222] 또한, 본 발명의 제초제는 논 잡초인 피, 알방동사니, 소귀나물, 쯤췌챙이골 등에 대해, 우수한 살초 효력을 갖고, 벼에 선택성을 나타내는 경우가 있다.

[0223] 또한, 본 발명의 제초제는 과수원, 잔디밭, 선로변, 공터 등의 잡초의 방제에도 적용할 수 있다.

[0224] 본 발명의 제초제가 사용될 수 있는 유용 식물은 곡물, 예를 들면 보리 및 밀, 목화, 유채, 해바라기, 옥수수, 쌀, 대두, 사탕무, 사탕수수, 및 잔디 등의 작물을 포함한다.

[0225] 작물은 과수, 야자 나무, 코코야자 나무, 또는 다른 나무 열매 등의 나무도 포함할 수 있다. 포도, 과실의 관목, 과실 식물, 및 야채 등의 덩굴 식물도 포함된다.

[0226] 방제 대상이 되는 밭 잡초로는, 이하에 나타내는 잡초를 들 수 있다.

[0227] (A) 단자엽류의 잡초

[0228] (1) 사초과(Cyperaceae)의 잡초

[0229] 방동사니속(Cyperus)의 잡초, 예를 들면, 기름골(Cyperus esculentus), 참방동사니(Cyperus iria), 방동사니(Cyperus microiria), 향부자(Cyperus rotundus).

[0230] (2) 벼과(Poaceae)의 잡초

[0231] 뚝새풀속(Alopecurus)의 잡초, 예를 들면, 뚝새풀(Alopecurus aequalis), 블랙 그래스(쥐꼬리뚝새풀(Alopecurus myosuroides));

[0232] 아페라속(Apera)의 잡초, 예를 들면, 아페라스피카벤티(Apera spica-venti);

[0233] 귀리속(Avena)의 잡초, 예를 들면, 귀리(Avena sativa);

[0234] 참새귀리속(Bromus)의 잡초, 예를 들면, 참새귀리(Bromus japonicus), 까락빡새귀리(Bromus sterilis);

- [0235] 바랭이속(*Digitaria*)의 잡초, 예를 들면, 바랭이(*Digitaria ciliaris*), 줌바랭이(*Digitaria sanguinalis*);
- [0236] 피속(*Echinochloa*)의 잡초, 예를 들면, 돌피(*Echinochloa crus-galli*);
- [0237] 왕바랭이속(*Eleusine*)의 잡초, 예를 들면, 왕바랭이(*Eleusine indica*);
- [0238] 쥐보리속(*Lolium*)의 잡초, 예를 들면, 이탈리아안 라이그래스(쥐보리(*Lolium multiflorum* Lam.));
- [0239] 기장속(*Panicum*)의 잡초, 예를 들면, 미국개기장(*Panicum dichotomiflorum*);
- [0240] 포아속(*Poa*)의 잡초, 예를 들면, 새포아풀(*Poa annua*);
- [0241] 강아지풀속(*Setaria*)의 잡초, 예를 들면, 가을 강아지풀(*Setaria faberi*), 금강아지풀(*Setaria pumila*), 강아지풀(*Setaria viridis*);
- [0242] 수수속(*Sorghum*)의 잡초, 예를 들면, 수수(*Sorghum bicolor*);
- [0243] 우로클로아속(*Urochloa*)의 잡초, 예를 들면, 우로클로아 플라티필라(*Urochloa platyphylla*).
- [0244] (B) 쌍자엽류의 잡초
- [0245] (1) 비름과(*Amaranthaceae*)의 잡초
- [0246] 비름속(*Amaranthus blitum*)의 잡초, 예를 들면, 개비름(*Amaranthus blitum*), 긴이삭비름(*Amaranthus palmeri*), 털비름(*Amaranthus retroflexus*), 아마란투스 루디스(*Amaranthus rudis*);
- [0247] 명아주속(*Chenopodium*)의 잡초, 예를 들면, 명아주(*Chenopodium album*);
- [0248] 바시아속(*Bassia*)의 잡초, 예를 들면, 땀싸리(*Bassia scoparia*).
- [0249] (2) 국화과(*Asteraceae*)의 잡초
- [0250] 돼지풀속(*Ambrosia*)의 잡초, 예를 들면, 돼지풀(*Ambrosia artemisiifolia*), 단풍잎돼지풀(*Ambrosia trifida*);
- [0251] 망초속(*Conyza*)의 잡초, 예를 들면, 망초(*Conyza canadensis*), 큰망초(*Conyza sumatrensis*);
- [0252] 개망초속(*Erigeron*)의 잡초, 예를 들면, 개망초(*Erigeron annuus*);
- [0253] 마트리카리아속(*Matricaria*)의 잡초, 예를 들면, 꽃죽제비쑥(*Matricaria inodora*), 카밀레(*Matricaria recutita*);
- [0254] 도꼬마리속(*Xanthium*)의 잡초, 예를 들면, 큰도꼬마리(*Xanthium occidentale*).
- [0255] (3) 패랭이꽃과(*Caryophyllaceae*)의 잡초
- [0256] 개미자리속(*Sagina*)의 잡초, 예를 들면, 개미자리(*Sagina japonica*);
- [0257] 별꽃속(*Stellaria*)의 잡초, 예를 들면, 별꽃(*Stellaria media*).
- [0258] (4) 메꽃과(*Convolvulaceae*)의 잡초
- [0259] 메꽃속(*Calystegia*)의 잡초, 예를 들면, 메꽃(*Calystegia japonica*);
- [0260] 나팔꽃속(*Ipomoea*)의 잡초, 예를 들면, 둥근잎유홍초(*Ipomoea coccinea*), 미국나팔꽃(*Ipomoea hederacea*), 애기나팔꽃(*Ipomoea lacunosa*), 별나팔꽃(*Ipomoea triloba*).
- [0261] (5) 꿀풀과(*Lamiaceae*)의 잡초
- [0262] 광대나물속(*Lamium*)의 잡초, 예를 들면, 광대수염(*Lamium album* var. *barbatum*), 광대나물(*Lamium amplexicaule*), 자주광대나물(*Lamium purpureum*).
- [0263] (6) 아욱과(*Malvaceae*)의 잡초
- [0264] 어저귀속(*Abutilon*)의 잡초, 예를 들면, 어저귀(*Abutilon theophrasti*);
- [0265] 공단풀속(*Sida*)의 잡초, 예를 들면, 공단풀(*Sida spinosa*).
- [0266] (7) 질경이과(*Plantaginaceae*)의 잡초

- [0267] 개불알풀속(*Veronica*)의 잡초, 예를 들면, 큰개불알풀(*Veronica persica*).
- [0268] (8) 마디풀과(*Polygonaceae*)의 잡초
- [0269] 닭의덩굴속(*Fallopia*)의 잡초, 예를 들면, 나도닭의덩굴(*Fallopia convolvulus*).
- [0270] 여뀌속(*Persicaria*)의 잡초, 예를 들면, 명아주여뀌(*Persicaria lapathifolia*), 개여뀌(*Persicaria longiseta*).
- [0271] (9) 꼭두서니과(*Rubiaceae*)의 잡초
- [0272] 갈퀴덩굴속(*Galium*)의 잡초, 예를 들면, 갈퀴덩굴(*Galium spurium* var. *echinospermon*).
- [0273] 방제 대상이 되는 논 잡초로는, 이하에 나타내는 잡초를 들 수 있다.
- [0274] (A) 단자엽류의 잡초
- [0275] (1) 택사과(*Alismataceae*)의 잡초
- [0276] 소귀나물속(*Sagittaria*)의 잡초, 예를 들면, 올미(*Sagittaria pygmaea* Miq.), 소귀나물(*Sagittaria trifolia*).
- [0277] (2) 사초과(*Cyperaceae*)의 잡초
- [0278] 방동사니속(*Cyperus*)의 잡초, 예를 들면, 너도방동사니(*Cyperus serotinus*), 알방동사니(*Cyperus difforis*);
- [0279] 바늘골속(*Eleocharis*)의 잡초, 예를 들면, 올방개(*Eleocharis kuroguwai* Ohwi);
- [0280] 올챙이골속(*Schoenoplectiella*)의 잡초, 예를 들면, 좀올챙이골(*Schoenoplectiella hotarui*), 올챙이고랭이(*Schoenoplectiella juncoides* Roxb.).
- [0281] 고랭이속(*Scirpus*)의 잡초, 예를 들면, 매자기(*Scirpus martimus*), 물고랭이(*Scirpus nipponicus*).
- [0282] (3) 벼과(*Poaceae*)의 잡초
- [0283] 피속(*Echinochloa*)의 잡초(이른바, 피), 예를 들면, 강피(*Echinochloa oryzoides*), 돌피(*Echinochloa crus-galli*);
- [0284] 겨풀속(*Leersia*)의 잡초, 예를 들면, 나도겨풀(*Leersia japonica*);
- [0285] 참새피속(*Paspalum*)의 잡초, 예를 들면, 물참새피(*Paspalum distichum*).
- [0286] (4) 물옥잠과(*Pontederiaceae*)의 잡초
- [0287] 물옥잠속(*Monochoria*)의 잡초, 예를 들면, 물옥잠(*Monochoria korsakowii*), 물달개비(*Monochoria vaginalis* var. *plantaginea*).
- [0288] (B) 쌍자엽류의 잡초
- [0289] (1) 미나리과(*Apiaceae*)의 잡초
- [0290] 미나리속(*Oenanthe*)의 잡초, 예를 들면, 미나리(*Oenanthe javanica*).
- [0291] (2) 물별과(*Elatinaceae*)의 잡초
- [0292] 물별속(*Elatine*)의 잡초, 예를 들면, 물별(*Elatine triandra*).
- [0293] (3) 외풀과(*Linderniaceae*)의 잡초
- [0294] 외풀속(*Lindernia*)의 잡초, 예를 들면, 나도미국외풀(*Lindernia dubia* subsp. *major*), 미국외풀(*Lindernia dubia* subsp. *dubia*), 발뚝외풀(*Lindernia procumbens*).
- [0295] (4) 부처꽃과(*Lythraceae*)의 잡초
- [0296] 마디꽃속(*Rotala*)의 잡초, 예를 들면, 마디꽃(*Rotala indica* var. *uliginosa*).
- [0297] 또한, 본 발명은 유용 식물에 있어서의 단자엽류 및/또는 쌍자엽류의 잡초를 방제하는 방법으로서, 화합물 (I) 또는 그의 염, 또는 화합물 (I)를 함유하는 제초제를 상기 잡초 및/또는 상기 식물 및/또는 그의 자리에 사용하는 공정을 포함하는 방법이다.

- [0298] 본 발명의 방법을 사용함으로써, 유용 식물 및/또는 잡초를 포함하는 장소에 있어서도, 잡초를 선택적으로 방제하는 것이 가능하다.
- [0299] 또한, 유용 식물이 성장하고 있는 장소 이외에도, 유용 식물이 성장할 예정인 장소에 있어서도, 잡초의 방제가 가능하다.
- [0300] 시용 방법은 일반적으로, 제초제를 제형에 맞추어, 분무, 살분, 점적, 관주, 혼화 등의 방법에 따라 행할 수 있다.
- [0301] 본 발명의 제초제는 본 발명 화합물만으로 이루어지는 것이어도 되고, 농약으로서 일반적으로 취할 수 있는 제형, 예를 들면, 수화제, 입제, 분제, 유제, 수용제, 현탁제, 플로어블 등으로 제제화한 것이어도 된다.
- [0302] 제제화에 있어서 공지의 첨가제 또는 담체를 사용할 수 있다.
- [0303] 즉, 본 발명의 양태의 하나는, 농에 화학적으로 허용할 수 있는 고체 담체, 및/또는 액체 담체를 포함하는 제초제이다.
- [0304] 고체의 제형을 목적으로 하는 경우에는, 콩가루, 밀가루 등의 식물성 분말, 규조토, 인회석, 석고, 톨크, 벤토나이트, 파이로필라이트, 클레이 등의 광물성 미분말, 벤조산소다, 요소, 망초 등의 유기 및 무기 화합물 등의 고체 담체를 사용할 수 있다.
- [0305] 액체의 제형을 목적으로 하는 경우에는, 케로신, 자일렌, 및 솔벤트나프타 등의 석유 유분, 시클로헥산, 시클로헥사논, 디메틸포름아미드, 디메틸설폭시드, 알코올, 아세톤, 트리클로로에틸렌, 메틸이소부틸케톤, 광물유, 식물유, 물 등의 액체 담체를 사용할 수 있다.
- [0306] 제제화에 있어서, 필요에 따라, 계면 활성제를 첨가할 수 있다. 계면 활성제로는, 폴리옥시에틸렌이 부가된 알킬페닐에테르, 폴리옥시에틸렌이 부가된 알킬에테르, 폴리옥시에틸렌이 부가된 고급 지방산 에스테르, 폴리옥시에틸렌이 부가된 소르비탄 고급 지방산 에스테르, 폴리옥시에틸렌이 부가된 트리스티릴페닐에테르 등의 비이온성 계면 활성제, 폴리옥시에틸렌이 부가된 알킬페닐에테르의 황산에스테르염, 알킬나프탈렌설포산염, 폴리카복실산염, 리그닌설포산염, 알킬나프탈렌설포산염의 포름알데히드 축합물, 이소부틸렌-무수 말레산의 공중합체 등을 들 수 있다.
- [0307] 본 발명의 제초제는 제형에 따라, 유효 성분 농도를 적절히 설정할 수 있다. 예를 들면, 수화제에 있어서의 유효 성분 농도는, 바람직하게는 5~90중량%, 보다 바람직하게는 10~85중량%이다. 유제에 있어서의 유효 성분 농도는, 바람직하게는 3~70중량%, 보다 바람직하게는 5~60중량%이다. 입제에 있어서의 유효 성분 농도는, 바람직하게는 0.01~50중량%, 보다 바람직하게는 0.05~40중량%이다.
- [0308] 이와 같이 하여 얻어진 수화제 또는 유제는 물에서 소정의 농도로 희석하여 현탁액 또는 유탁액으로 하고, 입제는 그대로 잡초의 발아 전 또는 발아 후 토양에 살포 처리 또는 혼화 처리할 수 있다. 본 발명의 제초제를 포장에 적용하는데 있어서는 1헥타르당 유효 성분 0.1g 이상의 적당량을 시용할 수 있다.
- [0309] 또한, 본 발명의 제초제는 공지의 살균제, 살균 활성 성분, 살충제, 살충 활성 성분, 살진드기제, 살진드기 활성 성분, 제초제, 제초 활성 성분, 식물 생장 조절제, 비료, 약해 경감제(세이프너) 등과 혼합하여 사용할 수도 있다. 특히, 제초제와 혼합 사용함으로써, 사용약량을 감소시키는 것이 가능하다. 또한, 노동력 절감을 가져올 뿐만 아니라, 혼합 약제의 상승 작용에 의해 한층 높은 효과도 기대할 수 있다. 그 경우, 복수의 공지 제초제와의 조합도 가능하다.
- [0310] 즉, 본 발명의 양태의 하나는, 1개 이상의 또 다른 제초 활성 성분을 포함하는 제초제이다.
- [0311] 또한, 본 발명의 양태의 하나는, 1개 이상의 또 다른 약해 경감제를 포함하는 제초제이다.
- [0312] 본 발명에 사용되는 그 밖의 제초 활성 성분으로는, 특별히 제약되지 않으나, 예를 들면, 다음과 같은 것을 들 수 있다.
- [0313] (a) 클로디나포프로파르길(clodinafop-propargyl), 시할로포부틸(cyhalofop-butyl), 디클로포메틸(diclofop-methyl), 페녹사프로프 에틸(fenoxaprop-P-ethyl), 플루아지포프P(fluzifop-P), 플루아지포프-P-부틸(fluzifop-P-butyl), 할록시포메틸(haloxifop-methyl), 피리페늄나트륨(pyriphenop-sodium), 프로파퀴자포프(propaquizafop), 퀴자로포프 에틸(quizalofop-P-ethyl), 메타미포프(metamifop) 등의 아릴옥시페녹시프로피온산에스테르계; 알록시딤(alloxydim), 부트록시딤(butroxydim), 클레토딤(clethodim), 시클록시딤(cycloxydim), 프로록시딤

(profoxydim), 세톡시딤(sethoxydim), 테프라록시딤(tepraloxym), 트랄록시딤(tralkoxydim) 등의 시클로헥산 디온계; 피녹사덴(pinoxaden) 등의 페닐피라졸린계; 그 외의 식물의 아세틸CoA카르복실라아제를 저해함으로써 제초 효력을 나타낸다고 되어 있는 것.

[0314]

(b) 아마도설푸론(amidosulfuron), 아짐설푸론(azimsulfuron), 벤설푸론메틸(bensulfuron-methyl), 클로리무론 에틸(chlorimuron-ethyl), 클로르설푸론(chlorsulfuron), 시노설푸론(cinosulfuron), 시클로설파무론(cyclosulfamuron), 에타메트설푸론메틸(ethametsulfuron-methyl), 에톡시설푸론(ethoxysulfuron), 플라자설푸론(flazasulfuron), 플루필설푸론(flupyrasulfuron), 포람설푸론(foramsulfuron), 할로설푸론메틸(halosulfuron-methyl), 이마조설푸론(imazosulfuron), 요오드설푸론(iodosulfuron-methyl), 메소설푸론(mesosulfuron), 메소설푸론메틸(mesosulfuron-methyl), 메트설푸론메틸(metsulfuron-methyl), 니코설푸론(nicosulfuron), 옥사설푸론(oxasulfuron), 프리미설푸론(primisulfuron), 프로설푸론(prosulfuron), 피라조설푸론에틸(pyrazosulfuron-ethyl), 림설푸론(rimsulfuron), 설포메트론메틸(sulfometuron-methyl), 설포설푸론(sulfosulfuron), 티펜설푸론메틸(thifensulfuron-methyl), 트리아설푸론(triasulfuron), 트리베누론메틸(tribenuron-methyl), 트리플루옥시설푸론(trifloxysulfuron), 트리플루설푸론메틸(triflusaluron-methyl), 트리토설푸론(tritosulfuron), 오르소설파무론(orthosulfamuron), 프로피리설푸론(propyrisulfuron), 플루세토설푸론(flucetosulfuron), 메타조설푸론(metazosulfuron), 메티오피설푸론(methiopyrsulfuron), 모노설푸론메틸(monosulfuron-methyl), 오르소설푸론(orsosulfuron), 이오펜설푸론(iofensulfuron) 등의 설포닐우레아계; 이마자픽(imazapic), 이마자메타벤즈(imazamethabenz), 이마자목스암모늄(imazamox-ammonium), 이마자필(imazapyr), 이마자퀸(imazaquin), 이마제타필(imazethapyr) 등의 이미다졸리논계; 클로란술람메틸(cloransulam-methyl), 디클로술람(diclosulam), 플로라술람(florasulam), 플루메트술람(flumetsulam), 메토술람(metosulam), 페녹스술람(penoxsulam), 피록스술람(pyroxsulam), 메토설팜(metosulfam) 등의 트리아졸로피리미딘설폰아미드계; 비스피리백-나트륨(bispyribac-sodium), 피리벤족심(pyribenzoxim), 피리프탈리드(pyriftalid), 피리티오백-나트륨(pyriothibac-sodium), 피리미노백메틸(pyriminobac-methyl), 피리미설판(pyrimisulfan) 등의 피리미디닐(티오)벤조에이트계; 플루카르바존(flucarbazone), 프로폭시카르바존(propoxycarbazone), 티엔카르바존메틸(thiencarbazone-methyl) 등의 설포닐아미노카르보닐트리아졸리논계; 트리아파몬(triafame) 등의 설포아닐리드계; 그 외의 식물의 아세트라트산 합성 효소(ALS)(아세트하이드록시산 합성 효소(AHAS))를 저해함으로써 제초 효력을 나타낸다고 되어 있는 것.

[0315]

(c) 아메트린(ametryn), 아트라진(atrazine), 시아나진(cyanazine), 데스메트린(desmetryne), 디메타메트린(dimethametryn), 프로메톤(prometon), 프로메트린(prometryn), 프로파진계(프로파진(propazine)), CAT(시마진(simazine)), 시메트린(simetryn), 테르부메톤(terbumeton), 테르부티라진(terbutylazine), 테르부트린(terbutryne), 트리에타진(trietazine), 아트라톤(atratone), 시부트린(cybutryne) 등의 트리아진계; 헥사지논(hexazinone), 메타미트론(metamitron), 메트리부진(metribuzin) 등의 트리아지논계; 아미카르바존(amicarbazone) 등의 트리아졸리논계; 브로마실(bromacil), 레나실(lenacil), 테르바실(terbacil) 등의 우라실계; PAC(클로리다존(chloridazon)) 등의 피리다지논계; 데스메디팜(desmedipham), 펜메디팜(phenmedipham), 스웍(sweep) 등의 카르바메이트계; 클로로브로무론(chlorobromuron), 클로로토루론(chlorotoluron), 클로록수론(chloroxuron), 디메푸론(dimefuron), DCMU(디우론(diuron)), 에티디무론(ethidimuron), 페뉴론(fenuron), 플루오메투론(flumeturon), 이소프로투론(isoproturon), 이소우론(isouron), 리뉴론(linuron), 메타벤즈티아주론(methabenzthiazuron), 메토브로무론(metobromuron), 메톡수론(metoxuron), 모노리뉴론(monolinuron), 네부론(neburon), 시듀론(siduron), 테부티우론(tebuthiuron), 메토벤주론(metobenzuron), 카르부틸레이트(karbutilate) 등의 요소계; DCPA(프로파닐(propanil)), CMM(펜타노클로르(pentachlor)) 등의 아미드계; 시프로미드(cypromid) 등의 아닐리드계; 브로모페녹심(bromofenoxim), 브로목시닐(bromoxynil), 아이옥시닐(ioxynil) 등의 니트릴계; 벤타존(bentazone) 등의 벤조티아디아지논계; 피리데이트(pyridate), 피리다폴(pyridafol) 등의 페닐피리다진계; 그 외 메타졸(methazole) 등의 식물의 광합성을 저해함으로써 제초 효력을 나타낸다고 되어 있는 것.

[0316]

(d) 디쿼트(diquat), 파라쿼트(paraquat) 등의 비피리디늄계; 그 외의 그 자체가 식물체 중에서 프리 라디칼이 되어, 활성 산소를 생성시켜 속효적인 제초 효력을 나타낸다고 되어 있는 것.

[0317]

(e) 아시플루오르펜나트륨(acifluorfen-sodium), 비페녹스(bifenox), 클로메톡시닐(클로메톡시펜(chlormethoxyfen)), 플루오로글리코펜(fluoroglycofen), 포메사펜(fomesafen), 할로사펜(halosafen), 락토펜(lactofen), 옥시플루오르펜(oxyfluorfen), 니트로펜(nitrofen), 에톡시펜에틸(ethoxyfen-ethyl) 등의 디페닐 에테르계; 플루아졸레이트(fluzolate), 피라플루펜에틸(pyraflufen-ethyl) 등의 페닐피라졸계; 시니돈에틸

(cinidon-ethyl), 플루미옥사진(flumioxazin), 플루미클로락펜틸(flumiclorac-pentyl), 클로르프탈림(chlorphthalim) 등의 N-페닐프탈이미드계; 플루티아세트메틸(fluthiacet-methyl), 티디아지민(thidiazimin) 등의 티아디아졸계; 옥사디아존(oxadiazon), 옥사디아르길(oxadiargyl) 등의 옥사디아졸계; 아자페니딘(azafenidin), 카르펜트라존에틸(carfentrazone-ethyl), 설펜트라존(sulfentrazone), 벤카르바존(bencarbazone) 등의 트리아졸리논계; 펜톡사존(phentoxazone) 등의 옥사졸리딘디온계; 벤즈펜디존(benzfendizone), 부타페나실(butafenacil) 등의 피리미딘디온계; 사플루페나실(saflufenacil) 등의 설폰아미드계; 플루펜필에틸(flufenpyr-ethyl) 등의 피리다진계; 그 외 피라클로닐(pyrachlonil), 프로플루아졸(proflumazone), 티아페나실(tiafenacil), 트리플루디목사진(trifludimoxazin) 등의 식물의 클로로필 생합성을 저해하고, 광 증감 과산화물질을 식물체 중에 이상 축적시킴으로써 제초 효력을 나타낸다고 되어 있는 것.

[0318] (f) 노르플루라존(norflurazon), 메트플루라존(metflurazon) 등의 피리다진계; 디플루페니칸(diflufenican), 피콜리나펜(picolinafen) 등의 피리딘카복사미드계; 메소트리온(mesotrione), 설펜트리온(sulcotrione), 테푸릴트리온(tefuryltrione), 템보트리온(tembotrione), 비시클로피론(bicyclopyrone), 펜퀴노트리온(fenquinotrione) 등의 트리케톤계; 이소사클로르톨(isoxachlortole), 이소사플루톨(isoxaflutole) 등의 이소옥사졸계; 벤조페납(benzofenap), 피라졸레이트(피라졸리네이트(pyrazolynate)), 피라옥시펜(pyrazoxyfen), 토프라메존(topramezone), 피라설포톨(pyrasulfotole), 톨피라레이트(tolpyralate) 등의 피라졸계; ATA(아미트룰(amtrol)) 등의 트리아졸계; 클로마존(clomazone) 등의 이소옥사졸리딘계; 아클로니펜(aclonifen) 등의 디페닐에테르계; 그 외 베플루부타미드(beflubutamid), 플루리돈(fluridone), 플루로클로리돈(flurochloridone), 플루르타몬(flurtamone), 벤조비시클론(benzobicyclone), 메톡시페논(methoxyphenone), 케토스피라독스(ketospiradox) 등의 카르티노이드 등의 식물의 색소 생합성을 저해하고, 백화 작용을 특징으로 하는 제초 효력을 나타낸다고 되어 있는 것.

[0319] (g) 글리포세이트(glyphosate), 글리포세이트암모늄(glyphosate-ammonium), 글리포세이트이소프로필아민(glyphosate-isopropylamine), 글리포세이트트리메슘(설포세이트(sulfosate)) 등의 글리신계; 그 외의 EPSP 합성 효소 저해

[0320] (h) 글루포시네이트(glufosinate), 글루포시네이트암모늄(glufosinate-ammonium), 비알라포스(비라나포스(bilanafos)) 등의 포스핀산계 등의 글루타민 합성 효소 저해

[0321] 그 외의 식물의 아미노산 생합성을 저해함으로써 제초 효력을 나타낸다고 되어 있는 것.

[0322] (I) 아슬람(asulam) 등의 카르바메이트계; 그 외의 DHP(디히드로프테로인산) 합성 효소 저해

[0323] (j) 베스로딘(벤플루랄린(benfluralin)), 부트랄린(butralin), 디니트라민(dinitramine), 에탈플루랄린(ethalfluralin), 오리잘린(oryzalin), 펜디메탈린(pendimethalin), 트리플루랄린(trifluralin), 니트랄린(nitralin), 프로디아민(prodiamine) 등의 디니트로아닐린계; 아미프로포스메틸(amiprofos-methyl), 부타미포스(butamifos) 등의 포스포로아미데이트계; 디티오피(thiopyr), 티아조필(thiazopyr) 등의 피리딘계; 프로피자미드(propyzamide), 테부탐(tebutam) 등의 벤즈아미드계; 클로르탈(chlorthal), TCTP(클로르탈디메틸(chlorthal-dimethyl)) 등의 벤조산계; IPC(클로르프로팜(chlorpropham), 프로팜(propham), 카르베타미드(carbetamide), 바반(barban) 등의 카르바메이트계; 플람프로-M(flamprop-M), 플람프로-M-이소프로필(flamprop-M-isopropyl) 등의 아릴알라닌계; 아세토클로르(acetochlor), 알라클로르(alachlor), 부타클로르(butachlor), 디메타클로르(dimethachlor), 디메테나미드(dimethenamid), 디메테나미드-P(dimethenamid-P), 메타자클로르(metazachlor), 메톨라클로르(metolachlor), S-메톨라클로르(S-metolachlor), 페톡사미드(pethoxamid), 프레틸라클로르(pretilachlor), 프로파클로르(propachlor), 프로피소클로르(propisochlor), 테닐클로르(thenylchlor) 등의 클로로아세트아미드계; 디페나미드(diphenamid), 나프로파미드(napropamide), 나프로아닐리드(naproanilide) 등의 아세트아미드계; 플루페나세트(flufenacet), 메페나세트(mefenacet) 등의 옥시아세트아미드계; 펜트라자미드(fentrazamide) 등의 테트라졸리논계; 그 외 아닐로포스(anilofos), 인다노판(indanofan), 카펜스트롤(cafenstrole), 피페로포스(piperophos), 메티오졸린(methiozolin), 페녹사설펜(fenoxasulfone), 피록사설펜(pyroxasulfone), 이프헨카르바존(ipfencarbazone) 등의 식물의 미세소관 중합이나 미세소관 형성, 세포 분열을 저해하는 것, 혹은 초장쇄 지방산(Very Long Chain Fatty Acid: VLCFA) 생합성을 저해함으로써 제초 효력을 나타낸다고 되어 있는 것.

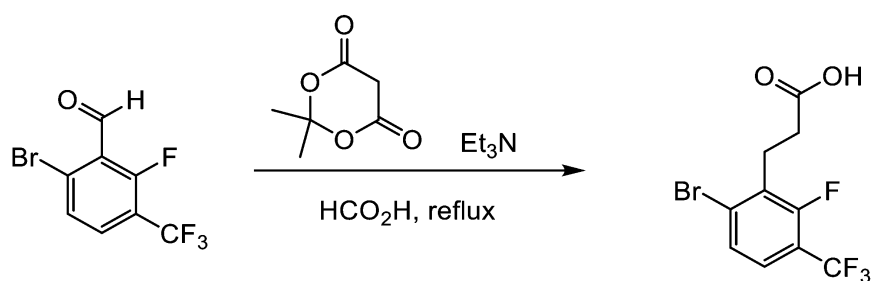
[0324] (k) DBN(디클로베닐(dichlobenil)), DCBN(클로르티아미드(chlorthiamid)) 등의 니트릴계; 이소사벤(isoxaben) 등의 벤즈아미드계; 플루폭삼(flupoxam) 등의 트리아졸로카복사미드계; 퀴클로락(quinclorac) 등의 퀴놀린카복실산계; 그 외 트리아지플람(triaziflam), 인다지플람(indaziflam) 등의 세포벽(셀룰로오스) 합성을 저해함

으로써 제초 효력을 나타낸다고 되어 있는 것.

- [0325] (l) DNOC, DNBP(디노셉(dinoseb)), 디노텡(dinoterb) 등의 디니트로페놀계; 그 외의 언커플링(막 파괴)에 의해 제초 효력을 나타낸다고 되어 있는 것.
- [0326] (m) 부틸레이트(butylate), 헥실티오카르바트(시클로에이트(cycloate)), 디메피페레이트(dimepiperate), EPTC, 에스프로카르브(esprocarb), 몰리네이트(molinate), 오르벤카르브(orbencarb), 페불레이트(pebulate), 프로실포카르브(prosulfocarb), 벤티오카르브(티오벤카르브(thiobencarb)), 티오카르바질(tiocarbazil), 트리알레이트(triallate), 버놀레이트(vernolate), 디알레이트(diallate) 등의 티오카르바메이트계; SAP(벤설라이드(bensulide)) 등의 포스포로디티오에이트계; 벤푸레세이트(benfuresate), 에토푸메세이트(ethofumesate) 등의 벤조푸란계; TCA, DPA(달라폰(dalapon)), 테트라피온(플루프로파네이트(flupropanate)) 등의 클로로탄산계; 그 외의 식물의 지질 생합성을 저해함으로써 제초 효력을 나타낸다고 되어 있는 것.
- [0327] (n) 클로메프롭(clomeprop), 2,4-PA(2,4-D), 2,4-DB, 디클로르프롭(dichlorprop), MCPA, MCPB, MCPP(메코프롭(mecoprop)) 등의 페녹시카르복실산계; 클로람벤(chloramben), MDBA(디캄바(dicamba)), TCBA(2,3,6-TBA) 등의 벤조산계; 클로피랄리드(clopyralid), 아미노피랄리드(aminopyralid), 플루록시필(fluroxypyr), 피클로람(picloram), 트리클로필(triclopyr), 할라시펜(halaxifen) 등의 피리딘카르복실산계; 퀸클로락(quinclorac), 퀸메락(quinmerac) 등의 퀴놀린카르복실산계; NPA(나프탈람(naptalam)), 디플루펜조필(diflufenzopyr) 등의 프탈라메이트세미카르바존계; 그 외 베나졸린(benazolin), 디플루펜조필(diflufenzopyr), 플루록시필(fluroxypyr), 클로르플루레놀(chlorflurenol), 아미노시클로필라클로르(aminocyclopyrachlor), DAS534 등의 식물의 호르몬 작용을 교란함으로써 제초 효력을 나타낸다고 되어 있는 것.
- [0328] (o) 플람프롭메틸/이소프로필(flamprop-isopropyl) 등의 아릴아미노프로피온산계; 디펜조퀴트(difenzoquat) 등의 피라졸륨계; DSMA, MSMA 등의 유기 비소계; 그 외 브로모부티드(bromobutide), (클로르)-플루레놀(chlorflurenol), 신메틸린(cinmethylin), 쿠밀루론(cumyluron), 다조메트(dazomet), 다이무론(daimuron), 메틸다이무론(methyl-dymron), 에토펙자니드(etobenzanid), 포사민(fosamine), 옥사지클로메폰(oxaziclomefone), 올레산(oleic acid), 펠라르곤산(pelargonicacid), 피리부티카르브(pyributicarb), 엔도탈(endothall), 염소산염(sodiumchlorate), 메탐(metam), 퀴노클라민(quinoclamine), 시클로피리모레이트(cyclopyrimorate), 트리디판(tridiphane), 클라시포스(clacyfos) 등의 제초제.
- [0329] 본 발명에 사용할 수 있는 약해 경감제(세이프너)로는 예를 들면, 베녹사코르(benoxacor), 클로퀸토세트(cloquintocet), 클로퀸토세트맥실(cloquintocet-mexyl), 시오메트리닐(cyometrinil), 시프로설파미드(cyprosulfamide), 디클로르미드(dichlormid), 디시클로논(dicyclonon), 디에톨레이트(dietholate), 펜클로라졸(fenchlorazole), 펜클로라졸에틸(fenchlorazole-ethyl), 펜클로림(fencloim), 플루라졸(flurazole), 플록소페님(fluxofenim), 푸릴라졸(furilazole), 이속사디펜(isoxadifen), 이속사디펜에틸(isoxadifen-ethyl), 메펜필(mefenpyr), 메펜필디에틸(mefenpyr-diethyl), 메페네이트(mephenate), 나프탈릭언하이드리드(naphthalic anhydride), 옥사베트리닐(oxabetrinil) 등을 들 수 있다.
- [0330] 실시예
- [0331] [제제예]
- [0332] 본 발명의 제초제에 관한 제제예를 약간 나타내지만, 본 발명 화합물(유효 성분), 첨가물, 및 첨가 비율은 본 실시예에만 한정되지 않고, 넓은 범위로 변경 가능하다. 제제 실시예 중의 부는 중량부를 나타낸다.
- [0333] (제제 실시예 1) 수화제
- [0334] 본 발명 화합물 20부
- [0335] 화이트 카본 20부
- [0336] 규조토 52부
- [0337] 알킬황산소다 8부
- [0338] 이상을 균일하게 혼합, 미세하게 분쇄하여, 유효 성분 20%의 수화제를 얻는다.
- [0339] (제제 실시예 2) 유제
- [0340] 본 발명 화합물 20부

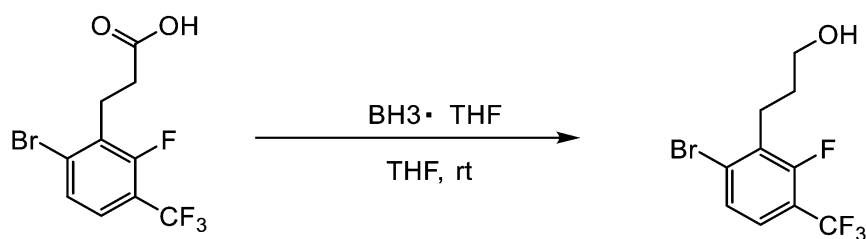
- [0341] 자일렌 55부
- [0342] 디메틸포름아미드 15부
- [0343] 폴리옥시에틸렌페닐에테르 10부
- [0344] 이상을 혼합, 용해하여 유효 성분 20%의 유제를 얻는다.
- [0345] (제제 실시예 3) 입제
- [0346] 본 발명 화합물 5부
- [0347] 탭크 40부
- [0348] 클레이 38부
- [0349] 벤토나이트 10부
- [0350] 알킬황산소다 7부
- [0351] 이상을 균일하게 혼합하고, 미세하게 분쇄 후, 직경 0.5~1.0mm의 입자 형상으로 조립하여 유효 성분 5%의 입제를 얻는다.
- [0352] 이어서, 합성 실시예를 나타낸다. 단, 본 발명은 하기의 실시예에 한정되는 것은 아니다.
- [0353] (실시예 1)
- [0354] 5-(1,1-디옥시도-8-(트리플루오로메틸)티오크로만-5-일)-4-메톡시-2-메틸피리다진-3(2H)-온[5-(1,1-dioxido-8-(trifluoromethyl)thiochroman-5-yl)-4-methoxy-2-methylpyridazin-3(2H)-one]의 합성: (화합물 번호 A-1)
- [0355] (공정 1)
- [0356] 3-(6-브로모-2-플루오로-3-(트리플루오로메틸)페닐)프로피온산의 합성

화학식 11



- [0357]
- [0358] 500ml의 4구 플라스크에 포름산(58.2g), 트리에틸아민(18.3g), 6-브로모-2-플루오로-3-(트리플루오로메틸)벤즈알데히드 48.7g, 및 멜드림산(26.0g)을 0℃에서 순차적으로 첨가했다. 그 후, 4시간 가열 환류했다.
- [0359] 얻어진 액체에 염산을 첨가하고, 석출 고형물을 여별했다. 얻어진 고형물을 건조시킴으로써 목적 화합물 53.8g을 얻었다.
- [0360] (공정 2)
- [0361] 3-(6-브로모-2-플루오로-3-(트리플루오로메틸)페닐)프로판-1-올의 합성

화학식 12



[0362]

[0363]

3-(6-브로모-2-플루오로-3-(트리플루오로메틸)페닐)프로피온산(30g)을 테트라히드로푸란(191ml)에 용해시켜, 0℃에서 교반했다. 여기에 보란·테트라히드로푸란 착체(0.9M, 127ml)를 첨가하고, 실온에서 1시간 교반했다.

[0364]

얻어진 액체를 염산에 따르고, 이어서 초산에틸로 추출했다. 얻어진 유기층을 포화 식염수로 세정하고, 무수황산마그네슘으로 건조시켜, 여과했다. 여과액을 감압 농축했다. 얻어진 농축물을 실리카겔 컬럼 크로마토그래피로 정제함으로써 목적 화합물 28.9g을 얻었다.

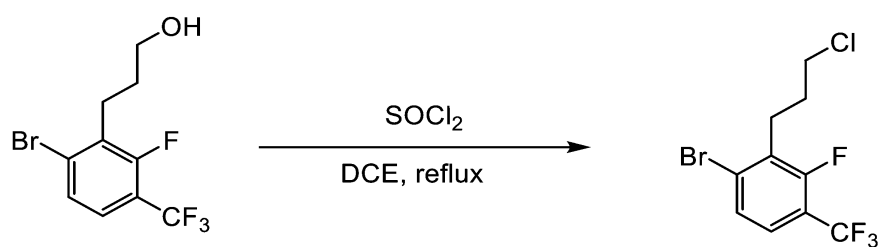
[0365]

(공정 3)

[0366]

1-브로모-2-(3-클로로프로필)-3-플루오로-4-(트리플루오로메틸)벤젠의 합성

화학식 13



[0367]

[0368]

3-(6-브로모-2-플루오로-3-(트리플루오로메틸)페닐)프로판-1-올(15.3g)을 디클로로에탄(102ml)에 용해시켜, 실온에서 교반했다. 여기에 염화티오닐(9.1g) 및 N,N-디메틸포름아미드(0.2g)를 첨가하고, 2시간 가열 환류했다.

[0369]

얻어진 여과액을 감압 농축했다. 얻어진 농축물을 실리카겔 컬럼 크로마토그래피로 정제함으로써 목적 화합물 16.4g을 얻었다.

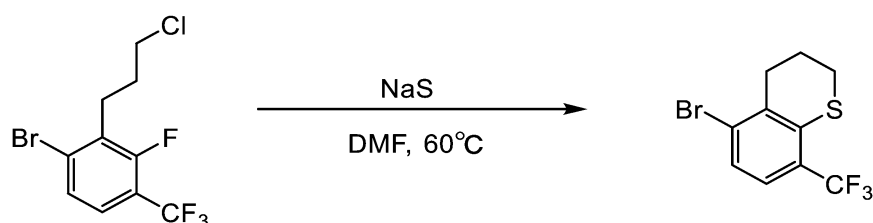
[0370]

(공정 4)

[0371]

5-브로모-8-(트리플루오로메틸)티오크로만의 합성

화학식 14



[0372]

[0373]

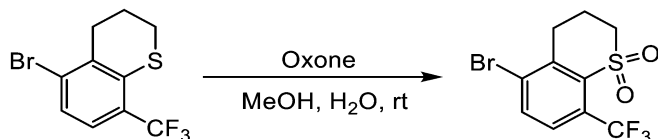
1-브로모-2-(3-클로로프로필)-3-플루오로-4-(트리플루오로메틸)벤젠(14.4g)을 N,N-디메틸포름아미드(158ml)에 용해시켜, 실온에서 교반했다. 여기에 황화나트륨(4.2g)을 첨가하고, 60℃에서 하룻밤 가열 환류했다.

[0374] 얻어진 액체를 물에 따르고, 이어서 초산에틸로 추출했다. 얻어진 유기층을 포화 식염수로 세정하고, 무수황산 마그네슘으로 건조시켜, 여과했다. 여과액을 감압 농축했다. 얻어진 농축물을 실리카겔 컬럼 크로마토그래피로 정제함으로써 목적 화합물 6.8g을 얻었다.

[0375] (공정 5)

[0376] 5-브로모-8-(트리플루오로메틸)티오크로만 1,1-디옥시드의 합성

화학식 15



[0377]

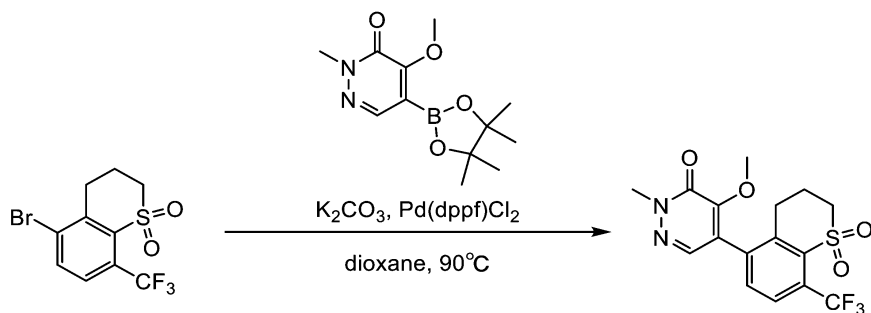
[0378] 5-브로모-8-(트리플루오로메틸)티오크로만(2.0g)을 메탄올 27ml, 물 7ml에 용해시켜, 실온에서 교반했다. 여기에 옥손(8.3g)을 첨가하고, 48시간 실온에서 교반했다.

[0379] 얻어진 액을 여과했다. 여과액을 감압 농축했다. 여기에 물을 따르고, 이어서 초산에틸로 추출했다. 얻어진 유기층을 포화 식염수로 세정하고, 무수황산마그네슘으로 건조시켜, 여과했다. 여과액을 감압 농축했다. 얻어진 농축물을 실리카겔 컬럼 크로마토그래피로 정제함으로써 목적 화합물 2.0g을 얻었다.

[0380] (공정 6)

[0381] 5-(1,1-디옥시도-8-(트리플루오로메틸)티오크로만-5-일)-4-메톡시-2-메틸피리다진-3(2H)-온[5-(1,1-dioxido-8-(trifluoromethyl)thiochroman-5-yl)-4-methoxy-2-methylpyridazin-3(2H)-one]의 합성(화합물 번호: A-1)

화학식 16



[0382]

[0383] 5-브로모-8-(트리플루오로메틸)티오크로만 1,1-디옥시드(0.36g)를 디옥산(10ml)에 용해시켜, 실온에서 교반했다. 여기에 4-메톡시-2-메틸-5-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-디옥사보로란-2-일)피리다진-3(2H)-온(0.27g), 탄산칼륨(0.41g), 및 [1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센]팔라듐(II)디클로라이드-디클로로메탄 부가물(0.04g)을 순차적으로 첨가하고, 90℃에서 하룻밤 교반했다.

[0384] 얻어진 액체를 여과했다. 여과액을 감압 농축했다. 얻어진 농축물을 실리카겔 컬럼 크로마토그래피로 정제함으로써 목적 화합물 0.22g을 얻었다.

화합물 A-1: ¹H-NMR(400MHz, CDCl₃): δ 2.40-2.48(m, 2H), 2.72-2.80(m, 1H), 2.86-2.95(m, 1H), 3.40(t, 2H), 3.83(s, 3H), 4.12(s, 3H), 7.41(d, 1H), 7.44(s, 1H), 7.84(d, 1H).

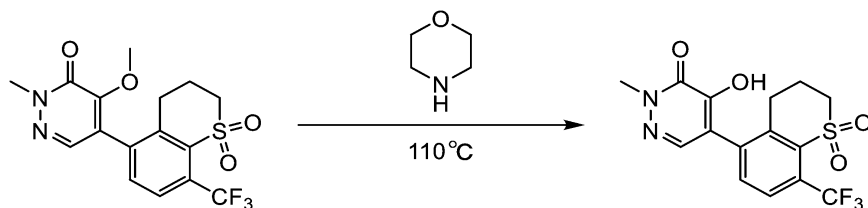
[0385]

[0386] (실시예 2)

[0387] 5-(1,1-디옥시도-8-(트리플루오로메틸)티오크로만-5-일)-4-히드록시-2-메틸피리다진-3(2H)-온[5-(1,1-dioxido-

8-(trifluoromethyl)thiochroman-5-yl)-4-hydroxy-2-methylpyridazin-3(2H)-one]의 합성(화합물 번호 A-2)

화학식 17



[0388]

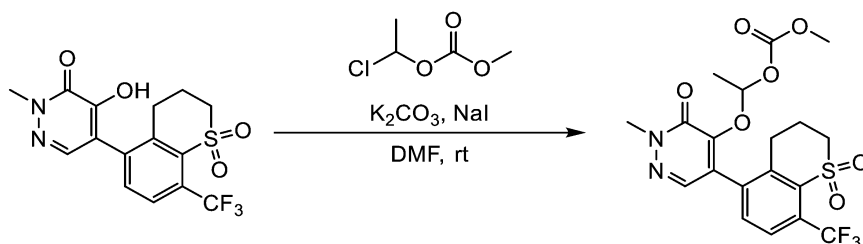
[0389] 5-(1,1-디옥시도-8-(트리플루오로메틸)티오크로만-5-일)-4-메톡시-2-메틸피리다진-3(2H)-온(0.39g)을 모르폴린(2ml)에 용해시켰다. 이를 110°C에서 1시간 가열 환류했다.

[0390] 얻어진 액체를 염산에 따르고, 이어서 초산에틸로 추출했다. 얻어진 유기층을 포화 식염수로 세정하고, 무수황산마그네슘으로 건조시켜, 여과했다. 여과액을 감압 농축함으로써 목적물 0.31g을 얻었다.

[0391] (실시예 3)

[0392] 1-((5-(1,1-디옥시도-8-(트리플루오로메틸)티오크로만-5-일)-2-메틸-3-옥소-2,3-디히드로피리다진-4-일)옥시)에틸메틸카보네이트[1-((5-(1,1-dioxido-8-(trifluoromethyl)thiochroman-5-yl)-2-methyl-3-oxo-2,3-dihydropyridazin-4-yl)oxy)ethyl methyl carbonate]의 합성(화합물 번호 A-3)

화학식 18



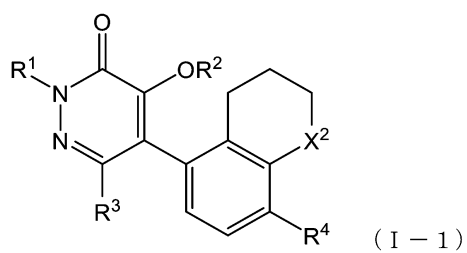
[0393]

[0394] 5-(1,1-디옥시도-8-(트리플루오로메틸)티오크로만-5-일)-4-히드록시-2-메틸피리다진-3(2H)-온(0.10g)을 N,N-디메틸포름아미드(1ml)에 용해시켜, 실온에서 교반했다. 여기에 탄산칼륨(0.06g), 1-클로로에틸메틸카보네이트(0.06g), 및 요오드화나트륨(0.01g)을 순차적으로 첨가하고, 실온에서 3시간 교반했다.

[0395] 얻어진 액체를 감압 농축했다. 얻어진 농축물을 실리카겔 컬럼 크로마토그래피로 정제함으로써 목적 화합물 0.11g을 얻었다.

[0396] 상기 합성 실시예와 동일한 방법으로 제조한 본 발명 화합물의 일 예를 표 1에 나타낸다. 표 1은 식 (I-1)로 나타내는 화합물 중의 치환기를 나타낸다. 아울러 물성값으로서 융점도 나타낸다. Me는 메틸기를 나타내고, ⁱPr는 i-프로필기를 나타내며, ^cPr는 시클로프로필기를 나타내고, Ph는 페닐기를 나타낸다. 이하, 표 2에 있어서 동일한 의미를 나타낸다.

화학식 19



[0397]

표 1

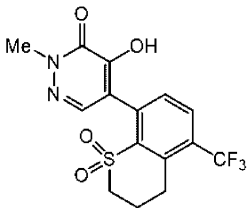
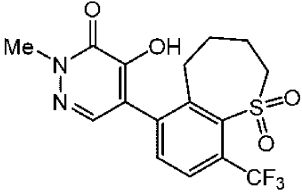
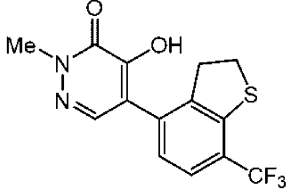
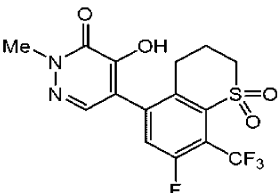
화합물 번호	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ²	물성값
A-2	Me	H	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 287-288°C
A-3	Me	CH(Me)O-CO ₂ Me	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 234-235°C
A-4	Me	H	H	CN	SO ₂	*
A-5	MeOCH ₂ CH ₂	H	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 279-280°C
A-6	Me	CO(1-Me-1H-pyrazol-4-yl)	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 283-287°C
A-7	Me	CO(1,3-Me ₂ -1H-pyrazol-5-yl)	H	CF ₃	SO ₂	*
A-8	Me	H	H	CHF ₂	SO ₂	m. p. 278-280°C
A-9	CH ₂ =CHCH ₂	H	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 251-252°C
A-10	Me	CH(Me)O-CO ⁱ Pr	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 181-183°C
A-11	Me	CH ₂ O-CO ⁱ Pr	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 118-121°C
A-12	Me	CH ₂ (4-MeOPh)	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 157-159°C
A-13	Me	SO ₂ (4-MePh)	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 243-245°C
A-14	Me	CO ₂ Me	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 237-239°C
A-15	Me	COMe	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 226-229°C
A-16	Me	COPh	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 265-268°C
A-17	^t Pr	H	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 250-251°C
A-18	Me	H	H	Cl	S	*
A-19	CF ₃ CH ₂	H	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 279-280°C
A-20	Me	H	^t Pr	CF ₃	SO ₂	m. p. 299-300°C
A-21	Me	H	Me	CF ₃	SO ₂	m. p. 262-263°C
A-22	MeOCH ₂	H	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 206-207°C
A-23	Me	CH(Me)O-CO ₂ Me	H	CF ₃	S	m. p. 140-141°C
A-24	Me	H	H	CF ₃	S	m. p. 246-249°C
A-25	Me	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃	SO ₂	m. p. 135-137°C
A-26	Me	H	H	OCHF ₂	SO ₂	m. p. 294-296°C
A-27	Me	H	H	OCF ₃	SO ₂	m. p. 262-263°C

[0398]

[0399]

또한, 동일한 방법으로 제조한 본 발명 화합물의 일 예를 표 2에 나타낸다.

표 2

화합물 번호	구조식	물성값
B-1		*
B-2		m.p. 216- 218°C
B-3		m.p. 238- 240°C
B-4		*

[0400]

[0401]

표 1 및 2에 기재한 화합물 중, 물성값의 란에 *를 부여한 화합물은, 비결정질 또는 점성 오일의 성상을 갖는 화합물이었다. 그 $^1\text{H-NMR}$ 데이터를 이하에 나타낸다.

화합물 A-4: $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, DMSO d-6): δ 2.20-2.26(m, 2H), 2.78-2.79(m, 2H), 3.68-3.72(m, 5H), 7.65(d, 1H), 7.70(s, 1H), 8.07(d, 1H).

화합물 A-7: $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3): δ 2.25(s, 3H), 2.46-2.52(m, 2H), 2.90-2.96(m, 2H), 3.40-3.43(m, 2H), 3.91(s, 3H), 4.06(s, 3H), 6.63(s, 1H), 7.51(d, 1H), 7.64(s, 1H), 7.86(d, 1H).

화합물 A-18: $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3): δ 2.05-2.17(m, 2H), 2.64(m, 2H), 3.06-3.08(m, 2H), 3.88(s, 3H), 6.87(d, 1H), 7.28(d, 1H), 7.61(s, 1H).

화합물 B-1: $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, DMSO d-6): δ 2.30-2.36(m, 2H), 3.16-3.19(m, 2H), 3.50-3.58(m, 2H), 3.70(s, 3H), 7.47(d, 1H), 7.62(s, 1H), 8.01(d, 1H).

화합물 B-4: $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO d-6): δ 2.21-2.28(m, 2H), 2.76-2.81(m, 2H), 3.54-3.56(m, 2H), 3.72(s, 3H), 7.77(d, 1H).

[0402]

[0403]

(제조 효과의 평가)

- [0404] 이어서 본 발명 화합물이 제초제의 유효 성분으로서 유용하다는 것을 이하의 시험예로 나타낸다.
- [0405] (시험예 1)
- [0406] (1) 시험용 유제의 조제
- [0407] POA 알릴페닐에테르(4.1중량부), POE-POP 글리콜(1중량부), POE 소르비탄라우레이트(0.8중량부), 글리세린(2.6중량부), 디메틸포름아미드(65.9중량부), N-메틸피롤리돈(5.1중량부), 시클로헥사논(15.4중량부), 및 방향족 탄화수소(5.1중량부)를 혼합하여 용해시키고, 유제를 조제했다. 이 유제(100 μ l)에 대해, 본 발명 화합물(4mg)을 용해시키고, 시험용 유제를 조제했다. 한편, POA는 「폴리옥시알킬렌」을, POE는 「폴리옥시에틸렌」을, POP는 「폴리옥시프로필렌」을 의미한다.
- [0408] (2) 경엽 살포 처리
- [0409] 150cm²의 포트에 토양을 충전하고, 표층에 귀리(*Avena sativa*), 카밀레(*Matricaria chamomilla*), 가을 강아지풀(*Setaria faberi*), 바랭이(*Digitaria ciliaris*), 어저귀(*Abutilon theophrasti*), 및 털비름(*Amaranthus retroflexus*)의 종자를 뿌리고, 가볍게 흙을 덮었다. 그 후, 온실 내에서 생육시켰다. 각 식물이 2~4cm의 키로 생육한 시점에서, 소정의 유효 성분량이 되도록 상기 시험용 유제를 물로 희석하고, 헥타르당 250L의 살포수량으로 소형 분무기로 경엽부에 살포했다.
- [0410] (3) 평가
- [0411] 3주일 후, 잡초마다 무처리구 및 처리구의 지상부 생초 중량을 측정하고, 하기의 산출식에 의해 살초율을 산출했다.
- [0412] (4) 살초율의 산출식
- [0413]
$$\text{살초율}(\%) = [(\text{무처리구의 지상부 생초 중량} - \text{처리구의 지상부 생초 중량}) / (\text{무처리구의 지상부 생초 중량})] \times 100$$
- [0414] (a) 귀리
- [0415] 표 3에 나타내는 화합물을, 헥타르당 250g의 살포량이 되도록 희석 유제를 살포했다. 결과, 어느 화합물도 귀리에 대해, 100%의 살초 활성을 나타냈다.

표 3

화합물 번호		
A-2	A-15	B-1
A-3	A-16	B-2
A-5	A-17	
A-6	A-18	
A-7	A-19	
A-10	A-20	
A-11	A-21	
A-12	A-22	
A-13	A-23	
A-14	A-24	

- [0416]
- [0417] (b) 카밀레
- [0418] 표 4에 나타내는 화합물을, 헥타르당 250g의 살포량이 되도록 희석 유제를 살포했다. 결과, 어느 화합물도 카밀레에 대해, 80% 이상의 살초 활성을 나타냈다.

표 4

화합물 번호		
A-2	A-12	A-22
A-3	A-13	A-23
A-4	A-14	A-24
A-5	A-15	B-1
A-6	A-16	B-2
A-7	A-17	B-3
A-8	A-18	A-27
A-9	A-19	B-4
A-10	A-20	
A-11	A-21	

[0419]

[0420]

(c) 가을 강아지풀

[0421]

표 5에 나타내는 화합물을, 헥타르당 250g의 살포량이 되도록 희석 유제를 살포했다. 결과, 어느 화합물도 가을 강아지풀에 대해, 100%의 살초 활성을 나타냈다.

표 5

화합물 번호		
A-2	A-13	B-1
A-3	A-14	B-2
A-4	A-15	B-3
A-5	A-16	
A-6	A-18	
A-7	A-20	
A-8	A-21	
A-10	A-22	
A-11	A-23	
A-12	A-24	

[0422]

[0423]

(d) 바랭이

[0424]

표 6에 나타내는 화합물을, 헥타르당 250g의 살포량이 되도록 희석 유제를 살포했다. 결과, 어느 화합물도 바랭이에 대해, 100%의 살초 활성을 나타냈다.

표 6

화합물 번호		
A-2	A-12	A-22
A-3	A-13	A-23
A-4	A-14	A-24
A-5	A-15	B-1
A-6	A-16	B-2
A-7	A-17	B-3
A-8	A-18	A-26
A-9	A-19	
A-10	A-20	
A-11	A-21	

[0425]

[0426]

(e) 어저귀

[0427]

표 7에 나타내는 화합물을, 헥타르당 250g의 살포량이 되도록 희석 유제를 살포했다. 결과, 어느 화합물도 어저귀에 대해, 80% 이상의 살초 활성을 나타냈다.

표 7

화합물 번호		
A-2	A-13	A-24
A-3	A-14	B-1
A-5	A-15	B-3
A-6	A-16	A-4
A-7	A-17	A-25
A-8	A-18	A-26
A-9	A-20	A-27
A-10	A-21	
A-11	A-22	
A-12	A-23	

[0428]

[0429]

(f) 털비름

[0430]

표 8에 나타내는 화합물을, 헥타르당 250g의 살포량이 되도록 희석 유제를 살포했다. 결과, 어느 화합물도 털비름에 대해, 100%의 살초 활성을 나타냈다.

표 8

화합물 번호		
A-2	A-12	A-22
A-3	A-13	A-23
A-4	A-14	A-24
A-5	A-15	B-1
A-6	A-16	B-2
A-7	A-17	B-3
A-8	A-18	
A-9	A-19	
A-10	A-20	
A-11	A-21	

[0431]

[0432]

(시험예 2) 경엽 처리 시험

[0433]

(1) 시험용 유제의 조제

[0434]

시험예 1과 동일하게 조제했다.

[0435]

(2) 경엽 살포 처리

[0436]

150cm²의 포트에 토양을 충전하고, 표층에 이탈리아인 라이그래스(*Lolium multiflorum*), 바랭이(*Digitaria ciliaris*), 및 사료용 옥수수(*Zea mays*)의 종자를 뿌리고, 가볍게 흙을 덮었다. 그 후, 온실 내에서 생육시켰다. 이탈리아인 라이그래스 및 바랭이가 2~4cm의 키로, 사료용 옥수수가 20~30cm의 키로 생육한 시점에서, 소정의 유효 성분량이 되도록 상기 시험용 유제를 물로 희석하고, 헥타르당 250L의 살포 수량으로 소형 분무기로 경엽부에 살포했다.

[0437]

(3) 평가

[0438]

4주일 후, 이탈리아인 라이그래스, 바랭이, 및 사료용 옥수수의 무처리구 및 처리구의 지상부 생초 중량을 측정하고, 하기의 산출식에 의해 살초율을 산출했다.

[0439]

(4) 살초율의 산출식

[0440]

살초율(%)=[(무처리구의 지상부 생초 중량-처리구의 지상부 생초 중량)/(무처리구의 지상부 생초 중량)]×100

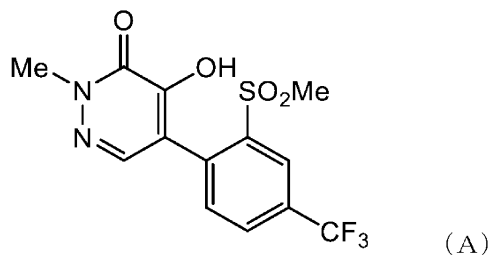
[0441]

A-2의 화합물을, 헥타르당 63g의 살포량이 되도록 희석 유제를 살포했다.

[0442]

또한, 특허문헌 1에 기재된 화합물 (A)에 대해서도 동일하게 살포했다.

화학식 20



[0443]

각 화합물의 살초율을 표 9에 나타낸다.

표 9

화합물 번호	살포량	살초율		
		이탈리안 라이그래스	바랭이	사료용 옥수수
A-2	63g/ha	100%	90%	0%
(A)	63g/ha	40%	80%	50%

[0445]

[0446] (시험예 3)

[0447] (1) 시험용 유제의 조성

[0448] 시험예 1과 동일하게 조제했다.

[0449] (2) 경엽 살포 처리

[0450] 150cm²의 포트에 토양을 충전하고, 표층에 사료용 옥수수(Zea mays), 쥐꼬리뚝새풀(Alopecurus myosuroides), 이탈리아 라이그래스(Lolium multiflorum), 귀리(Avena sativa), 바랭이(Digitaria ciliaris), 가을 강아지풀(Setaria faberi), 어저귀(Abutilon theophrasti), 및 털비름(Amaranthus retroflexus)의 종자를 뿌리고, 가볍게 흙을 덮었다. 그 후, 온실 내에서 생육시켰다. 쥐꼬리뚝새풀, 이탈리아 라이그래스, 귀리, 바랭이, 가을 강아지풀, 어저귀, 및 털비름이 2~4cm의 키로, 사료용 옥수수가 20~30cm의 키로 생육한 시점에서, 소정의 유효 성분량이 되도록 상기 시험용 유제를 물로 희석하고, 헥타르당 250L의 살포수량으로 소형 분무기로 경엽부에 살포했다.

[0451] (3) 평가

[0452] 3주일 후, 잡초마다 무처리구 및 처리구의 지상부 생초 중량을 측정하고, 하기의 산출식에 의해 살초율을 산출했다.

[0453] (4) 살초율의 산출식

[0454]
$$\text{살초율}(\%) = [(\text{무처리구의 지상부 생초 중량} - \text{처리구의 지상부 생초 중량}) / (\text{무처리구의 지상부 생초 중량})] \times 100$$

[0455] A-2의 화합물을, 헥타르당 250g 또는 63g의 살포량이 되도록 희석 유제를 살포했다.

[0456] 또한, 특허문헌 1에 기재된 화합물 (A)에 대해서도 동일하게 살포했다.

[0457] 각 화합물의 살초율을 표 10에 나타낸다. 표 10 중, 「gai」는 활성 성분(active ingredient)의 그램(g)을 나타낸다.

표 10

화합물	살포량	살초율							
		쥐꼬리뚝새풀	이탈리안 라이그래스	귀리	바랭이	가을 강아지풀	어저귀	털비름	사료용 옥수수
A-2	250gai/ha	100%	100%	100%	100%	100%	100%	100%	20%
A-2	63gai/ha	80%	100%	100%	90%	100%	100%	100%	0%
(A)	250gai/ha	90%	50%	80%	90%	100%	90%	100%	90%
(A)	63gai/ha	50%	40%	60%	80%	80%	80%	100%	40%

[0458]

[0459] 상기 표 9 및 표 10에 나타난 결과로부터 명백한 바와 같이, 본 발명 화합물은 특허문헌 1에 기재된 화합물에 비해, 저약량으로도 경엽 처리에 있어서의 살초 효과가 우수하다. 한편, 본 발명 화합물은 사료용 옥수수에 대해, 살초 효과를 나타내지 않은 점에서, 본 발명 화합물이 작물에 따라 안전한 것을 알 수 있다.

산업상 이용가능성

[0460]

본 발명의 피리다진 화합물은, 저약량으로도 확실한 잡초 방제 효과를 나타내고, 작물에 대한 약해가 적으며, 또한 환경에 대한 안전성이 높기 때문에, 제초제의 유효 성분으로서 유용하다. 발명의 제초제는 농원에 작물의 재배에 있어서, 잡초의 방제를 위해 안심하고 사용할 수 있다.