(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2024-0123806
(43) 공개일자 2024년08월14일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
C07D 401/06 (2006.01) *A01N 43/56* (2006.01)
A01N 43/647 (2006.01) *A01N 43/653* (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01) *C07D 405/14* (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01) *C07D 417/14* (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01) *C07D 491/048* (2006.01)
C07D 491/052 (2006.01)
(52) CPC특허분류
C07D 401/06 (2013.01)
A01N 43/56 (2013.01)
(21) 출원번호 10-2024-7021419
(22) 출원일자(국제) 2022년12월09일
심사청구일자 없음
(85) 번역문제출일자 2024년06월26일
(86) 국제출원번호 PCT/EP2022/085139
(87) 국제공개번호 WO 2023/110664
국제공개일자 2023년06월22일
(30) 우선권주장
21215564.2 2021년12월17일
유럽특허청(EPO)(EP)

(71) 출원인
신젠타 크롭 프로텍션 아게
스위스 바젤 로젠탈슈트라쎄 67 (우: 4058)
(72) 발명자
월리, 루이자
영국 알쥐42 6이와이 브랙넬 질로츠 힐 인터내셔널 리서치 센터 신젠타
모리스, 제임스 앨런
영국 알쥐42 6이와이 버크셔 브랙넬 질로츠 힐 인터내셔널 리서치 센터 신젠타
(뒷면에 계속)
(74) 대리인
특허법인(유)남아이피그룹

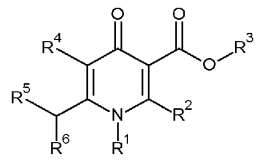
전체 청구항 수 : 총 15 항

(54) 발명의 명칭 **제초제 피리돈 유도체**

(57) 요 약

화학식 I의 화합물:

[화학식 I]



상기 식에서, 치환기는 제1항에 정의된 바와 같다. 본 발명은 추가로 화학식 I의 화합물을 포함하는 제초제 조성물, 및 특히 유용한 식물의 작물에서 잡초를 방제하기 위한 화학식 I의 화합물의 용도에 관한 것이다.

(52) CPC특허분류
A01N 43/647 (2013.01)
A01N 43/653 (2013.01)
C07D 401/14 (2013.01)
C07D 405/14 (2013.01)
C07D 409/14 (2013.01)
C07D 417/14 (2013.01)
C07D 471/04 (2022.08)
C07D 491/048 (2013.01)
C07D 491/052 (2013.01)
(72) 발명자
마틴, 크리스토퍼, 제임스
영국 알쥐42 6이에스 버크셔 브랙넬 질로츠 힐 인터내셔널 리서치 센터 신젠타
먼스, 고든 리차드
영국 알쥐42 6이와이 브랙넬 질로츠 힐 인터내셔널 리서치 센터 신젠타

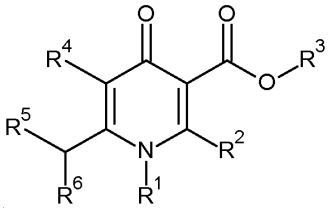
명 세 서

청구범위

청구항 1

화학식 I의 화합물:

[화학식 I]



[상기 식에서,

R^1은 C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_2-C_6알케닐, C_2-C_6알키닐, 또는 C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬이고;

R^2는 페닐 또는 헤테로아릴이고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 3 또는 4개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 각각의 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^7로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

R^3은 수소 또는 C_1-C_6알킬이고;

R^4는 수소, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6할로알킬, 또는 페닐이고, 페닐 모이어티는 각각, R^8로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

R^5는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 1, 2, 또는 3개의 질소 원자를 포함하는 5원 방향족 모노사이클릭 고리임)이고, 헤테로아릴 모이어티는 헤테로아릴 고리에서 질소 원자를 통해 분자의 나머지에 부착되고, 헤테로아릴 모이어티는 각각, R^9로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

R^6은 수소, C_1-C_3알킬, 또는 C_1-C_6알콕시이고;

R^7은 시아노, 니트로, 아미노, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬, C_1-C_6알킬설파닐, C_1-C_6알킬설피닐, C_1-C_6알킬설포닐, C_1-C_6알킬설폰아미도, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, 또는 N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노카보닐이고;

R^8은 할로겐, C_1-C_3알킬, 또는 C_1-C_3알콕시이고;

R^9는 포르밀, 아세틸, 시아노, 아미노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_2-C_6알케닐옥시, 시아노C_1-C_6알킬, 시아노C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_6알킬설파닐, C_1-C_6알킬설피닐, C_1-C_6알킬설포닐, C_1-C_6알킬설폰아미도, 하이드록시카보닐, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_1-C_6알킬아미노, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알콕시이미노C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_2-C_6알케닐카보닐아미노, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노, N,N-디(C_1-C_4

알킬)아미노카보닐, 페닐, 벤질옥시, 또는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 또는 3개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리임)이고, 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 C_3-C_6사이클로알킬 고리 또는 페닐 고리를 형성할 수 있고, C_3-C_6사이클로알킬 및 페닐 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 3 또는 4개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

R^{10}은 할로겐, 니트로, C_1-C_3알킬 또는 C_1-C_3알콕시임];

또는 이의 염 또는 N-옥사이드.

청구항 2

제1항에 있어서, R^2는 페닐 또는 헤테로아릴이고, 헤테로아릴 모이어티는 N 및 O로부터 개별적으로 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 각각의 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^7로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있는, 화합물.

청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, R^2는 R^7로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환된 페닐인, 화합물.

청구항 4

제1항 내지 제3항 중 어느 한 항에 있어서, R^3은 수소 또는 C_1-C_4알킬인, 화합물.

청구항 5

제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 있어서, R^4는 수소, 할로겐, C_1-C_3알킬, 또는 페닐이고, 페닐 모이어티는 단일 R^8 기로 선택적으로 치환될 수 있는, 화합물.

청구항 6

제1항 내지 제5항 중 어느 한 항에 있어서, R^5는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 1, 2, 또는 3개의 질소 원자를 포함하는 5원 방향족 모노사이클릭 고리임)이고, 헤테로아릴 모이어티는 헤테로아릴 고리에서 질소 원자를 통해 분자의 나머지에 부착되고, 헤테로아릴 모이어티는 각각, R^9로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있는, 화합물.

청구항 7

제1항 내지 제6항 중 어느 한 항에 있어서, R^5는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 2 또는 3개의 질소 원자를 포함하는 5원 방향족 모노사이클릭 고리임)이고, 헤테로아릴 모이어티는 헤테로아릴 고리에서 질소 원자를 통해 분자의 나머지에 부착되고, 헤테로아릴 모이어티는 각각, R^9로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있는, 화합물.

청구항 8

제1항 내지 제7항 중 어느 한 항에 있어서, R^9는 포르밀, 아세틸, 시아노, 아미노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_2-C_6알케닐옥시, 시아노C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_6알킬설파닐, C_1-C_6알킬설포닐, 하이드록시카보닐, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_1-C_6알콕시이미노C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_2-C_6알케닐카보닐아미노, C_3-C_6사이클로알킬, 페닐, 또는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 또는 3개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리임)이고, 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 C_3-C_6사이클로알킬 고리 또는 페닐 고리를 형성할 수 있고, C_3-C_6사이클로알킬 및 페닐 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 또는 3개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있는, 화합물.

청구항 9

제1항 내지 제7항 중 어느 한 항에 있어서, R^9는 아세틸, 시아노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_4알킬, C_1-C_4알콕시, C_1-C_4할로알킬, C_1-C_4할로알콕시, C_2-C_4알케닐옥시, 시아노C_1-C_4알킬, C_1-C_4알콕시C_1-C_4알킬, C_1-C_4알콕시C_1-C_4알콕시, C_1-C_4알콕시카보닐, C_1-C_4알킬설파닐, C_1-C_4알킬설포닐, C_1-C_4알킬카보닐, C_1-C_4알킬카보닐아미노, C_1-C_4알콕시이미노C_1-C_4알킬, C_1-C_4알콕시C_1-C_4알킬카보닐아미노, C_2-C_4알케닐카보닐아미노, C_3-C_4사이클로알킬, 페닐, 또는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리임)이고, 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 C_5-C_6사이클로알킬 고리 또는 페닐 고리를 형성할 수 있고, C_5-C_6사이클로알킬 및 페닐 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또

는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

임의의 2개의 인접한 R^{9} 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수 있는, 화합물.

청구항 10

제1항 내지 제9항 중 어느 한 항에 있어서, R^{10}은 할로겐인, 화합물.

청구항 11

제1항 내지 제10항 중 어느 한 항에 따른 화합물 및 농업적으로 허용 가능한 제형 보조제를 포함하는, 제초제 조성물.

청구항 12

제11항에 있어서, 적어도 하나의 추가의 농약(pesticide)을 추가로 포함하는, 제초제 조성물.

청구항 13

제12항에 있어서, 추가의 농약은 제초제 또는 제초제 약해 경감제인, 제초제 조성물.

청구항 14

제1항 내지 제10항 중 어느 한 항에 정의된 바와 같은 화학식 I의 화합물, 또는 제11항 내지 제13항 중 어느 한 항에 따른 제초제 조성물을 원치 않는 식물에 또는 이의 생육지(locus)에 시용하는 단계를 포함하는, 원치 않는 식물 성장을 방제하는 방법.

청구항 15

제1항 내지 제10항 중 어느 한 항에 따른 화학식 I의 화합물의 제초제로서의 용도.

발명의 설명

기 술 분 야

[0001] 본 발명은, 예를 들어 제초제 활성을 갖는 유효 성분으로서의 제초제 피리돈 유도체에 관한 것이다. 본 발명은 또한 피리돈 유도체 중 적어도 하나를 포함하는 농화학적 조성물, 이들 화합물의 제조 프로세스, 및 특히 유용한 식물의 작물에서 잡초를 방제하기 위한 농업 또는 원예에서의 피리돈 유도체 또는 조성물의 용도에 관한 것이다.

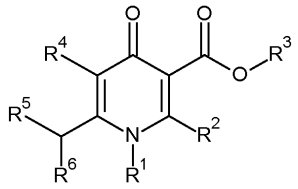
배 경 기 술

[0002] EP0239391호, EP0127313호, EP0040082호, CN108617661호, 및 GB2182931호에 제초 제제로서의 피리돈 유도체가 기술되어 있다.

발명의 내용

[0003] 본 발명에 따르면, 화학식 I의 화합물:

[0004] [화학식 I]



[0005]

[0006] [상기 식에서,

[0007] R^1은 C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_2-C_6알케닐, C_2-C_6알키닐, 또는 C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬이고;

[0008] R^2는 페닐 또는 헤테로아릴이고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 3 또는 4개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 각각의 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^7로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

[0009] R^3은 수소 또는 C_1-C_6알킬이고;

[0010] R^4는 수소, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6할로알킬, 또는 페닐이고, 페닐 모이어티는 각각, R^8로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

[0011] R^5는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 1, 2, 또는 3개의 질소 원자를 포함하는 5원 방향족 모노사이클릭 고리임)이고, 헤테로아릴 모이어티는 헤테로아릴 고리에서 질소 원자를 통해 분자의 나머지에 부착되고, 헤테로아릴 모이어티는 각각, R^9로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

[0012] R^6은 수소, C_1-C_3알킬, 또는 C_1-C_6알콕시이고;

[0013] R^7은 시아노, 니트로, 아미노, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬, C_1-C_6알킬설파닐, C_1-C_6알킬설피닐, C_1-C_6알킬설포닐, C_1-C_6알킬설폰아미도, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, 또는 N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노카보닐이고;

[0014] R^8은 할로겐, C_1-C_3알킬, 또는 C_1-C_3알콕시이고;

[0015] R^9는 포르밀, 아세틸, 시아노, 아미노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_2-C_6알케닐옥시, 시아노C_1-C_6알킬, 시아노C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_6알킬설파닐, C_1-C_6알킬설피닐, C_1-C_6알킬설포닐, C_1-C_6알킬설폰아미도, 하이드록시카보닐, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_1-C_6알킬아미노, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알콕시이미노C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_2-C_6알케닐카보닐아미노, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노, N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노카보닐, 페닐, 벤질옥시, 또는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 또는 3개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리임)이고, 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0016] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 C_3-C_6사이클로알킬 고리 또는 페닐 고리를 형성

할 수 있고, C_3-C_6사이클로알킬 및 페닐 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0017] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 3 또는 4개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0018] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

[0019] R^{10}은 할로겐, 니트로, C_1-C_3알킬 또는 C_1-C_3알콕시임];

[0020] 또는 이의 염 또는 N-옥사이드가 제공된다.

[0021] 놀랍게도, 실용적 목적을 위한 화학식 I의 신규 화합물은 매우 유리한 수준의 제초제 활성을 갖는다는 것이 발견되었다.

[0022] 본 발명의 제2 양태에 따르면, 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물의 제초 유효량을 포함하는 농화학적 조성물이 제공된다. 이러한 농업 조성물은 적어도 하나의 추가의 유효 성분 및/또는 농화학적으로 허용 가능한 희석제 또는 담체를 추가로 포함할 수 있다.

[0023] 본 발명의 제3 양태에 따르면, 화학식 I의 화합물을 포함하는 조성물의 잡초 방제량을 생육지(locus)에 시용하는 단계를 포함하는, 생육지에서 잡초를 방제하는 방법이 제공된다.

[0024] 본 발명의 제4 양태에 따르면, 화학식 I의 화합물의 제초제로서의 용도가 제공된다.

[0025] 치환기가 "선택적으로 치환되는" 것으로 명시되는 경우, 이는 이들이 하나 이상의 동일하거나 상이한 치환기, 예를 들어 1, 2 또는 3개의 R^7 치환기를 보유할 수 있거나, 보유할 수 없음을 의미한다. 예를 들어, 1, 2 또는 3개의 할로겐에 의해 치환된 C_1-C_6알킬은 $-CH_2Cl$, $-CHCl_2$, $-CCl_3$, $-CH_2F$, $-CHF_2$, $-CF_3$, $-CH_2CF_3$ 또는 $-CF_2CH_3$ 기를 포함할 수 있지만, 이로 제한되지는 않는다. 또 다른 예로서, 1, 2 또는 3개의 할로겐에 의해 치환된 C_1-C_6알콕시는 CH_2ClO-, $CHCl_2O-$, CCl_3O-, CH_2FO-, CHF_2O-, CF_3O-, CF_3CH_2O- 또는 CH_3CF_2O- 기를 포함할 수 있지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0026] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "시아노"는 -CN 기를 의미한다.

[0027] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "하이드록시" 또는 "하이드록실"은 -OH 기를 지칭한다.

[0028] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "할로겐"은 불소(플루오로), 염소(클로로), 브롬(브로모) 또는 요오드(아이오도)를 지칭한다.

[0029] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "니트로"는 $-NO_2$ 기를 의미한다.

[0030] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "포르밀"은 -C(O)H 기를 의미한다.

[0031] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "아세틸"은 $-C(O)CH_3$ 기를 의미한다.

[0032] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알킬"은 오로지 탄소 및 수소 원자로 구성되고, 불포화를 함유하지 않고, 1 내지 6개의 탄소 원자를 갖고, 단일 결합에 의해 분자의 나머지에 부착되는 직선형 또는 분지형 탄화수소 사슬 라디칼을 지칭한다. "C_1-C_4알킬" 및 "C_1-C_3알킬"은 이에 따라 해석되어야 한다. C_1-C_6알킬의 예는 메틸, 에틸, n-프로필, 및 이의 이성질체, 예를 들어 이소-프로필을 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다. "C_1-C_6알킬렌" 기는 C_1-C_6알킬의 상응하는 정의를 지칭하지만, 이러한 라디칼이 2개의 단일 결합에 의해 분자의 나머지에 부착되

는 것은 제외한다. 용어 "C_1-C_2알킬렌"은 이에 따라 해석되어야 한다. C_1-C_6알킬렌의 예는 -CH_2-, -CH_2CH_2- 및 -$(CH_2)_3$-을 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0033] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6할로알킬"은 동일하거나 상이한 할로겐 원자 중 하나 이상에 의해 치환된, 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬 라디칼을 지칭한다. 용어 "C_1-C_4할로알킬" 및 "C_1-C_3할로알킬"은 이에 따라 해석되어야 한다. C_1-C_6할로알킬의 예는 트리플루오로메틸을 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0034] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알콕시"는 화학식 -OR_a의 라디칼을 지칭하며, 여기서, R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬 라디칼이다. 용어 "C_1-C_4알콕시" 및 "C_1-C_3알콕시"는 이에 따라 해석되어야 한다. C_1-C_6알콕시의 예는 메톡시, 에톡시, 1-메틸에톡시(이소-프로폭시), 및 프로폭시를 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0035] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6할로알콕시"는 동일하거나 상이한 할로겐 원자 중 하나 이상에 의해 치환된, 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알콕시 라디칼을 지칭한다. 용어 "C_1-C_4할로알콕시" 및 "C_1-C_3할로알콕시"는 이에 따라 해석되어야 한다. C_1-C_6할로알콕시의 예는 트리플루오로메톡시를 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0036] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "시아노C_1-C_6알콕시"는 하나 이상의 시아노 기에 의해 치환된 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알콕시 라디칼을 지칭한다. 용어 "시아노C_1-C_4알콕시" 및 "시아노C_1-C_3알콕시"는 이에 따라 해석되어야 한다. 시아노C_1-C_6알콕시의 예는 시아노에톡시를 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0037] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "시아노C_1-C_6알킬"은 하나 이상의 시아노 기에 의해 치환된 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬 라디칼을 지칭한다. 용어 "시아노C_1-C_4알킬", "시아노C_1-C_3알킬" 및 "시아노C_1-C_2알킬"은 이에 따라 해석되어야 한다. 시아노C_1-C_6알킬의 예는 시아노메틸을 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0038] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_2-C_6알케닐"은 오로지 탄소 및 수소 원자로 구성되고, (*E*)- 또는 (*Z*)-배열을 가질 수 있는 적어도 하나의 이중 결합을 함유하고, 2 내지 6개의 탄소 원자를 갖고, 단일 결합에 의해 분자의 나머지에 부착되는 직선형 또는 분지형 탄화수소 사슬 라디칼 기를 지칭한다. 용어 "C_2-C_3알케닐"은 이에 따라 해석되어야 한다. C_2-C_6알케닐의 예는 에테닐(비닐), 프로프-1-에닐, 프로프-2-에닐(아릴), 부트-1-에닐을 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0039] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_2-C_6알키닐"은 오로지 탄소 및 수소 원자로 구성되고, 적어도 하나의 삼중 결합을 함유하고, 2 내지 6개의 탄소 원자를 갖고, 단일 결합에 의해 분자의 나머지에 부착되는 직선형 또는 분지형 탄화수소 사슬 라디칼 기를 지칭한다. 용어 "C_2-C_3알키닐"은 이에 따라 해석되어야 한다. C_2-C_6알키닐의 예는 에티닐, 프로프-1-이닐, 부트-1-이닐을 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0040] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_2-C_6알케닐옥시"는 오로지 탄소 및 수소 원자로 구성되고, (*E*)- 또는 (*Z*)-배열을 가질 수 있는 적어도 하나의 이중 결합을 함유하고, 2 내지 6개의 탄소 원자를 갖고, 산소 링커를 통해 분자의 나머지에 부착되는 직선형 또는 분지형 탄화수소 사슬 라디칼 기를 지칭한다.

[0041] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬"은 화학식 R_bOR_a-의 라디칼을 지칭하며, 여기서, R_b는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬 라디칼이고, R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬렌 라디칼이다. 용어 "C_1-C_4알콕시C_1-C_4알킬"은 이에 따라 해석되어야 한다.

[0042] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알콕시C_1-C_6알콕시"는 화학식 R_bOR_aO-의 라디칼을 지칭하며, 여기서, R_a 및 R_b는 둘 모두 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬렌 라디칼이다. 용어 "C_1-C_4알콕시C_1-C_4알콕시"는 이에 따라 해석되어야 한다.

[0043] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알콕시카보닐C_1-C_6알콕시"는 화학식 $R_bOC(O)R_aO$-의 라디칼을 지칭하며, 여

기서 R_a 및 R_b는 둘 모두 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬렌 라디칼이다.

[0044] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_3-C_6사이클로알킬"은 모노사이클릭 포화 고리 시스템이고, 3 내지 6개의 탄소 원자를 함유하는 라디칼을 지칭한다. 용어 "C_3-C_5사이클로알킬" 및 "C_3-C_4사이클로알킬"은 이에 따라 해석되어야 한다. C_3-C_6사이클로알킬의 예는 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸, 및 사이클로헥실을 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0045] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐"은 -NHC(O)- 링커를 통해 분자의 나머지에 부착된 C_3-C_6사이클로알킬 고리를 지칭한다.

[0046] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "벤질옥시"는 산소 원자를 통해 분자의 나머지에 부착된 벤질 고리를 지칭한다.

[0047] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "헤테로아릴"은 질소, 산소 및 황으로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 3 또는 4개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 모노사이클릭 고리 라디칼을 지칭한다. 일부 경우에, 헤테로아릴 모이어티는 헤테로아릴 고리에서 질소 원자를 통해 분자의 나머지에 부착될 수 있다. 다른 경우에, 헤테로아릴 모이어티는 헤테로아릴 고리에서 탄소 원자를 통해 분자의 나머지에 부착될 수 있다. 헤테로아릴의 예는 푸라닐, 피롤릴, 티에닐, 피라졸릴, 이미다졸릴, 티아졸릴, 이소티아졸릴, 옥사졸릴, 이속사졸릴, 트리아졸릴, 테트라졸릴, 피라지닐, 피리다지닐, 피리미디닐 또는 피리딜을 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0048] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "헤테로사이클릴"은 1, 2 또는 3개의 헤테로원자를 포함하는 안정한 4원, 5원 또는 6원(본 경우에 바람직하게는 5원 또는 6원) 비-방향족 모노사이클릭 고리를 지칭하며, 헤테로원자는 질소, 산소, 및 황으로부터 개별적으로 선택된다. 헤테로사이클릴 라디칼은 탄소 원자 또는 헤테로원자를 통해 분자의 나머지에 결합될 수 있다. 헤테로사이클릴의 예는 아지리디닐, 아제티디닐, 옥세타닐, 티에타닐, 테트라하이드로푸릴, 피롤리디닐, 피라졸리디닐, 이미다졸리디닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 모르폴리닐, 디옥솔라닐, 디티오라닐 및 티아졸리디닐을 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0049] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알킬카보닐"은 화학식 -C(O)R_a의 라디칼을 지칭하며, 여기서, R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬 라디칼이다. C_1-C_6알킬카보닐의 예는 아세틸을 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0050] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알콕시카보닐"은 화학식 -C(O)OR_a의 라디칼을 지칭하며, 여기서, R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬 라디칼이다.

[0051] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알킬아미노"는 화학식 R_aNH-의 라디칼을 지칭하며, 여기서 R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬 라디칼이다.

[0052] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알킬아미노카보닐"은 화학식 -C(O)NHR_a의 라디칼을 지칭하며, 여기서, R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬 라디칼이다.

[0053] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알킬카보닐아미노"는 화학식 R_aC(O)NH-의 라디칼을 지칭하며, 여기서 R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬 라디칼이다.

[0054] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬아미노카보닐"은 화학식 R_aOR_bNHC(O)-의 라디칼을 지칭하며, 여기서 R_a는 C_1-C_6알킬 라디칼이고, R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬렌 라디칼이다.

[0055] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬카보닐아미노"는 화학식 R_aOR_bC(O)NH-의 라디칼을 지칭하며, 여기서 R_a는 C_1-C_6알킬 라디칼이고, R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬렌 라디칼이다.

[0056] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_2-C_6알케닐카보닐아미노"는 화학식 R_aOC(O)NH-의 라디칼을 지칭하며, 여기서 R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬렌 라디칼이다.

[0057] 본원에 사용되는 바와 같이, 용어 "N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노"는 화학식 (R_a)(R_b)NH-의 라디칼을 지칭하며, 여기

서, R_a 및 R_b는 각각 개별적으로, 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_4알킬 라디칼이다.

[0058] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노카보닐"은 화학식 -C(O)N(R_a)(R_b)의 라디칼을 지칭하며, 여기서, R_a 및 R_b는 각각 개별적으로, 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_4알킬 라디칼이다. 용어 "N,N-디(C_1-C_3알킬)아미노카보닐"은 이에 따라 해석되어야 한다.

[0059] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알킬설파닐"은 화학식 -SR_a의 라디칼을 지칭하며, 여기서, R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬 라디칼이다. 용어 "C_1-C_4알킬설파닐" 및 "C_1-C_3알킬설파닐"은 이에 따라 해석되어야 한다. C_1-C_6알킬설파닐의 예는 메틸설파닐을 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0060] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알킬설피닐"은 화학식 -S(O)R_a의 라디칼을 지칭하며, 여기서, R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬 라디칼이다. 용어 "C_1-C_4알킬설피닐" 및 "C_1-C_3알킬설피닐"은 이에 따라 해석되어야 한다. C_1-C_6알킬설피닐의 예는 메틸설피닐을 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0061] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알킬설포닐"은 화학식 -S(O)$_2$$R_a$의 라디칼을 지칭하며, 여기서, R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬 라디칼이다. 용어 "C_1-C_4알킬설포닐" 및 "C_1-C_3알킬설포닐"은 이에 따라 해석되어야 한다. C_1-C_6알킬솔파닐의 예는 메틸설포닐을 포함하지만, 이로 제한되지는 않는다.

[0062] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알킬설폰아미도"는 화학식 -NHS(O)$_2$$R_a$의 라디칼을 지칭하며, 여기서, R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬 라디칼이다.

[0063] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "하이드록시카보닐" 또는 "카복시"는 화학식 -COOH의 라디칼을 지칭한다.

[0064] 본원에 사용된 바와 같이, 용어 "C_1-C_6알콕시이미노C_1-C_6알킬"은 화학식 R_a=NR_b-의 라디칼을 지칭하며, 여기서 R_a는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알콕시 라디칼이고, R_b는 일반적으로 상기 정의된 바와 같은 C_1-C_6알킬렌 라디칼이다.

[0065] 화학식 I의 화합물에서 하나 이상의 가능한 입체발생 요소(stereogenic element)의 존재는 화합물이 광학적으로 이성질체의 형태, 즉, 거울상 이성질체 또는 부분입체 이성질체 형태로 발생할 수 있음을 의미한다. 또한, 회전장애 이성질체는 단일 결합을 중심으로 한 제한된 회전으로 인해 발생할 수 있다. 화학식 I에는 그러한 가능한 모든 이성질체 형태 및 이의 혼합물이 포함되도록 하고자 한다. 본 발명은 화학식 I의 화합물에 대한 그러한 가능한 모든 이성질체 형태 및 이의 혼합물을 포함한다. 마찬가지로, 화학식 I에는 가능한 모든 호변 이성질체가 포함되도록 하고자 한다. 본 발명은 화학식 I의 화합물에 대한 가능한 모든 호변 이성질체 형태를 포함한다.

[0066] 각각의 경우, 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물은 유리 형태, N-옥사이드로서의 산화된 형태, 또는 염 형태, 예를 들어 작물학적으로 사용 가능한 염 형태이다. 화학식 I의 화합물이 1차, 2차 및 3차 아민을 포함하는 아민(예를 들어, 암모니아, 디메틸아민 및 트리에틸아민), 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 염기, 전이 금속 또는 4차 암모늄 염기와 함께 형성할 수 있는 염이 바람직하다.

[0067] N-옥사이드는 3차 아민의 산화된 형태, 또는 질소-함유 헤테로방향족 화합물의 산화된 형태이다. 이들은 예를 들어 서적["Heterocyclic N-oxides" by A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton (1991)]에 기술되어 있다.

[0068] 다음의 리스트는 화학식 I의 화합물과 관련하여 치환기 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, 및 R^9에 대한 바람직한 정의를 포함하는 정의를 제공한다. 이들 치환기 중 임의의 하나에 대해, 아래에 주어진 임의의 정의는 하기 또는 본 문서의 다른 곳에서 주어지는 임의의 다른 치환기의 임의의 정의와 조합될 수 있다.

[0069] R^1은 C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_2-C_6알케닐, C_2-C_6알키닐, 또는 C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬이다. 바람직하게는, R^1은 C_1-C_4알킬, C_1-C_4알콕시, C_2-C_4알케닐, C_2-C_4알키닐, 또는 C_1-C_4알콕시C_1-C_4알킬이다. 보다 바람직하게는, R^1은 C_1-C_3알킬, C_1-C_3알콕시, C_2-C_3알케닐, C_2-C_3알키닐, 또는 C_1-C_3알콕시C_1-C_3알킬이다. 보다 더 바람직하게는, R^1은 메틸, 에틸, n-프로필, 메톡시, 2-메톡시에틸, 알리, 및 프로프-2-이닐이다. 더욱더 바람직하게는, R^1은 메틸

또는 에틸이다. 하나의 실시형태 세트에서, R^1은 에틸이다.

[0070] R^2는 페닐 또는 헤테로아릴이고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 3 또는 4개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 각각의 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^7로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0071] 바람직하게는, R^2는 페닐 또는 헤테로아릴이고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 또는 3개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 각각의 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^7로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0072] 보다 바람직하게는, R^2는 페닐 또는 헤테로아릴이고, 헤테로아릴 모이어티는 N 및 O로부터 개별적으로 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 각각의 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^7로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0073] 보다 더 바람직하게는, R^2는 페닐 또는 헤테로아릴이고, 헤테로아릴 모이어티는 N 및 O로부터 개별적으로 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 각각의 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^7로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0074] 더욱더 바람직하게는, R^2는 R^7로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환된 페닐이다. 하나의 실시형태 세트에서, R^2는 3,4-디클로로페닐, 4-클로로-3-시아노페닐, 4-클로로페닐, 2-클로로-4-메틸설포닐페닐, 또는 4-아미노-3-클로로페닐이다. 추가의 실시형태 세트에서, R^2는 3,4-디클로로페닐이다.

[0075] R^3은 수소 또는 C_1-C_6알킬이다. 바람직하게는, R^3은 수소 또는 C_1-C_4알킬이다. 보다 바람직하게는, R^3은 수소, 메틸, 에틸, 또는 t-부틸이다. 보다 더 바람직하게는, R^3은 수소, 메틸, 또는 에틸이다.

[0076] R^4는 수소, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6할로알킬, 또는 페닐이고, 페닐 모이어티는 각각, R^8로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다. 바람직하게는, R^4는 수소, 할로겐, C_1-C_4알킬, C_1-C_4할로알킬, 또는 페닐이고, 페닐 모이어티는 R^8로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다. 보다 바람직하게는, R^4는 수소, 할로겐, C_1-C_3알킬, C_1-C_3할로알킬, 또는 페닐이고, 페닐 모이어티는 R^8로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다. 더욱더 바람직하게는, R^4는 수소, 할로겐, C_1-C_3알킬, 또는 페닐이고, 페닐 모이어티는 단일 R^8 기로 선택적으로 치환될 수 있다. 보다 더 바람직하게는, R^4는 수소, 할로겐, 메틸, 또는 4-클로로페닐이다. 보다 더욱더 바람직하게는, R^4는 수소, 브로모, 메틸, 또는 4-클로로페닐이다. 하나의 실시형태 세트에서, R^4는 수소, 브로모, 또는 4-클로로페닐이다. 또 다른 실시형태 세트에서, R^4는 수소이다.

[0077] R^5는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 1, 2, 또는 3개의 질소 원자를 포함하는 5원 방향족 모노사이클릭 고리임)이고, 헤테로아릴 모이어티는 헤테로아릴 고리에서 질소 원자를 통해 분자의 나머지에 부착되고, 헤테로아릴 모이어티는 각각, R^9로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0078] 바람직하게는, R^5는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 1, 2, 또는 3개의 질소 원자를 포함하는 5원 방향족 모노사이클릭 고리임)이고, 헤테로아릴 모이어티는 헤테로아릴 고리에서 질소 원자를 통해 분자의 나머지에 부착되고, 헤테로아릴 모이어티는 각각, R^9로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0079] 보다 바람직하게는, R^5는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 2 또는 3개의 질소 원자를 포함하는 5원 방향족 모노사이클릭 고리임)이고, 헤테로아릴 모이어티는 헤테로아릴 고리에서 질소 원자를 통해 분자의 나머지에 부착되고, 헤테로아릴 모이어티는 각각, R^9로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0080] 보다 더 바람직하게는, R^5는 피라졸릴, 이미다졸릴, 또는 트리아졸릴이고, 임의의 피라졸릴, 이미다졸릴, 및 트리아졸릴 모이어티는 각각, R^9로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0081] 하나의 실시형태 세트에서, R^5는 벤조트리아졸-2-일메틸, 인다졸-1-일, 인다졸-2-일, 4,5,6,7-테트라하이드로인다졸-2-일, 이미다조[4,5-b]피리딘-1-일, 6-클로로피라졸로[4,3-c]피리딘-1-일, 3-(디플루오로메틸)-6,7-디하이드로-4H-피라노[4,3-c]피라졸-1-일, 3-(디플루오로메틸)-6,7-디하이드로-4H-피라노[4,3-c]피라졸-2-일, 4,6-디하이드로푸로[3,4-c]피라졸-2-일, 또는 3-(트리플루오로메틸)-6,7-디하이드로-4H-피라노[4,3-c]피라졸-1-일이다.

[0082] R^6은 수소, C_1-C_3알킬, 또는 C_1-C_6알콕시이다. 바람직하게는, R^6은 수소 또는 C_1-C_3알킬이다. 보다 바람직하게는, R^6은 수소 또는 메틸이다. 보다 더 바람직하게는, R^6은 수소이다.

[0083] R^7은 시아노, 니트로, 아미노, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬, C_1-C_6알킬설파닐, C_1-C_6알킬설피닐, C_1-C_6알킬설포닐, C_1-C_6알킬설폰아미도, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, 또는 N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노카보닐이다.

[0084] 바람직하게는, R^7은 시아노, 니트로, 아미노, 할로겐, C_1-C_4알킬, C_1-C_4알콕시, C_1-C_4할로알킬, C_1-C_4할로알콕시, C_1-C_4알콕시C_1-C_3알킬, C_1-C_4알킬설파닐, C_1-C_4알킬설피닐, C_1-C_4알킬설포닐, C_1-C_4알킬설폰아미도, C_1-C_4알킬카보닐, C_1-C_4알콕시카보닐, C_1-C_4알킬아미노카보닐, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, 또는 N,N-디(C_1-C_3알킬)아미노카보닐이다.

[0085] 보다 바람직하게는, R^7은 시아노, 니트로, 아미노, 할로겐, C_1-C_3알킬, C_1-C_3알콕시, C_1-C_3할로알킬, C_1-C_3할로알콕시, C_1-C_3알콕시C_1-C_3알킬, C_1-C_3알킬설파닐, C_1-C_3알킬설피닐, C_1-C_3알킬설포닐, C_1-C_3알킬설폰아미도, C_1-C_3알킬카보닐, C_1-C_3알콕시카보닐, C_1-C_3알킬아미노카보닐, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, 또는 N,N-디(C_1-C_3알킬)아미노카보닐이다.

[0086] 보다 더 바람직하게는, R^7은 시아노, 니트로, 아미노, 할로겐, 및 C_1-C_3알킬설포닐이고, 더욱더 바람직하게는, R^7은 시아노, 니트로, 아미노, 클로로, 플루오로, 및 메틸설포닐이다.

[0087] 하나의 실시형태 세트에서, R^7은 시아노, 니트로, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬, C_1-C_6알킬설파닐, C_1-C_6알킬설피닐, C_1-C_6알킬설포닐, C_1-C_6알킬설폰아미도, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, 또는 N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노카보닐이다.

[0088] 바람직하게는, R^7은 시아노, 니트로, 할로겐, C_1-C_4알킬, C_1-C_4알콕시, C_1-C_4할로알킬, C_1-C_4할로알콕시, C_1-C_4알콕시C_1-C_3알킬, C_1-C_4알킬설파닐, C_1-C_4알킬설피닐, C_1-C_4알킬설포닐, C_1-C_4알킬설폰아미도, C_1-C_4알킬카보닐, C_1-C_4알콕시카보닐, C_1-C_4알킬아미노카보닐, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, 또는 N,N-디(C_1-C_3알킬)아미노카보닐이다.

[0089] 보다 바람직하게는, R^7은 시아노, 니트로, 할로겐, C_1-C_3알킬, C_1-C_3알콕시, C_1-C_3할로알킬, C_1-C_3할로알콕시, C_1-C_3알콕시C_1-C_3알킬, C_1-C_3알킬설파닐, C_1-C_3알킬설피닐, C_1-C_3알킬설포닐, C_1-C_3알킬설폰아미도, C_1-C_3알킬카보닐, C_1-C_3알콕시카보닐, C_1-C_3알킬아미노카보닐, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, 또는 N,N-디(C_1-C_3알킬)아미노카보닐이다.

[0090] 보다 더 바람직하게는, R^7은 시아노, 니트로, 할로겐, 또는 C_1-C_3알킬설포닐이고, 더욱더 바람직하게는, R^7은 시아노, 니트로, 클로로, 플루오로, 및 메틸설포닐이다.

[0091] R^8은 할로겐, C_1-C_3알킬, 또는 C_1-C_3알콕시이다. 바람직하게는, R^8은 할로겐, 메틸, 에틸, 메톡시, 또는 에톡시이다. 보다 바람직하게는, R^8은 클로로, 브로모, 플루오로, 메틸, 또는 메톡시이다. 보다 더 바람직하게는, R^8은 클로로이다.

[0092] R^9는 포르밀, 아세틸, 시아노, 아미노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_2-C_6알케닐옥시, 시아노C_1-C_6알킬, 시아노C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_6알킬설파닐, C_1-C_6알킬설피닐, C_1-C_6알킬설포닐, C_1-C_6알킬설폰아미도, 하이드록시카보닐, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_1-C_6알킬아미노, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알콕시이미노C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_2-C_6알케닐카보닐아미노, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노, N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노카보닐, 페닐, 벤질옥시, 또는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 또는 3개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리임)이고, 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0093] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 C_3-C_6사이클로알킬 고리 또는 페닐 고리를 형성할 수 있고, C_3-C_6사이클로알킬 및 페닐 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0094] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 3 또는 4개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0095] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0096] 바람직하게는, R^9는 포르밀, 아세틸, 시아노, 아미노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_2-C_6알케닐옥시, 시아노C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_6알킬설파닐, C_1-C_6알킬설포닐, 하이드록시카보닐, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_1-C_6알콕시이미노C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_2-C_6알케닐카보닐아미노, C_3-C_6사이클로알킬, 페닐, 또는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 또는 3개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리임)이고, 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0097] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 C_3-C_6사이클로알킬 고리 또는 페닐 고리를 형성할 수 있고, C_3-C_6사이클로알킬 및 페닐 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0098] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 또는 3개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0099] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0100] 보다 바람직하게는, R^9는 아세틸, 시아노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_4알킬, C_1-C_4알콕시, C_1-C_4할로알킬, C_1-C_4할로알콕시, C_2-C_4알케닐옥시, 시아노C_1-C_4알킬, C_1-C_4알콕시C_1-C_4알킬, C_1-C_4알콕시C_1-C_4알콕시, C_1-C_4알콕시카보닐, C_1-C_4알킬설파닐, C_1-C_4알킬설포닐, C_1-C_4알킬카보닐, C_1-C_4알킬카보닐아미노, C_1-C_4알콕시이미노C_1-C_4알킬, C_1-C_4알콕시C_1-C_4알킬카보닐아미노, C_2-C_4알케닐카보닐아미노, C_3-C_4사이클로알킬, 페닐, 또는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리임)이고, 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0101] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 C_5-C_6사이클로알킬 고리 또는 페닐 고리를 형성할 수 있고, C_5-C_6사이클로알킬 및 페닐 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0102] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0103] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0104] 더욱더 바람직하게는, R^9는 아세틸, 시아노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_4알킬, C_1-C_4알콕시, C_1-C_3할로알킬, C_1-C_3할로알콕시, C_2-C_3알케닐옥시, 시아노C_1-C_2알킬, C_1-C_3알콕시C_1-C_3알킬, C_1-C_3알콕시C_1-C_3알콕시, C_1-C_2알콕시카보닐, C_1-C_2알킬설파닐, C_1-C_2알킬설포닐, C_1-C_3알킬카보닐, C_1-C_3알킬카보닐아미노, C_1-C_2알콕시이미노C_1-C_2알킬, C_2-C_3알케닐카보닐아미노, 사이클로프로필, 페닐, 또는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리임)이고, 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 단일 R^{10} 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0105] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 사이클로헥실 또는 페닐 고리를 형성할 수 있고, 페닐 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수

있거나;

[0106] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 단일 질소 원자를 포함하는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 단일 R^{10} 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0107] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 1개의 단일 R^{10} 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0108] 하나의 실시형태 세트에서, R^9는 포르밀, 시아노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_2-C_6알케닐옥시, 시아노C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_6알킬설파닐, C_1-C_6알킬설피닐, C_1-C_6알킬설포닐, C_1-C_6알킬설폰아미도, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_1-C_6알킬아미노, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_2-C_6알케닐카보닐아미노, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노, N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노카보닐, 또는 벤질옥시이거나;

[0109] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 C_3-C_6사이클로알킬 고리 또는 페닐 고리를 형성할 수 있고, C_3-C_6사이클로알킬 및 페닐 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0110] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 3 또는 4개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0111] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

[0112] 바람직하게는, R^9는 포르밀, 시아노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_2-C_6알케닐옥시, 시아노C_1-C_4알콕시, C_1-C_4알콕시C_1-C_4알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알콕시, C_1-C_4알콕시카보닐C_1-C_4알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_4알킬설파닐, C_1-C_4알킬설피닐, C_1-C_4알킬설포닐, C_1-C_4알킬설폰아미도, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_1-C_6알킬아미노, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_4알콕시C_1-C_4알킬카보닐아미노, C_2-C_6알케닐카보닐아미노, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, N,N-디(C_1-C_3알킬)아미노, N,N-디(C_1-C_3알킬)아미노카보닐, 또는 벤질옥시이거나;

[0113] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 C_3-C_6사이클로알킬 고리 또는 페닐 고리를 형성할 수 있고, C_3-C_6사이클로알킬 및 페닐 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0114] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 또는 3개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0115] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

[0116] 보다 바람직하게는, R^9는 포르밀, 시아노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_4알킬, C_1-C_4알콕시, C_1-C_4할로알킬, C_1-C_4할로알콕시, C_2-C_4알케닐옥시, 시아노C_1-C_3알콕시, C_1-C_3알콕시C_1-C_3알킬, C_1-C_3알콕시C_1-C_3알콕시, C_1-C_3알콕시카보닐C_1-C_3알콕시, C_1-C_3알콕시카보닐, C_1-C_3알킬설파닐, C_1-C_3알킬설피닐, C_1-C_3알킬설포닐, C_1-C_3알킬설폰아미도, C_1-C_3알킬카보닐, C_1-C_3알킬아미노카보닐, C_1-C_3알킬카보닐아미노, C_1-C_3알킬아미노, C_1-C_3알콕시C_1-C_3알킬아미노카보닐, C_1-C_3알콕시C_1-C_3알킬카보닐아미노, C_2-C_4알케닐카보닐아미노, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, N,N-디(C_1-C_3알킬)아미노, N,N-디(C_1-C_3알킬)아미노카보닐, 또는 벤질옥시이거나;

[0117] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 C_3-C_6사이클로알킬 고리 또는 페닐 고리를 형성할 수 있고, C_3-C_6사이클로알킬 및 페닐 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0118] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 또는 3개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0119] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

[0120] 더욱더 바람직하게는, R^9는 포르밀, 시아노, 니트로, 할로겐, C_1-C_4알킬, C_1-C_3알콕시, C_1-C_3할로알킬, C_1-C_2할로알콕시, C_2-C_3알케닐옥시, 시아노C_1-C_2알콕시, C_1-C_3알콕시C_1-C_3알킬, C_1-C_3알콕시C_1-C_3알콕시, C_1-C_3알콕시카보닐C_1-C_3알콕시, C_1-C_3알콕시카보닐, C_1-C_3알킬설파닐, C_1-C_3알킬설포닐, C_1-C_3알킬카보닐, C_1-C_3알킬아미노카보닐, C_1-C_3알킬카보닐아미노, C_1-C_3알킬아미노, C_1-C_3알콕시C_1-C_3알킬아미노카보닐, C_1-C_2알콕시C_1-C_2알킬카보닐아미노, C_3-C_4알케닐카보닐아미노, C_3-C_4사이클로알킬, 또는 N,N-디(C_1-C_3알킬)아미노이거나;

[0121] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 C_5-C_6사이클로알킬 고리 또는 페닐 고리를 형성할 수 있고, C_5-C_6사이클로알킬 및 페닐 모이어티는 단일 R^{10} 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0122] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 6원 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 단일 질소 원자를 포함하는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 단일 R^{10} 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0123] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 단일 R^{10} 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0124] 특히 바람직한 실시형태 세트에서, R^9는 아세틸, 시아노, 니트로, 하이드록시, 클로로, 플루오로, 브로모, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 이소프로폭시, tert부톡시, 디플루오로메틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 2,2,2-트리플루오로에톡시, 알릴옥시, 시아노메틸, 메톡시메틸, 에톡시

메틸, 메톡시메톡시, 메톡시에톡시, 메톡시카보닐, 메틸설파닐, 메틸설포닐, 메틸카보닐아미노(아세트아미노), 프로파노일아미노, 메톡시이미노에틸, (부트-2-에노일)아미노, 사이클로프로필, 페닐, 피리딜, 티에닐, 푸라닐, 티아졸릴, 또는 피라지닐이고, 페닐 및 헤테로아릴 모이어티는 단일 R^{10} 기로 선택적으로 치환될 수 있다.

[0125] R^{10}은 할로겐, 니트로, C_1-C_3알킬 또는 C_1-C_3알콕시이다. 바람직하게는, R^{10}은 할로겐, 니트로, 메틸 또는 메톡시이다. 보다 바람직하게는, R^{10}은 할로겐 또는 메틸이다. 더욱더 바람직하게는, R^{10}은 클로로, 플루오로, 또는 메틸이다. 보다 더 바람직하게는, R^{10}은 클로로 또는 플루오로이고, R^{10}이 클로로인 경우가 특히 바람직하다.

[0126] 하나의 실시형태 세트에서, R^{10}은 할로겐, C_1-C_3알킬, 또는 C_1-C_3알콕시이다. 바람직하게는, R^{10}은 할로겐, 메틸 또는 메톡시이다. 보다 바람직하게는, R^{10}은 할로겐이다. 더욱더 바람직하게는, R^{10}은 클로로 또는 플루오로이다. 보다 더 바람직하게는, R^{10}은 클로로이다.

[0127] 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물에서, 바람직하게는,

[0128] R^1은 메틸 또는 에틸이고;

[0129] R^2는 R^7로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 또는 2개의 기로 선택적으로 치환된 페닐이고;

[0130] R^3은 수소, 메틸, 또는 에틸이고;

[0131] R^4는 수소, 브로모, 메틸, 또는 4-클로로페닐이고;

[0132] R^5는 피라졸릴, 이미다졸릴, 또는 트리아졸릴이고, 임의의 피라졸릴, 이미다졸릴, 및 트리아졸릴 모이어티는 각각, R^9로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0133] R^5는 벤조트리아졸-2-일메틸, 인다졸-1-일, 인다졸-2-일, 4,5,6,7-테트라하이드로인다졸-2-일, 이미다조[4,5-b]피리딘-1-일, 6-클로로피라졸로[4,3-c]피리딘-1-일, 3-(디플루오로메틸)-6,7-디하이드로-4H-피라노[4,3-c]피라졸-1-일, 3-(디플루오로메틸)-6,7-디하이드로-4H-피라노[4,3-c]피라졸-2-일, 4,6-디하이드로푸로[3,4-c]피라졸-2-일, 또는 3-(트리플루오로메틸)-6,7-디하이드로-4H-피라노[4,3-c]피라졸-1-일이고;

[0134] R^6은 수소 또는 메틸이고;

[0135] R^7은 시아노, 니트로, 할로겐, 또는 C_1-C_3알킬설포닐이고;

[0136] R^9는 포르밀, 시아노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_2-C_6알케닐옥시, 시아노C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_6알킬설파닐, C_1-C_6알킬설피닐, C_1-C_6알킬설포닐, C_1-C_6알킬설폰아미도, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_1-C_6알킬아미노, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_2-C_6알케닐카보닐아미노, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노, N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노카보닐, 또는 벤질옥시이다.

[0137] 일 실시형태에서, 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물에서, 바람직하게는,

[0138] R^1은 메틸 또는 에틸이고;

[0139] R^2는 3,4-디클로로페닐이고;

[0140] R^3은 수소 또는 C_1-C_4알킬이고;

[0141] R^4는 수소, 브로모, 또는 4-클로로페닐이고;

[0142] R^5는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 2 또는 3개의 질소 원자를 포함하는 5원 방향족 모노사이클릭 고리임)이고, 헤테로아릴 모이어티는 헤테로아릴 고리에서 질소 원자를 통해 분자의 나머지에 부착되고, 헤테로아릴 모이어티는 각각, R^9로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

[0143] R^6은 수소이고;

[0144] R^9는 포르밀, 시아노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_2-C_6알케닐옥시, 시아노C_1-C_4알콕시, C_1-C_4알콕시C_1-C_4알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알콕시, C_1-C_4알콕시카보닐C_1-C_4알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_4알킬설파닐, C_1-C_4알킬설피닐, C_1-C_4알킬설포닐, C_1-C_4알킬설폰아미도, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_1-C_6알킬아미노, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_4알콕시C_1-C_4알킬카보닐아미노, C_2-C_6알케닐카보닐아미노, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, N,N-디(C_1-C_3알킬)아미노, N,N-디(C_1-C_3알킬)아미노카보닐, 또는 벤질옥시이거나;

[0145] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 C_3-C_6사이클로알킬 고리 또는 페닐 고리를 형성할 수 있고, C_3-C_6사이클로알킬 및 페닐 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0146] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 또는 3개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0147] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

[0148] R^{10}은 할로겐이다.

[0149] 또 다른 실시형태에서, 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물에서, 바람직하게는,

[0150] R^1은 메틸 또는 에틸이고;

[0151] R^2는 3,4-디클로로페닐이고;

[0152] R^3은 수소, 메틸, 또는 에틸이고;

[0153] R^4는 수소, 브로모, 메틸, 또는 4-클로로페닐이고;

[0154] R^5는 헤테로아릴(여기서, 헤테로아릴 모이어티는 1, 2, 또는 3개의 질소 원자를 포함하는 5원 방향족 모노사이클릭 고리임)이고, 헤테로아릴 모이어티는 헤테로아릴 고리에서 질소 원자를 통해 분자의 나머지에 부착되고, 헤테로아릴 모이어티는 각각, R^9로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 또는 3개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

[0155] R^6은 수소 또는 메틸이고;

[0156] R^7은 시아노, 니트로, 할로겐, 또는 C_1-C_3알킬설포닐이고;

[0157] R^9는 포르밀, 시아노, 니트로, 하이드록시, 할로겐, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, C_1-C_6할로알킬, C_1-C_6할로알콕시, C_2-C_6알케닐옥시, 시아노C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐C_1-C_6알콕시, C_1-C_6알콕시카보닐, C_1-C_6알킬설파닐, C_1-C_6알킬설피닐, C_1-C_6알킬설포닐, C_1-C_6알킬설폰아미도, C_1-C_6알킬카보닐, C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_1-C_6알킬아미노, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬아미노카보닐, C_1-C_6알콕시C_1-C_6알킬카보닐아미노, C_2-C_6알케닐카보닐아미노, C_3-C_6사이클로알킬, C_3-C_6사이클로알킬아미노카보닐, N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노, N,N-디(C_1-C_4알킬)아미노카보닐, 또는 벤질옥시이거나;

[0158] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 C_3-C_6사이클로알킬 고리 또는 페닐 고리를 형성할 수 있고, C_3-C_6사이클로알킬 및 페닐 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

[0159] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로아릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로아릴 모이어티는 N, O 및 S로부터 개별적으로 선택되는 1, 2, 3 또는 4개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원 방향족 고리이고, 헤테로아릴 모이어티는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있거나;

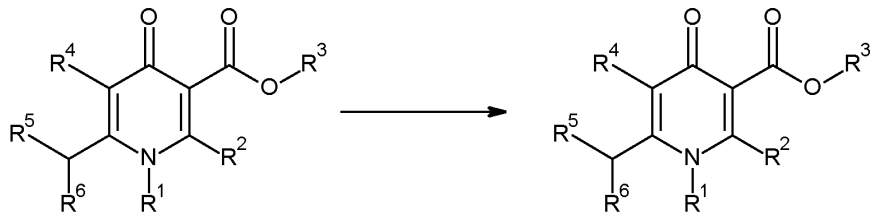
[0160] 임의의 2개의 인접한 R^9 기는 이들이 부착되는 탄소 원자와 함께 5원 또는 6원 헤테로사이클릴 고리를 형성할 수 있고, 헤테로사이클릴 모이어티는 O 및 N으로부터 선택되는 1 또는 2개의 헤테로원자를 포함하는 5원 또는 6원이고, 헤테로사이클릴 고리는 R^{10}으로 표시되는 동일하거나 상이할 수 있는 1, 2, 3 또는 4개의 기로 선택적으로 치환될 수 있고;

[0161] R^{10}은 클로로 또는 플루오로이다.

[0162] 본 발명의 화합물은 다음의 반응식에 나타낸 바와 같이 제조할 수 있으며, 여기서 달리 명시되지 않는 한, 각각의 변수의 정의는 화학식 I의 화합물에 대해 상기 정의된 바와 같다. 화학식 I의 화합물의 생산을 위한 일반적 방법은 아래에 기술되어 있다. 텍스트에서 달리 명시되지 않는 한, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 및 R^6은 상기 정의된 바와 같다. 본 발명의 화합물의 제조를 위해 사용되는 출발 물질은 통상의 상업적 공급업체로부터 구입할 수 있거나, 알려진 방법에 의해 제조할 수 있다. 출발 물질뿐만 아니라 중간체는 크로마토그래피, 결정화, 증류 및 여과와 같은 최신의 방법론에 의해 다음 단계에서 사용하기 전에 정제될 수 있다.

[0163] 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물은 하기 반응식 1에 나타낸 바와 같이 화학식 I의 화합물로부터 제조될 수 있다.

[0164] **[반응식 1]**



화학식 I 화학식 I

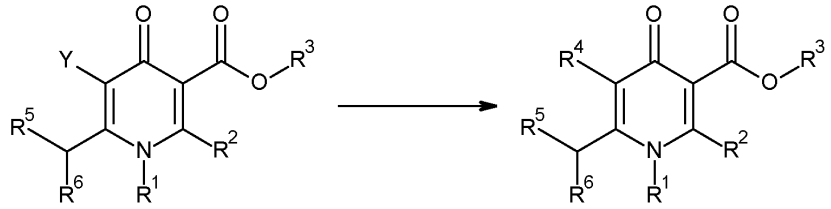
[0165]

[0166] 화학식 I(여기서, R^3은 수소임)의 화합물은 선택적 공용매(예컨대, 물)를 갖는 적합한 용매(예컨대, 메탄올, 에탄올, 디클로로메탄, 클로로포름, 에틸 아세테이트 또는 테트라하이드로푸란) 중 적합한 염기(예컨대, 수산화나트륨 또는 수산화리튬) 또는 적합한 산(예컨대, 트리플루오로아세트산, 염산, 포름산 또는 황산)을 이용한 화학식 I(여기서, R^3은 수소가 아니지만, 상기 정의된 바와 같은 임의의 다른 R^3 기임)의 화합물의 가수분해에 의해 제조할 수 있다. 염기를 사용하였을 경우, 생성물은 적합한 산(예컨대, 염산)을 이용한 산성화 후에 수득하였다.

[0167] 대안적으로, 화학식 I(여기서, R^3은 수소임)의 화합물은 물의 존재 하에 적합한 용매(예컨대, 테트라하이드로푸란) 중 물 안정성 루이스 산, 예컨대, 스칸듐(III) 트리플루오로메탄설포네이트의 존재 하에 화학식 I(여기서, R^3은 수소가 아니지만, 상기 정의된 바와 같은 임의의 다른 R^3 기임)의 화합물의 가수분해에 의해 제조될 수 있다.

[0168] 화학식 I의 화합물은 하기 기술된 바와 같은 방법에 의해 추가적으로 제조될 수 있다.

[0169] **[반응식 2]**



[0170] 화학식 B 화학식 I

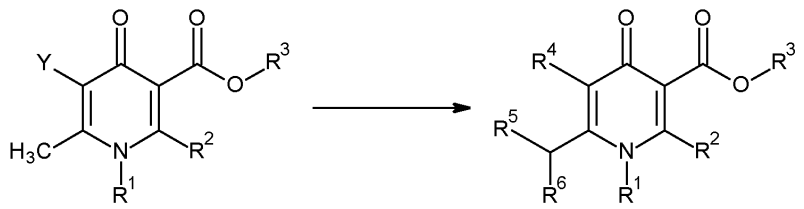
[0171] 화학식 B(여기서, Y = Br, Cl 또는 I임)의 화합물은 선택적으로 유기산(예컨대, 아세트산)의 존재 하에 적합한 유기 용매(예컨대, 메탄올, 에탄올 또는 에틸 아세테이트) 중 적합한 촉매(예컨대, 탄소 상 팔라듐 또는 백금)의 존재 하에 수소 가스를 사용한 환원에 의해 화학식 I(여기서, R^4는 수소임)의 화합물로 전환될 수 있다.

[0172] 대안적으로, 화학식 B(여기서, Y는 Br임)의 화합물은 상승된 온도에서 유기 용매(예컨대, 아세토니트릴) 중 적합한 촉매(예컨대, 디클로로비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II))의 존재 하에 적합한 수소 공급원(예컨대, 암모늄 포르메이트)을 사용하여 전이 수소화 조건 하에 화학식 I(여기서, R^4는 수소임)의 화합물로 전환될 수 있다.

[0173] 또 다른 변형에서, 화학식 I(여기서, R^4는 C_1-C_6알킬임)의 화합물은 문헌 조건과 유사한 스즈키-미야우라 크로스-커플링 조건(Suzuki-Miyaura cross-coupling condition) 하에서 알킬 보론산(예컨대, 메틸 보론산)과의 반응에 의해 화학식 B(여기서, Y는 I 또는 Br임)의 화합물의 반응으로부터 수득될 수 있다. 전형적으로, 반응은, 선택적으로 상승된 온도에서 물의 존재 하에 적합한 유기 용매(예컨대, 1,4-디옥산, 톨루엔 또는 테트라하이드로푸란) 중 염기(예컨대, 탄산칼륨 또는 탄산세슘 또는 제3인산칼륨)의 존재 하에 적합한 촉매(예컨대, 디클로로비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II), 테트라키스(트리페닐포스핀)팔라듐), 트리스(디벤질리덴아세톤)디팔라듐, 또는 디클로로(1,1'-비스(디페닐포스파닐)페로센)팔라듐(II) 디클로로메탄 부가체) 또는 선택적으로 리간드(예컨대, 2-디사이클로헥실포스피노-2',6'-디메톡시바이페닐)를 갖는 팔라듐 디아세테이트의 존재 하에 화학식 B의 화합물과 R^4-보론산 또는 보록신의 반응에 의해 수행된다.

[0174] 또 다른 변형에서, 화학식 I(여기서, R^4는 페닐임)의 화합물은 문헌 조건과 유사한 스즈키-미야우라 크로스-커플링 조건 하에서 페닐 보론산 또는 보록신과의 반응에 의해 화학식 B(여기서, Y는 I 또는 Br임)의 화합물의 반응으로부터 수득될 수 있다. 이는 상기 반응식 2에 나타나 있다.

[0175] **[반응식 2a]**

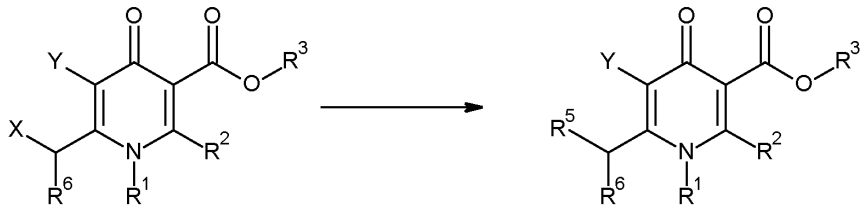


[0176] 화학식 B-I 화학식 I

[0177] 대안적 변형에서, 화학식 I(여기서, R^4 및 R^6은 수소이고, R^3은 수소 또는 상기 정의된 바와 같은 임의의 다른 R^3 기임)의 화합물은 상승된 온도에서 유기 용매(예컨대, *N,N*-디메틸아세트아미드) 중 적합한 리간드(예컨대, 1,10-페난트롤린) 및 적합한 염기(예컨대, 탄산칼륨)를 이용하여 화학량론적 구리(예컨대, 요오드화구리(I))의

존재 하에 화학식 B-I(여기서, Y는 I 또는 Br임)의 화합물의 반응으로부터 및 화학식 R^5-H의 화합물(여기서, 화학식 R^5-H의 화합물은 아졸, 예컨대, 피라졸, 이미다졸 또는 트리아졸임)과의 반응에 의해 수득될 수 있다. 아졸은 상업적으로 입수 가능하거나 문헌(*Tetrahedron* **2012**, *68*, 3165-3171)에 보고된 방법에 의해 제조될 수 있다. 이는 상기 반응식 2a에 나타나 있다.

[0178] **[반응식 3]**

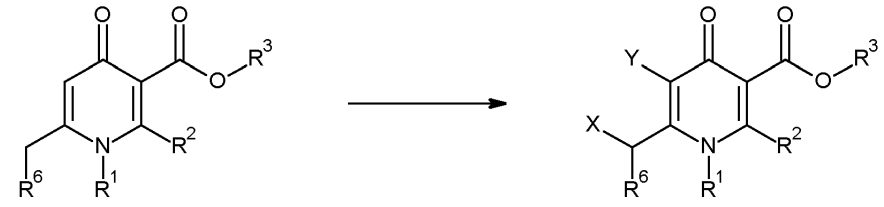


화학식 C 화학식 B

[0179]

[0180] 화학식 C(여기서, Y는 Br, Cl, I 또는 H이고, X는 Br임)의 화합물은 주위 온도 또는 상승된 온도에서 적합한 용매(예컨대, 아세토니트릴, N,N-디메틸포름아미드 또는 테트라하이드로푸란) 중 염기(예컨대, 탄산칼륨 또는 수소화나트륨)의 존재 하에 친핵체 R^5-H(예컨대, 피라졸, 이미다졸, 또는 트리아졸)과 친핵성 치환 반응에 의해 화학식 B의 화합물로 전환될 수 있다. 아졸은 상업적으로 입수 가능하거나 당업자에게 친숙한 방법에 의해 제조될 수 있다. 이는 상기 반응식 3에 나타나 있다.

[0181] **[반응식 4]**

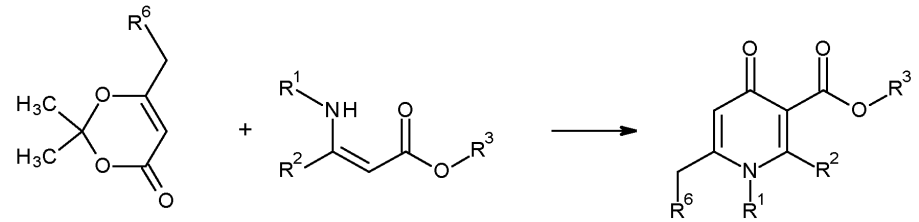


화학식 D 화학식 C

[0182]

[0183] 화학식 C(여기서, Y 및 X는 동일하고 X는 Br, Cl 또는 I임)의 화합물은 주위 온도 또는 상승된 온도에서 화학식 D의 화합물을 선택적으로 추가의 산(예컨대, 트리플루오로아세트산)과 함께 적합한 용매(예컨대, 아세토니트릴) 중 적합한 할로겐화제(예컨대, *N*-브로모-, *N*-클로로- 또는 *N*-아이오도-숙신이미드)로 처리함으로써 제조될 수 있다. 이는 상기 반응식 4에 나타나 있다.

[0184] **[반응식 5]**

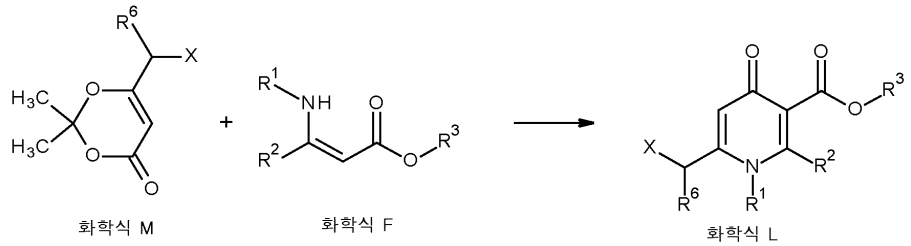


화학식 E 화학식 F 화학식 D

[0185]

[0186] 화학식 D의 화합물은 상승된 온도(예를 들어, 120℃)에서 선택적으로 용매(예컨대, 디옥산)의 존재 하에 화학식 E의 화합물과 화학식 F의 화합물을 반응시킴으로써 제조할 수 있다. 화학식 E의 화합물은 상업적으로 입수 가능하거나, 당업자에게 친숙한 방법에 의해 제조할 수 있다. 이는 상기 반응식 5에 나타나 있다.

[0187] [반응식 5a]

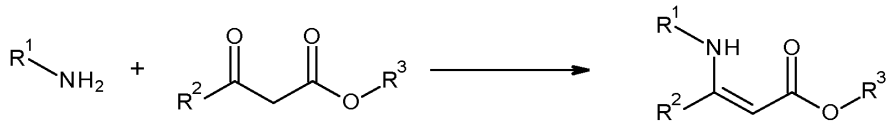


화학식 M 화학식 F 화학식 L

[0188]

[0189] 상이한 변형에서, 화학식 L(여기서, X는 Br임)의 화합물은 선택적으로 용매(예컨대, 디옥산)의 존재 하에 상승된 온도(예를 들어, 120℃)에서 화학식 M의 화합물을 화학식 F의 화합물과 반응시킴으로써 제조될 수 있다. 화학식 M의 화합물은 상업적으로 입수 가능하거나 당업자에게 친숙한 방법에 의해 제조될 수 있다. 이는 상기 반응식 5a에 나타나 있다.

[0190] [반응식 6]

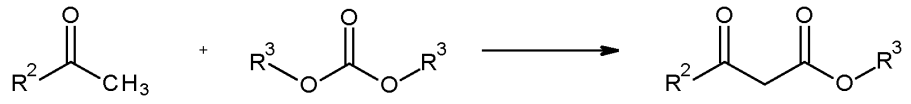


화학식 G 화학식 H 화학식 F

[0191]

[0192] 화학식 F의 화합물은 화학식 G의 β-케토 에스테르와 아민 염의 반응으로부터 제조할 수 있다. 아민 염은 화학식 H의 아민과 적합한 산(예컨대, 아세트산)의 산성화에 의해 인시츄(*in situ*)로 제조할 수 있다. 이어서, 이들 아민 염은 산(예컨대, 아세트산)과 건조제(예컨대, 4 Å 분자체)의 존재 하에 적합한 용매(예컨대, 톨루엔) 중에서 화학식 G의 화합물과 반응할 수 있다. 화학식 G의 화합물은 상업적으로 입수 가능하거나, 하기 기술된 조건을 사용하여 제조할 수 있다. 화학식 H의 화합물은 상업적으로 입수 가능하거나, 문헌에 보고된 방법에 의해 제조할 수 있다. 이는 상기 반응식 6에 나타나 있다.

[0193] [반응식 7]



화학식 K 화학식 J 화학식 H

[0194]

[0195] 화학식 H의 화합물은 화학식 J의 디알킬 카보네이트(예컨대, 디메틸 카보네이트)의 존재 하에 염기(예컨대, 수소화나트륨)를 이용하여 화학식 K의 케톤을 처리함으로써 제조할 수 있다. 화학식 K 및 화학식 J의 화합물은 상업적으로 입수 가능하거나, 당업자에게 친숙한 방법에 의해 제조할 수 있다. 이는 상기 반응식 7에 나타나 있다.

[0196] 본 발명은 또한 생육지에서 잡초를 방제하는 방법을 추가로 제공하며, 상기 방법은 화학식 I의 화합물을 포함하는 조성물의 잡초 방제량을 생육지에 시용하는 단계를 포함한다. 또한, 본 발명은 유용한 (작물) 식물 및 잡초를 포함하는 생육지에서 잡초를 선택적으로 방제하는 방법을 추가로 제공할 수 있으며, 방법은 본 발명에 따른 조성물의 잡초 방제량을 생육지에 시용하는 단계를 포함한다. '방제'는 사멸, 성장의 감소 또는 지연, 또는 발아의 방지 또는 감소를 의미한다. 본 발명의 화합물은 알려져 있는 구조적으로 유사한 화합물과 비교하여 훨씬 개선된 선택성을 나타냄에 유의한다. 일반적으로, 방제될 식물은 원하지 않는 식물(잡초)이다. '생육지'는 식물이 성장하고 있거나 성장할 영역을 의미한다. 시용은 작물 식물의 출아 전(pre-emergence) 및/또는 출아 후(postemergence)에 생육지에 적용될 수 있다. 일부 작물 식물은 내재적으로 화학식 I의 화합물의 제초 효과에 내성일 수 있다.

[0197] 화학식 I의 화합물의 시용 비율은 광범위한 한계 내에서 달라질 수 있으며, 토양의 성질, 시용 방법(출아 전 또는 출아 후; 종자분의; 파종골에 시용하는 것; 경운 시용(tillage application)을 하지 않는 것 등), 작물

식물, 방제될 잡초(들), 주요 기상 조건, 및 시용 방법, 시용 시간 및 표적 작물에 의해 결정지어지는 기타 인자에 좌우된다. 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물은 일반적으로 10 내지 2500 g/ha, 특히 25 내지 1000 g/ha, 보다 특별하게는 25 내지 250 g/ha 비율로 시용된다.

[0198] 시용은 일반적으로 조성물을 분무하는 것에 의해, 전형적으로는 넓은 면적에 대해 분무기가 장착되어 있는 트랙터에 의해 이루어지지만, 다른 방법, 예컨대 살분법(분말의 경우), 점적(drip) 또는 관주(drench)도 사용될 수 있다.

[0199] 용어 "유용한 식물"은 종래의 육종 또는 유전 공학의 방법으로 인해, 예를 들어 4-하이드록시페닐피루베이트 디옥시제나제(HPPD) 억제제, ALS 억제제, 예를 들어 프리미술푸론, 프로술푸론 및 트리플록시술푸론, 5-에놀-피로빌-쉬키메이트-3-포스페이트-신타제(EPSPS) 억제제, 글루타민 합성효소(GS) 억제제 또는 프로토포르피리노겐-옥시다제(PPO) 억제제 등의 제초제 부류 또는 브로목시닐과 같은 제초제에 내성이 생긴 유용한 식물도 포함하는 것으로 이해되어야 한다. 종래의 육종(돌연변이유발) 방법에 의해 이미다졸리논, 예를 들어 이마자목스에 내성이 생긴 작물의 예는 Clearfiel® 여름 유채(카놀라)이다. 유전 공학 방법에 의해 제초제 또는 제초제 부류에 내성이 생긴 작물의 예는 상표명 RoundupReady®, Herculex I® 및 LibertyLink®로 상업적으로 입수 가능한 글리포세이트- 및 글루포시네이트-저항성 메이즈(maize) 품종을 포함한다.

[0200] 용어 "유용한 식물"은, 알려진 바와 같이 이들이 예를 들어 독소 생성 세균, 특히 바실러스 속의 세균들로부터 하나 이상의 선택적으로 작용하는 독소를 합성할 수 있는 재조합 DNA 기법을 사용함으로써, 이와 같이 변형된 유용한 식물도 포함하는 것으로 이해되어야 한다.

[0201] 이러한 식물의 예는 YieldGard®(CryIA(b) 독소를 발현하는 메이즈 품종); YieldGard Rootworm®(CryIIIB(b1) 독소를 발현하는 메이즈 품종); YieldGard Plus®(CryIA(b) 및 CryIIIB(b1) 독소를 발현하는 메이즈 품종); Starlink®(Cry9(c) 독소를 발현하는 메이즈 품종); Herculex I®(CryIF(a2) 독소 및 제초제 글루포시네이트 암모늄에 대한 내성을 달성하기 위한 효소 포스피노트리신 N-아세틸트랜스퍼라제(PAT)를 발현하는 메이즈 품종); NuCOTN 33B®(CryIA(c) 독소를 발현하는 목화 품종); Bollgard I®(CryIA(c) 독소를 발현하는 목화 품종); Bollgard II®(CryIA(c)및 CryIIA(b) 독소를 발현하는 목화 품종); VIPCOT®(VIP 독소를 발현하는 목화 품종); NewLeaf®(CryIIIA 독소를 발현하는 감자 품종); NatureGard® Agrisure® GT Advantage(GA21 글리포세이트-내성 형질), Agrisure® CB Advantage(Bt11 조명 나방(CB) 형질), Agrisure® RW(옥수수근총 형질) 및 Protecta®이다.

[0202] 식물 작물 또는 이의 종자 물질 둘 모두는 제초제, 및 동시에 곤충 섭식에 저항성일 수 있다("중첩적" 유전자이식 사건("stacked" transgenic event)). 예를 들어, 종자는 살충성 Cry3 단백질을 발현하는 능력을 가질 수 있는 동시에, 글리포세이트에 내성이 있다.

[0203] 작물 식물은 종래의 육종 또는 유전 공학 방법에 의해 수득되며, 소위 산출 특질(예를 들어, 개선된 저장 안정성, 보다 높은 영양가 및 개선된 풍미)을 보유하는 것들을 포함하는 것으로도 이해되어야 한다.

[0204] 화학식 I의 화합물(또는 이를 포함하는 조성물)은 원하지 않는 식물(집합적으로, '잡초')을 방제하는 데 사용될 수 있다. 방제될 잡초는 단자엽 종, 예를 들어 *아그로스티스(Agrostis), 알로페쿠루스(Alopecurus), 아베나(Avena), 브라치아리아(Brachiaria), 브로무스(Bromus), 센크루스(Cenchrus), 사이페루스(Cyperus), 디지타리아(Digitaria), 에치노클로아(Echinochloa), 엘루신(Eleusine), 롤리움(Lolium), 모노코리아(Monochoria), 로트보엘리아(Rottboellia), 사기타리아(Sagittaria), 사이르푸스(Scirpus), 세타리아(Setaria)* 및 *소르그흄(Sorghum)*, 및 쌍자엽 종, 예를 들어 *아부틸론(Abutilon), 아마란투스(Amaranthus), 암브로시아(Ambrosia), 케노포디움(Chenopodium), 크리산테뮴(Chrysanthemum), 코니자(Conyza), 갈리움(Galium), 이포모에아(Ipomoea), 나스투르티움(Nasturtium), 시다(Sida), 시나피스(Sinapis), 솔라늄(Solanum), 스텔라리아(Stellaria), 베로니카(Veronica), 비올라(Viola)* 및 *잔티움(Xanthium)* 둘 모두일 수 있다.

[0205] 화학식 I의 화합물은 비개질된 형태로, 또는 바람직하게는 담체, 용매 및 표면 활성제(SAA)와 같은 제형 보조제를 사용하여 제초제 조성물을 제공하기 위한 제형 분야에서 종래에 이용된 보조제와 함께 사용될 수 있다. 따라서, 본 발명은 화학식 I의 적어도 하나의 화합물 및 농업적으로 허용 가능한 담체 및 선택적으로 보조제를 포함하는 제초제 조성물을 추가로 제공한다. 농업적으로 허용 가능한 담체는, 예를 들어 농업 용도에 적합한 담체이다. 농업용 담체는 당업계에 잘 알려져 있다.

[0206] 제초제 조성물은 일반적으로 0.1 내지 99 중량%, 특히 0.1 내지 95 중량%의 화학식 I의 화합물, 및 바람직하게는 0 내지 25 중량%의 표면 활성 물질을 포함하는 1 내지 99.9 중량%의 제형 보조제를 포함한다.

[0207] 조성물은 다수의 제형 유형으로부터 선택될 수 있다. 이들은 유제 원액(EC), 현탁 제제(SC), 현탁유제(SE: suspo-emulsion), 캡슐 현탁액(CS), 수분산성 과립(WG), 유화성 과립(EG: emulsifiable granule), 에멀션, 유중수(EO), 에멀션, 수중유(EW), 마이크로에멀션(ME), 오일 분산액(OD), 혼화성 유동성 오일(OF: oil miscible flowable), 오일 혼화성 액체(OL), 가용성 농축물(SL), 초-미량 현탁액(SU: ultra-low volume suspension), 초-미량 액체(UL), 공업용 농축물(TK: technical concentrate), 분산성 농축물(DC), 가용성 분말(SP), 습윤성 분말(WP) 및 가용성 과립(SG)을 포함한다. 임의의 경우에 선택되는 제형의 유형은 예상되는 특정 목적, 및 화학식 I의 화합물의 물리적, 화학적 및 생물학적 특성에 좌우될 것이다.

[0208] 가용성 분말(SP)은 화학식 I의 화합물을 하나 이상의 수용성 무기염(예컨대, 중탄산나트륨, 탄산나트륨 또는 황산마그네슘) 또는 하나 이상의 수용성 유기 고체(예컨대, 다당류), 및 선택적으로 하나 이상의 습윤제, 하나 이상의 분산제 또는 상기 제제의 혼합물과 혼합함으로써 제조되어 수 분산성/용해도를 개선할 수 있다. 이어서, 혼합물은 미세 분말로 분쇄된다. 유사한 조성물 또한 과립화되어 수용성 과립(SG)을 형성할 수 있다.

[0209] 습윤성 분말(WP)은 화학식 I의 화합물을 하나 이상의 고체 희석제 또는 담체, 하나 이상의 습윤제, 및 바람직하게는 하나 이상의 분산제, 및 선택적으로 하나 이상의 현탁제와 혼합함으로써 제조되어 액체 중의 분산을 촉진할 수 있다. 이어서, 혼합물은 미세 분말로 분쇄된다. 유사한 조성물 또한 과립화되어 수분산성 과립(WG)을 형성할 수 있다.

[0210] 과립(GR)은 화학식 I의 화합물과 하나 이상의 분말화된 고체 희석제 또는 담체의 혼합물을 과립화함으로써 형성되거나, 화학식 I(또는 적합한 제제 중의 이의 용액)의 화합물을 다공성 과립 재료(예컨대, 부석, 아타풀자이트 점토, 산성 백토, 키셀굴(kieselguhr), 규조토 또는 분쇄 옥수수 속대) 중에 흡수시킴으로써, 또는 화학식 I(또는 적합한 제제 중의 이의 용액)의 화합물을 경질 코어 재료(예컨대, 모래, 규산염, 미네랄 탄산염, 황산염 또는 인산염) 상에 흡착시키고, 필요한 경우 건조시킴으로써 사전-형성된 블랭크 과립(blank granule)으로부터 형성될 수 있다. 흡수 또는 흡착을 돕기 위해 일반적으로 사용되는 제제는 용매(예컨대, 지방족 및 방향족 석유 용매, 알코올, 에테르, 케톤 및 에스테르) 및 점착제(예컨대, 폴리비닐 아세테이트, 폴리비닐 알코올, 덱스트린, 당 및 식물성 오일)를 포함한다. 하나 이상의 기타 첨가제(예를 들어, 유화제, 습윤제, 또는 분산제)도 과립 내에 포함될 수 있다.

[0211] 분산성 농축물(DC)은 화학식 I의 화합물을 물 또는 유기 용매, 예컨대 케톤, 알코올 또는 글리콜 에테르 중에 용해시킴으로써 제조될 수 있다. 이들 용액은 (예를 들어, 물 희석을 개선하거나, 분무 탱크 내의 결정화를 방지하기 위한) 표면 활성제를 함유할 수 있다.

[0212] 유제(EC: emulsifiable concentrate) 또는 수중유 에멀션(EW)은 화학식 I의 화합물을 유기 용매(선택적으로, 하나 이상의 습윤제, 하나 이상의 유화제 또는 상기 제제의 혼합물을 함유함) 중에 용해시킴으로써 제조될 수 있다. EC에서 사용하기에 적합한 유기 용매는 방향족 탄화수소(예컨대, SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 및 SOLVESSO 200에 의해 예시되는 알킬벤젠 또는 알킬나프탈렌; SOLVESSO는 등록상표임), 케톤(예컨대, 사이클로헥사논 또는 메틸사이클로헥사논) 및 알코올(예컨대, 벤질 알코올, 푸르푸릴 알코올 또는 부탄올), N-알킬피롤리돈(예컨대, N-메틸피롤리돈 또는 N-옥틸피롤리돈), 지방산의 디메틸 아미드(예컨대, C_8-C_{10} 지방산 디메틸아미드) 및 염소화 탄화수소를 포함한다. EC 생성물은 물에 첨가할 시 동시에 유화되어 충분한 안정성을 갖는 에멀션을 생성하여 적절한 장비를 통한 분무 시용을 가능하게 할 수 있다.

[0213] EW의 제조는 화학식 I의 화합물을 액체로서(실온에서 액체가 아닌 경우, 이는 전형적으로 70℃ 미만의 적정한 온도에서 용융될 수 있음) 또는 용액 중에 (이를 적절한 용매 중에 용해시킴으로써) 수득하는 것, 및 이어서 생성된 액체 또는 용액을 고전단 하에 하나 이상의 SAA를 함유하는 물 중에 유화시켜 에멀션을 생산하는 것을 수반한다. EW에서 사용하기에 적합한 용매는 식물성 오일, 염소화 탄화수소(예컨대, 클로로벤젠), 방향족 용매(예컨대, 알킬벤젠 또는 알킬나프탈렌), 및 물 중에서 낮은 용해도를 갖는 기타 적절한 유기 용매를 포함한다.

[0214] 마이크로에멀션(ME)은 물을 하나 이상의 용매와 하나 이상의 SAA의 블렌드와 혼합하여, 열역학적으로 안정한 등방성 액체 제형을 자연스럽게 생산함으로써 제조될 수 있다. 화학식 I의 화합물은 초기에 물 또는 용매/SAA 블렌드 중에 존재한다. ME에서 사용하기에 적합한 용매는 EC 및 EW에서 사용하기 위한 상기 기술된 것들을 포함한다. ME는 수중유 또는 유중수 시스템(여기서, 존재하는 시스템은 전도도 측정에 의해 결정될 수 있음)일 수 있으며, 동일한 제형 중에 수용성 및 유용성 농약(pesticide)을 혼합하기에 적합할 수 있다. ME는 물 중에 희석하기에 적합하며, 마이크로에멀션으로서 잔류하거나 종래의 수중유 에멀션을 형성한다.

[0215] 현탁 제제(SC)는 화학식 I의 화합물의 미세 분할 불용성 고체 입자의 수성 또는 비-수성 현탁액을 포함할 수 있

다. SC는 선택적으로 하나 이상의 분산제를 갖는 적합한 매질 중의 화학식 I의 고체 화합물을 볼 또는 비드 밀링하여 화합물의 미세 입자 현탁액을 생산함으로써 제조될 수 있다. 하나 이상의 습윤제가 조성물 중에 포함될 수 있으며, 입자가 침강되는 속도를 감소시키기 위해 현탁제가 포함될 수 있다. 대안적으로는, 화학식 I의 화합물은 건조 밀링되거나, 상기 기술된 제제를 함유하는 물에 첨가되어, 소기의 최종 생성물을 생산할 수 있다.

[0216] 에어로졸 제형은 화학식 I의 화합물 및 적합한 분사제(예를 들어, *n*-부탄)를 포함한다. 화학식 I의 화합물은 또한 적합한 매질(예를 들어, 물 또는 물 혼화성 액체, 예컨대, *n*-프로판올) 중에 용해 또는 분산되어, 비-가압형 수동 구동 분무 펌프(non-pressurised, hand-actuated spray pump)에서 사용하기 위한 조성물을 제공할 수 있다.

[0217] 캡슐 현탁액(CS)은, EW 제형의 제조와 유사한 방식이지만 오일 액적의 수성 분산액이 수득되도록 추가의 중합 스테이지를 이용하여 제조될 수 있으며, 여기서, 각각의 오일 액적은 중합체 쉘에 의해 캡슐화되고, 화학식 I의 화합물, 및 선택적으로 이를 위한 담체 또는 희석제를 함유한다. 중합체 쉘은 계면 중축합 반응에 의해 또는 코아세르베이션 절차에 의해 생산될 수 있다. 조성물은 화학식 I의 화합물의 통제 방출을 제공할 수 있으며, 이들은 종자 처리를 위해 사용될 수 있다. 화학식 I의 화합물은 또한 생체 분해성 중합체 매트릭스 내에 제형화되어 화합물의 느린 통제 방출을 제공할 수 있다.

[0218] 조성물은, 예를 들어 표면 상에서의 습윤, 체류 또는 분포; 처리된 표면 상에서의 비에 대한 저항성; 또는 화학식 I의 화합물의 흡수 또는 이동도를 개선함으로써 조성물의 생물학적 성능을 개선하기 위한 하나 이상의 첨가제를 포함할 수 있다. 이러한 첨가제는 표면 활성제(SAA), 오일에 기반한 분무 첨가제, 예를 들어 특정 미네랄 오일 또는 천연 식물성유(예컨대, 대두유 및 유채씨유), 개질된 식물성유, 예컨대 메틸화 유채씨유(MRSO), 및 이들과 기타 바이오-강화 보조제(화학식 I의 화합물의 작용을 돕거나, 개질할 수 있는 성분)의 블렌드를 포함한다.

[0219] 습윤제, 분산제 및 유화제는 양이온성, 음이온성, 양쪽성 또는 비-이온성 유형의 SAA일 수 있다.

[0220] 양이온성 유형의 적합한 SAA는 4차 암모늄 화합물(예를 들어, 세틸트리메틸 암모늄 브로마이드), 이미다졸린 및 아민 염을 포함한다.

[0221] 적합한 음이온성 SAA는 지방산의 알칼리 금속염, 황산의 지방족 모노에스테르의 염(예를 들어, 나트륨 라우릴 설페이트), 설폰화 방향족 화합물의 염(예를 들어, 나트륨 도데실벤젠설포네이트, 칼슘 도데실벤젠설포네이트, 부틸나프탈렌 설포네이트, 및 나트륨 디-*이*소프로필- 및 트리-*이*소프로필-나프탈렌 설포네이트의 혼합물), 에테르 설페이트, 알코올 에테르 설페이트(예를 들어, 나트륨 라우레스-3-설페이트), 에테르 카복실레이트(예를 들어, 나트륨 라우레스-3-카복실레이트), 포스페이트 에스테르(하나 이상의 지방 알코올과 인산(주로 모노-에스테르) 또는 오산화인(주로 디-에스테르) 사이의 반응, 예를 들어 라우릴 알코올과 테트라인산 사이의 반응으로부터의 생성물; 추가적으로, 이들 생성물은 에톡실화될 수 있음), 설포숙신아메이트, 파라핀 또는 올레핀 설포네이트, 타우레이트, 리그로설포네이트 및 트리스트티릴페놀의 포스페이트/설페이트를 포함한다.

[0222] 양쪽성 유형의 적합한 SAA는 베타인, 프로피오네이트 및 글리시네이트를 포함한다. 비-이온성 유형의 적합한 SAA는 알킬렌 옥사이드, 예컨대 에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드, 부틸렌 옥사이드 또는 이의 혼합물과, 지방 알코올(예컨대, 올레일 알코올 또는 세틸 알코올) 또는 알킬페놀(예컨대, 옥틸페놀, 노닐페놀 또는 옥틸크레졸)의 축합 생성물; 장쇄 지방산 또는 헥시톨 무수물로부터 유래된 부분 에스테르; 상기 부분 에스테르와 에틸렌 옥사이드의 축합 생성물; 블록 중합체(에틸렌 옥사이드 및 프로필렌 옥사이드 포함); 알카놀아미드; 단순 에스테르(예를 들어, 지방산 폴리에틸렌 글리콜 에스테르); 아민 옥사이드(예를 들어, 라우릴 디메틸 아민 옥사이드); 레시틴 및 소르비탄, 및 이의 에스테르, 알킬 폴리글리코시드 및 트리스티릴페놀을 포함한다. 적합한 현탁제는 친수성 콜로이드(예컨대, 다당류, 폴리비닐피롤리돈 또는 나트륨 카복시메틸셀룰로스) 및 팽윤성 점토(예컨대, 벤토나이트 또는 아타풀자이트)를 포함한다.

[0223] 본 발명의 화합물은 또한 하나 이상의 추가의 제초제 및/또는 식물 성장 조절제와 혼합하여 사용될 수 있다. 이러한 추가의 제초제 또는 식물 성장 조절제의 예는 아세토클로르, 아시플루오르펜(아시플루오르펜-나트륨 포함), 아클로니펜, 아메트린, 아미카르바존, 아미노피랄리드, 아미노트리아졸, 아트라진, 베플루부타미드-M, 벤퀴트리온, 벤술푸론(벤술푸론-메틸 포함), 벤타존, 바이사이클로피론, 빌라나포스, 바이피라존, 비스피리박-나트륨, 빅슬로존, 브로마실, 브로목시닐, 부타클로르, 부타페나실, 카르펜트라존(카르펜트라존-에틸 포함), 클로란술람(클로란술람-메틸 포함), 클로리무론(클로리무론-에틸 포함), 클로로톨루론, 클로르술푸론, 신메틸린, 클라시포스, 클레토딤, 클로디나포프(클로디나포프-프로파길 포함), 클로마존, 클로피랄리드, 사이클로피라닐, 사

이클로피리모레이트, 사이클로설파무론, 사이할로포프(사이할로포프-부틸 포함), 2,4-D(이의 콜린 염 및 2-에틸헥실 에스테르 포함), 2,4-DB, 데스메디팜, 디캄바(이의 알루미늄, 아미노프로필, 비스-아미노프로필메틸, 콜린, 디클로로프로프, 디글리콜아민, 디메틸아민, 디메틸암모늄, 칼륨 및 나트륨 염 포함), 디클로술람, 디플루페니칸, 디플루펜조피르, 디메타클로르, 디메텐아미드-P, 디옥소피리트리온, 디콰트 디브로마이드, 디우론, 에피리페나실, 에탈플루랄린, 에토푸메세이트, 페녹사프로프(페녹사프로프-P-에틸 포함), 페녹사술폰, 펜피라존, 펜퀴노트리온, 펜트라자미드, 플라자술푸론, 플로라술람, 플로르피록시펜(플로르피록시펜-벤질 포함), 플루아지포프(플루아지포프-P-부틸 포함), 플루카르바존(플루카르바존-나트륨 포함), 플루페나세트, 플루메트술람, 플루미옥사진, 플루오메투론, 포메사펜 플루피르술푸론(플루피르술푸론-메틸-나트륨 포함), 플루록시피르(플루록시피르-멥틸 포함), 포메사펜, 포람술푸론, 글루포시네이트(L-글루포시네이트 및 그 둘 모두의 암모늄 염 포함), 글리포세이트(이의 디암모늄, 이소프로필암모늄 및 칼륨 염 포함), 할락시펜(할락시펜-메틸 포함), 할록시포프(할록시포프-메틸 포함), 헥사지논, 하이단토시딘, 이마자목스(R-이마자목스 포함), 이마자픽, 이마자피르, 이마제타피르, 인다지플람, 아이오도술푸론(아이오도술푸론-메틸-나트륨 포함), 이오펜술푸론(이오펜술푸론-나트륨 포함), 이옥시닐, 이소프로투론, 이속사플루톨, 란코트리온, MCPA, MCPB, 메코프로프-P, 메소술푸론(메소술푸론-메틸 포함), 메소트리온, 메타미트론, 메타자클로르, 메티오졸린, 메톨라클로르, 메토술람, 메트리부진, 메트술푸론, 나프로파미드, 니코술푸론, 노르플루라존, 옥사디아존, 옥사술푸론, 옥시플루오르펜, 파라콰트 디클로라이드, 펜디메탈린, 페녹술람, 펜메디팜, 피클로람, 피녹사덴, 프레틸라클로르, 프리미술푸론-메틸, 프로메트린, 프로파닐, 프로파퀴자포프, 프로피리술푸론, 프로피자미드, 프로술포카르브, 프로술푸론, 피라클로닐, 피라플루펜(피라플루펜-에틸 포함), 피라술포톨, 피리데이트, 피리프탈리드, 피리미술판, 피록사술폰, 피록스술람, 퀸클로락, 퀸메락, 퀴잘로포프(퀴잘로포프-P-에틸 및 퀴잘로포프-P-테푸릴 포함), 리미속사펜, 림술푸론, 사플루페나실, 세톡시딤, 시마진, S-메탈로클로르, 술펜트라존, 술포술푸론, 테부티우론, 테푸릴트리온, 템보트리온, 테르부틸라진, 테르부트린, 테트플루피롤리메트, 티엔카르바존, 티펜술푸론, 티아페나실, 톨피랄레이트, 토프라메존, 트랄콕시딤, 트리아파몬, 트리알레이트, 트리아술푸론, 트리베누론(트리베누론-메틸 포함), 트리클로피르, 트리플록시술푸론(트리플록시술푸론-나트륨 포함), 트리플루디목사진, 트리플루랄린, 트리플루술푸론, 트리피라술폰, [(E)-[2-(트리플루오로메틸)페닐]메틸렌아미노] 2,6-비스[(4,6-디메톡시피리미딘-2-일)옥시]벤조에이트, 3-(2-클로로-4-플루오로-5-(3-메틸-2,6-디옥소-4-트리플루오로메틸-3,6-디하이드로피리미딘-1(2H)-일)페닐)-5-메틸-4,5-디하이드로이속사졸-5-카복실산 에틸 에스테르, 4-하이드록시-1-메톡시-5-메틸-3-[4-(트리플루오로메틸)-2-피리딜]이미다졸리딘-2-온, 4-하이드록시-1,5-디메틸-3-[4-(트리플루오로메틸)-2-피리딜]이미다졸리딘-2-온, 5-에톡시-4-하이드록시-1-메틸-3-[4-(트리플루오로메틸)-2-피리딜]이미다졸리딘-2-온, 4-하이드록시-1-메틸-3-[4-(트리플루오로메틸)-2-피리딜]이미다졸리딘-2-온, 4-하이드록시-1,5-디메틸-3-[1-메틸-5-(트리플루오로메틸)피라졸-3-일]이미다졸리딘-2-온, (4R)1-(5-tert-부틸이속사졸-3-일)-4-에톡시-5-하이드록시-3-메틸-이미다졸리딘-2-온, 4-아미노-3-클로로-5-플루오로-6-(7-플루오로-1H-인돌-6-일)피리딘-2-카복실산(이의 농화학적으로 허용되는 에스테르 포함, 예를 들어 메틸 4-아미노-3-클로로-5-플루오로-6-(7-플루오로-1H-인돌-6-일)피리딘-2-카복실레이트, 프로프-2-이닐 4-아미노-3-클로로-5-플루오로-6-(7-플루오로-1H-인돌-6-일)피리딘-2-카복실레이트 및 시아노메틸 4-아미노-3-클로로-5-플루오로-6-(7-플루오로-1H-인돌-6-일)피리딘-2-카복실레이트), 3-에틸설파닐-N-(1,3,4-옥사디아졸-2-일)-5-(트리플루오로메틸)-[1,2,4]트리아졸로[4,3-a]피리딘-8-카복스아미드, 3-(이소프로필술파닐메틸)-N-(5-메틸-1,3,4-옥사디아졸-2-일)-5-(트리플루오로메틸)-[1,2,4]트리아졸로[4,3-a]피리딘-8-카복스아미드, 3-(이소프로필술포닐메틸)-N-(5-메틸-1,3,4-옥사디아졸-2-일)-5-(트리플루오로메틸)-[1,2,4]트리아졸로[4,3-a]피리딘-8-카복스아미드, 3-(에틸술포닐메틸)-N-(5-메틸-1,3,4-옥사디아졸-2-일)-5-(트리플루오로메틸)-[1,2,4]트리아졸로[4,3-a]피리딘-8-카복스아미드, 에틸-2-[[3-[[3-클로로-5-플루오로-6-[3-메틸-2,6-디옥소-4-(트리플루오로메틸)피리미딘-1-일]-2-피리딜]옥시]아세테이트, 6-클로로-4-(2,7-디메틸-1-나프틸)-5-하이드록시-2-메틸-피리다진-3-온, 테트라하이드로푸란-2-일메틸 (2R)-2-[(4-아미노-3,5-디클로로-6-플루오로-2-피리딜)옥시]프로파노에이트, (2R)-2-[(4-아미노-3,5-디클로로-6-플루오로-2-피리딜)옥시]프로판산, 테트라하이드로푸란-2-일메틸 2-[(4-아미노-3,5-디클로로-6-플루오로-2-피리딜)옥시]프로파노에이트, 2-[(4-아미노-3,5-디클로로-6-플루오로-2-피리딜)옥시]프로판산, 2-플루오로-N-(5-메틸-1,3,4-옥사디아졸-2-일)-3-[(R)-프로필설피닐]-4-(트리플루오로메틸)벤즈아미드, 2-플루오로-N-(5-메틸-1,3,4-옥사디아졸-2-일)-3-프로필설피닐-4-(트리플루오로메틸)벤즈아미드, (2-플루오로페닐)메틸 6-아미노-5-클로로-2-(4-클로로-2-플루오로-3-메톡시-페닐)피리미딘-4-카복실레이트, 6-아미노-5-클로로-2-(4-클로로-2-플루오로-3-메톡시-페닐)피리미딘-4-카복실산, 3-(3-클로로페닐)-6-(5-하이드록시-1,3-디메틸-피라졸-4-카보닐)-1,5-디메틸-퀴나졸린-2,4-디온 및 [4-[3-(3-클로로페닐)-1,5-디메틸-2,4-디옥소-퀴나졸린-6-카보닐]-2,5-디메틸-피라졸-3-일] N,N-디에틸카바메이트, 메틸 2-[(E)-[2-클로로-4-플루오로-5-[3-메틸-2,6-디옥소-4-(트리플루오로메틸)피리미딘-1-일]페닐] 메틸렌아미노]옥시프로파노에이트 및 메틸 (2R)-2-[(E)-[2-클로로-4-플루오로-

5-[3-메틸-2,6-디옥소-4-(트리플루오로메틸)피리미딘-1-일]페닐]메틸렌아미노] 옥시프로파노에이트를 포함한다.

[0224] 화학식 I의 화합물의 혼합 파트너는 또한 예를 들어 문헌[The Pesticide Manual, Sixteenth Edition, British Crop Protection Council, 2012]에 언급된 바와 같은 에스테르 또는 염의 형태일 수 있다. 화학식 I의 화합물 대 혼합 파트너의 혼합 비율은 바람직하게는 1:100 내지 1000:1이다.

[0225] 혼합물은 유리하게는 상기 언급된 제형에서 사용될 수 있다(이러한 경우, "유효 성분"은 화학식 I의 화합물과 혼합 파트너의 각 혼합물에 관한 것임).

[0226] 본 발명의 화합물 또는 혼합물은 또한 하나 이상의 제초제 약해 경감제와 조합하여 사용될 수 있다. 이러한 약해 경감제의 예는 베녹사코르, 클로퀸토세트(클로퀸토세트-메실 포함), 사이프로설파미드, 디클로르미드, 펜클로라졸(펜클로라졸-에틸 포함), 펜클로림, 플룩소페님, 푸릴라졸, 이속사디펜(이속사디펜-에틸 포함), 메펜피르(메펜피르-디에틸 포함), 메트카미펜 및 옥사베트리닐을 포함한다. 특히 바람직한 것은 화학식 I의 화합물과 사이프로설파미드, 이속사디펜-에틸, 클로퀸토세트-메틸 및/또는 메트카미펜의 혼합물이다.

[0227] 화학식 I의 화합물의 약해 경감제는 또한 예를 들어 문헌[The Pesticide Manual, 16th Edition (BCPC), 2012]에 언급된 바와 같은 에스테르 또는 염의 형태일 수 있다. 클로퀸토세트-메실에 대한 언급은 WO 02/34048호에 개시된 바와 같은 이의 리튬, 나트륨, 칼륨, 칼슘, 마그네슘, 알루미늄, 철, 암모늄, 4차 암모늄, 설포늄 또는 포스포늄 염에도 적용된다.

[0228] 바람직하게는, 화학식 I의 화합물 대 약해 경감제의 혼합 비율은 100:1 내지 1:10, 특히 20:1 내지 1:1이다.

[0229] 화학식 I의 화합물은 보통 농화학적 조성물의 형태로 사용되며, 추가의 화합물과 동시에 또는 그에 연이어, 처리될 작물 영역 또는 식물에 시용될 수 있다. 이들 추가의 화합물은, 예를 들어 식물의 성장에 영향을 미치는 비료 또는 미량영양소 공여체 또는 기타 조제물일 수 있다. 이들은 또한 원하는 경우, 제형 분야에서 통상적으로 이용되는 추가의 담체, 계면활성제 또는 시용 촉진 보조제를 함께 갖는, 선택적 제초제 또는 비-선택적 제초제뿐만 아니라 살충제, 살진균제, 살균제, 살선충제, 연체 동물 살충제, 또는 이들 조제물 중 몇몇의 혼합물일 수 있다.

[0230] 본원에 사용된 바와 같은 용어 "생육지"는 식물이 안에서 또는 위에서 성장하고 있거나, 종자 또는 재배된 식물이 파종되거나, 종자가 토양 내에 배치될 포장(field)을 의미한다. 이는 토양, 종자, 및 실생뿐만 아니라 확립된 식생을 포함한다.

[0231] 용어 "식물"은 종자, 실생, 묘목, 뿌리, 괴경, 줄기, 대, 엽, 및 열매를 포함하는, 식물의 모든 물리적 부분을 지칭한다.

[0232] 용어 "식물 번식 물질"은 식물의 증식에 사용될 수 있는 종자와 같은 식물의 생식 부분, 및 삽수 또는 괴경과 같은 영양성장적 물질, 예를 들어 감자를 나타내는 것으로 이해된다. 예를 들어 (엄격한 의미로는) 종자, 뿌리, 열매, 괴경, 구근, 근경, 및 식물의 부분이 언급될 수 있다. 토양으로부터 출아한 후 또는 발아한 후에 이식될 발아 식물 및 어린 식물도 언급될 수 있다. 이들 어린 식물은 침지에 의한 전체적 또는 부분적 처리에 의해 이식 전에 보호될 수 있다. 바람직하게는, "식물 번식 물질"은 종자를 나타내는 것으로 이해된다.

[0233] 본원에 언급된 농약 제제는 이들의 일반 명칭을 사용하여, 예를 들어 문헌["The Pesticide Manual", 15th Ed., British Crop Protection Council 2009]으로부터 알려져 있다.

[0234] 화학식 I의 화합물은 비개질된 형태로, 또는 바람직하게는 제형 분야에서 종래에 이용된 보조제와 함께 사용될 수 있다. 이를 위해, 편의상 이들은 알려진 방식으로 유제, 코팅 가능한 페이스트, 직접 분무 가능하거나 희석 가능한 용액 또는 현탁액, 희석 에멀션, 습윤성 분말, 가용성 분말, 분제, 과립, 및 또한 예를 들어 중합체 물질 내의 캡슐화제로 제형화될 수 있다. 조성물의 유형과 같이, 시용 방법, 예컨대 분무, 약제미립화, 살분법, 산포, 코팅 또는 주입(pouring)은 의도된 목적 및 주요 상황에 따라 선택된다. 조성물은 또한 추가의 보조제, 예컨대 안정화제, 지포제, 점도 조절제, 결합제 또는 점착부여제뿐만 아니라, 비료, 미량영양소 공여체, 또는 특별한 효과를 얻기 위한 기타 제형을 함유할 수 있다.

[0235] 예를 들어 농업 용도를 위한 적합한 담체 또는 보조제는 고체 또는 액체일 수 있으며, 제형 기술에 유용한 물질, 예를 들어 천연 또는 재생 미네랄 물질, 용매, 분산제, 습윤제, 점착부여제, 증점제, 결합제 또는 비료이다. 이러한 담체는 예를 들어 WO 97/33890호에 기술되어 있다.

[0236] 화학식 I의 화합물은 보통 조성물의 형태로 사용되며, 추가의 화합물과 동시에 또는 그에 연이어, 처리될 작물

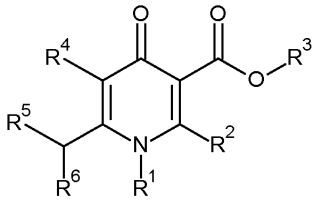
영역 또는 식물에 시용될 수 있다. 이들 추가의 화합물은, 예를 들어 식물의 성장에 영향을 미치는 비료 또는 미량영양소 공여체 또는 기타 조제물일 수 있다. 이들은 또한 원하는 경우, 제형 분야에서 통상적으로 이용되는 추가의 담체, 계면활성제 또는 시용 촉진 보조제를 함께 갖는, 선택적 제초제 또는 비-선택적 제초제뿐만 아니라 살충제, 살진균제, 살균제, 살선충제, 연체 동물 살충제, 또는 이들 조제물 중 몇몇의 혼합물일 수 있다.

[0237] 화학식 I의 화합물은 조성물의 유일한 유효 성분일 수 있거나, 적절한 경우, 하나 이상의 추가의 유효 성분, 예컨대 농약, 살진균제, 상승제, 제초제 또는 식물 성장 조절제와 혼합될 수 있다. 일부 경우에, 추가의 유효 성분은 예상외의 상승적 활성을 초래할 수 있다.

[0238] 일반적으로, 제형은 0.01 내지 90 중량%의 활성제, 0 내지 20%의 농업적으로 허용 가능한 계면활성제, 및 10 내지 99.99%의 고체 또는 액체 제형 불활성물질 및 보조제(들)를 포함하며, 활성제는 구성요소 (B) 및 (C), 및 선택적으로 기타 활성제, 특히 살미생물제 또는 보존제 등과 함께, 적어도 화학식 I의 화합물로 구성된다. 조성물의 농축된 형태는 일반적으로 약 2 내지 80 중량%, 바람직하게는 약 5 내지 70 중량%의 활성제를 함유한다. 제형의 시용 형태는 예를 들어 0.01 내지 20 중량%, 바람직하게는 0.01 내지 5 중량%의 활성제를 함유할 수 있다. 상업적 제품은 바람직하게는 농축물로 제형화될 것이나, 최종 사용자는 보통 희석된 제형을 이용할 것이다.

[0239] 하기 표는 본 발명에 따른 화학식 I의 개별 화합물의 예를 예시한다:

[0240] [화학식 I]

[0241] 

[0242] [표 1]

[0243] **본 발명에 따른 화학식 I의 개별 화합물**

화합물 번호	R^1	R^2	R^5	R^6
001	Et	(3-클로로-4-메틸설포닐-페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
002	Et	(4-클로로-3-니트로-페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
003	Et	(4-클로로-3-시아노-페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
004	Et	(3-클로로-4-메틸설포닐-페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
005	Et	(3-클로로-4-니트로-페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
006	Et	(3-클로로-4-시아노-페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
007	Et	(3-클로로-4-메틸설포닐-페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
008	Et	(4-클로로-3-니트로-페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
009	Et	(4-클로로-3-시아노-페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
010	Et	(3-클로로-4-메틸설포닐-페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
011	Et	(3-클로로-4-니트로-페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H

[0244]

화합물 번호	R^1	R^2	R^5	R^6
012	Et	(3-클로로-4-시아노-페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
013	Me	(3-클로로-4-메틸설포닐-페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
014	Me	(4-클로로-3-니트로-페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
015	Me	(4-클로로-3-시아노-페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
016	Me	(3-클로로-4-메틸설포닐-페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
017	Me	(3-클로로-4-니트로-페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
018	Me	(3-클로로-4-시아노-페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
019	Me	(3-클로로-4-메틸설포닐-페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
020	Me	(4-클로로-3-니트로-페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
021	Me	(4-클로로-3-시아노-페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
022	Me	(3-클로로-4-메틸설포닐-페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
023	Me	(3-클로로-4-니트로-페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
024	Me	(3-클로로-4-시아노-페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
025	Et	(3,4-디클로로페닐)	(3-프로폭시피라졸-1-일)	H
026	Et	(3,4-디클로로페닐)	(3-에톡시피라졸-1-일)	H
027	Et	(3,4-디클로로페닐)	[3-(2-메톡시에톡시)피라졸-1-일]	H
028	Et	(3,4-디클로로페닐)	(3-알릴옥시피라졸-1-일)	H
029	Et	(3,4-디클로로페닐)	[3-(2-시아노에톡시)피라졸-1-일]	H
030	Et	(3,4-디클로로페닐)	(3-알릴옥시피라졸-1-일)	H
031	Et	(3,4-디클로로페닐)	[3-(2-메톡시-2-옥소-에톡시)피라졸-1-일]	H
032	Et	(3,4-디클로로페닐)	(3-아세트아미도피라졸-1-일)	H
033	Et	(3,4-디클로로페닐)	[3-[(2-메톡시아세틸)아미노]피라졸-1-일]	H
034	Et	(3,4-디클로로페닐)	[3-(부트-3-에노일아미노)피라졸-1-일]	H
035	Et	(3,4-디클로로페닐)	[3-(에틸카바모일)피라졸-1-일]	H
036	Et	(3,4-디클로로페닐)	[3-(2-메톡시에틸카바모일)피라졸-1-일]	H
037	Et	(3,4-디클로로페닐)	[5-(2-메톡시에톡시)-3-메틸-피라졸-1-일]	H
038	Et	(3,4-디클로로페닐)	[5-(2-메톡시에톡시)-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
039	Et	(3,4-디클로로페닐)	(5-에톡시-3-메틸-피라졸-1-일)	H
040	Et	(3,4-디클로로페닐)	[5-에톡시-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
041	Et	(3,4-디클로로페닐)	[3-(프로필아미노)피라졸-1-일]	H
042	Et	(3,4-디클로로페닐)	[3-[메틸(프로필)아미노]피라졸-1-일]	H
043	^{n}Pr	(3,4-디클로로페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
044	알릴	(3,4-디클로로페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
045	OMe	(3,4-디클로로페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
046	프로프-2-이닐	(3,4-디클로로페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H
047	2-메톡시에틸	(3,4-디클로로페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	H

[0245]

화합물 번호	R^1	R^2	R^5	R^6
048	^{n}Pr	(3,4-디클로로페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
049	알릴	(3,4-디클로로페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
050	OMe	(3,4-디클로로페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
051	프로프-2-이닐	(3,4-디클로로페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
052	2-메톡시에틸	(3,4-디클로로페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	H
053	Et	(3,4-디클로로페닐)	[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]	Me
054	Et	(3,4-디클로로페닐)	(3-클로로피라졸-1-일)	Me

[0246]

[0247] 표 A-1은 화학식 I의 54개의 화합물 A-1.001 내지 A.1.054를 제공하며, 여기서 R^3 및 R^4는 둘 모두 수소이고, R^1, R^2, R^5, 및 R^6은 표 1에 정의된 바와 같다.

[0248] 제형 실시예

습윤성 분말	a)	b)	c)
유효 성분[화학식 I 의 화합물]	25 %	50 %	75 %
나트륨 리그노설포네이트	5 %	5 %	-
나트륨 라우릴 설페이트	3 %	-	5 %
나트륨 디이소부틸나프탈렌설포네이트	-	6 %	10 %
페놀 폴리에틸렌 글리콜 에테르 (7 내지 8 mol 의 에틸렌 옥사이드)	-	2 %	-
고도로 분산된 규산	5 %	10 %	10 %
고령토	62 %	27 %	-

[0249]

[0250] 유효 성분을 보조제와 완전히 혼합하고, 혼합물을 적합한 밀(mill)에서 완전히 분쇄하여 습윤성 분말을 제공하고, 이를 물로 희석하여 소기의 농도의 현탁액을 제공할 수 있다.

건조 종자 처리를 위한 분말	a)	b)	c)
유효 성분[화학식 I 의 화합물]	25 %	50 %	75 %
경질 미네랄 오일	5 %	5 %	5 %
고도로 분산된 규산	5 %	5 %	-
고령토	65 %	40 %	-
활석	-		20 %

[0251]

[0252] 유효 성분을 보조제와 완전히 혼합하고, 혼합물을 적합한 밀에서 완전히 분쇄하여, 종자 처리에 직접 사용될 수 있는 분말을 제공한다.

[0253] 유제

유효 성분[화학식 I 의 화합물]	10 %
옥틸페놀 폴리에틸렌 글리콜 에테르 (4 내지 5 mol 의 에틸렌 옥사이드)	3 %
칼슘 도데실벤젠설포네이트	3 %
피마자유 폴리글리콜 에테르(35 mol 의 에틸렌 옥사이드)	4 %
사이클로헥사논	30 %
자일렌 혼합물	50 %

[0254]

[0255] 식물 보호에 사용될 수 있는, 임의의 희석이 필요한 에멀션은 물을 이용한 희석에 의해 이러한 농축물로부터 수득할 수 있다.

분제	a)	b)	c)
유효 성분[화학식 I 의 화합물]	5 %	6 %	4 %
활석	95 %	-	-
고령토	-	94 %	-
미네랄 충전제	-	-	96 %

[0256]

[0257] 유효 성분을 담체와 혼합하고 혼합물을 적합한 밀에서 분쇄함으로써, 사용할 준비가 된 분제를 수득한다. 이러한 분말은 또한 종자를 위한 건조 드레싱을 위해 사용할 수 있다.

[0258] 압출기 과립

유효 성분[화학식 I 의 화합물]	15 %
나트륨 리그노설포네이트	2 %
카복시메틸셀룰로스	1 %
고령토	82 %

[0259]

[0260] 유효 성분을 보조제와 혼합하고, 분쇄하고, 혼합물을 물을 이용하여 습윤시킨다. 혼합물을 압출하고, 이어서 공기 스트림 중에서 건조시킨다.

[0261] 코팅된 과립

유효 성분[화학식 I 의 화합물]	8 %
폴리에틸렌 글리콜(몰 중량 200)	3 %

[0262] 고령토 89 %

[0263] 미세하게 분쇄된 유효 성분은 혼합기 내에서 폴리에틸렌 글리콜을 이용하여 습윤된 고령토에 균일하게 도포된다. 비-분진성(non-dusty)의 코팅된 과립을 이러한 방식으로 수득한다.

[0264] 현탁 제제

유효 성분[화학식 I 의 화합물]	40 %
프로필렌 글리콜	10 %
노닐페놀 폴리에틸렌 글리콜 에테르(15 mol 의 에틸렌 옥사이드)	6 %
나트륨 리그노설포네이트	10 %
카복시메틸셀룰로스	1 %
실리콘 오일(물 중 75% 에멀션의 형태임)	1 %

[0265] 물 32 %

[0266] 미세하게 분쇄된 유효 성분을 보조제와 친밀하게 혼합하여 현탁 제제를 제공하고, 이로부터 물을 이용한 희석에 의해 임의의 소기의 희석 현탁액을 수득할 수 있다. 이러한 희석액을 사용하면, 살아 있는 식물뿐만 아니라 식물 번식 물질이 분무, 주입, 또는 침지에 의해, 미생물에 의한 감염에 대항하여 처리 및 보호될 수 있다.

[0267] 종자 처리를 위한 유동성 농축물

유효 성분[화학식 I 의 화합물]	40 %
프로필렌 글리콜	5 %
공중합체 부탄올 PO/EO	2 %
10 내지 20 몰의 EO 를 갖는 트리스티렌페놀	2 %
1,2-벤즈이소티아졸린-3-온(물 중 20% 용액의 형태임)	0.5 %
모노아조-안료 칼슘염	5 %
실리콘 오일(물 중 75% 에멀션의 형태임)	0.2 %

[0268] 물 45.3 %

[0269] 미세하게 분쇄된 유효 성분을 보조제와 친밀하게 혼합하여 현탁 제제를 제공하고, 이로부터 물을 이용한 희석에 의해 임의의 소기의 희석 현탁액을 수득할 수 있다. 이러한 희석액을 사용하면, 살아 있는 식물뿐만 아니라 식물 번식 물질이 분무, 주입, 또는 침지에 의해, 미생물에 의한 감염에 대항하여 처리 및 보호될 수 있다.

[0270] 서방성 캡슐 현탁액

[0271] 28부의 화학식 I의 화합물의 조합을 2부의 방향족 용매, 및 7부의 톨루엔/디이소시아네이트/폴리메틸렌-폴리페닐이소시아네이트-혼합물(8:1)과 혼합한다. 이러한 혼합물을 소기의 입자 크기가 달성될 때까지 1.2부의 폴리비닐 알코올, 0.05부의 소포제, 및 51.6부의 물의 혼합물 중에 유화시킨다. 이러한 에멀션에, 5.3부의 물 중 2.8부의 1,6-디아미노헥산의 혼합물을 첨가한다. 중합 반응이 완료될 때까지, 혼합물을 교반한다. 수득된 캡슐 현탁액을 0.25부의 증점제와 3부의 분산제를 첨가함으로써 안정화시킨다. 캡슐 현탁액 제형은 28%의 유효 성분을 함유한다. 중간 캡슐 직경은 8 내지 15 마이크론이다. 수득된 제형은 해당 목적에 적합한 장치에서 수성 현탁액으로서 종자에 시용된다.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

[0272] **실시예**

[0273] 다음의 비-제한적 실시예는 하기 표 2에 언급되는 바와 같은 본 발명의 대표적 화합물에 대한 구체적 합성 방법

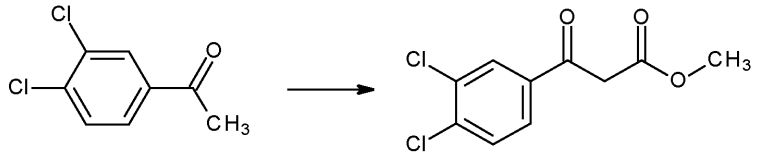
을 제공한다.

[0274] 약어 리스트

[0275] brd = 넓은 이중항, brm = 넓은 다중항, brs = 넓은 단일항, ℃ = 섭씨온도, d = 이중항, dd = 이중항들 중의 이중항, DMSO = 디메틸 설폭사이드, HPLC = 고성능 액체 크로마토그래피, LCMS = 액체 크로마토그래피 질량 분광법, M = 몰, m = 다중항, MHz = 메가헤르츠, q = 사중항, s = 단일항, t = 삼중항.

[0276] **실시예 1: 6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산(화합물 4)의 합성**

[0277] **단계 1: 메틸 3-(3,4-디클로로페닐)-3-옥소-프로파노에이트의 합성**

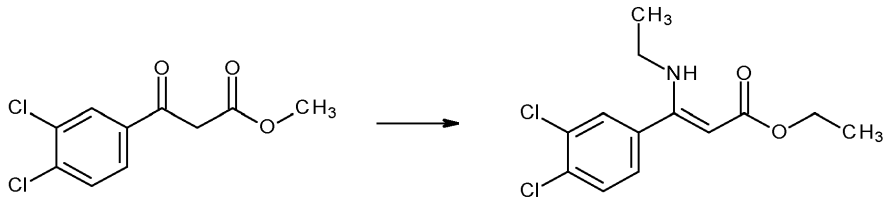
[0278] 

[0279] 질소 하에 0℃까지 냉각된 1-(3,4-디클로로페닐)에타논(5.00 g, 26.5 mmol) 및 디메틸 카보네이트(40 mL, 466 mmol)의 교반된 용액에 수소화나트륨(3.17 g, 79.5 mmol, 60 질량%)을 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온까지 가온되도록 하고, 16시간 동안 교반하였다. 하룻밤 동안, 반응 혼합물은 교반 불가능한 고체 페이스트가 되었다. 켄칭을 위한 이동성 슬러리를 생성하기 위하여, 디메틸 카보네이트(10 mL)를 더 첨가하였다. 반응 혼합물을 0℃까지 냉각시키고, 질소 하에 물(25 mL)을 첨가하여 켄칭하였다. 반응 혼합물을 2 M 수성 염산의 첨가에 의해 pH 3으로 산성화하고, 이어서 에틸 아세테이트를 이용하여 추출하였다. 유기 추출물을 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 감압 하에서 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 이소헥산 중 0%에서 15%의 에틸 아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 메틸 3-(3,4-디클로로페닐)-3-옥소-프로파노에이트(호변 이성질체의 혼합물)를 무색 액체로서 제공하였다.

[0280] 에놀: ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 12.47 (s, 1H), 7.87 (d, 1H), 7.59 (m, 3H), 7.49 (d, 1H), 5.65 (s, 1H), 3.82 (s, 3H)

[0281] 케토: ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 8.03 (d, 1H), 7.77 (m, 1H), 7.58 (d, 2H), 3.97 (s, 2H), 3.76 (s, 3H)

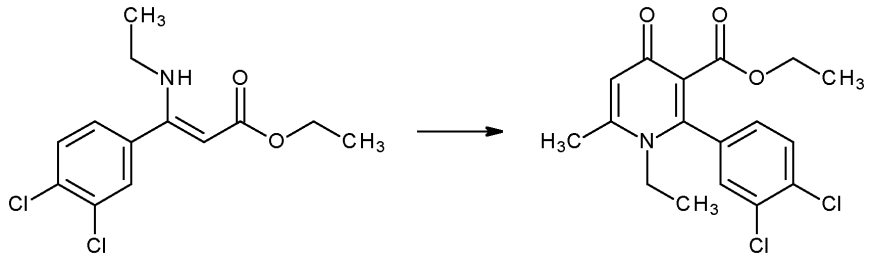
[0282] **단계 2: 에틸 (Z)-3-(3,4-디클로로페닐)-3-(에틸아미노)프로프-2-에노에이트의 합성**

[0283] 

[0284] 톨루엔(11 mL) 중 에틸 3-(3,4-디클로로페닐)-3-옥소-프로파노에이트(1.65 g, 6.319 mmol)의 교반된 용액에 에틸암모늄;아세테이트(19.0 mmol) 및 아세트산(6.32 mmol)을 첨가하였다. 오렌지색 반응 혼합물을 환류에서 6시간 동안 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 에틸 아세테이트를 이용하여 희석하고, 포화 수성 중탄산나트륨 용액을 이용하여 세정하였다. 상을 분리하고, 수성 상을 에틸 아세테이트(x3)를 이용하여 추출하였다. 유기 추출물을 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 감압 하에서 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 사이클로헥산 중 0%에서 10%의 에틸 아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 (Z)-3-(3,4-디클로로페닐)-3-(에틸아미노)프로프-2-에노에이트를 무색 오일로서 제공하였다.

[0285] ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.49 - 7.43 (m, 2H), 7.23 - 7.15 (m, 1H), 4.58 - 4.50 (m, 1H), 4.17 - 4.08 (m, 2H), 3.12 - 2.91 (m, 2H), 1.31 - 1.22 (m, 3H), 1.15 - 1.06 (m, 3H)

[0286] **단계 3: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

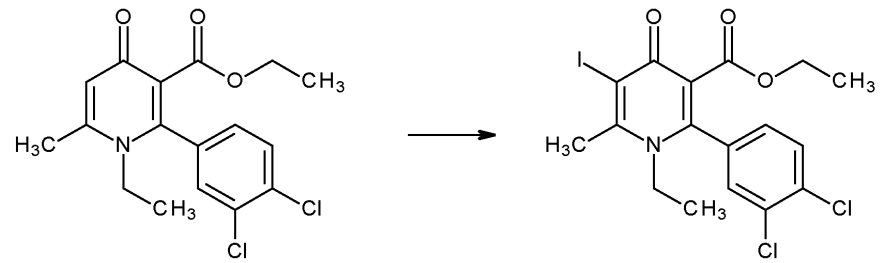


[0287]

[0288] 질소 하에서의 에틸 (Z)-3-(3,4-디클로로페닐)-3-(에틸아미노)프로프-2-에노에이트(0.583 g, 2.02 mmol) 및 2,2,6-트리메틸-1,3-디옥신-4-온(4.05 mmol)의 교반된 혼합물을 120℃에서 3시간 동안 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 에틸 아세테이트를 이용하여 희석하고, 감압 하에서 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 디클로로메탄 중 0%에서 10%의 메탄올의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 갈색 고체로서 제공하였다.

[0289] ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.59 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.29 (dd, 1H), 6.39 (s, 1H), 4.04 - 3.95 (m, 2H), 3.77 (q, 2H), 2.44 (s, 3H), 1.14 (t, 3H), 0.97 (t, 3H)

[0290] **단계 4: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-아이오도-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

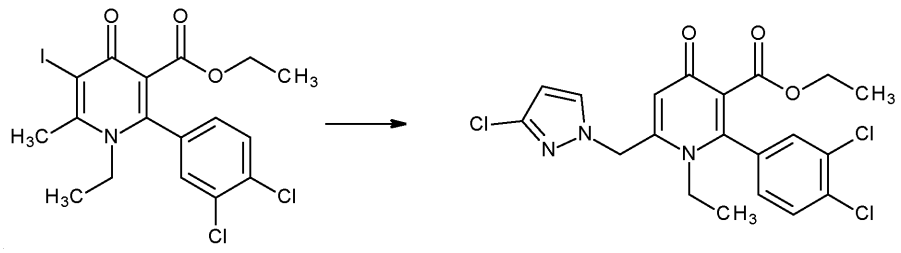


[0291]

[0292] 80℃에서 아세토니트릴(800 mL) 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(80 g, 226 mmol)의 용액에 2,2,2-트리플루오로아세트산(5.2 mL, 67.8 mmol)을 첨가하고, 이어서 1-아이오도피롤리딘-2,5-디온(224 mmol)을 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 3시간 동안 교반하였다. 냉각된 반응 혼합물을 포화 수성 탄산수소나트륨 용액의 첨가에 의해 켄칭하고, 디클로로메탄(x3)을 이용하여 추출하였다. 합한 유기 추출물을 포화 티오황산나트륨 용액, 이어서 브라인을 이용하여 세정하고, 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에서 증발시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 사이클로헥산 중 40%에서 45%의 에틸 아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-아이오도-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 백색 고체로서 제공하였다.

[0293] ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.57 (d, *J* = 8.3 Hz, 1H), 7.50 (d, *J* = 2.0 Hz, 1H), 7.24 (dd, *J* = 2.1, 8.2 Hz, 1H), 4.10 - 3.97 (m, 2H), 3.89 (q, *J* = 7.1 Hz, 2H), 2.87 (s, 3H), 1.17 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 1.03 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H)

[0294] **단계 5: 에틸 6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**



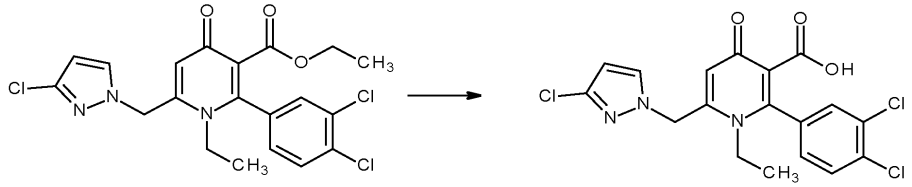
[0295]

[0296] 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-아이오도-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(0.200 g, 0.417 mmol),

3-클로로-1H-피라졸(0.154 g, 1.50 mmol), 요오드화구리(I)(0.0801 g, 0.417 mmol), 1,10-페난트롤린(0.155 g, 0.833 mmol) 및 탄산칼륨(0.116 g, 0.833 mmol)의 혼합물을 압력 해제 스크류 캡핑된 바이알에 첨가하였다. 내용물을 질소(X3)로 퍼징한 후, 탈기된 N,N-디메틸아세트아미드(2.8 mL)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 120℃에서 18시간 동안 밤새 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 물을 이용하여 희석하고, 2 M 수성 염산의 첨가에 의해 pH 1로 산성화한 후 디클로로메탄을 이용하여 추출하였다. 미정제 잔류물을 질량-분석 역상(mass-directed reverse phase) HPLC에 의해 정제하여 에틸 6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 오렌지색 검으로서 제공하였다.

[0297] ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.59 (d, 1H), 7.56 - 7.52 (m, 2H), 7.29 (d, 1H), 6.58 (brs, 1H), 6.36 - 6.25 (m, 1H), 5.31 (s, 2H), 4.08 - 3.93 (m, 4H), 1.09 (t, 3H), 0.99 (t, 3H)

[0298] **단계 6: 6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산(화합물 4)의 합성**

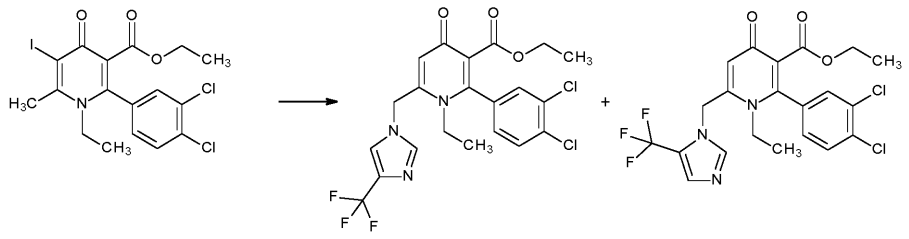
[0299] 

[0300] 메탄올(1.15 mL)과 물(0.32 mL)의 혼합물 중 에틸 6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(0.064 g, 0.14 mmol)의 용액에 수산화리튬(0.013 g, 0.56 mmol)을 첨가하였다. 생성된 용액을 환류에서 1시간 동안 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 디클로로메탄 및 물을 이용하여 희석하고, 2 M 수성 염산의 첨가에 의해 pH 1로 산성화한 후 디클로로메탄으로 추출하였다. 유기 추출물을 감압하에 증발시켜 6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 오렌지색 검으로서 제공하였다.

[0301] ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.61 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.17 (dd, 1H), 6.32 (d, 1H), 6.24 (s, 1H), 5.36 (s, 2H), 3.96 (q, 2H), 1.21 (t, 3H)

[0302] **실시예 2: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[4-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산(화합물 10)의 합성**

[0303] **단계 1: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[4-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트 및 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[5-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0304] 

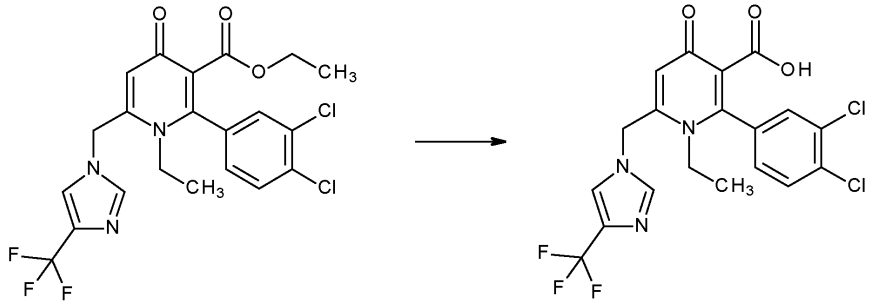
[0305] 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-아이오도-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(0.200 g, 0.417 mmol), 5-(트리플루오로메틸)-1H-이마다졸(0.204 g, 1.50 mmol), 요오드화구리(I)(0.0801 g, 0.417 mmol), 1,10-페난트롤린(0.155 g, 0.833 mmol) 및 탄산칼륨(0.116 g, 0.833 mmol)의 혼합물을 압력 해제 스크류 캡핑된 바이알, 이어서 N,N-디메틸아세트아미드(2.8 mL)에 첨가하였다. 반응 혼합물을 120℃에서 18시간 동안 밤새 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 포화 수성 염화암모늄 용액에 붓고, 에틸 아세테이트를 이용하여 희석하였다. 물을 첨가하여 수성 상에 고체 침전물을 용해시켰다. 혼합물을 규조토를 통해 여과하고, 유기 상을 포화 수성 염화암모늄, 물, 이어서 브라인을 이용하여 순차적으로 세정한 다음, 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 감압 하에 농축시켰다. 미정제 잔류물을 질량-분석 역상 HPLC에 의해 정제하여 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[4-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트(0.017 g, 0.035 mmol, 8%) 및 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[5-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트를 제공

하였다.

[0306] 이성질체 1: ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.70 (brs, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.41 (brs, 1H), 7.29 (dd, 1H), 6.24 (brs, 1H), 5.27 (brs, 2H), 4.06 - 3.94 (m, 2H), 3.77 (brd, 2H), 1.08 (brt, 3H), 0.97 (t, 3H)

[0307] 이성질체 2: ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 8.05 (brm, 1H), 7.63 - 7.56 (m, 3H), 7.32 (dd, 1H), 6.01 (s, 1H), 5.38 (s, 2H), 4.09 - 3.98 (m, 2H), 3.79 (q, 2H), 1.26 - 1.11 (m, 3H), 0.99 (t, 3H)

[0308] **단계 2: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[4-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산의 합성**



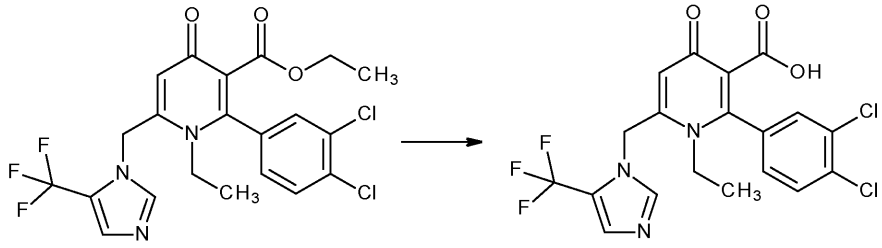
[0309]

[0310] 메탄올(0.27 mL)과 물(0.075 mL)의 혼합물 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[4-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트(0.015 g, 0.031 mmol)의 용액에 수산화리튬(0.0029 g, 0.12 mmol)을 첨가하였다. 생성된 용액을 환류에서 1.2시간 동안 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 디클로로메탄 및 물을 이용하여 희석하고, 2 M 수성 염산의 첨가에 의해 pH 1로 산성화한 후 디클로로메탄으로 추출하였다. 유기 추출물을 감압 하에 농축시켜 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[4-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0311] ^{1}H NMR (400 MHz, 메탄올) δ = 8.07 - 8.00 (m, 1H), 7.89 - 7.84 (m, 1H), 7.77 - 7.71 (m, 1H), 7.68 - 7.65 (m, 1H), 7.39 - 7.33 (m, 1H), 6.10 (s, 1H), 5.67 (s, 2H), 4.02 - 3.94 (m, 2H), 1.22 (t, 3H)

[0312] **실시예 3: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[5-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산(화합물 16)의 합성**

[0313] **단계 1: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[5-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산의 합성**



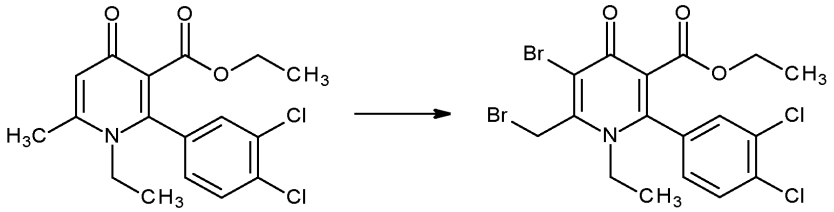
[0314]

[0315] 메탄올(0.41 mL)과 물(0.11 mL)의 혼합물 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[5-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트(0.023 g, 0.047 mmol)의 용액에 수산화리튬(0.005 g, 0.19 mmol)을 첨가하였다. 생성된 용액을 환류에서 1.2시간 동안 가열한 다음, 실온에서 18시간 동안 정치시켰다. 냉각된 반응 혼합물을 디클로로메탄 및 물을 이용하여 희석하고, 2 M 수성 염산의 첨가에 의해 pH 1로 산성화한 후 디클로로메탄으로 추출하였다. 유기 추출물을 감압 하에 농축시켜 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[5-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0316] ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.78 (s, 1H), 7.66 - 7.60 (m, 2H), 7.41 (d, 1H), 7.17 (dd, 1H), 5.99 (s, 1H), 5.37 (s, 2H), 3.84 (q, 2H), 1.33 - 1.17 (m, 3H)

[0317] **실시예 4: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산 (화합물 2)의 합성**

[0318] **단계 1: 에틸 5-브로모-6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

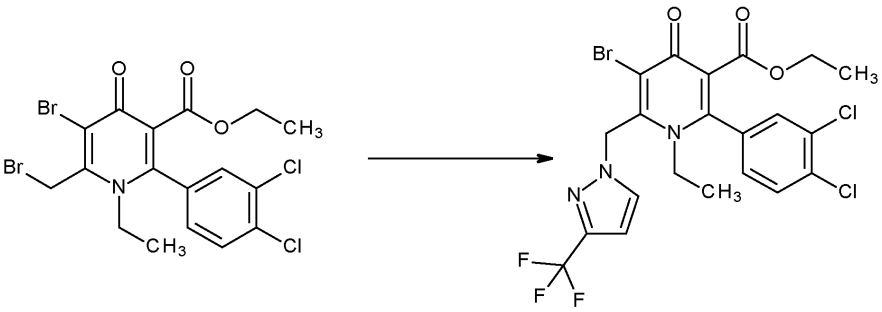


[0319]

[0320] 아세토니트릴(100 mL) 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(10.05 g, 28.37 mmol)의 현탁액에 N-브로모숙신이미드(NBS, 5.56 g, 31.2 mmol)를 3분에 걸쳐 조금씩 첨가하였다. 첨가 완료 시, 반응 혼합물을 40℃에서 3시간 동안 가열하였다. 이 시간 후, 반응 혼합물을 아세토니트릴(100 mL)을 이용하여 희석하고, 트리플루오로아세트산(3.93 g, 2.66 mL, 34 mmol)을 첨가하고, 이어서 NBS(5.05 g, 28.4 mmol)를 5분에 걸쳐 조금씩 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 80℃에서 4시간 동안 가열한 다음, 실온에서 18시간 동안 정치시켰다. 아세토니트릴을 감압 하에 제거하고, 잔류물을 디클로로메탄과 물 사이에 분배하였다. 유기 상을 탄산수소나트륨 포화 수용액, 이어서 브라인을 이용하여 세정한 다음, 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 농축시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 사이클로헥산 중 0%에서 100%의 에틸 아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 5-브로모-6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 회백색 고체로서 제공하였다.

[0321] ^{1}H NMR (500 MHz, 클로로포름) δ = 7.59 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 4.72 (brs, 2H), 4.10 - 3.95 (m, 4H), 1.25 (t, 3H), 1.04 (t, 3H)

[0322] **단계 2: 에틸 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트의 합성**

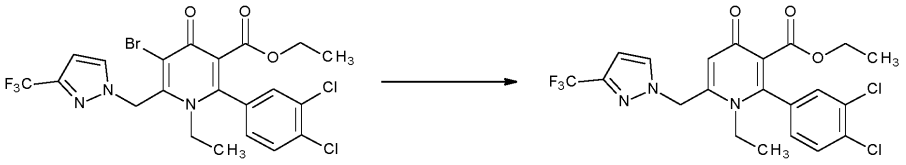


[0323]

[0324] 아세토니트릴(100 mL) 중 에틸 5-브로모-6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(5.2 g, 10.1 mmol)의 용액에 3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸(1.52 g, 11.2 mmol)을 첨가하고, 이어서 탄산칼륨(2.83 g, 20.3 mmol)을 2분에 걸쳐 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 1.7시간 동안 교반하였다. 아세토니트릴을 감압 하에 제거하고, 잔류물을 디클로로메탄(100 mL)과 물(100 mL)의 혼합물에 용해시켰다. 수성 상을 디클로로메탄(x2)을 이용하여 추출하고, 합한 유기 추출물을 브라인을 이용하여 세정하고, 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 농축시켜 에틸 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트를 백색 포말로서 제공하였다.

[0325] ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.80 (dd, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.23 (dd, 1H), 6.64 - 6.61 (m, 1H), 5.81 (s, 2H), 4.23 (brd, 2H), 4.11 - 3.99 (m, 2H), 1.09 - 1.01 (m, 6H)

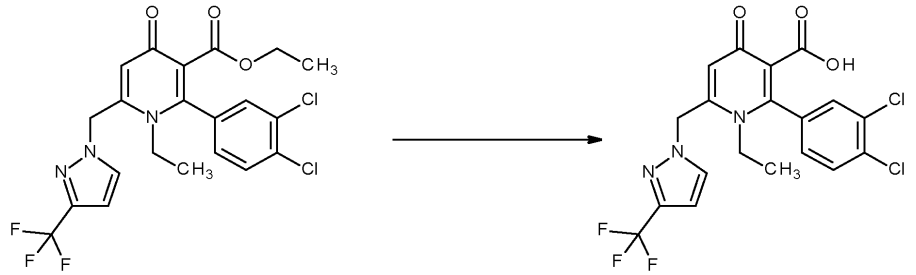
[0326] **단계 3: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0327] 

[0328] 수소화 용기에 5% 탄소 상 팔라듐(50% 습윤)(1.3 g), 에틸 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트(5.0 g, 8.8 mmol), 에탄올(130 mL) 및 아세트산(25 mL)을 로딩하였다. 혼합물을 수소 분위기(2 bar) 하에 5.5시간 동안 교반하였다. 이 시간 후, 추가의 5% 탄소 상 팔라듐(50% 습윤)(0.5 g)을 첨가하고, 혼합물을 수소 분위기(2 bar) 하에 2.3시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 규조토를 통해 여과하고, 디클로로메탄을 이용하여 세정하고, 여액을 감압 하에 증발시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 물(+0.1% 포름산) 중 40%에서 80%의 아세토니트릴(+0.1% 포름산)의 구배를 사용하는 C-18 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트를 백색 고체로서 제공하였다.

[0329] ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.65 - 7.62 (m, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.26 - 7.23 (m, 1H), 6.65 (d, 1H), 6.34 (s, 1H), 5.35 (s, 2H), 4.09 - 3.97 (m, 2H), 3.87 (q, 2H), 1.04 - 0.95 (m, 6H)

[0330] **단계 4: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산의 합성**

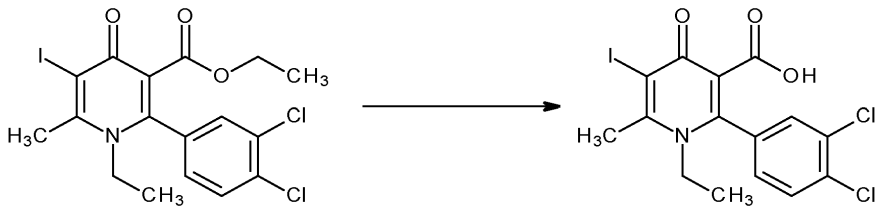
[0331] 

[0332] 메탄올(55 mL)과 물(15 mL)의 혼합물 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트(3.08 g, 6.31 mmol)의 용액에 수산화리튬(0.604 g, 25.2 mmol)을 첨가하였다. 생성된 용액을 환류에서 2시간 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 40℃까지 냉각되도록 한 후, 물(50 mL)을 이용하여 희석하고, 2 M 수성 염산(20 mL)의 첨가에 의해 pH 1로 산성화하여 백색 고체를 침전시켰다. 메탄올을 감압 하에 제거하고, 생성된 수성 혼합물을 아이스 배쓰에서 냉각시켰다. 생성된 백색 고체를 여과에 의해 단리하고, 물을 이용하여 세정하고, 공기 건조시켜 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0333] ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.73 - 7.68 (m, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.17 (dd, *J* = 2.0, 8.3 Hz, 1H), 6.67 (d, 1H), 6.20 (s, 1H), 5.47 (s, 2H), 4.02 - 3.91 (m, 2H), 1.20 (t, 3H)

[0334] **실시예 5: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-메톡시카보닐피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산(화합물 40)의 합성**

[0335] **단계 1: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-아이오도-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산의 합성**

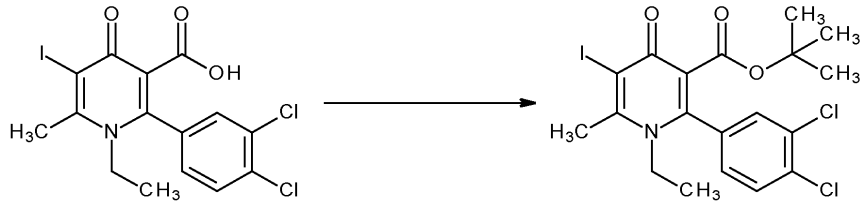
[0336] 

[0337] 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-아이오도-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(6.0 g, 12.5 mmol)를 메탄올(54 mL)과 물(24 mL)의 혼합물에 용해시키고, 수산화리튬(1.32 g, 31.5 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 80℃에서 2시간 동안 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 감압 하에 증발 건조시키고, 잔류물을 냉수를 이용하여

희석하고, 2 M 수성 염산의 첨가에 의해 산성화하였다. 생성된 침전물을 여과하고, 물을 이용하여 세정하고, 감압 하에 건조시켜 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-아이오도-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0338] ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.60 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.11 (dd, 1H), 4.13 - 3.92 (q, 2H), 3.00 (s, 3H), 1.23 (t, 3H).

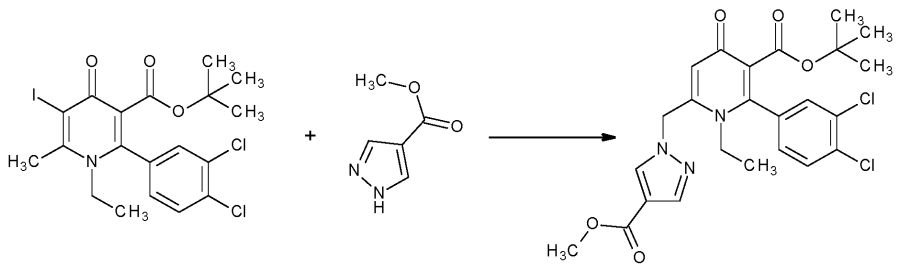
[0339] **단계 2: tert-부틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-아이오도-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0340] 

[0341] 실온에서 2-메틸프로판-2-올(3 mL/mmol) 중 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-아이오도-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산(4.7 g, 10 mmol)의 현탁액에 N,N-디메틸피리딘-4-아민(5.2 mmol) 및 tert-부톡시카보닐 tert-부틸 카보네이트(21 mmol)를 순차적으로 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 18시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 포화 수성 탄산수소나트륨 용액을 이용하여 희석하고, 에틸 아세테이트(x3)로 추출하였다. 합한 추출물을 포화 수성 탄산수소나트륨 용액을 이용하여 1회 세정한 다음, 황산마그네슘 상에서 건조시켰다. 잔류물을 용리액으로서 사이클로헥산 중 에틸 아세테이트를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 tert-부틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-아이오도-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 제공하였다.

[0342] ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.64 - 7.45 (m, 1H), 7.56 - 7.46 (m, 1H), 7.26 - 7.24 (m, 1H), 3.97 - 3.85 (q, 2H), 2.87 (s, 3H), 1.25 (s, 9H), 1.20 - 1.15 (m, 3H).

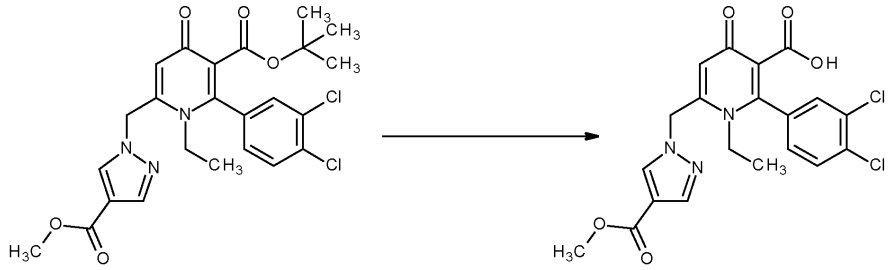
[0343] **단계 3: tert-부틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-메톡시카보닐피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0344] 

[0345] 질소 하에서 tert-부틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-아이오도-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(1.0 g, 1.97 mmol), 메틸 1H-피라졸-4-카복실레이트(0.89 g, 7.1 mmol), 요오드화구리(I)(0.379 g, 1.97 mmol), 1,10-페난트롤린(0.731 g, 3.94 mmol) 및 탄산칼륨(0.55 g, 3.94 mmol)의 혼합물에 탈기된 N,N-디메틸아세트아미드(13 mL)를 첨가하였다. 혼합물을 마이크로파 조사 하에 교반하면서 120℃에서 2시간 동안 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 포화 수성 염화암모늄 용액에 붓고, 에틸 아세테이트 및 물을 첨가하였다. 혼합물을 규조토를 통해 여과하고, 유기 상을 포화 수성 염화암모늄, 물, 이어서 브라인을 이용하여 순차적으로 세정한 다음, 황산마그네슘 상에서 건조시켰다. 미정제 잔류물을 HPLC에 의해 정제하여 tert-부틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-메톡시카보닐피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 백색 고체로서 제공하였다.

[0346] 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 8.16 - 8.12 (m, 1H), 7.99 - 7.97 (m, 1H), 7.64 - 7.59 (m, 1H), 7.58 - 7.55 (m, 1H), 7.33 - 7.29 (m, 1H), 6.85 - 6.44 (m, 1H), 5.56 - 5.27 (m, 2H), 4.01 - 3.93 (m, 2H), 3.89 - 3.86 (m, 3H), 1.26 - 1.20 (m, 9H), 1.14 - 1.05 (m, 3H)

[0347] **단계 4: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-메톡시카보닐피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산의 합성**

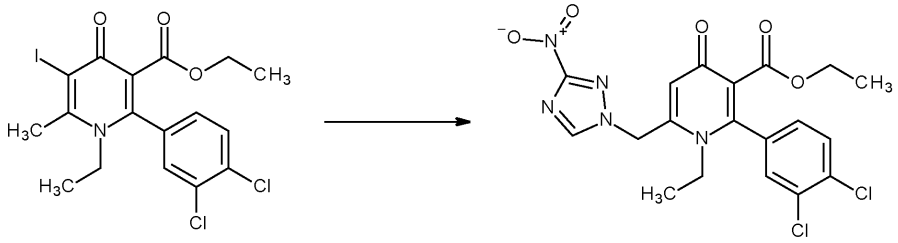
[0348] 

[0349] 트리플루오로메틸벤젠(10 mL/g) 중 tert-부틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-메톡시카보닐피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(100 mg, 0.20 mmol)의 용액에 0℃에서 2,2,2-트리플루오로아세트산(15 당량, 2.962 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온까지 가온시키고, 24시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 하에 증발 건조시키고, 잔류물을 세정하였다. 그 후에, 이를 rt에서 24 h 동안 교반되도록 하였다. 반응을 LCMS에 의해 모니터링하였다. 이는 완료를 보여주었다. 이어서, 반응 혼합물을 감압 하에 농축시키고, 잔류물을 메틸 tert-부틸 에테르를 이용하여 세정하여, 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-메톡시카보닐피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 제공하였다.

[0350] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.66 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.86 - 7.73 (m, 2H), 7.44 (dd, 1H), 6.18 (s, 1H), 5.73 (s, 2H), 3.94 - 3.89 (m, 2H), 3.78 (s, 3H), 1.05 (t, 3H)

[0351] **실시예 6: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-메톡시-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산(화합물 44)의 합성**

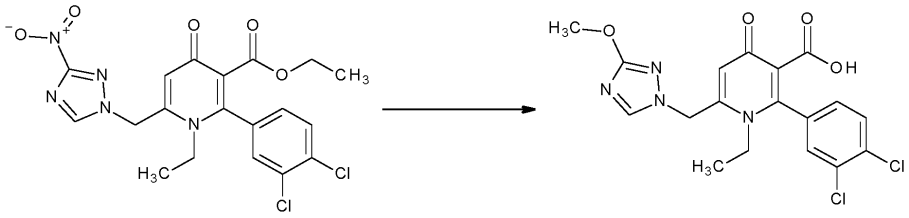
[0352] **단계 1: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-니트로-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0353] 

[0354] 질소 하에서 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-아이오도-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(1.00 g, 2.08 mmol), 3-니트로-1H-1,2,4-트리아졸(0.855 g, 7.50 mmol), 요오드화구리(I)(0.401 g, 2.08 mmol), 1,10-페난트롤린(0.774 g, 4.17 mmol) 및 탄산칼륨(0.582 g, 4.17 mmol)의 혼합물에 탈기된 N,N-디메틸아세트아미드(14 mL)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 마이크로파 조사 하에 150℃에서 1시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 포화 수성 염화암모늄 용액에 붓고, 에틸 아세테이트 및 물을 첨가하였다. 혼합물을 규조토를 통해 여과하고, 유기 상을 포화 수성 염화암모늄, 물, 이어서 브라인을 이용하여 순차적으로 세정한 다음, 황산마그네슘 상에서 건조시켰다. 미정제 잔류물을 HPLC에 의해 정제하여 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-니트로-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 제공하였다.

[0355] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 9.10 (s, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.49 (dd, 1H), 6.17 (s, 1H), 5.78 (s, 2H), 3.91 - 3.76 (m, 4H), 1.03 (t, 3H), 0.82 (t, 3H)

[0356] **단계 2: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-메톡시-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산의 합성**

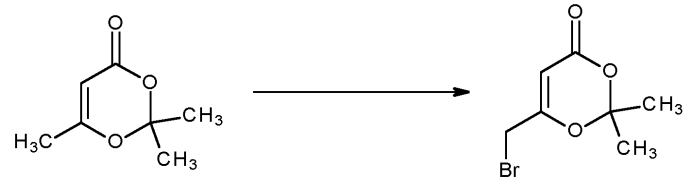
[0357] 

[0358] 메탄올(10 mL) 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-니트로-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(40 mg, 0.086 mmol)의 용액에 물(0.04 mL) 중 수산화리튬(0.014 g, 0.34 mmol)의 현탁액을 첨가하였다. 반응 혼합물을 80℃에서 1시간 동안 교반하였다. 냉각된 반응 혼합물을 2 M 수성 염산의 첨가에 의해 산성화하고, 추가의 물(10 mL)을 이용하여 희석한 다음, 에틸 아세테이트(2 x 10 mL)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 브라인을 이용하여 세정하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 농축시켰다. 미정제 물질을 tert-부틸 메틸 에테르를 이용하여 분쇄하고, 여과하고, 고체 여과물(solid filtrate)을 감압 하에 건조시켜 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-메톡시-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 제공하였다.

[0359] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.48 (s, 1H), 7.84 - 7.80 (m, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.44 (dd, 1H), 6.27 (s, 1H), 5.62 (s, 2H), 3.92 - 3.86 (m, 5H), 1.07 (t, 3H)

[0360] **실시예 7: 6-[(3-브로모피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산(화합물 177)의 합성**

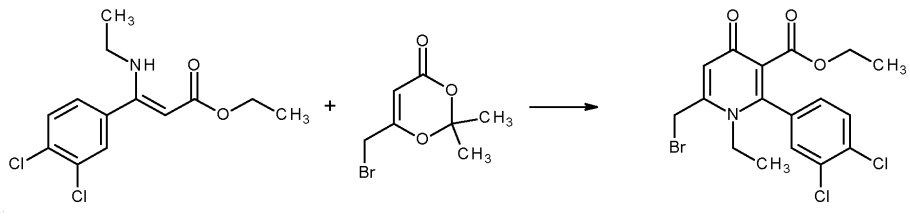
[0361] **단계 1: 6-(브로모메틸)-2,2-디메틸-1,3-디옥신-4-온의 합성**

[0362] 

[0363] 디클로로메탄(120 mL) 중 2,2,6-트리메틸-1,3-디옥신-4-온(4.88 g, 34.3 mmol) 및 N-브로모숙신이미드(7.94 g, 44.6 mmol)의 교반된 용액을 실온에서 12시간 동안 450 nm 광으로 조사하였다. 오렌지색 반응 혼합물을 포화 수성 중탄산나트륨 용액 및 포화 수성 티오황산나트륨 용액의 50:50 혼합물을 이용하여 세정하였다. 유기 상을 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 물(+0.1% 포름산) 중 30%에서 60%의 아세토니트릴(+0.1% 포름산)의 구배를 사용하는 C-18 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 6-(브로모메틸)-2,2-디메틸-1,3-디옥신-4-온을 황색 오일로서 제공하였다.

[0364] ^{1}H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 5.54 (s, 1H), 3.90 (s, 2H), 1.73 (s, 6H)

[0365] **단계 2: 에틸 6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

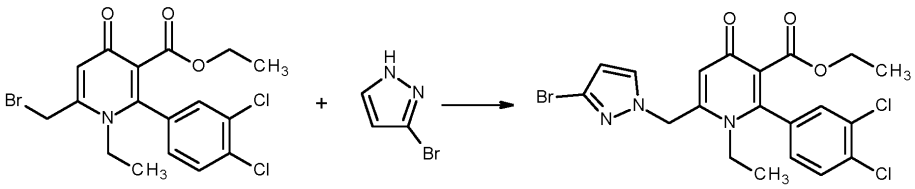
[0366] 

[0367] 자일렌(20.0 mL) 중 에틸 (Z)-3-(3,4-디클로로페닐)-3-(에틸아미노)프로프-2-에노에이트(2.00 g, 6.94 mmol)의 교반된 용액에 6-(브로모메틸)-2,2-디메틸-1,3-디옥신-4-온(2.30 g, 10.4 mmol)을 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 140℃에서 5분 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 에틸 아세테이트를 이용하여 희석하고, 유기 용액을 브라인을 이용하여 세정하고, 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 갈색 고체로서 6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트로 증발 건조시켰다.

[0368] ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.89 (s, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 6.59 (s, 1H), 4.72 (s, 2H),

3.82-3.77 (q, 4H), 1.11 (t, 3H), 0.84 (t, 3H).

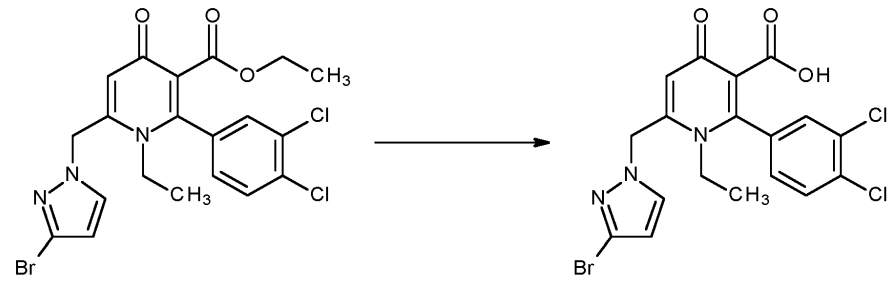
[0369] **단계 3: 에틸 6-[(3-브로모피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0370] 

[0371] 아세토니트릴(10 mL) 중 에틸 6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(0.500 g, 1.15 mmol)의 용액에 3-브로모-1H-피라졸(0.19 g, 1.27 mmol)을 첨가하고, 이어서 탄산칼륨(0.32 g, 2.31 mmol)을 2분에 걸쳐 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 물 및 에틸 아세테이트를 이용하여 희석하고, 상을 분리하였다. 유기 추출물을 무수 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 물(+0.1% 포름산) 중 20%에서 80%의 아세토니트릴(+0.1% 포름산)의 구배를 사용하는 역상 C-18 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 6-[(3-브로모피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 백색 고체 포말로서 제공하였다.

[0372] 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.56 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 6.40 (d, 1H), 6.38 (s, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.09 - 3.97 (m, 2H), 3.86 (q, 2H), 1.04 (t, 3H), 0.98 (t, 3H)

[0373] **단계 4: 6-[(3-브로모피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산의 합성**

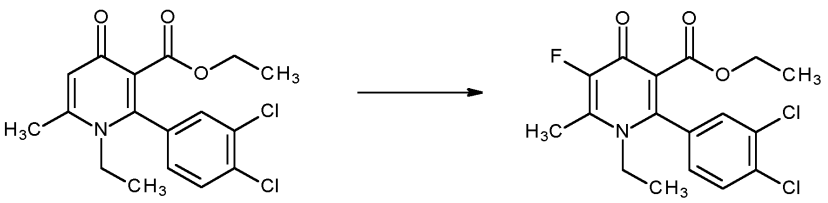
[0374] 

[0375] 메탄올(1.25 mL)과 물(0.35 mL)의 혼합물 중 에틸 6-[(3-브로모피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(0.139 g, 0.278 mmol)의 용액에 수산화리튬(0.048 g, 1.11 mmol)을 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 80℃에서 3시간 동안 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 디클로로메탄 및 물을 이용하여 희석하고, 2 M 수성 염산의 첨가에 의해 pH 1로 산성화하였다. 상을 분리하고, 유기 상을 감압 하에 증발 건조시켜 6-[(3-브로모피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 백색 고체 포말로서 제공하였다.

[0376] 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.61 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.43 (d, 1H), 6.34 (s, 1H), 5.37 (s, 2H), 3.96 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)

[0377] **실시예 8: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-플루오로-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산(화합물 206)의 합성**

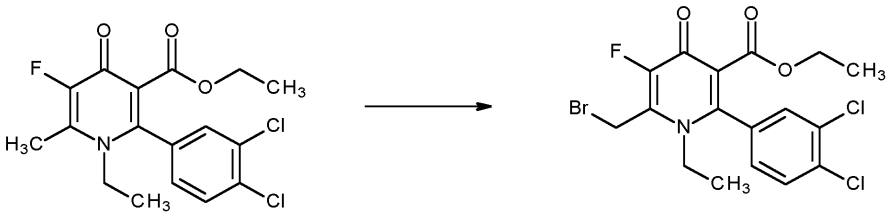
[0378] **단계 1: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-플루오로-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0379] 

[0380] 실온에서 에탄올(100 mL) 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(2.50 g,

7.06 mmol)의 교반된 용액에 1-(클로로메틸)-4-플루오로-1,4-디아조니아바이사이클로[2.2.2]옥탄; 디테트라플루오로보레이트(7.50 g, 21.2 mmol)를 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 80℃에서 48분 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 물(100 mL)을 이용하여 희석하고 디클로로메탄(2 x 100 mL)으로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 물(+0.1% 포름산) 중 0%에서 65%의 아세토니트릴(+0.1% 포름산)의 구배를 사용하는 역상 C-18 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-플루오로-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 백색 고체로서 제공하였다.

[0381] **단계 2: 에틸 6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-플루오로-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

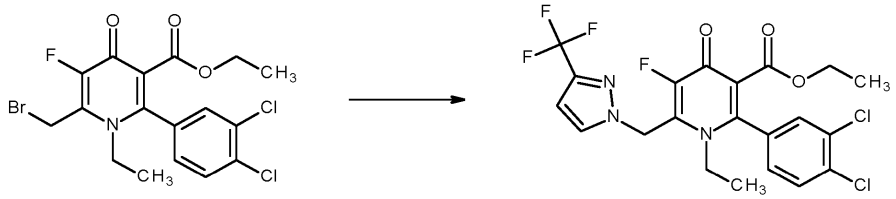


[0382]

[0383] 아세토니트릴(25 mL) 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-플루오로-6-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(500 mg, 1.01 mmol)의 교반된 용액에 실온에서 1-브로모피롤리딘-2,5-디온(0.269 g, 1.51 mmol) 및 트리플루오로아세트산(0.293 g, 1.21 mmol)을 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 80℃에서 2시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 물(50 mL)을 이용하여 희석하고, 에틸 아세테이트(x2)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 브라인(20 mL)을 이용하여 세정하고, 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 헥산 중 10%에서 50%의 에틸 아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-플루오로-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 백색 고체로서 제공하였다.

[0384] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.92 - 7.81 (m, 2H), 7.56 - 7.43 (m, 1H), 3.90 - 3.81 (m, 4H), 2.70 (s, 2H), 1.11 (t, 3H), 0.93 (t, 3H)

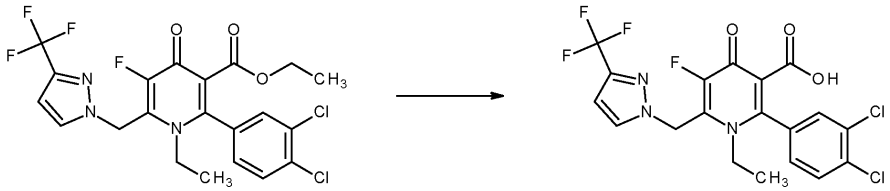
[0385] **단계 3: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-플루오로-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트의 합성**



[0386]

[0387] 아세토니트릴(10 mL) 중 에틸 6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-플루오로-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(400 mg, 0.84 mmol)의 교반된 용액에 3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸(126 mg, 0.93 mmol) 및 탄산칼륨(232 mg, 1.68 mmol)을 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 물(50 mL)을 이용하여 희석하고, 에틸 아세테이트(x2)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 잔류물을 용리액으로서 헥산 중 10%에서 50%의 에틸 아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-플루오로-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트를 백색 고체로서 제공하였다.

[0388] **단계 4: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-플루오로-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산의 합성**



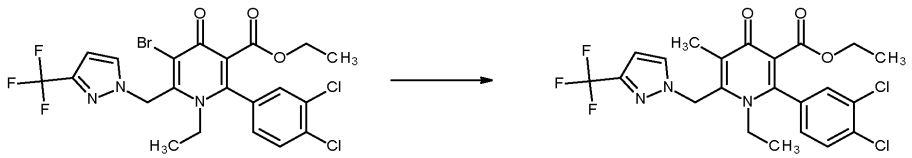
[0389]

[0390] 실온에서의 아세토니트릴(7.5 mL)과 물(2.5 mL)의 혼합물 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-플루오로-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트(190 mg, 0.38 mmol)의 교반된 용액에 주위 온도에서의 수산화리튬 수화물(0.063 g, 1.5 mmol)을 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 80℃에서 4시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 물(20 mL)을 이용하여 희석하고, 2 M 수성 염화수소 용액의 첨가에 의해 중화시켰다. 침전된 고체를 여과하고, 감압 하에 용매의 증발에 의해 건조시켜 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-플루오로-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산을 담갈색 고체로서 제공하였다.

[0391] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.24 (d, 1H), 7.81 (dd, 2H), 7.46 (dd, 1H), 6.86 (d, 1H), 5.80 (d, 2H), 3.96 (q, 2H), 0.59 (t, 3H)

[0392] **실시예 9: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-메틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산(화합물 20)의 합성**

[0393] **단계 1: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-메틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트의 합성**

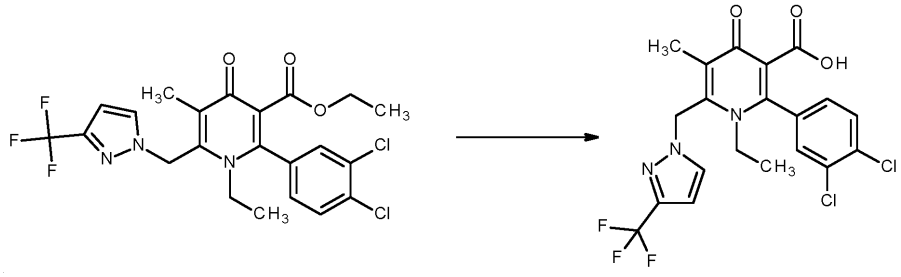


[0394]

[0395] 질소 하에서 아세토니트릴(8 mL)과 물(2 mL)의 탈기된 혼합물에 에틸 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트(200 mg, 0.35 mmol), 메틸보론산(40 mg, 0.67 mmol) 및 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II)) 디클로라이드(60 mg, 0.083 mmol), 이어서 탄산칼륨(200 mg, 1.4 mmol)을 첨가하였다. 생성된 현탁액을 질소로 블랭킷하고, 마이크로파 조사 하에 100℃에서 0.5시간 동안 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 규조토를 통해 여과하고, 디클로로메탄을 이용하여 세정하였다. 여액을 브라인을 이용하여 세정한 다음, 무수 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 사이클로헥산 중 에틸 아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-메틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트(170 mg, 0.34 mmol)를 크림색 고체로서 제공하였다.

[0396] 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.56 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.22 (dd, 1H), 6.63 (d, 1H), 5.51 (s, 2H), 4.11 - 3.98 (m, 2H), 3.92 (q, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.06 - 0.98 (m, 6H)

[0397] **단계 2: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-메틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산의 합성**



[0398]

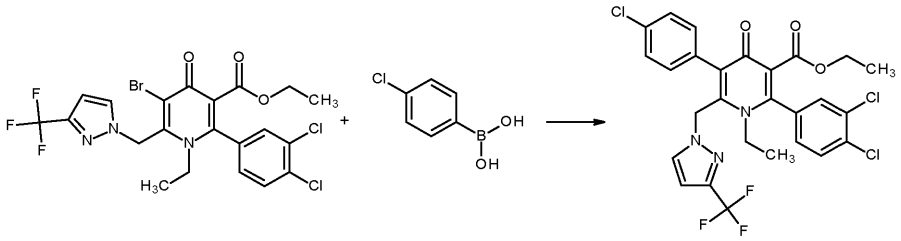
[0399] 메탄올(5.0 mL) 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-메틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트(170 mg, 0.34 mmol)의 용액에 물(1 mL) 중 수산화리튬 수화물(75 mg, 1.8 mmol)의

용액을 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 80℃에서 1.5시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 물에 붓고, 2 M 수성 염화수소 용액을 이용하여 산성화하고, 디클로로메탄으로 추출하였다. 미정제 물질을 용리액으로서 물(+0.1% 포름산) 중 아세토니트릴(+0.1% 포름산)의 구배를 사용하는 역상 C-18 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-메틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산을 크림색 고체로서 제공하였다.

[0400] 1H NMR (400 MHz, 메탄올) δ = 7.64 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.65 (d, 1H), 5.61 (s, 2H), 4.19 - 4.08 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.14 (t, 3H)

[0401] **실시예 10: 5-(4-클로로페닐)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산(화합물 21)의 합성**

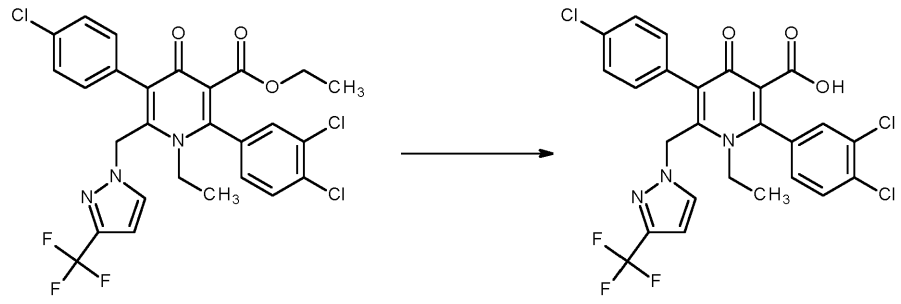
[0402] **단계 1: 에틸 5-(4-클로로페닐)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0403] 

[0404] 질소 하에서 아세토니트릴(8 mL)과 물(2 mL)의 탈기된 혼합물에 에틸 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트(200 mg, 0.35 mmol), (4-클로로페닐)보론산(70 mg, 0.45 mmol) 및 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II)) 디클로라이드(50 mg, 0.069 mmol), 이어서 탄산칼륨(150 mg, 1.1 mmol)을 첨가하였다. 생성된 현탁액을 질소로 블랭킷하고, 마이크로파 조사 하에 100℃에서 0.5시간 동안 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 규조토를 통해 여과하고, 디클로로메탄을 이용하여 세정하였다. 여액을 브라인을 이용하여 세정한 다음, 무수 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 사이클로헥산 중 에틸 아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 5-(4-클로로페닐)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트를 무색 검으로서 제공하였다.

[0405] 1H NMR (500 MHz, 클로로포름) δ = 7.59 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.43 (d, 2H), 7.29 (dd, 1H), 7.15 (d, 2H), 7.10 (d, 1H), 6.54 (d, 1H), 5.29 (s, 2H), 4.14 - 4.00 (m, 4H), 1.11 - 1.00 (m, 6H)

[0406] **단계 2: 5-(4-클로로페닐)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산의 합성**

[0407] 

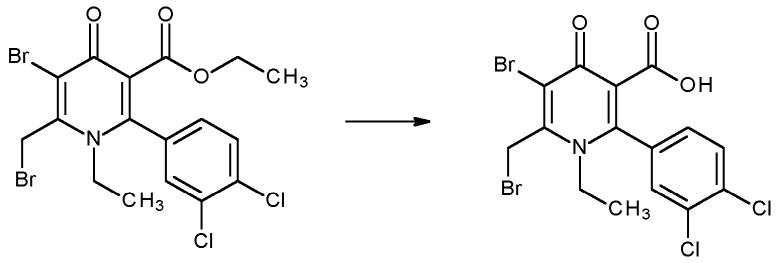
[0408] 메탄올(10 mL)과 물(1 mL)의 혼합물 중 에틸 5-(4-클로로페닐)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트(160 mg, 0.27 mmol)의 용액에 수산화리튬 수화물(35 mg, 0.83 mmol)을 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 80℃에서 4시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 2 M 염화수소 수용액에 붓고, 디클로로메탄으로 추출하였다. 유기 추출물을 감압 하에 증발 건조시켜 5-(4-클로로페닐)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산을 크림색 고체로서 제공하였다.

[0409] 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.61 (d, 1H), 7.48 (brd, 2H), 7.44 - 7.38 (m, 1H), 7.18 (dd, 1H),

7.12 (brd, 2H), 7.07 (d, 1H), 6.54 (d, 1H), 5.33 (s, 2H), 4.27 - 4.15 (m, 2H), 1.17 (t, 2H)

[0410] **실시예 11: 6-[[3,5-비스(에톡시카보닐)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산(화합물 112)의 합성**

[0411] **단계 1: 5-브로모-6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실산의 합성**

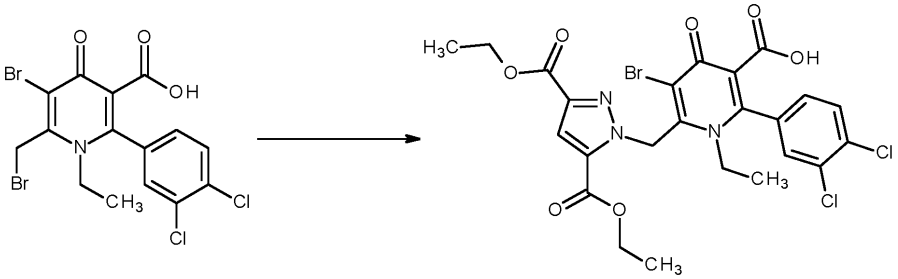


[0412]

[0413] 테트라하이드로푸란(50 mL)과 물(10 mL)의 혼합물 중 에틸 5-브로모-6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(5.00 g, 9.77 mmol)의 용액에 스칸듐(III)트리플루오로메탄설포네이트(6.25 g, 12.7 mmol)를 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 50℃에서 12시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 에틸 아세테이트(30 mL)를 이용하여 희석하고, 물 및 브라인을 이용하여 순차적으로 세정한 다음, 무수 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 디클로로메탄을 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 5-브로모-6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0414] 1H NMR (500 MHz, 클로로포름) δ = 7.60 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.12 (dd, 1H), 4.96 (s, 2H), 4.18 - 4.09 (m, 2H), 1.22 (t, 3H)

[0415] **단계 2: 6-((3,5-비스(에톡시카보닐)-1H-피라졸-1-일) 메틸)-5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실산의 합성**

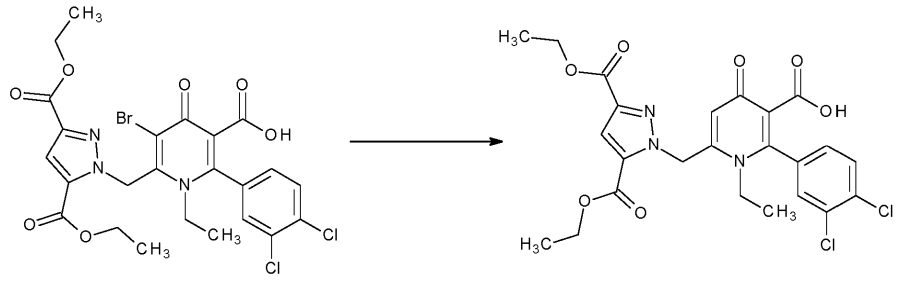


[0416]

[0417] 무수 테트라하이드로푸란(3 mL) 중 디에틸 1H-피라졸-3,5-디카복실레이트(158 mg, 0.74 mmol)의 용액에 질소 분위기 하에서 수소화나트륨(50 mg)을 첨가하였다. 5분 후, 무수 테트라하이드로푸란(3 mL) 중 5-브로모-6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실산(300 mg, 0.62 mmol)의 용액을 적가하였다. 생성된 반응 혼합물을 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 물의 첨가에 의해 켄칭하고, 에틸 아세테이트(x3)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 브라인을 이용하여 세정하고, 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 디클로로메탄 중 0%에서 5%의 메탄올의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 6-((3,5-비스(에톡시카보닐)-1H-피라졸-1-일) 메틸)-5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0418] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 14.06 (s, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.36 (s, 1H), 6.23 (s, 2H), 4.39 (q, 2H), 4.28 (q, 2H), 3.95 (dd, 2H), 1.35 (t, 3H), 1.29 (t, 3H), 1.03 (t, 3H)

[0419] **단계 3: 6-[[3,5-비스(에톡시카보닐)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산의 합성**



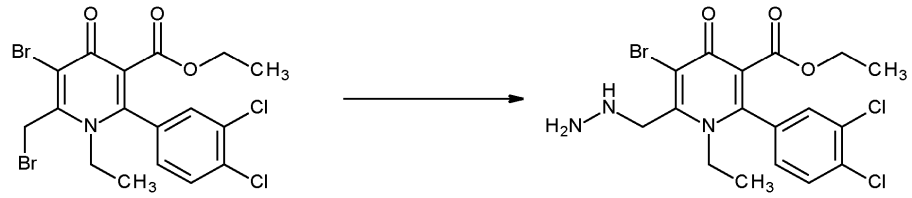
[0420]

[0421] 메탄올(10 mL) 중 6-((3,5-비스(에톡시카보닐)-1H-피라졸-1-일) 메틸)-5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실산 9(250 mg, 0.41 mmol)의 용액에 실온에서 10% 탄소 상 팔라듐(100 mg)을 첨가하고, 혼합물을 수소 분위기 하에 12시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 규조토를 통해 농축시키고, 여액을 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 분취용 HPLC에 의해 정제하여 6-[[3,5-비스(에톡시카보닐)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0422] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 16.22 (s, 1H), 7.83 - 7.79 (m, 2H), 7.45 (m, 2H), 6.10 (s, 2H), 5.52 (s, 1H), 4.33 - 4.29 (m, 4H), 3.86 (q, 2H), 1.32 - 1.28 (m, 6H), 1.17 (t, 3H)

[0423] **실시예 12: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-하이드록시-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산(화합물 147)의 합성**

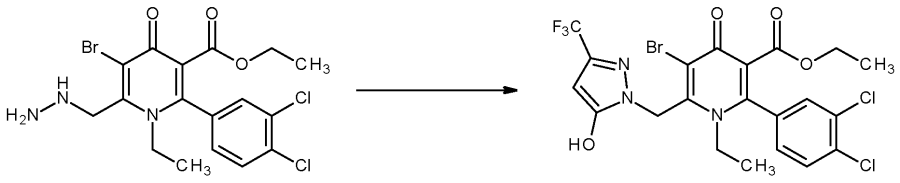
[0424] **단계 1: 에틸 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-(하이드라지노메틸)-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**



[0425]

[0426] 아세토니트릴(20 mL) 중 하이드라진 일수화물(0.211 g, 4.3 mmol)의 용액에 실온에서 에틸 5-브로모-6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(2.0 g, 3.9 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 2시간 동안 교반하였다. 반응 완료 시, 반응물을 감압 하에 증발 건조시켜 에틸 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-(하이드라지노메틸)-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 담황색 고체로서 제공하였다.

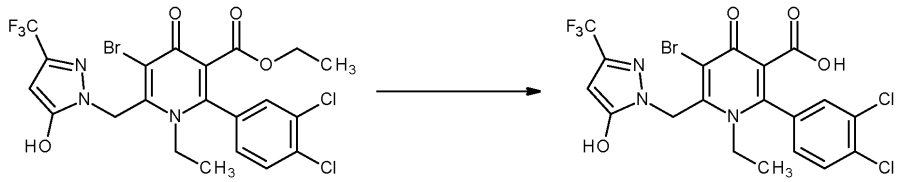
[0427] **단계 2: 에틸 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-하이드록시-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**



[0428]

[0429] 톨루엔(3 mL) 중 에틸 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-(하이드라지노메틸)-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(1.4 g, 3.02 mmol)의 교반된 용액에 메틸 4,4,4-트리플루오로-3-옥소-부타노에이트(0.514 g, 3.02 mmol) 및 *p*-톨루엔설폰산 일수화물(29 mg, 0,15 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 환류에서 8시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 여과하고, 디클로로메탄을 이용하여 세정하여, 에틸 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-((5-하이드록시-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일)메일)-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실레이트를 백색 고체로서 제공하였다.

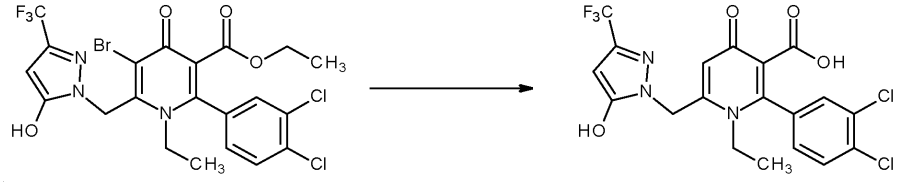
[0430] **단계 3: 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-하이드록시-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산의 합성**



[0431]

[0432] 테트라하이드로푸란(1 mL)과 물(1 mL)의 혼합물 중 에틸 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-((5-하이드록시-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일)메일)-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실레이트(200 mg, 0.34 mmol)의 교반된 혼합물에 수산화리튬(25 mg, 1.03 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 65℃에서 18시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 감압 하에 증발 건조시키고, 잔류물을 물에 현탁시켰고, 이를 2 M 수성 염화수소 용액의 첨가에 의해 산성화하였다. 생성물을 에틸 아세테이트로 추출하고, 감압 하에 담황색 고체로서 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-하이드록시-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산으로 증발 건조시켰다.

[0433] **단계 4: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-하이드록시-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산의 합성**



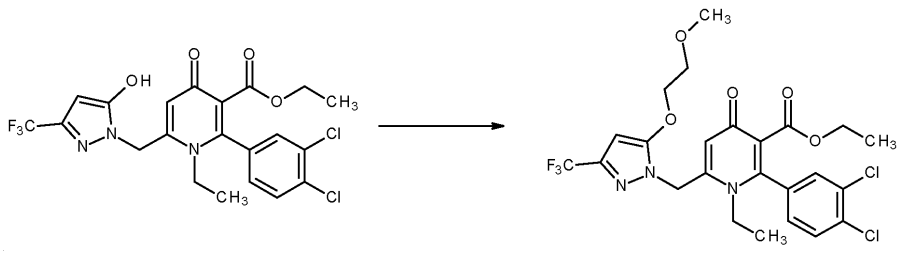
[0434]

[0435] 아세토니트릴(3 mL) 중 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-하이드록시-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산(140 mg, 0.252 mmol)의 용액에 암모늄 포르메이트(79.5 mg, 1.26 mmol) 및 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II)클로라이드(17.7 mg, 0.025 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 마이크로파 조사 하에 120℃에서 1시간 동안 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 아세토니트릴을 이용하여 희석하고, 규조토를 통해 여과하고, 디클로로메탄을 이용하여 세정하였다. 여액을 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 물(+0.1% 포름산) 중 5%에서 95%의 아세토니트릴(+0.1% 포름산)의 구배를 사용하는 역상 C-18 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-하이드록시-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 백색 분말로서 제공하였다.

[0436] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 12.53 (s, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 5.94 - 5.89 (m, 2H), 5.48 (s, 2H), 3.88 (q, 2H), 1.06 (t, 3H)

[0437] **실시예 13: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-(2-메톡시에톡시)-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산(화합물 144)의 합성**

[0438] **단계 1: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-(2-메톡시에톡시)-3-(트리플루오로메틸) 피라졸-1-일] 메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

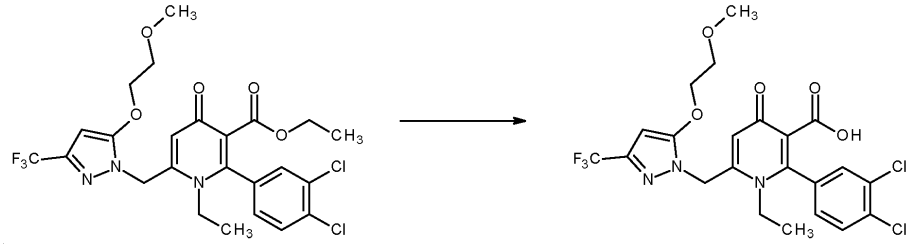


[0439]

[0440] *N,N*-디메틸포름아미드(2 mL) 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-하이드록시-3-(트리플루오로메틸) 피라졸-1-일] 메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(200 mg, 0.40 mmol)의 교반된 용액에 1-아이오도-2-메톡시-에탄(0.148 g, 0.793 mmol) 및 탄산칼륨(0.164 g, 1.19 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 50℃에서 1시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 물을 이용하여 희석하고, 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 상을 브라인을 이용하여 세정하고, 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켜 미정제 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-(2-메톡시에톡시)-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-

4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 제공하였고, 이를 추가 정제 없이 다음 단계에 직접 사용하였다.

[0441] **단계 2: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-(2-메톡시에톡시)-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산의 합성**

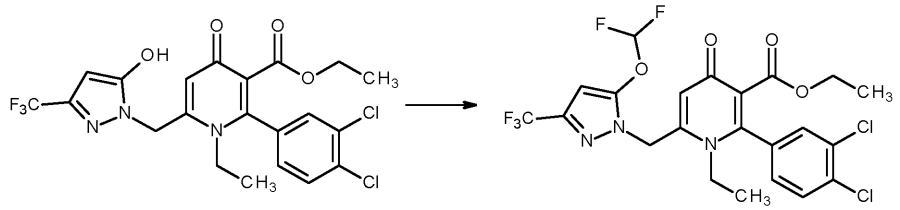
[0442] 

[0443] 실온에서 테트라하이드로푸란(1 mL)과 물(1 mL)의 혼합물 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-(2-메톡시에톡시)-3-(트리플루오로메틸) 피라졸-1-일] 메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(200 mg, 0.356 mmol)의 교반된 용액에 수산화리튬 일수화물(0.045 g, 1.07 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 50℃에서 12시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 디클로로메탄 및 물을 이용하여 희석하고, 1 M 수성 염화수소 용액의 첨가에 의해 pH 3으로 산성화하였다. 상을 분리하고, 유기 상을 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 분취용-HPLC에 의해 정제하여 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-(2-메톡시에톡시)-3-(트리플루오로메틸) 피라졸-1-일] 메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0444] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.87 - 7.70 (m, 2H), 7.44 (dd, 1H), 6.48 (s, 1H), 6.01 (s, 1H), 5.51 (s, 2H), 4.46 - 4.30 (m, 2H), 3.88 (q, 2H), 3.68 - 3.61 (m, 2H), 3.25 (s, 3H), 1.05 (t, 3H)

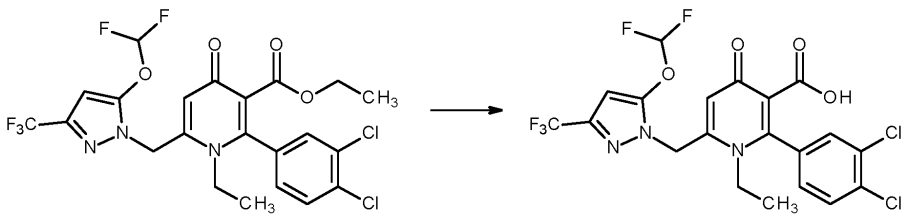
[0445] **실시예 14:** 2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[5-(디플루오로메톡시)-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산**(화합물 151)의 합성**

[0446] **단계 1: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[5-(디플루오로메톡시)-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0447] 

[0448] *N,N*-디메틸포름아미드(5 mL) 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-하이드록시-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(200 mg, 0.397 mmol) 및 나트륨;2-클로로-2,2-디플루오로-아세테이트(181 mg, 1.2 mmol)의 교반된 혼합물에 탄산세슘(388 mg, 1.2 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 12시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 하에 증발 건조시키고, 잔류물을 물을 이용하여 희석하고, 에틸 아세테이트(x2)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 감압 하에 증발 건조시키고, 생성된 잔류물을 용리액으로서 디클로로메탄 중 0%에서 3%의 메탄올의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[5-(디플루오로메톡시)-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 백색 고체로서 제공하였다.

[0449] **단계 2: 2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[5-(디플루오로메톡시)-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산의 합성**

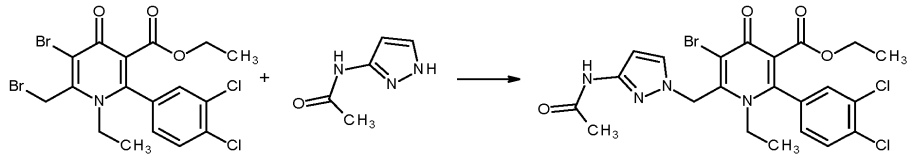
[0450] 

[0451] 테트라하이드로푸란(5 mL)과 물(1 mL)의 혼합물 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[5-(디플루오로메톡시)-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(82 mg, 0.148 mmol)의 교반된 용액에 스칸듐(III) 트리플루오로메탄설포네이트(109 mg, 0.22 mmol)를 한 번에 첨가하였다. 반응 혼합물을 질소 분위기 하에 50℃에서 24시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 증발시켜 테트라하이드로푸란을 제거하고, 잔류물을 에틸 아세테이트(x3)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 분취용-HPLC에 의해 정제하여 2-(3,4-디클로로페닐)-6-((5-(디플루오로메톡시)-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일)메틸)-1-에틸-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0452] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 16.12 (s, 1H), 7.80 (m, 2H), 7.62 - 7.26 (m, 1H), 7.47 - 7.41 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 5.92 (s, 1H), 5.69 (s, 2H), 3.87 (d, 2H), 1.06 (t, 3H)

[0453] **실시예 15: 6-[(3-아세트아미도피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산(화합물 154)의 합성**

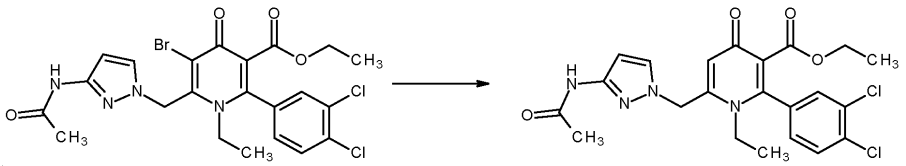
[0454] **단계 1: 에틸 6-[(3-아세트아미도피라졸-1-일)메틸]-5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0455] 

[0456] 무수 테트라하이드로푸란(50 mL) 중 N-(1H-피라졸-3-일)아세트아미드(1.47 g, 11.7 mmol)의 교반된 용액에 0℃에서 수소화나트륨(0.508 g, 12.7 mmol)을 5분에 걸쳐 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 이 온도에서 0.5시간 동안 교반하였다. 테트라하이드로푸란 중 에틸 5-브로모-6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(5.0 g, 9.8 mmol)의 용액을 5분에 걸쳐 적가하였다. 반응물을 0℃에서 0.5시간 동안 교반한 후, 실온까지 가온되도록 하고, 추가 0.5시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 0℃에서 물(!00 mL)을 이용하여 희석하고, 디클로로메탄(x3)으로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 물(x3) 및 브라인을 이용하여 순차적으로 세정하고, 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 석유 에테르 중 10%에서 50%의 에틸 아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 6-[(3-아세트아미도피라졸-1-일)메틸]-5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 제공하였다.

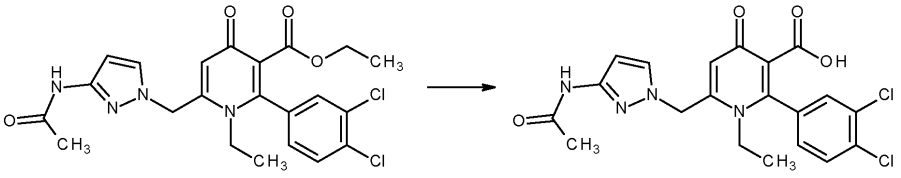
[0457] 1H NMR (400 MHz, DMSO) δ = 10.46 (s, 1H), 7.89 - 7.75 (m, 3H), 7.46 (dd, 1H), 6.56 (d, 1H), 5.67 (s, 2H), 4.04 - 3.78 (m, 4H), 1.97 (s, 3H), 0.98 - 0.80 (m, 6H)

[0458] **단계 2: 에틸 6-[(3-아세트아미도피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0459] 

[0460] 메탄올(25 mL)과 아세토니트릴(25 mL)의 혼합물 중 에틸 6-[(3-아세트아미도피라졸-1-일)메틸]-5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(3.00 g, 5.4 mmol)의 용액에 10% 탄소 상 팔라듐(0.50 g)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 수소의 벌룬 압력 하에 실온에서 12시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 규조토를 통해 여과하고, 여액을 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 물(+0.1% 포름산) 중 5%에서 95%의 아세토니트릴(+0.1% 포름산)의 구배를 사용하는 역상 C-18 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 6-[(3-아세트아미도피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 담황색 고체로서 제공하였다.

[0461] **단계 3: 6-[(3-아세트아미도피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산의 합성**

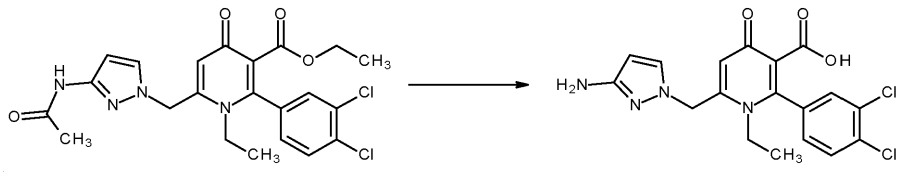


[0462]

[0463] 테트라하이드로푸란(1.5 mL)과 물(1.5 mL)의 혼합물 중 에틸 6-[(3-아세트아미도피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(200 mg, 0.42 mmol)의 교반된 용액에 실온에서 수산화나트륨(0.067 g, 1.68 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 50℃에서 2시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 1 M 수성 염화수소 용액의 첨가에 의해 pH 4로 산성화하고, 디클로로메탄(x3)으로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 분취용-HPLC에 의해 정제하여 6-[(3-아세트아미도피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0464] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 10.50 (s, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.81 - 7.74 (m, 2H), 7.42 (dd, 1H), 6.63 (d, 1H), 6.12 (s, 1H), 5.56 (s, 2H), 3.88 (d, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.03 (t, 3H)

[0465] **실시예 16: 6-[(3-아미노피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산(화합물 156)의 합성**

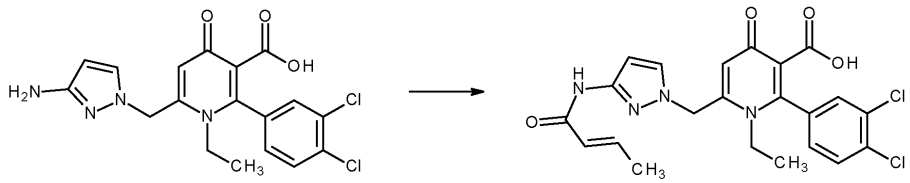


[0466]

[0467] 테트라하이드로푸란(1.5 mL)과 물(1.5 mL)의 혼합물 중 에틸 6-[(3-아세트아미도피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(0.200 g, 0.42 mmol)의 교반된 용액에 수산화나트륨(0.067 g, 1.68 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 80℃에서 2시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 1 M 수성 염화수소 용액의 첨가에 의해 pH 4로 산성화하고, 디클로로메탄(x3)으로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 분취용-HPLC에 의해 정제하여 6-[(3-아미노피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0468] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 - 7.74 (m, 2H), 7.57 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.05 (s, 1H), 5.57 (d, 1H), 5.37 (s, 2H), 4.82 (s, 2H), 3.87 (d, 2H), 1.06 (t, 3H)

[0469] **실시예 17: 6-[[3-[[(E)-부트-2-에노일]아미노]피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산(화합물 155)의 합성**



[0470]

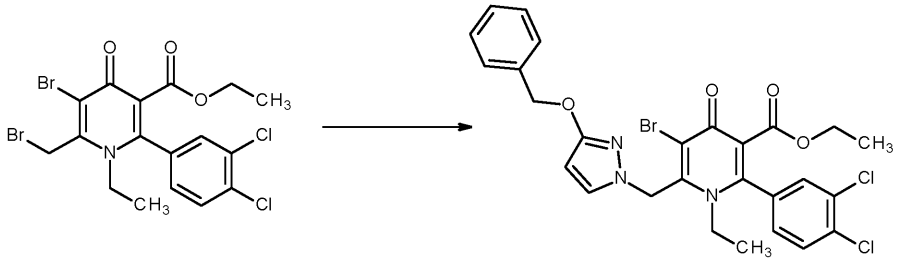
[0471] 무수 *N,N*-디메틸포름아미드(5 mL) 중 (E)-부트-2-엔산(63 mg, 0.74 mmol)의 교반된 혼합물에 [디메틸아미노(트리아졸로[4,5-b]피리딘-3-일옥시)메틸렌]-디메틸-암모늄;헥사플루오로포스페이트(HATU, 280 mg, 0.74 mmol) 및 트리에틸아민(150 mg, 1.5 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 0.5시간 동안 교반한 후 6-((3-아미노-1H-피라졸-1-일)메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실산(200 mg, 0.49 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 2시간 동안 교반한 후, 물로 켄칭하고, 에틸 아세테이트(x3)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 분취용-HPLC에 의해 정제하여 6-[[3-[[(E)-부트-2-에노일]아미노]피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클

로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0472] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 10.57 (d, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.80 - 7.76 (m, 2H), 7.42 (d, 1H), 6.86 - 6.73 (m, 1H), 6.71 (s, 1H), 6.16 (d, 2H), 5.57 (s, 2H), 3.89 (d, 2H), 1.84 (d, 3H), 1.02 (t, 3H)

[0473] **실시예 18: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-하이드록시피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산(화합물 167)의 합성**

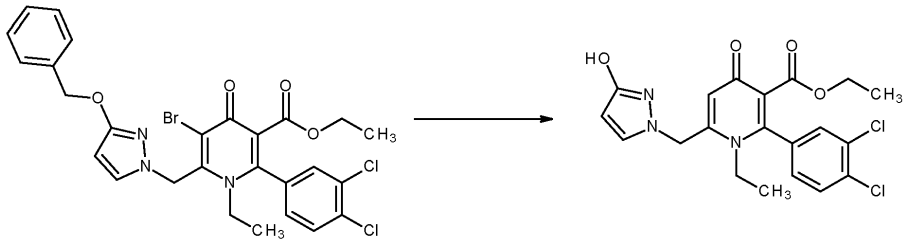
[0474] **단계 1: 에틸 6-((3-(벤질옥시)-1H-피라졸-1-일)메틸)-5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실레이트의 합성**



[0475]

[0476] 질소 분위기 하에서 무수 테트라하이드로푸란(10 mL) 중 1-[3-(벤질옥시)-1H-피라졸-1-일]에타논(680 mg, 3.90 mmol)의 용액에 수소화나트륨(230 mg, 10 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 0.5시간 동안 교반하고, 이어서 무수 테트라하이드로푸란(10 mL) 중 에틸 5-브로모-6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(2.0 g, 3.9 mmol)의 용액을 적가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 물(10 mL)을 이용하여 희석하고, 에틸 아세테이트(x3)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 브라인을 이용하여 세정하고, 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켜 에틸 6-[(3-벤질옥시피라졸-1-일)메틸]-5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 백색 고체로서 제공하였다.

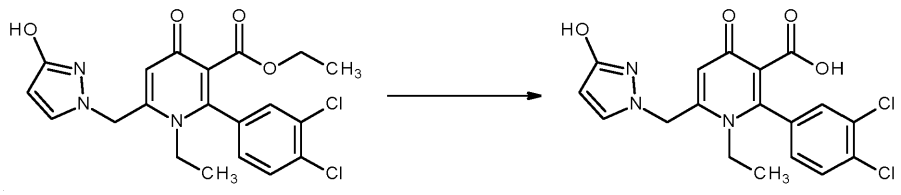
[0477] **단계 2: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-((3-하이드록시-1H-피라졸-1-일) 메틸)-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실레이트의 합성**



[0478]

[0479] 테트라하이드로푸란(10 mL) 중 에틸 6-((3-(벤질옥시)-1H-피라졸-1-일)메틸)-5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실레이트(1.0 g, 1.65 mmol)의 교반된 용액에 10% 탄소 상 팔라듐(1 g)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 수소의 벌룬 압력 하에 실온에서 6시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 규조토를 통해 여과하고, 여액을 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 디클로로메탄 중 0%에서 5%의 메탄올의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-((3-하이드록시-1H-피라졸-1-일)메틸)-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실레이트를 백색 분말로서 제공하였다.

[0480] **단계 3: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-하이드록시피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산의 합성**



[0481]

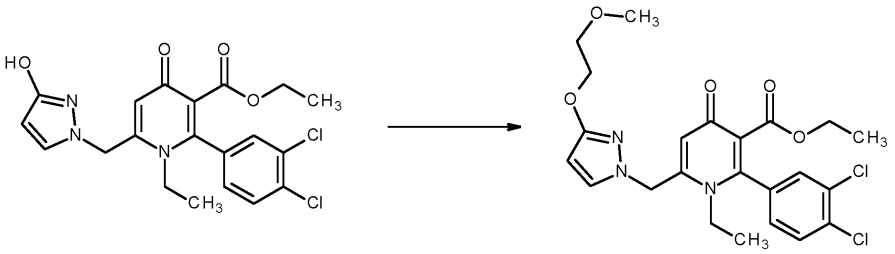
[0482] 테트라하이드로푸란(2.5 mL), 메탄올(2.5 mL) 및 물(2.5 mL)의 혼합물 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-

6-((3-하이드록시-1H-피라졸-1-일) 메틸)-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실레이트(230 mg, 0.527 mmol)의 교반된 혼합물에 수산화리튬(50 mg, 2.09 mmol)을 한 번에 첨가하였다. 반응 혼합물을 50℃에서 18시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 감압 하에 증발 건조시킨 다음, 물(5 mL)을 이용하여 희석하고, 2 M 수성 염화수소 용액의 첨가에 의해 pH 1로 산성화하였다. 침전된 고체를 여과하고, 물을 이용하여 세정한 다음, 용리액으로서 물(+0.1% 포름산) 중 5%에서 100%의 아세토니트릴(+0.1% 포름산)의 구배를 사용하는 역상 C-18 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-((3-하이드록시-1H-피라졸-1-일) 메틸)-4-옥소-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실산을 백색 분말로서 제공하였다.

[0483] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 9.94 (s, 1H), 7.82 - 7.73 (m, 2H), 7.66 (d, 1H), 7.45 - 7.40 (m, 1H), 6.08 (d, 1H), 5.64 (d, 1H), 5.41 (s, 2H), 3.88 (q, 2H), 1.05 (t, 3H)

[0484] **실시예 19: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-(2-메톡시에톡시)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산 (화합물 161)의 합성**

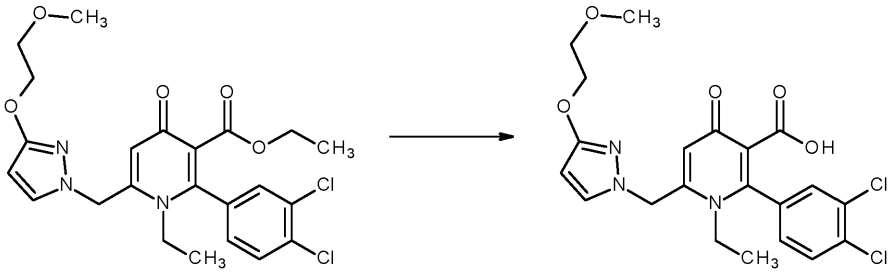
[0485] **단계 1: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-(2-메톡시에톡시)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**



[0486]

[0487] *N,N*-디메틸포름아미드(3 mL) 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-하이드록시피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(150 mg, 0.344 mmol)와 1-아이오도-2-메톡시-에탄(192 mg, 1.03 mmol)의 교반된 혼합물에 탄산칼륨(190 mg, 1.38 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 24시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 하에 증발 건조시키고, 잔류물을 물을 이용하여 희석하고, 에틸 아세테이트(x3)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 감압 하에 증발 건조시키고, 미정제 잔류물을 용리액으로서 디클로로메탄 중 0%에서 3%의 메탄올의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-(2-메톡시에톡시)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 백색 고체로서 제공하였다.

[0488] **단계 2: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-(2-메톡시에톡시)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산의 합성**



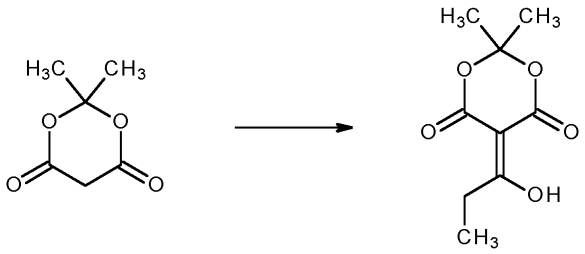
[0489]

[0490] 테트라하이드로푸란(2 mL)과 물(2 mL)의 혼합물 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-(2-메톡시에톡시)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(120 mg, 0.243 mmol)의 교반된 용액에 수산화리튬(23 mg, 0.97 mmol)을 한 번에 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 24시간 동안 교반하였다. 테트라하이드로푸란을 감압 하에 제거하고, 수성 잔류물을 에틸 아세테이트(x2)를 이용하여 세정하였다. 1 M 수성 염화수소 용액의 첨가에 의해 수성 상을 pH 2로 산성화한 다음, 에틸 아세테이트(x3)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 감압 하에 증발 건조시키고, 미정제 잔류물을 분취용-HPLC에 의해 정제하여 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-(2-메톡시에톡시)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0491] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.87 - 7.68 (m, 3H), 7.43 (dd, 1H), 5.95 (s, 1H), 5.88 (d,1H), 5.50 (s, 2H), 4.23 - 4.12 (m, 2H), 3.88 (q, 2H), 3.67 - 3.54 (m, 2H), 3.29 (s, 3H), 1.08 (t, 3H)

[0492] **실시예 20: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[1-[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]에틸]피리딘-3-카복실산(화합물 172)의 합성**

[0493] **단계 1: 5-(1-하이드록시프로필리덴)-2,2-디메틸-1,3-디옥산-4,6-디온의 합성**

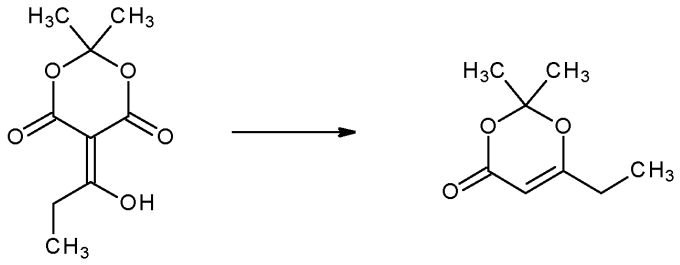


[0494]

[0495] 0℃에서 디클로로메탄(100 mL) 중 2,2-디메틸-1,3-디옥산-4,6-디온(10.0 g, 69.4 mmol)의 교반된 용액에 피리딘(11.2 mL, 139 mmol) 및 프로파노일 클로라이드(6.42 g, 69.4 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 0℃에서 1시간 동안 교반한 다음, 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 얼음물 위에 붓고, 2 M 수성 염화수소 용액의 첨가에 의해 산성화하고, 디클로로메탄(x2)으로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켜 5-(1-하이드록시프로필리덴)-2,2-디메틸-1,3-디옥산-4,6-디온을 황색 고체로서 제공하였다.

[0496] 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 15.4 (brs, 1H), 3.11 (q, 2H), 1.74 (s, 6H), 1.26 (t, 3H)

[0497] **단계 2: 6-에틸-2,2-디메틸-1,3-디옥신-4-온의 합성**

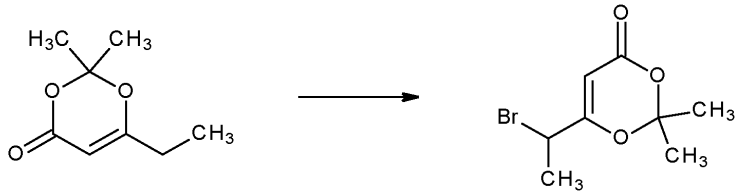


[0498]

[0499] 실온에서 톨루엔(10 mL) 중 5-(1-하이드록시프로필리덴)-2,2-디메틸-1,3-디옥산-4,6-디온(1.0 g, 5.0 mmol)의 교반된 용액에 아세톤(0.145 g, 2.5 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 120℃에서 1시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 얼음 위에 붓고, 에틸 아세테이트(x2)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 헥산 중 0%에서 50%의 에틸 아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 6-에틸-2,2-디메틸-1,3-디옥신-4-온을 무색 액체로서 제공하였다.

[0500] 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 5.22 (s, 1H), 2.25 (q, 2H), 1.68 (s, 6H), 1.13 (t, 3H)

[0501] **단계 3: 6-(1-브로모에틸)-2,2-디메틸-1,3-디옥신-4-온의 합성**



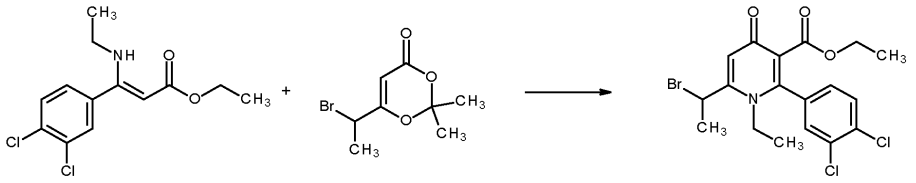
[0502]

[0503] 디클로로메탄(20 mL) 중 6-에틸-2,2-디메틸-1,3-디옥신-4-온(2.0 g, 11.5 mmol)의 교반된 용액에 1-브로모피롤리딘-2,5-디온(2.26 g, 12.7 mmol) 및 2-[(E)-(1-시아노-1-메틸-에틸)아조]-2-메틸-프로판니트릴(0.189 g, 1.15 mmol)을 실온에서 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반하면서 Penn 반응기(λ = 420 nm)에서 조사하였다. 반응 혼합물을 디클로로메탄을 이용하여 희석하고, 티오황산나트륨 포화 수용액을 첨가하였다. 상을 분리하고, 수성 상을 디클로로메탄(x2)으로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 헥산 중 0%에서 50%의 에틸

아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 6-(1-브로모에틸)-2,2-디메틸-1,3-디옥신-4-온을 무색 액체로서 제공하였다.

[0504] 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 5.48 (s, 1H), 4.49 (q, 1H), 1.84 (d, 3H), 1.72 (d, 6H).

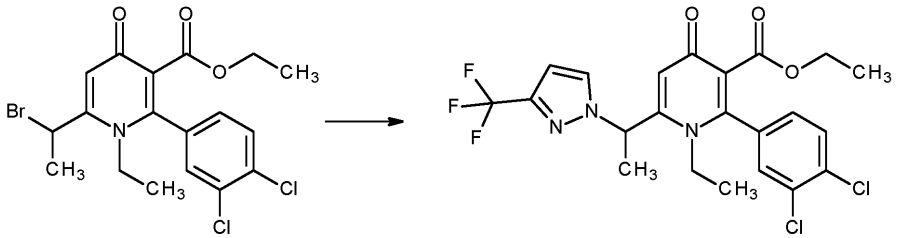
[0505] **단계 4: 에틸 6-(1-브로모에틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0506] 

[0507] 자일렌(40 mL) 중 에틸 (Z)-3-(3,4-디클로로페닐)-3-(에틸아미노)프로프-2-에노에이트(4.0 g, 14 mmol) 및 6-(1-브로모에틸)-2,2-디메틸-1,3-디옥신-4-온(4.9 g, 21 mmol)의 교반된 용액을 120℃에서 0.5시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 감압 하에 증발 건조시키고, 잔류물을 메틸 tert-부틸 에테르를 이용하여 세정하여, 에틸 6-(1-브로모에틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 담황색 고체로서 제공하였다.

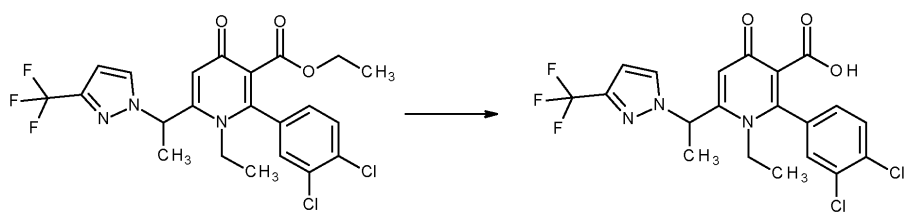
[0508] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.94 (d, 0.5H) 7.85 (d, 0.5H), 7.82 (d, 1H), 7.55 - 7.47 (m, 1H), 6.90 (d, 1H), 5.61 - 5.54 (m, 1H), 3.99 - 3.82 (m, 4H), 2.03 (q, 3H), 1.13 (t, 3H), 0.83 (t, 3H)

[0509] **단계 5: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[1-[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]에틸]피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0510] 

[0511] N,N-디메틸포름아미드(10 mL) 중 에틸 6-(1-브로모에틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(100 mg, 0.223 mmol)의 교반된 용액에 3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸(28 mg, 0.27 mmol) 및 탄산칼륨(93 mg, 0.67 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 6시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 물(50 mL)을 이용하여 희석하고, 에틸 아세테이트(x2)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 헥산 중 10%에서 50%의 에틸 아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-(1-(3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일)에틸)-1,4-디하이드로피리딘-3-카복실레이트를 백색 고체로서 제공하였다.

[0512] **단계 6: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[1-[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]에틸]피리딘-3-카복실산의 합성**

[0513] 

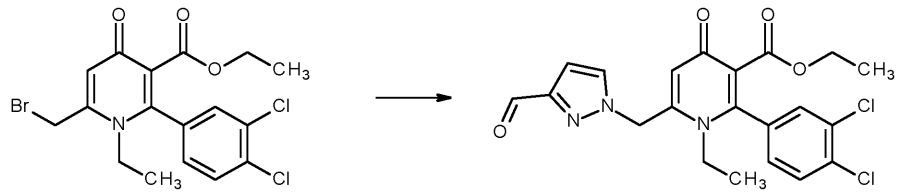
[0514] 실온에서 테트라하이드로푸란(8 mL)과 물(2 mL)의 혼합물 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[1-[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]에틸]피리딘-3-카복실레이트(180 mg, 0.358 mmol)의 교반된 용액에 수산화리튬 수화물(30 mg, 0.72 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 80℃에서 6시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 2 M 수성 염화수소 용액의 첨가에 의해 산성화하고, 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유

기 추출물을 감압 하에 증발 건조시키고, 미정제 잔류물을 용리액으로서 물(+0.1% 포름산) 중 0%에서 100%의 아세토니트릴(+0.1% 포름산)의 구배를 사용하는 역상 C-18 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[1-[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]에틸]피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0515] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.38 (s, 1H), 7.87 - 7.75 (m, 2H), 7.52 - 7.44 (m, 1H), 6.93 (s, 1H), 6.63 (s, 0.5H), 6.54 (s, 0.5H), 6.18 - 6.13 (m, 1H), 4.00 - 3.85 (m, 2H), 1.93 (d, 3H), 1.14 (t, 3H)

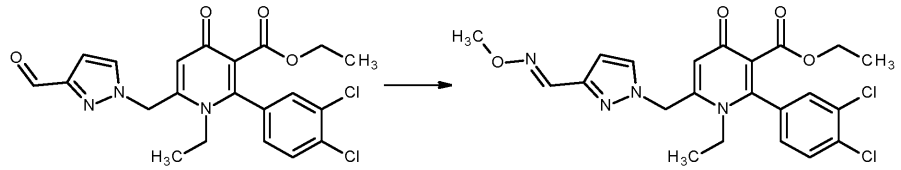
[0516] **실시예 21: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-[(E)-메톡시이미노메틸]피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산(화합물 204)의 합성**

[0517] **단계 1: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-포르밀피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0518] 

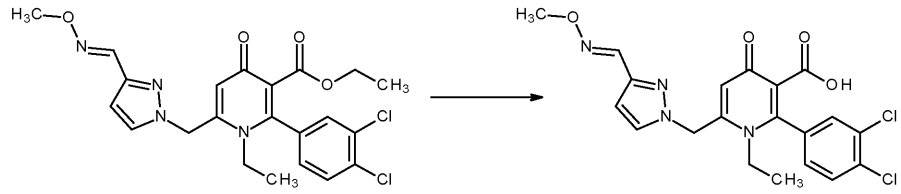
[0519] 실온에서 아세토니트릴(15 mL) 중 에틸 6-(브로모메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(380 mg, 0.83 mmol)의 교반된 용액에 1H-피라졸-3-카브알데하이드(88 mg, 0.92 mmol) 및 탄산칼륨(230 mg, 1.67 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 24시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 물을 이용하여 희석하고, 에틸 아세테이트(2x)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켜 미정제 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-포르밀피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 제공하였고, 이를 임의의 정제 없이 후속 단계에 사용하였다.

[0520] **단계 2: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-[(E)-메톡시이미노메틸]피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

[0521] 

[0522] 0℃에서 메탄올(5 mL)과 물(1.5 mL)의 혼합물 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-포르밀피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(140 mg, 0.312 mmol)의 교반된 용액에 아세트산나트륨(0.038 g, 0.47 mmol) 및 O-메틸하이드록실아민;하이드로클로라이드(0.052 g, 0.63 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 5분 동안 교반한 다음, 80℃에서 6시간 동안 교반하면서 가열하였다. 반응 혼합물을 물의 첨가에 의해 켄칭하고, 에틸 아세테이트(x3)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 물 및 브라인을 이용하여 순차적으로 세정하고, 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 헥산 중 0%에서 50%의 에틸 아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-[(E)-메톡시이미노메틸]피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 무색 액체로서 제공하였다.

[0523] **단계 3: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-[(E)-메톡시이미노메틸]피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산의 합성**

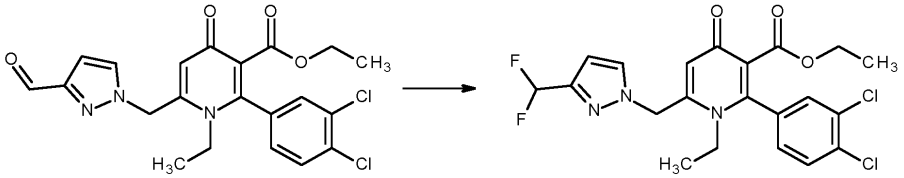
[0524] 

[0525] 실온에서 테트라하이드로푸란(8 mL)과 물(2 mL)의 혼합물 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-[(E)-메톡시이미노메틸]피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(110 mg, 0.22 mmol)의 교반된 용액에 수산화리튬(28 mg, 0.66 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 80℃에서 16시간 동안 교반하면서 가열하였다. 반응 혼합물을 1 M 수성 염화수소 용액을 이용하여 희석하고, 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 물 및 브라인을 이용하여 순차적으로 세정하고, 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 물을 사용하는 역상 C-18 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-[(E)-메톡시이미노메틸]피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0526] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.16 (s, 1H), 8.03 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.00 (s, 1H), 5.71 (s, 2H), 3.91 - 3.88 (m, 2H), 3.88 (s, 3H), 1.03 (t, 3H)

[0527] **실시예 22: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(2,2,2-트리플루오로에톡시)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산(화합물 186)의 합성**

[0528] **단계 1: 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[3-(디플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트의 합성**

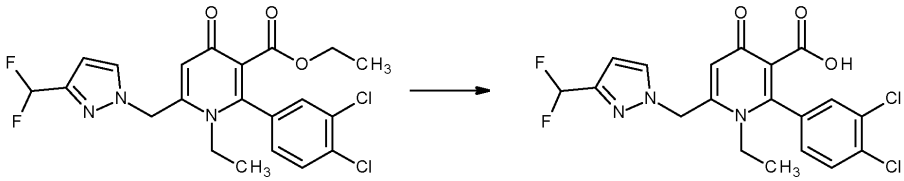


[0529]

[0530] -20℃에서 디클로로메탄(15 mL) 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-포르밀피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(250 mg, 0.50 mmol)의 교반된 용액에 N-에틸-N-(트리플루오로-λ^4-설파닐)에탄아민(0.20 mL, 1.51 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 5시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 물을 이용하여 희석하고, 디클로로메탄(3x)으로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 무수 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 증발 건조시켰다. 미정제 잔류물을 용리액으로서 헥산 중 10%에서 100%의 에틸 아세테이트의 구배를 사용하는 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[3-(디플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트를 담황색 고체로서 제공하였다.

[0531] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.09 (s, 1H), 7.84 - 7.79 (m, 2H), 7.48 (d, 1H), 7.18 - 6.91 (s, 1H), 6.77 (s, 1H), 5.67 (s, 1H), 5.60 (s, 2H), 3.86 - 3.76 (m, 4H), 0.97 (t, 3H), 0.82 (t, 3H).

[0532] **단계 2: 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(2,2,2-트리플루오로에톡시)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산의 합성**



[0533]

[0534] 실온에서 테트라하이드로푸란(5 mL)과 물(2 mL)의 혼합물 중 에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[3-(디플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트(160 mg, 0.34 mmol)의 교반된 용액에 수산화리튬;수화물(29 mg, 0.68 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 80℃에서 16시간 동안 교반하면서 가열하였다. 냉각된 반응 혼합물을 2 M 수성 염화수소 용액의 첨가에 의해 산성화하고, 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 감압 하에 증발 건조시키고, 미정제 잔류물을 용리액으로서 물(+0.1% 포름산) 중 0%에서 100%의 아세토니트릴(+0.1% 포름산)의 구배를 사용하는 역상 C-18 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피에 의해 정제하여 2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[3-(디플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산을 백색 고체로서 제공하였다.

[0535] 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.12 (d, 1H), 7.79 (t, 2H), 7.43 (dd, 1H), 7.19 - 6.92 (m, 1H), 6.71 (s, 1H), 5.99 (s, 1H), 5.75 (s, 2H), 3.91 - 3.86 (m, 2H), 1.03 (t, 3H)

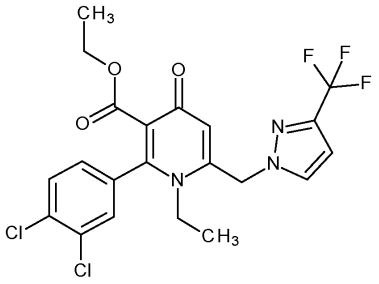
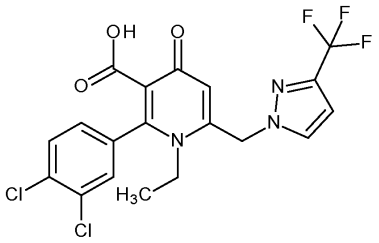
[0536] 이 설명 전반에 걸쳐, 온도는 섭씨온도(℃) 단위로 주어지며, "m.p."는 용융점을 의미한다. LC/MS는 액체 크로마토그래피 질량 분광법을 의미하며, 장치 및 방법에 관한 설명은 다음과 같다:

[0537] **방법 A:** 샘플 매니저(Sample Manager) FTN, H-등급 QSM, 컬럼 매니저(Column Manager), 2 x 컬럼 매니저 Aux, 광다이오드 어레이, ELSD 및 QDA SQD 2를 갖는 샘플 오거나이저(Sample Organizer)를 사용하는 Waters Aquity UPLC-MS로부터의 질량 분광기에서 스펙트럼을 기록하였다. SQD 질량 분광기-이온화 방법: 전기분무(ESI), 극성: 양이온, 모세관(kV) 3.00, 콘(V) 30.00, 추출기(V) 2.00, 공급원 온도(℃) 150, 탈용매화 온도(℃) 350, 콘 가스 흐름(L/시간) 0, 탈용매화 가스 흐름(L/시간) 650. Waters HSS T3 C18 컬럼(컬럼 길이 50 mm, 컬럼의 내부 직경 2.3 mm, 입자 크기 1.8 마이크론)이 장착된 기기. 3.3분에 걸쳐 0.6 ml/분으로 물 중 5%에서 100%의 MeCN의 구배 용리. MeCN 및 물 둘 모두는 0.05% v/v TFA를 함유함.

[0538] **방법 B:** 전기분무 공급원(극성: 양이온 및 음이온, 프로브 온도: 600℃, 콘: 15 V, 공급원 온도: 120℃, ESI 모세관: 0.8 kV, 질량 범위: 양극 130 Da 내지 700 Da, 음극 130 Da 내지 700 Da, 데이터: 중심) 및 2777 샘플 매니저, H-등급 BSM, 컬럼 매니저 UBM, 광다이오드 어레이 검출기 UPD 및 코로나 베오(Corona Veo) RS 하전된 에어로졸 검출기를 사용하는 Waters로부터의 Acquity UPLC가 장착된 Waters로부터의 질량 분광기(QDa 단일 사중극자 질량 분광기)에서 스펙트럼을 기록하였다. 컬럼: Phenomenex Kinetex 2.6 um C18 100Å 50 x 4.6 mm P.N. 00B-4462-E0. 온도: 40℃, DAD 파장 범위: 205 내지 310 nm, 용매 구배: 용매 A: 0.1% 포름산과 H_2O, 용매 B: 0.1% 포름산과 CH_3CN, 구배: 0분 30% B, 70% A; 1.2분 90% B, 10% A; 1.7분 90% B, 10% A; 1.8분 30% B, 70% A; 2.0분 30% B, 70% A. 유량 2.0 ml/분. 주입 부피 2 ul. 총 실행 시간 2.0분

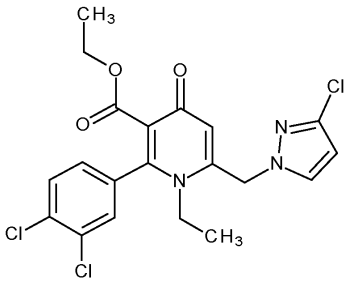
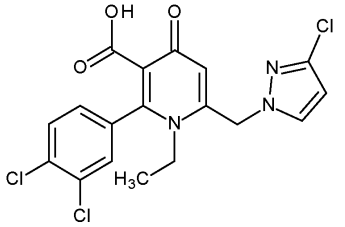
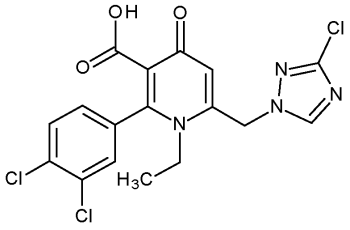
[0539] [표 2]

[0540] **본 발명에 따른 선택된 화합물에 대한 ^{1}H NMR 및 LC/MS.**

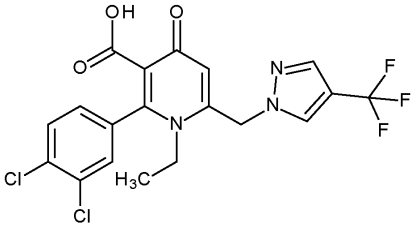
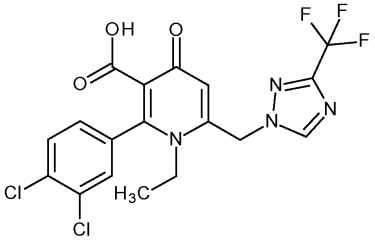
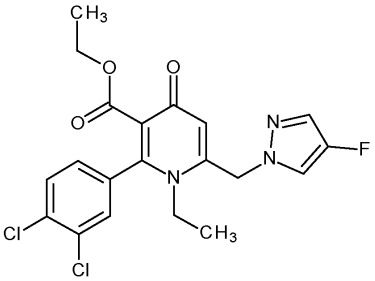
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
1	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.65 - 7.62 (m, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.26 - 7.23 (m, 1H), 6.65 (d, 1H), 6.34 (s, 1H), 5.35 (s, 2H), 4.09 - 3.97 (m, 2H), 3.87 (q, 2H), 1.04 - 0.95 (m, 6H)	
2	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.73 - 7.67 (m, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 6.67 (d, 1H), 6.23 (s, 1H), 5.47 (s, 2H), 4.04 - 3.90 (m, 2H), 1.24 - 1.17 (m, 3H)	

[0541]

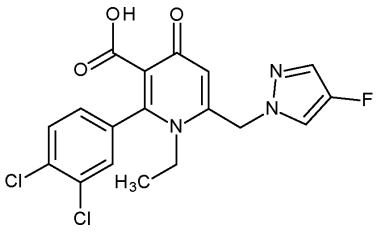
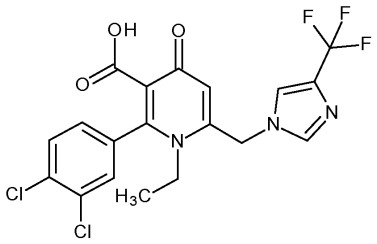
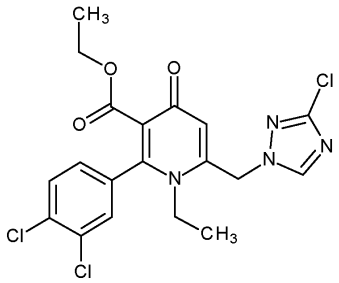
[0542]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
3	에틸 6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.59 (d, 1H), 7.52 (dd, 2H), 7.26 - 7.24 (m, 1H), 6.74 (s, 1H), 6.32 (d, 1H), 5.29 (s, 2H), 4.08 - 3.97 (m, 4H), 1.09 (t, 3H), 1.00 (t, 3H)	
4	6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.61 (d, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.39 (s, 1H), 6.35 (d, 1H), 5.34 (s, 2H), 3.97 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)	
5	6-[(3-클로로-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 메탄올) δ = 8.67 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.40 - 7.33 (m, 1H), 6.49 (s, 1H), 5.74 (s, 2H), 4.05 (q, 2H), 1.21 (t, 3H)	

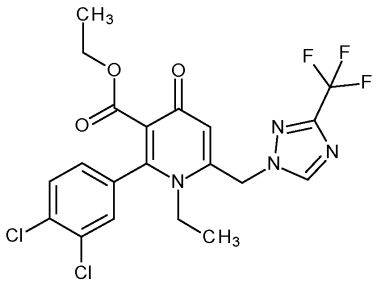
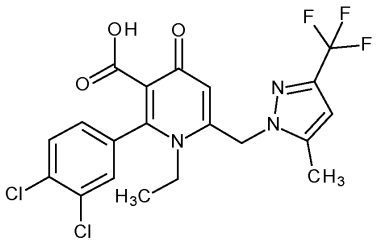
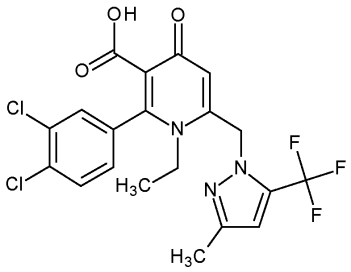
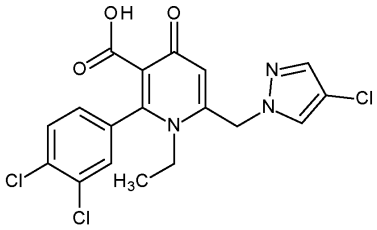
[0543]

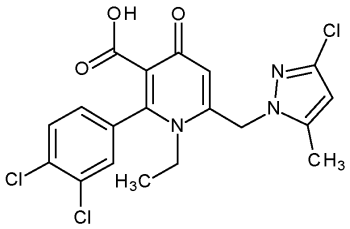
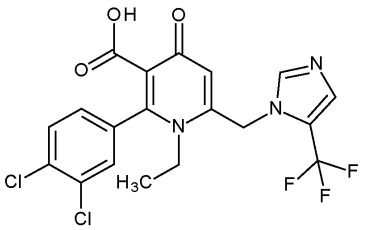
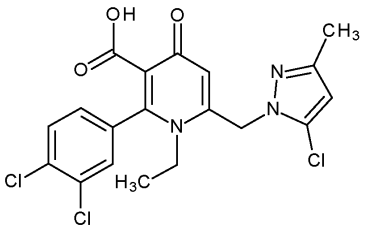
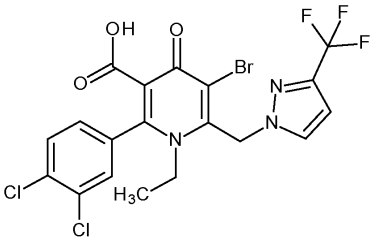
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
6	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[4-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산		
7	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)-1,2,4-트리아졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 9.11 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.44 (dd, 1H), 6.40 (s, 1H), 5.90 (s, 2H), 3.89 (q, 2H), 1.03 (t, 3H)	
8	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-플루오로피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.57 (d, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.45 - 7.38 (m, 2H), 7.25 (d, 1H), 6.37 (s, 1H), 5.20 (s, 2H), 4.03 (dd, 2H), 3.85 (brd, 2H), 1.04 - 0.96 (m, 6H)	

[0544]

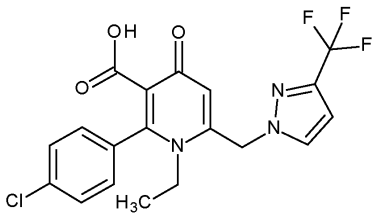
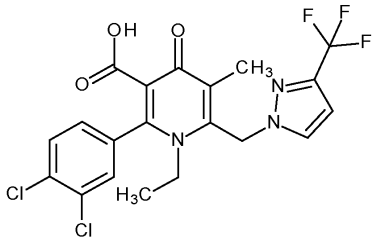
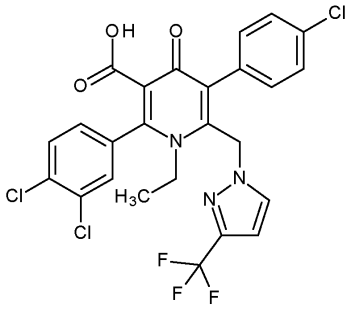
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
9	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-플루오로피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.13 (brd, 1H), 7.80 (brs, 1H), 7.78 (brs, 1H), 7.72 (brd, 1H), 7.44 (brd, 1H), 6.06 (s, 1H), 5.61 (s, 2H), 3.88 (brd, 2H), 1.05 (brt, 3H)	
10	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[4-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 메탄올) δ = 8.07 - 8.00 (m, 1H), 7.89 - 7.84 (m, 1H), 7.77 - 7.71 (m, 1H), 7.68 - 7.65 (m, 1H), 7.39 - 7.33 (m, 1H), 6.10 (s, 1H), 5.67 (s, 2H), 4.02 - 3.94 (m, 2H), 1.22 (t, 3H)	
11	에틸 6-[(3-클로로-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 8.29 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.31 (dd, 1H), 6.69 (s, 1H), 5.39 (s, 2H), 4.08 - 3.98 (m, 4H), 1.18 (t,3H), 0.99 (t, 3H)	

[0545]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
12	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)-1,2,4-트리아졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 8.55 (s, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.31 (dd, 1H), 6.31 (s, 1H), 5.47 (d, 2H), 4.08 - 3.96 (m, 2H), 3.92 (q, 2H), 1.14 (t, 3H), 0.98 (t, 3H)	
13a	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.27 분 (A); MS: m/z = 474.18 (M+1) 13b와의 혼합물
13b	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-메틸-5-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.27 분 (A); MS: m/z = 474.18 (M+1) 13a와의 혼합물
14	6-[(4-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		

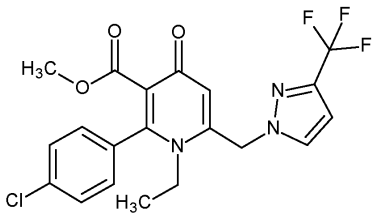
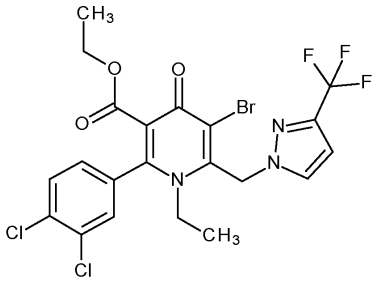
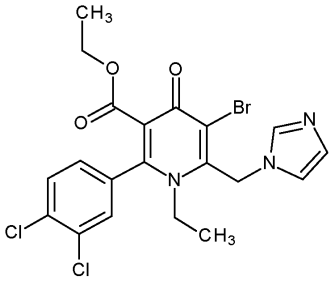
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.63 - 7.58 (m, 2H), 7.52 (s, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.17 (dd, 1H), 6.31 (s, 1H), 5.36 (s, 2H), 3.95 (q, 2H), 1.27 - 1.14 (m, 3H)	
15	6-[(3-클로로-5-메틸-피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 0.93 분 (B); MS: m/z = 442.19 (M+1) 17과의 혼합물
16	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[5-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.78 (s, 1H), 7.66 - 7.60 (m, 2H), 7.41 (d, 1H), 7.17 (dd, 1H), 5.99 (s, 1H), 5.37 (s, 2H), 3.84 (q, 2H), 1.33 - 1.17 (m, 3H)	
17	6-[(5-클로로-3-메틸-피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 0.93 분 (B); MS: m/z = 442.19 (M+1) 17과의 혼합물
18	5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산		

[0546]

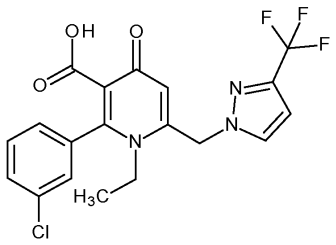
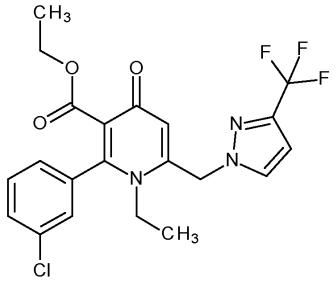
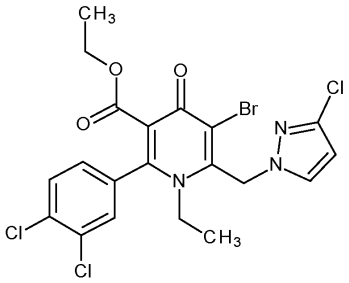
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.84 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.11 (dd, 1H), 6.64 (d, 1H), 5.86 (s, 2H), 4.44 (brs, 2H), 1.28 - 1.15 (m, 3H)	
19	2-(4-클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.71 (d, 1H), 7.51 - 7.45 (m, 2H), 7.26 - 7.20 (m, 2H), 6.63 (d,1H), 6.11 (s, 1H), 5.48 (s, 2H), 3.93 (q, 2H), 1.16 (t, 3H)	
20	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-메틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 메탄올) δ = 7.64 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.65 (d, 1H), 5.61 (s, 2H), 4.19 - 4.08 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.14 (t, 3H)	
21	5-(4-클로로페닐)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.61 (d, 1H), 7.48 (brd, 2H), 7.44 - 7.38 (m, 1H), 7.18 (dd, 1H), 7.12 (brd, 2H), 7.07 (d, 1H), 6.54 (d, 1H), 5.33 (s, 2H), 4.27 - 4.15 (m, 2H), 1.17 (t, 2H)	

[0547]

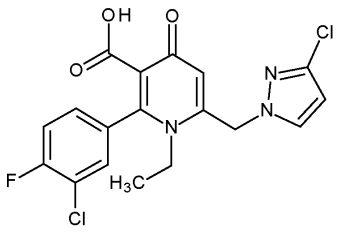
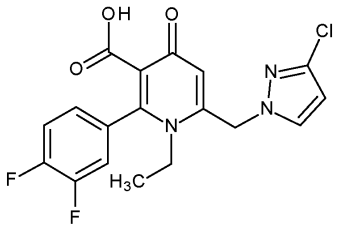
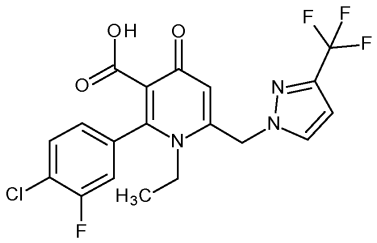
[0548]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
22	메틸 2-(4-클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름 + 2 방울 MeOD) δ = 7.76 (s, 1H), 7.48 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.36 - 7.30 (m, 2H), 6.65 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.40 (s, 1H), 5.45 (s, 2H), 3.95 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 3.51 (s, 3H), 1.02 (t, J = 7.1 Hz, 3H)	
23	에틸 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.80 (dd, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.50 (d,1H), 7.23 (dd, 1H), 6.64 - 6.61 (m, 1H), 5.81 (s, 2H), 4.23 (brd, 2H), 4.11 - 3.99 (m, 2H), 1.09 - 1.01 (m, 6H)	
24	에틸 5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-(이미다졸-1-일메틸)-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.71 - 7.60 (m, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.22 (dd, 1H), 7.19 (brd, 1H), 7.13 - 6.98 (m, 1H), 5.60 (s, 2H), 4.14 - 3.99 (m, 2H), 3.79 (q, 2H), 1.04 (t, 3H), 0.99 (t, 3H)	

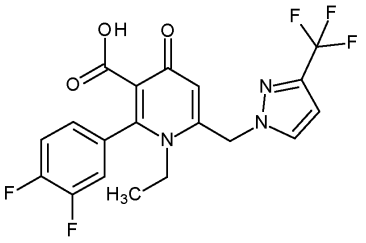
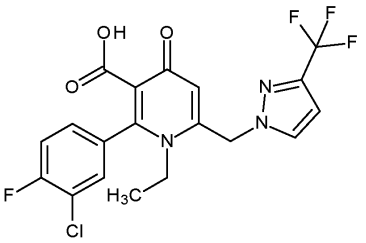
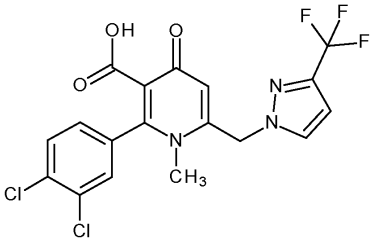
[0549]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
25	2-(3-클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.70 (d, 1H), 7.56 - 7.44 (m, 2H), 7.30 (t, 1H), 7.19 (d, 1H), 6.67 (d, 1H), 6.25 (s, 1H), 5.48 (s, 2H), 4.01 - 3.90 (m, 2H), 1.19 (t, 3H)	
26	에틸 2-(3-클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.59 (d, 1H), 7.51 - 7.46 (m, 1H), 7.45 - 7.37 (m, 2H), 7.28 (t, 1H), 6.66 (d, 1H), 6.42 (s, 1H), 5.34 (s, 2H), 4.00 (dq, 2H), 3.86 (q, 2H), 1.00 (t, 3H), 0.93 (t, 3H)	
27	에틸 5-브로모-6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.66 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.60 - 7.56 (m, 1H), 7.51 - 7.50 (m, 1H), 7.25 - 7.23 (m, 1H), 6.30 - 6.25 (m, 1H), 5.68 (s, 2H), 4.24 (q, J = 6.9	

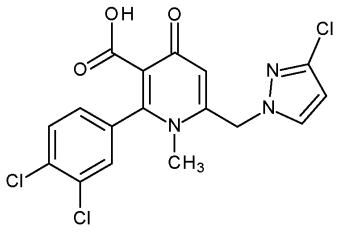
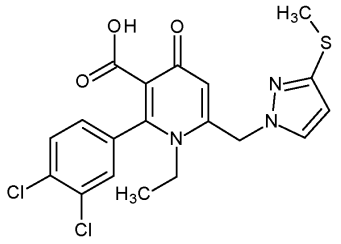
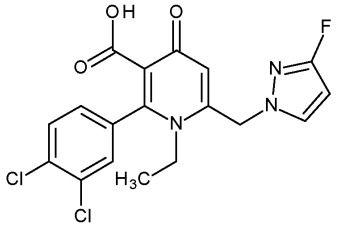
[0550]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		Hz, 2H), 4.12 - 3.99 (m, 2H), 1.10 (t, J = 7.1 Hz, 3H), 1.07 - 1.01 (m, 3H)	
28	2-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.06 (d, 1H), 7.77 - 7.75 (dd, 1H), 7.58 - 7.54 (t, 1H), 7.47 - 7.43 (m, 1H), 6.52 (d, 1H), 6.08 (s, 1H), 5.65 (s, 2H) 3.90-3.85 (q, 2H) 1.03 (t, 3H)	
29	6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디플루오로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.05 (d, 1H), 7.67 - 7.54 (m, 2H), 7.28 - 7.27 (m, 1H), 6.52 (d, 1H), 6.08 (s, 1H), 5.65 (s, 2H), 3.91 - 3.86 (m, 2H), 1.04 (t, 3H)	
30	2-(4-클로로-3-플루오로-페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.24 (s, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 6.92 (s, 1H), 5.99 (s, 1H), 5.85 (s, 2H), 3.89 (s, 2H), 1.13 (t, 3H)	

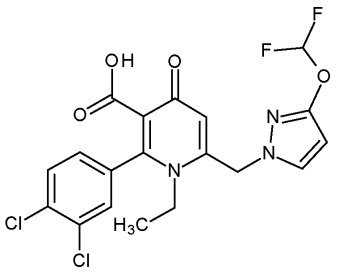
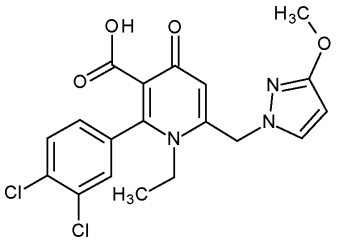
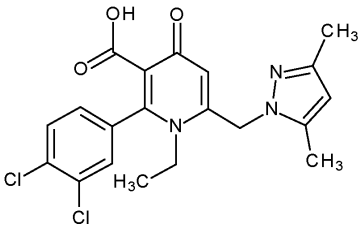
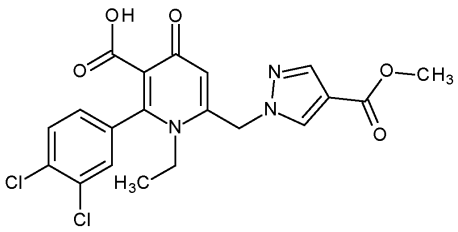
[0551]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
31	2-(3,4-디플루오로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.24 (d, 1H), 7.66 - 7.55 (m, 2H), 7.29 - 7.27 (m, 1H), 6.94 (d, 1H), 5.98 (s, 1H), 5.82 (s, 2H), 3.91 - 3.86 (m, 2H), 1.03 (t, 3H)	
32	2-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.24 - 8.23 (m, 1H), 7.76 - 7.74 (m, 1H), 7.62 - 7.52 (m, 1H), 7.52 - 7.43 (m, 1H), 6.92 (d, 1H), 5.99 (s, 1H), 5.82 (s, 2H), 3.89 - 3.87 (m, 2H), 1.02 (t, 3H)	
33	2-(3,4-디클로로페닐)-1-메틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.68 - 7.64 (m, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.08 (dd, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.29 (s, 1H), 5.44 (s, 2H), 3.41 (s, 3H)	

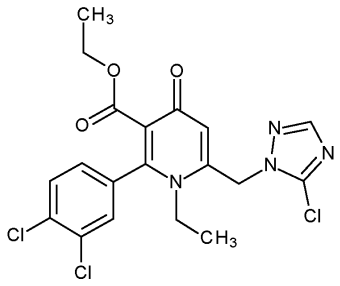
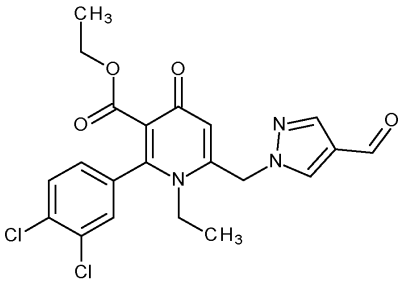
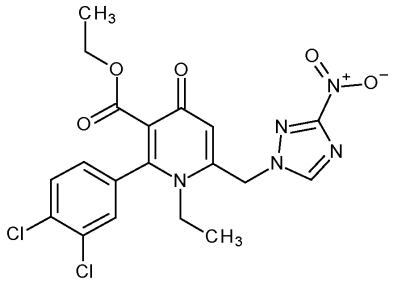
[0552]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
34	6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.61 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.09 (dd, 1H), 6.33 (d, 1H), 6.29 (s, 1H), 5.32 (s, 2H), 3.40 (s, 3H)	
35	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-메틸설파닐피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.81 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 5.86 (d, 1H), 5.82 (s, 1H), 5.39 (s, 2H), 3.92 (s, 3H), 3.89 (q, 2H), 1.07 (t, 3H)	
36	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-플루오로피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 - 7.77 (m, 2H), 7.65 - 7.60 (m, 1H), 7.47 - 7.42 (m, 1H), 6.18 (dd, 1H), 5.96 (s, 1H), 5.62 (s, 2H), 3.95 - 3.85 (m, 2H), 1.07 (t,3H)	

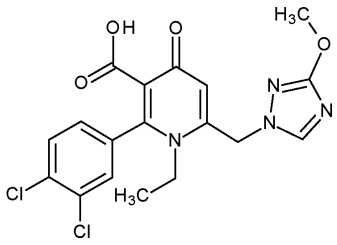
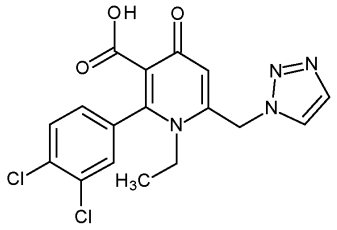
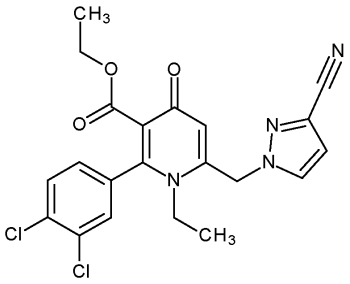
[0553]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
37	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[3-(디플루오로메톡시)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 - 7.77 (m, 2H), 7.64 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.35 (s, 1H), 6.22 - 6.19 (m, 1H), 5.86 (s, 1H), 5.54 (s, 2H), 3.89 (q, 2H), 1.07 (t, 3H)	
38	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-메톡시피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 1.90 분 (A); MS: m/z = 422.14 (M+1)
39	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[(3,5-디메틸피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 1.94 분 (A); MS: m/z = 420.18 (M+1)
40	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-메톡시카보닐피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.66 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.86 - 7.73 (m, 2H), 7.44 (dd, 1H), 6.18 (s, 1H), 5.73 (s, 2H), 3.94 - 3.89 (m, 2H), 3.78 (s, 3H), 1.05 (t, 3H)	

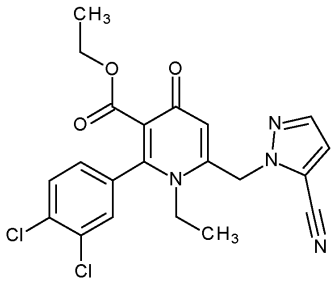
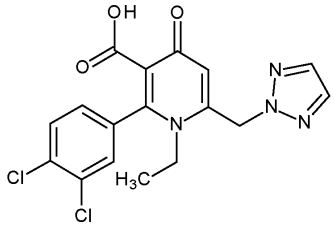
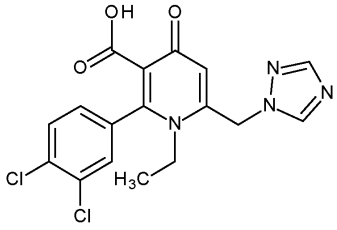
[0554]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
41	에틸 6-[(5-클로로-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.95 (s, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.28 - 7.26 (m, 1H), 6.33 (s, 1H), 5.32 (s, 2H), 4.08 - 3.93 (m, 4H), 1.17 (t, 3H), 0.98 (t, 3H)	
42	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-포르밀피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 9.92 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.27 - 7.25 (m, 1H), 6.39 (s, 1H), 5.37 (s, 2H), 4.09 - 4.00 (m, 2H), 3.90 (q, 2H), 1.09 (t, 3H), 1.00 (t, 3H)	
43	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-니트로-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 9.10 (s, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.49 (dd, 1H), 6.17 (s, 1H), 5.78 (s, 2H), 3.91 - 3.76 (m, 4H), 1.03 (t, 3H), 0.82 (t, 3H)	

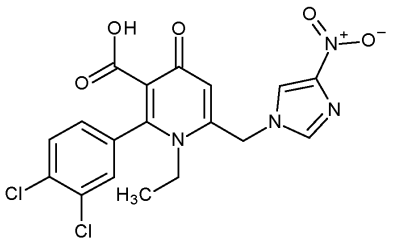
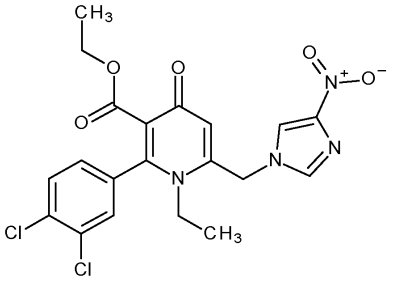
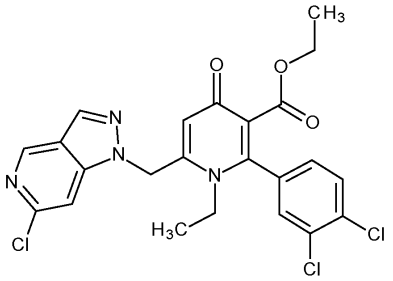
[0555]

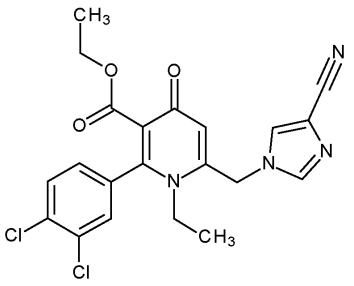
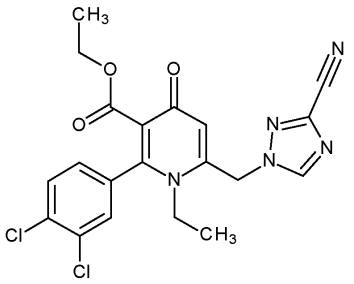
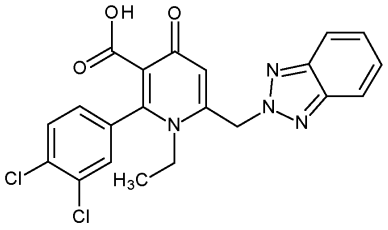
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
44	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-메톡시-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.48 (s, 1H), 7.84 - 7.80 (m, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.44 (dd, 1H), 6.27 (s, 1H), 5.62 (s, 2H), 3.92 - 3.86 (m, 5H), 1.07 (t, 3H)	
45	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-(트리아졸-1-일메틸)피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.13 (brd, 1H), 7.80 (brs, 1H), 7.78 (brs, 1H), 7.72 (brd, 1H), 7.44 (brd, 1H), 6.06 (s, 1H), 5.61 (s, 2H), 3.88 (brd, 2H), 1.05 (brt, 3H)	
46	에틸 6-[(3-시아노피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.76 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.31 - 7.25 (m, 1H), 6.79 (d, 1H), 6.28 (s, 1H), 5.39 (s, 2H), 4.07 - 3.95 (m, 2H) 3.95 - 3.85 (m, 2H), 1.07 (t, 3H), 0.98 (t, 3H)	

[0556]

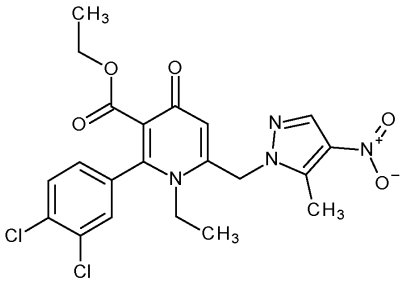
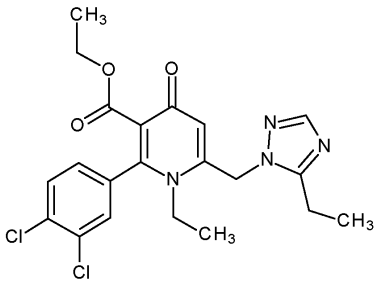
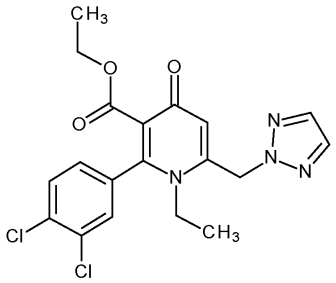
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
47	에틸 6-[(5-시아노피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.74 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.32 - 7.29 (m, 1H), 6.96 (d, 1H), 6.06 (s, 1H), 5.50 (s, 2H), 4.05 (dd, 2H), 3.93 (d, 2H), 1.22 (t, 3H), 0.99 (t, 3H)	
48	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-(트리아졸-2-일메틸)피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.13 (brd, 1H), 7.80 (brs, 1H), 7.78 (brs, 1H), 7.72 (brd, 1H), 7.44 (brd, 1H), 6.06 (s, 1H), 5.61 (s, 2H), 3.88 (brd, 2H), 1.05 (brt, 3H)	
49	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-(1,2,4-트리아졸-1-일메틸)피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.80 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.44 (dd, 1H), 6.20 (s, 1H), 5.79 (s, 2H), 3.92 (brd, 2H), 1.06 (t, 3H)	

[0557]

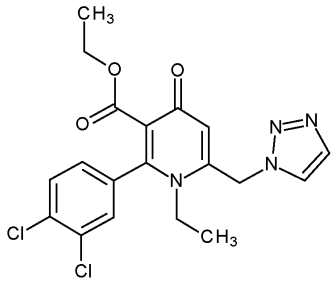
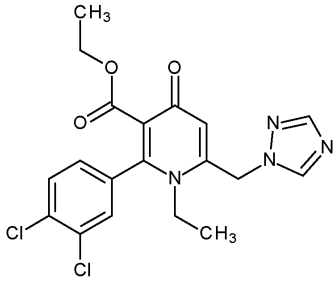
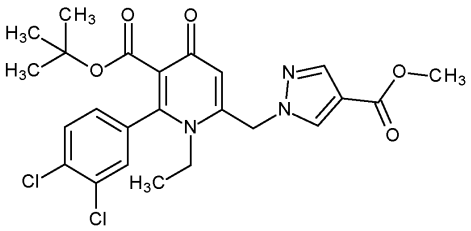
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
50	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-니트로이미다졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.57 - 8.53 (m, 1H), 8.08 - 8.04 (m, 1H), 7.82 - 7.79 (m, 2H), 7.47 - 7.42 (m, 1H), 6.36 - 6.33 (m, 1H), 5.67 - 5.64 (m, 2H), 3.88 - 3.82 (m, 2H), 1.10 - 1.06 (m, 3H)	
51	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-니트로이미다졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.34 - 8.21 (m, 1H), 8.16 - 8.07 (m, 1H), 7.89 - 7.80 (m, 2H), 7.53 - 7.44 (m, 1H), 5.79 - 5.70 (m, 1H), 5.55 - 5.44 (m, 2H), 3.94 - 3.82 (m, 2H), 3.78 - 3.67 (m, 2H), 1.05 - 0.95 (m, 3H), 0.85 - 0.77 (m, 3H)	
52	에틸 6-[(6-클로로피라졸로[4,3-c]피리딘-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 9.04 (s, 1H), 8.56 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.79 - 7.79 (m, 2H), 7.49 (d, 1H), 5.88	

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		(brs, 2H), 5.41 (s, 1H), 3.96 - 3.87 (m, 4H), 1.08 (t, 3H), 0.80 (t, 3H)	
53	에틸 6-[(4-시아노이미다졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.34 - 8.21 (m, 1H), 8.16 - 8.07 (m, 1H), 7.89 - 7.80 (m, 2H), 7.53 - 7.44 (m, 1H), 5.79 - 5.70 (m, 1H), 5.55 - 5.44 (m, 2H), 3.94 - 3.82 (m, 2H), 3.78 - 3.67 (m, 2H), 1.05 - 0.95 (m, 3H), 0.85 - 0.77 (m, 3H)	
54	에틸 6-[(3-시아노-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 9.19 - 9.12 (m, 1H), 7.90 - 7.79 (m, 2H), 7.51 - 7.43 (m, 1H), 6.13 - 6.07 (m, 1H), 5.79 - 5.70 (m, 2H), 3.91 - 3.73 (m, 4H), 1.04 - 0.96 (m, 3H), 0.86 - 0.78 (m, 3H)	
55	6-(벤조트리아졸-2-일메틸)-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		

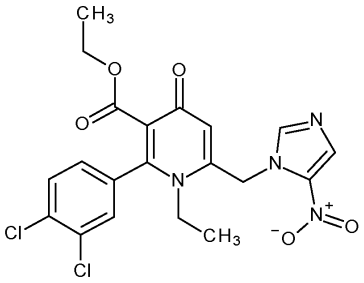
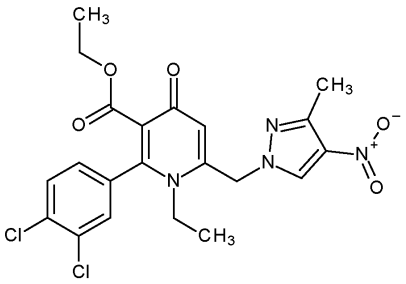
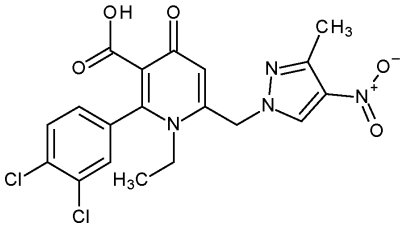
[0558]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ =8.03 - 7.97 (m, 2H), 7.81 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.55 - 7.48 (m, 2H), 7.44 (dd, 1H), 6.50 (s, 1H), 6.34 (s, 2H), 3.96 (q, 2H), 0.96 (t, 3H)	
56	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(5-메틸-4-니트로-피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.42 (s, 1H), 7.86 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.49 (dd, 1H), 5.63 (s, 2H), 5.47 (s, 1H), 3.96 - 3.73 (m, 4H), 2.65 (s, 3H), 1.09 (t, 3H), 0.81 (t, 3H)	
57	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(5-에틸-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 메탄올) δ = 8.02 (s, 1H), 7.77 - 7.70 (m, 2H), 7.47 (dd, 1H), 5.79 (s, 1H), 5.62 (s, 2H), 4.05 - 3.87 (m, 4H), 2.88 (q, 2H), 1.36 (t, 3H), 1.18 (t, 3H), 0.94 (t, 3H)	
58	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-(트리아졸-2-일메틸)피리딘-3-카복실레이트		

[0559]

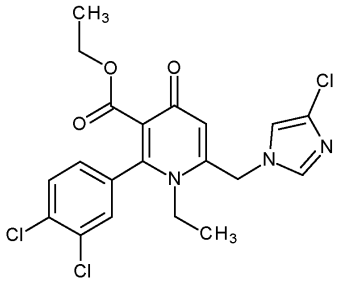
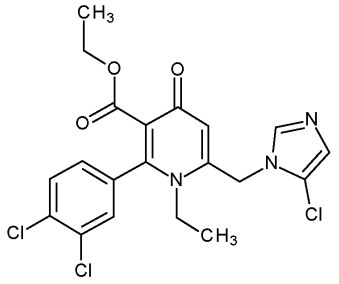
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.73 (s, 2H), 7.58 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.26 (dd, 1H), 6.45 (s, 1H), 5.60 (s, 2H), 4.09 - 3.99 (m, 2H), 3.92 (q, 2H), 1.09 (t, 3H), 1.00 (t, 3H)	
59	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-(트리아졸-1-일메틸)피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ =7.83 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.22 (dd, 1H), 6.55 (s, 1H), 5.57 (s, 2H), 4.12 - 3.96 (m, 2H), 3.95 - 3.85 (m, 2H), 1.07 - 0.98 (m, 6H)	
60	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-(1,2,4-트리아졸-1-일메틸)피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.78 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.86 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.48 (dd, 1H), 5.81 (s, 1H), 5.64 (s, 2H), 3.92 - 3.76 (m, 4H), 1.00 (t, 3H), 0.82 (t, 3H)	
61	tert-부틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-메톡시카보닐피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 8.16 - 8.12 (m, 1H), 7.99 - 7.97 (m, 1H), 7.64 - 7.59 (m, 1H), 7.58 - 7.55 (m,	

[0560]

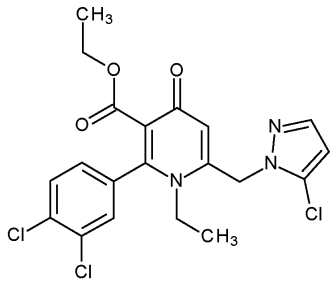
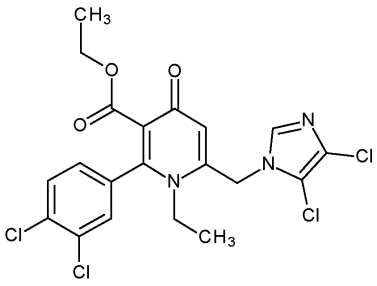
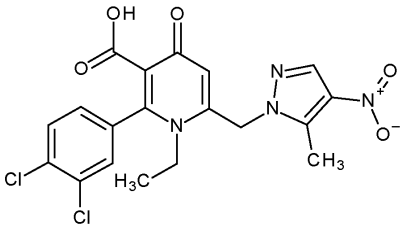
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		1H), 7.33 - 7.29 (m, 1H), 6.85 - 6.44 (m, 1H), 5.56 - 5.27 (m, 2H), 4.01 - 3.93 (m, 2H), 3.89 - 3.86 (m, 3H), 1.26 - 1.20 (m, 9H), 1.14 - 1.05 (m, 3H)	
62	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(5-니트로이미다졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 8.17 (brs, 1H), 7.91 (brs, 1H), 7.65 - 7.57 (m, 2H), 7.33 (dd, 1H), 5.65 (s, 1H), 5.60 (s, 2H), 3.88 - 3.78 (m, 2H), 4.10 - 3.99 (m, 2H), 1.30 (t, 3H), 1.01 (t, 3H)	
63	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-메틸-4-니트로-피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 9.06 - 8.96 (m, 1H), 7.86 - 7.77 (m, 2H), 7.52 - 7.43 (m, 1H), 6.04 - 5.99 (m, 1H), 5.59 - 5.51 (m, 2H), 3.92 - 3.81 (m, 4H), 2.48 - 2.45 (m, 3H), 1.06 - 0.97 (m, 3H), 0.83 - 0.77 (m, 3H)	
64	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-메틸-4-니트로-피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산		

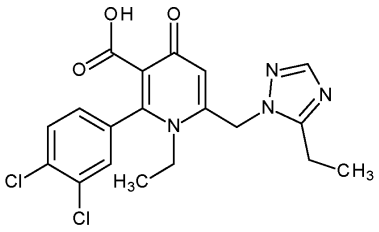
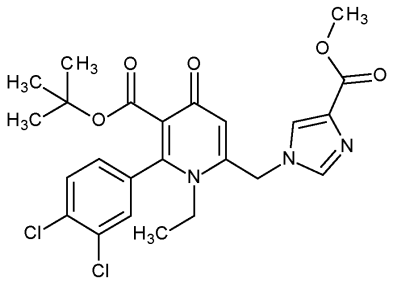
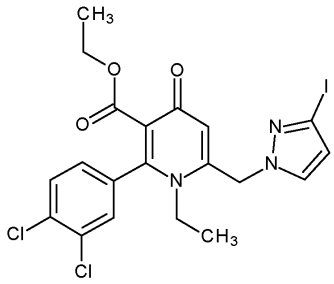
[0561]

[0562]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 9.06 - 8.96 (m, 1H), 7.86 - 7.77 (m, 2H), 7.52 - 7.43 (m, 1H), 6.04 - 5.99 (m, 1H), 5.59 - 5.51 (m, 2H), 3.92 - 3.81 (m, 4H), 2.48 - 2.45 (m, 3H), 1.06 - 0.97 (m, 3H), 0.83 - 0.77 (m, 3H)	
65	에틸 6-[(4-클로로이미다졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.61 (d, 1H), 7.55 - 7.52 (m, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.28 - 7.25 (m, 1H), 6.91 (d, 1H), 6.37 (s, 1H), 5.08 (s, 2H), 4.06 (dd, 2H), 3.69 (d, 2H), 1.10 (t, 3H), 1.01 (t, 3H)	
66	에틸 6-[(5-클로로이미다졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.63 - 7.54 (m, 3H), 7.30 (s, 1H), 7.28 - 7.25 (m, 1H), 6.07 (s, 1H), 5.11 (s, 2H), 4.06 (dd, 2H), 3.74 (d, 2H), 1.19 (t, 3H), 1.01 (t, 3H)	

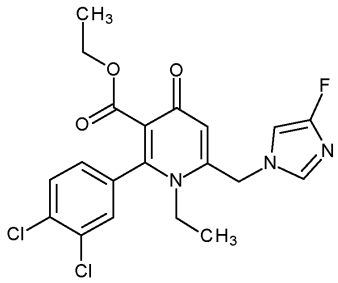
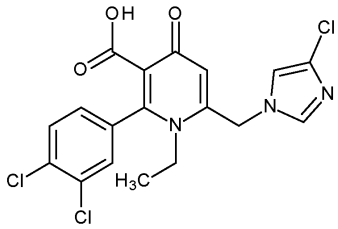
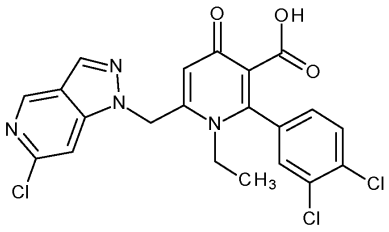
[0563]

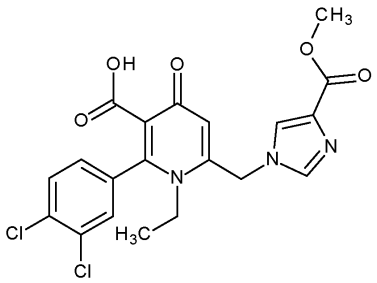
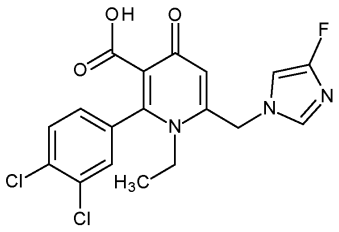
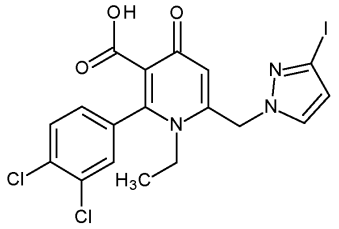
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
67	에틸 6-[(5-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.61 - 7.56 (m, 2H), 7.54 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 6.35 (d, 2H), 5.37 (s, 2H), 4.09 - 3.97 (m, 4H), 1.17 (t, 3H), 0.98 (t, 3H)	
68	에틸 6-[(4,5-디클로로이미다졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.68 - 7.54 (m, 2H), 7.52 - 7.44 (m, 1H), 7.37 - 7.27 (m, 1H), 5.81 (s, 1H), 5.18 (s, 2H), 4.05 - 3.92 (m, 2H), 3.77 (q, 2H), 1.19 (t, 3H), 0.96 (t, 3H)	
69	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(5-메틸-4-니트로-피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, 클로로포름) δ = 8.19 (s, 1H), 7.61 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.42 - 7.35 (m, 1H), 7.17 - 7.11 (m, 1H), 6.16 (s, 1H), 5.40 (s, 2H), 4.08 - 3.92 (m, 1H), 4.00 (br d, J = 7.2 Hz, 1H), 2.71 (s, 3H), 1.27 (t, J = 7.1 Hz, 3H)	

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
70	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(5-에틸-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, 클로로포름) δ = 7.91 (s, 1H), 7.61 (brd, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.29 (s, 1H), 5.36 (s, 2H), 4.03 (q, 2H), 2.79 (q, 2H), 1.42 (t, 3H), 1.30 - 1.17 (m, 3H)	
71	tert-부틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-메톡시카보닐이미다졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.69 - 7.67 (m, 1H), 7.66 - 7.63 (m, 1H), 7.62 - 7.59 (m, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.28 - 7.26 (m, 1H), 6.28 (s, 1H), 5.16 (s, 2H), 3.93 (s, 3H), 3.66 (q, 2H), 1.23 (s, 9H), 1.06 (t, 3H)	
72	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-아이오도피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.59 - 7.57 (m, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.25 - 7.23 (m, 1H), 6.55 (d, 1H), 6.40 (s, 1H), 5.30 (s, 2H), 4.08 - 3.98 (m, 2H), 3.86 (q, 2H), 1.06 - 0.97 (m, 6H)	

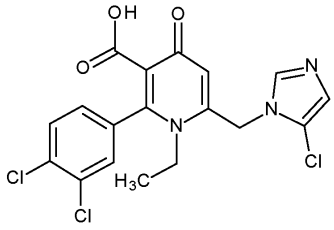
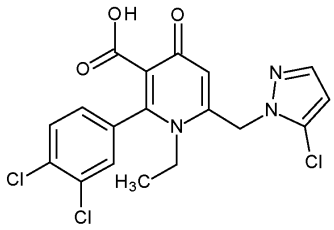
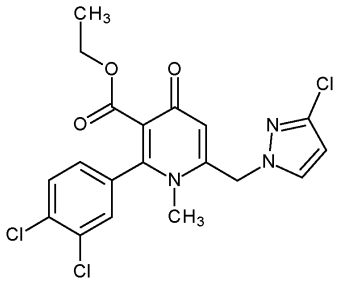
[0564]

[0565]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
73	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-플루오로이미다졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.59 (d, 1H), 7.53 - 7.50 (m, 1H), 7.25 - 7.22 (m, 1H), 7.20 (s, 1H), 6.52 (dd, 1H), 6.35 (s, 1H), 5.04 (s, 2H), 4.10 - 3.98 (m, 2H), 3.69 (q, 2H), 1.08 (t, 3H), 1.00 (t, 3H)	
74	6-[(4-클로로이미다졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.85 (d, 1H), 7.79 (dd, 2H), 7.45 - 7.40 (m, 2H), 6.08 (s, 1H), 5.56 (s, 2H), 3.83 (q, 2H), 1.05 (t, 3H)	
75	6-[(6-클로로피라졸로[4,3-c]피리딘-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 9.05 (d, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.87 - 7.72 (m, 2H), 7.45 (dd, 1H), 6.02 (s, 2H), 5.76 (s, 1H), 4.02 - 3.94 (m, 2H), 1.14 (t, 3H)	

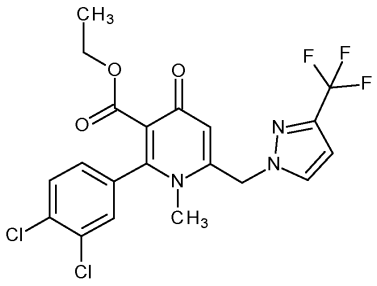
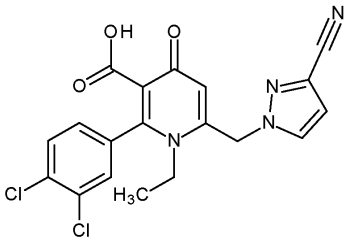
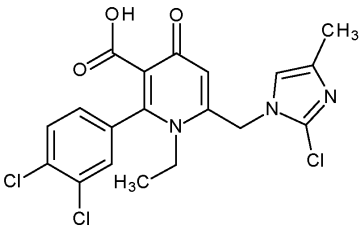
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
76	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-메톡시카보닐이미다졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.09 (s, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.82 - 7.76 (m, 2H), 7.42 (dd, 1H), 6.10 (s, 1H), 5.61 (s, 2H), 3.88 - 3.80 (m, 2H), 3.78 (s, 3H), 1.05 (t, 3H)	
77	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-플루오로이미다졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 - 7.73 (m, 2H), 7.58 (s, 1H), 7.42 (dd, 1H), 7.02 (dd, 1H), 6.09 (s, 1H), 5.51 (s, 2H), 3.83 (q, 2H), 1.05 (t, 3H)	
78	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-아이오도피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.91 (d, 1H), 7.83 - 7.75 (m, 2H), 7.43 (dd, 1H), 6.67 (d, 1H), 5.99 (s, 1H), 5.71 (s, 2H), 3.87 (q, 2H), 1.04 (t, 3H)	

[0566]

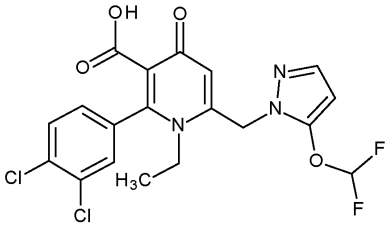
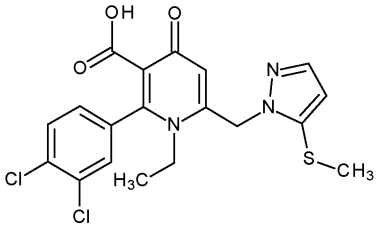
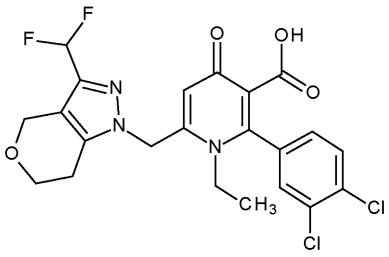
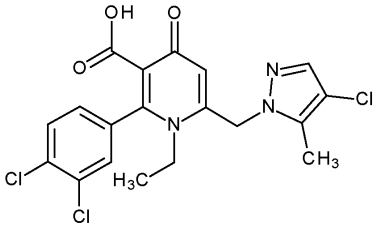
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
79	6-[(5-클로로이미다졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.63 (d, 2H), 7.39 (d, 1H), 7.19 - 7.11 (m, 2H), 6.11 (s, 1H), 5.23 (s, 2H), 3.87 (brd, 2H), 1.29 (brt, 3H)	
80	6-[(5-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.63 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.38 (d, 1H), 6.27 (s, 1H), 5.43 (s, 2H), 4.00 (q, 2H), 1.24 (t, 3H)	
81	에틸 6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-메틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.63 - 7.57 (m, 2H), 7.55 (d, 1H), 7.31 (dd, 1H), 6.35 (s, 1H), 6.29 (d, 1H), 5.34 (s, 2H), 4.03 (dq, 2H), 3.44 (s, 3H), 0.99 (t, 3H)	

[0567]

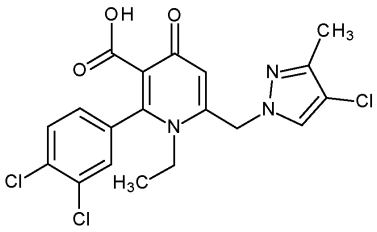
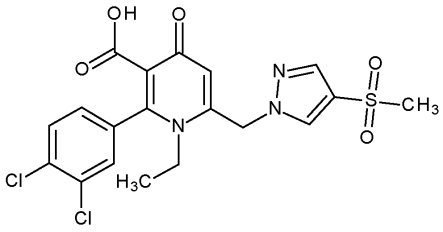
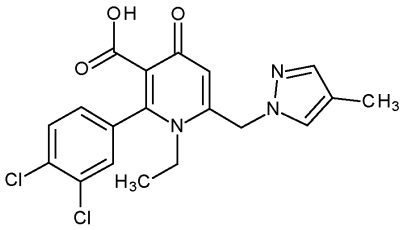
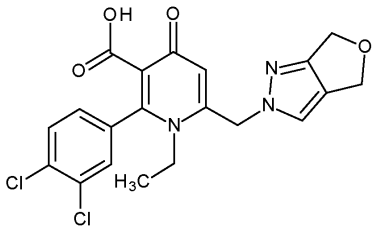
[0568]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
82	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-메틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.70 (s, 1H), 7.63 - 7.57 (m, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.26 - 7.24 (m, 1H), 6.64 (d, 1H), 6.44 (s, 1H), 5.43 (s, 2H), 4.04 (dq, 2H), 3.46 - 3.39 (m, 3H), 1.00 (t, 3H)	
83	6-[(3-시아노피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.76 - 7.66 (m, 1H), 7.62 (brd, 1H), 7.41 (brs, 1H), 7.19 - 7.12 (m, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.35 (brs, 1H), 5.72 - 5.00 (m, 2H), 4.06 - 3.93 (m, 2H), 1.21 (brm, 3H)	
84	6-[(2-클로로-4-메틸-이미다졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.16 (s, 1H), 5.73 (s, 1H), 5.45 (s, 2H), 3.86 (brq, 2H), 2.15 (s, 3H), 1.14 (t, 3H)	

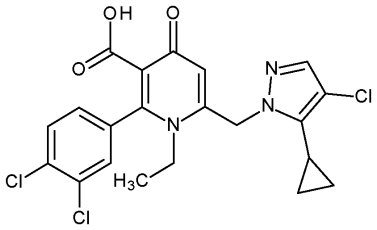
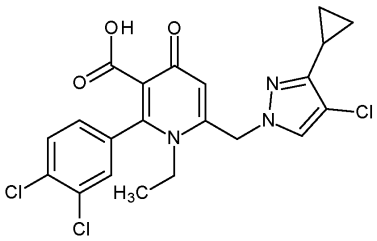
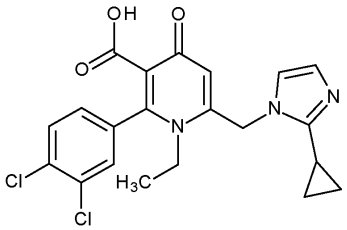
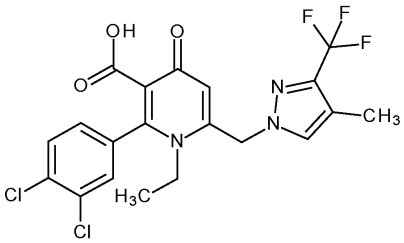
[0569]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
85	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[5-(디플루오로메톡시)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.03 분 (A); MS: m/z = 458.16 (M+1)
86	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(5-메틸설파닐피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.05 분 (A); MS: m/z = 438.12 (M+1)
87	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[3-(디플루오로메틸)-6,7-디하이드로-4H-피라노[4,3-c]피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.06 분 (A); MS: m/z = 498.15 (M+1)
88	6-[(4-클로로-5-메틸-피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.13 분 (A); MS: m/z = 440.14 (M+1)

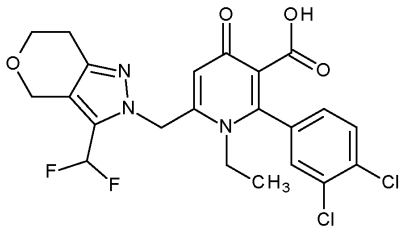
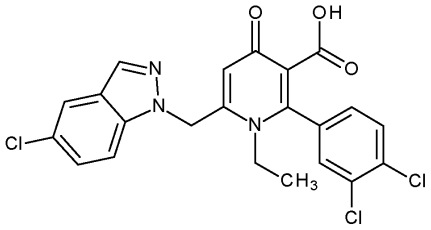
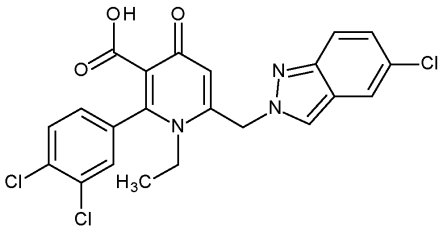
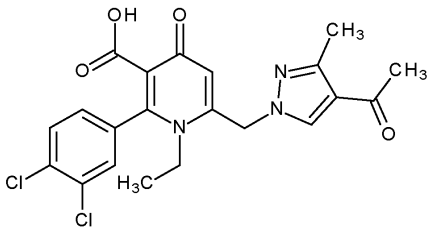
[0570]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
89	6-[(4-클로로-3-메틸-피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.16 분 (A); MS: m/z = 440.13 (M+1)
90	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-메틸설포닐피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 1.73 분 (A); MS: m/z = 470.14 (M+1)
91	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-메틸피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 1.94 분 (A); MS: m/z = 406.12 (M+1)
92	2-(3,4-디클로로페닐)-6-(4,6-디하이드로푸로[3,4-c]피라졸-2-일메틸)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 1.75 분 (A); MS: m/z = 434.19 (M+1)

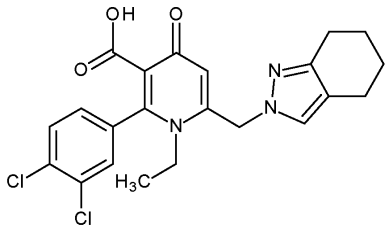
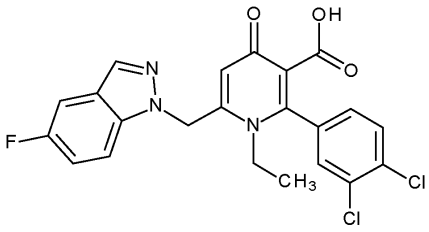
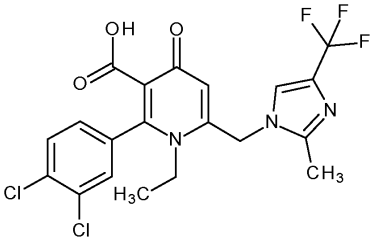
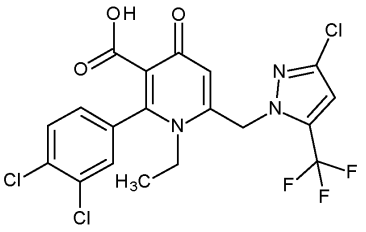
[0571]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
93	6-[(4-클로로-5-사이클로프로필-피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.30 분 (A); MS: m/z = 466.11 (M+1)
94	6-[(4-클로로-3-사이클로프로필-피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.36 분 (A); MS: m/z = 466.15 (M+1)
95	6-[(2-사이클로프로필이미다졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 1.46 분 (A); MS: m/z = 432.24 (M+1)
96	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[4-메틸-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.33 분 (A); MS: m/z = 474.20 (M+1)

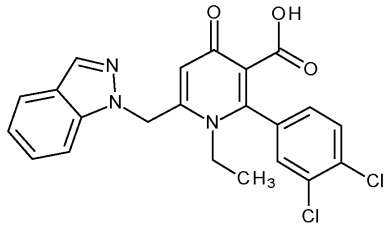
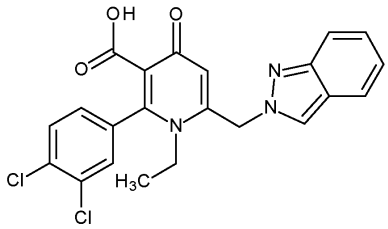
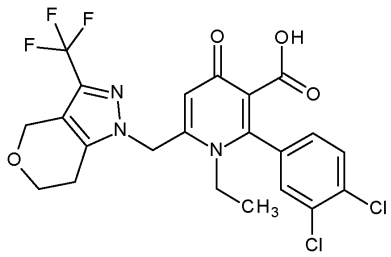
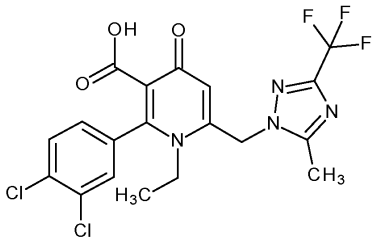
[0572]

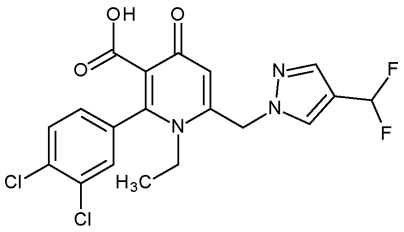
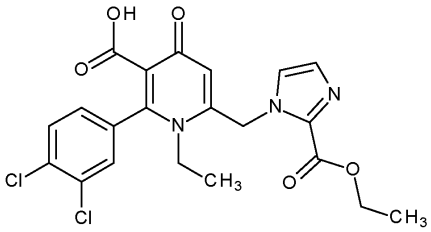
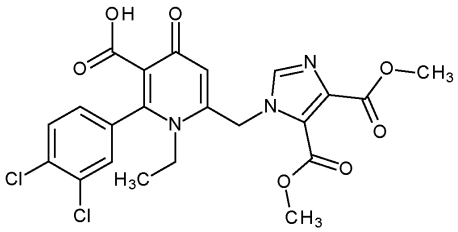
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
97	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[3-(디플루오로메틸)-6,7-디하이드로-4H-피라노[4,3-c]피라졸-2-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.02 분 (A); MS: m/z = 498.20 (M+1)
98	6-[(5-클로로인다졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.34 분 (A); MS: m/z = 476.12 (M+1)
99	6-[(5-클로로인다졸-2-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.30 분 (A); MS: m/z = 476.15 (M+1)
100	6-[(4-아세틸-3-메틸-피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 1.84 분 (A); MS: m/z = 448.18 (M+1)

[0573]

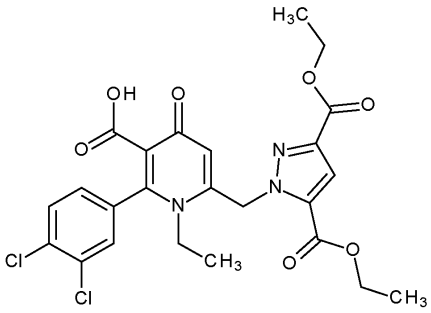
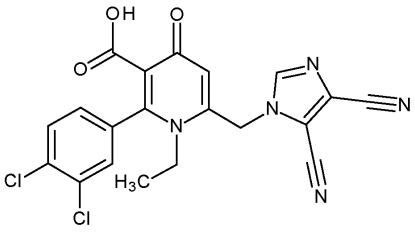
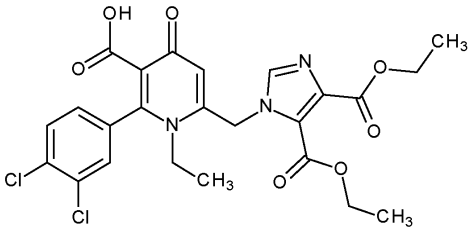
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
101	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-(4,5,6,7-테트라하이드로인다졸-2-일메틸)피리딘-3-카복실산		R_t = 2.16 분 (A); MS: m/z = 446.19 (M+1)
102	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(5-플루오로인다졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.21 분 (A); MS: m/z = 460.20 (M+1)
103	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[2-메틸-4-(트리플루오로메틸)이미다졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 1.94 분 (A); MS: m/z = 474.18 (M+1)
104	6-[[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.36 분 (A); MS: m/z = 494.09 (M+1)

[0574]

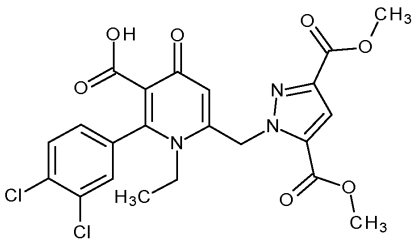
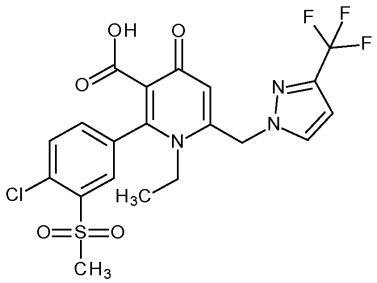
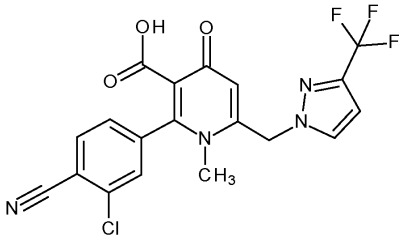
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
105	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-(인다졸-1-일메틸)-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.17 분 (A); MS: m/z = 442.15 (M+1)
106	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-(인다졸-2-일메틸)-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.09 분 (A); MS: m/z = 442.21 (M+1)
107	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)-6,7-디하이드로-4H-피라노[4,3-c]피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산		R_t = 2.23 분 (A); MS: m/z = 516.15 (M+1)
108	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1,2,4-트리아졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.07 분 (A); MS: m/z = 475.18 (M+1)

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
109	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[4-(디플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 2.01 분 (A); MS: m/z = 442.17 (M+1)
110	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[(2-에톡시카보닐이미다졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.32 (s, 1H), 5.89 (s, 2H), 5.48 (s, 1H), 4.27 (q, 2H), 3.87 (q, 2H), 1.27 (t, 3H), 1.19 (t, 3H)	
111	6-[[4,5-비스(메톡시카보닐)이미다졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.17 (s, 1H), 7.82 (dd, 2H), 7.46 (dd, 1H), 5.78 (s, 2H), 5.65 (s, 1H), 3.90 – 3.82 (m, 5H), 3.79 (s, 3H), 1.16 (t, 3H)	

[0575]

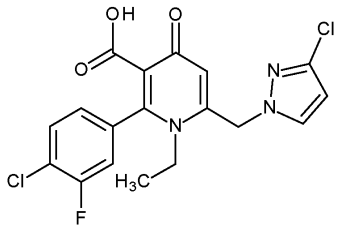
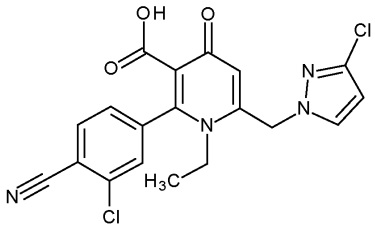
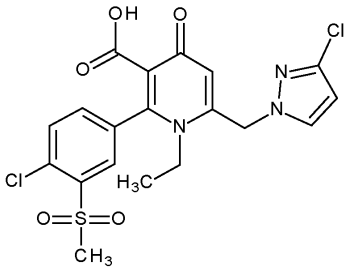
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
112	6-[[3,5-비스(에톡시카보닐)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 16.22 (s, 1H), 7.83 – 7.79 (m, 2H), 7.45 (m, 2H), 6.10 (s, 2H), 5.52 (s, 1H), 4.33 – 4.29 (m, 4H), 3.86 (q, 2H), 1.32 – 1.28 (m, 6H), 1.17 (t, 3H)	
113	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[(4,5-디시아노이미다졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 15.91 (s, 1H), 8.48 (s, 1H), 7.82 (dd, 2H), 7.47 (dd, 1H), 6.37 (s, 1H), 5.80 (s, 2H), 3.83 (q, 2H), 1.11 (t, 3H)	
114	6-[[4,5-비스(에톡시카보닐)이미다졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 16.13 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.80 (d, 2H), 7.44 (d, 1H), 5.78 (s, 2H), 5.65 (s, 1H), 4.37 – 4.15 (m, 4H), 3.85 (d, 2H), 1.30 (t, 3H), 1.21 (t, 3H), 1.16 (t, 3H)	

[0576]

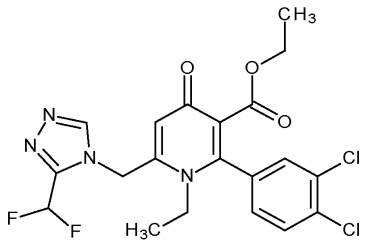
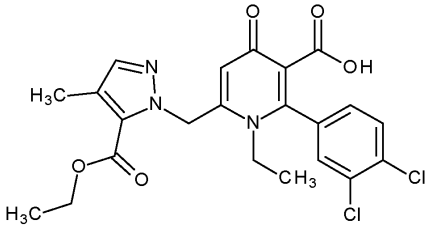
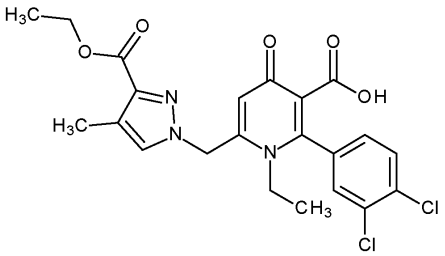
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
115	6-[[3,5-비스(메톡시카보닐)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 16.23 (brs, 1H), 7.86 – 7.77 (m, 2H), 7.50 – 7.44 (m, 2H), 6.09 (s, 2H), 5.54 (s, 1H), 3.88 - 3.84 (m, 8H), 1.18 (t, 3H)	
116	2-(4-클로로-3-메틸설포닐-페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.23 (t, 1H), 8.07 (d, 1H), 7.89 (d, 1H), 7.84 - 7.82 (dd, 1H), 6.94 (d, 1H), 6.01 (s, 1H), 5.82 (s, 2H), 3.93 - 3.81 (m, 2H), 3.41 (s, 3H), 1.01 (t, 3H)	
117	2-(3-클로로-4-시아노-페닐)-1-메틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.24 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.66 – 7.64 (dd, 1H), 6.94 (d, 1H), 6.04 (s, 1H), 5.83 (s, 2H), 3.89 – 3.83 (q, 2H), 1.03 (t, 3H)	

[0577]

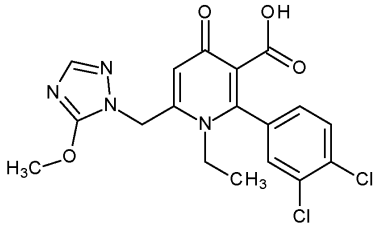
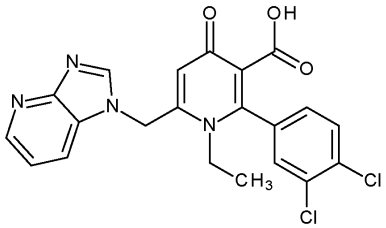
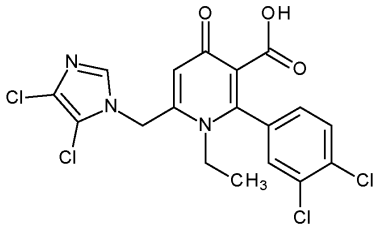
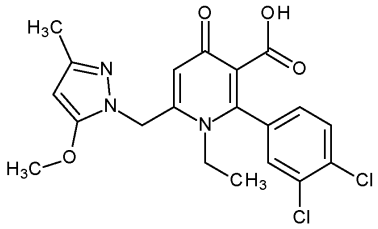
[0578]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
118	2-(4-클로로-3-플루오로-페닐)-6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.06 (d, 1H), 7.77 - 7.75 (dd, 1H), 7.58 - 7.54 (m, 1H), 7.47 - 7.43 (m, 1H), 6.52 (d, 1H), 6.08 (s, 1H), 5.65 (s, 2H), 3.90 - 3.85 (q, 2H), 1.03 (t, 3H)	
119	2-(3-클로로-4-시아노-페닐)-6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.14 (d, 1H), 8.08 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.67 – 7.64 (dd, 1H), 6.54 (d, 1H), 6.13 (s, 1H), 5.67 (s, 2H), 3.88 – 3.83 (q, 2H), 1.03 (t, 3H)	
120	2-(4-클로로-3-메틸설포닐-페닐)-6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.07 (d, 2H), 7.90 - 7.88 (t, 1H), 7.84 - 7.82 (dd, 1H), 6.53 (d, 1H), 6.10 (s, 1H), 5.66 (s, 2H), 3.91 - 3.82 (m, 2H), 3.41 (s, 3H), 1.02 (t, 3H)	

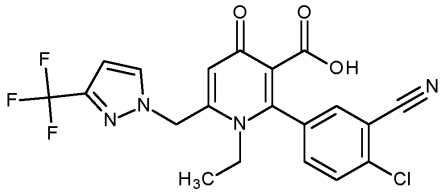
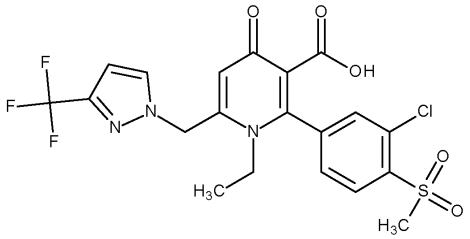
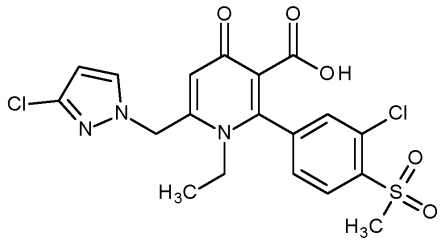
[0579]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
121	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[3-(디플루오로메틸)-1,2,4-트리아졸-4-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트		R_t = 1.95 분 (A); MS: m/z = 471.17 (M+1)
122	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[(5-에톡시카보닐-4-메틸-피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.60 (d, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.14 (dd, 1H), 5.85 (s, 2H), 5.85 (s, 1H), 4.34 (q, 2H), 3.93 (q, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.39 (t, 3H), 1.32 (t, 3H)	
123	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[(3-에톡시카보닐-4-메틸-피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 16.35 (brs, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 5.95 (s, 1H), 5.73 (s, 2H), 4.26 (q, 2H), 3.87 (q, 2H), 2.25 (s, 3H), 1.29 (t, 3H), 1.06 (t, 3H)	

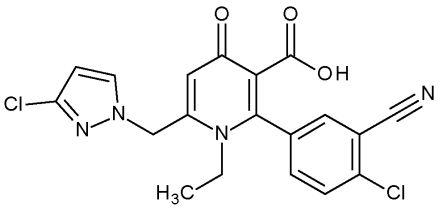
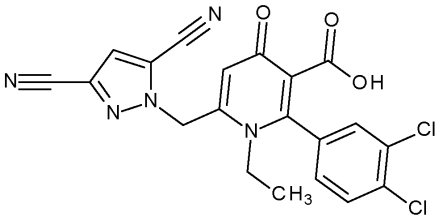
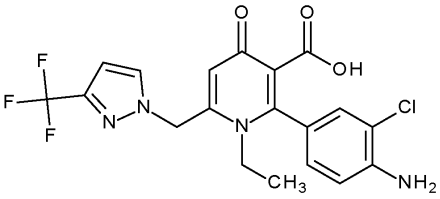
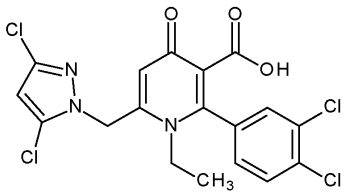
[0580]

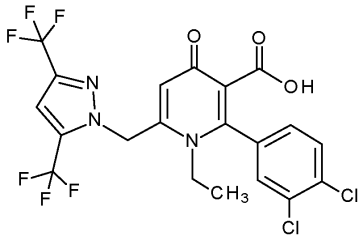
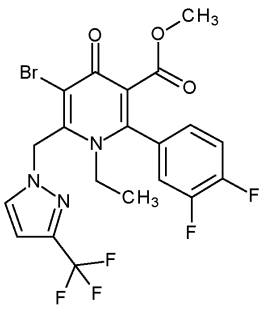
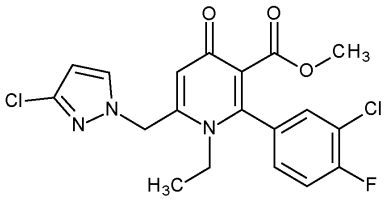
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
124	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(5-메톡시-1,2,4-트리아졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.65 - 7.59 (m, 2H), 7.36 (d, 1H), 7.12 (dd, 1H), 6.64 (s, 1H), 5.19 (s, 2H), 4.18 (s, 3H), 4.06 (q, 2H), 1.26 - 1.18 (m, 3H)	
125	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-(이미다조[4,5-b]피리딘-1-일메틸)-4-옥소-피리딘-3-카복실산		R_t = 1.49 분 (A); MS: m/z = 443.33 (M+1)
126	6-[(4,5-디클로로이미다졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.03 (s, 1H), 7.79 (dd, 2H), 7.47 (dd, 1H), 5.76 (s, 1H), 5.58 (s, 2H), 3.86 (q, 2H), 1.14 (t, 3H)	
127	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(5-메톡시-3-메틸-피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산		

[0581]

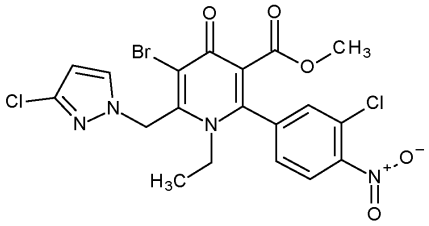
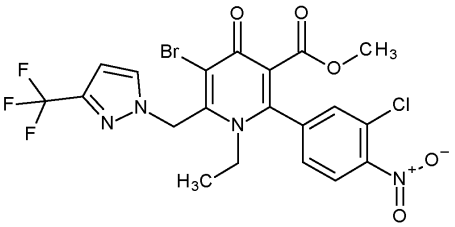
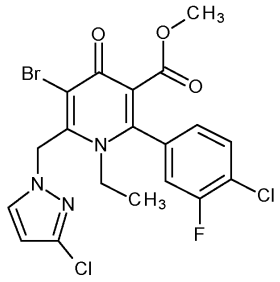
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.81 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.44 (dd, 1H), 5.84 (s, 1H), 5.68 (s, 1H), 5.29 (s, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.86 (m, 2H), 2.14 (s, 3H), 1.06 (t, 3H)	
128	2-(4-클로로-3-시아노-페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.25 (dd, 1H), 8.16 (d, 1H), 7.91 (d, 1H), 7.83 - 7.80 (m, 1H), 6.94 (d, 1H), 6.05 (s, 1H), 5.84 (s, 2H), 3.90 - 3.86 (q, 2H), 1.02 (t, 3H)	
129	2-(3-클로로-4-메틸설포닐-페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.25 (s, 1H), 8.15 (d, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.70 - 7.68 (dd, 1H), 6.95 (s, 1H), 6.02 (s, 1H), 5.84 (s, 2H), 3.87 - 3.85 (q, 2H), 3.45 (s, 3H), 1.05 (t, 3H)	
130	2-(3-클로로-4-메틸설포닐-페닐)-6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.15 (d, 1H), 8.08 (d, 1H), 7.95 (d, 1H), 7.70 - 7.68 (dd, 1H), 6.54 (d, 1H), 6.11 (s, 1H), 5.67 (s, 2H), 3.86 (q, 2H), 3.45 (s, 3H), 1.05 (t, 3H)	

[0582]

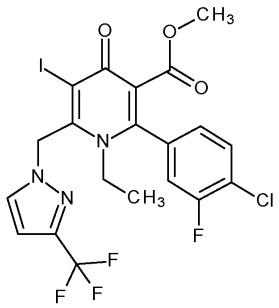
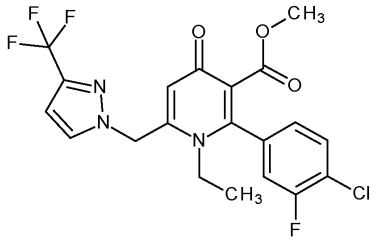
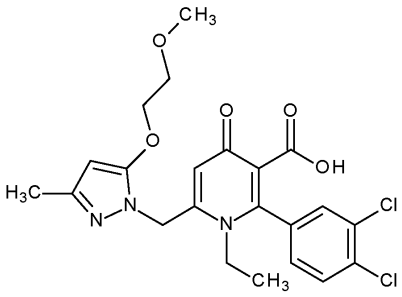
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
131	2-(4-클로로-3-시아노-페닐)-6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.17 (d, 1H), 8.08 (d, 1H), 7.93 - 7.90 (m, 1H), 7.83 - 7.81 (m, 1H), 6.54 (d, 1H), 6.14 (d, 1H), 5.68 (s, 2H), 3.90 (q, 2H), 1.02 (t, 3H)	
132	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[(3,5-디시아노피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 15.92 (brs, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.80 - 7.79 (m, 2H), 7.47 - 7.44 (m, 1H), 6.25 (s, 1H), 6.02 (s, 2H), 3.86 (q, 2H), 1.08 (t, 3H)	
133	2-(4-아미노-3-클로로-페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.22 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 6.98 – 6.96 (dd, 1H), 6.92 (d, 1H), 6.84 (d, 1H), 5.85 (s, 1H), 5.76 (s, 2H), 5.76 (s, 2H), 3.93 – 3.88 (q, 2H), 1.00 (t, 3H)	
134	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[(3,5-디클로로피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.81 (dd, 2H), 7.46 (dd, 1H), 6.90 (s, 1H), 5.81 (s, 1H), 5.69 (s, 2H), 3.87 (q, 2H), 1.09 (t, 3H)	
135	6-[[3,5-비스(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.36 (dd, 1H), 5.83 (s, 2H), 5.34 (s, 1H), 3.76 (q, 2H), 0.99 (t, 3H)	
136	메틸 5-브로모-2-(3,4-디플루오로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.22 (s, 1H), 7.77 - 7.72 (m, 1H), 7.66 - 7.59 (m, 1H), 7.36 - 7.34 (m, 1H), 6.86 (d, 1H), 5.86 (s, 2H), 4.02 – 3.97 (q, 2H), 3.41 (s, 3H), 0.91 (t, 3H)	
137	메틸 2-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.02 (d, 1H), 7.82 - 7.79 (dd, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.51 - 7.47 (m, 1H), 6.49 (d,	

[0583]

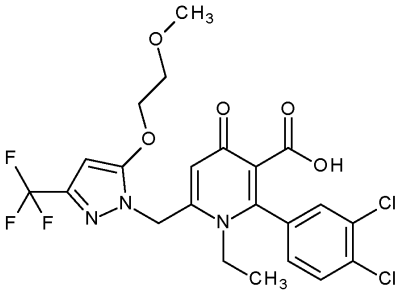
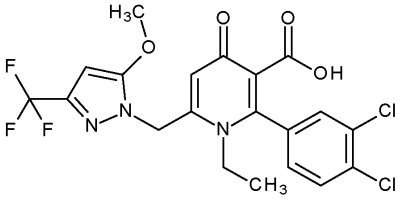
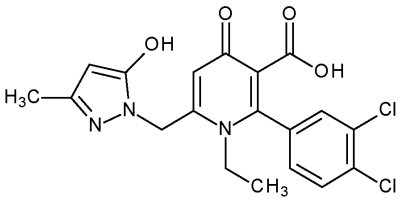
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		1H), 5.72 (s, 1H), 5.49 (s, 2H), 3.78 (q, 2H), 3.36 (s, 3H), 0.97 (t, 3H)	
138	메틸 5-브로모-2-(3-클로로-4-니트로-페닐)-6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.23 (d, 1H), 8.10 (d, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.78 - 7.76 (m, 1H), 6.44 (d, 1H), 5.72 (s, 2H), 4.05 - 3.99 (m, 2H), 3.42 (s, 3H), 0.96 (t, 3H)	
139	메틸 5-브로모-2-(3-클로로-4-니트로-페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.23 (d, 1H), 8.20 (t, 1H), 8.08 (d, 1H), 7.78 - 7.75 (dd, 1H), 6.86 (d, 1H), 5.86 (s, 2H), 3.99 (q, 2H), 3.43 (s, 3H), 0.93 (t, 3H)	
140	메틸 5-브로모-2-(4-클로로-3-플루오로-페닐)-6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 8.36 (d, 1H), 8.21 (d, 1H), 7.95 (dd, 1H), 7.83 (dd, 1H), 6.83 (d, 1H), 5.85 (s, 2H), 4.05 - 3.95 (m, 2H), 3.42 (s, 3H), 0.92 (t, 3H)	

[0584]

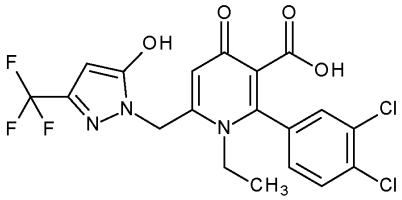
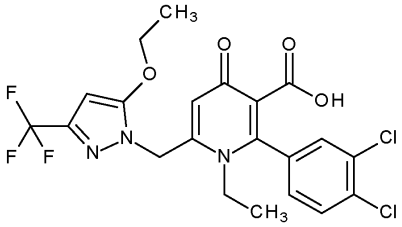
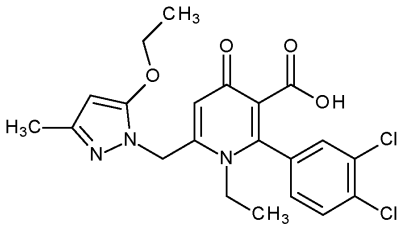
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
141	메틸 2-(4-클로로-3-플루오로-페닐)-1-에틸-5-아이오도-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.89 (d, 1H), 7.56 (t, 1H), 7.19 (dd, 1H), 7.11 (dd, 1H), 6.61 (s, 1H), 5.91 (s, 2H), 4.22 (q, 2H), 3.59 (s, 3H), 1.07 (t, 3H)	
142	메틸 2-(4-클로로-3-플루오로-페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.68 - 7.42 (m, 2H), 7.21 - 7.08 (m, 2H), 6.65 (d, 1H), 6.45 (s, 1H), 5.39 (s, 2H), 3.85 (m, 2H), 3.51 (s, 3H), 1.01 (t, 3H)	
143	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-(2-메톡시에톡시)-3-메틸-피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 – 7.75 (m, 2H), 7.43 (d, 1H), 5.99 (s, 1H), 5.68 (s, 1H), 5.28 (s, 2H), 4.26 – 4.16 (m, 2H), 3.87 (m, 2H), 3.65 – 3.56 (m, 2H), 3.24 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.06 (t, 3H)	

[0585]

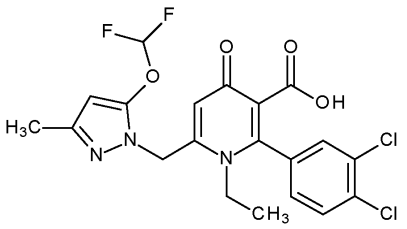
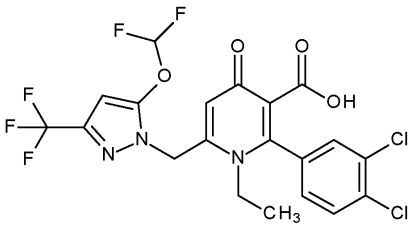
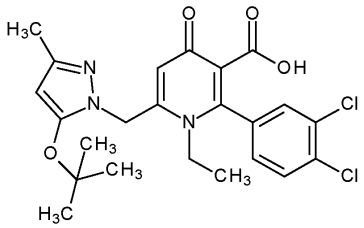
[0586]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
144	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-(2-메톡시에톡시)-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.87 – 7.70 (m, 2H), 7.44 (dd, 1H), 6.48 (s, 1H), 6.01 (s, 1H), 5.51 (s, 2H), 4.46 – 4.30 (m, 2H), 3.88 (q, 2H), 3.68 – 3.61 (m, 2H), 3.25 (s, 3H), 1.05 (t, 3H)	
145	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-메톡시-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.87 – 7.67 (m, 2H), 7.45 (dd, 1H), 6.47 (s, 1H), 5.85 (s, 1H), 5.53 (s, 2H), 4.01 (s, 3H), 3.87 (q, 2H), 1.05 (t, 3H)	
146	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(5-하이드록시-3-메틸-피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 11.37 (s, 1H), 7.82 - 7.77 (m, 2H), 7.46 - 7.43 (m, 1H), 5.94 (s, 1H), 5.31 - 4.98 (m, 3H), 3.88 (d, 2H), 2.09 (s, 3H), 1.07 (t, 3H)	

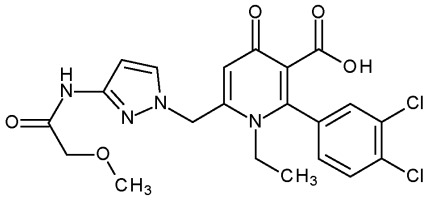
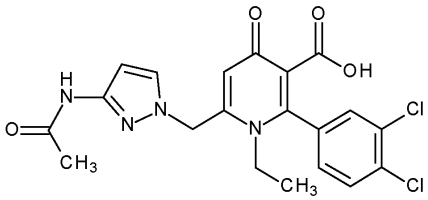
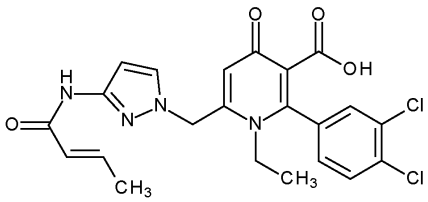
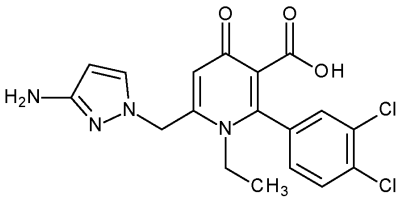
[0587]

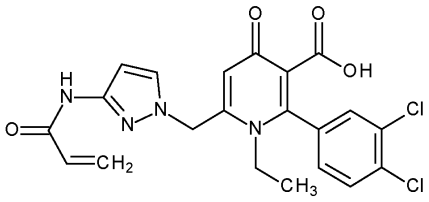
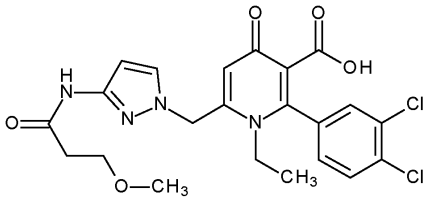
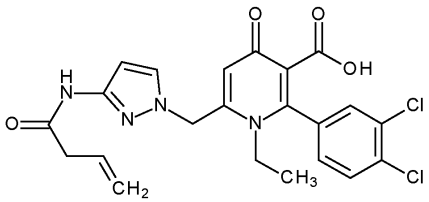
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
147	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-하이드록시-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 12.53 (s, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 5.94 - 5.89 (m, 2H), 5.48 (s, 2H), 3.88 (q, 2H), 1.06 (t, 3H)	
148	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[5-에톡시-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.92 – 7.70 (m, 2H), 7.45 (d, 1H), 6.45 (s, 1H), 5.94 (s, 1H), 5.51 (s, 2H), 4.29 (q, 2H), 3.87 (q, 2H), 1.34 (t, 3H), 1.05 (t, 3H)	
149	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[(5-에톡시-3-메틸-피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.84 – 7.74 (m, 2H), 7.44 (d, 1H), 5.93 (s, 1H), 5.65 (s, 1H), 5.27 (s, 2H), 4.14 (q, 2H), 3.87 (q, 2H), 2.13 (s, 3H), 1.30 (t, 3H), 1.06 (t, 3H)	

[0588]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
150	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[5-(디플루오로메톡시)-3-메틸-피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.81 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.51 – 7.13 (m, 2H), 6.02 (s, 1H), 5.87 (s, 1H), 5.44 (s, 2H), 3.87 (q, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.07 (t, 3H)	
151	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[5-(디플루오로메톡시)-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 16.12 (s, 1H), 7.80 (m, 2H), 7.62 – 7.26 (m, 1H), 7.47 – 7.41 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 5.92 (s, 1H), 5.69 (s, 2H), 3.87 (d, 2H), 1.06 (t, 3H)	
152	6-[(5-tert-부톡시-3-메틸-피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.80 (m, 2H), 7.44 (dd, 1H), 5.91 (s, 1H), 5.76 (s, 1H), 5.27 (s, 2H), 3.87 (q, 2H), 2.14 (s, 3H), 1.38 (s, 9H), 1.06 (t, 3H)	

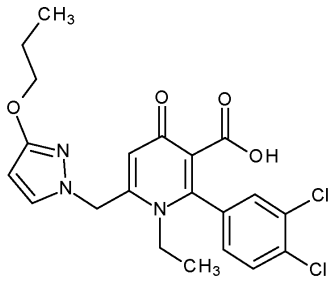
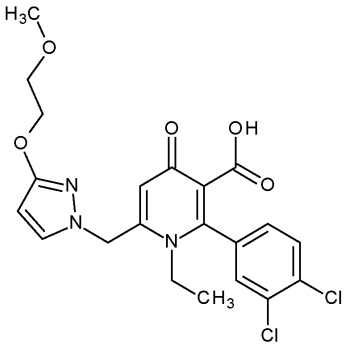
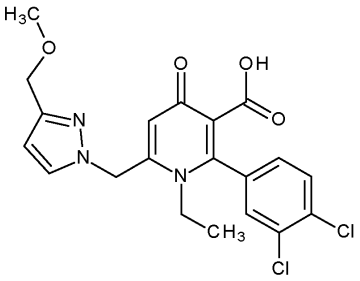
[0589]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
153	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-[(2-메톡시아세틸)아미노]피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 10.28 (s, 1H), 7.89 - 7.86 (d, 1H), 7.80 - 7.77 (m, 2H), 7.44 - 7.42 (d, 1H), 6.66 (s, 1H), 6.12 (s, 1H), 5.58 (s, 2H), 4.40 (s, 2H), 3.90 (dd, 2H), 3.34 (s, 3H), 1.05 (t, 3H)	
154	6-[(3-아세트아미도피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 10.50 (s, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.81 – 7.74 (m, 2H), 7.42 (dd, 1H), 6.63 (d, 1H), 6.12 (s, 1H), 5.56 (s, 2H), 3.88 (d, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.03 (t, 3H)	
155	6-[[3-[[(E)-부트-2-에노일]아미노]피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 10.57 (d, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.80 – 7.76 (m, 2H), 7.42 (d, 1H), 6.86 – 6.73 (m, 1H), 6.71 (s, 1H), 6.16 (d, 2H), 5.57 (s, 2H), 3.89 (d, 2H), 1.84 (d, 3H), 1.02 (t, 3H)	
156	6-[(3-아미노피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		

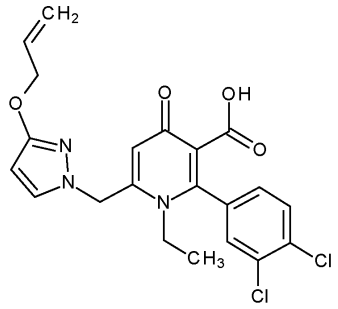
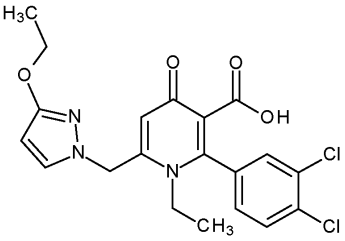
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 – 7.74 (m, 2H), 7.57 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.05 (s, 1H), 5.57 (d, 1H), 5.37 (s, 2H), 4.82 (s, 2H), 3.87 (d, 2H), 1.06 (t, 3H)	
157	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(프로프-2-에노일아미노)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 10.79 (s, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.74 (d, 1H), 6.46 (dd, 1H), 6.25 (dd, 1H), 6.19 (s, 1H), 5.80 – 5.67 (m, 1H), 5.58 (s, 2H), 3.89 (q, 2H), 1.02 (t, 3H)	
158	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-(3-메톡시프로파노일아미노)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 10.53 (s, 1H), 7.86 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.43 (dd, 1H), 6.65 (d, 1H), 6.14 (s, 1H), 5.56 (s, 2H), 3.89 (dd, 2H), 3.59 (t, 2H), 3.22 (s, 3H), 2.55 - 2.50 (m, 2H), 1.04 (t, 3H)	
159	6-[[3-(부트-3-에노일아미노)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 10.57 (s, 1H), 7.87 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 6.71 (d, 1H), 6.17 (s, 1H), 6.17 (s, 1H), 6.17 - 6.13 (m, 1H), 5.57 (s, 2H), 3.88 (dd, 2H), 1.84 (dd, 2H), 1.03 (t, 3H)	

[0590]

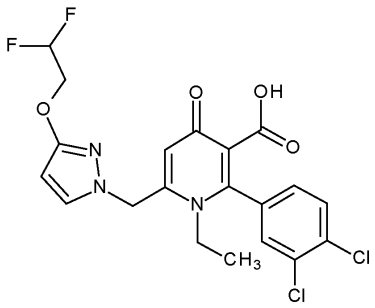
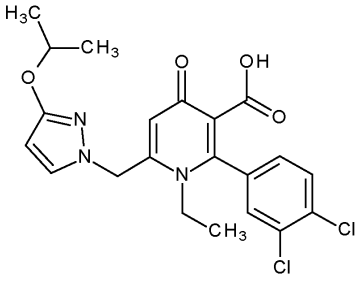
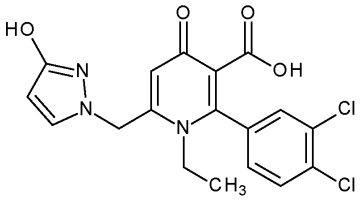
[0591]

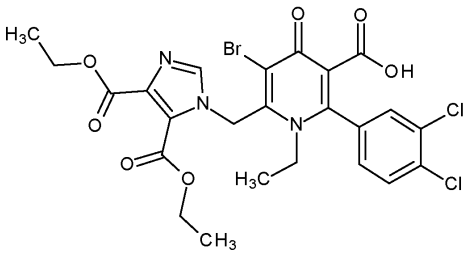
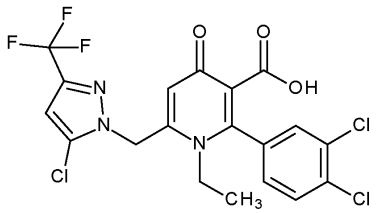
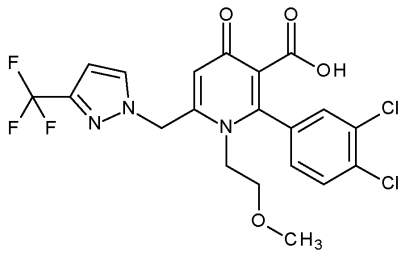
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
160	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[(3-프로폭시피라졸-1-일)메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 – 7.75 (m, 3H), 7.43 (dd, 1H), 5.94 (s, 1H), 5.87 (d, 1H), 5.49 (s, 2H), 4.01 (t, 2H), 3.88 (dd, 2H), 1.76 – 1.64 (m, 2H), 1.08 (t, 3H), 0.94 (t, 3H)	
161	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-(2-메톡시에톡시)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.87 – 7.68 (m, 3H), 7.43 (dd, 1H), 5.95 (s, 1H), 5.88 (d,1H), 5.50 (s, 2H), 4.23 – 4.12 (m, 2H), 3.88 (q, 2H), 3.67 – 3.54 (m, 2H), 3.29 (s, 3H), 1.08 (t, 3H)	
162	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-(메톡시메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산		

[0592]

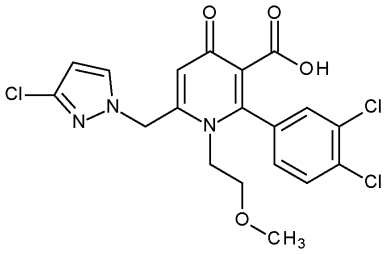
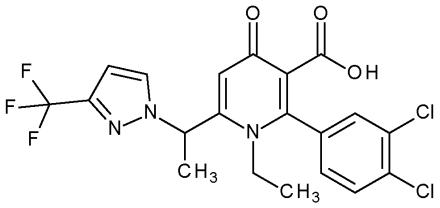
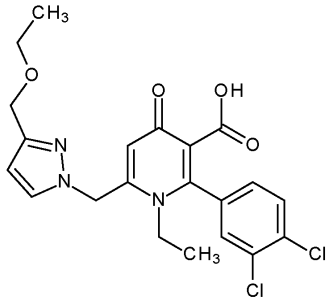
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.94 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.43 (dd, 1H), 6.41 (d, 1H), 5.92 (s, 1H), 5.66 (s, 2H), 4.39 (s, 2H), 3.94 - 3.85 (m, 2H), 3.28 - 3.25 (m, 3H), 1.06 (t, 3H)	
163	6-[(3-알릴옥시피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.81 – 7.75 (m, 3H), 7.43 (d, 1H), 6.03 (m, 1H), 5.95 (s, 1H), 5.89 (s, 1H), 5.50 (s, 2H), 5.37 (d, 1H), 5.24 (d, 1H), 4.61 (d, 2H), 3.88 (q, 2H), 1.07 (t, 3H)	
164	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[(3-에톡시피라졸-1-일)메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 - 7.75 (m, 3H), 7.43 (dd, 1H), 5.95 (s, 1H), 5.86 (d, 1H), 5.49 (s, 2H), 4.11 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 3.93 - 3.84 (m, 2H), 1.36 - 1.24 (m, 3H), 1.08 (t, J = 7.2 Hz, 3H)	

[0593]

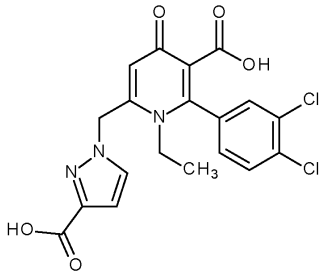
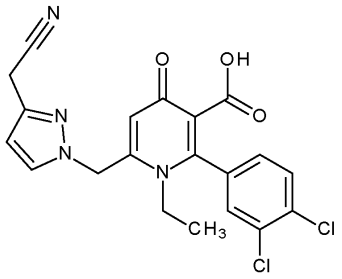
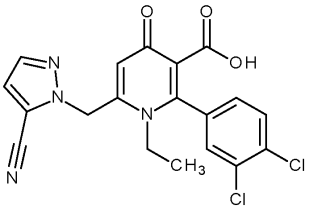
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
165	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[3-(2,2-디플루오로에톡시)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.81 (brs, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.36 (dd, 1H), 6.35 (tt, 1H), 5.93 (d, 1H), 5.80 (s, 1H), 5.40 (s, 2H), 4.37 (dt, 2H), 3.86 - 3.77 (m, 2H), 0.99 (t, 3H)	
166	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-이소프로폭시피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.80 - 7.73 (m, 3H), 7.41 (dd, 1H), 5.92 (s, 1H), 5.83 (d, 1H), 5.46 (s, 2H), 4.66 (td, 1H), 3.87 (q, 2H), 1.27 (d, 6H), 1.07 (t, 3H)	
167	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-하이드록시피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 9.94 (s, 1H), 7.82 – 7.73 (m, 2H), 7.66 (d, 1H), 7.45 – 7.40 (m, 1H), 6.08 (d, 1H), 5.64 (d, 1H), 5.41 (s, 2H), 3.88 (q, 2H), 1.05 (t, 3H)	

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
168	6-[[4,5-비스(에톡시카보닐)이미다졸-1-일]메틸]-5-브로모-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 14.16 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.91 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.58 – 7.47 (m, 1H), 5.78 (d, 2H), 4.39 – 4.23 (m, 4H), 3.90 (d, 2H), 1.29 (q, 6H), 1.05 (t, 3H)	
169	6-[[5-클로로-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.61 (d, 1H), 7.37 (d,1H), 7.13 (dd, 1H), 6.67 (s, 1H), 6.31 (s, 1H), 5.47 (s, 2H), 4.01 (dq, 2H), 1.24 (t, 3H)	
170	2-(3,4-디클로로페닐)-1-(2-메톡시에틸)-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 15.89 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.89 - 7.76 (m, 2H), 7.42 - 7.40 (dd, 1H), 6.93 (d, 1H), 5.94 (s, 1H), 5.83 (s, 2H), 4.07 (t, 2H), 3.38 (t, 2H), 2.07 (s, 3H)	

[0594]

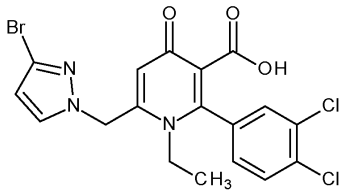
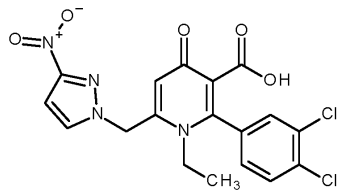
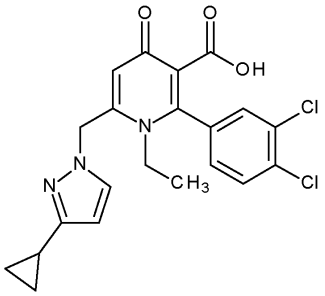
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
171	6-[(3-클로로피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-(2-메톡시에틸)-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.00 (d, 1H), 7.79 - 7.76 (m, 2H), 7.42 - 7.39 (dd, 1H), 6.52 (d, 1H), 6.01 (s, 1H), 5.68 (s, 2H), 4.06 (t, 2H), 3.37 (t, 2H), 3.17 (s, 3H)	
172	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[1-[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]에틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.38 (s, 1H), 7.87 - 7.75 (m, 2H), 7.52 - 7.44 (m, 1H), 6.93 (s, 1H), 6.63 (s, 0.5H), 6.54 (s, 0.5H), 6.18 - 6.13 (m, 1H), 4.00 - 3.85 (m, 2H), 1.93 (d, 3H), 1.14 (t, 3H)	
173	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[3-(에톡시메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.92 (d, 1H), 7.83 – 7.71 (m, 2H), 7.43 (dd, 1H), 6.40 (d, 1H), 5.91 (s, 1H), 5.65 (s, 2H), 4.42 (s, 2H), 3.89 (d, 2H), 3.47 (q, 2H), 1.12 (t, 3H), 1.05 (t, 3H)	

[0595]

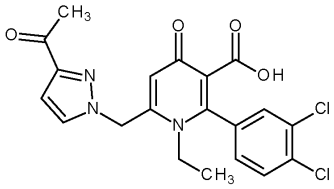
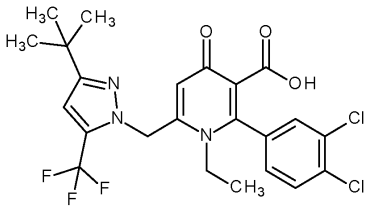
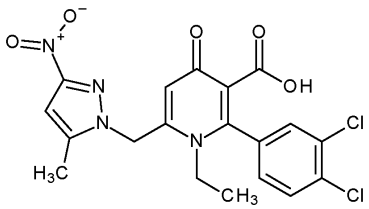
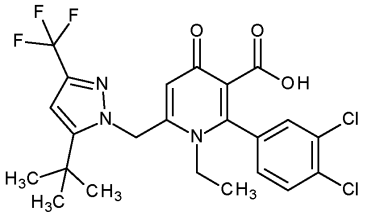
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
174	6-[(3-카복시피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.08 (d, 1H), 7.82 - 7.77 (m, 2H), 7.44 (dd, 1H), 6.86 (d, 1H), 6.01 (s, 1H), 5.78 (s, 2H), 3.92 - 3.88 (m, 2H), 1.05 (t, 3H)	
175	6-[[3-(시아노메틸)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.98 (d, 1H), 7.79 - 7.77 (m, 2H), 7.45 - 7.42 (dd, 1H), 6.42 (d, 1H), 5.93 (s, 1H), 5.68 (s, 2H), 4.06 (s, 2H), 3.89 (q, 2H), 1.08 - 1.04 (t, 3H)	
176	6-[(5-시아노피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 16.24 (brs, 1H), 8.29 (d, 1H), 7.90 – 7.67 (m, 2H), 7.44 (d, 1H), 7.17 (d, 1H), 6.16 (s, 1H), 5.82 (s, 2H), 3.88 (q, 2H), 1.02 (t, 3H)	

[0596]

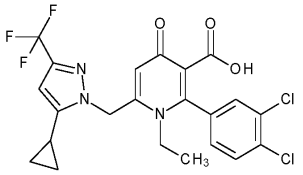
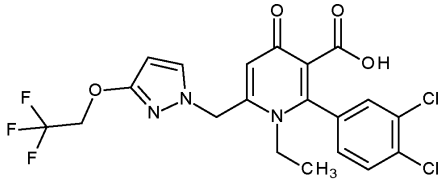
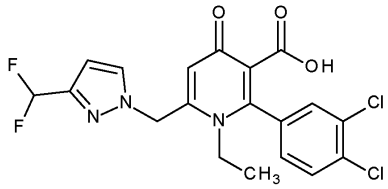
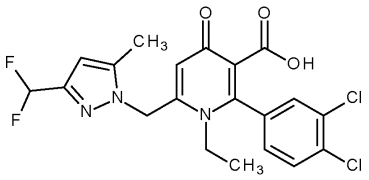
[0597]

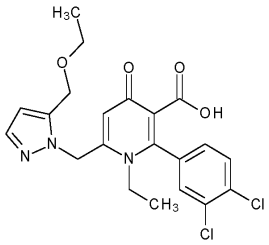
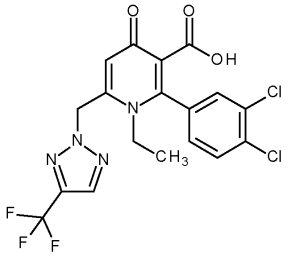
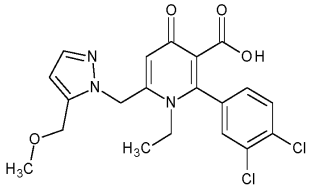
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
177	6-[(3-브로모피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.61 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.43 (d, 1H), 6.34 (s, 1H), 5.37 (s, 2H), 3.96 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)	
178	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(3-니트로피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.28 (d, 1H), 7.82 - 7.77 (m, 2H), 7.44 (dd, 1H), 7.23 (d, 1H), 6.24 (s, 1H), 5.85 (s, 2H), 3.89 (q, 2H), 1.06 (t, 3H)	
179	6-[(3-사이클로프로필피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 - 7.74 (m, 3H), 7.42 (dd, 1H), 6.12 (d, 1H), 5.87 (s, 1H), 5.56 (s, 2H), 3.88 (brd, 2H), 1.91 (dt, 1H), 1.06 (t, 3H), 0.93 - 0.84 (m, 2H), 0.69 - 0.62 (m, 2H)	

[0598]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
180	6-[(3-아세틸피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 16.33 (brs, 1H), 8.11 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.44 (dd, 1H), 6.89 (d, 1H), 5.99 (s, 1H), 5.82 (s, 2H), 3.92 (q, 2H), 2.50 (s, 3H), 1.09 (t, 3H)	
181	6-[[3-tert-부틸-5-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.71 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.35 (dd, 1H), 7.04 (s, 1H), 5.60 (s, 2H), 5.17 (s, 1H), 3.78 (q, 2H), 1.30 (s, 9H), 0.99 (t, 3H)	
182	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(5-메틸-3-니트로-피라졸-1-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.80 (dd, 2H), 7.45 (dd, 1H), 7.07 (s, 1H), 5.80 (s, 2H), 5.76 (s, 1H), 3.95 - 3.81 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.12 (t, 3H)	
183	6-[[5-tert-부틸-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산		

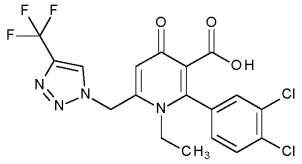
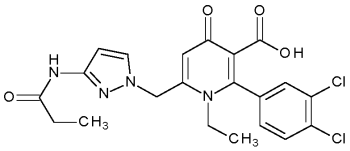
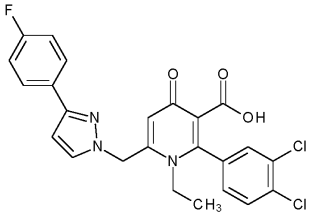
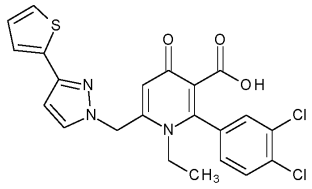
[0599]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 6.75 (s, 1H), 5.80 (s, 2H), 5.37 (s, 1H), 3.93 - 3.86 (m, 2H), 1.37 (s, 9H), 1.14 (t, 3H)	
184	6-[[5-사이클로프로필-3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.71 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.40 - 7.32 (m, 1H), 6.58 (s, 1H), 5.70 (s, 2H), 5.34 (s, 1H), 3.85 - 3.74 (m, 2H), 2.01 - 1.92 (m, 1H), 1.06 - 0.93 (m, 5H), 0.81 - 0.71 (m, 2H)	
185	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(2,2,2-트리플루오로에톡시)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.86 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.43 (dd, 1H), 6.04 (d, 1H), 6.01 (s, 1H), 5.53 (s, 2H), 4.80 (q, 2H), 3.89 (q, 2H), 1.08 (t, 3H)	
186	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[3-(디플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.12 (d, 1H), 7.79 (t, 2H), 7.43 (dd, 1H), 7.19 – 6.92 (m, 1H), 6.71 (s, 1H), 5.99 (s, 1H), 5.75 (s, 2H), 3.91 – 3.86 (m, 2H), 1.03 (t, 3H)	
187	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[3-(디플루오로메틸)-5-메틸-피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-		

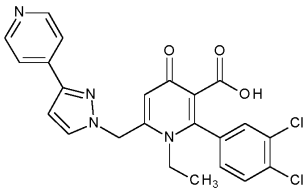
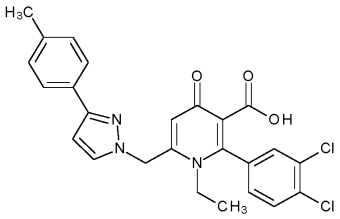
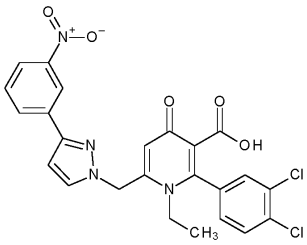
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
	옥소-피리딘-3-카복실산	1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.81 – 7.77 (m, 2H), 7.4 (dd, 1H), 7.32 (s, 0.2H), 7.13 (s, 0.3H), 6.99 (s, 0.3H), 6.80 (s, 0.2H), 6.64 (s, 0.3H), 6.53 (s, 0.7H), 5.67 (s, 2H), 5.53 (s, 1H), 3.39 (q, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.09 (t, 3H)	
188	2-(3,4-디클로로페닐)-6-[[5-(에톡시메틸)피라졸-1-일]메틸]-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.78 (dd, 2H), 7.62 (d, 1H), 7.41 (dd, 1H), 6.46 (d, 1H), 5.65 (d, 3H), 4.56 (s, 2H), 3.89 (d, 2H), 3.40 (dd, 2H), 1.10 (t, 3H), 1.01 (t, 3H)	
189	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[4-(트리플루오로메틸)트리아졸-2-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.98 (s, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.70 (d, 1H), 5.74 (s, 2H), 4.02 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)	
190	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[5-(메톡시메틸)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 - 7.76 (m, 3H), 7.63 (d, 1H), 7.46 - 7.41 (m, 1H), 6.48 (d,1H), 5.64 (s, 2H), 4.52 (s, 2H), 3.88 (q, 2H), 3.22 (s, 3H), 1.10 (t, 3H)	

[0600]

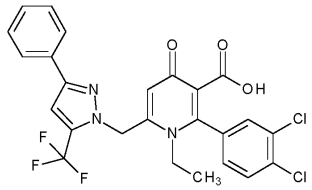
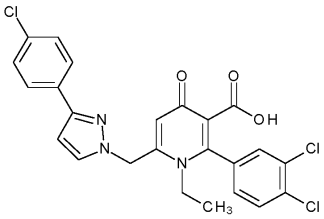
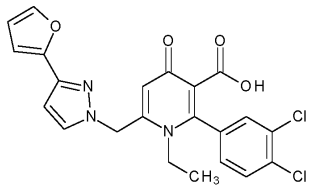
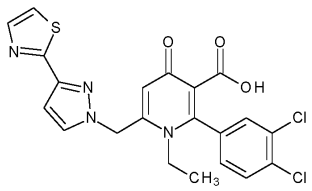
[0601]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
191	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[4-(트리플루오로메틸)트리아졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 8.36 (s, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.12 (dd, 1H), 6.63 (s, 1H), 5.74 (s, 2H), 4.04 (q, 2H), 1.27 - 1.12 (m, 3H)	
192	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(프로파노일아미노)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 10.45 (s, 1H), 7.85 - 7.77 (m, 3H), 7.42 (d, 1H), 6.65 (s, 1H), 6.12 (s, 1H), 5.56 (s, 2H), 3.88 (d, 2H), 2.28 (d, 2H), 1.09 – 0.99 (m, 6H)	범위 확인
193	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-(4-플루오로페닐)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 16.48 (brs, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.88 (dd, 2H), 7.81 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.26 (t, 2H), 6.92 (d, 1H), 6.03 (s, 1H), 5.74 (s, 2H), 3.94 (q, 2H), 1.11 (t, 3H)	
194	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(2-티에닐)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.97 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.51 - 7.41 (m, 2H), 7.35 (dd, 1H), 7.10 (dd, 1H), 6.76 (d, 1H), 5.70 (s, 1H), 5.57 (s, 2H), 3.87 - 3.77 (m, 2H), 0.99 (t, 3H)	

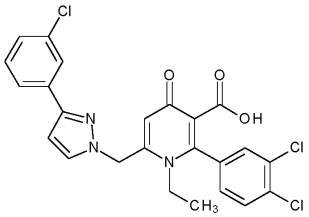
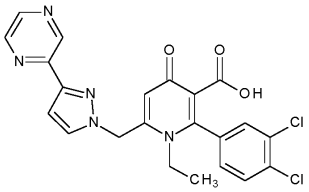
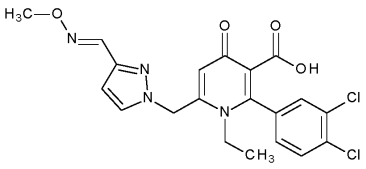
[0602]

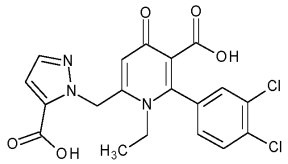
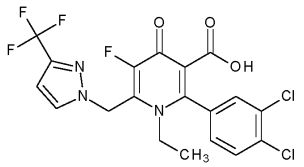
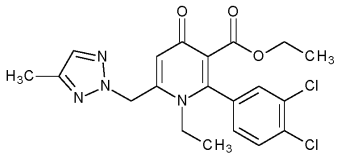
화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
195	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(4-피리딜)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.66 (brs, 2H), 8.25 (s, 1H), 7.90 (brs, 2H), 7.86 - 7.75 (m, 2H), 7.46 (dd,1H), 7.17 (brs, 1H), 6.04 (s, 1H), 5.87 (s, 2H), 3.97 (q, 2H), 1.10 (t, 3H)	
196	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-(p-톨릴)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.02 (d, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.72 (m, 2H), 7.45 (dd, 1H), 7.23 (m, 2H), 6.87 (d, 1H), 6.01 (s, 1H), 5.73 (s, 2H), 3.94 (q, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.11 (t, 3H)	
197	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-(3-니트로페닐)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.63 (s, 1H), 8.30 (d, 1H), 8.19 (dd, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.15 (d, 1H), 6.01 (s, 1H), 5.80 (s, 2H), 3.94 (q, 2H), 1.11 (t, 3H)	

[0603]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
198	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[[3-페닐-5-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.92 (d, 2H), 7.72 (d, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.48 (t, 2H), 7.43 - 7.40 (m, 1H), 7.38 (dd, 1H), 5.73 (s, 2H), 5.34 (s, 1H), 3.82 (q, 2H), 1.03 (t, 3H)	
199	6-[[3-(4-클로로페닐)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.06 (d, 1H), 7.86 (d, 2H), 7.81 (s, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.49 (d, 2H), 7.45 (dd, 1H), 6.95 (d, 1H), 6.03 (s, 1H), 5.75 (s, 2H), 3.94 (q, 2H), 1.10 (t, 3H)	
200	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-(2-푸릴)피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.01 (brs, 1H), 7.70 (d, 2H), 7.66 (d, 1H), 7.40 - 7.32 (m, 1H), 6.74 (d, 1H), 6.67 (d, 1H), 6.57 (dd, 1H), 5.76 (s, 1H), 5.60 (brs, 2H), 3.83 (brq, 2H), 0.98 (brt, 3H)	
201	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[(3-티아졸-2-일피라졸-1-일)메틸]피리딘-3-카복실산		

[0604]

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.15 (s, 1H), 7.91 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 6.94 (d, 1H), 5.98 (s, 1H), 5.81 (s, 2H), 3.92 (q, 2H), 1.10 (t, 3H)	
202	6-[[3-(3-클로로페닐)피라졸-1-일]메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.03 (brs, 1H), 7.86 (t, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.45 (t, 1H), 7.41 - 7.33 (m, 2H), 6.96 (d, 1H), 5.76 (s, 1H), 5.60 (brs, 2H), 3.85 (brq, 2H), 0.98 (brt, 3H)	
203	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-6-[(3-피라진-2-일피라졸-1-일)메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 9.15 (d, 1H), 8.70 - 8.67 (m, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.16 (d, 1H), 7.83 - 7.77 (m, 2H), 7.46 (dd, 1H), 7.09 (d, 1H), 6.08 (s, 1H), 5.83 (s, 2H), 3.97 (q, 2H), 1.12 (t, 3H)	
204	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[[3-[(E)-메톡시이미노메틸]피라졸-1-일]메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.16 (s, 1H), 8.03 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.00 (s, 1H), 5.71 (s, 2H), 3.91 – 3.88 (m, 2H), 3.88 (s, 3H), 1.03 (t, 3H)	

화합물 번호	화합물 명칭	구조 및 ^{1}H NMR 데이터	LC/MS
205	6-[(5-카복시피라졸-1-일)메틸]-2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-4-옥소-피리딘-3-카복실산	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 16.23 (brs, 1H), 7.84 - 7.76 (m, 3H), 7.46 (dd, 1H), 7.05 (d, 1H), 6.01 (s, 2H), 5.47 (s, 1H), 3.90 (q, 2H), 1.16 (t, 3H)	
206	2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-5-플루오로-4-옥소-6-[[3-(트리플루오로메틸)피라졸-1-일]메틸]피리딘-3-카복실산	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.24 (d, 1H), 7.81 (dd, 2H), 7.46 (dd, 1H), 6.86 (d, 1H), 5.80 (d, 2H), 3.96 (q, 2H), 0.59 (t, 3H)	
207	에틸 2-(3,4-디클로로페닐)-1-에틸-6-[(4-메틸트리아졸-2-일)메틸]-4-옥소-피리딘-3-카복실레이트	 1H NMR (400 MHz, 클로로포름) δ = 7.62 - 7.57 (m, 2H), 7.45 (s, 1H), 7.36 - 7.31 (m, 1H), 6.51 (s, 1H), 5.60 (s, 2H), 4.06 - 3.94 (m, 4H), 2.33 (s, 3H), 1.10 (t, 3H), 0.97 (t, 3H)	

[0605]

[0606] **생물학적 실시예**

[0607] 다양한 시험 종의 종자를 포트 내의 표준 토양에 파종한다(*세타리아 파베리*(*Setaria faberi*)(SETFA), *에치노클로아 크루스-갈리*(*Echinochloa crus-galli*)(ECHCG), *지 메이스*(*Zea mays*)(*ZEAMX*), *이포모에아 헤데라세아*(*Ipomoea hederacea*)(*IPOHE*), *아마란투스 팔메리*(*Amaranthus palmeri*)(AMAPA), *아마란투스 레토플렉수스*(*Amaranthus retoflexus*)(AMARE)). 온실 내에서의 제어된 조건(낮/밤, 24℃/16℃에서; 14시간 광; 65% 습도) 하에 8일간의 재배 후, 식물에, 0.5% Tween 20(폴리옥시에틸렌 소르비탄 모노라우레이트, CAS RN 9005-64-5)을 함유하는 아세톤/물(50:50) 용액 중의 본 기술의 유효 성분의 제형으로부터 유래된 수성 분무 용액을 분무한다. 달리 명시되지 않는 한, 화합물은 1000 g/ha로 시용한다. 이어서, 시험 식물을 온실 내에서의 제어된 조건(낮/밤, 24℃/16℃에서; 14시간 광; 65% 습도) 하에 온실 내에서 기르고, 시험 식물에 하루에 두 차례 물을 준다. 13일 후, 시험을 식물에 야기된 손상 백분율에 대해 평가한다. 생물학적 활성을 5점 척도(5 = 81 내지 100%; 4 = 61 내지 80%; 3 = 41 내지 60%; 2 = 21 내지 40%; 1 = 0 내지 20%; - = 시험되지 않음)로 다음 표에 나타낸다.

[0608] [표 B1]

[0609] **출아 전 시험**

화합물 번호	SETFA	ECHCG	ZEAMX	IPOHE	AMAPA	AMARE
1	4	3	0	0	0	0
1*	4	2	0	0	0	0
2	5	5	4	3	3	3
2*	5	5	4	4	0	1
3	5	4	0	0	0	1
3*	1	1	0	0	0	0
4	5	5	3	3	1	2
4*	5	5	1	2	0	0
5	3	4	0	0	2	0
5*	2	3	0	0	0	0
6	4	3	0	2	-	0
6*	2	3	0	1	1	0
7	3	3	1	0	0	0
8	1	3	0	1	0	0
9	5	5	0	0	2	1
9*	5	5	0	1	1	0
11	3	3	2	4	4	3
11*	3	3	0	2	4	2
12	0	0	0	0	0	0
13a	4	3	0	0	0	0
13a*	2	2	0	0	1	0
14	5	5	0	0	1	1
14*	3	4	0	0	0	0
15	4	4	2	3	5	2
16	1	4	0	0	5	4
16*	0	1	0	0	3	1
17	4	4	2	3	5	2
18	2	1	0	0	0	0
19	5	5	3	3	1	1
19*	5	2	0	0	0	0
20	2	4	1	0	0	0
21*	0	0	0	1	0	0
22	4	3	0	0	0	0
22*	4	1	0	0	0	0
25	5	5	1	1	2	2
26	3	2	1	0	0	0
27	0	0	0	0	0	1
28	5	5	0	1	0	0
29	5	4	0	0	1	1
30	5	5	5	4	1	0
31	5	5	0	1	0	0
32	5	5	4	3	4	3
33	5	5	0	0	3	0
34	5	5	0	0	1	0
35	4	5	5	4	2	1

[0610]

[0611]

화합물 번호	SETFA	ECHCG	ZEAMX	IPOHE	AMAPA	AMARE
36*	4	3	0	0	2	1
37	5	5	5	4	2	1
38	5	5	5	4	3	2
39	3	4	0	2	1	1
40	1	0	0	2	3	1
44	1	2	0	1	3	2
45	1	4	0	0	1	0
48	5	5	0	0	1	0
49	0	1	0	0	1	2
50	0	1	0	0	1	1
52	0	-	0	0	1	1
61	1	-	0	0	1	1
64*	2	0	0	3	1	0
75*	1	1	0	0	1	1
78	5	5	3	4	2	2
78*	5	5	4	4	3	2
79*	1	1	0	0	1	0
80	5	5	0	3	1	0
80*	4	3	0	2	1	0
84	0	0	0	0	0	0
85*	3	2	0	1	0	0
88	2	3	1	2	-	-
89	4	5	1	4	3	2
89*	3	4	0	3	0	0
91	0	0	0	0	1	1
92	4	4	0	2	2	0
92*	3	3	0	3	1	0
93*	0	0	0	0	2	1
94	1	2	0	1	2	1
94*	1	2	0	0	1	0
96	3	3	0	1	1	1
98*	0	0	0	0	1	0
100	1	0	0	2	2	2
101	1	0	1	2	2	1
102	1	1	0	3	1	1
103	1	1	0	0	2	1
104	5	5	5	4	1	1
104*	5	5	2	1	1	1
108	0	0	0	0	0	0
109	5	5	0	4	0	0
109*	2	3	0	1	0	0
112	0	0	0	0	1	1
115	1	0	0	0	1	0
117	5	4	1	2	2	2
117*	4	3	0	0	1	0
118	4	4	0	2	0	1
118*	5	4	0	1	0	1
119	4	3	0	0	1	0

[0612]

화합물 번호	SETFA	ECHCG	ZEAMX	IPOHE	AMAPA	AMARE
119*	3	1	0	0	1	0
122*	1	0	0	0	1	0
123	1	0	0	0	1	0
124*	0	0	0	0	1	1
125*	1	0	0	0	1	0
127	5	3	4	2	1	2
127*	3	1	0	0	1	1
128	3	1	0	1	1	1
130	0	0	0	0	1	1
134	5	5	4	4	4	2
134*	5	4	0	1	2	1
135	0	1	1	2	0	1
143	0	0	0	0	1	1
144	5	1	0	1	0	0
145	5	4	0	3	0	1
145*	5	2	0	0	0	0
146	1	1	0	0	0	0
147	1	0	0	0	1	0
148	5	2	0	2	1	0
148*	2	0	0	0	0	0
149	4	1	0	0	3	1
150	5	5	3	4	2	1
150*	5	4	1	1	1	0
151	5	5	2	4	1	0
151*	5	5	2	2	0	0
160	5	5	3	2	0	1
160*	2	2	0	2	0	0
161	4	3	0	3	1	0
161*	1	0	0	0	0	0
162	-	5	4	4	1	3
162*	-	3	1	1	0	1
163	3	4	2	3	0	0
163*	0	1	0	1	0	0
164	-	5	0	4	1	1
164*	-	4	1	4	0	1
165	-	5	4	4	2	1
165*	-	4	1	3	0	0
166	-	5	5	4	1	1
166*	-	5	1	2	0	0
169*	5	4	0	1	1	1
170	4	3	0	2	0	0
171	4	1	1	0	0	1
173	4	4	0	3	0	0
175	3	1	0	1	0	0
176	4	4	0	1	2	0
176*	4	2	0	0	1	0
177	-	5	0	2	1	1
177*	-	4	0	1	1	0

화합물 번호	SETFA	ECHCG	ZEAMX	IPOHE	AMAPA	AMARE
178	-	2	0	0	0	0
178*	-	1	0	0	0	0
179	-	5	5	4	2	4
179*	-	1	0	0	0	-
180	-	1	0	0	1	2
185	-	5	3	3	2	3
185*	-	1	0	1	1	1
186	5	5	3	4	1	2
186*	5	4	0	2	0	0
187	-	1	1	3	0	0
189*	-	5	4	3	2	2
190	-	4	2	3	1	1
190*	-	1	1	1	0	0
193	-	0	0	1	0	0
194	-	2	1	2	0	0
194*	-	1	0	1	0	0
198	-	1	1	0	1	1
201	-	0	0	1	0	0
203	-	2	1	0	1	1
204	-	4	2	4	1	1
204*	-	2	1	2	1	0

[0613]

[0614] * 화합물은 250 g/Ha로 시용됨

[0615] [표 B2]

[0616] **출아 후 시험**

화합물 번호	SETFA	ECHCG	ZEAMX	IPOHE	AMAPA	AMARE
1	4	4	3	1	1	1
1*	3	3	1	2	0	0
2	5	4	4	4	4	4
2*	4	4	4	3	3	3
3	3	3	2	2	2	1
3*	2	1	0	4	1	1
4	4	4	3	4	4	2
4*	4	4	2	-	3	3
5	4	1	2	1	1	1
6	4	4	4	1	2	0
6*	0	3	0	1	0	1
7	4	2	1	1	1	1
8	4	1	1	1	1	1
9	3	4	2	1	1	0
9*	4	3	0	3	0	0
10	0	0	1	1	0	0
11	1	1	1	1	1	1
12	1	1	1	2	2	1
13a	4	4	3	2	2	0
13a*	3	2	0	3	0	1
14	4	4	1	3	3	1

[0617]

[0618]

화합물 번호	SETFA	ECHCG	ZEAMX	IPOHE	AMAPA	AMARE
14*	2	1	1	3	1	1
15	4	4	3	5	5	3
15*	3	4	2	3	5	5
16	5	4	4	5	5	1
16*	2	2	0	2	4	4
17	4	4	3	5	5	3
17*	3	4	2	3	5	5
18	3	3	2	1	2	1
18*	1	1	1	1	0	1
19	4	4	3	2	1	4
19*	3	2	2	4	0	0
20	4	3	1	0	0	1
21	0	0	1	3	2	1
22	3	3	1	2	1	1
22*	3	0	0	1	1	1
23	2	2	1	2	2	1
24	1	1	3	1	1	1
24*	1	1	1	2	1	1
25	4	4	3	4	2	2
25*	4	3	0	4	2	2
26	1	1	2	3	2	1
26*	1	1	1	1	1	1
27	0	0	0	0	0	0
28	4	4	4	1	2	0
28*	4	3	0	4	1	1
29	4	4	4	1	1	2
29*	4	3	0	4	0	1
30	5	4	4	2	2	4
30*	4	3	3	4	0	1
31	4	4	3	2	2	2
31*	4	2	1	4	0	1
32	4	4	3	2	2	4
32*	4	3	1	4	2	1
33	4	4	2	3	2	3
33*	3	3	1	4	1	1
34	4	4	2	4	3	1
34*	3	2	1	4	1	1
35	4	4	3	2	1	3
35*	4	3	2	4	1	-
36*	4	3	2	4	1	2
37	5	4	4	2	4	1
37*	4	4	1	4	2	2
38	4	4	4	3	4	4
38*	4	3	2	4	1	2
39	4	4	4	2	2	2
39*	1	3	0	2	1	2
40	1	0	2	2	1	0
40*	0	1	0	0	0	1

[0619]

화합물 번호	SETFA	ECHCG	ZEAMX	IPOHE	AMAPA	AMARE
43	1	1	1	0	1	0
43*	0	1	0	0	1	1
44	1	1	1	2	3	0
45	1	1	0	0	1	0
48	4	5	3	2	3	0
48*	4	3	0	4	1	1
49	2	2	0	0	1	0
49*	1	0	0	1	0	0
50	2	1	1	2	3	0
51	1	1	0	1	1	0
52	1	1	0	2	2	0
54	1	1	1	0	1	1
55	1	2	1	3	3	0
55*	0	2	0	0	1	1
58	1	1	0	0	0	1
60	1	2	0	1	0	1
61	1	0	0	0	0	1
64*	2	3	1	1	2	3
67*	0	0	0	0	1	1
68	1	1	0	1	1	1
68*	1	0	1	1	1	1
69	3	1	2	1	1	1
70	2	1	0	1	1	1
74	0	0	1	0	0	0
75*	0	1	0	0	1	1
76	1	0	1	0	1	1
77	0	1	1	0	1	1
78	4	4	3	4	2	3
78*	4	3	1	4	2	1
79*	0	1	1	1	0	1
80	4	4	3	3	2	2
80*	3	3	1	4	2	2
84	0	0	1	0	0	0
84*	0	1	0	0	0	0
85*	4	2	0	4	0	0
87	1	1	1	1	2	1
87*	0	1	1	0	0	0
88	4	2	3	2	2	1
88*	0	3	0	2	1	1
89	4	4	3	3	3	1
89*	2	4	0	-	1	1
90	0	1	0	0	1	1
91	1	1	1	3	4	2
91*	0	3	1	0	1	1
92	3	4	2	3	2	2
92*	3	3	2	3	2	2
93*	1	2	1	1	1	1
94	4	1	0	3	3	3

[0620]

화합물 번호	SETFA	ECHCG	ZEAMX	IPOHE	AMAPA	AMARE
94*	0	4	0	0	2	3
95	1	1	1	1	1	0
96	3	2	4	0	0	1
96*	0	2	0	0	0	0
97*	0	1	1	0	1	1
98*	1	2	1	1	0	1
99	0	0	1	1	0	0
99*	0	1	0	0	0	0
100	2	2	1	3	2	2
100*	0	3	0	0	0	0
101	0	0	0	3	0	0
101*	0	1	0	0	0	0
102	2	3	0	3	4	4
102*	1	3	1	1	2	1
103	1	1	1	0	1	1
104	4	4	4	3	4	4
104*	4	4	4	4	3	3
105	2	3	1	4	2	2
105*	0	3	0	0	0	0
106	1	1	0	3	1	1
106*	0	2	0	0	0	0
107	1	1	0	2	1	1
107*	0	2	0	0	0	0
108	2	2	1	0	0	0
108*	1	1	0	0	0	0
109	4	4	3	3	3	1
109*	1	3	1	2	0	0
110	1	1	0	1	0	0
111	1	2	0	0	1	1
112	1	2	0	2	1	1
113	1	1	1	0	1	1
115	0	0	1	0	2	0
115*	0	0	0	0	1	1
116	1	1	1	1	1	1
117	4	4	4	3	2	1
117*	3	3	1	3	0	0
118	4	4	2	4	-	2
118*	4	3	2	4	2	2
119	4	4	0	2	-	0
119*	1	1	0	1	0	1
123	1	1	1	2	-	1
123*	0	2	0	0	0	0
124*	2	4	1	0	0	1
125*	1	1	1	1	0	1
126	0	0	1	0	1	0
126*	0	1	0	0	0	0
127	3	4	3	3	3	2
127*	3	2	1	1	0	0

[0621]

화합물 번호	SETFA	ECHCG	ZEAMX	IPOHE	AMAPA	AMARE
128	3	4	1	1	1	1
128*	0	1	0	1	0	0
129	0	1	1	0	0	0
130	1	0	0	1	2	1
131	2	-	0	1	0	0
132	1	1	1	0	-	0
133	0	0	0	1	1	1
133*	1	0	0	0	1	1
134	4	4	3	3	4	4
134*	4	3	2	4	1	2
135	4	-	2	3	1	2
135*	-	1	1	2	1	1
143	2	2	1	2	1	1
144	3	3	3	2	1	2
144*	2	2	0	1	0	1
145	4	4	3	3	3	3
145*	3	3	1	3	0	1
146	1	0	0	0	0	0
147	0	0	0	1	0	1
148	4	4	2	2	3	3
148*	3	2	1	2	1	1
149	3	4	2	2	1	2
149*	1	1	0	1	0	0
150	4	4	3	2	1	2
150*	4	2	1	4	0	0
151	4	4	3	4	2	3
151*	4	3	1	4	1	1
152	0	1	1	0	1	1
153	0	0	1	2	0	1
154	0	0	1	0	0	0
154*	0	0	1	0	0	0
155	0	1	0	0	1	0
155*	1	1	0	1	1	1
160	4	4	4	3	1	1
160*	2	2	1	3	0	0
161	3	3	1	3	1	0
161*	2	2	1	1	0	1
162	5	-	3	4	2	2
162*	-	3	1	2	1	1
163	4	3	1	2	1	1
164	5	-	4	4	3	3
164*	-	4	4	3	1	1
165	4	-	3	4	2	3
165*	-	3	2	4	1	1
166	5	-	4	4	1	1
166*	-	4	2	2	1	0
167	0	0	0	0	1	0
169*	4	3	4	4	3	3

화합물 번호	SETFA	ECHCG	ZEAMX	IPOHE	AMAPA	AMARE
170	4	4	1	3	1	1
170*	3	3	0	3	0	0
171	3	3	1	1	0	0
171*	0	1	1	1	0	0
172	1	-	1	1	2	2
172*	-	0	0	0	1	1
173	4	4	1	2	1	1
173*	1	2	0	1	0	0
175	3	2	1	2	0	0
175*	0	1	0	1	0	0
176	4	4	1	3	-	3
176*	2	2	0	2	0	0
177	4	-	1	3	2	3
177*	-	3	1	4	2	1
178	2	-	0	0	1	1
178*	-	1	0	1	1	0
179	4	-	4	4	3	3
179*	-	3	3	4	1	0
180	1	-	1	1	0	1
180*	-	1	0	0	0	0
181	0	-	0	1	1	1
181*	-	1	0	0	0	0
184	4	-	3	4	3	3
184*	-	3	1	1	1	1
185	4	-	4	3	3	3
185*	-	3	1	3	1	1
186	4	4	1	4	2	3
186*	4	4	1	4	2	1
187	1	-	1	4	1	1
187*	-	2	0	1	0	0
188	0	0	0	1	1	0
189*	-	4	4	4	5	4
190	4	-	3	3	1	2
190*	-	3	0	1	1	1
192	0	0	0	0	1	1
193	0	-	1	2	1	1
193*	-	3	0	0	0	0
194	3	-	1	2	1	2
194*	-	2	1	1	0	0
195	2	-	1	1	0	1
195*	-	1	0	0	0	0
196	0	-	1	0	0	0
196*	-	1	0	0	0	0
198	2	-	2	2	3	4
198*	-	2	1	1	1	1
199	0	-	0	2	0	0
199*	-	1	0	0	0	0
200	1	-	1	1	0	0

[0622]

화합물 번호	SETFA	ECHCG	ZEAMX	IPOHE	AMAPA	AMARE
200*	-	1	1	0	0	0
201	2	-	1	2	1	2
201*	-	1	0	0	0	0
202	1	-	1	1	0	0
203	1	-	1	1	0	0
203*	-	1	1	2	1	1
204	4	-	3	3	1	2
204*	-	3	2	2	1	1

[0623]

[0624] * 화합물은 250 g/Ha로 시용됨