



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2013년06월24일
(11) 등록번호 10-1277039
(24) 등록일자 2013년06월13일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
A01N 43/80 (2006.01) A01P 3/00 (2006.01)
(21) 출원번호 10-2007-7003259
(22) 출원일자(국제) 2005년08월10일
심사청구일자 2010년08월03일
(85) 번역문제출일자 2007년02월09일
(65) 공개번호 10-2007-0047778
(43) 공개일자 2007년05월07일
(86) 국제출원번호 PCT/JP2005/014970
(87) 국제공개번호 WO 2006/016708
국제공개일자 2006년02월16일
(30) 우선권주장
JP-P-2004-00235634 2004년08월12일 일본(JP)
JP-P-2005-00178614 2005년06월17일 일본(JP)
(56) 선행기술조사문헌
US04988719 A*
WO2000073290 A1*
EP01256569 A1*
*는 심사관에 의하여 인용된 문헌

(73) 특허권자
이시하라 산교 가부시끼가이샤
일본 오오사카시 니시구에 도보리1쵸메3방15교
(72) 발명자
나카무라, 유지
일본 5250025 시가켄 구사쯔시 니시시부카와 2쵸
메 3-1 이시하라산교 가부시끼가이샤 쥬오 겐꾸쇼
내
미따니, 시게루
일본 5250025 시가켄 구사쯔시 니시시부카와 2쵸
메 3-1 이시하라산교 가부시끼가이샤 쥬오 겐꾸쇼
내
요네다, 데쯔오
일본 5250025 시가켄 구사쯔시 니시시부카와 2쵸
메 3-1 이시하라산교 가부시끼가이샤 쥬오 겐꾸쇼
내
(74) 대리인
위혜숙, 주성민

전체 청구항 수 : 총 12 항

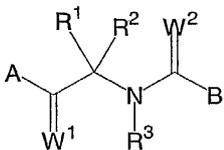
심사관 : 유준석

(54) 발명의 명칭 산 아미드 유도체를 함유하는 살진균성 조성물

(57) 요약

종래부터 제공되고 있는 많은 살진균성 조성물은, 예방 효과와 치료 효과 중 어느 하나가 불충분하거나, 잔효성이 불충분하거나, 또는 사용하는 곳에 따라 식물 병해에 대한 방제 효과가 불충분하다는 등, 실용상 몇 개의 문제점을 갖고 있기 때문에, 이러한 문제점을 극복한 살진균성 조성물이 요구되고 있다. 본 발명은, 화학식 I로 표시되는 산 아미드 유도체 또는 그의 염을 유효 성분으로서 함유하는 살진균성 조성물을 제공한다.

<화학식 I>



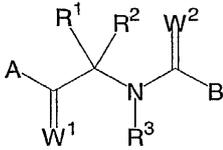
식 중, A는 치환 가능한 페닐, 치환 가능한 벤질, 치환 가능한 나프틸, 치환 가능한 복소환, 치환 가능한 축합 복소환 등이고; B는 치환 가능한 복소환, 치환 가능한 축합 복소환 또는 치환 가능한 나프틸이고; R¹ 및 R²는 각각 독립적으로 알킬 등이고; R³은 수소 원자 등이고; W¹ 및 W²는 각각 독립적으로 산소 원자 또는 황 원자이다.

특허청구의 범위

청구항 1

화학식 I로 표시되는 산 아마이드 유도체 또는 그의 염을 유효 성분으로서 함유하는 살진균성 조성물.

<화학식 I>



식 중,

A가 X로 치환될 수도 있는 페닐, X로 치환될 수도 있는 벤조디옥솔라닐 또는 X로 치환될 수도 있는 벤조디옥사닐이고;

B가 Y로 치환될 수도 있는 푸릴, 또는 Y로 치환될 수도 있는 티에닐이고;

R¹ 및 R²가 각각 알킬이고, 또는 R¹과 R²는 하나가 되어 3 내지 6원 포화 탄소환을 형성할 수도 있고;

X가 불소 원자, 염소 원자, 요오드 원자, 알킬, 할로알킬, 알콕시 또는 할로알콕시이고;

Y가 할로겐, 알킬, 할로알킬, 알콕시 또는 할로알콕시이고;

R³이 수소 원자이고;

W¹ 및 W²가 각각 산소 원자이다.

청구항 2

삭제

청구항 3

삭제

청구항 4

삭제

청구항 5

삭제

청구항 6

삭제

청구항 7

제1항에 있어서, B가 Y로 치환된 푸릴인 살진균성 조성물.

청구항 8

제1항에 있어서, B가 Y로 치환된 티에닐인 살진균성 조성물.

청구항 9

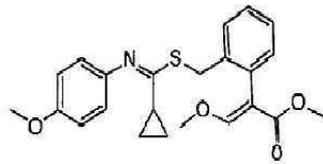
삭제

청구항 10

제1항에 기재된 화학식 I의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염과, 다른 살진균성 유효 성분 화합물을 유효 성분으로서 함유하는 혼합 살진균성 조성물.

청구항 11

제10항에 있어서, 다른 살진균성 유효 성분 화합물이 아닐리노피리미딘계 화합물, 피리딘아민계 화합물, 아졸계 화합물, 퀴놀살린계 화합물, 디티오카르바메이트계 화합물, 유기 염소계 화합물, 이미다졸계 화합물, 시아노아세트아미드계 화합물, 페닐아미드계 화합물, 술펜산계 화합물, 구리계 화합물, 이속사졸계 화합물, 유기 인계 화합물, N-할로게노티오알킬계 화합물, 디카르복시이미드계 화합물, 벤즈아닐리드계 화합물, 아닐리드계 화합물, 피페라진계 화합물, 피리딘계 화합물, 카르비놀계 화합물, 피페리딘계 화합물, 모르폴린계 화합물, 유기 주석계 화합물, 요소계 화합물, 신남산계 화합물, 페닐카르바메이트계 화합물, 시아노피롤계 화합물, 스트로빌루린계 화합물, 옥사졸리디논계 화합물, 티아졸카르복스아미드계 화합물, 실릴아미드계 화합물, 아미노산 아마이드 카르바메이트계 화합물, 이미다졸리딘계 화합물, 히드록시아닐리드계 화합물, 벤젠술폰아미드계 화합물, 옥심 에테르계 화합물, 페녹시아미드계 화합물, 향생 물질, 구아니딘계 화합물, 이소프로티올란, 피로퀼론, 디클로메진, 퀴녹시펜, 프로파모카르브 염산염, 스피록사민, 클로로피크린, 다조메트, 메탐-소듐, 니코비펜, 메트



라페논, 펜티오피라드, 디클로시메트, 프로퀸아지드, 아미술브롬(Amisulbrom), 피리벤카르브 메틸(Pyribencarb methyl) 및 만디프로파미드(Mandipropamid))으로 이루어지는 군으로부터 선택되는 1종 이상인 것을 특징으로 하는 혼합 살진균성 조성물.

청구항 12

제1항에 기재된 화학식 I의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염의 유효량을 사용하는 것을 포함하는, 유해 진균류를 방제하는 방법.

청구항 13

제1항에 기재된 화학식 I의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염의 살진균성 유효량을 사용하는 것을 포함하는, 식물 병해를 방제하는 방법.

청구항 14

제1항에 기재된 화학식 I의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염의 살진균성 유효량을 사용하는 것을 포함하는, 작물을 보호하는 방법.

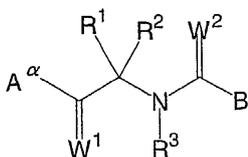
청구항 15

제1항에 기재된 화학식 I의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염의 살진균성 유효량을 사용하는 것을 포함하는, 작물의 수확량을 향상시키는 방법.

청구항 16

화학식 I-a로 표시되는 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

<화학식 I-a>



식 중, A^a는 X^a로 치환될 수도 있는 페닐, X^a로 치환될 수도 있는 벤조디옥솔라닐 또는 X^a로 치환될 수도 있는

벤조디옥사닐이고;

B는 Y로 치환될 수도 있는 푸릴 또는 Y로 치환될 수도 있는 티에틸이고;

X^a는 불소 원자, 염소 원자, 요오드 원자, 알킬, 할로알킬, 알콕시알킬, 알콕시, 또는 할로알콕시이고;

Y는 할로겐, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 또는 할로알콕시이고;

R¹ 및 R²는 각각 독립적으로 알킬이거나, 또는 R¹과 R²는 하나가 되어 3 내지 6원 포화 탄소환을 형성할 수도 있고;

R³은 수소 원자이고;

W¹, 및 W²은 각각 독립적으로 산소 원자이다.

청구항 17

삭제

청구항 18

삭제

청구항 19

삭제

청구항 20

제16항에 있어서, B가 Y로 치환된 푸릴인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

청구항 21

제16항에 있어서, B가 Y로 치환된 티에닐인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

청구항 22

삭제

명세서

기술분야

[0001] 본 발명은 산 아마이드 유도체를 함유하는 살진균성 조성물에 관한 것이다.

배경기술

[0002] W02001/60783 및 W02003/27059에는, 일정한 화학 구조를 갖는 산 아마이드 유도체가 유해 생물 방제제의 유효 성분으로서 유용하다고 기재되어 있다. 그러나, 이들에는 후술하는 화학식 I의 화합물이 살진균 작용을 갖는다는 것에 대해서는 기재되어 있지 않다. 한편, 본 출원인의 일본 특원 제2003-420864에는, 산 아마이드 유도체를 유효 성분으로서 함유하는 살진균성 조성물이 기재되어 있지만, 이것의 유효 성분 화합물은 후술하는 화학식 I의 화합물과는 상이하다.

[0003] 종래부터 제공되고 있는 많은 살진균성 조성물은, 예방 효과와 치료 효과 중 어느 하나가 불충분하거나, 잔효성이 불충분하거나, 또는 사용하는 곳에 따라 식물 병해에 대한 방제 효과가 불충분하다는 등, 실용상 몇 개의 문제점을 갖고 있다. 따라서, 이러한 문제점을 극복한 살진균성 조성물이 요구되고 있다.

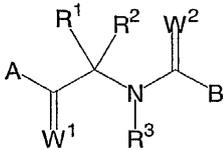
발명의 상세한 설명

[0004] 본 발명자들은, 상술한 문제점을 해결하기 위해 연구한 결과, 후술하는 화학식 I의 산 아마이드 유도체를 함유하는 살진균성 조성물이 다양한 유해 진균류, 예를 들면 난균류, 자낭균류, 담자균류 및 불완전균류에 기인하는

각종 병해에 대하여 우수한 예방 효과 및 치료 효과를 발휘하며, 동시에 실용상 만족할 수 있는 잔효성을 갖는다는 것을 발견하였다. 본 발명은 상기 발견을 기초로 하여 완성되었다.

[0005] 즉 본 발명은, 화학식 I로 표시되는 산 아마이드 유도체 또는 그의 염을 유효 성분으로서 함유하는 살진균성 조성물에 관한 것이다.

화학식 I



[0006]

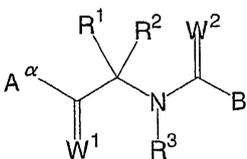
[0007]

식 중, A는 X로 치환될 수도 있는 페닐, X로 치환될 수도 있는 벤질, X로 치환될 수도 있는 나프틸, X로 치환될 수도 있는 복소환, X로 치환될 수도 있는 축합 복소환, 인다닐(인다닐은 할로겐, 알킬 또는 알콕시로 치환될 수도 있음) 또는 테트라히드로나프틸(테트라히드로나프틸은 할로겐, 알킬 또는 알콕시로 치환될 수도 있음)이고; B는 Y로 치환될 수도 있는 복소환(단, 피리딜은 제외함), Y로 치환될 수도 있는 축합 복소환 또는 Y로 치환될 수도 있는 나프틸이고; X는 할로겐, E¹로 치환될 수도 있는 알킬, E¹로 치환될 수도 있는 알케닐, E¹로 치환될 수도 있는 알키닐, 히드록시, 시아노옥시, E¹로 치환될 수도 있는 알콕시, E¹로 치환될 수도 있는 알케닐옥시, E¹로 치환될 수도 있는 알키닐옥시, 머캅토, 시아노티오, E¹로 치환될 수도 있는 알킬티오, E¹로 치환될 수도 있는 알케닐티오, E¹로 치환될 수도 있는 알키닐티오, E²로 치환될 수도 있는 알킬술피닐, E²로 치환될 수도 있는 알킬술포닐, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬옥시, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬티오, 시아노, 니트로, 포르밀, Y로 치환될 수도 있는 페닐, Y로 치환될 수도 있는 페녹시, Y로 치환될 수도 있는 페닐티오, Y로 치환될 수도 있는 페닐알킬, Y로 치환될 수도 있는 페닐알케닐, Y로 치환될 수도 있는 페닐알키닐, Y로 치환될 수도 있는 페닐알킬옥시, Y로 치환될 수도 있는 페닐알케닐옥시, Y로 치환될 수도 있는 페닐알키닐옥시, Y로 치환될 수도 있는 페닐알킬티오, Y로 치환될 수도 있는 페닐알케닐티오, Y로 치환될 수도 있는 페닐알키닐티오, Y로 치환될 수도 있는 페닐아미노, -OR⁴, -SR⁵, -NR^{6,7}, -CO₂R⁸, -C(=O)NR^{8,9}, -SO₂NR^{8,9}, -CH=NR¹⁰ 또는 복소환(복소환은 할로겐, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; Y는 할로겐, E¹로 치환될 수도 있는 알킬, E¹로 치환될 수도 있는 알케닐, E¹로 치환될 수도 있는 알키닐, 히드록시, 시아노옥시, E¹로 치환될 수도 있는 알콕시, E¹로 치환될 수도 있는 알케닐옥시, E¹로 치환될 수도 있는 알키닐옥시, 머캅토, 시아노티오, E¹로 치환될 수도 있는 알킬티오, E¹로 치환될 수도 있는 알케닐티오, E¹로 치환될 수도 있는 알키닐티오, E²로 치환될 수도 있는 알킬술피닐, E²로 치환될 수도 있는 알킬술포닐, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬옥시, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬티오, 시아노, 니트로, 포르밀, -OR⁴, -SR⁵, -NR^{6,7}, -CO₂R⁸, -C(=O)NR^{8,9}, -SO₂NR^{8,9}, -CH=NR¹⁰ 또는 복소환(복소환은 할로겐, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; R¹ 및 R²는 각각 독립적으로 수소 원자, 알킬, 할로알킬, 히드록시알킬, 알콕시알킬, 할로알콕시알킬, 시아노알킬, 알콕시카르보닐알킬, 알케닐, 할로알케닐, 알콕시알케닐, 알키닐, 할로알키닐, 알콕시알키닐, 시클로알킬, 할로시클로알킬, (알킬)시클로알킬, (할로알킬)시클로알킬, 시아노 또는 -CO₂R⁸이거나, 또는 R¹과 R²는 하나가 되어 3 내지 6원 포화 탄소환을 형성할 수도 있고; R³은 수소 원자, E¹로 치환될 수도 있는 알킬, E¹로 치환될 수도 있는 알케닐, E¹로 치환될 수도 있는 알키닐, 히드록시, 시아노옥시, E¹로 치환될 수도 있는 알콕시, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬옥시, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬티오, 시아노, 포르밀, -C(=W³)R¹¹, -C(=W³)OR¹², -C(=W³)SR¹², -C(=W³)NR^{12,13}, -S(O)mR¹² 또는 -S(O)nNR^{12,13}이고; R⁴는 -C(=W³)R¹², -C(=W³)OR¹², -C(=W³)SR¹², -C(=W³)NR^{12,13}, -S(O)mR¹², -S(O)nNR^{12,13} 또는 복소환(복소환은 할로겐, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; R⁵는 -C(=W³)R¹², -C(=W³)OR¹²,

$-C(=W^3)SR^{12}$, $-C(=W^3)NR^{12}R^{13}$ 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; R^6 은 수소 원자, 알킬, 할로알킬, 알콕시알킬, 할로알콕시알킬, 시아노알킬, (시클로알킬)알킬, 시클로알킬, 시아노, $-C(=W^3)R^{12}$, $-C(=W^3)OR^{12}$, $-C(=W^3)SR^{12}$, $-C(=W^3)NR^{12}R^{13}$, $-S(O)mR^{12}$, $-S(O)nNR^{12}R^{13}$ 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; R^7 은 수소 원자, 알킬, 할로알킬, 알콕시알킬 또는 할로알콕시알킬이고; R^8 및 R^9 는 각각 독립적으로 수소 원자, 알킬, 할로알킬, 알콕시알킬 또는 할로알콕시알킬이고, 인접하는 R^8 과 R^9 는 하나가 되어 환을 형성할 수도 있고; R^{10} 은 알킬(알킬은 할로젠, 알콕시 또는 할로알콕시로 치환될 수도 있음), 알콕시(알콕시는 할로젠, 알콕시 또는 할로알콕시로 치환될 수도 있음), 알케닐옥시(알케닐옥시는 할로젠, 알콕시 또는 할로알콕시로 치환될 수도 있음), 알키닐옥시(알키닐옥시는 할로젠, 알콕시 또는 할로알콕시로 치환될 수도 있음) 또는 알콕시카르보닐(알콕시카르보닐은 할로젠, 알콕시 또는 할로알콕시로 치환될 수도 있음)이고; R^{11} 은 수소 원자, E^3 으로 치환될 수도 있는 알킬, 페닐(페닐은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음) 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; R^{12} 및 R^{13} 은 각각 독립적으로 E^3 으로 치환될 수도 있는 알킬, 알콕시, 할로알콕시, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬 또는 페닐(페닐은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고, 인접하는 R^{12} 와 R^{13} 은 하나가 되어 환을 형성할 수도 있고; W^1 , W^2 및 W^3 은 각각 독립적으로 산소 원자 또는 황 원자이고; m 및 n은 각각 독립적으로 0 내지 2의 정수이고; E^1 은 할로젠, 히드록시, 알콕시, 할로알콕시, 머캄토, 알킬티오, 할로알킬티오, 알킬술포닐, 시클로알킬, 아미노, 모노알킬아미노, 디알킬아미노, 시아노, 니트로, 히드록시카르보닐, 알콕시카르보닐, 알킬카르보닐옥시, 트리알킬실릴 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; E^2 는 할로젠, 히드록시, 알콕시, 할로알콕시, 시클로알킬, 아미노, 모노알킬아미노, 디알킬아미노, 시아노, 니트로, 히드록시카르보닐, 알콕시카르보닐, 트리알킬실릴 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; E^3 은 할로젠, 알콕시, 알킬티오, 아미노, 모노알킬아미노, 디알킬아미노, 시클로알킬, 시아노, 알콕시카르보닐, 할로알콕시, 할로알킬티오 또는 페닐(페닐은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; J는 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시 또는 할로알콕시이다.

[0008] 또한, 본 발명은, 상기 산 아마이드 유도체 또는 그의 염의 유효량을 사용하여 다양한 유해 진균류 또는 다양한 유해 진균류에 기인하는 각종 병해를 방제하는 방법, 상기 산 아마이드 유도체 또는 그의 염의 유효량을 사용하여 작물을 보호하거나, 작물의 수확량을 향상시키는 방법에 관한 것이다. 또한, 본 발명은, 종래 구체적으로 알려져 있지 않은 화학식 I-a로 표시되는 산 아마이드 유도체 또는 그의 염에 관한 것이다.

[0009] [화학식 I-a]



[0010]

[0011] A^a 는 X^a 로 치환될 수도 있는 페닐, X^a 로 치환된 나프틸, X^a 로 치환된 티에닐, X^a 로 치환될 수도 있는 벤조디옥솔라닐 또는 X^a 로 치환될 수도 있는 벤조디옥사닐이고; B는 Y로 치환될 수도 있는 복소환(단, 피리딜은 제외함), Y로 치환될 수도 있는 축합 복소환 또는 Y로 치환될 수도 있는 나프틸이고; X^a 는 불소 원자, 염소 원자, 요오드 원자, 알킬, 할로알킬, 알콕시알킬, 디알킬아미노알킬, 알키닐, 트리알킬실릴알키닐, 히드록시, 알콕시, 할로알콕시, 알콕시알콕시, 시클로알킬, 니트로, 페닐, 페닐알키닐, 할로알킬로 치환될 수도 있는 피리딜옥시, 알킬카르보닐옥시, 알킬술포닐옥시 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; Y는 할로젠, E^1 로 치환될 수도 있는 알킬, E^1 로 치환될 수도 있는 알케닐, E^1 로 치환될 수도 있는 알키

닐, 히드록시, 시아노옥시, E¹로 치환될 수도 있는 알콕시, E¹로 치환될 수도 있는 알케닐옥시, E¹로 치환될 수도 있는 알킬닐옥시, 머캅토, 시아노티오, E¹로 치환될 수도 있는 알킬티오, E¹로 치환될 수도 있는 알케닐티오, E¹로 치환될 수도 있는 알킬닐티오, E²로 치환될 수도 있는 알킬술폰닐, E²로 치환될 수도 있는 알킬술폰닐, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬옥시, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬티오, 시아노, 니트로, 포르밀, -OR⁴, -SR⁵, -NR^{6,7}, -CO₂R⁸, -C(=O)NR^{8,9}, -SO₂NR^{8,9}, -CH=NR¹⁰ 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; R¹ 및 R²는 각각 독립적으로 수소 원자, 알킬, 할로알킬, 히드록시알킬, 알콕시알킬, 할로알콕시알킬, 시아노알킬, 알콕시카르보닐알킬, 알케닐, 할로알케닐, 알콕시알케닐, 알키닐, 할로알키닐, 알콕시알키닐, 시클로알킬, 할로시클로알킬, (알킬)시클로알킬, (할로알킬)시클로알킬, 시아노 또는 -CO₂R⁸이거나, 또는 R¹과 R²는 하나가 되어 3 내지 6원 포화 탄소환을 형성할 수도 있고; R³은 수소 원자, E¹로 치환될 수도 있는 알킬, E¹로 치환될 수도 있는 알케닐, E¹로 치환될 수도 있는 알키닐, 히드록시, 시아노옥시, E¹로 치환될 수도 있는 알콕시, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬옥시, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬티오, 시아노, 포르밀, -C(=W³)R¹¹, -C(=W³)OR¹², -C(=W³)SR¹², -C(=W³)NR^{12,13}, -S(O)mR¹² 또는 -S(O)nNR^{12,13}이고; R⁴는 -C(=W³)R¹², -C(=W³)OR¹², -C(=W³)SR¹², -C(=W³)NR^{12,13}, -S(O)mR¹², -S(O)nNR^{12,13} 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; R⁵는 -C(=W³)R¹², -C(=W³)OR¹², -C(=W³)SR¹², -C(=W³)NR^{12,13} 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; R⁶은 수소 원자, 알킬, 할로알킬, 알콕시알킬, 할로알콕시알킬, 시아노알킬, (시클로알킬)알킬, 시클로알킬, 시아노, -C(=W³)R¹², -C(=W³)OR¹², -C(=W³)SR¹², -C(=W³)NR^{12,13}, -S(O)mR¹², -S(O)nNR^{12,13} 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; R⁷은 수소 원자, 알킬, 할로알킬, 알콕시알킬 또는 할로알콕시알킬이고; R⁸ 및 R⁹는 각각 독립적으로 수소 원자, 알킬, 할로알킬, 알콕시알킬 또는 할로알콕시알킬이고, 인접하는 R⁸과 R⁹는 하나가 되어 환을 형성할 수도 있고; R¹⁰은 알킬(알킬은 할로젠, 알콕시 또는 할로알콕시로 치환될 수도 있음), 알콕시(알콕시는 할로젠, 알콕시 또는 할로알콕시로 치환될 수도 있음), 알케닐옥시(알케닐옥시는 할로젠, 알콕시 또는 할로알콕시로 치환될 수도 있음), 알키닐옥시(알키닐옥시는 할로젠, 알콕시 또는 할로알콕시로 치환될 수도 있음) 또는 알콕시카르보닐(알콕시카르보닐은 할로젠, 알콕시 또는 할로알콕시로 치환될 수도 있음)이고; R¹¹은 수소 원자, E³로 치환될 수도 있는 알킬, 페닐(페닐은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음) 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; R¹² 및 R¹³은 각각 독립적으로 E³로 치환될 수도 있는 알킬, 알콕시, 할로알콕시, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬 또는 페닐(페닐은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고, 인접하는 R¹²와 R¹³은 하나가 되어 환을 형성할 수도 있고; W¹, W² 및 W³은 각각 독립적으로 산소 원자 또는 황 원자이고; m 및 n은 각각 독립적으로 0 내지 2의 정수이고; E¹은 할로젠, 히드록시, 알콕시, 할로알콕시, 머캅토, 알킬티오, 할로알킬티오, 알킬술폰닐, 시클로알킬, 아미노, 모노알킬아미노, 디알킬아미노, 시아노, 니트로, 히드록시카르보닐, 알콕시카르보닐, 알킬카르보닐옥시, 트리알킬실릴 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; E²는 할로젠, 히드록시, 알콕시, 할로알콕시, 시클로알킬, 아미노, 모노알킬아미노, 디알킬아미노, 시아노, 니트로, 히드록시카르보닐, 알콕시카르보닐, 트리알킬실릴 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; E³은 할로젠, 알콕시, 알킬티오, 아미노, 모노알킬아미노, 디알킬아미노, 시클로알킬, 시아노, 알콕시카르보닐, 할로알콕시, 할로알킬티오 또는 페닐(페닐은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; J는 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시 또는 할로알콕시이다.

[0012] 상기 화학식 I 중, A에 포함되는 치환기로서의 X의 치환수는 1 이상일 수 있고, 2 이상인 경우, 이들 치환기는

동일하거나 상이할 수 있다. A에 포함되는 인다닐 또는 테트라히드로나프틸의 치환기인 할로젠, 알킬 또는 알콕시의 치환수는 1 이상일 수 있고, 2 이상인 경우, 이들 치환기는 동일하거나 상이할 수 있다. B 또는 X에 포함되는 치환기로서의 Y의 치환수는 1 이상일 수 있고, 2 이상인 경우, 이들 치환기는 동일하거나 상이할 수 있다. X, Y, R³, R¹¹, R¹² 또는 R¹³에 포함되는 치환기로서의 E¹, E² 또는 E³의 치환수는 1 이상일 수 있고, 2 이상인 경우, 이들 치환기는 동일하거나 상이할 수 있다. X, Y, R³, R¹² 또는 R¹³에 포함되는 치환기로서의 J의 치환수는 1 이상일 수 있고, 2 이상인 경우, 이들 치환기는 동일하거나 상이할 수 있다. X, Y, R⁴, R⁵, R⁶, R¹¹, R¹², R¹³, E¹, E² 또는 E³에 포함되는 페닐 또는 복소환의 치환기인 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시 또는 알킬카르보닐의 치환수는 1 이상일 수 있고, 2 이상인 경우, 이들 치환기는 동일하거나 상이할 수 있다. R¹⁰에 포함되는 알킬, 알콕시, 알케닐옥시, 알키닐옥시 또는 알콕시카르보닐의 치환기인 할로젠, 알콕시 또는 할로알콕시의 치환수는 1 이상일 수 있고, 2 이상인 경우, 이들 치환기는 동일하거나 상이할 수 있다.

[0013] A, B, X, Y, R⁴, R⁵, R⁶, R¹¹, E¹ 또는 E² 중의 복소환으로서 0, S 및 N으로 이루어지는 군으로부터 선택된 1종 이상의 원자를 1 내지 4개 함유하는 3, 5 또는 6원 복소환이 바람직하고, 예를 들면 옥시라닐과 같은 3원 복소환; 푸릴, 테트라히드로푸릴, 티에닐, 피롤릴, 피롤리닐, 피롤리디닐, 디옥솔라닐, 옥사졸릴, 이속사졸릴, 티아졸릴, 이소티아졸릴, 이미다졸릴, 이미다졸리닐, 이미다졸리디닐, 피라졸릴, 피라졸리닐, 피라졸리디닐, 트리아졸릴, 옥사디아졸릴, 티아디아졸릴 및 테트라졸릴 등의 5원 복소환; 피라닐, 피리디닐, 피페리디닐, 디옥사닐, 옥사지닐, 모르폴리닐, 티아지닐, 피리다지닐, 피리미디닐, 피라지닐, 피페라지닐 및 트리아지닐 등의 6원 복소환을 들 수 있다.

[0014] A 또는 B 중의 축합 복소환으로서 0, S 및 N으로 이루어지는 군으로부터 선택된 1종 이상의 원자를 1 내지 4개 함유하는 8 내지 10원 축합 복소환, 예를 들면 벤조푸라닐, 이소벤조푸라닐, 디히드로벤조푸라닐, 디히드로이소벤조푸라닐, 벤조티에닐, 이소벤조티에닐, 디히드로벤조티에닐, 디히드로이소벤조티에닐, 테트라히드로벤조티에닐, 인돌릴, 이소인돌릴, 벤조옥사졸릴, 벤조티아졸릴, 인다졸릴, 벤즈이미다졸릴, 벤조디옥솔라닐, 벤조디옥사닐, 크로메닐, 크로마닐, 이소크로마닐, 크로모닐, 크로마노닐, 퀴놀릴, 이소퀴놀릴, 신놀리닐, 프탈라지닐, 퀴나졸리닐, 퀴녹살리닐, 인돌리지닐, 퀴놀리디닐, 이미다조피리디닐, 나프틸리디닐, 프테릴디닐, 디히드로벤조옥사지닐, 디히드로벤조옥사졸리노닐, 디히드로벤조옥사디노닐 및 벤조티옥사닐 등을 들 수 있다.

[0015] A, X, Y, R¹ 내지 R³, R⁶ 내지 R¹³, E¹ 내지 E³ 또는 J 중의 알킬 또는 알킬 부분은, 직쇄상 또는 분지상 중 어느 하나일 수 있고, 그의 구체예로서는 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 부틸, tert-부틸, 헥실 및 헵틸과 같은 C₁₋₇인 것 등을 들 수 있다.

[0016] X, Y, R¹ 내지 R³, R⁶, R¹², R¹³ 또는 E¹ 내지 E³ 중의 시클로알킬 또는 시클로알킬 부분으로서, 탄소수 3 내지 6인 것, 예를 들면 시클로프로필, 시클로펜틸 및 시클로헥실 등을 들 수 있다. 또한, R¹과 R²가 하나가 되어 형성되는 3 내지 6원 포화 탄소환의 구체예로서는, 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸 및 시클로헥실을 들 수 있다.

[0017] X, Y, R¹ 내지 R³ 또는 R¹⁰ 중의 알케닐 또는 알케닐 부분으로서, 탄소수 2 내지 7의 직쇄 또는 분지상인 것, 예를 들면 비닐, 1-프로페닐, 알릴, 이소프로페닐, 1-부테닐, 1,3-부타디에닐, 1-헥세닐 및 1-헵테닐 등을 들 수 있다. 또한, X, Y, R¹ 내지 R³ 또는 R¹⁰ 중의 알키닐 또는 알키닐 부분으로서, 탄소수 2 내지 7의 직쇄 또는 분지상인 것, 예를 들면 에티닐, 2-부티닐, 2-펜티닐, 3-헥시닐 및 4-디메틸-2-펜티닐 등을 들 수 있다.

[0018] A, X, Y, R¹ 내지 R¹³, E¹ 내지 E³ 또는 J 중의 할로젠 또는 치환기로서의 할로겐으로서, 불소, 염소, 브롬 또는 요오드의 각 원자를 들 수 있다. 치환기로서의 할로겐의 수는 1 이상일 수 있고, 2 이상인 경우, 각 할로겐은 동일하거나 상이할 수 있다. 또한, 할로겐의 치환 위치는 어떠한 위치여도 상관없다.

[0019] 상기 화학식 I-a 중의 치환기 A^a 또는 X^a의 정의는, 각각 상기 화학식 I 중의 치환기 A 또는 X의 정의에 준한다.

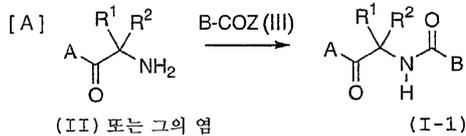
[0020] 상기 화학식 I 또는 I-a의 산 아마이드 유도체의 염으로서, 농업상 허용되는 것이면 모든 것이 포함되지만, 예를 들면 나트륨염 및 칼륨염과 같은 알칼리 금속염; 마그네슘염 및 칼슘염과 같은 알칼리 토류 금속염; 염산염,

과염소산염, 황산염 및 질산염과 같은 무기산염; 아세트산염 및 메탄술포산염과 같은 유기산염 등을 들 수 있다.

[0021] 상기 화학식 I 또는 I-a의 산 아마이드 유도체에는 각종 이성체, 예를 들면 광학 이성체 및 기하 이성체 등이 존재하지만, 본 발명에는 각 이성체 및 이성체 혼합물 모두 포함된다. 또한, 본 발명에는, 해당 기술 분야에서의 기술 상식의 범위 내에서, 상기한 것 이외의 각종 이성체도 포함된다. 또한, 이성체의 종류에 따라 상기 화학식 I 또는 I-a와는 상이한 화학 구조가 되는 경우가 있지만, 당업자이면 이들이 이성체의 관계에 있다는 것을 충분히 인식할 수 있기 때문에, 본 발명의 범위 내인 것은 분명하다.

[0022] 상기 화학식 I 또는 I-a의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염은, 이하의 반응 [A] 내지 [K], [U] 내지 [W] 및, 통상적인 염의 제조 방법에 따라 제조할 수 있다.

반응(A)



[0023]

[0024] 반응 [A] 중, A, B, R¹ 및 R²는 상술한 바와 같고, Z는 히드록시, 알콕시 또는 할로젠이며, 할로젠으로서는 불소, 염소, 브롬 또는 요오드의 각 원자를 들 수 있다.

[0025] 반응 [A]는, 통상적으로 염기 및 용매의 존재하에 행할 수 있다.

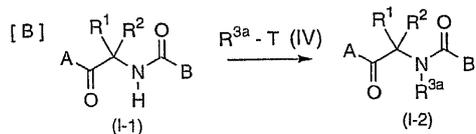
[0026] 염기는, 예를 들면 나트륨 및 칼륨과 같은 알칼리 금속; 나트륨메톡사이드, 나트륨에톡사이드 및 칼륨 제3급 부톡사이드와 같은 알칼리 금속 알콕사이드; 탄산나트륨 및 탄산칼륨과 같은 탄산염; 중탄산나트륨 및 중탄산칼륨과 같은 중탄산염; 수산화나트륨 및 수산화칼륨과 같은 금속 수산화물; 수소화나트륨 및 수소화칼륨과 같은 금속 수소화물; 모노메틸아민, 디메틸아민 및 트리에틸아민과 같은 아민류; 피리딘 및 4-디메틸아미노피리딘과 같은 피리딘류; 메틸리튬, n-부틸리튬 및 리튬디소프로필아미드와 같은 유기 리튬 화합물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다. 염기는 화학식 II의 화합물에 대하여 1 내지 3배몰, 바람직하게는 1 내지 2배몰 사용할 수 있다.

[0027] 용매는 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 염화메틸, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술포사이드, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈, 피리딘, 아세토니트릴 및 프로피오니트릴과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0028] 반응 [A]는, 필요에 따라 탈수 촉합제의 존재하에 행할 수 있다. 상기 탈수 촉합제로서는 N,N'-디시클로헥실 카르보디이미드, 클로로술포닐이소시아네이트, N,N'-카르보닐디이미다졸 및 트리플루오로아세트산 무수물 등을 들 수 있다.

[0029] 반응 [A]는, 통상적으로 0 내지 100 °C, 바람직하게는 0 내지 50 °C에서 행할 수 있으며, 반응 시간은 통상적으로 0.5 내지 48 시간, 바람직하게는 1 내지 24 시간이다.

반응(B)



[0030]

[0031] 반응 [B] 중, A, B, R¹ 및 R²는 상술한 바와 같고, R^{3a}는 E¹로 치환될 수도 있는 알킬, E¹로 치환될 수도 있는 알케닐, E¹로 치환될 수도 있는 알킬닐, 히드록시, 시아노옥시, E¹로 치환될 수도 있는 알콕시, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬옥시, J로 치환될 수도 있는 시클로알킬티오, 시아노, 포르밀, -C(=W³)R¹¹, -C(=W³)OR¹², -C(=W³)SR¹², -C(=W³)NR¹²R¹³, -S(O)mR¹² 또는 -S(O)nNR¹²R¹³ (E¹, J, R¹¹, R¹², R¹³, W³,

m 및 n은 상술한 바와 같음)이고, T는 할로젠이고, 할로젠으로서는 불소, 염소, 브롬 또는 요오드의 각 원자를 들 수 있다.

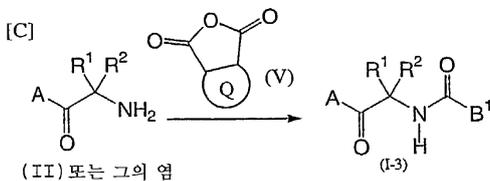
[0032] 반응 [B]는, 통상적으로 염기 및 용매의 존재하에 행할 수 있다.

[0033] 염기는, 예를 들면 나트륨 및 칼륨과 같은 알칼리 금속; 나트륨메톡사이드, 나트륨에톡사이드 및 칼륨 제3급 부톡사이드와 같은 알칼리 금속 알콕사이드; 탄산나트륨 및 탄산칼륨과 같은 탄산염; 중탄산나트륨 및 중탄산칼륨과 같은 중탄산염; 수산화나트륨 및 수산화칼륨과 같은 금속 수산화물; 수소화나트륨 및 수소화칼륨과 같은 금속 수소화물; 모노메틸아민, 디메틸아민 및 트리에틸아민과 같은 아민류; 피리딘 및 4-디메틸아미노피리딘과 같은 피리딘류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택한다. 염기는 화학식 I-1의 화합물에 대하여 1 내지 3배몰, 바람직하게는 1 내지 1.5배몰 사용할 수 있다.

[0034] 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 염화메틸, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술폭사이드, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈 및 피리딘과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세토니트릴, 프로피오니트릴 및 아크릴로니트릴과 같은 니트릴류; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0035] 반응 [B]는, 통상적으로 0 내지 100 °C, 바람직하게는 0 내지 50 °C에서 행할 수 있으며, 반응 시간은 통상적으로 1 내지 300 시간, 바람직하게는 1 내지 150 시간이다.

반응 (C)



[0036]

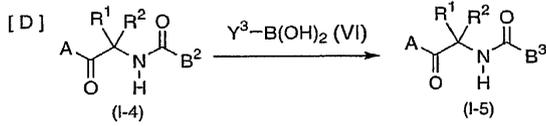
[0037] 반응 [C] 중, A, R¹ 및 R²는 상술한 바와 같고, B¹은 -CO₂H로 치환된 복소환 또는 -CO₂H로 치환된 축합 복소환이다. 화학식 V는 Q(페닐, 복소환 또는 축합 복소환)의 디카르복실산 무수물이다.

[0038] 반응 [C]는, 통상적으로 용매의 존재하에 행할 수 있다. 상기 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 염화메틸, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술폭사이드, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈 및 피리딘과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세토니트릴, 프로피오니트릴 및 아크릴로니트릴과 같은 니트릴류; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류; 메탄올, 에탄올, 프로판올 및 tert-부탄올과 같은 알코올류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0039] 반응 [C]는, 필요에 따라 염기의 존재하에 행할 수 있다. 상기 염기로서는, 예를 들면 나트륨 및 칼륨과 같은 알칼리 금속; 나트륨메톡사이드, 나트륨에톡사이드 및 칼륨 제3급 부톡사이드와 같은 알칼리 금속 알콕사이드; 탄산나트륨 및 탄산칼륨과 같은 탄산염; 중탄산나트륨 및 중탄산칼륨과 같은 중탄산염; 수산화나트륨 및 수산화칼륨과 같은 금속 수산화물; 수소화나트륨 및 수소화칼륨과 같은 금속 수소화물; 모노메틸아민, 디메틸아민 및 트리에틸아민과 같은 아민류; 피리딘 및 4-디메틸아미노피리딘과 같은 피리딘류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다. 염기는 화학식 II의 화합물에 대하여 1 내지 3배몰, 바람직하게는 1 내지 1.5배몰 사용할 수 있다.

[0040] 반응 [C]는 통상적으로 0 내지 150 °C, 바람직하게는 0 내지 80 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.5 내지 96 시간, 바람직하게는 1 내지 48 시간이다.

반응 D



[0041]

[0042] 반응 [D] 중, A, R¹ 및 R²는 상술한 바와 같고, B²는 Y²로 치환된 축합 복소환이고, B³은 Y³으로 치환된 복소환 또는 Y³으로 치환된 축합 복소환이고, Y²는 염소, 브롬 또는 요오드의 각 원자이고, Y³은 복소환(복소환은 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시 또는 할로알콕시로 치환될 수도 있음)이다.

[0043] 반응 [D]는 통상적으로 촉매, 염기, 용매 및 불활성 가스의 존재하에 행할 수 있다.

[0044] 촉매는, 예를 들면 테트라키스(트리페닐포스핀)팔라듐(0), 비스(디벤질리텐아세톤)팔라듐(0) 및 트리스(디벤질리텐아세톤)디팔라듐(0)과 같은 팔라듐 착체 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

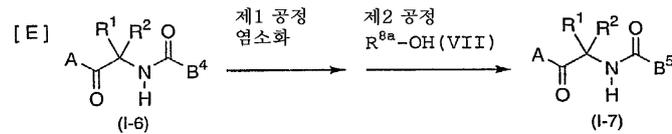
[0045] 염기는 예를 들면 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산칼슘과 같은 탄산염; 중탄산나트륨 및 중탄산칼륨과 같은 중탄산염; 수산화나트륨 및 수산화칼륨과 같은 금속 수산화물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다. 염기는 화학식 I-4의 화합물에 대하여 1 내지 20배몰, 바람직하게는 1 내지 10배몰 사용할 수 있다.

[0046] 용매는 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 염화메틸, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술폰, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈 및 피리딘과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세토니트릴, 프로피오니트릴 및 아크릴로니트릴과 같은 니트릴류; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류; 메탄올, 에탄올, 프로판올 및 tert-부탄올과 같은 알코올류; 물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0047] 불활성 가스는, 예를 들면 질소 가스 및 아르곤 가스 등을 사용할 수 있다.

[0048] 반응 [D]는 통상적으로 0 내지 150 °C, 바람직하게는 15 내지 100 °C에서 행할 수 있으며, 반응 시간은 통상적으로 0.5 내지 96 시간, 바람직하게는 1 내지 48 시간이다.

반응 E



[0049]

[0050] 반응 [E] 중, A, R¹ 및 R²는 상술한 바와 같고, B⁴는 -CO₂H로 치환된 복소환 또는 -CO₂H로 치환된 축합 복소환이고, B⁵는 -CO₂R^{8a}로 치환된 복소환 또는 -CO₂R^{8a}로 치환된 축합 복소환기이고, R^{8a}는 알킬, 할로알킬, 알콕시알킬 또는 할로알콕시알킬이다.

[0051] 반응 [E] 중의 제1 공정은, 염소화제의 존재하에 행할 수 있다. 상기 염소화제로서는, 예를 들면 염화티오닐, 염화옥살릴 및 오염화인 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0052] 반응 [E] 중의 제1 공정은, 필요에 따라 용매의 존재하에 행할 수 있다. 상기 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 염화메틸, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0053] 반응 [E] 중의 제1 공정의 반응은 통상적으로 0 내지 200 °C, 바람직하게는 15 내지 150 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 72 시간, 바람직하게는 0.5 내지 3 시간이다.

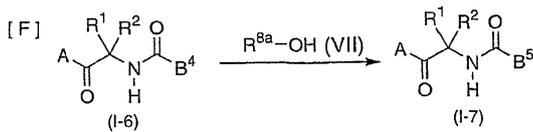
[0054] 반응 [E] 중의 제2 공정은, 필요에 따라 염기의 존재하에 행할 수 있다. 상기 염기는, 예를 들면 나트륨 및 칼륨과 같은 알칼리 금속; 나트륨메톡사이드, 나트륨에톡사이드 및 칼륨 제3급 부톡사이드와 같은 알칼리 금속 알콕사이드; 탄산나트륨 및 탄산칼륨과 같은 탄산염; 중탄산나트륨 및 중탄산칼륨과 같은 중탄산염; 수산화나트륨

및 수산화칼륨과 같은 금속 수산화물; 수소화나트륨 및 수소화칼륨과 같은 금속 수소화물; 모노메틸아민, 디메틸아민 및 트리에틸아민과 같은 아민류; 피리딘 및 4-디메틸아미노피리딘과 같은 피리딘류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다. 염기는 화학식 I-6의 화합물에 대하여 1 내지 5배물, 바람직하게는 1 내지 2배물 사용할 수 있다.

[0055] 반응 [E] 중의 제2 공정은, 필요에 따라 용매의 존재하에 행할 수 있다. 상기 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 염화메틸, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술폭사이드, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈 및 피리딘과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세토니트릴, 프로피오니트릴 및 아크릴로니트릴과 같은 니트릴류; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다. 또한, 이 반응에서는, 화학식 VII의 화합물을 대량으로 사용함으로써 용매를 겸할 수 있다.

[0056] 반응 [E] 중의 제2 공정의 반응은 통상적으로 0 내지 100 °C, 바람직하게는 0 내지 50 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 48 시간, 바람직하게는 0.5 내지 6 시간이다.

반응 F



[0057]

[0058] 반응 [F] 중, A, B⁴, B⁵, R¹, R² 및 R^{8a}는 상술한 바와 같다.

[0059] 반응 [F]는, 통상적으로 용매 또는 탈수 촉합제의 존재하에 행할 수 있다.

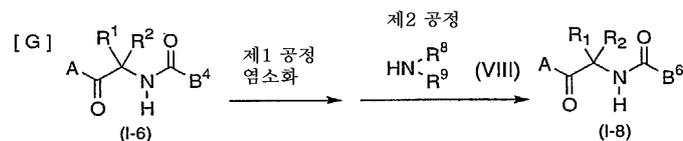
[0060] 촉매는, 예를 들면 염산 및 황산과 같은 무기산; 파라톨루엔술폰산과 같은 유기산; 3불화 붕소에테레이트와 같은 루이스산 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0061] 탈수 촉합제는 N,N'-디시클로헥실카르보디이미드, 클로로술폴로닐이소시아네이트, N,N'-카르보닐디이미다졸 및 트리플루오로아세트산 무수물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0062] 반응 [F]는, 필요에 따라 용매의 존재하에 행할 수 있다. 상기 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 염화메틸, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술폭사이드, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈 및 피리딘과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세토니트릴, 프로피오니트릴 및 아크릴로니트릴과 같은 니트릴류; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류; 메탄올, 에탄올, 프로판올 및 tert-부탄올과 같은 알코올류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다. 또한, 이 반응에서는, 화학식 VII의 화합물을 대량으로 사용함으로써 용매를 겸할 수 있다.

[0063] 반응 [F]는 통상적으로 0 내지 200 °C, 바람직하게는 0 내지 100 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 96 시간, 바람직하게는 0.5 내지 24 시간이다.

반응 G



[0064]

[0065] 반응 [G] 중, A, B⁴, R¹, R², R⁸ 및 R⁹는 상술한 바와 같고, B⁶은 -CONR⁸R⁹로 치환된 복소환 또는 -CONR⁸R⁹로 치환된 축합 복소환기(R⁸ 및 R⁹는 상술한 바와 같음)이다.

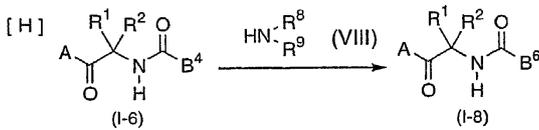
[0066] 반응 [G] 중의 제1 공정은, 상기 반응 [E]의 제1 공정에 준하여 행할 수 있다.

[0067] 반응 [G] 중의 제2 공정은, 필요에 따라 염기의 존재하에 행할 수 있다. 상기 염기는, 예를 들면 나트륨 및 칼륨과 같은 알칼리 금속; 나트륨메톡사이드, 나트륨에톡사이드 및 칼륨 제3급 부톡사이드와 같은 알칼리 금속 알콕사이드; 탄산나트륨 및 탄산칼륨과 같은 탄산염; 중탄산나트륨 및 중탄산칼륨과 같은 중탄산염; 수산화나트륨 및 수산화칼륨과 같은 금속 수산화물; 수소화나트륨 및 수소화칼륨과 같은 금속 수소화물; 모노메틸아민, 디메틸아민 및 트리메틸아민과 같은 아민류; 피리딘 및 4-디메틸아미노피리딘과 같은 피리딘류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다. 염기는 화학식 I-6의 화합물에 대하여 1 내지 10배몰, 바람직하게는 1 내지 2배몰 사용할 수 있다.

[0068] 반응 [G] 중의 제2 공정은, 필요에 따라 용매의 존재하에 행할 수 있다. 상기 용매는 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 염화메틸, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술폰, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈 및 피리딘과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세토니트릴, 프로피오니트릴 및 아크릴로니트릴과 같은 니트릴류; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류; 물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0069] 반응 [G] 중의 제2 공정의 반응은 통상적으로 0 내지 100 °C, 바람직하게는 0 내지 50 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 48 시간, 바람직하게는 0.5 내지 6 시간이다.

반응 H



[0070]

[0071] 반응 [H] 중, A, B⁴, B⁶, R¹, R², R⁸ 및 R⁹는 상술한 바와 같다.

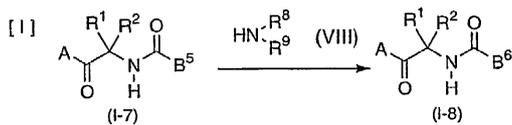
[0072] 반응 [H]는, 통상적으로 탈수 촉합제 및 용매의 존재하에 행할 수 있다.

[0073] 탈수 촉합제는 N,N'-디시클로헥실카르보디이미드, 클로로술폰일소시아네이트, N,N'-카르보닐디이미다졸 및 트리플루오로아세트산 무수물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0074] 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 염화메틸, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술폰, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈 및 피리딘과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세토니트릴, 프로피오니트릴 및 아크릴로니트릴과 같은 니트릴류; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0075] 반응 [H]는 통상적으로 0 내지 200 °C, 바람직하게는 0 내지 100 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 96 시간, 바람직하게는 0.5 내지 24 시간이다.

반응 I



[0076]

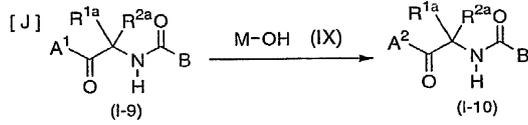
[0077] 반응 [I] 중, A, B⁵, B⁶, R¹, R², R⁸ 및 R⁹는 상술한 바와 같다.

[0078] 반응 [I]는, 통상적으로 용매의 존재하에 행할 수 있다. 상기 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없고, 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 염화메틸, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술폰, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈 및 피리딘과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세토니트릴, 프로피오니트릴 및 아크릴로니트릴과 같은 니트릴류; 아세톤 및

메틸에틸케톤과 같은 케톤류; 메탄올, 에탄올, 프로판올 및 tert-부탄올과 같은 알코올류; 물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택한다. 또한, 이 반응에서는, 화학식 VIII의 화합물을 대량으로 사용함으로써 용매를 검할 수 있다.

[0079] 반응 [I]는 통상적으로 0 내지 150 °C, 바람직하게는 0 내지 80 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 48 시간, 바람직하게는 0.5 내지 24 시간이다.

반응 J



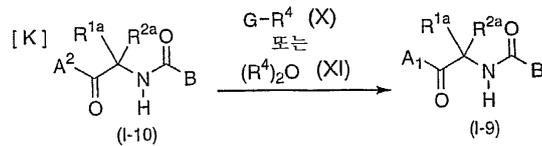
[0080]

[0081] 반응 [J] 중, B는 상술한 바와 같고, A¹은 -OR⁴로 치환된 페닐, -OR⁴로 치환된 벤질, -OR⁴로 치환된 나프틸, -OR⁴로 치환된 복소환 또는 -OR⁴로 치환된 축합 복소환(R⁴는 상술한 바와 같음)이고, A²는 -OH로 치환된 페닐, -OH로 치환된 벤질, -OH로 치환된 나프틸, -OH로 치환된 복소환 또는 -OH로 치환된 축합 복소환이고, R^{1a} 및 R^{2a}는 각각 알킬, 할로알킬, 히드록시알킬, 알콕시알킬, 할로알콕시알킬, 시아노알킬, 알콕시카르보닐알킬, 알케닐, 할로알케닐, 알콕시알케닐, 알키닐, 할로알키닐, 알콕시알키닐, 시클로알킬, 할로시클로알킬, (알킬)시클로알킬, (할로알킬)시클로알킬 또는 시아노이고, R^{1a}와 R^{2a}는 하나가 되어 3 내지 6원 포화 탄소환을 형성할 수도 있고, M은 나트륨 또는 칼륨이다.

[0082] 반응 [J]는, 통상적으로 용매의 존재하에 행할 수 있다. 상기 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 염화메틸, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 디메틸술폭시드, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈 및 피리딘과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세트니트릴, 프로피오니트릴 및 아크릴로니트릴과 같은 니트릴류; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류; 메탄올, 에탄올, 프로판올 및 tert-부탄올과 같은 알코올류; 물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0083] 반응 [J]는 통상적으로 0 내지 100 °C, 바람직하게는 20 내지 80 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 24 시간, 바람직하게는 0.1 내지 12 시간이다.

반응 K



[0084]

[0085] 반응 [K] 중, A¹, A², B, R^{1a}, R^{2a} 및 R⁴는 상술한 바와 같고, G는 염소, 브롬 또는 요오드의 각 원자이다.

[0086] 반응 [K]는, 통상적으로 염기 및 용매의 존재하에 행할 수 있다.

[0087] 염기는, 예를 들면 나트륨메톡시드, 나트륨에톡시드 및 칼륨 제3급 부톡시드와 같은 알칼리 금속 알콕시드; 탄산나트륨 및 탄산칼륨과 같은 탄산염, 중탄산나트륨 및 중탄산칼륨과 같은 중탄산염; 수산화나트륨 및 수산화칼륨과 같은 금속 수산화물; 수소화나트륨 및 수소화칼륨과 같은 금속 수소화물; 모노메틸아민, 디메틸아민 및 트리메틸아민과 같은 아민류; 피리딘 및 4-디메틸아미노피리딘과 같은 피리딘류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택한다. 염기는 화학식 I-10의 화합물에 대하여 1 내지 2배몰, 바람직하게는 1 내지 1.5배몰 사용할 수 있다.

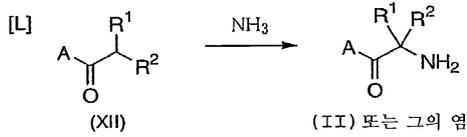
[0088] 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없고, 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 염화메틸, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술폭시드, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈 및 피리딘과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세트니트릴, 프로피오니트릴 및 아크릴로니트릴과 같은 니트릴류; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택

할 수 있다.

[0089] 반응 [K]는 통상적으로 -20 내지 100 °C, 바람직하게는 0 내지 50 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 24 시간, 바람직하게는 0.1 내지 12 시간이다.

[0090] 상기 반응 [A] 또는 [C]에서 사용되는 화학식 II의 화합물은, 이하의 반응 [L] 내지 [N]에 따라 제조할 수 있다.

반응 (L)



[0091]

[0092] 반응 [L] 중, A, R¹ 및 R²는 상술한 바와 같다. 반응 [L]에서는, 반응 후의 처리 또는 통상적인 염 형성 반응에 준하여 화합물 (II)의 염을 제조할 수 있다.

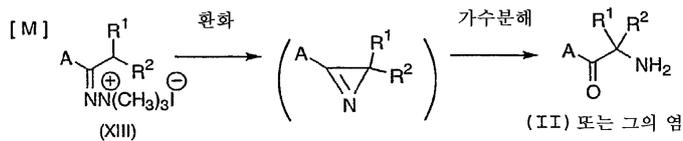
[0093] 반응 [L]은, 통상적으로 산화제 및 물의 존재하에 행할 수 있다.

[0094] 산화제로서는, 예를 들면 페리시안화칼륨 등을 들 수 있다. 산화제는, 화학식 XII의 화합물에 대하여 1 내지 10배몰, 바람직하게는 1 내지 5배몰 사용할 수 있다.

[0095] 용매로서는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술폭사이드, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈, 피리딘, 아세트니트릴 및 프로피오니트릴과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0096] 반응 [L]은 통상적으로 20 내지 150 °C, 바람직하게는 50 내지 100 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.5 내지 30 시간, 바람직하게는 1 내지 20 시간이다.

반응 (M)



[0097]

[0098] 반응 [M] 중, A, R¹ 및 R²는 상술한 바와 같다. 반응 [M]에서는, 반응 후의 처리 또는 통상적인 염 형성 반응에 준하여 화합물 (II)의 염을 제조할 수 있다.

[0099] 반응 [M]의 환화 반응은, 통상적으로 염기 및 용매의 존재하에 행할 수 있다.

[0100] 염기는, 예를 들면 나트륨 및 칼륨과 같은 알칼리 금속; 나트륨메톡사이드, 나트륨에톡사이드 및 칼륨 제3급 부톡사이드와 같은 알칼리 금속 알콕사이드; 수소화나트륨 및 수소화칼륨과 같은 금속 수소화물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택한다. 염기는 화학식 XIII의 화합물에 대하여 1 내지 3배몰, 바람직하게는 1 내지 1.5배몰 사용할 수 있다.

[0101] 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 메탄올, 에탄올, 프로판올 및 tert-부탄올과 같은 알코올류; 아세트니트릴, 프로피오니트릴 및 아크릴로니트릴과 같은 니트릴류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0102] 반응 [M]의 환화 반응은 통상적으로 0 내지 150 °C, 바람직하게는 30 내지 100 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.5 내지 24 시간, 바람직하게는 1 내지 12 시간이다.

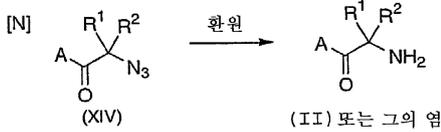
[0103] 반응 [M]의 가수분해 반응은, 일반적인 가수분해 반응에 준하여 행할 수 있으며, 통상적으로 산 또는 염기 및 용매의 존재하에 행할 수 있다.

[0104] 산으로서, 예를 들면 염화수소 및 황산 등을 들 수 있다. 염기로서는 예를 들면 수산화나트륨 및 수산화칼륨과 같은 금속 수산화물 등을 들 수 있다.

[0105] 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 메탄올, 에탄올, 프로판올 및 tert-부탄올과 같은 알코올류; 아세토니트릴, 프로피오니트릴 및 아크릴로니트릴과 같은 니트릴류; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류; 물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0106] 반응 [M]의 가수분해 반응은 통상적으로 0 내지 100 °C, 바람직하게는 20 내지 80 °C에서 행할 수 있으며, 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 12 시간, 바람직하게는 0.1 내지 1 시간이다.

반응 (N)



[0107] 반응 [N] 중, A, R¹ 및 R²는 상술한 바와 같다. 반응 [N]에서는, 반응 후의 처리 또는 통상적인 염 형성 반응에 준하여 화합물 (II)의 염을 제조할 수 있다.

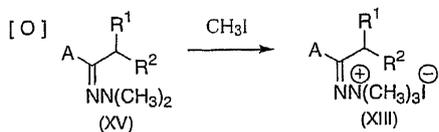
[0109] 반응 [N]의 환원 반응으로서, 예를 들면 접촉 환원, 금속 수소화물(수소화붕소나트륨 및 수소화알루미늄리튬 등)에 의한 환원; 트리페닐포스핀, 디메틸술피드 또는 디페닐술피드에 의한 환원; 철 및 구리와 같은 금속과, 포름산 및 아세트산과 같은 카르복실산으로 구성되는 반응계에서의 환원 등을 들 수 있다. 접촉 환원은, 통상적으로 수소 분위기에 백금, 산화백금, 백금흑, 라니 니켈, 팔라듐, 팔라듐탄소, 로듐 및 로듐-알루미나 등을 촉매로서 사용함으로써 행한다.

[0110] 반응 [N]은, 통상적으로 용매의 존재하에 행할 수 있다. 상기 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔 및 크실렌과 같은 방향족 탄화수소류; 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술폭사이드, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈, 피리딘, 아세토니트릴 및 프로피오니트릴과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류; 메탄올, 에탄올, 프로판올 및 tert-부탄올과 같은 알코올류; 물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0111] 반응 [N]은 통상적으로 0 내지 150 °C, 바람직하게는 0 내지 80 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.5 내지 96 시간, 바람직하게는 0.5 내지 48 시간이다.

[0112] 상기 반응 [M]에서 사용되는 화학식 XIII의 화합물은, 이하의 반응 [O]에 따라 제조할 수 있다.

반응 (O)



[0113] 반응 [O] 중, A, R¹ 및 R²는 상술한 바와 같다.

[0115] 반응 [O]는, 필요에 따라 용매의 존재하에 행할 수 있다. 상기 용매로서는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없고, 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 메탄올, 에탄올, 프로판올 및 tert-부탄올과 같은 알코올류; 아세토니트릴 및 프로피오니트릴과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

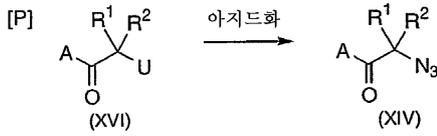
[0116] 반응 [O]의 요오드화메틸은, 화학식 XV의 화합물에 대하여 1 내지 10배몰, 바람직하게는 1 내지 3배몰 사용할

수 있다. 또한, 요오드화메틸은 대량으로 사용함으로써 용매를 겸할 수 있다.

[0117] 반응 [O]는, 통상적으로 0 내지 100 °C, 바람직하게는 10 내지 50 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.5 내지 48 시간, 바람직하게는 1 내지 24 시간이다.

[0118] 상기 반응 [N]에서 사용되는 화학식 XIV의 화합물은, 이하의 반응 [P]에 따라 제조할 수 있다.

반응 (P)



[0119]

[0120] 반응 [P] 중, A, R¹ 및 R²는 상술한 바와 같고, U는 염소 또는 브롬의 각 원자이다.

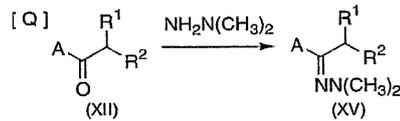
[0121] 반응 [P]는, 아지드화제의 존재하에 행할 수 있다. 상기 아지드화제로서는, 예를 들면 아지화나트륨, 아지화칼륨 및 트리메틸실릴아지드 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0122] 반응 [P]는, 통상적으로 용매의 존재하에 행할 수 있다. 상기 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술폭사이드, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈, 피리딘, 아세토니트릴 및 프로피오니트릴과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세톤 및 메틸에틸케톤과 같은 케톤류; 메탄올, 에탄올, 프로판올 및 tert-부탄올과 같은 알코올류; 물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0123] 반응 [P]는 통상적으로 0 내지 150 °C, 바람직하게는 20 내지 90 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 96 시간, 바람직하게는 0.5 내지 12 시간이다.

[0124] 상기 반응 [O]에서 사용되는 화학식 XV의 화합물은, 이하의 반응 [Q]에 따라 제조할 수 있다.

반응 (Q)



[0125]

[0126] 반응 [Q] 중, A, R¹ 및 R²는 상술한 바와 같다.

[0127] 반응 [Q]는 일반적인 히드라존 합성 반응에 준하여 행할 수 있으며, 필요에 따라 탈수제 및/또는 촉매의 존재하에 행할 수 있다.

[0128] 탈수제로서는, 예를 들면 분자 체 등을 들 수 있다. 탈수제는, 화학식 XII의 화합물의 중량에 대하여 통상적으로 1 내지 30배, 바람직하게는 5 내지 10배 사용할 수 있다.

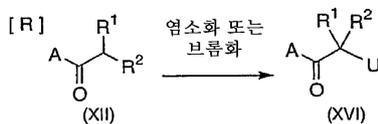
[0129] 촉매로서는, 예를 들면 사염화티탄 등을 들 수 있다.

[0130] 반응 [Q]의 디메틸히드라진은, 화학식 XII의 화합물에 대하여 통상적으로 1 내지 30배물, 바람직하게는 5 내지 10배물 사용할 수 있다.

[0131] 반응 [Q]는 통상적으로 20 내지 150 °C, 바람직하게는 50 내지 120 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 5 내지 200 시간, 바람직하게는 24 내지 120 시간이다.

[0132] 상기 반응 [P]에서 사용되는 화학식 XVI의 화합물은, 이하의 반응 [R]에 따라 제조할 수 있다.

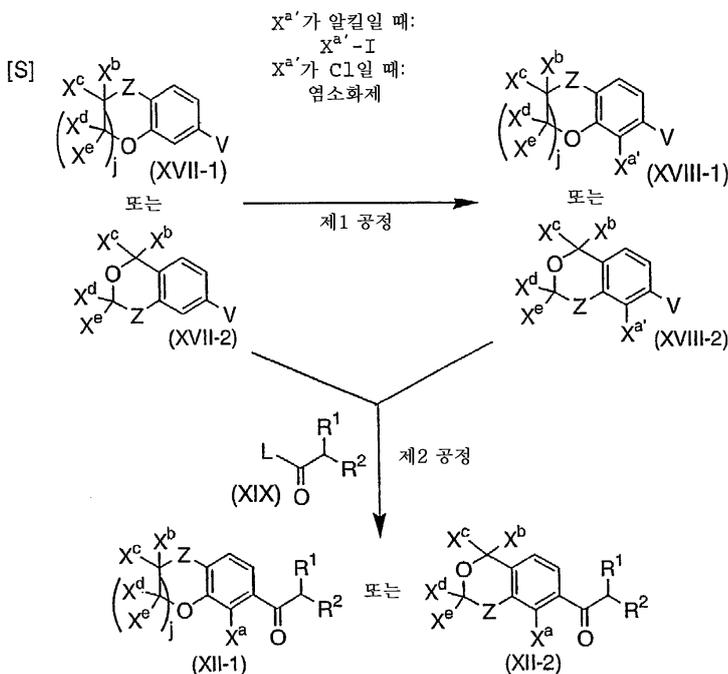
반응 (R)



[0133]

- [0134] 반응 [R] 중, A, R¹, R² 및 U는 상술한 바와 같다.
- [0135] 반응 [R]은, 염소화제 또는 브롬화제의 존재하에 행할 수 있다. 상기 염소화제로서는, 예를 들면 염소 및 N-클로로숙신산이미드 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다. 브롬화제로서는, 예를 들면 브롬, N-브로모숙신산이미드 및 페닐트리메틸암모늄트리브로마이드 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.
- [0136] 반응 [R]은, 통상적으로 용매의 존재하에 행할 수 있다. 상기 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 사염화탄소, 염화메틸, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류; 디옥산, 테트라히드로푸란, 디에틸에테르 및 디메톡시에탄과 같은 에테르류; 아세트산메틸 및 아세트산에틸과 같은 에스테르류; 디메틸술폭시드, 술폴란, 디메틸아세트아미드, 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈 및 피리딘과 같은 극성 비양성자성 용매; 아세트산 및 프로피온산과 같은 유기산; 물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.
- [0137] 반응 [R]은, 필요에 따라 염기의 존재하에 행할 수 있다.
- [0138] 상기 염기로서는, 예를 들면 리튬디이소프로필아미드 등을 들 수 있다. 염기는 화학식 XII의 화합물에 대하여 1 내지 2배몰, 바람직하게는 1 내지 1.2배몰 사용할 수 있다.
- [0139] 염기의 존재하에 행하는 경우, 통상적으로 용매는 테트라히드로푸란 및 디에틸에테르와 같은 에테르류로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.
- [0140] 산은 아세트산 및 프로피온산과 같은 유기산 또는 염화알루미늄으로부터 적합하게 선택된 1종 이상일 수 있다. 또한, 용매로서의 유기산은 대량으로 사용함으로써 용매 및 산을 겸할 수 있다.
- [0141] 반응 [R]은 통상적으로 -100 내지 150 °C, 바람직하게는 -78 내지 110 °C에서 행할 수 있다. 그러나, 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 48 시간, 바람직하게는 0.5 내지 24 시간이다. 그러나, 염기의 존재하에 행하는 경우, 통상적으로 -100 내지 0 °C, 바람직하게는 -78 내지 -20 °C에서 행할 수 있으며, 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 12 시간, 바람직하게는 0.5 내지 6 시간이다. 산의 존재하에 행하는 경우, 통상적으로 0 내지 150 °C, 바람직하게는 20 내지 110 °C에서 행할 수 있으며, 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 48 시간, 바람직하게는 1 내지 24 시간이다.
- [0142] 상기 반응 [Q]에서 사용되는 화학식 XII의 화합물은 공지된 화합물이거나, 또는 이하의 반응 [S] 내지 [T] 또는 이들에 준한 방법에 따라 제조할 수 있다.

반응 (S)

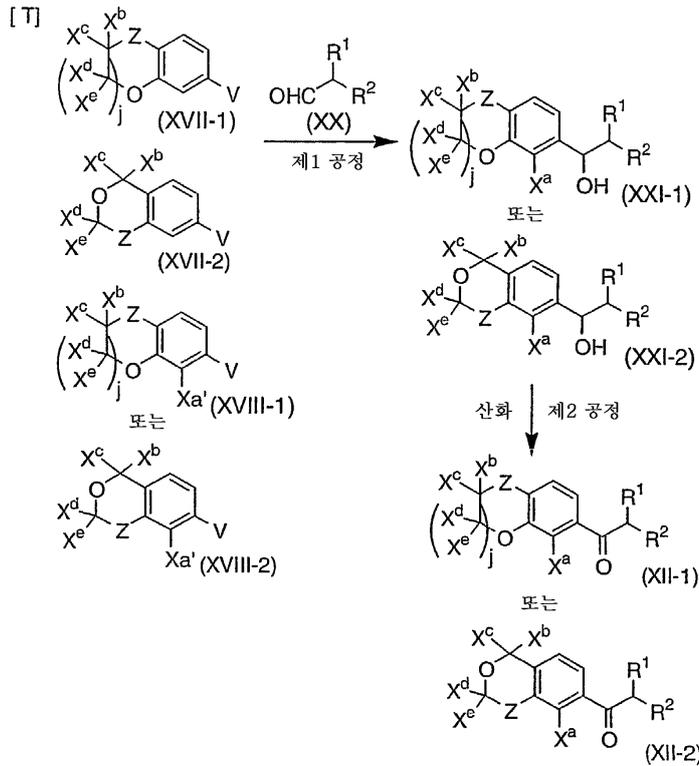


- [0143]
- [0144] 반응 [S] 중, R¹ 및 R²는 상술한 바와 같고, Z는 산소 원자 또는 -C(G¹)G²-이고, X^a는 수소 원자, 염소 원자 또

는 알킬이고, $X^{a'}$ 는 염소 원자 또는 알킬이고, X^b, X^c, X^d, X^e, G^1 및 G^2 는 각각 독립적으로 수소 원자, 불소 원자 또는 염소 원자이고, V 는 브롬 원자 또는 요오드 원자이고, j 는 0 또는 1이다.

- [0145] 반응 [S]의 제1 공정은, 통상적으로 염기 및 용매의 존재하에 행할 수 있다.
- [0146] 염기는, 리튬디소프로필아미드와 같은 유기 리튬 화합물 등으로부터 적절하게 선택할 수 있다. 염기는 화학식 XVII-1 또는 XVII-2의 화합물에 대하여 1 내지 2배물, 바람직하게는 1 내지 1.5배물 사용할 수 있다.
- [0147] 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 디옥산, 테트라히드로푸란 및 디에틸 에테르와 같은 에테르류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.
- [0148] 반응 [S]의 제1 공정에서 사용하는 염소화제로서는, 예를 들면 N-클로로숙신산이미드 등을 들 수 있다.
- [0149] 반응 [S]의 제1 공정에서 사용하는 화학식 $X^{a'}$ -I는, 화학식 XVII-1 또는 XVII-2의 화합물에 대하여 1 내지 10 배물, 바람직하게는 1 내지 5배물 사용할 수 있다. 또한, 반응 [S]의 제1 공정에서 사용하는 염소화제는, 화학식 XVII-1 또는 XVII-2의 화합물에 대하여 1 내지 5배물, 바람직하게는 1 내지 3배물 사용할 수 있다.
- [0150] 반응 [S]의 제1 공정은, 필요에 따라 불활성 가스의 존재하에 행할 수 있다. 상기 불활성 가스는, 예를 들면 질소 가스 및 아르곤 가스 등으로부터 적절하게 선택할 수 있다.
- [0151] 반응 [S]의 제1 공정은 통상적으로 -100 내지 50 °C, 바람직하게는 -70 내지 25 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 1 내지 48 시간, 바람직하게는 1 내지 20 시간이다.
- [0152] 반응 [S]의 제2 공정은, 통상적으로 염기 및 용매의 존재하에 행할 수 있다.
- [0153] 염기는 메틸리튬 및 n-부틸리튬과 같은 유기 리튬 화합물; 이소프로필마그네슘클로라이드와 같은 그리냐르 화합물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다. 염기는 화학식 XVII-1, XVII-2, XVIII-1 또는 XVIII-2의 화합물에 대하여 1 내지 2배물, 바람직하게는 1 내지 1.5배물 사용할 수 있다.
- [0154] 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 디옥산, 테트라히드로푸란 및 디에틸 에테르와 같은 에테르류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.
- [0155] 반응 [S]의 제2 공정에서 사용하는 화학식 XIX의 화합물은, 화학식 XVII-1, XVII-2, XVIII-1 또는 XVIII-2의 화합물에 대하여 1 내지 3배물, 바람직하게는 1 내지 1.5배물 사용할 수 있다.
- [0156] 반응 [S]의 제2 공정은, 필요에 따라 불활성 가스의 존재하에 행할 수 있다. 상기 불활성 가스는, 예를 들면 질소 가스 및 아르곤 가스 등으로부터 적절하게 선택할 수 있다.
- [0157] 반응 [S]의 제2 공정은 통상적으로 -100 내지 50 °C, 바람직하게는 -70 내지 25 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 1 내지 48 시간, 바람직하게는 1 내지 20 시간이다.

반응 (T)



[0158]

[0159] 반응 [T] 중, R¹, R², Z, X^a, X^{a'}, X^b, X^c, X^d, X^e, V 및 j는 상술한 바와 같다.

[0160] 반응 [T]의 제1 공정은, 통상적으로 염기 및 용매의 존재하에 행할 수 있다.

[0161] 염기는 메틸리튬 및 n-부틸리튬과 같은 유기 리튬 화합물; 이소프로필마그네슘클로라이드와 같은 그리냐르 화합물 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0162] 염기는 화학식 XVII-1, XVII-2, XVIII-1 또는 XVIII-2의 화합물에 대하여 1 내지 2배몰, 바람직하게는 1 내지 1.5배몰 사용할 수 있다.

[0163] 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 디옥산, 테트라히드로푸란 및 디에틸 에테르와 같은 에테르류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0164] 반응 [T]의 제1 공정에서 사용하는 화학식 XX은, 화학식 XVII-1, XVII-2, XVIII-1 또는 XVIII-2의 화합물에 대하여 1 내지 3배몰, 바람직하게는 1 내지 1.5배몰 사용할 수 있다.

[0165] 반응 [T]의 제1 공정은, 필요에 따라 불활성 가스의 존재하에 행할 수 있다. 상기 불활성 가스는, 예를 들면 질소 가스 및 아르곤 가스 등으로부터 적절하게 선택할 수 있다.

[0166] 반응 [T]의 제1 공정은 통상적으로 -100 내지 50 °C, 바람직하게는 -70 내지 25 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 1 내지 48 시간, 바람직하게는 1 내지 20 시간이다.

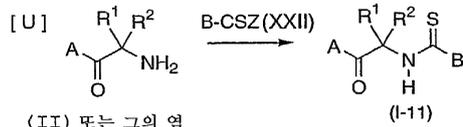
[0167] 반응 [T]의 제2 공정은, 통상적으로 산화제 및 용매의 존재하에 행할 수 있다.

[0168] 산화제는, 클로로크롬산피리디늄 및 이산화망간 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다. 산화제는, 화학식 XXI-1 또는 XXI-2의 화합물에 대하여 1 내지 10배몰, 바람직하게는 1 내지 3배몰 사용한다.

[0169] 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것이어도 상관없다. 예를 들면 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 클로로벤젠과 같은 방향족 탄화수소류; 사염화탄소, 클로로포름, 디클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄, 헥산 및 시클로헥산과 같은 지방족 탄화수소류 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0170] 반응 [T]의 제2 공정은 통상적으로 0 내지 150 °C, 바람직하게는 20 내지 100 °C에서 행할 수 있다. 반응 시간은 통상적으로 0.5 내지 24 시간, 바람직하게는 1 내지 12 시간이다.

반응 (U)



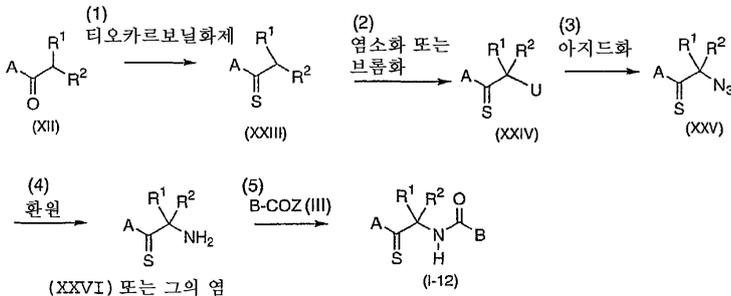
[0171]

[0172] 반응 [U] 중, A, B, R¹, R² 및 Z는 상술한 바와 같다.

[0173] 반응 [U]는, 상기 반응 [A]에 준하여 행할 수 있다.

반응 (V)

[V]



[0174]

[0175] 반응 [V] 중, A, B, R¹, R², U 및 Z는 상술한 바와 같다. 또한, 티오카르보닐화제로서는, 로손 시약 및 오황화 이인 등을 들 수 있다. 반응 [V]는, 상기 흐름 중 (1) 내지 (5)와 같이 5 단계의 반응을 포함하며, 각각의 반응 조건에 대해서는 이하에 설명한다.

[0176] (1)의 반응은, 통상적으로 용매의 존재하에 행할 수 있다. 상기 용매는, 반응에 불활성인 용매이면 어떠한 것 이어도 상관없고, 예를 들면 벤젠, 톨루엔 및 크실렌과 같은 방향족 탄화수소류; 펜탄, 헥산, 헵탄, 석유 에테르, 리그로인 및 석유 벤진과 같은 지방족 탄화수소류; 디에틸에테르, 디프로필에테르, 디부틸에테르, 테트라히드로푸란 및 디옥산과 같은 에테르류; 이황화탄소 등으로부터 1종 이상을 적절하게 선택할 수 있다.

[0177] (1)의 반응은, 통상적으로 -20 내지 150 °C, 바람직하게는 0 내지 110 °C에서 행할 수 있으며, 반응 시간은 통상적으로 0.1 내지 48 시간이다.

[0178] (1)의 반응에서, 티오카르보닐화제는 화학식 XII의 화합물에 대하여 0.4 내지 2배몰 사용할 수 있다.

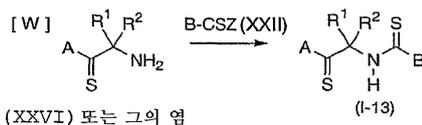
[0179] (2)의 반응은, 상기 반응 [R]에 준하여 행할 수 있다.

[0180] (3)의 반응은, 상기 반응 [P]에 준하여 행할 수 있다.

[0181] (4)의 반응은, 상기 반응 [N]에 준하여 행할 수 있다.

[0182] (5)의 반응은, 상기 반응 [A]에 준하여 행할 수 있다.

반응 (W)



[0183]

[0184] 반응 [W] 중, A, B, R¹, R² 및 Z는 상술한 바와 같다.

[0185] 반응 [W]는, 상기 반응 [A]에 준하여 행할 수 있다.

[0186] 또한, 화학식 I의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염은, 필요에 따라 W02001/60783 또는 W02003/27059에 개시된 방법을 참고로 하여 제조할 수 있다.

[0187] 화학식 I로 표시되는 산 아마이드 유도체 또는 그의 염을 유효 성분으로서 함유하는 살진균성 조성물(이하, 본 발명의 조성물로서 간단히 나타냄)은 저약량에서 다양한 유해 진균류를 방제할 수 있어서, 예를 들어 농업적 또는

원예학적 살진균성 조성물로서 유용하다.

[0188] <발명을 실시하기 위한 최선의 형태>

[0189] 본 발명 조성물의 바람직한 양태에 대하여 이하에 설명한다.

[0190] 본 발명 조성물은, 저약량으로 유해 진균류를 방제할 수 있는 살진균성 조성물로서 유용하며, 특히 농원예용의 살진균성 조성물로서 유용하다. 농원예용의 살진균성 조성물로서 사용한 경우, 본 발명 조성물은 예를 들면 난균류(Oomycetes), 자낭균류(Ascomycetes), 담자균류(Basidiomycetes) 및 불완전균류(Deuteromycetes) 등에 속하는 유해 진균류를 방제할 수 있으며, 이 중에서도 자낭균류(Ascomycetes), 불완전균류(Deuteromycetes) 등에 속하는 유해 진균류의 방제에 특히 유효하다.

[0191] 상기 유해 진균류의 보다 구체적인 예로서는, 예를 들면 이하와 같은 것 등을 들 수 있다.

[0192] 난균류로서, 감자 또는 토마토 역병균(*Phytophthora infestans*), 토마토 회색 역병균(*Phytophthora capsici*)과 같은 파이토포트라(*Phytophthora*)속; 오이 노균병(*Pseudoperonospora cubensis*)과 같은 슈도페로노스포라(*Pseudoperonospora*)속; 포도 노균병(*Plasmopara viticola*)과 같은 플라스모파라(*Plasmopara*)속; 벼 묘립고병균(*Pythium graminicola*), 밀 갈색 설부병균(*Pythium iwayamai*)과 같은 피시움(*Pythium*)속 등을 들 수 있다.

[0193] 자낭균류로서, 보리 흰가루병균(*Erysiphe graminis*)와 같은 에리시페(*Erysiphe*)속; 오이 흰가루병균(*Sphaerotheca fuliginea*), 딸기 흰가루병균(*Sphaerotheca humuli*)과 같은 스파에로테카(*Sphaerotheca*)속; 포도 흰가루병균(*Uncinula necator*)과 같은 웅키놀라(*Uncinula*)속; 사과 흰가루병균(*Podosphaera leucotricha*)과 같은 포도스파에라(*Podosphaera*)속; 완두 갈문병균(*Mycosphaerella pinodes*), 사과 흑점병균(*Mycosphaerella pomi*), 바나나 블랙 시가토키아병균(*Mycosphaerella musicola*), 감나무 둥근 무늬 낙엽병균(*Mycosphaerella nawae*), 딸기 뱀눈 무늬병균(*Mycosphaerella fragariae*)과 같은 미코스파에렐라(*Mycosphaerella*)속; 사과 흑성병균(*Venturia inaequalis*), 배 흑성병균(*Venturia nashicola*)과 같은 벤투리아(*Venturia*)속; 보리 망반병균(*Pyrenophora teres*), 보리 반엽병균(*Pyrenophora graminea*)과 같은 피레노포라(*Pyrenophora*)속; 까치콩 균핵병균, 오이 균핵병균, 양배추 균핵병균, 배추 균핵병균, 고추 균핵병균, 피망 균핵병균, 양파 균핵병균(*Sclerotinia sclerotiorum*), 밀 설부 대립 균핵병균(*Sclerotinia borealis*), 토마토 소립 균핵병균(*Sclerotinia minor*), 콩과목초 균핵병균(*Sclerotinia trifoliorum*)과 같은 스크레로티니아(*Sclerotinia*)속; 땅콩 소균핵병균(*Botryolinia arachidis*)과 같은 보트리올리니아(*Botryolinia*)속; 벼깨씨 엽고병균(*Cochliobolus miyabeanus*)과 같은 코클리올볼루스(*Cochliobolus*)속; 오이 덩굴 마름병균(*Didymella bryoniae*)과 같은 디디멜라(*Didymella*)속; 밀 붉은 곰팡이병균(*Gibberella zeae*)과 같은 지베렐라(*Gibberella*)속; 포도 흑두병균(*Elsinoe ampelina*), 감귤 더텡이병균(*Elsinoe fawcettii*)과 같은 엘시노에(*Elsinoe*)속; 감귤 흑점병균(*Diaporthe citri*), 포도 지팽(枝膨)병균(*Diaporthe sp.*)과 같은 디아포르테(*Diaporthe*)속; 사과 꽃썩음병균(*Monilinia mali*), 복숭아 회성병균(*Monilinia fructicola*)과 같은 모닐리니아(*Monilinia*)속; 포도 만부병균(*Glomerella cingulata*)과 같은 글로메렐라(*Glomerella*)속 등을 들 수 있다.

[0194] 담자균류로서, 벼 문고병균(*Rhizoctonia solani*)과 같은 리족토니아(*Rhizoctonia*)속; 보리 걸감부기병균(*Ustilago unda*)과 같은 우스틸라고(*Ustilago*)속; 귀리 관녹병균(*Puccinia coronata*), 밀 붉은녹병균(*Puccinia recondita*), 밀 줄녹병균(*Puccinia striiformis*)과 같은 푸치니아(*Puccinia*)속; 보리 설부 소립균핵병균(*Typhula incarnata*, *Typhula ishikariensis*)과 같은 티플라(*Typhula*)속 등을 들 수 있다.

[0195] 불완전균류로서, 밀 반고병균(*Septoria nodorum*), 밀 엽고병균(*Septoria tritici*)과 같은 셉토리아(*Septoria*)속; 포도 회색 곰팡이병균, 감귤 회색 곰팡이병균, 오이 회색 곰팡이병균, 토마토 회색 곰팡이병균, 딸기 회색 곰팡이병균, 가지 회색 곰팡이병균, 까치콩 회색 곰팡이병균, 팔 회색 곰팡이병균, 완두 회색 곰팡이병균, 땅콩 회색 곰팡이병균, 고추 회색 곰팡이병균, 피망 회색 곰팡이병균, 양상추 회색 곰팡이병균, 양파 회색 곰팡이병균, 스타티스 회색 곰팡이병균, 카네이션 회색 곰팡이병균, 장미 회색 곰팡이병균, 팬지 회색 곰팡이병균, 해바라기 회색 곰팡이병균(*Botrytis cinerea*), 양파 회색 부패병균(*Botrytis allii*), 양파의 보트리티스속 균에 의한 잎마름을 발생시키는 병원균(*Botrytis squamosa*, *Botrytis byssoidea*, *Botrytis tulipae*)과 같은 보트리티스(*Botrytis*)속; 벼 도열병균(*Pyricularia oryzae*)과 같은 피리쿨라리아(*Pyricularia*)속; 사탕무 갈반병균(*Cercospora beticola*), 감나무 각반병균(*Cercospora kakivola*)과 같은 세르코스포라(*Cercospora*)속; 오이 탄저병균(*Colletotrichum orbiculare*)과 같은 콜레토티리움(*Colletotrichum*)속; 사과 반점 낙엽병균(*Alternaria alternata* apple pathotype), 배 흑반병균(*Alternaria alternata* Japanese pear pathotype), 감자 하역 또는 토마토 윤문병균(*Alternaria solani*), 양배추 또는 배추 흑반병균(*Alternaria brassicae*), 양배추 흑매병(黑煤

病)균(*Alternaria brassicola*), 양파 또는 파 흑반병균(*Alternaria porri*)과 같은 알터나리아(*Alternaria*)속; 보리 점무늬병균(*Pseudocercospora herpotrichoides*)과 같은 슈도세르코스포렐라(*Pseudocercospora*)속; 포도 갈반병균(*Pseudocercospora vitis*)과 같은 슈도세르코스포라(*Pseudocercospora*)속; 보리 구름 무늬병균(*Rhynchosporium secalis*)과 같은 린코스포리움(*Rhynchosporium*)속; 복숭아 흑성병균(*Cladosporium carpophilum*)과 같은 클라도스포리움(*Cladosporium*)속; 복숭아 포모프시스 부패병균(*Phomopsis sp.*)과 같은 포모프시스(*Phomopsis*)속; 감나무 탄저병균(*Gloeosporium kaki*)과 같은 글로에오스포리움(*Gloeosporium*)속; 토마토 잎곰팡이병균(*Fulvia fulva*)과 같은 풀비아(*Fulvia*)속; 오이 갈반병균(*Corynespora cassicola*)과 같은 코리네스포라(*Corynespora*)속 등을 들 수 있다.

[0196] 본 발명 조성물은, 상술한 각종 유해 진균류를 방제할 수 있기 때문에, 각종 병해를 예방적 또는 치료적으로 방제할 수 있다. 특히 본 발명 조성물은, 농원에 분야에서 문제가 되는 각종 병해, 예를 들면 벼의 도열병, 깨엽고병, 문고병 또는 묘립고병(*Oryza sativa* 등); 보리류의 흰가루병, 붉은곰팡이병, 붉은녹병, 줄녹병, 망반병, 반엽병, 설부병, 길잡부기병, 보리 점무늬병, 구름 무늬병, 엽고병 또는 반고병(*Hordeum vulgare*, *Tricum aestivum* 등); 감귤의 흑점병 또는 더랭이병(*Citrus spp.* 등); 사과의 꽃썩음병, 흰가루병, 흑점병, 반점 낙엽병 또는 흑성병(*Malus pumila*); 배의 흑성병 또는 흑반병(*Pyrus serotina*, *Pyrus ussuriensis*, *Pyrus communis*); 복숭아의 잣빛 무늬병, 흑성병 또는 포모프시스 부패병(*Prunus persica* 등); 포도의 흑두병, 만부병, 갈반병, 지팽(枝膨)병, 흰가루병 또는 노균병(*Vitis vinifera spp.* 등); 감의 탄저병, 둥근 무늬 낙엽병 또는 각반병(*Diospyros kaki* 등); 참외류의 탄저병, 흰가루병, 덩굴 노균병, 갈반병 또는 마름병(*Cucumis melo* 등); 토마토의 윤문병, 회색 역병, 잎곰팡이병 또는 역병(*Lycopersicon esculentum*); 바나나의 블랙 시가토카병(*Musa sapientum* 등); 사탕무의 갈반병(*Beta vulgaris var. saccharifera* 등); 완두의 갈문병(*Pisum sativum*); 유채과 야채의 흑반병(*Brassica sp.*, *Raphane's sp.* 등); 감자의 역병 또는 하역병(*Solanum tuberosum*); 딸기의 흰가루병 또는 뱀눈 무늬병(*Fragaria* 등); 및 콩류, 야채류, 과수류 및 화훼류 등 다양한 작물의 회색 곰팡이병 또는 균핵병 등의 각종 병해의 방제에 유효하다. 이 중에서도 오이(*Cucumis sativus*), 까치콩(*Phaseolus vulgaris*), 팥(*Vigna angularis*), 대두(*Glycine max*), 완두, 땅콩(*Arachis hypogaea*), 토마토, 딸기, 가지(*Solanum melongena*), 고추(*Capsicum annum*), 피망(*Capsicum annum*), 양상추(*Lactuca sativa*), 양파(*Allium cepa*), 포도, 감귤, 스타티스(*Limonium spp.*), 카네이션(*Dianthus spp.*), 장미(*Rosa spp.*), 팬지(*Viola* 등) 및 해바라기(*Helianthus annuus*)의 회색 곰팡이병균(*Sclerotinia*)에 특히 유효하다.

[0197] 또한 본 발명 조성물은, 푸사리움균, 피시움균, 리족토니아균, 버티실리움균 및 플라스모디오포라균 등의 식물 병원균에 의해 발생하는 토양 병해의 예방적 또는 치료적 방제에도 유효하다.

[0198] 또한, 본 발명 조성물은 벤즈이미다졸, 스트로빌루린, 디카르복시이미드, 페닐아마이드 및 에르고스테롤 생합성 조해제 등의 약제에 대한 각종 저항성 유해 진균류의 방제에도 유효하다.

[0199] 또한 본 발명 조성물은, 우수한 침투 이행을 갖고 있기 때문에, 본 발명 조성물을 함유하는 유해 생물 방제제를 토양에 시용함으로써 토양 중의 유해 진균류의 방제와 동시에, 경엽부의 유해 진균류도 방제할 수 있다.

[0200] 본 발명 조성물은, 통상적으로 화학식 I의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염과 각종 농업상의 보조제를 혼합하여 분제, 입제, 과립 수화제, 수화제, 수성 현탁제, 유성 현탁제, 수용제, 유제, 액제, 페이스트제, 에어졸제 및 미량 산포제 등의 다양한 형태로 제제하여 사용되지만, 본 발명의 목적에 적합하면, 통상적인 해당 분야에서 사용되고 있는 모든 제제 형태로 할 수 있다. 제제에 사용하는 보조제로서는, 규조토, 소석회, 탄산칼슘, 탈크, 화이트 카본, 카올린, 벤토나이트, 카올리나이트 및 세리사이트의 혼합물, 클레이, 탄산나트륨, 중탄산나트륨, 황산나트륨, 제올라이트 및 전분 등의 고형 담체; 물, 톨루엔, 크실렌, 솔벤트 나프타, 디옥산, 아세톤, 이소포론, 메틸이소부틸케톤, 클로로벤젠, 시클로헥산, 디메틸술폭시드, N,N-디메틸포름아미드, 디메틸아세트아미드, N-메틸-2-피롤리돈 및 알코올 등의 용제; 지방산염, 벤조산염, 알킬술포숙신산염, 디알킬술포숙신산염, 폴리카르복실산염, 알킬황산에스테르염, 알킬황산염, 알킬아릴황산염, 알킬디글리콜에테르황산염, 알코올황산에스테르염, 알킬술포산염, 알킬아릴술포산염, 아릴술포산염, 리그닌술포산염, 알킬디페닐에테르디술포산염, 폴리스티렌술포산염, 알킬인산에스테르염, 알킬아릴인산염, 스티릴아릴인산염, 폴리옥시에틸렌알킬에테르황산에스테르염, 폴리옥시에틸렌알킬아릴에테르황산염, 폴리옥시에틸렌알킬아릴에테르황산에스테르염, 폴리옥시에틸렌알킬에테르인산염, 폴리옥시에틸렌알킬아릴인산에스테르염 및 나프탈렌술포산포르말린 축합물의 염과 같은 음이온계의 계면활성제나 전착제; 소르비탄 지방산에스테르, 글리세린 지방산에스테르, 지방산 폴리글리세리드, 지방산알코올 폴리글리콜에테르, 아세틸렌글리콜, 아세틸렌알코올, 옥시알킬렌 블록 중합체, 폴리옥시에틸렌알킬에테르, 폴리옥시에틸렌알킬아릴에테르, 폴리옥시에틸렌스티릴아릴에테르, 폴리옥시에틸렌글리콜알킬에테르, 폴리에틸렌글리콜, 폴리옥시에틸렌 지방산에스테르, 폴리옥시에틸렌소르비탄 지방산에스테르, 폴리옥시에틸렌글리세린 지방산

에스테르, 폴리옥시에틸렌 경화 피마자유 및 폴리옥시프로필렌 지방산에스테르와 같은 비이온계의 계면활성제나 전착제; 올리브유, 케이폭유, 피마자유, 종려 나무유, 동백유, 야자유, 참기름, 옥수수유, 쌀겨유, 땅콩유, 면실유, 대두유, 채종유, 아마인유, 오동나무유 및 액상 과라핀 등의 식물유나 광물유 등을 들 수 있다. 이들 보조제의 각 성분은 본 발명의 목적에서 벗어나지 않는 한, 1종 이상을 적절하게 선택하여 사용할 수 있다. 또한, 상기한 보조제 이외에도 해당 분야에서 알려진 것들 중 적절하게 선택하여 사용할 수 있으며, 예를 들면 증량제, 증점제, 침강 방지제, 동결 방지제, 분산 안정제, 약해 경감제 및 방미제 등 통상적으로 사용되는 각종 보조제도 사용할 수 있다.

[0201] 화학식 I의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염과 각종 보조제의 배합 비율은 0.001:99.999 내지 95:5, 바람직하게는 0.005:99.995 내지 90:10이다.

[0202] 이들 제제의 실제 사용시에는 그대로 사용하거나, 물 등의 희석제로 소정 농도로 희석하고, 필요에 따라 각종 전착제(계면활성제, 식물유 및 광물유 등)를 첨가하여 사용할 수 있다.

[0203] 본 발명 조성물의 사용은 기상 조건, 제제 형태, 대상 작물, 사용 시기, 사용 장소, 유해 진균류의 종류나 발생 상황 및 병해의 종류나 발생 상황 등의 차이에 따라 일률적으로 규정할 수 없다. 그러나, 일반적으로 경엽 처리의 경우 0.1 내지 10,000 ppm, 바람직하게는 1 내지 2,000 ppm의 유효 성분 농도로 사용할 수 있으며, 사용 적량은 1 헥타르당 화학식 I의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염을 0.1 내지 50,000 g, 바람직하게는 1 내지 30,000 g 정도로 할 수 있다. 토양 처리의 경우에는, 일반적으로 1 헥타르당 화학식 I의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염을 10 내지 100,000 g, 바람직하게는 200 내지 20,000 g 사용할 수 있다.

[0204] 본 발명 조성물의 다양한 제제 또는 그 희석물의 사용은, 통상 일반적으로 행해지고 있는 사용 방법, 즉 산포(예를 들면 산포, 분무, 미스팅, 아토마이징, 산립(散粒) 및 수면 사용 등), 토양 사용(혼입 및 탁주(灌注) 등), 표면 사용(도포, 분의(紛衣) 및 피복 등) 등에 의해 행할 수 있다. 또한, 소위 초고농도 소량 산포법(ultra low volume)에 의해 처리할 수 있다. 이 방법에서는, 활성 성분을 100% 함유하는 것이 가능하다.

[0205] 본 발명 조성물은 다른 농약, 비료 및 약해 경감제 등과 혼용 또는 병용할 수 있으며, 이 경우 한층 우수한 효과 및 작용성을 나타낸다. 다른 농약으로서는 제초제, 살충제, 살진드기제, 살선충제, 살토양 해충제, 살진균제, 항바이러스제, 유인제, 항생 물질, 식물 호르몬 및 식물 성장 조절제 등을 들 수 있다. 특히, 화학식 I의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염과, 다른 살진균성 유효 성분 화합물 중 1종 이상을 혼용 또는 병용한 혼합 살진균성 조성물은, 적용 범위, 약제 처리의 시기 및 방제 활성 등을 바람직한 방향으로 개량하는 경우가 있다. 또한, 화학식 I의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염과 다른 살진균제의 유효 성분 화합물은, 각각 제제한 것을 산포시에 혼합하여 사용할 수도 있고, 양자를 함께 제제하여 사용할 수도 있다. 본 발명에는, 이러한 혼합 살진균성 조성물도 포함된다.

[0206] 화학식 I의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염과 다른 살진균성 유효 성분 화합물의 혼합비는, 기상 조건, 제제 형태, 대상 작물, 사용 시기, 사용 장소, 유해 진균류의 종류나 발생 상황 및 병해의 종류나 발생 상황 등의 차이에 따라 일률적으로 규정할 수 없지만, 일반적으로 1:300 내지 300:1, 바람직하게는 1:100 내지 100:1로 할 수 있다. 또한, 사용 적량은 1 헥타르당 총유효 성분 화합물량으로서 0.1 내지 70,000 g, 바람직하게는 1 내지 30,000 g으로 할 수 있다. 본 발명에는, 이러한 혼합 살진균성 조성물의 사용에 의한 유해 진균류의 방제 방법도 포함된다.

[0207] 상기 다른 농약 중의 살진균성 유효 성분 화합물(일반명; 일부 신청 중을 포함하거나, 또는 일본 식물 방역 협회 공시 시험 코드)로서는, 예를 들면,

[0208] 메파니피림(Mepanipirim), 피리메타닐(Pyrimethanil) 및 시프로디닐(Cyprodinil)과 같은 아닐리노피리미딘계 화합물;

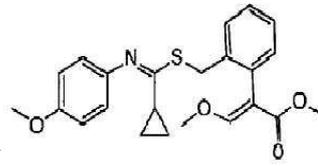
[0209] 플루아지남(Fluazinam)과 같은 피리딘아민계 화합물;

[0210] 트리아디메폰(Triadimefon), 비터타놀(Bitertanol), 트리플루미졸(Triflumizole), 에타코나졸(Etaconazole), 프로피코나졸(Propiconazole), 펜코나졸(Penconazole), 플루실라졸(Flusilazole), 마이클로부타닐(Myclobutanil), 시프로코나졸(Cyproconazole), 테부코나졸(Tebuconazole), 헥사코나졸(Hexaconazole), 퍼코나졸-시스(Furconazole-cis), 프로클로라즈(Prochloraz), 메트코나졸(Metconazole), 에폭시코나졸(Epoxiconazole), 테트라코나졸(Tetraconazole), 옥스포코나졸 푸마레이트(Oxpoconazole fumarate), 시프로코나졸(Sipconazole), 프로티오코나졸(Prothioconazole), 트리아디메놀(Triadimenol), 플루트리아폴(Flutriafol), 디페노코나졸(Difenoconazole), 플루킨코나졸(Fluquinconazole), 펜부코나졸(Fenbuconazole), 브로무코나졸

(Bromuconazole), 디니코나졸(Diniconazole), 트리시클라졸(Tricyclazole), 프로베나졸(Probenazole), 시메코나졸(Simeconazole), 페푸라조에이트(Pefurazoate), 이프코나졸(Ipconazole) 및 이미벤코나졸(Imibenconazole)과 같은 아졸계 화합물;

- [0211] 퀴노메티오네이트(Quinomethionate)와 같은 퀴녹살린계 화합물;
- [0212] 마네브(Maneb), 지네브(Zineb), 만코제브(Mancozeb), 폴리카르바메이트(Polycarbamate), 메티람(Metiram) 및 프로피네브(Propineb)와 같은 디티오카르바메이트계 화합물;
- [0213] 프탈라이드(Fthalide), 클로로탈로닐(Chlorothalonil) 및 퀸토젠(Quintozene)과 같은 유기 염소계 화합물;
- [0214] 베노밀(Benomyl), 티오파네이트-메틸(Thiophanate-Methyl), 카르벤다짐(Carbendazim) 및 시아조파미드(Cyazofamid)와 같은 이미다졸계 화합물;
- [0215] 시목사닐(Cymoxanil)과 같은 시아노 아세트아미드계 화합물;
- [0216] 메탈락실(Metalaxy1), 메탈락실 M(Metalaxy1 M), 옥사딕실(Oxadixyl), 오푸레이스(Ofurace), 베날락실(Benalaxy1), 베날락실 M(Benalaxy1 M), 푸랄락실(Furalaxy1) 및 시프로푸람(Cyprofuram)과 같은 페닐아미드계 화합물;
- [0217] 디클로플루아니드(Dichlofluanid)와 같은 술펜산계 화합물;
- [0218] 수산화 제2 구리(Cuprichydroxide) 및 옥식 구리(Oxine Copper)와 같은 구리계 화합물;
- [0219] 히멕사졸(Hymexazol)과 같은 이속사졸계 화합물;
- [0220] 포세틸-알루미늄(Fosetyl-Al), 톨코포스-메틸(Tolcofos-Methyl), S-벤질 O, O-디이소프로필포스폴로티오에이트, O-에틸 S,S-디페닐포스폴로티오에이트 및 알루미늄에틸히드로젠포스포네이트와 같은 유기 인계 화합물;
- [0221] 캡탄(Captan), 캡타폴(Captafol) 및 폴렛(Folpet)과 같은 N-할로게노티오알킬계 화합물;
- [0222] 프로시미돈(Procymidone), 이프로디온(Iprodione) 및 빈클로졸린(Vinclozolin)과 같은 디카르복시이미드계 화합물;
- [0223] 플루톨라닐(Flutolanil), 메프로닐(Mepronil), 족사미드(Zoxamid) 및 티아디닐(Tiadinil)과 같은 벤즈아닐리드계 화합물;
- [0224] 보스칼리드(Boscalid)와 같은 아닐리드계 화합물;
- [0225] 트리포린(Triforine)과 같은 피페라진계 화합물;
- [0226] 피리페녹스(Pyriphenox)와 같은 피리딘계 화합물;
- [0227] 페나리몰(Fenarimol) 및 플루트리아폴(Flutriafol)과 같은 카르비놀계 화합물;
- [0228] 펜프로피딘(Fenpropidine)과 같은 피페리딘계 화합물;
- [0229] 펜프로피모르프(Fenpropimorph) 및 트리데모르프(Tridemorph)와 같은 모르폴린계 화합물;
- [0230] 펜틴히드록시드(Fentin Hydroxide) 및 펜틴 아세테이트(Fentin Acetate)와 같은 유기 주석계 화합물;
- [0231] 펜시쿠론(Pencycuron)과 같은 요소계 화합물;
- [0232] 디메토모르프(Dimethomorph) 및 플루모르프(Flumorph)와 같은 신남산계 화합물;
- [0233] 디에토펜카르브(Diethofencarb)와 같은 페닐카르바메이트계 화합물;
- [0234] 플루디옥소닐(Fludioxonil) 및 펜피클로닐(Fenpiclonil)과 같은 시아노피롤계 화합물;
- [0235] 아зок시스트로빈(Azoxystrobin), 크레속심-메틸(Kresoxim-Methyl), 메토미노펜(Metominofen), 트리플록시스트로빈(Trifloxystrobin), 피록시스트로빈(Picoxystrobin), 오리자스트로빈(Oryzastrobin), 디목시스트로빈(Dimoxystrobin), 피라클로스트로빈(Pyraclostrobin), 플루옥사스트로빈(Fluoxastrobin) 및 플루아크리피린(Fluacrypyrin)과 같은 스트로빌루린계 화합물;
- [0236] 파목사돈(Famoxadone)과 같은 옥사졸리디논계 화합물;

- [0237] 에타복삼(Ethaboxam)과 같은 티아졸카르복스아미드계 화합물;
- [0238] 실티오팜(Silthiopham)과 같은 실릴아미드계 화합물;
- [0239] 이프로발리카르브(Iprovalicarb) 및 벤티아발리카르브-이소프로필(benthiavalicarb-isopropyl)과 같은 아미노산 아미드 카르바메이트계 화합물;
- [0240] 페나미돈(Fenamidone)과 같은 이미다졸리딘계 화합물;
- [0241] 펜헥사미드(Fenhexamid)와 같은 히드록시아닐리드계 화합물;
- [0242] 플루술폰아미드(Flusulfamid)와 같은 벤젠술폰아미드계 화합물;
- [0243] 시플루페나미드(Cyflufenamid)와 같은 옥심 에테르계 화합물;
- [0244] 페녹사닐(Fenoxanil)과 같은 페녹시아미드계 화합물;
- [0245] 폴리옥신(polyoxins)과 같은 항생 물질;
- [0246] 이미노크타딘(Iminoctadine)과 같은 구아니딘계 화합물;
- [0247] 또한, 기타 화합물로서 이소프로티올란(Isoprothiolane), 피로퀼론(Pyroquilon), 디클로메진(Diclomezine), 퀴녹시펜(Quinoxifen), 프로파모카르브 염산염(Propamocarb Hydrochloride), 스피록사민(Spiroxamine), 클로로피크린(Chloropicrin), 다조메트(Dazomet), 메탐-소듐(Metam-sodium), 니코비펜(Nicobifen), 메트라페논



(Metrafenone), MTF-753(펜티오피라드(Pentiopyrad)), UBF-307(), 디클로시메트(Diclocymet), 프로퀸아지드(Proquinazid), NC-224(아미브롬돌(Ambromdole), 아미숴브롬(Amisulbrom)), KIF-7767(KUF-1204, 피리벤카르브 메틸(Pyribencarb methyl), 메피리카르브(Mepyrincarb)) 및 신젠타 446510(만디프로파미드(Mandipropamid), 디프로만다미드(Dipromandamid)) 등을 들 수 있다.

- [0248] 상기 다른 농약 중의 살충제, 살진드기제, 살선충제 또는 살토양 해충제, 즉 해충 방제제의 유효 성분 화합물 (일반명; 일부 신청 중을 포함함)로서는, 예를 들면
- [0249] 프로페노포스(Profenofos), 디클로르보스(Dichlorvos), 페나미포스(Fenamiphos), 페니트로티온(Fenitrothion), EPN, 다이아지논(Diazinon), 클로르피리포스-메틸(Chlorpyrifos-methyl), 아세페이트(Acephate), 프로티오포스(Prothiofos), 포스티아제이트(Fosthiazate), 포스포카르브(Phosphocarb), 카두사포스(Cadusafos), 디숴포톤(Disulfoton), 클로르피리포스(Chlorpyrifos), 데메톤-S-메틸(Demeton-S-methyl), 디메토에이트(Dimethoate) 및 메타미도포스(Methamidophos)와 같은 유기 인산에스테르계 화합물;
- [0250] 카르바릴(Carbaryl), 프로폭수르(Propoxur), 알디카르브(Aldicarb), 카르보푸란(Carbofuran), 티오디카르브(Thiodicarb), 메토밀(Methomyl), 옥사밀(Oxamyl), 에티오펜카르브(Ethiofencarb), 피리미카르브(Pirimicarb), 페노부카르브(Fenobucarb), 카르보숴판(Carbosulfan) 및 벤푸라카르브(Benfuracarb)와 같은 카르바메이트계 화합물;
- [0251] 카르타프(Cartap), 티오시클람(Thiocyclam) 및 벤숴탑(Bensultap)과 같은 넬라이스톡신 유도체;
- [0252] 디코폴(Dicofol) 및 테트라디폰(Tetradifon)과 같은 유기 염소계 화합물;
- [0253] 펜부타틴 옥시드(Fenbutatin Oxide)와 같은 유기 금속계 화합물;
- [0254] 펜발레레이트(Fenvalerate), 페메트린(Permethrin), 사이페메트린(Cypermethrin), 델타메트린(Deltamethrin), 시할로트린(Cyhalothrin), 테플루트린(Tefluthrin), 에토펜프록스(Ethofenprox), 펜프로파트린(Fenpropathrin), 비펜트린(Bifenthrin)과 같은 피레트로이드계 화합물;
- [0255] 디플루벤주론(Diflubenzuron), 클로르플루아주론(Chlorfluazuron), 테플루벤주론(Teflubenzuron), 플루페녹수론(Flufenoxuron), 루페누론(Lufenuron) 및 노발루론(Novaluron)과 같은 벤조일우레아계 화합물;
- [0256] 메토프렌(Methoprene), 피리프로キシ펜(Pyriproxifen) 및 페녹시카르브(Fenoxycarb)와 같은 유약(幼若) 호르몬형

화합물;

- [0257] 피리다벤(Pyridaben)과 같은 피리다지논계 화합물;
- [0258] 펜피록시메이트(Fenpyroximate), 피프로닐(Fipronil), 테부펜피라드(Tebufenpyrad), 에티프롤(Ethiprole), 톨펜피라드(Tolfenpyrad), 아세토프롤(Acetoprole), 피라플루프롤(Pyrafluprole) 및 피리프롤(Pyriprole)과 같은 피라졸계 화합물;
- [0259] 이미다클로프리트(Imidacloprid), 니텐피람(Nitenpyram), 아세타미프리트(Acetamiprid), 티아클로프리트(Thiacloprid), 티아메톡삼(Thiamethoxam), 클로티아니딘(Clothianidin) 및 디노테푸란(Dinotefuran) 등의 네오니코티노이드;
- [0260] 테부페노지드(Tebufenozide), 메톡시페노지드(Methoxyfenozide) 및 크로마페노지드(Chromafenozide) 등의 히드라진계 화합물;
- [0261] 디니트로계 화합물, 유기 황 화합물, 요소계 화합물, 트리아진계 화합물, 히드라존계 화합물, 또는
- [0262] 기타 화합물로서 플로니카미드(Flonicamid), 부프로페진(Buprofezin), 헥시티아족스(Hexythiazox), 아미트라즈(Amitraz), 클로르디메포름(chlordimeform), 실라플루오펜(Silafluofen), 트리아자메이트(Triazamate), 피메트로진(Pyrimetozine), 피리미디펜(Pyrimidifen), 클로르페나피르(Chlorfenapyr), 인독사카르브(Indoxacarb), 아세퀴노실(Acequinocyl), 에톡사졸(Etoxazole), 시로마진(Cyromazine), 1,3-디클로로프로펜(1,3-dichloropropene), 디아펜티우론(Diafenthiuron), 벤클로티아즈(Benclothiaz), 플루페네림(Flufenimer), 피리다릴(Pyridalyl), 스피로디클로펜(Spirodiclofen), 비페나제이트(Bifenazate), 스피로메시펜(Spiromesifen), 스피로테트라메트(Spirotetramat), 프로파르기트(Propargite), 클로펜테진(Clofentezine), 플루아크리피림(Fluacrypyrim), 메타플루미존(Metaflumizone), 플루벤디아미드(Flubendiamide) 및 시플루메토펴(Cyflumetofen)과 같은 화합물 등을 들 수 있다.
- [0263] 또한, BT제, 곤충 병원 바이러스제, 곤충 병원 사상균제 및 선충 병원 사상균제 등과 같은 미생물 농약
- [0264] 아버멕틴(Avermectin), 에마멕틴-벤조에이트(Emamectin-Benzoate), 밀베멕틴(Milbemectin), 스피노사드(Spinosad), 이버멕틴(Ivermectin) 및 레피멕틴(Lepimectin)과 같은 항생 물질
- [0265] 아자디라크틴(Azadirachtin)과 같은 천연물 등을 들 수 있다.
- [0266] 본 발명의 바람직한 양태는 이하와 같다. 단, 본 발명은 이것으로 한정되지 않는다. 그러나, 본 발명이 이러한 특정 양태로 어떠한 방식으로든 한정되지 않는 것으로 이해되어야 한다.
- [0267] (1) 상기 화학식 I로 표시되는 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0268] (2) 상기 화학식 I 중, A가 X로 치환될 수도 있는 페닐, X로 치환될 수도 있는 나프틸, X로 치환될 수도 있는 복소환 또는 X로 치환될 수도 있는 축합 복소환이고; B가 Y로 치환될 수도 있는 복소환(단, 피리딘은 제외함), Y로 치환될 수도 있는 축합 복소환 또는 Y로 치환될 수도 있는 나프틸이고; X가 할로젠, 알킬(알킬은 할로젠, 히드록시, 알콕시, 할로알콕시, 알킬티오, 알킬술폰, 시클로알킬, 아미노, 모노알킬아미노, 디알킬아미노, 시아노, 알콕시카르보닐 또는 알킬카르보닐옥시로 치환될 수도 있음), 알케닐, 할로알케닐, 알킬닐(알킬닐은 할로젠, 히드록시, 알콕시, 아미노, 히드록시카르보닐, 알콕시카르보닐 또는 트리알킬실릴로 치환될 수도 있음), 히드록시, 시아노옥시, 알콕시(알콕시는 할로젠, 알콕시, 할로알콕시, 알킬티오, 시클로알킬, 모노알킬아미노, 디알킬아미노, 시아노 또는 복소환으로 치환될 수도 있음), 알케닐옥시, 할로알케닐옥시, 알킬닐옥시, 할로알킬닐옥시, 알킬티오(알킬티오는 할로젠, 시클로알킬 또는 시아노로 치환될 수도 있음), 알케닐티오, 할로알케닐티오, 알킬닐티오, 할로알킬닐티오, 알킬술폰, 할로알킬술폰, 알킬술폰, 할로알킬술폰, 할로젠으로 치환될 수도 있는 시클로알킬, 할로젠으로 치환될 수도 있는 시클로알킬옥시, 할로젠으로 치환될 수도 있는 시클로알킬티오, 시아노, 니트로, 포르밀, 페닐(페닐은 할로젠, 알킬, 할로알킬 또는 알콕시로 치환될 수도 있음), 알킬로 치환될 수도 있는 페녹시, 알킬로 치환될 수도 있는 페닐티오, 알킬로 치환될 수도 있는 페닐알킬, 알킬로 치환될 수도 있는 페닐알케닐, 알킬로 치환될 수도 있는 페닐알킬닐, 알킬로 치환될 수도 있는 페닐알킬옥시, 알킬로 치환될 수도 있는 페닐알케닐옥시, 알킬로 치환될 수도 있는 페닐알킬닐옥시, 알킬로 치환될 수도 있는 페닐아미노, -OR⁴, -SR⁵, -NR^{6,7}R, -CO₂R⁸, -C(=O)NR^{8,9}, -SO₂NR^{8,9}, -CH=NR¹⁰ 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; Y가 할로젠, 알킬(알킬은 할로젠, 알콕시, 할로알콕시, 아미노, 모노알킬아미노 또는 디알킬아미노로 치환될 수도 있음), 알케닐, 알킬닐, 히드록시, 알콕시, 할로

알콕시, 알킬티오, 할로알킬티오, 알킬술폰, 할로알킬술폰, 알킬술폰, 할로알킬술폰, 시클로알킬, 시아노, 니트로, 포르밀, $-OR^4$, $-NR^6R^7$, $-CO_2R^8$, $-C(=O)NR^8R^9$, $-SO_2NR^8R^9$ 또는 $-CH=NR^{10}$ 이고; R^1 및 R^2 가 각각 독립적으로 수소 원자, 알킬, 할로알킬, 알콕시알킬, 알케닐, 알키닐 또는 시클로알킬이거나, 또는 R^1 과 R^2 는 하나가 되어 3 내지 6원 포화 탄소환을 형성할 수도 있고; R^3 이 수소 원자, 알킬(알킬은 할로젠, 알콕시, 할로알콕시, 알킬티오, 아미노, 모노알킬아미노, 디알킬아미노 또는 시아노로 치환될 수도 있음), 알케닐, 알키닐, 히드록시, 알콕시, 할로알콕시, 시클로알킬, 시클로알킬옥시, 시아노, 포르밀, $-C(=W^3)R^{11}$, $-C(=W^3)OR^{12}$ 또는 $-S(O)_mR^{12}$ 인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

[0269] (3) A가 X로 치환될 수도 있는 페닐, X로 치환될 수도 있는 나프틸, X로 치환될 수도 있는 복소환 또는 X로 치환될 수도 있는 축합 복소환이고; B가 Y로 치환될 수도 있는 5원 복소환, 피라지닐 또는 Y로 치환될 수도 있는 축합 복소환이고; X가 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시알킬, 디알킬아미노알킬, 알키닐, 트리알킬실릴알킬, 히드록시, 알콕시, 할로알콕시, 알콕시알콕시, 시클로알킬, 니트로, 페닐, 페닐알킬, 할로알킬로 치환될 수도 있는 피리딜옥시, 알킬카르보닐옥시, 알킬술폰옥시 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; Y가 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시, 시클로알킬 또는 포르밀이고; R^1 및 R^2 가 각각 독립적으로 수소 원자 또는 알킬이고; R^3 이 수소 원자, 알킬, 알킬카르보닐 또는 알콕시카르보닐이고; W^1 및 W^2 가 각각 독립적으로 산소 원자 또는 황 원자인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

[0270] (4) 상기 (3)에 있어서, W^1 및 W^2 가 각각 산소 원자인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

[0271] (5) 상기 (3)에 있어서, B가 Y로 치환될 수도 있는 축합 복소환인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

[0272] (6) 상기 (5)에 있어서, 축합 복소환이 벤조푸라닐, 디히드로벤조푸라닐, 벤조디옥사닐 또는 퀴놀린인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

[0273] (7) 상기 (3)에 있어서, B가 Y로 치환될 수도 있는 5원 복소환이고; X가 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알키닐, 히드록시, 알콕시, 할로알콕시, 알콕시알콕시, 시클로알킬, 니트로, 페닐알킬, 할로알킬로 치환될 수도 있는 피리딜옥시, 알킬카르보닐옥시 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; Y가 할로젠, 알킬, 할로알킬 또는 알콕시이고; R^3 이 수소 원자, 알킬카르보닐 또는 알콕시카르보닐이고; W^1 및 W^2 가 각각 산소 원자인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

[0274] (8) 상기 (3) 또는 (7)에 있어서, B가 Y로 치환될 수도 있는 푸릴, Y로 치환될 수도 있는 티에닐, Y로 치환될 수도 있는 피롤릴, Y로 치환될 수도 있는 옥사졸릴, Y로 치환될 수도 있는 이속사졸릴, Y로 치환될 수도 있는 티아졸릴, Y로 치환될 수도 있는 이소티아졸릴, Y로 치환될 수도 있는 피라졸릴 또는 Y로 치환될 수도 있는 티아디아졸릴인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

[0275] (9) 상기 (8)에 있어서, B가 Y로 치환될 수도 있는 푸릴, Y로 치환될 수도 있는 티에닐, Y로 치환될 수도 있는 피롤릴, Y로 치환될 수도 있는 옥사졸릴, Y로 치환될 수도 있는 티아졸릴, Y로 치환될 수도 있는 이소티아졸릴, Y로 치환될 수도 있는 피라졸릴 또는 Y로 치환될 수도 있는 티아디아졸릴인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

[0276] (10) 상기 (9)에 있어서, B가 Y로 치환된 푸릴인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

[0277] (11) 상기 (9)에 있어서, B가 Y로 치환된 티에닐인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

[0278] (12) 상기 (9)에 있어서, B가 Y로 치환된 피라졸릴인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

[0279] (13) 상기 화학식 I-a로 표시되는 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

[0280] (14) 상기 화학식 I-a 중, B가 Y로 치환될 수도 있는 5원 복소환, 피라지닐 또는 Y로 치환될 수도 있는 축합 복소환이고; X^a 가 불소 원자, 염소 원자, 요오드 원자, 알킬, 할로알킬, 알콕시알킬, 디알킬아미노알킬, 알키닐, 트리알킬실릴알킬, 히드록시, 알콕시, 할로알콕시, 알콕시알콕시, 시클로알킬, 니트로, 페닐, 페닐알킬, 할로알킬로 치환될 수도 있는 피리딜옥시, 알킬카르보닐옥시, 알킬술폰옥시 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; Y가 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시, 시클로알킬 또는 포르밀이고; R^1 및 R^2 가 각각 독립적으로 수소 원자 또는 알킬이고; R^3 이 수소 원자, 알킬, 알킬카

르보닐 또는 알콕시카르보닐이고; W^1 및 W^2 가 각각 독립적으로 산소 원자 또는 황 원자인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

- [0281] (15) 상기 (14)에 있어서, W^1 및 W^2 가 각각 산소 원자인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0282] (16) 상기 (14)에 있어서, B가 Y로 치환될 수도 있는 축합 복소환인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0283] (17) 상기 (16)에 있어서, 축합 복소환이 벤조푸라닐, 디히드로벤조푸라닐, 벤조디옥사닐 또는 퀴놀린인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0284] (18) 상기 (14)에 있어서, B가 Y로 치환될 수도 있는 5원 복소환이고; X^n 가 불소 원자, 염소 원자, 요오드 원자, 알킬, 할로알킬, 알키닐, 히드록시, 알콕시, 할로알콕시, 알콕시알콕시, 시클로알킬, 니트로, 페닐알키닐, 할로알킬로 치환될 수도 있는 피리딜옥시, 알킬카르보닐옥시 또는 복소환(복소환은 할로젠, 알킬 또는 알킬카르보닐로 치환될 수도 있음)이고; Y가 할로젠, 알킬, 할로알킬 또는 알콕시이고; R^3 이 수소 원자, 알킬카르보닐 또는 알콕시카르보닐이고; W^1 및 W^2 가 각각 산소 원자인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0285] (19) 상기 (14) 또는 (18)에 있어서, B가 Y로 치환될 수도 있는 푸릴, Y로 치환될 수도 있는 티에닐, Y로 치환될 수도 있는 피롤릴, Y로 치환될 수도 있는 옥사졸릴, Y로 치환될 수도 있는 이속사졸릴, Y로 치환될 수도 있는 티아졸릴, Y로 치환될 수도 있는 이소티아졸릴, Y로 치환될 수도 있는 이미다졸릴, Y로 치환될 수도 있는 피라졸릴 또는 Y로 치환될 수도 있는 티아디아졸릴인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0286] (20) 상기 (19)에 있어서, B가 Y로 치환될 수도 있는 푸릴, Y로 치환될 수도 있는 티에닐, Y로 치환될 수도 있는 피롤릴, Y로 치환될 수도 있는 옥사졸릴, Y로 치환될 수도 있는 이속사졸릴, Y로 치환될 수도 있는 티아졸릴, Y로 치환될 수도 있는 이소티아졸릴, Y로 치환될 수도 있는 피라졸릴 또는 Y로 치환될 수도 있는 티아디아졸릴인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0287] (21) 상기 (20)에 있어서, B가 Y로 치환된 푸릴인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0288] (22) 상기 (20)에 있어서, B가 Y로 치환된 티에닐인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0289] (23) 상기 (20)에 있어서, B가 Y로 치환된 피라졸릴인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0290] (24) 상기 (3) 또는 (14)에 있어서, A가 X로 치환될 수도 있는 페닐, X로 치환될 수도 있는 나프틸, X로 치환될 수도 있는 벤조디옥솔라닐 또는 X로 치환될 수도 있는 벤조디옥사닐이고; B가 Y로 치환될 수도 있는 푸릴, Y로 치환될 수도 있는 티에닐 또는 Y로 치환될 수도 있는 피라졸릴이고; X가 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시 또는 할로알콕시이고; Y는 할로젠, 알킬, 할로알킬, 알콕시 또는 할로알콕시이고; R^3 이 수소 원자이고; W^1 및 W^2 가 각각 산소 원자인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0291] (25) 상기 (24)에 있어서, B가 Y로 치환된 푸릴, Y로 치환된 티에닐 또는 Y로 치환된 피라졸릴인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0292] (26) 상기 (24)에 있어서, B가 Y로 치환된 푸릴, Y로 치환된 티에닐 또는 Y로 치환된 피라졸릴이고, Y가 할로젠, 알킬 또는 할로알킬인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0293] (27) 상기 (24)에 있어서, A가 X로 치환된 페닐 또는 X로 치환된 벤조디옥솔라닐이고, B가 Y로 치환된 푸릴, Y로 치환된 티에닐 또는 Y로 치환된 피라졸릴인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0294] (28) 상기 (24)에 있어서, A가 X로 치환된 페닐 또는 X로 치환된 벤조디옥솔라닐이고, B가 Y로 치환된 푸릴, Y로 치환된 티에닐 또는 Y로 치환된 피라졸릴이고, X가 할로젠, 알킬 또는 알콕시이고, Y가 할로젠, 알킬 또는 할로알킬인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0295] (29) 상기 (24)에 있어서, A가 X로 치환된 페닐 또는 X로 치환된 벤조디옥솔라닐이고, B가 Y로 치환된 푸릴, Y로 치환된 티에닐 또는 Y로 치환된 피라졸릴이고, R^1 및 R^2 가 각각 알킬이고, X가 할로젠, 알킬 또는 알콕시이고, Y가 할로젠, 알킬 또는 할로알킬인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0296] (30) 상기 (24) 내지 (29) 중 어느 하나에 있어서, B가 Y로 치환된 푸릴인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.

- [0297] (31) 상기 (24) 내지 (29) 중 어느 하나에 있어서, B가 Y로 치환된 티에닐인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0298] (32) 상기 (24) 내지 (29) 중 어느 하나에 있어서, B가 Y로 치환된 피라졸릴인 산 아마이드 유도체 또는 그의 염.
- [0299] (33) 상기 (1) 내지 (32) 중 어느 하나에 기재된 산 아마이드 유도체 또는 그의 염을 유효 성분으로서 함유하는 살진균성 조성물.
- [0300] (34) 상기 (1) 내지 (32) 중 어느 하나에 기재된 산 아마이드 유도체 또는 그의 염과, 다른 살진균성 유효 성분 화합물을 유효 성분으로서 함유하는 혼합 살진균성 조성물.
- [0301] (35) 상기 (34)에 있어서, 다른 살진균성 유효 성분 화합물이 아닐리노피리미딘계 화합물, 피리딘아민계 화합물, 아졸계 화합물, 퀴놀살린계 화합물, 디티오카르바메이트계 화합물, 유기 염소계 화합물, 이미다졸계 화합물, 시아노 아세트아미드계 화합물, 페닐아미드계 화합물, 술헤산계 화합물, 구리계 화합물, 이속사졸계 화합물, 유기 인계 화합물, N-할로게노티오알킬계 화합물, 디카르복시이미드계 화합물, 벤즈아닐리드계 화합물, 아닐리드계 화합물, 피페라진계 화합물, 피리딘계 화합물, 카르비놀계 화합물, 피페리딘계 화합물, 모르폴린계 화합물, 유기 주석계 화합물, 요소계 화합물, 신남산계 화합물, 페닐카르바메이트계 화합물, 시아노피롤계 화합물, 스트로빌루린계 화합물, 옥사졸리디논계 화합물, 티아졸카르복스아미드계 화합물, 실릴아미드계 화합물, 아미노산 아마이드 카르바메이트계 화합물, 이미다졸리딘계 화합물, 히드록시아닐리드계 화합물, 벤젠술폰아미드계 화합물, 옥심 에테르계 화합물, 페녹시아미드계 화합물, 항생 물질, 구아니딘계 화합물, 이소프로티올란, 피로퀼론, 디클로메진, 퀴녹시펜, 프로파모카르브 염산염, 스피록사민, 클로로피크린, 다조메트, 메탐-소듐, 니코비펜, 메트라페논, MTF-753, UBF-307, 디클로시메트, 프로퀸아지드, NC-224, KIF-7767 및 신젠타 446510으로 이루어지는 군으로부터 선택되는 1종 이상인 것을 특징으로 하는 혼합 살진균성 조성물.
- [0302] (36) 상기 (35)에 있어서, 다른 살진균성 유효 성분 화합물이 피리딘아민계 화합물, 아졸계 화합물, 디티오카르바메이트계 화합물, 유기 염소계 화합물, 이미다졸계 화합물, 구리계 화합물, 디카르복시이미드계 화합물, 아닐리드계 화합물, 피페라진계 화합물, 피리딘계 화합물, 카르비놀계 화합물, 페닐카르바메이트계 화합물, 시아노피롤계 화합물, 스트로빌루린계 화합물, 히드록시아닐리드계 화합물, MTF-753 및 KIF-7767로 이루어지는 군으로부터 선택되는 1종 이상인 것을 특징으로 하는 혼합 살진균성 조성물.
- [0303] (37) 상기 (36)에 있어서, 다른 살진균성 유효 성분 화합물이 플루아지남, 트리아디메폰, 비터타놀, 트리플루미졸, 에타코나졸, 프로피코나졸, 펜코나졸, 플루실라졸, 마이클로부타닐, 시프로코나졸, 테부코나졸, 헥사코나졸, 피코나졸-시스, 프로클로라즈, 메트코나졸, 에폭시코나졸, 테트라코나졸, 옥스포코나졸, 푸마레이트, 시프로코나졸, 프로티오코나졸, 트리아디메놀, 플루트리아폴, 디페노코나졸, 플루퀸코나졸, 펜부코나졸, 브로무코나졸, 디니코나졸, 트리시클라졸, 프로베나졸, 시메코나졸, 페푸라조에이트, 이프로코나졸, 이미벤코나졸, 마네브, 지네브, 만제브, 폴리카르바메이트, 메티람, 프로피네브, 프탈라이드, 클로로탈로닐, 퀴토젠, 베노밀, 티오파네이트-메틸, 카르벤다짐, 시아조파미드, 수산화 제2 구리, 옥신 구리, 프로시미돈, 이프로디온, 빈클로졸린, 보스칼리드, 디에토펜카르브, 플루디옥소닐, 펜피클로닐, 아족시스트로빈, 크레속심-메틸, 메토미노펜, 트리플록시스트로빈, 피콕시스트로빈, 오리자스트로빈, 디목시스트로빈, 피라클로스트로빈, 플루옥사스트로빈, 플루아크리피림, 펜헥사미드, 폴리옥신, 이미노크타딘, MTF-753 및 KIF-7767로 이루어지는 군으로부터 선택되는 1종 이상인 것을 특징으로 하는 혼합 살진균성 조성물.
- [0304] (38) 상기 (1) 내지 (32) 중 어느 하나에 기재된 산 아마이드 유도체 또는 그의 염의 유효량을 사용하는 것을 포함하는, 유해 진균류를 방제하는 방법.
- [0305] (39) 상기 (1) 내지 (32) 중 어느 하나에 기재된 산 아마이드 유도체 또는 그의 염의 유효량을 사용하는 것을 포함하는, 식물 병해를 방제하는 방법.
- [0306] (40) 상기 (1) 내지 (32) 중 어느 하나에 기재된 산 아마이드 유도체 또는 그의 염의 유효량을 사용하는 것을 포함하는, 작물을 보호하는 방법.
- [0307] (41) 상기 (1) 내지 (32) 중 어느 하나에 기재된 산 아마이드 유도체 또는 그의 염의 유효량을 사용하는 것을 포함하는, 작물의 수확량을 향상시키는 방법.

실시예

- [0308] 이어서 본 발명의 실시예를 기재하지만, 본 발명은 이것으로 한정되지 않는다. 우선, 화학식 I 또는 I-a의 산아미드 유도체 또는 그의 염의 제조예를 기재한다.
- [0309] 제조예 1
- [0310] N-[(3',4'-디클로로-1,1-디메틸)페나실]-2-메틸-3-푸란카르복사미드(후술하는 화합물 No.1-57)의 제조
- [0311] (1) 아연 3.12 g에 3,4-디클로로벤조일클로라이드 10.0 g, 2-브로모이소부티르산에틸 9.31 g 및 에테르 무수물 90 ml의 혼합물을 질소 분위기하에 적당한 후, 환류하에 15 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 셀라이트 여과하고, 여과액을 20% 황산, 이어서 물로 세정하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/19)로 정제하여, 유상(油狀)의 2-(3',4'-디클로로벤조일)이소부티르산에틸 8.7 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다 (Solvent: 용매).
- ¹H-NMR δppm (Solvent : CDCl₃/400 MHz)
- 1.11 (t, 3H), 1.52 (s, 6H), 4.14 (q, 2H), 7.48 (d, 1H), 7.63 (dd, 1H), 7.96 (d, 1H)
- [0312]
- [0313] (2) 2-(3',4'-디클로로벤조일)이소부티르산에틸 8.7 g, 황산 14.2 ml, 물 14.2 ml 및 아세트산 40 ml의 혼합물을 환류하에 15 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 빙수 중에 투입하고, 아세트산에틸로 추출한 후 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/19)로 정제하여, 유상의 3,4-디클로로이소부티로페논 6.47 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.
- ¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃/400 MHz)
- 1.21 (d, 6H), 3.46 (m, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.79 (dd, 1H), 8.02 (d, 1H)
- [0314]
- [0315] (3) 3,4-디클로로이소부티로페논 6.47 g 및 테트라히드로푸란 100 ml의 혼합물에 페닐트리메틸암모늄트리브로마이드 9.32 g을 첨가하고, 실온에서 4 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 여과하고, 여과액을 감압 농축하여 유상의 α-브로모-3,4-디클로로이소부티로페논 6.39 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.
- ¹H-NMR δppm (Solvent : CDCl₃/300 MHz)
- 2.01 (s, 6H), 7.50 (d, 1H), 8.0 (dd, 1H), 8.20 (d, 1H)
- [0316]
- [0317] (4) α-브로모-3,4-디클로로이소부티로페논 6.39 g 및 디메틸술폭시드 60 ml의 혼합물에 아지화나트륨 2.8 g을 첨가하고, 50 °C에서 1 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 수중에 투입하고, 아세트산에틸로 추출한 후 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/9)로 정제하여, 유상의 α-아지드-3,4-디클로로이소부티로페논 6.34 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.
- ¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃/300 MHz)
- 1.60 (s, 6H), 7.53 (d, 1H), 7.97 (dd, 1H), 8.20 (d, 1H)
- [0318]
- [0319] (5) α-아지드-3,4-디클로로이소부티로페논 6.34 g, 테트라히드로푸란 90 ml 및 물 3.2 ml의 혼합물에 트리페닐포스핀 7.74 g을 첨가하고, 실온에서 23 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 잔사에 물, 이어서 염산을 첨가하여 약산성으로 한 후 에테르로 세정하였다. 수층을 수산화나트륨 수용액으로 중화하고, 에테르로 추출하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조하고, 감압 농축하였다. 잔사에 아세트산에틸을 첨가하고, 빙냉하에 염화수소 가스를 도입하며, 발생된 고체를 여과 취출하고 건조하여, α-아미노-3,4-디클로로이소부티로페논염산염 5.92 g을 얻었다.
- [0320] (6) α-아미노-3,4-디클로로이소부티로페논염산염 0.3 g 및 테트라히드로푸란 10 ml의 혼합물에 트리에틸아민 0.31 g을 첨가하고, 실온에서 5 시간 동안 교반하여, 이 혼합물을 감압 농축하였다. 얻어진 잔사, 2-메틸-3-푸란카르복실산 0.195 g 및 디클로로메탄 20 ml의 혼합물에, 빙냉하에 N,N'-디시클로헥실카르보디이미드 0.29 g

및 디클로로메탄 10 ml의 혼합물을 적하한 후, 실온에서 15 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 여과하고, 여과액을 디클로로메탄으로 희석하여, 탄산칼륨 수용액, 이어서 물로 세정하였다. 유기층을 황산나트륨 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/9)로 정제하여, 융점 175 내지 178 °C의 목적물 0.08 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃ /400 MHz)

1.71 (s, 6H), 2.43 (s, 3H), 6.28 (s, 1H), 6.44 (d, 1H), 7.26 (d, 1

H), 7.44 (d, 1H), 7.84 (dd, 1H), 8.11 (d, 1H)

[0321]

제조예 2

[0322]

N-[(3'-디플루오로메톡시-1,1-디메틸)페나실]-5-클로로-1,3-디메틸-4-피라졸카르복사미드(후술하는 화합물 No.1-72)의 제조

[0323]

(1) 3-디플루오로메톡시벤조니트릴 4.09 g 및 에테르 무수물 20 ml의 혼합물에 마그네슘 0.75 g, 2-브로모프로판 4.46 g 및 에테르 무수물 24 ml를 사용하여 제조한 그리냐르 시약을 적하하였다. 적하 종료 후, 실온에서 27 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 빙수 중에 투입하고, 6 N 황산을 첨가하여 약산성으로 한 후 0.5 시간 동안 교반하였다. 이 혼합물을 에테르로 추출하여 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/19)로 정제하여, 3-디플루오로메톡시이소부티로페논 2.04 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

[0324]

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃ /300 MHz)

1.23 (d, 6H), 3.52 (m, 1H), 6.56 (t, 1H), 7.32 (dd, 1H), 7.48 (t,

1H), 7.70 (s, 1H), 7.80 (d, 1H)

[0325]

(2) 3-디플루오로메톡시이소부티로페논 2.04 g 및 테트라히드로푸란 30 ml의 혼합물에 페닐트리메틸암모늄트리브로마이드 3.58 g을 첨가하고, 실온에서 2 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 여과하고, 여과액을 감압 농축하여 유상의 α-브로모-3-디플루오로메톡시이소부티로페논 2.79 g을 얻었다.

[0326]

(3) α-브로모-3-디플루오로메톡시이소부티로페논 2.79 g 및 디메틸술폭사이드 35 ml의 혼합물에 아지화나트륨 1.24 g을 첨가하고, 50 °C에서 1 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 수중에 투입하고, 아세트산에틸로 추출한 후 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/9)로 정제하여, 유상의 α-아지드-3-디플루오로메톡시이소부티로페논 2.21 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

[0327]

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃ /300 MHz)

1.61 (s, 6H), 6.56 (t, 1H), 7.34 (dd, 1H), 7.48 (t, 1H), 7.86 (s,

1H), 7.98 (d, 1H)

[0328]

(4) α-아지드-3-디플루오로메톡시이소부티로페논 2.18 g, 메탄올 35 ml 및 5% 팔라듐탄소 0.109 g의 혼합물을, 수소 분위기하에 실온에서 1.5 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 셀라이트 여과하고, 여과액을 감압 농축하였다. 잔사에 아세트산에틸을 첨가하고, 빙냉하에 염화수소 가스를 도입한 후 감압 농축하여, α-아미노-3-디플루오로메톡시이소부티로페논염산염 1.76 g을 얻었다.

[0329]

(5) α-아미노-3-디플루오로메톡시이소부티로페논염산염 0.3 g 및 테트라히드로푸란 10 ml의 혼합물에 트리에틸아민 0.33 g을 첨가하고, 여기에 5-클로로-1,3-디메틸-4-피라졸카르보닐클로라이드 0.25 g 및 테트라히드로푸란 5 ml의 혼합물을 빙냉하에 적하하였다. 적하 종료 후, 실온에서 3 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 아세트산에틸로 추출하여 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/4)로 정제하여, 융점 138 내지 139 °C의 목적물 0.23 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

[0330]

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃ /400 MHz)

1.75 (s, 6H), 2.28 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 6.50 (t, 1H), 6.80 (s, 1

H), 7.23 (dd, 1H), 7.38 (t, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.86 (d, 1H)

[0331]

- [0332] 제조예 3
- [0333] N-[2-(2'-나프틸카르보닐)-2-프로필]-5-클로로-1,3-디메틸-4-피라졸카르복스아미드(화합물 No.2-1)의 제조
- [0334] (1) 2-나프토니트릴 3.0 g 및 에테르 무수물 20 ml의 혼합물에 마그네슘 0.61 g, 2-브로모프로판 3.6 g 및 에테르 무수물 18 ml를 사용하여 제조한 그리나르 시약을 적하하였다. 적하 종료 후, 환류하에 12 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 빙수 중에 투입하고, 6 N 황산을 첨가하여 약산성으로 한 후 0.5 시간 동안 교반하였다. 이 혼합물을 아세트산에틸로 추출하여 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/50)로 정제하여, 2-나프틸이소프로필케톤 1.14 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃ /400 MHz)

1.27 (d, 6H), 3.73 (m, 1H), 7.53 to 7.65 (m, 2H), 7.86 to

- [0335] 7.92 (m, 2H), 7.97 (d, 1H), 8.03 (dd, 1H), 8.48 (d, 1H)

- [0336] (2) 2-나프틸이소프로필케톤 1.14 g 및 테트라히드로푸란 25 ml의 혼합물에 페닐트리메틸암모늄트리브로마이드 2.16 g을 첨가하고, 실온에서 3 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 여과하고, 여과액을 감압 농축하여 유상의 α-브로모이소프로필 2-나프틸케톤 1.59 g을 얻었다.

- [0337] (3) α-브로모이소프로필 2-나프틸케톤 1.59 g 및 디메틸술폭시드 40 ml의 혼합물에 아지화나트륨 0.75 g을 첨가하고, 50 °C에서 1.5 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 수중에 투입하고, 아세트산에틸로 추출한 후 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/9)로 정제하여, 유상의 α-아지드이소프로필 2-나프틸케톤 1.19 g을 얻었다.

- [0338] 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃ /400 MHz)

1.68 (s, 1H), 7.54 to 7.66 (m, 2H), 7.86 to

- [0339] 7.90 (m, 2H), 7.98 (d, 1H), 8.10 (dd, 1H), 8.74 (d, 1H)

- [0340] (4) α-아지드이소프로필 2-나프틸케톤 0.3 g, 메탄올 10 ml 및 5% 팔라듐탄소 15 mg의 혼합물을, 수소 분위기 하에 실온에서 1 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 셀라이트 여과하고, 여과액을 감압 농축하여 유상의 α-아미노이소프로필 2-나프틸케톤 0.26 g을 얻었다.

- [0341] (5) α-아미노이소프로필 2-나프틸케톤 0.26 g 및 테트라히드로푸란 10 ml의 혼합물에 트리에틸아민 0.19 g을 첨가하고, 여기에 5-클로로-1,3-디메틸-4-피라졸카르보닐클로라이드 0.24 g 및 테트라히드로푸란 5 ml의 혼합물을 빙냉하에 적하하였다. 적하 종료 후, 실온에서 15 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 아세트산에틸로 추출하여 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=2/3)로 정제하여, 용점 145 내지 147 °C의 목적물 0.15 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃ /300 MHz)

1.87 (s, 6H), 2.28 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 7.05 (s, 1H), 7.48 to

- [0342] 7.58 (m, 2H), 7.80 to 7.90 (m, 3H), 8.05 (dd, 1H), 8.56 (d, 1H)

- [0343] 제조예 4

- [0344] N-[2-[(2', 2', 3', 3'-테트라플루오로-1', 4'-벤조디옥산-6'-일)카르보닐]이소프로필]-3-메틸-2-티오펜 카르복스아미드(후술하는 화합물 No.4-10)의 제조

- [0345] (1) 6-브로모-2,2,3,3-테트라플루오로-1,4-벤조디옥산 3.0 g 및 디에틸에테르 38 ml의 혼합물에, 질소 분위기에 -50 °C에서 n-부틸리튬(1.57 M n-헥산 용액) 7.3 ml를 적하한 후, 동일한 온도에서 30분간 교반하였다. 여기에 -70 °C 이하에서 이소부틸알데히드 0.83 g을 적하한 후, 실온까지 승온하여 15 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 수중에 투입하고, 염산으로 약산성으로 하여, 디에틸에테르로 추출하였다. 유기층을 수세하고, 황산마그네슘으로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/9)로 정제하여, 유상의 1-(2', 2', 3', 3'-테트라플루오로-1', 4'-벤조디옥산-6'-일)-2-메틸프로판올

1.8 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃/400 MHz)
0.83 (d, 3H), 0.96 (d, 3H), 1.92 (m, 1H), 4.40 (d, 1H), 6.90 (d, 1H), 7.10 (s, 2H), 7.14 (s, 1H)

[0346]

(2) 클로로크롬산피리디늄 2.08 g, 아세트산나트륨 1.05 g 및 디클로로메탄 20 ml의 혼합물에, 1-(2',2',3',3'-테트라플루오로-1',4'-벤조디옥산-6'-일)-2-메틸프로판올 1.8 g 및 디클로로메탄 7 ml의 혼합물을 첨가하고, 실온에서 2 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 셀라이트 여과하고, 여과액을 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/19)로 정제하여, 유상의 2,2,3,3-테트라플루오로-1,4-벤조디옥산-6-일 이소프로필 케톤 1.40 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃/400 MHz)
1.23 (d, 6H), 3.48 (m, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.81 (dd,

[0348]

1H)

(3) 2,2,3,3-테트라플루오로-1,4-벤조디옥산-6-일 이소프로필 케톤 1.40 g 및 테트라히드로푸란 19.7 ml의 혼합물에 페닐트리메틸암모늄트리브로마이드 1.89 g을 첨가하고, 실온에서 2 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 여과하고, 여과액을 감압 농축하여 유상의 α-브로모이소프로필 2,2,3,3-테트라플루오로-1,4-벤조디옥산-6-일 케톤 1.78 g을 얻었다.

[0349]

(4) α-브로모이소프로필 2,2,3,3-테트라플루오로-1,4-벤조디옥산-6-일 케톤 1.78 g 및 디메틸술폭시드 10 ml의 혼합물에 아지화나트륨 0.65 g을 첨가하고, 50 °C에서 2 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 수중에 투입하고, 디에틸에테르로 추출한 후 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/19)로 정제하여, 유상의 α-아지드이소프로필 2,2,3,3-테트라플루오로-1,4-벤조디옥산-6-일 케톤 1.5 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

[0350]

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃/400 MHz)
1.61 (s, 6H), 7.23 (d, 1H), 8.01 to 8.03 (m, 2H)

[0351]

(5) α-아지드이소프로필 2,2,3,3-테트라플루오로-1,4-벤조디옥산-6-일 케톤 0.25 g, 메탄올 15 ml 및 5% 팔라듐탄소 13 mg의 혼합물을, 수소 분위기하에 실온에서 1 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 셀라이트 여과하고, 여과액을 감압 농축하여 유상의 α-아미노이소프로필 2,2,3,3-테트라플루오로-1,4-벤조디옥산-6-일 케톤 0.23 g을 얻었다.

[0352]

(6) α-아미노이소프로필 2,2,3,3-테트라플루오로-1,4-벤조디옥산-6-일 케톤 0.23 g 및 테트라히드로푸란 10 ml의 혼합물에 트리에틸아민 0.16 g을 첨가하고, 여기에 3-메틸-2-티오펜카르보닐클로라이드 0.13 g 및 테트라히드로푸란 5 ml의 혼합물을 빙냉하에 적하한 후, 실온에서 3 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 아세트산에틸로 추출하여 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/4)로 정제하여, 용점 120 내지 122 °C의 목적물 0.23 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

[0353]

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃/300 MHz)
1.76 (s, 6H), 2.39 (s, 3H), 6.54 (s, 1H), 6.84 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.96 (s, 1H)

[0354]

제조예 5

[0355]

N-[(3',4'-디클로로-1,1-디메틸)페나실]-3-메틸-2-티오펜 카르복스아미드(후술하는 화합물 No.1-20)의 제조

[0356]

상기 제조예 1 (1) 내지 (5)의 방법에 준하여 얻은 α-아미노-3,4-디클로로이소부티로페논염산염 268 mg과 테트라히드로푸란 5 ml의 혼합물에, 트리에틸아민 303 mg을 첨가하고, 여기에 3-메틸-2-티오펜카르보닐클로라이드 265 mg 및 테트라히드로푸란 2.5 ml의 혼합물을 빙냉하에 적하하였다. 적하 종료 후, 실온에서 3 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 아세트산에틸로 추출하여 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/3)로 정제하여,

[0357]

용점 141 °C의 목적물 180 mg을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃/400 MHz)
 1.72 (s, 6H), 2.37 (s, 3H), 6.53 (s, 1H), 6.85 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.86 (dd, 1H), 8.13 (s, 1H)

[0358]

제조예 6

[0359]

N-[(4'-메톡시-2'-메틸-1,1-디메틸)페나실]-3-메틸-2-티오펜 카르복사미드(후술하는 화합물 No.1-160)의 제조

[0360]

(1) 염화알루미늄 7.15 g 및 이황화탄소 20 ml의 혼합물에 이소부틸클로라이드 5.7 g 및 이황화탄소 5 ml의 혼합물을 10 °C 이하에서 적하하고, 0.5 시간 동안 반응시켰다. 이어서 m-크레졸 5.0 g 및 이황화탄소 5 ml의 혼합물을 5 °C 이하에서 적하한 후, 실온에서 4 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 빙수 및 염산의 혼합물 중에 투입하고, 염화메틸렌으로 추출한 후 수세하였다. 유기층을 황산나트륨 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사에 테트라히드로푸란 60 ml, 물 30 ml 및 수산화나트륨 3.7 g을 첨가하고, 실온에서 1.5 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 감압 농축한 후, 빙수 중에 투입하여 회류산으로 약산성으로 하고, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/9)로 정제하여, 고체의 4-히드록시-2-메틸이소부티로페논 2.45 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

[0361]

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃/400 MHz)
 1.15 (d, 6H), 2.43 (s, 3H), 3.40 (m, 1H), 6.70 (m, 2H), 7.57 (d, 1H)

[0362]

(2) 4-히드록시-2-메틸이소부티로페논 0.8 g, 탄산칼륨 0.68 g 및 디메틸포름아미드 15 ml의 혼합물에 황산디메틸 0.62 g 및 디메틸포름아미드 3 ml의 혼합물을 첨가하여 실온에서 3 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 수중에 투입하고, 아세트산에틸로 추출하여 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/9)로 정제하여, 유상의 4-메톡시-2-메틸이소부티로페논 0.59 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

[0363]

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃/400 MHz)
 1.13 (d, 6H), 2.46 (s, 1H), 3.38 (m, 1H), 6.72 (m, 2H), 7.59 (d, 1H)

[0364]

(3) 4-메톡시-2-메틸이소부티로페논 0.59 g 및 테트라히드로푸란 15 ml의 혼합물에 페닐트리메틸암모늄트리브로마이드 1.16 g을 첨가하고, 실온에서 2.5 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물에 에테르를 첨가하여 불용물을 여과 분별하고, 여과액을 감압 농축하여, 유상의 α-브로모-4-메톡시-2-메틸이소부티로페논 0.7 g을 얻었다.

[0365]

(4) α-브로모-4-메톡시-2-메틸이소부티로페논 0.7 g 및 디메틸술폭시드 8 ml의 혼합물에 아지화나트륨 0.4 g을 첨가하고, 50 °C에서 1.5 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 수중에 투입하고, 아세트산에틸로 추출한 후 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/9)로 정제하여, 유상의 α-아지드-4-메톡시-2-메틸이소부티로페논 0.67 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

[0366]

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃/300 MHz)
 1.54 (s, 6H), 2.33 (s, 1H), 3.81 (s, 3H), 6.72 (dd, 1H), 6.75 (d, 1H), 7.61 (d, 1H)

[0367]

(5) α-아지드-4-메톡시-2-메틸이소부티로페논 0.25 g, 메탄올 10 ml 및 5% 팔라듐탄소 13 mg의 혼합물을, 수소 분위기하에 실온에서 3 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 셀라이트 여과하고, 여과액을 감압 농축하여, 유상의 α-아미노-4-메톡시-2-메틸이소부티로페논 0.23 g을 얻었다.

[0368]

(6) α-아미노-4-메톡시-2-메틸이소부티로페논 0.22 g 및 테트라히드로푸란 12 ml의 혼합물에 트리에틸아민 0.13 g을 첨가하고, 여기에 3-메틸-2-티오펜카르보닐클로라이드 0.17 g 및 테트라히드로푸란 3 ml의 혼합물을 빙냉하에 적하하였다. 적하 종료 후, 실온에서 2 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 아세트산에틸로 추출

[0369]

하여 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/3)로 정제하여, 용점 99 내지 101 °C의 목적물 0.35 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃ /300 MHz)

1.77 (s, 6H), 2.38 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 6.81 (dd, 1H), 6.71 (s, 1H), 6.85 (m, 2H), 7.26 (d, 1H), 7.49 (d, 1H)

[0370]

제조예 7

[0371]

N-[(3',4'-디메톡시-1,1-디메틸)페나실]-3-메틸-2-티오펜 카르복스아미드(후술하는 화합물 No.1-535)의 제조

[0372]

(1) 3,4-디메톡시벤즈알데히드 5.0 g 및 에테르 50 ml의 혼합물에 2-브로모프로판 5.6 g, 마그네슘 0.94 g 및 에테르 30 ml로 제조한 이소프로필마그네슘브로마이드에테르 용액을 적하하고, 환류하에 15 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 빙수 중에 투입하고, 희류산을 첨가하여 교반한 후 염화메틸렌으로 추출하여 수세하였다. 유기층을 황산나트륨 무수물로 건조한 후 감압 농축하여, 유상의 1-(3',4'-디메톡시페닐)-2-메틸프로판올 6.3 g을 얻었다.

[0373]

(2) 클로로크롬산피리디늄 6.5 g, 아세트산나트륨 4.9 g 및 디클로로메탄 100 ml의 혼합물에, 1-(3',4'-디메톡시페닐)-2-메틸프로판올 6.28 g 및 디클로로메탄 30 ml의 혼합물을 첨가하고, 실온에서 15 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 셀라이트 여과하고, 여과액을 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=3/7)로 정제하여, 유상의 3,4-디메톡시이소부티로페논 3.9 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

[0374]

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃ /400 MHz)

1.70 (d, 6H), 3.50 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 6.85 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.56 (dd, 1H)

[0375]

(3) 3,4-디메톡시이소부티로페논 1.0 g 및 테트라히드로푸란 20 ml의 혼합물에 페닐트리메틸암모늄트리브로마이드 1.81 g을 첨가하고, 실온에서 2 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물에 에테르를 첨가하여 불용물을 여과 분별하고, 여과액을 감압 농축하여, 유상의 α-브로모-3,4-디메톡시이소부티로페논을 얻었다.

[0376]

(4) α-브로모-3,4-디메톡시이소부티로페논 및 디메틸술폭시드 20 ml의 혼합물에 아지화나트륨 0.62 g을 첨가하고, 50 °C에서 1.5 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 수중에 투입하고, 아세트산에틸로 추출한 후 수세하였다. 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=1/4)로 정제하여, 유상의 α-아지드-3,4-디메톡시이소부티로페논 1.1 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

[0377]

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃ /400 MHz)

1.56 (s, 6H), 3.91 (s, 3H), 3.93 (s, 3H), 6.86 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.94 (dd, 1H)

[0378]

(5) α-아지드-3,4-디메톡시이소부티로페논 0.25 g, 메탄올 15 ml 및 5% 팔라듐탄소 13 mg의 혼합물을, 수소 분위기하에 실온에서 3 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 셀라이트 여과하고, 여과액을 감압 농축하여 유상의 α-아미노-3,4-디메톡시이소부티로페논 0.2 g을 얻었다.

[0379]

(6) α-아미노-3,4-디메톡시이소부티로페논 0.2 g 및 1,2-디클로로에탄 12 ml의 혼합물에 트리에틸아민 0.11 g을 첨가하고, 여기에 3-메틸-2-티오펜카르보닐클로라이드 0.14 g 및 1,2-디클로로에탄 2 ml의 혼합물을 빙냉하에 적하하였다. 적하 종료 후, 실온에서 1.5 시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 염화메틸렌으로 추출하여 수세하였다. 유기층을 황산나트륨 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(전개 용매: 아세트산에틸/n-헥산=3/2)로 정제하여, 용점 138 내지 140 °C의 목적물 0.1 g을 얻었다. 이것의 NMR 스펙트럼 데이터는 이하와 같다.

[0380]

¹H-NMR δppm (Solvent: CDCl₃/300 MHz)

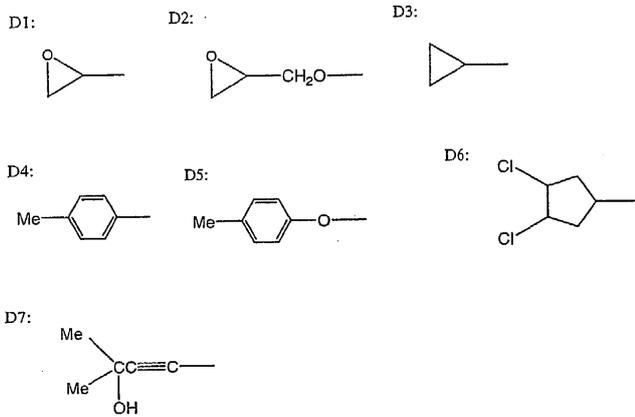
1.82 (s, 6H), 2.44 (s, 3H), 3.89 (s, 6H), 6.80 (d, 1H), 6.85 (d, 1

H), 6.88 (s, 1H), 7.23 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.75 (dd, 1H)

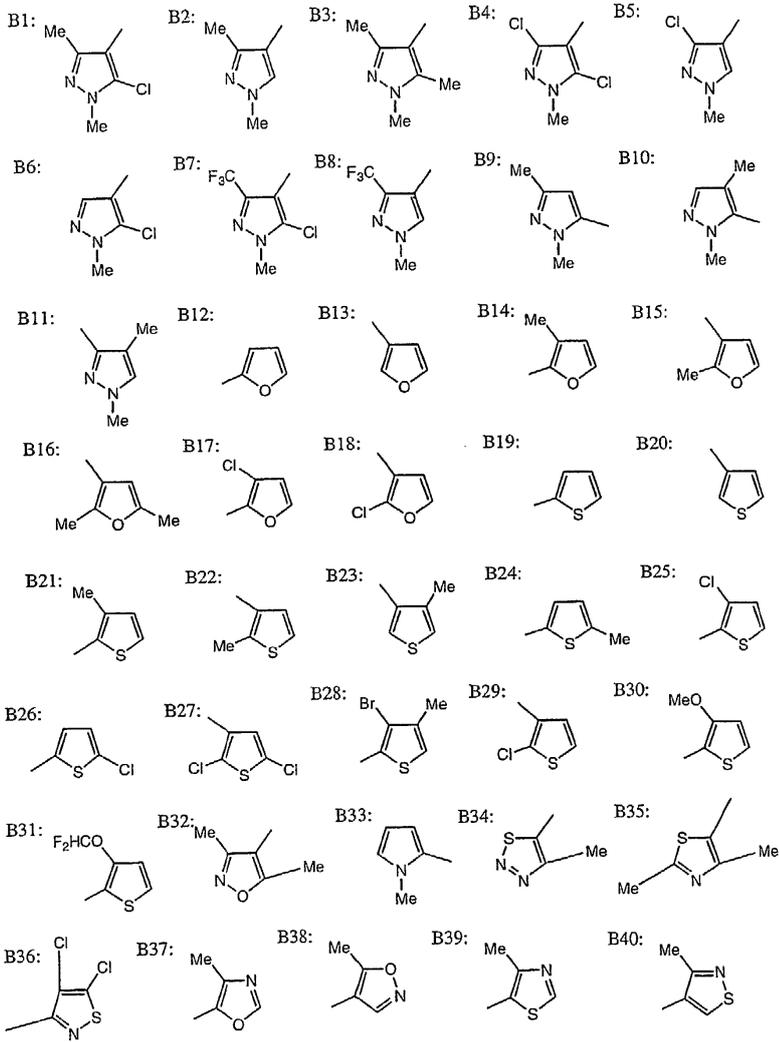
[0381]

[0382] 이어서, 화학식 I 또는 I-a의 산 아마이드 유도체 또는 그의 염의 대표예를 표 1 내지 표 9에 구체적으로 나타낸다. 이들 화합물은 상기 제조에 또는 상기한 다양한 제조 방법에 기초하여 제조할 수 있다.

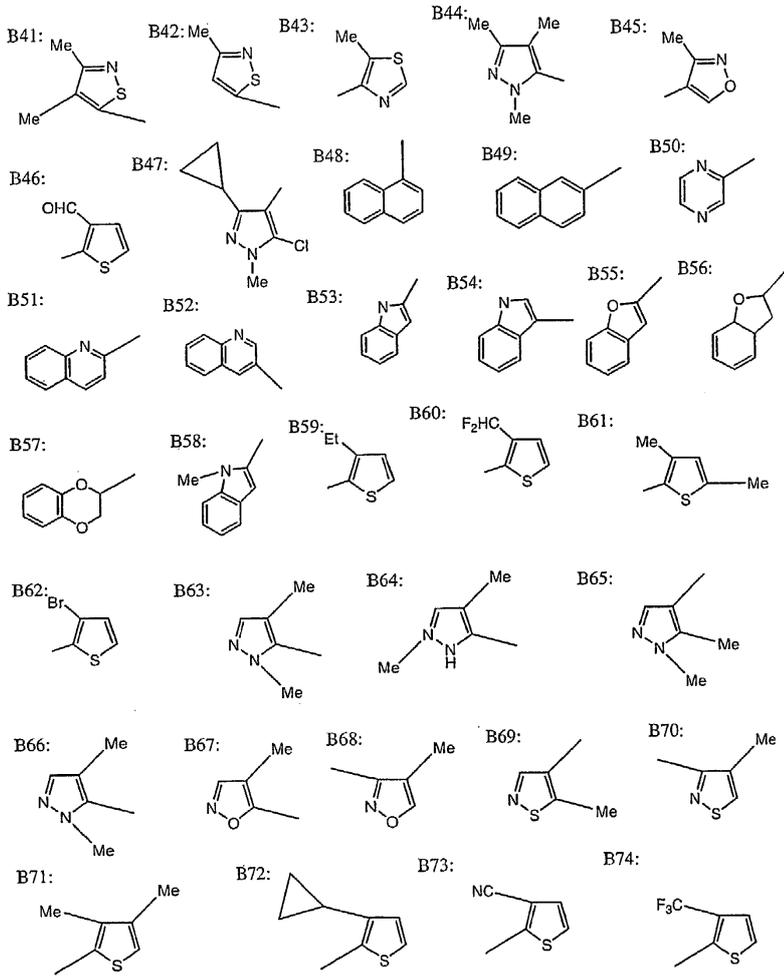
[0383] 표 중, No.는 화합물 No.를 나타내고, Me는 메틸, Et는 에틸, Pr(i)는 이소프로필, Pr(n)은 n-프로필, Bu(t)는 tert-부틸, Bu(n)은 n-부틸, Bu(sec)는 sec-부틸, CO는 카르보닐, CO₂는 카르복실을, Ph는 페닐을 각각 나타낸다. 또한, 표 중 Ph(4-Cl)이라는 것은, 4위치에 염소 원자가 치환된 페닐을 나타내고, Ph(3,4-Cl₂)이라는 것은, 3위치와 4위치에 각각 염소 원자가 치환된 페닐을 나타내고, 기타 동일한 기재도 이들에 준한다. 또한, 표 중에서 사용한 약호 D1 내지 D7 및 B1 내지 B117은, 각각 이하의 치환기를 나타낸다.



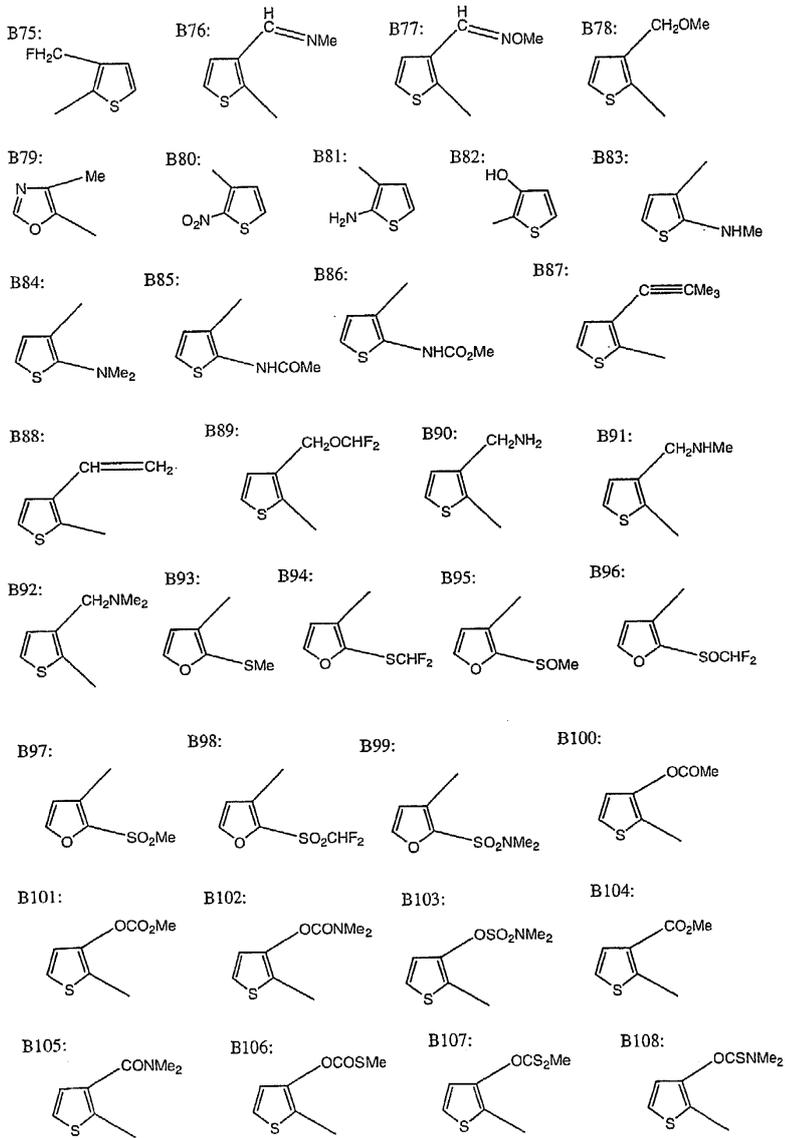
[0384]



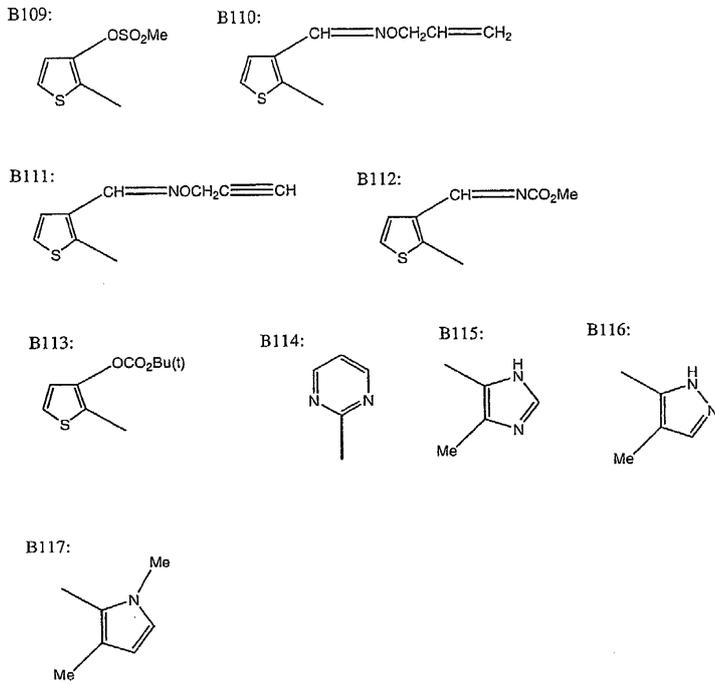
[0385]



[0386]

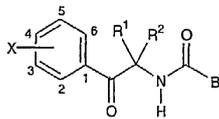


[0387]



[0388]

표 1



No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 ℃)
1-1	Me	Me	2-Me-4-F	B1	132-134
1-2	Me	Me	2-Me-4-F	B5	
1-3	Me	Me	2-Me-4-F	B8	
1-4	Me	Me	2-Me-4-Cl	B1	141-143
1-5	Me	Me	2-Me-4-Cl	B5	
1-6	Me	Me	2-Me-4-Cl	B21	96-100
1-7	Me	Me	2-Me-4-Br	B16	138-140
1-8	Me	Me	2-Me-4-Br	B8	
1-9	Me	Me	2-Me-4-Br	B21	108-110
1-10	Me	Me	4-Cl	B1	186-188
1-11	Me	Me	4-Cl	B16	184-186
1-12	Me	Me	H	B7	168-170
1-13	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B1	188-189
1-14	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B16	170-173
1-15	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B7	182-183
1-16	Me	Me	3-Cl	B1	112-113
1-17	Me	Me	3-Cl	B16	150-151
1-18	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B2	200-201
1-19	Me	Me	4-Br	B21	174
1-20	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B21	141
1-21	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B25	비정질
1-22	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B14	137
1-23	No.1-22의 나트륨염				
1-24	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B24	고체
1-25	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B26	229
1-26	Me	Me	3-Br	B25	149
1-27	Me	Me	3-Br	B21	119
1-28	Me	Me	3-Me	B21	유상
1-29	Me	Me	3-CF ₃	B21	비정질
1-30	Me	Me	3-OMe	B21	128

[0389]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 ℃)
1-31	Me	Me	3-OCHF ₂	B21	110
1-32	Me	Me	4-Cl	B21	175
1-33	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B9	126-130
1-34	Me	Me	H	B1	103-105
1-35	Me	Me	4-Br	B19	235-240
1-36	Me	Me	4-Br	B16	183-185
1-37	Me	Me	4-Br	B20	245-247
1-38	Me	Me	3-Cl	B2	141-142
1-39	Me	Me	4-Cl	B2	140-141
1-40	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B12	225-227
1-41	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B5	171-172
1-42	Me	Me	3-F-4-F	B1	134-136
1-43	Me	Me	3-F-4-F	B16	150-152
1-44	Me	Me	2-Cl	B1	144-145
1-45	Me	Me	2-Cl	B16	130-132
1-46	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B6	크레
1-47	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B4	150-152
1-48	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B27	140-141
1-49	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B3	141-146
1-50	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B10	
1-51	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B11	
1-52	Me	Me	4-Br	B1	183-185
1-53	Me	Me	3-Cl-5-Cl	B16	168-170
1-54	Me	Me	3-Cl-5-Cl	B1	152-153
1-55	Me	Me	3-Br	B16	143-145
1-56	Me	Me	3-Br	B1	151-152
1-57	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B15	175-178
1-58	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B17	
1-59	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B18	
1-60	Me	Me	2-Cl-4-Cl	B16	165-167
1-61	Me	Me	2-Cl-4-Cl	B1	170-171

[0390]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 ℃)
1-62	Me	Me	3-Me	B16	133-135
1-63	Me	Me	3-Me	B1	145-146
1-64	Me	Me	3-CF ₃	B16	125-127
1-65	Me	Me	3-CF ₃	B1	120-121
1-66	Me	Me	3-Cl	B21	128-130
1-67	Me	Me	3-Cl	B25	161-162
1-68	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B29	
1-69	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B30	93-96
1-70	Me	Et	3-Cl-4-Cl	B21	
1-71	Me	Me	3-OCHF ₂	B16	121-123
1-72	Me	Me	3-OCHF ₂	B1	138-139
1-73	Me	Me	3-OMe	B16	116-118
1-74	Me	Me	3-OMe	B1	118-120
1-75	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B22	155-158
1-76	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B31	유상
1-77	Me	Me	3-Me-4-Me	B21	101-102
1-78	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B23	220-222
1-79	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B28	109-110
1-80	Me	Me	3-Cl-4-F	B21	124-126
1-81	Me	Me	3-Cl-4-F	B16	
1-82	Me	Me	3-Cl-4-F	B1	
1-83	-(CH ₂) ₅ -		4-Br	B7	
1-84	-(CH ₂) ₅ -		4-Br	B11	
1-85	Me	Me	3,4-(OCHF ₂) ₂	B1	
1-86	Me	Me	3,4-(OCHF ₂) ₂	B21	147-150
1-87	Me	Me	4-OCF ₃	B1	
1-88	Me	Me	3-OCF ₃	B21	
1-89	Me	Me	4-CF ₃	B1	
1-90	Me	Me	4-CF ₃	B21	113-115
1-91	Me	Me	4-CF ₃	B15	
1-92	Me	Me	4-CF ₃	B11	
1-93	Me	Me	3-Me-4-Me	B16	133-135
1-94	Me	Me	4-NO ₂	B16	179-180
1-95	Me	Me	4-NO ₂	B1	168-170

[0391]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 °C)
1-96	Me	Me	4-NO ₂	B21	135-137
1-97	Me	Me	3-Me-4-Me	B1	130-132
1-98	Me	Me	2-Me-4-OCHF ₂	B21	112-114
1-99	Me	Me	3-Cl-5-Cl	B21	137-140
1-100	Me	Me	3-Cl-4-Br	B21	120-121
1-101	Me	Me	3-Me-4-Cl	B21	108-112
1-102	Me	Me	3-Br-4-Cl	B21	117-120
1-103	Me	Me	3-Cl-4-Me	B21	115-118
1-104	Me	Me	2-Me-4-F	B21	107-109
1-105	Me	Me	4-Me	B21	152-154
1-106	Me	Me	4-OCF ₃	B21	116-120
1-107	Me	Me	3-Br-4-OCF ₃	B21	107-111
1-108	Me	Me	3-CF ₃ -4-Cl	B21	133-135
1-109	Me	Me	3-Cl-4-Br	B1	105-109
1-110	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B19	192-195
1-111	Me	Me	4-OCH ₂ CF ₃	B21	134-138
1-112	Me	Me	4-OCHF ₂	B21	118-120
1-113	Me	Me	3-OMe-4-Cl	B21	154-159
1-114	Me	Me	3-Me-4-OCF ₃	B21	116-118
1-115	Me	Me	3-Cl-4-Me-5-Me	B21	107-114
1-116	Me	Me	2-Cl-3-Cl-4-Cl	B1	133-137
1-117	Me	Me	2-Me-3-Cl-4-Cl	B1	94-98
1-118	Me	Me	2-Cl-3-Cl-4-Cl	B21	112-115
1-119	Me	Me	2-Me-3-Cl-4-Cl	B21	90-95
1-120	Me	Me	2-Me-3-Me-4-Cl	B21	유상
1-121	Me	Me	2-Cl-3-Me-4-Me	B21	유상
1-122	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B8	200-202
1-123	Me	H	4-Cl	B16	유상
1-124	Me	Me	4-Br	B39	126-129
1-125	Me	Me	4-Bu(t)	B21	130-134
1-126	Me	Me	4-Bu(t)	B1	161-165
1-127	Me	Me	3-Me-4-Cl	B21	108-112
1-128	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B37	157-159
1-129	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B43	120-125
1-130	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B44	165-170

[0392]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 ℃)
1-131	Me	Me	4-(2-티에닐)	B21	119.2
1-132	Me	Me	4-(5-Me-2-티에닐)	B21	176.8
1-133	Me	Me	4-(2-푸릴)	B21	>300
1-134	Me	Me	4-(3-티에닐)	B21	>300
1-135	Me	Me	4-(5-C1-2-티에닐)	B21	153.5
1-136	Me	Me	4-(2-Me-3-티에닐)	B21	점성상
1-137	Me	Me	4-(5-COMe-2-티에닐)	B21	199.2
1-138	Me	Me	3-(2-티에닐)	B21	134.2
1-139	Me	Me	3-(3-티에닐)	B21	>300
1-140	Me	Me	3-(5-COMe-2-티에닐)	B21	유상
1-141	Me	Me	3-(5-C1-2-티에닐)	B21	141.7
1-142	Me	Me	3-(5-Me-2-티에닐)	B21	137.8
1-143	Me	Me	3-(4-Me-3-티에닐)	B21	비정질
1-144	Me	Me	3-(2-푸릴)	B21	고체
1-145	Me	Me	3-C1-4-C1	B32	135-137
1-146	Me	Me	3-C1-4-C1	B33	164
1-147	Me	Me	3-C1-4-C1	B34	153-154
1-148	Me	Me	3-C1-4-C1	B35	고체
1-149	Me	Me	3-C1-4-C1	B36	고체
1-150	Me	Me	3-C1-4-C1	B39	142-145
1-151	Me	Me	3-C1-4-C1	B40	145-146
1-152	Me	Me	3-C1-4-C1	B79	140-142
1-153	Me	Me	3-C1-4-C1	B38	165-166
1-154	Me	Me	3-C1-4-C1	B41	136-140
1-155	Me	Me	3-C1-4-C1	B42	175-178
1-156	Me	Me	3-C1-4-C1	B45	175-177
1-157	Me	Me	3-C1-4-C1	B46	유상
1-158	Me	Me	4-(5-CF ₃ -피리딘-2-일옥시)	B1	127-128
1-159	Me	Me	4-(5-CF ₃ -피리딘-2-일옥시)	B21	138-140
1-160	Me	Me	2-Me-4-OMe	B21	99-101
1-161	Me	Me	2-Me-4-OEt	B21	85-88
1-162	Me	Me	2-Me-4-CF ₃	B21	110-113
1-163	Me	Me	2-Me-4-Me	B21	102-105
1-164	Me	Me	2-Me	B21	79-82
1-165	Me	Me	2-Me-3-C1	B21	109-111

[0393]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 ℃)
1-166	Me	Me	2-Br-4-CF ₃	B21	90-92
1-167	Me	Me	3-Br-4-Br	B21	127-130
1-168	Me	Me	3-Me-4-OCHF ₂	B21	100-106
1-169	Me	Me	4-[D3]	B21	107-109
1-170	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B59	139-145
1-171	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B60	139-141
1-172	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B61	140-142
1-173	H	H	4-Cl	B21	119-121
1-174	Me	Me	2-Me-4-OPr	B21	97-100
1-175	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B62	89-92
1-176	Me	Me	3-Me-4-OMe	B21	123-125
1-177	Me	Me	3-Cl-4-OMe	B21	161-164
1-178	Me	Me	2-Me-3-Me-4-OMe	B21	88-90
1-179	Me	Me	2-Me-3-Me-4-OCHF ₂	B21	유상
1-180	Me	Me	4-OMe	B21	139-141
1-181	Me	Me	2-Me-4-OCOPr(i)	B21	비정질
1-182	Me	Me	2-Me-4-OH	B21	204-208
1-183	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ Me	B21	81-84
1-184	Me	Me	2-OMe	B21	유상
1-185	Me	Me	2-Me-3-OMe	B21	128-129
1-186	Me	Me	2-Me-4-OBu(n)	B21	69-71
1-187	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CF ₃	B21	유상
1-188	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ OMe	B21	73-75
1-189	Me	H	4-Cl	B21	유상
1-190	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B21	96-98
1-191	Me	Me	4-Br	B48	
1-192	Me	Me	4-Br	B49	
1-193	Me	Me	4-Br	B50	122-125
1-194	Me	Me	4-Br	B51	
1-195	Me	Me	4-Br	B52	192-195
1-196	Me	Me	4-Br	B53	
1-197	Me	Me	4-Br	B54	
1-198	Me	Me	4-Br	B13	
1-199	Me	Me	4-Br	B12	
1-200	Me	Me	4-Br	B63	132-134

[0394]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 ℃)
1-201	Me	Me	4-Br	B55	164-166
1-202	Me	Me	4-Br	B56	145-147
1-203	Me	Me	4-Br	B57	45-47
1-204	Me	Me	4-Br	B57	50-58
1-205	Me	Me	3-F-4-C1	B21	119-122
1-206	Me	Me	2-Me-4-Et	B21	77-81
1-207	Et	H	4-C1	B21	114-117
1-208	Me	Me	2-C1-4-C1	B21	103-104
1-209	Me	Me	3-OCHF ₂ -4-C1	B21	106-110
1-210	Me	Me	3-C1-4-OCHF ₂	B21	137-139
1-211	Me	Me	3-C1-4-C1	B63	
1-212	Me	Me	3-C1-4-C1	B64	
1-213	Me	Me	3-C1-4-C1	B65	
1-214	Me	Me	3-C1-4-C1	B66	
1-215	Me	Me	3-C1-4-C1	B67	
1-216	Me	Me	3-C1-4-C1	B68	
1-217	Me	Me	3-C1-4-C1	B69	
1-218	Me	Me	3-C1-4-C1	B70	
1-219	Me	Me	3-C1-4-C1	B71	122-124
1-220	Me	Me	3-C1-4-C1	B72	
1-221	Me	Me	3-C1-4-C1	B73	
1-222	Me	Me	3-C1-4-C1	B74	
1-223	Me	Me	3-C1-4-C1	B75	
1-224	Me	Me	3-C1-4-C1	B76	
1-225	Me	Me	3-C1-4-C1	B77	
1-226	Me	Me	3-C1-4-C1	B78	
1-227	Me	Me	2-Me-4-O-[D3]	B21	
1-228	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ NMe ₂	B21	
1-229	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OMe	B21	
1-230	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ SMe	B21	
1-231	Me	Me	2-Me-5-OMe	B21	유상
1-232	Me	Me	2-Me-5-C1	B21	
1-233	Me	Me	2-Me-6-OMe	B21	
1-234	Me	Me	2-Me-6-Me	B21	
1-235	Me	Me	2-Me-4-OMe-6-Me	B21	

[0395]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 °C)
1-236	Me	Me	2-Me-4-Br	B21	
1-237	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	B21	
1-238	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CF ₂ CF ₃	B21	
1-239	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	B21	
1-240	Me	Me	2-Et-4-OMe	B21	
1-241	Me	Me	2-CF ₃ -4-OMe	B21	
1-242	Me	Me	2-CF ₃ -4-Cl	B21	
1-243	Me	Me	3-Me-4-Br	B21	
1-244	Me	Me	3-Br-4-Me	B21	118-120
1-245	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CN	B21	
1-246	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ CN	B21	
1-247	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ CN	B21	
1-248	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ -[D3]	B21	
1-249	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ -[D3]	B21	
1-250	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ -[D3]	B21	
1-251	Me	Me	2-Me-4-SMe	B21	
1-252	Me	Me	2-Me-4-SOMe	B21	
1-253	Me	Me	2-Me-4-SO ₂ Me	B21	
1-254	Me	Me	2-Me-4-CHO	B21	
1-255	Me	Me	2-Me-4-OCF ₃	B21	
1-256	Me	Me	2-Me-4-CHF ₂	B21	
1-257	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ -[D3]	B21	
1-258	Me	Me	2-Me-4-[D3]	B21	
1-259	Me	Me	2-OCHF ₂ -4-Cl	B21	
1-260	Me	Me	2-F-4-Cl	B21	
1-261	Me	Me	2-OMe-4-Cl	B21	
1-262	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OCOMe	B21	
1-263	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OH	B21	
1-264	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ Br	B21	
1-265	Me	Me	2-Me-4-I	B21	
1-266	Me	Me	2-Me-3-OEt	B21	
1-267	Me	Me	2-Me-4-시클로펜틸옥시	B21	
1-268	Me	Me	2-Me-4-Ph	B21	97-102
1-269	Me	Me	2-Me-4-OPh	B21	
1-270	Me	Me	2-Me-4-OCOMe	B21	유상

[0396]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 ℃)
1-271	Me	Me	2-Me-4-C≡CCMe ₃	B21	비정질
1-272	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ C≡CH	B21	
1-273	Me	Me	2-Me-4-OBu(sec)	B21	점성상
1-274	Me	Me	2-Me-4-OCH([D3])Me	B21	
1-275	Me	Me	2-Me-4-NH([D3])Me	B21	
1-276	Me	Me	2-Me-4-C≡CPh	B21	비정질
1-277	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHFOCF ₃	B21	
1-278	Me	Me	2-Me-4-CN	B21	
1-279	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CCMe ₃	B21	
1-280	Me	Me	2-Me-4-C≡CMe	B21	
1-281	Me	Me	2-Me-4-C≡CH	B21	
1-282	Me	Me	2-Me-4-C≡CSiMe ₃	B21	점성상
1-283	Me	Me	2-Me-4-[D1]	B21	
1-284	Me	Me	2-Me-4-[D2]	B21	
1-285	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CI	B21	
1-286	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CH	B21	
1-287	Me	Me	2-Me-4-CH=CF ₂	B21	
1-288	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CH=CF ₂	B21	
1-289	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH=CCl ₂	B21	
1-290	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	B21	
1-291	Me	Me	2-Me-4-(CH ₂) ₅ CBrF ₂	B21	
1-292	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CI	B1	
1-293	Me	Et	3-C1-4-C1	B1	
1-294	Me	Et	3-Me-4-C1	B1	
1-295	Me	Et	2-Me-4-OMe	B1	
1-296	Me	Et	2-Me-4-OEt	B1	
1-297	Me	Et	2-Me-4-OPr(i)	B1	
1-298	Me	Et	3-C1-4-Br	B1	
1-299	Me	Et	3-Br-4-C1	B1	
1-300	Me	Et	3-F-4-C1	B1	
1-301	Me	Et	3-Me-4-Br	B1	
1-302	Et	Et	3-C1-4-C1	B1	
1-303	Et	Et	3-Me-4-C1	B1	
1-304	Et	Et	2-Me-4-OEt	B1	
1-305	Et	Et	2-Me-4-OPr(i)	B1	

[0397]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 ℃)
1-306	Me	Et	3-Cl-4-Cl	B16	
1-307	Me	Et	3-Me-4-Cl	B16	
1-308	Me	Et	2-Me-4-OMe	B16	
1-309	Me	Et	2-Me-4-OEt	B16	
1-310	Me	Et	2-Me-4-OPr(i)	B16	
1-311	Me	Et	3-Cl-4-Br	B16	
1-312	Me	Et	3-Br-4-Cl	B16	
1-313	Me	Et	3-F-4-Cl	B16	
1-314	Me	Et	3-Me-4-Br	B16	
1-315	Et	Et	3-Cl-4-Cl	B16	
1-316	Et	Et	3-Me-4-Cl	B16	
1-317	Et	Et	2-Me-4-OEt	B16	
1-318	Et	Et	2-Me-4-OPr(i)	B16	
1-319	Me	Et	3-Me-4-Cl	B21	
1-320	Me	Et	2-Me-4-OMe	B21	
1-321	Me	Et	2-Me-4-OEt	B21	
1-322	Me	Et	2-Me-4-OPr(i)	B21	
1-323	Me	Et	3-Cl-4-Br	B21	
1-324	Me	Et	3-Br-4-Cl	B21	
1-325	Me	Et	3-F-4-Cl	B21	
1-326	Me	Et	3-Me-4-Br	B21	
1-327	Et	Et	3-Cl-4-Cl	B21	
1-328	Et	Et	3-Me-4-Cl	B21	
1-329	Et	Et	2-Me-4-OEt	B21	
1-330	Et	Et	2-Me-4-OPr(i)	B21	
1-331	Me	Me	3-Me-4-Cl	B71	
1-332	Me	Me	2-Me-4-OMe	B71	
1-333	Me	Me	2-Me-4-OEt	B71	
1-334	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B71	
1-335	Me	Me	3-Cl-4-Br	B71	
1-336	Me	Me	3-Br-4-Cl	B71	
1-337	Me	Me	3-F-4-Cl	B71	
1-338	Me	Me	3-Me-4-Br	B71	
1-339	Me	Me	2-Me-4-[D4]	B21	
1-340	Me	Me	2-Me-4-[D5]	B21	

[0398]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 ℃)
1-341	Me	D3	3-C1-4-C1	B16	
1-342	Me	D3	3-Me-4-C1	B16	
1-343	Me	D3	2-Me-4-OMe	B16	
1-344	Me	D3	2-Me-4-OEt	B16	
1-345	Me	D3	2-Me-4-OPr (i)	B16	
1-346	Me	D3	3-C1-4-Br	B16	
1-347	Me	D3	3-Br-4-C1	B16	
1-348	Me	D3	3-F-4-C1	B16	
1-349	Me	D3	3-Me-4-Br	B16	
1-350	H	D3	3-C1-4-C1	B16	
1-351	H	D3	3-Me-4-C1	B16	
1-352	H	D3	2-Me-4-OMe	B16	
1-353	H	D3	2-Me-4-OEt	B16	
1-354	H	D3	2-Me-4-OPr (i)	B16	
1-355	Me	D3	3-C1-4-C1	B21	
1-356	Me	D3	3-Me-4-C1	B21	
1-357	Me	D3	2-Me-4-OMe	B21	
1-358	Me	D3	2-Me-4-OEt	B21	
1-359	Me	D3	2-Me-4-OPr (i)	B21	
1-360	Me	D3	3-C1-4-Br	B21	
1-361	Me	D3	3-Br-4-C1	B21	
1-362	Me	D3	3-F-4-C1	B21	
1-363	Me	D3	3-Me-4-Br	B21	
1-364	H	D3	3-C1-4-C1	B21	
1-365	H	D3	3-Me-4-C1	B21	
1-366	H	D3	2-Me-4-OMe	B21	
1-367	H	D3	2-Me-4-OEt	B21	
1-368	H	D3	2-Me-4-OPr (i)	B21	
1-369	Me	CH ₂ F	3-C1-4-C1	B21	
1-370	Me	CH ₂ F	3-Me-4-C1	B21	
1-371	Me	CH ₂ Cl	2-Me-4-OMe	B21	
1-372	Me	CH ₂ F	2-Me-4-OEt	B21	
1-373	Me	CH ₂ F	2-Me-4-OPr (i)	B21	
1-374	CH ₂ F	CH ₂ F	2-Me-4-OEt	B21	
1-375	CH ₂ F	CH ₂ F	2-Me-4-OPr (i)	B21	

[0399]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 ℃)
1-376	Me	Me	4-SMe	B16	
1-377	Me	Me	4-SOMe	B16	
1-378	Me	Me	4-SO ₂ Me	B16	
1-379	Me	Me	4-SO ₂ CF ₃	B16	
1-380	Me	Me	4-SO ₂ NMe ₂	B16	
1-381	Me	Me	4-CH ₂ CH=CH ₂	B16	
1-382	Me	Me	4-CH ₂ NHMe	B16	
1-383	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ NHMe	B21	
1-384	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CN	B21	
1-385	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ CN	B21	
1-386	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ CN	B21	
1-387	Me	Me	4-OCH ₂ CH=CH ₂	B16	
1-388	Me	Me	4-SCH ₂ CH=CH ₂	B16	
1-389	Me	Me	4-OCH ₂ C≡CH	B16	
1-390	Me	Me	4-SCH ₂ C≡CH	B16	
1-391	Me	Me	4-OCH ₂ C≡CI	B16	
1-392	Me	Me	4-SCH ₂ C≡CI	B16	
1-393	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHFOMe	B21	
1-394	Me	Me	4-S-CH ₂ CH=CF ₂	B16	
1-395	Me	Me	4-SOCHF ₂	B16	
1-396	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OCHF ₂	B21	
1-397	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ NH ₂	B21	
1-398	Me	Me	2-Me-4-SCHF ₂	B21	
1-399	Me	Me	2-Me-4-SOCHF ₂	B21	
1-400	Me	Me	2-Me-4-SO ₂ CHF ₂	B21	
1-401	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ SMe	B21	
1-402	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ NHMe	B21	
1-403	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ NMe ₂	B21	
1-404	Me	Me	2-Me-4-NH-[D3]	B21	
1-405	Me	Me	2-Me-4-S-[D3]	B21	
1-406	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ OCHF ₂	B71	
1-407	Me	Me	4-CH=NOCH ₂ CH=CH ₂	B1	
1-408	Me	Me	4-CH=NOCH ₂ C≡CH	B1	
1-409	Me	Me	4-CH=NCO ₂ Me	B1	
1-410	Me	Me	2-Me-4-CH=NMe	B21	

[0400]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 ℃)
1-411	Me	Me	2-Me-4-CH=N-OMe	B21	
1-412	Me	Me	4-[D6]	B71	
1-413	Me	Me	2-Me-4-OCOCF ₃	B21	
1-414	Me	Me	2-Me-4-OCO ₂ Me	B16	
1-415	Me	Me	2-Me-4-OCNMe ₂	B16	
1-416	Me	Me	2-Me-4-OCOSPh	B16	
1-417	Me	Me	2-Me-4-OCOSOMe	B14	
1-418	Me	Me	2-Me-4-OCS ₂ Me	B14	
1-419	Me	Me	2-Me-4-OCSNMe ₂	B14	
1-420	Me	Me	2-Me-4-OSCCl ₃	B14	
1-421	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ Me	B14	
1-422	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ CF ₃	B14	
1-423	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ Ph	B14	
1-424	Me	Me	2-Me-4-OSNMe ₂	B14	
1-425	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ NMe ₂	B14	
1-426	Me	Me	2-Me-4-NH ₂	B14	
1-427	Me	Me	2-Me-4-NH ₂ · HCl	B14	
1-428	Me	Me	2-Me-4-NHMe	B14	
1-429	Me	Me	2-Me-4-NMe ₂	B14	
1-430	Me	Me	2-Me-4-NHCOMe	B14	
1-431	Me	Me	2-Me-4-NHCOBu(t)	B14	
1-432	Me	Me	2-Me-4-NHCOCF ₃	B14	
1-433	Me	Me	2-Me-4-NHCO ₂ Me	B14	
1-434	Me	Me	2-Me-4-N(Me)CO ₂ Me	B14	
1-435	Me	Me	2-Me-4-NHCONMe ₂	B14	
1-436	Me	Me	2-Me-4-NHCOSMe	B14	
1-437	Me	Me	2-Me-4-NHCSOMe	B14	
1-438	Me	Me	2-Me-4-NHCS ₂ Me	B14	
1-439	Me	Me	2-Me-4-NHCSNMe ₂	B14	
1-440	Me	Me	2-Me-4-NHCS ₂ Ph	B14	
1-441	Me	Me	2-Me-4-NHSCCl ₃	B14	
1-442	Me	Me	2-Me-4-NHSOMe	B14	
1-443	Me	Me	2-Me-4-NHSO ₂ Me	B14	
1-444	Me	Me	2-Me-4-NHSO ₂ Ph	B14	
1-445	Me	Me	2-Me-4-NHCOPh	B14	

[0401]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 ℃)
1-446	Me	Me	4-CO ₂ Me	B14	
1-447	Me	Me	4-CO ₂ Et	B14	
1-448	Me	Me	4-CO ₂ H	B14	
1-449	Me	Me	4-CONH ₂	B14	
1-450	Me	Me	4-CONMe ₂	B14	
1-451	Me	Me	4-CONHMe	B14	
1-452	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ CF ₃	B21	
1-453	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ CF ₃	B21	
1-454	Me	Me	2-Me-4-SCHF ₂	B21	
1-455	Me	Me	2-Me-4-SO ₂ CH ₂ CF ₃	B21	
1-456	Me	Me	2-Me-4-OCN	B21	
1-457	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CO ₂ Me	B21	
1-458	Me	Me	2-Me-4-OPh	B21	
1-459	Me	Me	2-Me-4-Ph	B21	
1-460	Me	Me	2-Me-4-C≡CCO ₂ Me	B21	
1-461	Me	Me	2-Me-4-C≡CCO ₂ H	B21	
1-462	Me	Me	2-Me-4-C≡CCH ₂ OH	B21	
1-463	Me	Me	2-Me-4-C≡CCH ₂ Br	B21	
1-464	Me	Me	2-Me-4-C≡CCH ₂ NH ₂ · HCl	B21	
1-465	Me	Me	2-Me-4-[D7]	B21	
1-466	Me	Me	2-Me-4-C≡COEt	B21	
1-467	Me	Me	2-Me-4-C≡CCH ₂ OMe	B21	
1-468	Me	Me	2-Me-4-C≡C-[D4]	B21	
1-469	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ -[D4]	B21	
1-470	Me	Me	2-Me-4-[D5]	B14	
1-471	Me	Me	2-Me-4-[D4]	B14	
1-472	Me	Me	2-Me-4-CH=CH-[D4]	B21	
1-473	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ -[D4]	B21	
1-474	Me	Me	2-Me-4-OC≡C-[D4]	B21	
1-475	Me	Me	2-Me-4-OCH=CH-[D4]	B21	
1-476	Me	Me	4-Me	B62	
1-477	Me	Me	4-Me	B25	
1-478	Me	Me	3-C1-4-C1	B80	
1-479	Me	Me	3-C1-4-C1	B81	
1-480	Me	Me	3-C1-4-C1	B82	

[0402]

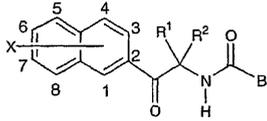
No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (융점 ℃)
1-481	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B83	
1-482	Me	Me	3-Me-4-Cl	B84	
1-483	Me	Me	2-Me-4-OMe	B85	
1-484	Me	Me	2-Me-4-OEt	B86	
1-485	Me	Me	2-Me-4-OPr (i)	B87	
1-486	Me	Me	3-Cl-4-Br	B88	
1-487	Me	Me	3-Br-4-Cl	B89	
1-488	Me	Me	3-F-4-Cl	B90	
1-489	Me	Me	3-Me-4-Br	B91	
1-490	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B92	
1-491	Me	Me	3-Me-4-Cl	B93	
1-492	Me	Me	2-Me-4-OMe	B94	
1-493	Me	Me	2-Me-4-OEt	B95	
1-494	Me	Me	2-Me-4-OPr (i)	B96	
1-495	Me	Me	3-Cl-4-Br	B97	
1-496	Me	Me	3-Br-4-Cl	B98	
1-497	Me	Me	3-F-4-Cl	B99	
1-498	Me	Me	3-Me-4-Br	B100	
1-499	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B101	
1-500	Me	Me	3-Me-4-Cl	B102	
1-501	Me	Me	2-Me-4-OMe	B103	
1-502	Me	Me	2-Me-4-OEt	B104	
1-503	Me	Me	2-Me-4-OPr (i)	B105	
1-504	Me	Me	3-Cl-4-Br	B106	
1-505	Me	Me	3-Br-4-Cl	B107	
1-506	Me	Me	3-F-4-Cl	B108	
1-507	Me	Me	3-Me-4-Br	B109	
1-508	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B110	
1-509	Me	Me	3-Me-4-Cl	B111	
1-510	Me	Me	2-Me-4-OMe	B112	
1-511	Me	Me	2-Me-4-OEt	B113	
1-512	Me	Me	2-Me-4-OPr (i)	B114	
1-513	Me	Me	3-Cl-4-Br	B115	
1-514	Me	Me	3-Br-4-Cl	B116	
1-515	Me	Me	3-F-4-Cl	B117	
1-516	Me	Me	2-Br-5-OMe	B21	유상
1-517	Me	Me	2-Me-4-OCH (Me) OMe	B16	

[0403]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (용점 ℃)
1-518	Me	Me	4-CH ₂ Br	B25	점성상
1-519	Me	Me	4-CH ₂ Br	B62	108-111
1-520	Me	Me	4-CH ₂ OMe	B25	97-102
1-521	Me	Me	4-CH ₂ NMe ₂	B25	점성상
1-522	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ Ph	B14	
1-523	Me	CH ₂ Cl	3-F-4-Cl	B1	
1-524	Me	CH ₂ Cl	3-Me-4-Br	B14	
1-525	Me	CH ₂ Cl	3-Cl-4-Cl	B16	
1-526	Me	CH=CH ₂	3-Me-4-Cl	B21	
1-527	Me	CH=CH ₂	2-Me-4-OMe	B1	
1-528	Me	CH=CH ₂	2-Me-4-OEt	B14	
1-529	Me	C≡CH	2-Me-4-OPr (i)	B16	
1-530	Me	C≡CH	3-Cl-4-Br	B21	
1-531	Me	C≡CH	3-Br-4-Cl	B1	
1-532	Me	CH ₂ OMe	3-F-4-Cl	B14	
1-533	Me	CH ₂ OMe	3-Me-4-Br	B16	
1-534	Me	CH ₂ OMe	3-Cl-4-Cl	B21	
1-535	Me	Me	3-OMe-4-OMe	B21	138-140
1-536	Me	Me	2-Br	B21	점성상
1-537	Me	Me	4-SPh	B1	
1-538	Me	Me	4-CH ₂ OMe	B62	74-76
1-539	Me	Me	4-CH ₂ NMe ₂	B62	점성상
1-540	Me	Me	4-CH ₂ OMe	B21	117-119
1-541	Me	Me	4-CH ₂ SMe	B21	
1-542	Me	Me	4-CH ₂ NMe ₂	B21	
1-543	Me	Me	2-Me-4-Ph (4-Cl)	B21	
1-544	Me	Me	2-Me-4-Ph (4-OMe)	B21	
1-545	Me	Me	2-Me-4-CH=CHCMe ₃	B16	
1-546	Me	Me	2-Me-4-Ph (4-CF ₃)	B21	
1-547	Me	Me	2-Me-4-CH=CHPh	B14	
1-548	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ SO ₂ Me	B21	
1-549	Me	Me	4-Me	B25	96-98
1-550	Me	Me	4-Me	B62	98-102
1-551	Me	Me	4-SCO ₂ Me	B1	
1-552	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CN	B16	
1-553	Me	Me	4-NHPh	B1	
1-554	Me	Me	2-Me-4-OBu (t)	B21	

[0404]

표 2



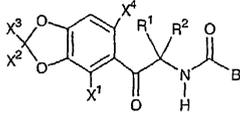
No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (융점 ℃)
2-1	Me	Me	H	B1	145-147
2-2	Me	Me	H	B16	159-161
2-3	Me	Me	H	B7	152-154
2-4	Me	Me	H	B2	고체
2-5	Me	Et	H	B1	
2-6	Me	Et	H	B16	
2-7	Me	Et	H	B21	
2-8	-(CH ₂) ₅ -		H	B16	
2-9	Me	Me	H	B12	225-226
2-10	Me	Me	H	B5	159-160
2-11	Me	Me	H	B8	196-198
2-12	Me	Me	H	B13	195-197
2-13	Me	Me	H	B15	158-160
2-14	Me	Me	H	B21	163-164
2-15	-(CH ₂) ₅ -		H	B21	
2-16	Me	Et	H	B1	
2-17	Me	Et	H	B5	
2-18	Me	Et	H	B8	
2-19	Me	Et	H	B11	
2-20	Me	Et	H	B14	
2-21	Me	Et	H	B15	
2-22	Me	Et	H	B16	
2-23	Me	Et	H	B21	
2-24	Me	Me	1-Me	B1	
2-25	Me	Me	3-Me	B5	
2-26	Me	Me	4-Me	B8	
2-27	Me	Me	5-Me	B14	
2-28	Me	Me	6-Me	B15	
2-29	Me	Me	7-Me	B16	
2-30	Me	Me	8-Me	B21	

[0405]

No.	R ¹	R ²	X	B	물성 (융점 ℃)
2-31	Me	Me	H	B48	
2-32	Me	Me	H	B49	
2-33	Me	Me	H	B19	
2-34	Me	Me	H	B20	
2-35	Me	Me	H	B50	
2-36	Me	Me	1-Me	B21	
2-37	Me	Me	1-Me	B16	

[0406]

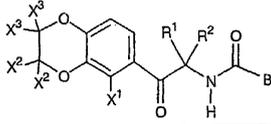
표 3



No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	물성 (용점 °C)
3-1	Me	Me	H	H	H	H	B1	127-128
3-2	Me	Me	H	H	H	H	B16	130-132
3-3	Me	Me	H	H	H	H	B21	155-158
3-4	Me	Me	H	F	F	H	B1	124-126
3-5	Me	Me	H	F	F	H	B16	
3-6	Me	Me	H	F	F	H	B21	116-118
3-7	Me	Me	Me	H	H	H	B1	
3-8	Me	Me	Me	H	H	H	B16	
3-9	Me	Me	Me	H	H	H	B21	98-102
3-10	Me	Me	Me	F	F	H	B1	99-107
3-11	Me	Me	Me	F	F	H	B16	
3-12	Me	Me	Me	F	F	H	B21	145-148
3-13	Me	Me	Cl	H	H	H	B1	
3-14	Me	Me	Cl	H	H	H	B16	
3-15	Me	Me	Cl	H	H	H	B21	
3-16	Me	Me	Cl	F	F	H	B1	
3-17	Me	Me	Cl	F	F	H	B16	
3-18	Me	Me	Cl	F	F	H	B21	
3-19	Me	Me	Me	F	F	H	B8	142-145
3-20	Me	Me	Me	F	F	H	B5	104-108
3-21	-(CH ₂) ₅ -		H	F	F	H	B21	
3-22	-(CH ₂) ₅ -		Me	F	F	H	B1	
3-23	Me	Me	H	F	F	H	B5	158-160
3-24	Me	Me	Me	F	F	H	B47	97-99
3-25	Me	Me	H	F	F	Me	B21	85-90
3-26	Me	Me	H	H	H	Me	B21	111-114
3-27	Me	Me	Me	Me	Me	H	B21	
3-28	Me	Me	Me	Me	H	H	B21	
3-29	Me	Me	Me	Et	H	H	B21	
3-30	Me	Me	Me	D3	H	H	B21	

[0407]

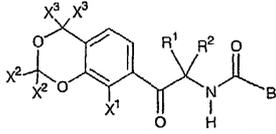
표 4



No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	B	물성 (용점 ℃)
4-1	Me	Me	H	H	H	B1	
4-2	Me	Me	H	H	H	B5	
4-3	Me	Me	H	H	H	B8	
4-4	Me	Me	H	H	H	B16	
4-5	Me	Me	H	H	H	B21	
4-6	Me	Me	H	F	F	B1	
4-7	Me	Me	H	F	F	B5	
4-8	Me	Me	H	F	F	B8	
4-9	Me	Me	H	F	F	B11	
4-10	Me	Me	H	F	F	B21	120-122
4-11	Me	Me	Me	H	H	B1	
4-12	Me	Me	Me	H	H	B4	
4-13	Me	Me	Me	H	H	B8	
4-14	Me	Me	Me	H	H	B16	
4-15	Me	Me	Me	H	H	B21	
4-16	Me	Me	Me	F	F	B1	
4-17	Me	Me	Me	F	F	B15	
4-18	Me	Me	Me	F	F	B10	
4-19	Me	Me	Me	F	F	B21	74-78
4-20	Me	Me	Me	F	F	B25	
4-21	Me	Me	Me	H	Me	B21	
4-22	Me	Me	Me	H	Me	B16	
4-23	Me	Me	Me	H	Me	B14	
4-24	Me	Me	Me	Me	H	B1	
4-25	Me	Me	Me	Me	H	B5	
4-26	Me	Me	Me	Me	H	B8	
4-27	Me	Me	Me	H	Me	B1	
4-28	Me	Me	Me	H	Me	B5	
4-29	Me	Me	Me	H	Me	B8	
4-30	Me	Me	Me	H	Me	B71	

[0408]

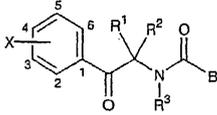
표 5



No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	B	물성 (용점 ℃)
5-1	Me	Me	H	H	H	B1	
5-2	Me	Me	H	H	H	B5	
5-3	Me	Me	H	H	H	B7	
5-4	Me	Me	H	H	H	B14	
5-5	Me	Me	H	H	H	B15	
5-6	Me	Me	Me	H	H	B1	
5-7	Me	Me	Me	H	H	B5	
5-8	Me	Me	Me	H	H	B8	
5-9	Me	Me	Me	H	H	B11	
5-10	Me	Me	Me	H	H	B21	
5-11	Me	Me	H	F	F	B1	
5-12	Me	Me	H	F	F	B4	
5-13	Me	Me	H	F	F	B8	
5-14	Me	Me	H	F	F	B16	
5-15	Me	Me	H	F	F	B21	
5-16	Me	Me	Me	F	F	B1	
5-17	Me	Me	Me	F	F	B15	
5-18	Me	Me	Me	F	F	B10	
5-19	Me	Me	Me	F	F	B21	
5-20	Me	Me	Me	F	F	B25	
5-21	Me	Me	Me	H	Me	B21	
5-22	Me	Me	Me	H	Me	B16	
5-23	Me	Me	Me	H	Me	B14	
5-24	Me	Me	Me	F	H	B1	
5-25	Me	Me	Me	F	H	B5	
5-26	Me	Me	Me	F	H	B8	
5-27	Me	Me	Me	Me	H	B14	
5-28	Me	Me	Me	Me	H	B16	
5-29	Me	Me	Me	Me	H	B21	
5-30	Me	Me	Me	Me	Me	B21	

[0409]

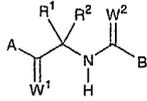
표 6



No.	R ¹	R ²	R ³	X	B	물성 (용점 ℃)
6-1	Me	Me	CO ₂ Bu(t)	4-Br	B21	유상
6-2	Me	Me	COMe	4-Br	B21	유상
6-3	Me	Me	COMe	3-Cl-4-Cl	B21	유상
6-4	Me	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B1	147-150
6-5	Me	Me	CO ₂ Bu(t)	3-Cl-4-Cl	B21	66-68
6-6	Me	Me	SCCl ₃	3-Br-4-Cl	B1	
6-7	Me	Me	SPh	3-Cl-4-Br	B5	
6-8	Me	Me	SOPh	3-Me-4-Br	B8	
6-9	Me	Me	SO ₂ Ph	3-Me-4-Cl	B14	
6-10	Me	Me	SO ₂ Me	3-Cl-4-Cl	B16	
6-11	Me	Me	SO ₂ CF ₃	3-F-4-Cl	B21	
6-12	Me	Me	SO ₂ NMe ₂	2-Me-4-OMe	B71	
6-13	Me	Me	CH ₂ OMe	2-Me-4-OEt	B1	
6-14	Me	Me	CH ₂ SMe	2-Me-4-OPr(i)	B5	
6-15	Me	Me	CN	3-Br-4-Br	B8	
6-16	Me	Me	CHO	2-Me-4-Cl	B14	
6-17	Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-Me-4-Br	B16	
6-18	Me	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Br-4-Cl	B21	
6-19	Me	Me	D3	3-Cl-4-Br	B71	
6-20	Me	Me	OH	3-Me-4-Br	B1	
6-21	Me	Me	CO ₂ CH ₂ Ph	3-Me-4-Cl	B5	
6-22	Me	Me	CO ₂ CH ₂ OMe	3-Cl-4-Cl	B8	
6-23	Me	Me	COPh	3-Cl-4-Cl	B14	
6-24	Me	Me	COCF ₃	3-Cl-4-Cl	B16	
6-25	Me	Me	CH ₂ C≡CH	3-Cl-4-Cl	B21	
6-26	Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	3-F-4-Cl	B71	
6-27	Me	Me	CH ₂ CN	2-Me-4-OMe	B1	
6-28	Me	Me	시클로헥틸옥시	2-Me-4-OEt	B5	
6-29	Me	Me	CH ₂ CH ₂ OCHF ₂	2-Me-4-OPr(i)	B8	
6-30	Me	Me	CH ₂ CH ₂ NH ₂	3-Br-4-Br	B14	
6-31	Me	Me	CH ₂ CH ₂ NHMe	2-Me-4-Cl	B16	
6-32	Me	Me	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	2-Me-4-Br	B21	

[0410]

표 7



No.	A	W ¹	R ¹	R ²	W ²	B	물성 (용점 ℃)
7-1	2-티에닐	0	Me	Me	0	B1	101-105
7-2	2-티에닐	0	Me	Me	0	B21	118-121
7-3	3-티에닐	0	Me	Me	0	B1	121-125
7-4	5-C1-3-티에닐	0	Me	Me	0	B21	138-142
7-5	2-C1-5-C1-3-티에닐	0	Me	Me	0	B21	119-121
7-6	5-C1-2-티에닐	0	Me	Me	0	B21	127-132
7-7	5-C1-2-티에닐	0	Me	Me	0	B1	115-120
7-8	4-C1-2-티에닐	0	Me	Me	0	B21	119-121
7-9	4-C1-2-티에닐	0	Me	Me	0	B1	유상
7-10	1-나프틸	0	Me	Me	0	B48	
7-11	1-나프틸	0	Me	Me	0	B49	
7-12	1-나프틸	0	Me	Me	0	B19	
7-13	1-나프틸	0	Me	Me	0	B20	
7-14	1-나프틸	0	Me	Me	0	B50	
7-15	1-나프틸	0	Me	Me	0	B12	
7-16	1-나프틸	0	Me	Me	0	B13	
7-17	2-티에닐	0	Me	Me	0	B48	
7-18	2-티에닐	0	Me	Me	0	B49	
7-19	2-티에닐	0	Me	Me	0	B19	
7-20	2-티에닐	0	Me	Me	0	B20	
7-21	2-티에닐	0	Me	Me	0	B50	
7-22	2-티에닐	0	Me	Me	0	B12	
7-23	2-티에닐	0	Me	Me	0	B13	
7-24	3-티에닐	0	Me	Me	0	B48	
7-25	3-티에닐	0	Me	Me	0	B49	
7-26	3-티에닐	0	Me	Me	0	B19	
7-27	3-티에닐	0	Me	Me	0	B20	
7-28	3-티에닐	0	Me	Me	0	B50	
7-29	3-티에닐	0	Me	Me	0	B12	
7-30	3-티에닐	0	Me	Me	0	B13	

[0411]

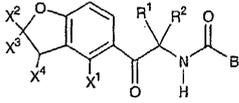
No.	A	W ¹	R ¹	R ²	W ²	B	물성 (용점 ℃)
7-31	2-피리딜	0	Me	Me	0	B48	
7-32	2-피리딜	0	Me	Me	0	B49	
7-33	2-피리딜	0	Me	Me	0	B19	
7-34	2-피리딜	0	Me	Me	0	B20	
7-35	2-피리딜	0	Me	Me	0	B50	
7-36	2-피리딜	0	Me	Me	0	B12	
7-37	2-피리딜	0	Me	Me	0	B13	
7-38	3-피리딜	0	Me	Me	0	B48	
7-39	3-피리딜	0	Me	Me	0	B49	
7-40	3-피리딜	0	Me	Me	0	B19	
7-41	3-피리딜	0	Me	Me	0	B20	
7-42	3-피리딜	0	Me	Me	0	B50	
7-43	3-피리딜	0	Me	Me	0	B12	
7-44	4-피리딜	0	Me	Me	0	B13	
7-45	4-피리딜	0	Me	Me	0	B48	
7-46	4-피리딜	0	Me	Me	0	B49	
7-47	4-피리딜	0	Me	Me	0	B19	
7-48	4-피리딜	0	Me	Me	0	B20	
7-49	4-피리딜	0	Me	Me	0	B50	
7-50	4-피리딜	0	Me	Me	0	B12	
7-51	4-피리딜	0	Me	Me	0	B13	
7-52	인플-3-일	0	Me	Me	0	B48	
7-53	인플-3-일	0	Me	Me	0	B49	
7-54	인플-3-일	0	Me	Me	0	B19	
7-55	인플-3-일	0	Me	Me	0	B20	
7-56	인플-3-일	0	Me	Me	0	B50	
7-57	인플-3-일	0	Me	Me	0	B12	
7-58	인플-3-일	0	Me	Me	0	B13	
7-59	N-Me-인플-3-일	0	Me	Me	0	B48	
7-60	N-Me-인플-3-일	0	Me	Me	0	B49	

[0412]

No.	A	W ¹	R ¹	R ²	W ²	B	물성 (용점 ℃)
7-61	N-Me-인플-3-일	0	Me	Me	0	B19	
7-62	N-Me-인플-3-일	0	Me	Me	0	B20	
7-63	N-Me-인플-3-일	0	Me	Me	0	B50	
7-64	N-Me-인플-3-일	0	Me	Me	0	B12	
7-65	N-Me-인플-3-일	0	Me	Me	0	B13	
7-66	3-티에닐	0	Me	Me	0	B21	131-133
7-67	Ph(3,4-Cl ₂)	S	Me	Me	0	B21	
7-68	Ph(3,4-Cl ₂)	0	Me	Me	S	B21	
7-69	2-C1-5-피리딜	0	Me	Me	0	B21	
7-70	3-피리딜	0	Me	Me	0	B21	
7-71	2-OMe-5-피리딜	0	Me	Me	0	B21	
7-72	2-C1-5-피리딜	0	Me	Me	0	B16	
7-73	2-OMe-5-피리딜	0	Me	Me	0	B16	
7-74	5-OMe-2-피리딜	0	Me	Me	0	B21	
7-75	5-OMe-2-피리딜	0	Me	Me	0	B16	
7-76	5-C1-2-피리딜	0	Me	Me	0	B21	
7-77	5-C1-2-피리딜	0	Me	Me	0	B16	

[0413]

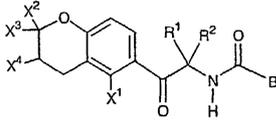
표 8



No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	물성 (용점 ℃)
8-1	Me	Me	Me	F	F	H	B1	
8-2	Me	Me	Me	F	F	H	B5	
8-3	Me	Me	Me	F	F	H	B8	
8-4	Me	Me	Me	F	F	H	B14	
8-5	Me	Me	Me	F	F	H	B16	
8-6	Me	Me	Me	F	F	H	B21	
8-7	Me	Me	Me	F	F	H	B71	
8-8	Me	Me	Me	H	H	H	B1	
8-9	Me	Me	Me	H	H	H	B14	
8-10	Me	Me	Me	H	H	H	B16	
8-11	Me	Me	Me	Me	H	H	B1	
8-12	Me	Me	Me	Me	H	H	B5	
8-13	Me	Me	Me	Me	H	H	B8	
8-14	Me	Me	Me	Me	H	H	B14	
8-15	Me	Me	Me	Me	H	H	B16	
8-16	Me	Me	Me	Me	H	H	B21	
8-17	Me	Me	Me	Me	H	H	B71	
8-18	Me	Me	Me	Me	Me	H	B1	
8-19	Me	Me	Me	Me	Me	H	B5	
8-20	Me	Me	Me	Me	Me	H	B8	
8-21	Me	Me	Me	Me	Me	H	B14	
8-22	Me	Me	Me	Me	Me	H	B16	
8-23	Me	Me	Me	Me	Me	H	B21	
8-24	Me	Me	Me	Me	Me	H	B71	
8-25	Me	Me	H	F	F	H	B5	
8-26	Me	Me	H	F	F	H	B8	
8-27	Me	Me	Me	F	F	Me	B14	
8-28	Me	Me	Me	F	F	Me	B16	
8-29	Me	Me	Me	Me	H	Me	B21	
8-30	Me	Me	Me	Me	Me	Me	B71	

[0414]

표 9



No.	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	물성 (용점 ℃)
9-1	Me	Me	Me	F	F	H	B1	
9-2	Me	Me	Me	F	F	H	B5	
9-3	Me	Me	Me	F	F	H	B8	
9-4	Me	Me	Me	F	F	H	B14	
9-5	Me	Me	Me	F	F	H	B16	
9-6	Me	Me	Me	F	F	H	B21	
9-7	Me	Me	Me	F	F	H	B71	
9-8	Me	Me	Me	H	H	H	B1	
9-9	Me	Me	Me	H	H	H	B14	
9-10	Me	Me	Me	H	H	H	B16	
9-11	Me	Me	Me	Me	H	H	B1	
9-12	Me	Me	Me	Me	H	H	B5	
9-13	Me	Me	Me	Me	H	H	B8	
9-14	Me	Me	Me	Me	H	H	B14	
9-15	Me	Me	Me	Me	H	H	B16	
9-16	Me	Me	Me	Me	H	H	B21	
9-17	Me	Me	Me	Me	H	H	B71	
9-18	Me	Me	Me	Me	Me	H	B1	
9-19	Me	Me	Me	Me	Me	H	B5	
9-20	Me	Me	Me	Me	Me	H	B8	
9-21	Me	Me	Me	Me	Me	H	B14	
9-22	Me	Me	Me	Me	Me	H	B16	
9-23	Me	Me	Me	Me	Me	H	B21	
9-24	Me	Me	Me	Me	Me	H	B71	
9-25	Me	Me	H	F	F	H	B5	
9-26	Me	Me	H	F	F	H	B8	
9-27	Me	Me	Me	F	F	Me	B14	
9-28	Me	Me	Me	F	F	Me	B16	
9-29	Me	Me	Me	Me	H	Me	B21	
9-30	Me	Me	Me	Me	Me	Me	B71	

[0415]

표 10

No.	¹ H-NMR δ ppm (용매 : CDCl ₃ / 400MHz)
1-21	1.73 (s, 6H), 6.97 (d, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.84 (dd, 1H), 8.10 (d, 1H)
1-24	1.56 (s, 6H), 1.71 (s, 3H), 6.44 (s, 1H), 6.71 (dd, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.82 (dd, 1H), 8.08 (d, 1H)
1-28	1.76 (s, 6H), 2.34 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 6.83 (m, 2H), 7.23 (m, 3H), 7.74 (m, 3H)
1-29	1.74 (s, 6H), 2.33 (s, 3H), 6.51 (s, 1H), 6.83 (d, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.50 (t, 1H), 7.70 (d, 1H), 8.18 (d, 1H), 8.26 (s, 1H)
1-46	1.73 (s, 6H), 3.88 (s, 3H), 6.75 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.83 (m, 2H), 8.10 (d, 1H)
1-76	1.71 (s, 6H), 6.70 (t, 1H), 6.90 (d, 1H), 7.42 (m, 3H), 7.81 (dd, 1H), 8.06 (d, 1H)
1-120	1.72 (s, 6H), 2.24 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.47 (s, 3H), 6.80 (s, 1H), 6.86 (d, 1H), 7.20 (d, 2H), 7.25 (d, 1H)
1-121	1.76 (s, 6H), 2.34 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 6.88 (d, 1H), 6.94 (s, 1H), 7.09 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.28 (d, 1H)
1-123	1.50 (d, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.56 (s, 3H), 5.66 (m, 1H), 6.70 (bd, 1H), 7.48 (bd, 1H), 7.96 (d, 2H)
1-136	1.81 (s, 6H), 2.24 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 6.78 (d, 1H), 6.83 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.22 (m, 2H), 7.40 (d, 2H), 8.03 (d, 2H)
1-140	1.73 (s, 6H), 2.24 (s, 3H), 2.47 (s, 3H), 6.58 (s, 1H), 6.75 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.63 (dd, 1H), 7.91 (dd, 1H), 8.21 (d, 1H)
1-143	1.76 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 6.71 (s, 1H), 6.83 (d, 1H), 7.00 (d, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.93 (dd, 1H), 7.96 (d, 1H)
1-144	1.77 (s, 6H), 2.38 (s, 3H), 6.45 (d, 1H), 6.67 (d, 1H), 6.83 (d, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.83 (dd, 1H), 8.26 (d, 1H)
1-148	1.72 (s, 6H), 2.53 (s, 3H), 2.65 (s, 3H), 6.38 (s, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.89 (dd, 1H), 8.05 (d, 1H)
1-149	1.74 (s, 6H), 7.45 (d, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.82 (dd, 1H), 8.07 (d, 1H)
1-157	1.76 (s, 6H), 7.38 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.83 (dd, 1H), 8.09 (d, 1H), 9.98 (s, 1H)
1-179	1.72 (s, 6H), 2.21 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 6.50 (t, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.85 (d, 1H), 6.91 (d, 1H), 7.25 (m, 2H)
1-181	1.32 (d, 6H), 1.72 (s, 6H), 2.36 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 2.80 (m, 1H), 6.74 (s, 1H), 6.84-6.92 (m, 2H), 6.98 (s, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.52 (d, 1H)

[0416]

No.	¹ H-NMR δ ppm (용매 : CDCl ₃ / 400MHz)
1-184	1.73 (s, 6H), 2.46 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 6.84 (d, 1H), 6.85-6.91 (m, 3H), 7.00 (t, 1H), 7.26 (d, 1H), 7.27-7.39 (m, 2H)
1-187	1.75 (s, 6H), 2.38 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 4.35 (q, 2H), 6.69 (s, 1H), 6.71 (dd, 1H), 6.82 (d, 1H), 6.86 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.52 (d, 1H)
1-189	1.52 (d, 3H), 2.57 (s, 3H), 5.67 (m, 1H), 6.90 (d, 1H), 7.0 (bd, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.50 (d, 2H), 7.97 (d, 2H)
1-231	1.77 (s, 6H), 2.25 (s, 3H), 2.48 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 6.85 (dd, 1H), 6.87 (d, 1H), 6.89 (s, 1H), 6.97 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.26 (d, 1H)
1-270	1.75 (s, 6H), 2.29 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 6.73 (s, 1H), 6.86 (d, 1H), 6.91 (dd, 1H), 6.99 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.51 (d, 1H)
1-271	1.31 (d, 9H), 1.73 (s, 6H), 2.31 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 6.75 (s, 1H), 6.85 (d, 2H), 7.17 (dd, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.28 (bs, 1H), 7.39 (d, 1H)
1-273	0.96 (t, 3H), 1.26-1.31 (m, 3H), 1.61-1.75 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 4.32 (m, 1H), 6.64 (dd, 1H), 6.75 (d, 1H), 6.85 (d, 1H), 6.88 (s, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.47 (d, 1H)
1-276	1.75 (s, 6H), 2.38 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 6.71 (s, 1H), 6.85 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.32 (dd, 1H), 7.34-7.36 (m, 3H), 7.43 (bs, 1H), 7.51-7.54 (m, 2H)
1-282	0.24 (s, 9H), 1.73 (s, 6H), 2.33 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 6.68 (s, 1H), 6.86 (d, 1H), 7.24 (dd, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.36 (bs, 1H), 7.42 (d, 1H)
1-516	1.78 (s, 6H), 2.53 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 6.76 (s, 1H), 6.83 (dd, 1H), 6.89 (d, 1H), 7.14 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 7.47 (d, 1H)
1-518	1.78 (s, 6H), 4.43 (s, 2H), 6.96 (d, 1H), 7.38 (d, 2H), 7.41 (d, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.96 (d, 2H)
1-521	1.74 (s, 6H), 2.13 (s, 6H), 3.34 (s, 2H), 6.87 (d, 1H), 7.25 (d, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.88 (d, 2H)
1-536	1.73 (s, 6H), 2.48 (s, 3H), 6.75 (s, 1H), 6.85 (d, 1H), 7.22-7.26 (m, 2H), 7.32 (dt, 1H), 7.55-7.58 (m, 2H)
1-539	1.80 (s, 6H), 2.30 (s, 6H), 3.56 (s, 2H), 7.01 (d, 1H), 7.39 (m, 3H), 7.93 (s, 1H), 7.98 (d, 2H)
2-4	1.87 (s, 6H), 2.45 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 7.54 (m, 2H), 7.69 (s, 1H), 7.90 (m, 3H), 8.00 (d, 1H), 8.50 (s, 1H)
6-1	0.75 (s, 3H), 1.34 (s, 9H), 1.59 (s, 3H), 2.57 (s, 3H), 6.93 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.39 (d, 2H), 7.54 (d, 2H)
6-2	0.74 (s, 3H), 1.62 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 2.56 (s, 3H), 6.92 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.37 (d, 2H), 7.53 (d, 2H)
6-3	1.60 (s, 6H), 2.04 (s, 3H), 2.54 (s, 3H), 6.91 (d, 1H), 7.29 (m, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.54 (s, 1H)
7-9	1.60 (s, 6H), 2.30 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 6.67 (s, 1H), 6.91 (d, 1H), 7.25 (d, 1H)

[0417]

[0418] 이하에, 본 발명 조성물의 시험예를 기재한다. 각 시험에서, 방제 지수는 이하의 기준에 따랐다.

[0419] [방제 지수] [발병 정도: 육안 관찰]

[0420] 5: 병반 또는 포자 형성이 전혀 관찰되지 않음.

[0421] 4: 병반 면적, 병반 길이, 병반수 또는 포자 형성 면적이 무처리구의 10% 미만.

[0422] 3: 병반 면적, 병반 길이, 병반수 또는 포자 형성 면적이 무처리구의 40% 미만.

[0423] 2: 병반 면적, 병반 길이, 병반수 또는 포자 형성 면적이 무처리구의 70% 미만.

[0424] 1: 병반 면적, 병반 길이, 병반수 또는 포자 형성 면적이 무처리구의 70% 이상.

[0425] 시험예 1(보리 흰가루병 예방 효과 시험)

[0426] 직경 7.5 cm의 플라스틱 포트에 보리(품종: 도린 61호)를 재배하고, 1.5 엽기(葉期)에 달했을 때 화학식 I의 산아미드 유도체 또는 그의 염을 소정 농도로 조정한 약액 10 ml를 스프레이건으로 산포하였다. 약액이 건조된 후(처리 당일), 흰가루병균(*Erysiphe graminis*)의 분생 포자를 뿌려 접종하고, 20 °C의 항온실 내에 유지하였다. 접종 6일 내지 7일 후에 포자 형성 면적을 조사하고, 상기 평가 기준에 따라 방제 지수를 구하였다. 상기 화합물 No.1-13, 1-29, 1-39, 1-54, 1-90, 1-96, 1-100, 1-101, 1-106, 1-107, 1-109, 1-124, 1-125, 1-127, 1-148, 1-152, 1-156, 1-174, 1-175, 1-190, 1-205, 1-516, 3-4, 3-9, 3-10, 3-12, 3-19, 3-20, 4-19, 6-1 또는 7-2에 대하여 시험한 바, 모든 화합물이 500 ppm에서 방제 지수 4 또는 5의 효과를 나타내었다.

[0427] 시험예 2(오이 흰가루병 예방 효과 시험)

[0428] 직경 7.5 cm의 플라스틱 포트에 오이(품종: 사가미한과쿠)를 재배하고, 1.5 엽기에 도달했을 때 화학식 I의 산아미드 유도체 또는 그의 염을 소정 농도로 조정한 약액 10 ml를 스프레이건으로 산포하였다. 약액이 건조된 후(처리 당일 또는 익일), 흰가루병균(*Sphaerotheca fuliginea*)의 분생 포자 현탁액을 분무 접종하고, 20 °C의

항온실 내에 유지하였다. 접종 6일 내지 7일 후에 포자 형성 면적을 조사하고, 상기 평가 기준에 따라 방제 지수를 구하였다. 상기 화합물 No.1-6, 1-9, 1-11, 1-14, 1-15, 1-17 내지 1-22, 1-27 내지 1-29, 1-32, 1-33, 1-36, 1-39, 1-41 내지 1-43, 1-47, 1-53 내지 1-56, 1-62 내지 1-64, 1-66, 1-73, 1-77, 1-79, 1-90, 1-93, 1-97 내지 1-104, 1-106 내지 1-108, 1-111, 1-115, 1-119, 1-120, 1-124, 1-127, 1-129, 1-131, 1-148, 1-150, 1-152, 1-156, 1-160, 1-161, 1-164, 1-165, 1-167, 1-170, 1-172, 1-174, 1-175, 1-190, 1-205, 1-516, 2-1, 2-14, 3-2, 3-4, 3-6, 3-9, 3-10, 3-12, 3-19, 3-20, 3-23, 4-10 또는 6-1 내지 6-3에 대하여 시험한 바, 모든 화합물이 500 ppm에서 방제 지수 4 또는 5의 효과를 나타내었으며, 상기 화합물 No.1-34에 대하여 시험한 바, 200 ppm에서 방제 지수 4의 효과를 나타내었다.

[0429] 시험예 3(벼 도열병 예방 효과 시험)

[0430] 직경 7.5 cm의 플라스틱 포트에 벼(품종: 니혼바레)를 재배하고, 1.5 엽기에 도달했을 때 화학식 I의 산 아미드 유도체 또는 그의 염을 소정 농도로 조정한 약액 10 ml를 스프레이건으로 산포하였다. 약액이 건조된 후(처리 당일 또는 익일), 도열병균(Pyricularia oryzae)의 분생 포자 현탁액을 분무 접종하고, 24 시간 동안 20 °C의 접종 상자에 유지하며, 그 후 20 °C의 항온실 내에 유지하였다. 접종 5일 내지 7일 후에 병반수를 조사하고, 상기 평가 기준에 따라 방제 지수를 구하였다. 상기 화합물 No.1-6, 1-9, 1-13, 1-14, 1-28, 1-45, 1-47, 1-52, 1-53, 1-55, 1-56, 1-62, 1-63, 1-66, 1-75, 1-77, 1-79, 1-109, 1-119, 1-164, 2-1, 2-2, 3-25 또는 4-19에 대하여 시험한 바, 모든 화합물이 500 ppm에서 방제 지수 4 또는 5의 효과를 나타내었다.

[0431] 시험예 4(까치콩 회색 곰팡이병 예방 효과 시험)

[0432] 직경 15 cm의 플라스틱 포트에 까치콩(품종: 다이쇼 긴도끼)를 재배하고, 본엽이 충분히 전개되었을 때 화학식 I의 산 아미드 유도체 또는 그의 염을 소정 농도로 조정한 약액 10 ml를 스프레이건으로 산포하였다. 약액이 건조된 후(처리 당일 또는 익일), 회색 곰팡이병균(Botrytis cinerea) 포자 현탁액(물로 50% 희석한 감자·글루코오스 전즙액(煎汁液))을 접종하고, 20 °C의 항온실 내에 유지하였다. 접종 3일 후에 병반 길이(mm)를 조사하고, 상기 평가 기준에 따라 방제 지수를 구하였다. 상기 화합물 No.1-11, 1-15, 1-17, 1-20, 1-22, 1-27, 1-41, 1-43, 1-52, 1-80, 1-99, 1-102, 1-112 내지 1-115, 1-117, 1-118, 1-120, 1-125, 1-131, 1-136, 1-160, 1-162, 1-169, 1-172, 1-176, 1-180, 1-182, 1-186 내지 1-189, 1-273, 2-2, 2-9, 2-13, 2-14 또는 7-6에 대하여 시험한 바, 모든 화합물이 500 ppm에서 방제 지수 4 또는 5의 효과를 나타내었다.

[0433] 시험예 5(까치콩 균핵병 예방 효과 시험)

[0434] 직경 15 cm의 플라스틱 포트에 까치콩(품종: 다이쇼 긴도끼)를 재배하고, 본엽이 충분히 전개되었을 때 화학식 I의 산 아미드 유도체 또는 그의 염을 소정 농도로 조정한 약액 10 ml를 스프레이건으로 산포하였다. 약액이 건조된 후(처리 당일 또는 익일), 균핵병균(Sclerotinia sclerotiorum)의 균총 디스크를 접종하고, 20 °C의 항온실 내에 유지하였다. 접종 3일 후에 병반 길이(mm)를 조사하고, 상기 평가 기준에 따라 방제 지수를 구하였다. 상기 화합물 No.1-1, 1-4, 1-7, 1-10, 1-16, 1-18, 1-19, 1-21, 1-26, 1-30 내지 1-33, 1-36, 1-38, 1-42, 1-44, 1-46, 1-57, 1-60, 1-64, 1-69, 1-71, 1-73, 1-75, 1-80, 1-86, 1-93, 1-96 내지 1-98, 1-103 내지 1-105, 1-108, 1-111 내지 1-114, 1-117, 1-118, 1-123, 1-126, 1-128, 1-129, 1-133 내지 1-136, 1-141 내지 1-144, 1-146, 1-149, 1-150, 1-159, 1-161 내지 1-163, 1-165 내지 1-171, 1-176, 1-180, 1-181, 1-186, 1-188, 1-208, 1-209, 1-271, 1-273, 1-276, 1-535, 2-1, 2-3, 2-4, 2-10, 2-11, 2-13, 3-2, 3-3, 3-6, 3-23, 3-26, 4-10, 6-2, 6-3, 7-2, 7-4, 7-6 내지 7-8 또는 7-66에 대하여 시험한 바, 모든 화합물이 500 ppm에서 방제 지수 4 또는 5의 효과를 나타내었다.

[0435] 시험예 6(보리 반고병 예방 효과 시험)

[0436] 직경 7.5 cm의 플라스틱 포트에 보리(품종: 노린 61호)를 재배하고, 1.5 엽기에 도달했을 때 화학식 I의 산 아미드 유도체 또는 그의 염을 소정 농도로 조정한 약액 10 ml를 스프레이건으로 산포하였다. 약액이 건조된 후(처리 당일), 반고병균(Septoria nodorum)의 분생 포자 현탁액을 분무 접종하고, 72 시간 동안 20 °C의 접종 상자에 유지하며, 그 후 20 °C의 항온실 내에 유지하였다. 접종 5일 내지 10일 후에 포자 형성 면적을 조사하고, 상기 평가 기준에 따라 방제 지수를 구하였다. 상기 화합물 No.1-179 또는 1-189에 대하여 시험한 바, 모든 화합물이 500 ppm에서 방제 지수 4 또는 5의 효과를 나타내었다.

[0437] 시험예 7(벼 문고병 예방 효과 시험)

[0438] 직경 7.5 cm의 플라스틱 포트에 벼(품종: 니혼바레)를 재배하고, 5 엽기에 도달했을 때 화학식 I의 산 아미드 유도체 또는 그의 염을 소정 농도로 조정한 약액 10 ml를 스프레이건으로 산포하였다. 약액이 건조된 후(처리

당일 또는 익일), 미리 배양한 문고병균(Rhizoctonia solani)의 균총 디스크를 엽초(葉梢)에 끼우고, 끈으로 고정하여 25 ℃의 접종 상자에 유지하였다. 접종 5일 내지 7일 후에 병반 길이를 조사하고, 상기 평가 기준에 따라 방제 지수를 구하였다. 상기 화합물 No.1-130, 1-137 또는 3-3에 대하여 시험한 바, 모든 화합물이 500 ppm에서 방제 지수 4 또는 5의 효과를 나타내었다.

[0439] 이어서 본 발명 조성물의 제제예를 기재하지만, 배합 비율량 및 제형 등은 기재예만으로 한정되지 않는다.

[0440] 제제예 1

[0441] (1) 화학식 I의 화합물 20 중량부

[0442] (2) 클레이 72 중량부

[0443] (3) 리그닌술포산 나트륨 8 중량부

[0444] 이상의 것을 균일하게 혼합하여 수화제로 한다.

[0445] 제제예 2

[0446] (1) 화학식 I의 화합물 5 중량부

[0447] (2) 탈크 95 중량부

[0448] 이상의 것을 균일하게 혼합하여 분제로 한다.

[0449] 제제예 3

[0450] (1) 화학식 I의 화합물 20 중량부

[0451] (2) N,N'-디메틸아세트아미드 20 중량부

[0452] (3) 폴리옥시에틸렌알킬페닐에테르 10 중량부

[0453] (4) 크실렌 50 중량부

[0454] 이상의 것을 균일하게 혼합, 용해하여 유제로 한다.

[0455] 제제예 4

[0456] (1) 클레이 68 중량부

[0457] (2) 리그닌술포산 나트륨 2 중량부

[0458] (3) 폴리옥시에틸렌알킬아릴술페이트 5 중량부

[0459] (4) 미분 실리카 25 중량부

[0460] 이상의 각 성분의 혼합물과, 화학식 I의 화합물을 4:1의 중량 비율로 혼합하여 수화제로 한다.

[0461] 제제예 5

[0462] (1) 화학식 I의 화합물 50 중량부

[0463] (2) 옥실화 폴리알킬페닐포스페이트-트리에탄올아민 2 중량부

[0464] (3) 실리콘 0.2 중량부

[0465] (4) 물 47.8 중량부

[0466] 이상의 것을 균일하게 혼합, 분쇄한 원액에 추가로

[0467] (5) 폴리카르복실산나트륨 5 중량부

[0468] (6) 황산나트륨 무수물 42.8 중량부

[0469] 를 첨가하여 균일하게 혼합, 조립 및 건조하여 과립 수화제로 한다.

[0470] 제제예 6

[0471] (1) 화학식 I의 화합물 5 중량부

[0472]	(2) 폴리옥시에틸렌옥틸페닐에테르	1 중량부
[0473]	(3) 폴리옥시에틸렌의 포스페이트	0.1 중량부
[0474]	(4) 입상 탄산칼슘	93.9 중량부
[0475]	(1) 내지 (3)을 미리 균일하게 혼합하여 적량의 아세톤으로 희석한 후, 성분 (4)에 분사하고, 아세톤을 제거하여 입제로 한다.	
[0476]	제제예 7	
[0477]	(1) 화학식 I의 화합물	2.5 중량부
[0478]	(2) N-메틸-2-피롤리돈	2.5 중량부
[0479]	(3) 대두유	95.0 중량부
[0480]	이상의 것을 균일하게 혼합, 용해하여 미량 산포제(ultra low volume formulation)로 한다.	
[0481]	제제예 8	
[0482]	(1) 화학식 I의 화합물	20 중량부
[0483]	(2) 옥실화 폴리알킬페놀포스페이트-트리에탄올아민	2 중량부
[0484]	(3) 실리콘	0.2 중량부
[0485]	(4) 크산탄검	0.1 중량부
[0486]	(5) 에틸렌글리콜	5 중량부
[0487]	(6) 물	72.7 중량부
[0488]	이상의 것을 균일하게 혼합, 분쇄하여 수성 현탁제로 한다.	