



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2018년04월11일
(11) 등록번호 10-1848116
(24) 등록일자 2018년04월05일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
C07D 417/14 (2006.01) A01N 43/80 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)
(21) 출원번호 10-2013-7023074
(22) 출원일자(국제) 2013년01월31일
심사청구일자 2017년01월31일
(85) 번역문제출일자 2013년08월30일
(65) 공개번호 10-2014-0009334
(43) 공개일자 2014년01월22일
(86) 국제출원번호 PCT/EP2012/051499
(87) 국제공개번호 WO 2012/104273
국제공개일자 2012년08월09일
(30) 우선권주장
11152839.4 2011년02월01일
유럽특허청(EPO)(EP)
61/438,374 2011년02월01일 미국(US)
(56) 선행기술조사문헌
WO2009055514 A2*
WO2008013622 A2
WO2006054652 A1
JP2010509190 A
*는 심사관에 의하여 인용된 문헌

(73) 특허권자
마이엘 인텔렉처 프로퍼티 게엠베하
독일, 40789 몬헤임 엠 라인, 알프레드-노엘-스트
라쎄 10
(72) 발명자
호프만, 세바스티안
독일 41470 노이스 파른베크 7
바스나이레, 피에르
독일 40225 뒤셀도르프 크리스토프스트라세 55
(뒷면에 계속)
(74) 대리인
양영준, 위혜숙

전체 청구항 수 : 총 6 항

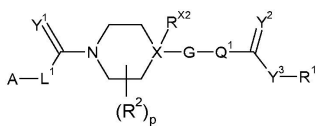
심사관 : 강신건

(54) 발명의 명칭 **살진균제로서의 헤테로아릴 피페리딘 및 헤테로아릴 피페라진 유도체**

(57) 요약

본 발명은 하기 화학식 I의 헤테로아릴 피페리딘 및 헤테로아릴 피페라진 유도체 및 그의 농약 활성 염, 식물병 원성 유해 진균을 방제하기 위한 그의 용도 및 또한 화학식 I의 화합물의 제조 방법에 관한 것이다.

<화학식 I>



상기 식에서, 부호는 각각 명세서에 정의된 바와 같다.

(72) 발명자

츠치야, 토모키

프랑스 69009 리옹 16 뤼 장 마리 레플레어

크리스토, 피에르

프랑스 에프-69009 리옹 4 뤼 마리에통

자이츠, 토마스

독일 40764 랑겐펠트 리에테르바흐 10베

클루트, 요아힘

독일 40764 랑겐펠트 비르네부르크스트라세 69

벤딩, 위르겐

독일 42799 라이홀링겐 암젤스트라세 7

마헨도르프-노이만, 울리케

독일 56566 노이비트 오베레어 마르켄베크 85

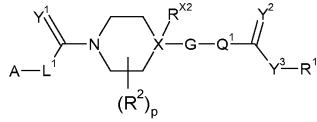
명세서

청구범위

청구항 1

하기 화학식 I의 화합물 또는 화학식 I의 화합물의 염 또는 금속 착물 또는 N-옥시드.

<화학식 I>



상기 식에서, 라디칼은 각각 하기와 같이,

A는 피라졸-1-일이고, 이는 L¹에 결합되며 그 외에 2개 이하의 치환기를 함유할 수 있고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 메틸, 에틸, 염소, 브로민, 플루오린, 디플루오로메틸 및 트리플루오로메틸로 구성된 군으로부터 선택되고,

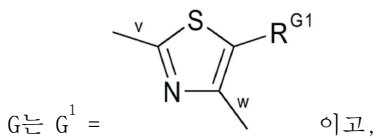
L¹은 CH₂이고,

Y¹은 산소이고,

X는 탄소이고,

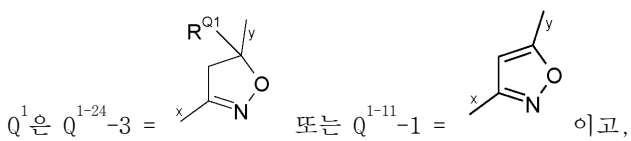
R^{X2}는 수소이고,

p는 0이고,



여기서 "v"로 나타낸 결합은 X에 직접 결합되며 "w"로 나타낸 결합은 Q¹에 직접 결합되고,

R^{G1}은 수소이고,



여기서 "x"로 나타낸 결합은 G에 직접 결합되며 "y"로 나타낸 결합은 -C(=Y²)-Y³-R¹에 직접 결합되고,

R⁰¹은 수소 또는 메틸이고,

Y²는 산소이고,

Y³은 산소 또는 -(NR^{Y3})-이고,

R^{Y3}은 수소이고,

R¹은 치환된 시클로프로필 또는 시클로헥실이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 메틸, 에틸 또는 페닐로부터 선택되거나, 또는

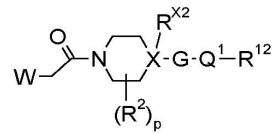
R¹은 시클로펜테닐 또는 시클로헥세닐이거나, 또는

R¹은 비치환 또는 치환된 페닐 또는 벤질이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 메틸, 에틸 및 메톡시로 구성된 군으로부터 선택된다.

청구항 2

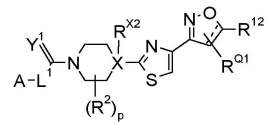
하기 화학식 XXXI의 화합물 또는 하기 화학식 XXXII의 화합물 또는 하기 화학식 XXXIII의 화합물 또는 하기 화학식 XXXIV의 화합물 또는 각 경우에 이들의 염 또는 금속 착물 또는 N-옥시드.

<화학식 XXXI>



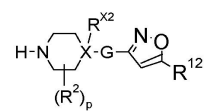
(상기 식에서, W는 염소, 브로민, 아이오딘, -OSO₂CH₃, -OSO₂CF₃ 또는 -OSO₂Ph이고, R¹²는 -C(=Y²)Y³-R¹임)

<화학식 XXXII>



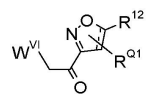
(상기 식에서, A-L¹(Y¹)-은 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐이고, R¹²는 -C(=Y²)Y³-R¹임)

<화학식 XXXIII>



(상기 식에서, R¹²는 -C(=Y²)Y³-R¹임)

<화학식 XXXIV>

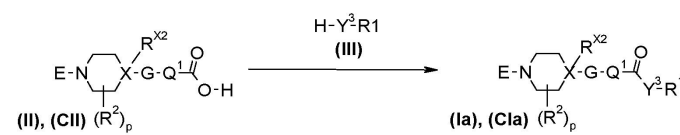


(상기 식에서, R¹²는 -C(=Y²)Y³-R¹이고, W^v는 염소, 브로민, 아이오딘, 톨루엔술포닐옥시 또는 메탄술포닐옥시임)

(상기 식들에서, 부호 Y², Y³, Q¹, G, X, R^{x2}, R⁰¹, R¹ 및 p는 각 경우에서 동일 또는 상이하며 각각 독립적으로 제1항에 정의된 바와 같음).

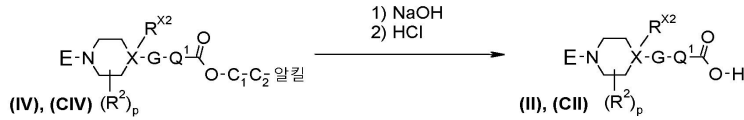
청구항 3

(A) 하기 반응식에 따라 화학식 II 또는 화학식 CII의 화합물을 커플링제의 존재 하에 화학식 III의 기체와 반응시켜 화학식 Ia 또는 화학식 CIa의 화합물을 생성함:



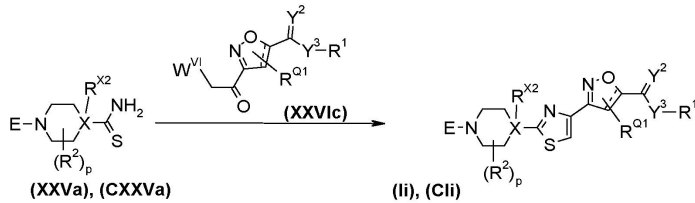
(상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐이며, A, L¹, Y¹, R¹, G, Q¹, X, R^{X2}, Y³ 및 p는 각각 제1항에 제시된 정의를 가짐); 또는

(B) 하기 반응식에 따라 화학식 IV 또는 화학식 CIV의 C₁-C₂-알킬 에스테르를 화학식 II 또는 화학식 CII의 카복실산으로 가수분해시킴:



(상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐이고, A, L¹, Y¹, G, Q¹, X, R^{X2} 및 p는 각각 제1항에 제시된 정의를 가짐); 또는

(C) 하기 반응식에 따라 화학식 XXVa 또는 화학식 CXXVa의 화합물을 화학식 XXVIc의 화합물과 반응시켜 화학식 Ii 및 화학식 CIi의 화합물을 생성함:



(상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐이고, W^{VI}는 염소, 브로민, 아이오딘, 톨루엔술포닐옥시이며, A, L¹, Y¹, X, R^{Q1}, Q¹, R¹, R^{X2}, Y², Y³ 및 p는 각각 제1항에 제시된 정의를 가짐)

을 특징으로 하는, 제1항에 따른 화학식 I의 화합물의 제조 방법.

청구항 4

제1항에 따른 화학식 I의 화합물을 식물병원성 유해 진균 및/또는 그의 서식지에 적용하는 것을 특징으로 하는 식물병원성 유해 진균의 방제 방법.

청구항 5

증량제 및/또는 계면활성제 이외에 제1항에 따른 화학식 I의 화합물 1종 이상을 함유하는 것을 특징으로 하는 식물병원성 유해 진균 방제용 조성물.

청구항 6

제1항에 따른 화학식 I의 화합물을 증량제 및/또는 계면활성제와 혼합하는 것을 특징으로 하는 식물병원성 유해 진균 방제용 조성물의 제조 방법.

청구항 7

삭제

청구항 8

삭제

청구항 9

삭제

청구항 10

삭제

청구항 11

삭제

청구항 12

삭제

청구항 13

삭제

청구항 14

삭제

청구항 15

삭제

발명의 설명

기술 분야

[0001] 본 발명은 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체, 그의 농약 활성 염, 식물 내에서 및/또는 식물 상에서 또는 식물의 종자 내에서 및/또는 식물의 종자 상에서 식물병원성 유해 진균을 방제하기 위한 그의 용도, 방법 및 조성물, 상기 조성물의 제조 방법 및 처리된 종자 및 농업, 원예 및 임학에서, 동물 방역에서, 물질 보호 및 가정 및 위생 부문에서 식물병원성 유해 진균의 방제를 위한 그의 용도에 관한 것이다. 추가로, 본 발명은 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체의 제조 방법에 관한 것이다.

배경 기술

[0002] 특정한 헤테로시클릭 치환된 티아졸은 살진균성 작물 보호제로서 사용될 수 있는 것으로 공지되어 있다 (공보 번호: WO07/014290, WO08/013925, WO08/013622, WO08/091594, WO08/091580, WO09/055514, WO09/094407, WO09/094445, WO09/132785, WO10/037479, WO10/065579, WO2010/066353의 특허 출원을 참조하며, 또한 출원 번호: DE102010000662.9, PCT/EP2010/003499, EP09174510.9, EP09174614.9; EP09180073.0, EP10161264.6, EP10163067.1, EP10164099.3, EP10172486.2, EP10174012.4, EP10189067.1의 특허 출원을 참조한다).

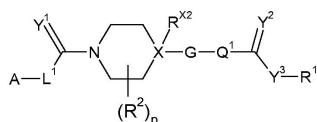
[0003] 현대 작물 보호 조성물에 이루어진 생태학적 및 경제적 수요는 예를 들어 활성 스펙트럼, 독성, 선택성, 적용율, 잔류물의 형성 및 바람직한 제조에 관하여 끊임없이 증가되고 있으며 예를 들어 내성과 관련된 문제가 존재할 수 있으므로, 적어도 일부 분야에서 공지의 조성물에 비하여 이점을 갖는 신규한 작물 보호 조성물, 특히 살진균제를 개발하는 것은 거듭되는 목적이 된다.

[0004] 이제, 놀랍게도 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체는 언급된 목적의 적어도 일부 구체예를 달성하며 작물 보호 조성물, 특히 살진균제로서 사용하기에 적절한 것으로 밝혀졌다.

발명의 내용

[0005] 본 발명은 하기 화학식 I의 화합물 및, 화학식 I의 화합물의 염, 금속 착물 및 N-옥시드에 관한 것이다.

[0006] <화학식 I>



[0007]

- [0008] 상기 식에서, 라디칼은 각각 하기와 같이 정의된다:
- [0009] A는 페닐이고, 이는 L¹에 결합되고 그 외에 5개 이하의 추가의 치환기를 함유할 수 있고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 Z^{A-1}로부터 선택되거나, 또는
- [0010] A는 임의로 벤조융합된, 비치환 또는 치환된 5- 또는 6-원 헤테로아릴이고, 이는 L¹에 결합되고 그 외에 4개 이하의 추가의 치환기를 함유할 수 있고, 여기서 탄소 상의 치환기는 각각 독립적으로 Z^{A-2}로부터 선택되며, 질소 상의 치환기는 각각 독립적으로 Z^{A-3}으로부터 선택되고,
- [0011] Z^{A-1}은 동일 또는 상이하며 각각 독립적으로 수소, 할로젠, 히드록실, 티옥시, 니트로, 시아노, -C(=O)H, -C(=O)OH, 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 할로알케닐, 할로알키닐, 시클로알킬, 시클로알케닐, 할로시클로알킬, 할로시클로알케닐, 히드록시알킬, 시아노알킬, 포르밀알킬, 알콕시알킬, 할로알콕시알킬, 시클로알콕시알킬, 알킬닐옥시알킬, 알킬티오알킬, 알킬술피닐알킬, 알킬아미노알킬, 할로알킬아미노알킬, 시클로알킬아미노알킬, 디알킬아미노알킬, 알킬카르보닐알킬, 알킬술포닐알킬, 알킬시클로알킬, 알킬시클로알케닐, 알콕시, 알킬시클로알킬알킬, 할로시클로알콕시, 알킬티오, 할로알킬티오, 시클로알킬티오, 알킬닐티오, 알케닐옥시, 알킬닐옥시, 할로알콕시, 할로알케닐옥시, 할로알키닐옥시, 시클로알콕시, 알콕시알콕시, 시클로알킬알콕시, 알킬카르보닐옥시, 할로알킬카르보닐옥시, 시클로알킬카르보닐옥시, 시클로알킬아미노, 알킬카르보닐아미노, 시클로알킬카르보닐아미노, 알콕시카르보닐아미노, 알킬술포닐아미노, 할로알킬술포닐아미노, 페닐술포닐아미노, 시클로알킬알킬, 할로시클로알킬알킬, 시클로알킬시클로알킬, 알콕시알콕시알킬, 알킬아미노카르보닐옥시, 알킬카르보닐알콕시, 시클로알킬아미노카르보닐, 시클로알킬알콕시카르보닐, 알킬술피닐, 할로알킬술피닐, 알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 시클로알킬술포닐, 알킬카르보닐, 할로알킬카르보닐, 시클로알킬카르보닐, 알콕시카르보닐, 시클로알콕시카르보닐, 트리알킬실릴, -SF₅, 페닐, -C(=O)NR³R⁴ 또는 -NR³R⁴이고,
- [0012] Z^{A-2} 및 R^{G1}은 동일 또는 상이하며 각각 독립적으로 수소, 할로젠, 히드록실, 티옥시, 니트로, 시아노, -C(=O)H, -C(=O)OH, 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 할로알케닐, 할로알키닐, 시클로알킬, 할로시클로알킬, 히드록시알킬, 포르밀알킬, 알콕시알킬, 알킬카르보닐알킬, 알킬시클로알킬, 알콕시, 알킬시클로알킬알킬, 알킬티오, 할로알킬티오, 알킬닐티오, 알케닐옥시, 알킬닐옥시, 할로알콕시, 알콕시알콕시, 알킬카르보닐옥시, 할로알킬카르보닐옥시, 시클로알킬카르보닐아미노, 알킬술포닐아미노, 할로알킬술포닐아미노, 페닐술포닐아미노, 시클로알킬알킬, 할로시클로알킬알킬, 시클로알킬시클로알킬, 알콕시카르보닐옥시, 알킬카르보닐티오, 알킬술피닐, 할로알킬술피닐, 알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 알킬카르보닐, 할로알킬카르보닐, 알콕시카르보닐, 알킬아미노카르보닐옥시, -C(=O)NR³R⁴ 또는 -NR³R⁴이고,
- [0013] Z^{A-3} 및 R^{G2}은 동일 또는 상이하며 각각 독립적으로 수소, -C(=O)H, -C(=O)NR³R⁴, 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 할로알케닐, 할로알키닐, 시클로알킬, 할로시클로알킬, 알킬시클로알킬, 시클로알킬알킬, 알콕시알킬, 알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 시클로알킬술포닐, 페닐술포닐, 알킬카르보닐, 할로알킬카르보닐, 알콕시카르보닐, 할로알콕시카르보닐, 시클로알콕시카르보닐, 페닐 또는 벤질이고,
- [0014] R³, R⁴ 및 R⁷은 동일 또는 상이하며 각각 독립적으로 수소, 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 시클로알킬, 벤질 또는 페닐이고,
- [0015] L¹은 NR^{L12} 또는 C(R^{L11})₂이고,
- [0016] R^{L11}은 동일 또는 상이하며 독립적으로 수소, 할로젠, 히드록실, 시아노, -C(=O)H, -C(=O)OH, 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 할로알케닐, 할로알키닐, 알콕시알킬, 알킬티오알킬, 알킬아미노알킬, 디알킬아미노알킬, 알콕시, 알킬티오, 할로알킬티오, 할로알콕시, 알킬카르보닐옥시, 알킬카르보닐아미노, 알킬카르보닐티오, 알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 알킬카르보닐, 할로알킬카르보닐, 알콕시카르보닐, 트리알킬실릴옥시, -NR³R⁴ 또는 -C(=O)NR³R⁴이거나, 또는
- [0017] 2개의 R^{L11} 라디칼은 이들이 결합되어 있는 탄소 원자와 함께 시클로프로필 고리를 형성하거나, 또는

- [0018] 2개의 R^{L11} 라디칼은 $=CH_2$, $=COR^3$, $=NOR^3$ 또는 $=CHN(R^3)_2$ 이고,
- [0019] R^{L12} 는 수소, $-C(=O)H$, 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 할로알케닐, 할로알키닐, 시클로알킬, 할로시클로알킬, 알킬시클로알킬, 시클로알킬알킬, 시클로알킬아미노카르보닐, 할로알킬아미노카르보닐, 알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 시클로알킬술포닐, 알킬카르보닐, 할로알킬카르보닐, 알콕시카르보닐, 할로알콕시카르보닐, 시클로알콕시카르보닐, 알킬아미노카르보닐, 디알킬아미노카르보닐, 페닐 또는 벤질이고,
- [0020] Y^1 은 황 또는 산소이고,
- [0021] X 는 탄소 또는 질소이고,
- [0022] R^{X2} 및 R^8 은 동일 또는 상이하하며 각각 독립적으로 수소, 알킬, 알케닐, 할로알킬, 알콕시, 할로젠, 시아노 또는 히드록실이고,
- [0023] R^2 는 옥소, 알킬, 알케닐, 할로알킬, 알콕시, 할로젠, 시아노 또는 히드록실이고,
- [0024] p 는 0, 1 또는 2이고,
- [0025] G 는 5-원 헤테로아릴이고, 이는 X 및 Q^1 에 의해 치환되며 그 외에 비치환 또는 치환될 수 있고, 여기서 탄소 상의 치환기는 각각 독립적으로 R^{G1} 로부터 선택되며, 질소 상의 치환기는 각각 독립적으로 R^{G2} 로부터 선택되고,
- [0026] Q^1 은 포화 또는 부분 또는 완전 불포화 5-원 헤테로시클릴이며, 이는 G 및 $-C(=Y^2)-Y^3-R^1$ 에 의해 치환되며 그 외에 비치환 또는 치환될 수 있고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 R^{Q1} 로부터 선택되고,
- [0027] R^{Q1} 은
- [0028] Q 의 5-원 헤테로시클릴의 탄소에 결합되며:
- [0029] 수소, 옥소, 할로젠, 시아노, 히드록실, 니트로, $-CHO$, $-C(=O)OH$, $-C(=O)NH_2$, $-C(=O)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 할로알케닐, 할로알키닐, 시클로알킬, 할로시클로알킬, 알킬시클로알킬, 시클로알킬알킬, 시클로알킬시클로알킬, 할로시클로알킬알킬, 알킬시클로알킬알킬, 시클로알케닐, 할로시클로알케닐, 알콕시알킬, 할로알콕시알킬, 시클로알콕시알킬, 알콕시알콕시알킬, 알킬티오알킬, 포르밀알킬, 알킬카르보닐알킬, 알킬술포닐알킬, 알킬술포닐알킬, 알킬아미노알킬, 디알킬아미노알킬, 할로알킬아미노알킬, 시클로알킬아미노알킬, 알킬카르보닐, 할로알킬카르보닐, 시클로알킬카르보닐, 알콕시카르보닐, 시클로알콕시카르보닐, 시클로알킬알콕시카르보닐, 시클로알킬아미노카르보닐, 히드록시알킬, 알콕시, 할로알콕시, 시클로알콕시, 할로시클로알콕시, 시클로알킬알콕시, 알케닐옥시, 할로알케닐옥시, 알키닐옥시, 할로알키닐옥시, 알콕시알콕시, 알킬카르보닐옥시, 할로알킬카르보닐옥시, 시클로알킬카르보닐옥시, 알킬카르보닐알콕시, 알킬티오, 할로알킬티오, 시클로알킬티오, 알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 시클로알킬술포닐, 트리알킬실릴, 알킬술포닐아미노, 할로알킬술포닐아미노, 페닐 또는 5- 또는 6-원 헤테로아릴 라디칼이며, 여기서, 페닐 또는 5- 또는 6-원 헤테로아릴 라디칼은 알케닐, 알케닐아미노, 알케닐옥시, 알케닐티오, 알키닐, 알키닐아미노, 알키닐옥시, 알키닐티오, 알콕시, 알콕시알케닐, 알콕시알키닐, 알콕시알콕시, 알콕시알콕시알킬, 알콕시알콕시카르보닐, 알콕시알킬, 알콕시알킬아미노카르보닐, 알콕시알킬카르보닐, 알콕시아미노, 알콕시카르보닐, 알콕시카르보닐알콕시, 알콕시카르보닐알킬, 알콕시카르보닐아미노, 알콕시할로알콕시, 알콕시할로알킬, 알킬, 알킬아미노, 알킬아미노알킬, 알킬아미노카르보닐, 알킬아미노카르보닐알킬아미노, 알킬아미노카르보닐아미노, 알킬아미노술포닐, 알킬아미노티오카르보닐, 알킬아미노티오카르보닐아미노, 알킬카르보닐, 알킬카르보닐알콕시, 알킬카르보닐아미노, 알킬카르보닐옥시, 알킬카르보닐티오, 알킬시클로알킬, 알킬시클로알킬알킬, 알킬술포닐, 알킬술포닐알킬, 알킬술포닐알킬, 알킬술포닐아미노, 알킬술포닐아미노카르보닐, 알킬티오, 알킬티오알킬, 알킬티오카르보닐, 알킬티오카르보닐옥시, 아미노, 아미노카르보닐, $C(=N-OR^7)R^8$, $C(=O)H$, $C(=O)NHCN$, $C(=O)OH$, 시아노, 시아노알콕시, 시아노알킬, 시클로알케닐, 시클로알케닐옥시알킬, 시클로알콕시, 시클로알콕시알킬, 시클로알콕시카르보닐, 시클로알킬, 시클로알킬알콕시, 시클로알킬알콕시카르보닐, 시클로알킬알킬, 시클로알킬알킬아미노, 시클로알킬알킬아미노알킬, 시클로알킬아미노, 시클로알킬아미노알킬, 시클로알킬아미노카르보닐, 시클로알킬카르보닐, 시클로알킬카르보닐옥시, 시클로알킬시클로알킬, 시클로알킬술

포닐, 시클로알킬티오, 디알콕시알킬, 디알킬아미노, 디알킬아미노알킬, 디알킬아미노카르보닐, 디알킬아미노카르보닐아미노, 디알킬아미노술포닐, 디알킬아미노티오카르보닐, 디알킬아미노티오카르보닐아미노, 할로젠, 할로알케닐, 할로알케닐옥시, 할로알키닐, 할로알키닐옥시, 할로알콕시, 할로알콕시알콕시, 할로알콕시알킬, 할로알콕시아미노, 할로알콕시카르보닐, 할로알콕시카르보닐아미노, 할로알콕시할로알콕시, 할로알콕시할로알킬, 할로알킬, 할로알킬아미노, 할로알킬아미노알킬, 할로알킬카르보닐, 할로알킬카르보닐아미노, 할로알킬카르보닐옥시, 할로알킬술포닐, 할로알킬술포닐아미노, 할로알킬술포닐아미노카르보닐, 할로알킬티오, 할로시클로알케닐, 할로시클로알케닐옥시알킬, 할로시클로알콕시, 할로시클로알콕시알킬, 할로시클로알킬, 할로시클로알킬알킬, 할로시클로알킬카르보닐옥시, 할로디알킬아미노, 할로디알킬아미노알킬, 히드록실, 히드록시알킬, NHCHO, NHCN, 니트로, 페닐술포닐아미노, SH, SF₅, SO₂NHCN, 티옥시, 트리알킬실릴, 수소로부터 각각 독립적으로 선택된 2개 이하의 추가의 치환기를 지닐 수 있고;

- [0030] Q의 5-원 헤테로시클럼의 점소에 결합되며:
- [0031] 수소, 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 할로알케닐, 할로알키닐, 시클로알킬, 할로시클로알킬, 알킬시클로알킬, 시클로알킬알킬, 페닐, 벤질, 알킬술포닐, 페닐술포닐, -C(=O)H, 알콕시카르보닐, 벤질옥시카르보닐, 알킬카르보닐알킬 또는 알킬카르보닐이고,
- [0032] Y²는 산소 또는 황이고,
- [0033] Y³은 산소, 황 또는 -(NR^{Y3})-이고,
- [0034] R^{Y3}은 수소, 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 할로알케닐, 할로알키닐, 시클로알킬, 시클로알킬알킬, 할로시클로알킬, 벤질, 페닐, NR^{3R4}, 알킬카르보닐, 알킬옥시카르보닐, 알킬아미노카르보닐, 트리알킬실릴, 벤질옥시카르보닐, 알콕시, 할로알콕시, 페녹시 또는 벤질옥시이고,
- [0035] R¹은 치환된 C₁-C₅-알킬이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 -Q² 및/또는 Z^{1a}로부터 선택되거나, 또는
- [0036] Y³이 O, S, -NH-인 경우 R¹은 비치환 또는 치환된 C₆-C₁₀-알킬이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 -Q² 및/또는 Z^{1b}로부터 선택되거나, 또는
- [0037] Y³이 -(NR^{Y3})-이고 R^{Y3}이 H가 아닌 경우 R¹은 치환된 C₆-C₁₀-알킬이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 -Q² 및/또는 Z^{1b}로부터 선택되거나, 또는
- [0038] Y²가 S이고 Y³이 -(NR^{Y3})-이고 R^{Y3}이 H가 아닌 경우 R¹은 비치환된 C₆-C₁₀-알킬이거나, 또는
- [0039] Y³이 -(NR^{Y3})-이고 R^{Y3}이 H가 아니며 Y²가 S가 아닌 경우 R¹은 비치환된 C₈-C₁₁-알킬이거나, 또는
- [0040] R¹은 비치환 또는 치환된 C₂-C₆-알케닐 또는 C₂-C₆-알키닐이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 -Q² 및/또는 Z^{1c}로부터 선택되거나, 또는
- [0041] R¹은 치환된 C₃-C₇-시클로알킬이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 -Q², Z^{1d}, 옥소 및/또는 티옥소로부터 선택되거나, 또는
- [0042] R¹은 치환된 C₃-C₇-시클로알킬-C₁-C₃-알킬이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 -Q², Z^{1d}, 옥소 및/또는 티옥소로부터 선택되거나, 또는
- [0043] Y³이 NR^{Y3}인 경우 R¹은 비치환된 C₃-C₇-시클로알킬-C₁-C₃-알킬이거나, 또는
- [0044] R¹은 비치환 또는 치환된 C₅-C₁₀-시클로알케닐 또는 C₅-C₁₀-시클로알케닐-C₁-C₄-알킬이고, 여기서 치환기는 각각

독립적으로 $-Q^2$, Z^{1e} , 옥소 및/또는 티옥소로부터 선택되거나, 또는

- [0045] R^1 은 비치환 또는 치환된 페닐, 벤질 또는 나프탈레닐이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 $-L^2Q^2$ 및/또는 Z^{1f} 로부터 선택되거나, 또는
- [0046] R^1 은 포화 또는 부분 또는 완전 불포화, 비치환 또는 치환, 비- 또는 트리시클릭 8- 내지 11-원 카르보시클릭 또는 헤테로시클릭 고리계를 나타내고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 Z^{1g} , 옥소 및/또는 티옥소로부터 선택되거나, 또는
- [0047] R^1 은 비치환 또는 치환된 5- 또는 6-원 헤테로아릴 라디칼이고, 여기서 탄소 상의 치환기는 각각 독립적으로 $-L^2Q^2$ 및/또는 Z^{1h} 로부터 선택되며, 질소 상의 치환기는 각각 독립적으로 Z^{1i} 로부터 선택되거나, 또는
- [0048] R^1 은 벤조융합된 비치환 또는 치환된 5- 또는 6-원 헤테로아릴 라디칼이고, 여기서 탄소 상의 치환기는 각각 독립적으로 Z^{1j} 로부터 선택되며, 질소 상의 치환기는 각각 독립적으로 Z^{1k} 로부터 선택되거나, 또는
- [0049] R^1 은 비치환 또는 치환된 5-, 6- 또는 7-원, 비방향족 (포화 또는 부분 불포화) 헤테로시클릭 계이고, 여기서 탄소 상의 치환기는 각각 독립적으로 Z^{1l} , 옥소 및/또는 티옥소로부터 선택되며, 질소 상의 치환기는 각각 독립적으로 Z^{1m} 로부터 선택되거나, 또는
- [0050] Y^3 이 $-(NR^{Y3})-$ 인 경우 R^1 은 R^{Y3} 과, 이들이 결합되어 있는 질소 원자와 함께, N, O 및 S로부터 선택된 2개 이하의 추가의 헤테로원자를 함유할 수 있는 5 내지 15-원, 비치환 또는 치환, 포화 또는 부분 포화 또는 불포화 모노-, 비- 또는 트리시클릭 고리계를 형성하고, 여기서 어떠한 2개의 산소 원자도 이웃하지 않고, 탄소 상의 가능한 치환기는 각각 독립적으로 R^{10} , 옥소 및/또는 티옥소로부터 선택되며, 질소 상의 가능한 치환기는 각각 독립적으로 R^{11} 로부터 선택되거나, 또는
- [0051] Y^3 이 황이고/이거나 Y^2 가 황인 경우 R^1 은 비치환된 C_1-C_5 -알킬, 비치환된 C_3-C_7 -시클로알킬 또는 비치환된 C_3-C_7 -시클로알킬- C_1-C_6 -알킬이며,
- [0052] Q^2 는 각각 독립적으로 Z^{1f} 로부터 선택된 2개 이하의 치환기를 갖는 페닐 고리이거나, 또는
- [0053] Q^2 는 2개 이하의 치환기를 함유할 수 있는 5- 또는 6-원 헤테로아릴 라디칼이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로
- [0054] 탄소 상의 치환기: 수소, 할로젠, 시아노, 히드록실, 포르밀, SH, 니트로, $NR^{6,7}$, 알킬, 알케닐, 알케닐옥시, 알킬닐, 알킬닐옥시, 할로알킬, 할로알케닐, 할로알킬닐, 시클로알킬, 할로시클로알킬, 알킬시클로알킬, 시클로알킬알킬, 시클로알킬시클로알킬, 알킬시클로알킬알킬, 알콕시알킬, 알킬카르보닐, 알콕시카르보닐, 알킬아미노카르보닐, 디알킬아미노카르보닐, 히드록시알킬, 알콕시, 할로알콕시, 알킬카르보닐옥시, 알킬카르보닐티오, 알킬티오, 할로알킬티오, 알킬술폰닐, 할로알킬술폰닐, 알킬술폰닐, 할로알킬술폰닐, 트리알킬실릴 또는 페닐,
- [0055] 질소 상의 치환기: 수소, 알킬, 알케닐, 알킬닐, 할로알킬, 할로알케닐, 할로알킬닐, 시클로알킬, 할로시클로알킬, 알킬시클로알킬, 시클로알킬알킬, 페닐, 벤질, 알킬술폰닐, 페닐술폰닐, $C(=O)H$, 알콕시카르보닐, 벤질옥시카르보닐, 알킬아미노카르보닐, 알킬카르보닐알킬 또는 알킬카르보닐
- [0056]로부터 선택되고,
- [0057] R^6 및 R^9 는 동일 또는 상이하며 각각 독립적으로 수소, 알킬, 알케닐, 알킬닐, 할로알킬, 시클로알킬, 벤질, 페닐, 알킬술폰닐, 페닐술폰닐, 알콕시카르보닐, 할로알콕시카르보닐, 벤질옥시카르보닐, 알킬아미노카르보닐, 알킬카르보닐알킬, 알킬카르보닐, 할로알킬카르보닐 또는 트리알킬실릴이며,
- [0058] L^2 는 직접 결합, $-O-$, $-C(=O)-$, $-S(O)_m-$, $-CHR^8$ 또는 $-NR^9-$, $-(C=O)O-$, $-(C=O)NR^3-$, $-O(C=O)-$ 또는

$-NR^3(C=O)-$ 이고,

[0059] m은 0, 1 또는 2이고,

[0060] Z^{1a} 는 시아노, 할로젠, 니트로, 포르밀, $NR^{6,7}$, 할로알킬, 시클로알킬시클로알킬, 알케닐, 할로알케닐, 알킬닐, 할로알킬닐, 트리알킬실릴, 페닐, 히드록실, SH, 옥소, 알콕시, 알콕시알콕시, 할로알콕시, 알케닐옥시, 알킬닐 옥시, 시클로알킬옥시, 시클로알킬알킬옥시, 할로시클로알킬옥시, 할로시클로알킬알킬옥시, 알콕시카르보닐, 알킬카르보닐옥시, 알킬카르보닐, 알킬티오 또는 할로알킬티오, 페녹시이며,

[0061] Z^{1b} , Z^{1c} , Z^{1d} , Z^{1e} , Z^{1g} 는 동일 또는 상이하며 각각 독립적으로 시아노, 할로젠, 니트로, $NR^6,7$, 알킬, 할로알킬, 시클로알킬, 시클로알킬시클로알킬, 알케닐, 할로알케닐, 알킬닐, 할로알킬닐, 트리알킬실릴, 페닐, 히드록실, SH, 옥소, 알콕시, 알콕시알콕시, 할로알콕시, 알케닐옥시, 알킬닐옥시, 시클로알킬옥시, 시클로알킬알킬옥시, 할로시클로알킬옥시, 할로시클로알킬알킬옥시, 알콕시카르보닐, 알킬카르보닐옥시, 알킬카르보닐, 알킬티오 또는 할로알킬티오, 페녹시이며,

[0062] Z^{1f} 는 수소, 알케닐, 알케닐아미노, 알케닐옥시, 알케닐티오, 알킬닐, 알킬닐아미노, 알킬닐옥시, 알킬닐티오, 알콕시, 알콕시알케닐, 알콕시알킬닐, 알콕시알콕시, 알콕시알콕시알킬, 알콕시알콕시카르보닐, 알콕시알킬, 알콕시알킬아미노카르보닐, 알콕시알킬카르보닐, 알콕시아미노, 알콕시카르보닐, 알콕시카르보닐알콕시, 알콕시카르보닐알킬, 알콕시카르보닐아미노, 알콕시할로알콕시, 알콕시할로알킬, 알킬, 알킬아미노, 알킬아미노알킬, 알킬아미노카르보닐, 알킬아미노카르보닐알킬아미노, 알킬아미노카르보닐아미노, 알킬아미노카르보닐아미노, 알킬아미노술포닐, 알킬아미노티오카르보닐, 알킬아미노티오카르보닐아미노, 알킬카르보닐, 알킬카르보닐알콕시, 알킬카르보닐아미노, 알킬카르보닐옥시, 알킬카르보닐티오, 알킬시클로알킬, 알킬시클로알킬알킬, 알킬술포닐, 알킬술포닐알킬, 알킬술포닐, 알킬술포닐알킬, 알킬술포닐아미노, 알킬술포닐아미노카르보닐, 알킬티오, 알킬티오알킬, 알킬티오카르보닐, 알킬티오카르보닐옥시, 아미노, 아미노카르보닐, $C(=N-OR^7)R^8$, $C(=O)H$, $C(=O)NHCN$, $C(=O)OH$, 시아노, 시아노알콕시, 시아노알킬, 시클로알케닐, 시클로알케닐옥시알킬, 시클로알콕시, 시클로알콕시알킬, 시클로알콕시카르보닐, 시클로알킬, 시클로알킬알콕시, 시클로알킬알콕시카르보닐, 시클로알킬알킬, 시클로알킬알킬아미노, 시클로알킬알킬아미노알킬, 시클로알킬아미노, 시클로알킬아미노알킬, 시클로알킬아미노카르보닐, 시클로알킬카르보닐, 시클로알킬카르보닐옥시, 시클로알킬시클로알킬, 시클로알킬술포닐, 시클로알킬티오, 디알콕시알킬, 디알킬아미노, 디알킬아미노알킬, 디알킬아미노카르보닐, 디알킬아미노카르보닐아미노, 디알킬아미노술포닐, 디알킬아미노티오카르보닐, 디알킬아미노티오카르보닐아미노, 할로젠, 할로알케닐, 할로알케닐옥시, 할로알킬닐, 할로알킬닐옥시, 할로알콕시, 할로알콕시알콕시, 할로알콕시알킬, 할로알콕시아미노, 할로알콕시카르보닐, 할로알콕시카르보닐아미노, 할로알콕시할로알콕시, 할로알콕시할로알킬, 할로알킬, 할로알킬아미노, 할로알킬아미노알킬, 할로알킬카르보닐, 할로알킬카르보닐아미노, 할로알킬카르보닐옥시, 할로알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 할로알킬술포닐아미노, 할로알킬술포닐아미노카르보닐, 할로알킬티오, 할로시클로알케닐, 할로시클로알케닐옥시알킬, 할로시클로알콕시, 할로시클로알콕시알킬, 할로시클로알킬, 할로시클로알킬알킬, 할로시클로알킬카르보닐옥시, 할로디알킬아미노, 할로디알킬아미노알킬, 히드록실, 히드록시알킬, $NHCHO$, $NHCN$, 니트로, 페닐술포닐아미노, SH, SF_5 , SO_2NHCN , 티옥시, 트리알킬실릴이고,

[0063] Z^{1h} , Z^{1j} 및 Z^{1i} 는 동일 또는 상이하며 각각 독립적으로 수소, 옥소, 할로젠, 시아노, 히드록실, 니트로, $-CHO$, $-C(=O)OH$, $-C(=O)NH_2$, $-C(=O)NR^3,4$, $-NR^3,4$, 알킬, 알케닐, 알킬닐, 할로알킬, 할로알케닐, 할로알킬닐, 시클로알킬, 할로시클로알킬, 알킬시클로알킬, 시클로알킬알킬, 시클로알킬시클로알킬, 할로시클로알킬알킬, 알킬시클로알킬알킬, 시클로알케닐, 할로시클로알케닐, 알콕시알킬, 할로알콕시알킬, 시클로알콕시알킬, 알콕시알콕시알킬, 알킬티오알킬, 포르밀알킬, 알킬카르보닐알킬, 알킬술포닐알킬, 알킬술포닐알킬, 알킬아미노알킬, 디알킬아미노알킬, 할로알킬아미노알킬, 시클로알킬아미노알킬, 알킬카르보닐, 할로알킬카르보닐, 시클로알킬카르보닐, 알콕시카르보닐, 시클로알콕시카르보닐, 시클로알킬알콕시카르보닐, 시클로알킬아미노카르보닐, 히드록시알킬, 알콕시, 할로알콕시, 시클로알콕시, 할로시클로알콕시, 시클로알킬알콕시, 알케닐옥시, 할로알케닐옥시, 알킬닐옥시, 할로알킬닐옥시, 알콕시알콕시, 알킬카르보닐옥시, 할로알킬카르보닐옥시, 시클로알킬카르보닐옥시, 알킬카르보닐알콕시, 알킬티오, 할로알킬티오, 시클로알킬티오, 알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 시클로알킬술포닐, 트리알킬실릴, 알킬술포닐아미노, 할로알킬술포닐아미노이고,

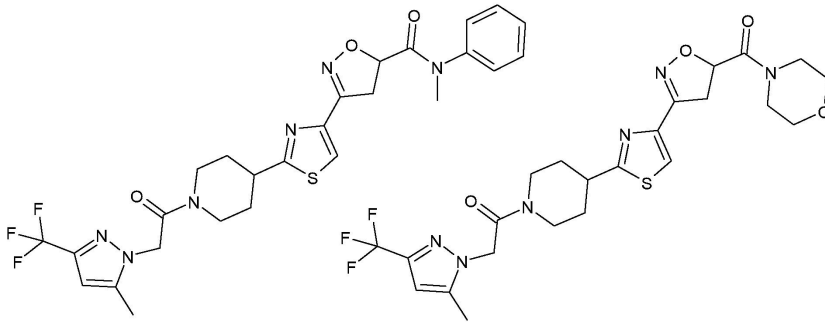
[0064] Z^{1i} , Z^{1k} 및 Z^{1m} 은 동일 또는 상이하며 각각 독립적으로 수소, 알킬, 알케닐, 알킬닐, 할로알킬, 할로알케닐, 할

로알킬닐, 시클로알킬, 할로시클로알킬, 알킬시클로알킬, 시클로알킬알킬, 페닐, 벤질, 알킬술폰닐, -C(=O)H, 알콕시카르보닐, 벤질옥시카르보닐 또는 알킬카르보닐이고,

[0065] R¹⁰은 수소, 시아노, 할로젠, NR⁶R⁷, 알킬, 할로알킬, 시클로알킬, 알케닐, 할로알케닐, 알키닐, 할로알키닐, 트리알킬실릴, 페닐, 히드록실, 옥소, 알콕시, 할로알콕시, 알케닐옥시, 알키닐옥시, 알킬티오 또는 할로알킬티오이고,

[0066] R¹¹은 수소, 알킬, 할로알킬, 시클로알킬, 알케닐, 할로알케닐, 알키닐, 할로알키닐, 트리알킬실릴, 벤질, 페닐, 알킬술폰닐, 페닐술폰닐, C(=O)H, 알콕시카르보닐, 할로알콕시카르보닐, 벤질옥시카르보닐, 알킬아미노카르보닐, 알킬카르보닐알킬, 알킬카르보닐 또는 할로알킬카르보닐이다.

[0067] 화학식 I의 화합물에서 하기 화합물은 제외한다.



[0068]

[0069] 화학식 I의 화합물로부터 제외된 화합물은 W02008013925 (p.261 및 p.264) 및 W02008013622 (p.259 및 p.262)에 개시되어 있다.

[0070] 추가로, 본 발명은 살진균제로서 화학식 I의 화합물의 용도를 제공한다.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

[0071] 본 발명의 화학식 I의 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체 및 그의 염, 금속 착물 및 N-옥시드는 식물병원성 유해 진균을 방제하는데 매우 적절하다. 진술한 본 발명의 화합물은 특히 유효한 살진균성 활성을 나타내며 농작물 보호, 가정용 및 위생 부문 및 물질 보호에 사용될 수 있다.

[0072] 화학식 I의 화합물은 상이한 가능한 이성질체 형태, 특히 입체이성질체, 예컨대 E 및 Z, 트레오 및 에리트로 및 또한 광학 이성질체, 예컨대 R 및 S 이성질체 또는 회전장애 이성질체 및 적절한 경우 또한 호변이성질체의 혼합물로서 또는 순수한 형태로 존재할 수 있다. E 및 Z 이성질체 및 트레오 및 에리트로 이성질체 및 또한 광학 이성질체 모두, 이들 이성질체의 임의의 바람직한 혼합물 및 가능한 호변이성질체 형태가 청구된다.

[0073] 본 발명의 화학식 I의 화합물의 라디칼 정의는 하기의 바람직한, 보다 바람직한 및 가장 바람직한 정의를 갖는다:

[0074] A는 바람직하게는 페닐이고, 이는 L¹에 결합되며 그 외에 2개 이하의 치환기를 함유할 수 있고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 할로젠, 시아노, 히드록실, -NR³R⁴, -C(=O)NR³R⁴, 니트로, C₁-C₆-알킬, C₂-C₆-알케닐, C₂-C₆-알키닐, C₃-C₈-시클로알킬, C₁-C₆-할로알킬, C₂-C₆-할로알케닐, C₂-C₆-할로알키닐, C₃-C₆-할로시클로알킬, C₁-C₄-알콕시, C₁-C₄-할로알콕시, C₁-C₄-알케닐옥시, C₁-C₄-알키닐옥시, C₁-C₄-알킬티오, C₁-C₄-알킬술폰닐, C₁-C₄-할로알킬티오, C₁-C₄-할로알킬술폰닐, C₁-C₄-알콕시-C₁-C₆-알킬, 히드록실-C₁-C₄-알킬, C₁-C₆-알킬카르보닐, C₁-C₆-알콕시카르보닐, C₁-C₆-알킬카르보닐옥시 또는 -C(=O)H로부터 선택되거나, 또는

[0075] A는 바람직하게는 푸란-2-일, 푸란-3-일, 티오펜-2-일, 티오펜-3-일, 이속사졸-3-일, 이속사졸-4-일, 이속사졸-5-일, 피롤-1-일, 피롤-2-일, 피롤-3-일, 옥사졸-2-일, 옥사졸-4-일, 옥사졸-5-일, 티아졸-2-일, 티아졸-4-일, 티아졸-5-일, 이소티아졸-3-일, 이소티아졸-4-일, 이소티아졸-5-일, 피라졸-1-일, 피라졸-3-일, 피라졸-4-일, 이미다졸-1-일, 이미다졸-2-일, 이미다졸-4-일, 1,2,3-트리아졸-1-일, 1,2,4-트리아졸-1-일, 피리딘-2-일, 피리딘-3-일, 피리딘-4-일, 피리다진-3-일, 피리다진-4-일, 피라진-2-일, 피라진-3-일, 피리미딘-2-일, 피리미딘-4-

일 또는 피리미딘-5-일의 군으로부터 선택된 헤테로방향족 라디칼이고, 이는 L¹에 결합되며 그 외에 2개 이하의 치환기를 함유할 수 있고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로

- [0076] 탄소 상의 치환기:
- [0077] 할로젠, 시아노, 히드록실, 니트로, -NR³R⁴, C₁-C₆-알킬, C₂-C₆-알케닐, C₂-C₆-알키닐, C₃-C₆-시클로알킬, C₁-C₆-할로알킬, C₂-C₆-할로알케닐, C₂-C₆-할로알키닐, C₃-C₆-할로시클로알킬, C₁-C₄-알콕시, C₁-C₄-할로알콕시, C₁-C₄-알킬티오, C₁-C₄-알킬술포닐, C₁-C₄-할로알킬티오, C₁-C₄-할로알킬술포닐, C₁-C₄-알콕시-C₁-C₄-알킬, 히드록시-C₁-C₄-알킬, C₁-C₆-알킬카르보닐, C₁-C₆-알콕시카르보닐, C₁-C₆-알킬카르보닐옥시 또는 페닐,
- [0078] 질소 상의 치환기:
- [0079] C₁-C₆-알킬, C₂-C₆-알케닐, C₂-C₆-알키닐, C₁-C₆-할로알킬, C₂-C₆-할로알케닐, C₂-C₆-할로알키닐, C₃-C₁₀-시클로알킬-C₁-C₆-알킬, C₁-C₆-할로알킬카르보닐, 페닐, 벤질, C₁-C₄-알킬술포닐, C₁-C₄-할로알킬술포닐, 페닐술포닐, -C(=O)H 또는 C₁-C₆-알킬카르보닐
- [0080] 로부터 선택되거나, 또는
- [0081] A는 보다 바람직하게는 페닐이고, 이는 L¹에 결합되며 그 외에 2개 이하의 추가의 치환기를 함유할 수 있고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 플루오린, 브로민, 아이오딘, 염소, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, n-프로필, 1-메틸에틸, 1,1-디메틸에틸, 클로로플루오로메틸, 디클로로메틸, 디클로로플루오로메틸, 디플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로메틸, 시클로프로필, 에톡시, 1-메틸에톡시, n-프로폭시, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 1-메틸에틸티오, 메틸티오, 에틸티오, n-프로필티오, 디플루오로메틸티오 또는 트리플루오로메틸티오로부터 선택되거나, 또는
- [0082] A는 보다 바람직하게는 푸란-2-일, 푸란-3-일, 티오펜-2-일, 티오펜-3-일, 이속사졸-3-일, 이속사졸-4-일, 이속사졸-5-일, 피롤-1-일, 피롤-2-일, 피롤-3-일, 옥사졸-2-일, 옥사졸-4-일, 옥사졸-5-일, 티아졸-2-일, 티아졸-4-일, 티아졸-5-일, 이소티아졸-3-일, 이소티아졸-4-일, 이소티아졸-5-일, 피라졸-1-일, 피라졸-3-일, 피라졸-4-일, 이미다졸-1-일, 이미다졸-2-일, 이미다졸-4-일, 1,2,3-트리아졸-1-일, 1,2,4-트리아졸-1-일, 피리딘-2-일, 피리딘-3-일, 피리딘-4-일, 피리다진-3-일, 피리다진-4-일, 피리미딘-2-일, 피리미딘-4-일 또는 피리미딘-5-일의 군으로부터 선택된 헤테로방향족 라디칼이고, 이는 L¹에 결합되며 그 외에 2개 이하의 추가의 치환기를 함유할 수 있고, 여기서 치환기는 동일 또는 상이하며 각각 독립적으로
- [0083] 탄소 상의 치환기:
- [0084] 플루오린, 염소, 브로민, 아이오딘, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, n-프로필, 1-메틸에틸, 1,1-디메틸에틸, 클로로플루오로메틸, 디클로로메틸, 디클로로플루오로메틸, 디플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로메틸, 시클로프로필, 에톡시, 1-메틸에톡시, n-프로폭시, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 1-메틸에틸티오, 메틸티오, 에틸티오, n-프로필티오, 디플루오로메틸티오, 트리플루오로메틸티오 또는 페닐,
- [0085] 질소 상의 치환기:
- [0086] 각각 독립적으로 메틸, 에틸, n-프로필, 1-메틸에틸, 메틸술포닐, 트리플루오로메틸술포닐, 메틸카르보닐, 트리플루오로메틸카르보닐, 클로로메틸카르보닐, 2,2-트리플루오로에틸, 2,2-디플루오로에틸, 2,2-디클로로-2-플루오로에틸, 2-클로로-2-디플루오로에틸 또는 2-클로로-2-플루오로에틸
- [0087] 로부터 선택되거나; 또는
- [0088] A는 가장 바람직하게는 피라졸-1-일이고, 이는 L¹에 결합되며 그 외에 2개 이하의 치환기를 함유할 수 있고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 메틸, 에틸, 염소, 브로민, 플루오린, 디플루오로메틸 또는 트리플루오로메틸로부터 선택되거나; 또는
- [0089] A는 가장 바람직하게는 페닐이고, 이는 L¹에 결합되며 그 외에 2개 이하의 치환기를 함유할 수 있고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 메틸, 에틸, 아이오딘, 염소, 브로민, 플루오린, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메틸 또는 트리플루오로메틸로부터 선택된다.

[0090] R^3 , R^4 및 R^7 은 바람직하게는 동일 또는 상이하며 각각 독립적으로 수소, C_1 - C_6 -알킬, C_2 - C_6 -알케닐, C_2 - C_6 -알키닐, C_1 - C_6 -할로알킬, C_3 - C_8 -시클로알킬, 벤질 또는 페닐, 보다 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 1-메틸에틸, n-부틸 또는 1,1-디메틸에틸이고,

[0091] L^1 은 바람직하게는 $C(R^{L11})_2$ (보다 바람직하게는 CHR^{L11}) 또는 NR^{L12} , 가장 바람직하게는 CH_2 이고,

[0092] R^{L11} 은 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸 또는 시클로프로필이거나, 또는

[0093] 2개의 R^{L11} 라디칼은 이들이 결합되어 있는 탄소 원자와 함께 시클로프로필 고리를 형성하거나, 또는

[0094] 2개의 R^{L11} 라디칼은 $=CHN(R^3)_2$ 이고,

[0095] R^{L11} 은 보다 바람직하게는 수소 또는 메틸이며,

[0096] R^{L12} 은 바람직하게는 수소, C_1 - C_4 -알킬, C_1 - C_4 -할로알킬, C_3 - C_8 -시클로알킬, C_1 - C_4 -알킬술포닐, C_1 - C_4 -알콕시카르보닐, 보다 바람직하게는 수소 또는 메틸, 가장 바람직하게는 수소이고,

[0097] Y^1 은 바람직하게는 산소 또는 황, 보다 바람직하게는 산소이고,

[0098] X는 탄소 또는 질소, 바람직하게는 탄소이며,

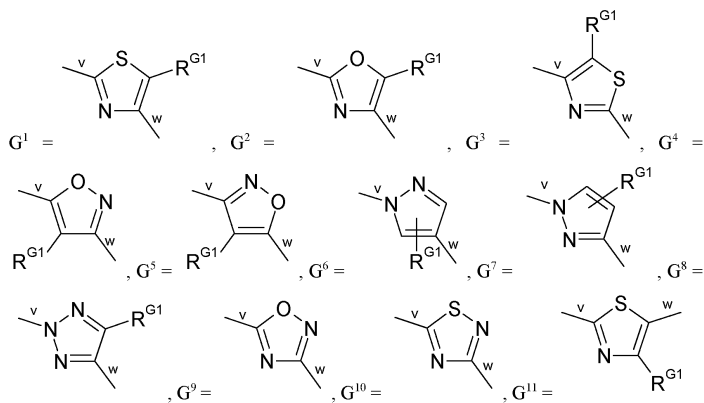
[0099] R^{X2} 은 바람직하게는 수소, C_1 - C_4 -알킬, C_1 - C_4 -알케닐, C_1 - C_4 -할로알킬, C_1 - C_4 -알콕시, 할로젠, 시아노 또는 히드록실, 보다 바람직하게는 수소, 플루오린, 염소, 브로민 또는 히드록실이고, 가장 바람직하게는 수소 또는 플루오린이며,

[0100] R^8 은 바람직하게는 수소 또는 C_1 - C_4 -알킬, 보다 바람직하게는 수소 및 메틸이고,

[0101] R^2 은 바람직하게는 옥소, C_1 - C_4 -알킬, C_1 - C_4 -알케닐, C_1 - C_4 -할로알킬, C_1 - C_4 -알콕시, 할로젠, 시아노 또는 히드록실, 보다 바람직하게는 플루오린, 염소, 브로민 또는 히드록실, 가장 바람직하게는 플루오린이고,

[0102] p는 바람직하게는 0 내지 1, 보다 바람직하게는 0이며,

[0103] G는 바람직하게는



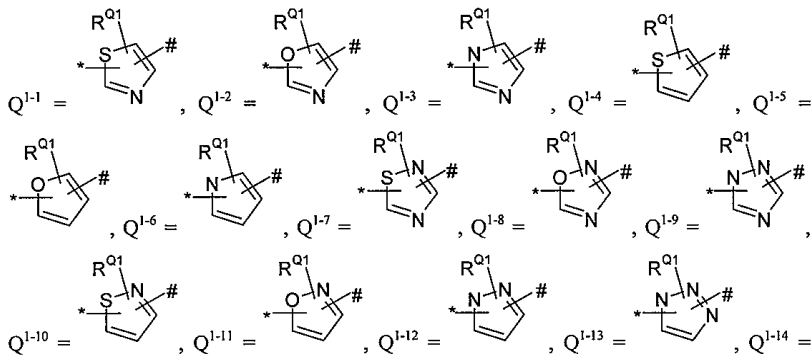
[0104] 이고,

[0105] 여기서 "v"로 나타낸 결합은 X에 직접 결합되며 "w"로 나타낸 결합은 Q^1 에 직접 결합되며,

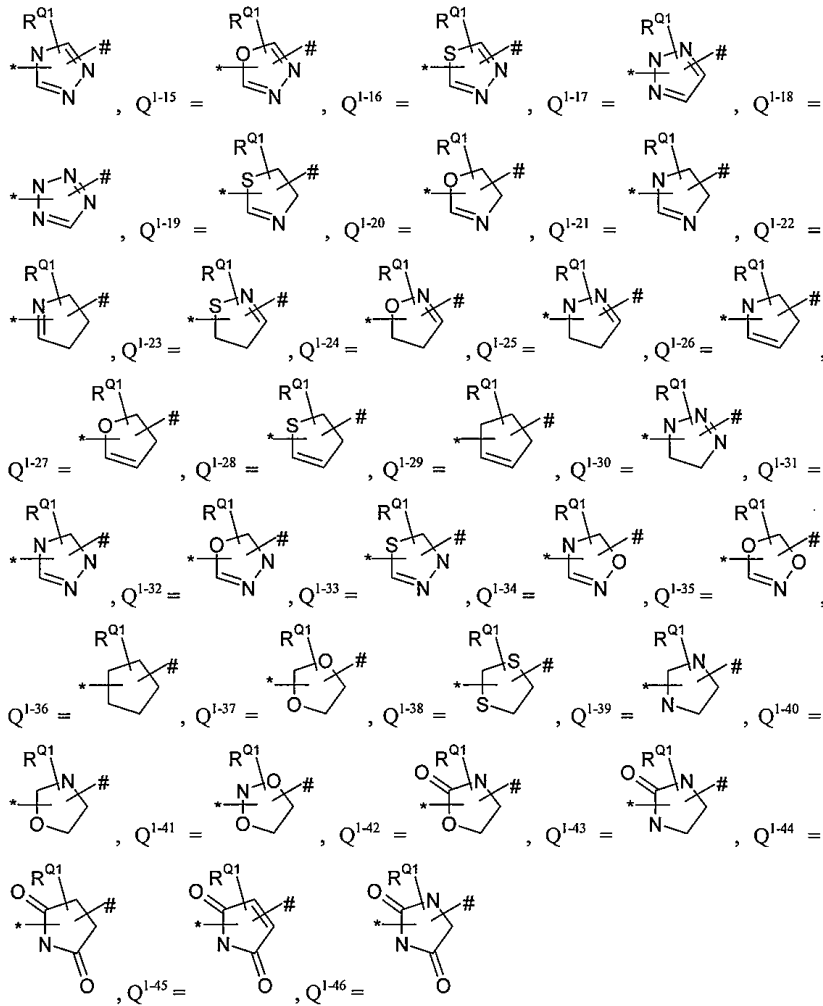
[0106] G는 보다 바람직하게는 G^1 , G^2 또는 G^3 , 가장 바람직하게는 G^1 이고,

[0107] R^{G1} 은 바람직하게는 수소 또는 할로젠, 보다 바람직하게는 수소이고,

[0108] Q¹은 바람직하게는



[0109]



[0110]

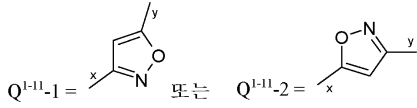
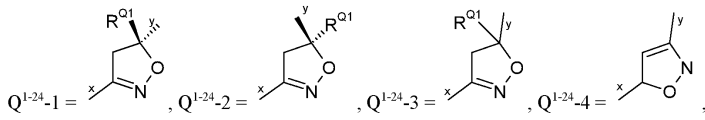
이고,

[0111]

여기서 "*"로 나타낸 결합은 G에 직접 결합되며 동시에 "#"로 나타낸 결합은 -C(=Y²)-Y³-R¹에 직접 결합되거나, 또는 "*"로 나타낸 결합은 -C(=Y²)-Y³-R¹에 직접 결합되고 동시에 "#"로 나타낸 결합은 G에 직접 결합되며,

[0112]

Q¹은 보다 바람직하게는



이고,

- [0113]
- [0114] 여기서 "x"로 나타낸 결합은 G에 직접 결합되며 "y"로 나타낸 결합은 -C(=Y²)-Y³-R¹에 직접 결합되며,
- [0115] Q¹은 가장 바람직하게는 Q¹⁻²⁴-3이다.

[0116] R^{O1}은 바람직하게는 동일 또는 상이하며 독립적으로

[0117] Q의 5-원 헤테로시클릴의 탄소에 결합되며:

- [0118] 수소, 시아노, -NR³R⁴, C₁-C₆-알킬, C₂-C₆-알케닐, C₂-C₆-알키닐, C₁-C₆-할로알킬, C₂-C₆-할로알케닐, C₂-C₆-할로알키닐, C₃-C₈-시클로알킬, C₃-C₈-할로시클로알킬, C₁-C₄-알킬-C₃-C₈-시클로알킬, C₃-C₈-시클로알킬-C₁-C₄-알킬, C₁-C₄-알콕시-C₁-C₄-알킬, C₃-C₈-시클로알콕시-C₁-C₄-알킬, C₁-C₄-알콕시-C₁-C₄-알콕시-C₁-C₄-알킬, C₁-C₄-알킬티오-C₁-C₄-알킬, C₁-C₆-알콕시, C₁-C₆-할로알콕시, C₃-C₈-시클로알콕시, C₃-C₈-할로시클로알콕시, C₃-C₈-시클로알킬-C₁-C₄-알콕시, C₂-C₆-알케닐옥시, C₂-C₆-할로알케닐옥시, C₂-C₆-알키닐옥시, C₂-C₆-할로알키닐옥시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₄-알콕시, C₁-C₆-알킬카르보닐옥시, C₁-C₆-할로알킬카르보닐옥시, C₃-C₈-시클로알킬카르보닐옥시, C₁-C₆-알킬카르보닐-C₁-C₆-알콕시, C₁-C₆-알킬티오, C₁-C₆-할로알킬티오, C₃-C₈-시클로알킬티오, 페닐 또는 5- 또는 6-원 헤테로아릴 라디칼이며, 여기서 페닐 또는 5- 또는 6-원 헤테로아릴 라디칼은 C₂-C₆-알케닐, C₂-C₆-알케닐아미노, C₂-C₆-알케닐옥시, C₂-C₆-알케닐티오, C₂-C₆-알키닐, C₂-C₆-알키닐아미노, C₂-C₆-알키닐옥시, C₂-C₆-알키닐티오, C₁-C₆-알콕시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₄-알케닐, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₄-알키닐, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₄-알콕시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₄-알콕시-C₁-C₄-알킬, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₄-알콕시카르보닐, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₄-알킬, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₄-알킬아미노카르보닐, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₄-알킬카르보닐, C₁-C₆-알콕시아미노, C₁-C₆-알콕시카르보닐, C₁-C₆-알콕시카르보닐-C₁-C₄-알콕시, C₁-C₆-알콕시카르보닐-C₁-C₄-알킬, C₁-C₆-알콕시카르보닐아미노, C₁-C₆-알콕시할로-C₁-C₄-알콕시, C₁-C₆-알콕시할로-C₁-C₄-알킬, C₁-C₆-알킬, C₁-C₆-알킬아미노, C₁-C₆-알킬아미노-C₁-C₄-알킬, C₁-C₆-알킬아미노카르보닐, C₁-C₆-알킬아미노카르보닐-C₁-C₄-알킬아미노, C₁-C₆-알킬아미노카르보닐아미노, C₁-C₆-알킬아미노술포닐, C₁-C₆-알킬아미노티오카르보닐, C₁-C₆-알킬아미노티오카르보닐아미노, C₁-C₆-알킬카르보닐, C₁-C₆-알킬카르보닐-C₁-C₄-알콕시, C₁-C₆-알킬카르보닐아미노, C₁-C₆-알킬카르보닐옥시, C₁-C₆-알킬카르보닐티오, C₁-C₆-알킬-C₃-C₆-시클로알킬, C₁-C₆-알킬-C₃-C₆-시클로알킬-C₁-C₄-알킬, C₁-C₆-알킬술포닐, C₁-C₆-알킬술포닐-C₁-C₄-알킬, C₁-C₆-알킬술포닐아미노, C₁-C₆-알킬술포닐아미노카르보닐, C₁-C₆-알킬티오, C₁-C₆-알킬티오-C₁-C₄-알킬, C₁-C₆-알킬티오카르보닐, C₁-C₆-알킬티오카르보닐옥시, 아미노, 아미노카르보닐, C(=N-OR⁷)R⁸, C(=O)H, C(=O)NHCN, C(=O)OH, 시아노, C₁-C₆-시아노알콕시, C₁-C₆-시아노알킬, C₄-C₈-시클로알케닐, C₄-C₈-시클로알케닐옥시-C₁-C₄-알킬, C₃-C₈-시클로알콕시, C₃-C₆-시클로알콕시-C₁-C₄-알킬, C₃-C₈-시클로알콕시카르보닐, C₃-C₈-시클로알킬, C₄-C₈-시클로알킬-C₁-C₄-알콕시, C₄-C₈-시클로알킬-C₁-C₆-알콕시카르보닐, C₄-C₈-시클로알킬-C₁-C₆-알킬, C₄-C₈-시클로알킬-C₁-C₄-알킬아미노, C₄-C₈-시클로알킬-C₁-C₄-알킬아미노-C₁-C₄-알킬, C₃-C₈-시클로알킬아미노, C₃-C₈-시클로알킬아미노-C₁-C₄-알킬, C₃-C₈-시클로알킬아미노카르보닐, C₃-C₈-시클로알킬카르보닐, C₃-C₈-시클로알킬카르보닐옥시, C₃-C₆-시클로알킬-C₃-C₆-시클로알킬, C₃-C₈-시클로알킬술포닐, C₃-C₈-시클로알킬티오, C₂-C₈-디알콕시-C₁-C₄-알킬, C₂-C₈-디알킬아미노, C₃-C₈-디알킬아미노-C₁-C₄-알킬, C₂-C₈-디알킬아미노카르보닐, C₂-C₈-디알킬아미노카르보닐아미노, C₂-C₈-디알킬아미노술포닐, C₂-C₈-디알킬아미노

티오카르보닐, C₂-C₈-디알킬아미노티오카르보닐아미노, 할로젠, C₂-C₈-할로알케닐, C₂-C₈-할로알케닐옥시, C₂-C₈-할로알키닐, C₂-C₈-할로알키닐옥시, C₁-C₆-할로알콕시, C₂-C₈-할로알콕시-C₁-C₄-알콕시, C₂-C₈-할로알콕시-C₁-C₄-알킬, C₁-C₈-할로알콕시아미노, C₁-C₆-할로알콕시카르보닐, C₁-C₆-할로알콕시카르보닐아미노, C₂-C₈-할로알콕시-C₁-C₄-할로알콕시, C₂-C₈-할로알콕시-C₁-C₄-할로알킬, C₁-C₆-할로알킬, C₁-C₆-할로알킬아미노, C₂-C₈-할로알킬아미노-C₁-C₄-알킬, C₁-C₆-할로알킬카르보닐, C₁-C₆-할로알킬카르보닐아미노, C₁-C₆-할로알킬카르보닐옥시, C₁-C₆-할로알킬술포닐, C₁-C₆-할로알킬술포닐아미노, C₁-C₆-할로알킬술포닐아미노카르보닐, C₁-C₆-할로알킬티오, C₃-C₈-할로시클로알케닐, C₄-C₈-할로시클로알케닐옥시-C₁-C₄-알킬, C₃-C₈-할로시클로알콕시, C₄-C₈-할로시클로알콕시-C₁-C₄-알킬, C₃-C₈-할로시클로알킬, C₃-C₆-할로시클로알킬-C₁-C₄-알킬, C₃-C₈-할로시클로알킬카르보닐옥시, C₂-C₈-할로디알킬아미노, C₃-C₈-할로디알킬아미노-C₁-C₄-알킬, 히드록실, C₁-C₆-히드록시알킬, NHCHO, NHCN, 니트로, 페닐술포닐아미노, SF₅, SO₂NHCN, 티옥시, C₃-C₁₂-트리알킬실릴, 수소로부터 각각 독립적으로 선택된 2개 이하의 치환기를 가지며,

[0119] Q의 5-원 헤테로시클릴의 질소에 결합되며:

[0120] 수소, -C(=O)H, C₁-C₃-알킬, C₁-C₆-알킬카르보닐, C₁-C₆-알콕시카르보닐 또는 벤질이고,

[0121] R⁵는 보다 바람직하게는 수소, 플루오린, 시아노, 메틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸 또는 메톡시메틸이거나, 또는

[0122] R⁰¹은 보다 바람직하게는 Q¹의 탄소 원자에 결합되며 수소, 플루오린, 염소, 니트로, 트리플루오로메틸, C(=O)H, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 프로프-2-인-1-일옥시, 부트-2-인-1-일옥시, 펜트-2-인-1-일옥시, 부트-3-인-1-일옥시, 부트-3-엔-1-일옥시, 3-클로로프로프-2-인-1-일옥시, 시아노메톡시, 알릴옥시로부터 각각 독립적으로 선택된 2개 이하의 치환기를 갖는 페닐 고리이거나, 또는

[0123] R⁰¹은 가장 바람직하게는 수소이거나, 또는

[0124] R⁰¹은 가장 바람직하게는 Q¹의 탄소 원자에 결합된 페닐 고리이고,

[0125] Y²는 바람직하게는 산소 또는 황, 보다 바람직하게는 산소이고,

[0126] Y³는 바람직하게는 산소, 황 또는 -(NR^{Y3})-, 보다 바람직하게는 산소 및 -(NR^{Y3})-, 바람직하게는 산소 단독이고,

[0127] R^{Y3}은 바람직하게는 수소, C₁-C₄-알킬, C₁-C₄-할로알킬, C₃-C₆-시클로알킬, C₁-C₄-알콕시, 보다 바람직하게는 수소, 메틸 또는 시클로프로필, 바람직하게는 수소 또는 시클로프로필이고,

[0128] R¹은 바람직하게는 치환된 메틸, 에틸, 프로필, 1-메틸에틸, 부틸, 1-메틸프로필, 2-메틸프로필, 1,1-디메틸에틸, 펜틸, 1-메틸부틸, 2-메틸부틸, 3-메틸부틸, 2,2-디메틸프로필, 1-에틸프로필, 1,1-디메틸프로필 또는 1,2-디메틸프로필이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 -Q² 및/또는 Z^{1a}로부터 선택되거나; 또는

[0129] Y²가 S이고 및/또는 Y³이 S인 경우 R¹은 바람직하게는 메틸, 에틸, 프로필, 1-메틸에틸, 부틸, 1-메틸프로필, 2-메틸프로필, 1,1-디메틸에틸, 펜틸, 1-메틸부틸, 2-메틸부틸, 3-메틸부틸, 2,2-디메틸프로필, 1-에틸프로필, 헥실, 1,1-디메틸프로필, 1,2-디메틸프로필, 1-메틸펜틸, 2-메틸펜틸, 3-메틸펜틸, 4-메틸펜틸, 1,1-디메틸부틸, 1,2-디메틸부틸, 1,3-디메틸부틸, 2,2-디메틸부틸, 2,3-디메틸부틸, 3,3-디메틸부틸, 1-에틸부틸, 2-에틸부틸, 1,1,2-트리메틸프로필, 1,2,2-트리메틸프로필, 1-에틸-1-메틸프로필 및 1-에틸-2-메틸프로필, 시클로프로필, 시클로펜틸, 시클로헥실, 시클로프로필메틸, 시클로프로필에틸, 시클로펜틸메틸, 시클로펜틸에틸, 시클로헥실메틸 또는 시클로헥실에틸, 바람직하게는 메틸, 에틸, 프로필, 1-메틸에틸, 시클로프로필, 시클로펜틸, 시클로헥실, 시클로프로필메틸, 시클로펜틸메틸 또는 시클로헥실메틸이거나, 또는

[0130] R¹은 바람직하게는 치환 또는 비치환된 알릴, 프로파르길, 부트-2-인-1-일, 부트-3-인-1-일이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 -Q² 및/또는 Z^{1c}로부터 선택되거나, 또는

- [0131] R^1 은 바람직하게는 치환된 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸 또는 시클로헥실, 바람직하게는 치환된 시클로프로필 또는 시클로헥실이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 $-Q^2$, Z^{1d} , 옥소 및/또는 티옥소로부터 선택되거나, 또는
- [0132] R^1 은 바람직하게는 치환된 시클로프로필메틸, 시클로부틸메틸, 시클로펜틸메틸, 시클로헥실메틸, 시클로프로필에틸, 시클로부틸에틸, 시클로펜틸에틸 또는 시클로헥실에틸, 바람직하게는 치환된 시클로프로필메틸, 시클로펜틸메틸, 시클로헥실메틸이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 $-Q^2$, Z^{1d} , 옥소 및/또는 티옥소로부터 선택되거나, 또는
- [0133] Y^3 이 $-(NR^{y3})$ -인 경우 R^1 은 바람직하게는 시클로프로필메틸, 시클로부틸메틸, 시클로펜틸메틸, 시클로헥실메틸, 시클로프로필에틸, 시클로부틸에틸, 시클로펜틸에틸 또는 시클로헥실에틸, 바람직하게는 시클로프로필메틸, 시클로펜틸메틸 또는 시클로헥실메틸이거나, 또는
- [0134] R^1 은 바람직하게는 비치환 또는 치환된 시클로펜테닐 또는 시클로헥세닐, 바람직하게는 비치환 시클로펜테닐 또는 시클로헥세닐이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 $-Q^2$, Z^{1e} , 옥소 및/또는 티옥소로부터 선택되거나, 또는
- [0135] R^1 은 바람직하게는 비치환 또는 치환된 시클로펜테닐메틸, 시클로헥세닐메틸, 시클로펜테닐에틸 또는 시클로헥세닐에틸, 바람직하게는 비치환 또는 치환된 시클로펜테닐메틸 또는 시클로헥세닐메틸이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 $-Q^2$, Z^{1e} , 옥소 및/또는 티옥소로부터 선택되거나, 또는
- [0136] R^1 은 바람직하게는 비치환 또는 치환된 페닐 또는 벤질, 바람직하게는 치환된 페닐 또는 벤질이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 $-L^2Q^2$ 및/또는 Z^{1f} 로부터 선택되거나, 또는
- [0137] R^1 은 바람직하게는 비치환 또는 치환된 푸란-2-일, 푸란-3-일, 티오펜-2-일, 티오펜-3-일, 이속사졸-3-일, 이속사졸-4-일, 이속사졸-5-일, 피롤-1-일, 피롤-2-일, 피롤-3-일, 옥사졸-2-일, 옥사졸-4-일, 옥사졸-5-일, 티아졸-2-일, 티아졸-4-일, 티아졸-5-일, 이소티아졸-3-일, 이소티아졸-4-일, 이소티아졸-5-일, 피라졸-1-일, 피라졸-3-일, 피라졸-4-일, 이미다졸-1-일, 이미다졸-2-일, 이미다졸-4-일, 1,2,4-옥사디아졸-3-일, 1,2,4-옥사디아졸-5-일, 1,3,4-옥사디아졸-2-일, 1,2,4-티아디아졸-3-일, 1,2,4-티아디아졸-5-일, 1,3,4-티아디아졸-2-일, 1,2,3-트리아졸-1-일, 1,2,3-트리아졸-2-일, 1,2,3-트리아졸-4-일, 1,2,4-트리아졸-1-일, 1,2,4-트리아졸-3-일, 1,2,4-트리아졸-4-일, 피리딘-2-일, 피리딘-3-일, 피리딘-4-일, 피리다진-3-일, 피리다진-4-일, 피리미딘-2-일, 피리미딘-4-일, 피리미딘-5-일 또는 피라진-2-일이고, 여기서 탄소 상의 치환기는 각각 독립적으로 $-L^2Q^2$ 및/또는 Z^{1h} 로부터 선택되며, 질소 상의 치환기는 각각 독립적으로 Z^{1i} 로부터 선택되거나, 또는
- [0138] R^1 은 바람직하게는 비치환 또는 치환된 인돌-1-일, 인돌-2-일, 인돌-3-일, 인돌-4-일, 인돌-5-일, 인돌-6-일, 인돌-7-일, 벤즈이미다졸-1-일, 벤즈이미다졸-2-일, 벤즈이미다졸-4-일, 벤즈이미다졸-5-일, 인다졸-1-일, 인다졸-3-일, 인다졸-4-일, 인다졸-5-일, 인다졸-6-일, 인다졸-7-일, 인다졸-2-일, 1-벤조푸란-2-일, 1-벤조푸란-3-일, 1-벤조푸란-4-일, 1-벤조푸란-5-일, 1-벤조푸란-6-일, 1-벤조푸란-7-일, 1-벤조티오펜-2-일, 1-벤조티오펜-3-일, 1-벤조티오펜-4-일, 1-벤조티오펜-5-일, 1-벤조티오펜-6-일, 1-벤조티오펜-7-일, 1,3-벤조티아졸-2-일, 1,3-벤조티아졸-4-일, 1,3-벤조티아졸-5-일, 1,3-벤조티아졸-6-일, 1,3-벤조티아졸-7-일, 1,3-벤즈옥사졸-2-일, 1,3-벤즈옥사졸-4-일, 1,3-벤즈옥사졸-5-일, 1,3-벤즈옥사졸-6-일, 1,3-벤즈옥사졸-7-일, 퀴놀린-2-일, 퀴놀린-3-일, 퀴놀린-4-일, 퀴놀린-5-일, 퀴놀린-6-일, 퀴놀린-7-일, 퀴놀린-8-일, 이소퀴놀린-1-일, 이소퀴놀린-3-일, 이소퀴놀린-4-일, 이소퀴놀린-5-일, 이소퀴놀린-6-일, 이소퀴놀린-7-일 또는 이소퀴놀린-8-일이고, 여기서 탄소 상의 치환기는 각각 독립적으로 Z^{1j} 로부터 선택되며, 질소 상의 치환기는 각각 독립적으로 Z^{1k} 로부터 선택되거나, 또는
- [0139] R^1 은 바람직하게는 비치환 또는 치환된 1,2,3,4-테트라히드로퀴놀린-1-일, 1,2,3,4-테트라히드로이소퀴놀린-2-일, 1,2,3,4-테트라히드로퀴놀살린-1-일, 인돌린-1-일, 이소인돌린-2-일, 데카히드로퀴놀린-1-일 또는 데카히드로이소퀴놀린-2-일이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 Z^{1g} , 옥소 및/또는 티옥소로부터 선택되거나, 또는

- [0140] R^1 은 바람직하게는 비치환 또는 치환된 피페리딘-1-일, 피페리딘-2-일, 피페리딘-3-일, 피페리딘-4-일, 피페라진-1-일, 피페라진-2-일, 피페라진-3-일, 모르폴린-1-일, 모르폴린-2-일, 모르폴린-3-일, 테트라히드로피란-2-일, 테트라히드로피란-3-일, 테트라히드로피란-4-일이고, 여기서 탄소 상의 치환기는 각각 독립적으로 Z^{11} , 옥소 및/또는 티옥소로부터 선택되며, 질소 상의 치환기는 각각 독립적으로 Z^{1m} 로부터 선택되거나, 또는
- [0141] Y^3 이 $-(NR^{13})$ -인 경우 R^1 은 R^{13} 과, 이들이 결합되어 있는 질소 원자와 함께, 바람직하게는 비치환 또는 치환, 포화 또는 부분 포화 또는 불포화 피페리딘-1-일, 피페라진-1-일, 1,2,3,4-테트라히드로퀴놀린-1-일, 테트라히드로퀴놀린-1-일, 인돌린-1-일, 이소인돌린-2-일, 데카히드로퀴놀린-1-일 또는 데카히드로이소퀴놀린-2-일을 형성하고, 여기서 탄소 상의 가능한 치환기는 각각 독립적으로 R^{10} , 옥소 및/또는 티옥소로부터 선택되며, 질소 상의 가능한 치환기는 각각 독립적으로 R^{11} 로부터 선택된다.
- [0142] Y^3 이 S인 경우 R^1 은 보다 바람직하게는 시클로프로필, 시클로펜틸 또는 시클로헥실이거나, 또는
- [0143] R^1 은 보다 바람직하게는 치환된 시클로프로필 또는 시클로헥실이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 메틸, 에틸 또는 페닐로부터 선택되거나, 또는
- [0144] R^1 은 보다 바람직하게는 시클로펜테닐 또는 시클로헥세닐이거나, 또는
- [0145] R^1 은 보다 바람직하게는 비치환 또는 치환된 페닐 또는 벤질이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 메틸, 에틸 또는 메톡시로부터 선택되고,
- [0146] Q^2 는 바람직하게는 수소, 플루오린, 염소, 니트로, 트리플루오로메틸, C(=O)H, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 프로프-2-인-1-일옥시, 부트-2-인-1-일옥시, 펜트-2-인-1-일옥시, 부트-3-인-1-일옥시, 부트-3-엔-1-일옥시, 3-클로로프로프-2-인-1-일옥시, 시아노메톡시, 알릴옥시의 군으로부터 각각 독립적으로 선택된 2개 이하의 치환기를 갖는 페닐 고리이거나, 또는
- [0147] Q^2 는 바람직하게는 2개 이하의 치환기를 함유할 수 있는 5- 또는 6-원 헤테로아릴 라디칼이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로
- [0148] 탄소 상의 치환기: 수소, 할로젠, 시아노, 포르밀, SH, 니트로, NR^6R^7 , C_1-C_6 -알킬, C_2-C_6 -알케닐, C_2-C_6 -알케닐옥시, C_2-C_6 -알키닐, C_2-C_6 -알키닐옥시, C_1-C_6 -할로알킬, C_3-C_6 -시클로알킬, C_3-C_6 -시클로알킬- C_1-C_4 -알킬, C_3-C_6 -시클로알킬- C_3-C_6 -시클로알킬, C_1-C_4 -알콕시- C_1-C_4 -알킬, C_1-C_4 -알킬카르보닐, C_1-C_6 -알콕시카르보닐, C_1-C_6 -알킬아미노카르보닐, C_2-C_8 -디아킬아미노카르보닐, C_1-C_4 -알콕시, C_1-C_4 -할로알콕시, C_1-C_6 -알킬카르보닐옥시 또는 페닐, 바람직하게는 수소, 플루오린, 염소, 니트로, 트리플루오로메틸, C(=O)H, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 프로프-2-인-1-일옥시, 부트-2-인-1-일옥시, 펜트-2-인-1-일옥시, 부트-3-인-1-일옥시, 부트-3-엔-1-일옥시, 3-클로로프로프-2-인-1-일옥시, 시아노메톡시, 알릴옥시,
- [0149] 질소 상의 치환기: 수소, C_1-C_6 -알킬, C_3-C_6 -시클로알킬, 벤질, C(=O)H, C_2-C_6 -알콕시카르보닐, 벤질옥시카르보닐, C_2-C_6 -알킬아미노카르보닐 또는 C_2-C_6 -알킬카르보닐, 바람직하게는 수소, 메틸, 벤질, C(=O)H, 메톡시카르보닐, tert-부톡시카르보닐, 벤질옥시카르보닐, 메틸아미노카르보닐, 메틸카르보닐 또는 에틸카르보닐
- [0150] 로부터 선택되거나, 또는
- [0151] Q^2 는 보다 바람직하게는 2개 이하의 치환기로 임의로 치환된 페닐 고리이고, 여기서 치환기는 각각 독립적으로 플루오린, 염소, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 메톡시, 에톡시 또는 프로프-2-인-1-일옥시의 군으로부터 선택되고,
- [0152] Q^2 는 가장 바람직하게는 비치환 페닐 고리이고,

[0153] R^6 및 R^9 는 바람직하게는 동일 또는 상이하며 각각 독립적으로 수소, C_1-C_6 -알킬, C_2-C_6 -알케닐, C_2-C_6 -알키닐, C_1-C_6 -할로알킬, C_3-C_8 -시클로알킬, 벤질 또는 페닐, 보다 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 1-메틸에틸, n-부틸 또는 1,1-디메틸에틸이며,

[0154] L^2 는 바람직하게는 직접 결합, -O-, CHR^8 - 또는 $-C(=O)-$, 보다 바람직하게는 직접 결합이고,

[0155] Z^{1a} 는 바람직하게는 시아노, 할로젠, 니트로, 포르밀, NR^6R^7 , C_1-C_6 -할로알킬, C_6-C_{12} -시클로알킬시클로알킬, C_2-C_6 -알케닐, C_2-C_6 -할로알케닐, C_2-C_6 -알키닐, C_2-C_6 -할로알키닐, C_3-C_{12} -트리알킬실릴, 페닐, 히드록실, 옥소, C_1-C_6 -알콕시, C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_4 -알콕시, C_1-C_6 -할로알콕시, C_2-C_6 -알케닐옥시, C_2-C_6 -알키닐옥시, C_3-C_6 -시클로알킬옥시, C_3-C_6 -시클로알킬- C_1-C_4 -알킬옥시, C_3-C_6 -할로시클로알킬옥시, C_1-C_6 -알콕시카르보닐, C_1-C_6 -알킬카르보닐옥시, C_1-C_6 -알킬카르보닐, C_1-C_6 -알킬티오, C_1-C_6 -할로알킬티오 또는 페녹시, 보다 바람직하게는 시아노, 니트로, 플루오린, 염소, 포르밀, 플루오로메틸, 클로로메틸, 브로모메틸, 디클로로메틸, 트리클로로메틸, 디플루오로메틸, 트리플루오로메틸, 클로로플루오로메틸, 디클로로플루오로메틸, 클로로디플루오로메틸, 1-클로로에틸, 1-브로모에틸, 1-플루오로에틸, 2-플루오로에틸, 2,2-디플루오로에틸, 2,2,2-트리플루오로에틸, 2-클로로-2-플루오로에틸, 2-클로로-2-디플루오로에틸, 2,2-디클로로-2-플루오로에틸, 2,2,2-트리클로로에틸, 펜타플루오로에틸, 1,1,1-트리플루오로프로프-2-일, 1,1'-비(시클로프로프-2-일), 에테닐, 1-프로페닐, 2-프로페닐, 1-메틸에테닐, 1-부테닐, 2-부테닐, 3-부테닐, 1-메틸-1-프로페닐, 2-메틸-1-프로페닐, 1-메틸-2-프로페닐, 2-메틸-2-프로페닐, 2,2-디플루오로에테닐, 플루오로에테닐, 1-플루오로프로프-2-엔-1-일, 1-클로로프로프-2-엔-1-일, 3-플루오로프로프-1-엔-1-일, 3-클로로프로프-1-엔-1-일, 에티닐, 2-프로페닐, 1-프로페닐, 페닐, 옥소, 메톡시, 에톡시, 프로톡시, 1-메틸에톡시, 메톡시메톡시, 메톡시에톡시, 메틸티오, 에틸티오, 프로필티오, 1-메틸에틸티오, 클로로메톡시, 브로모메톡시, 디클로로메톡시, 트리클로로메톡시, 플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 클로로플루오로메톡시, 디클로로플루오로메톡시, 클로로디플루오로메톡시, 1-클로로에톡시, 1-브로모에톡시, 1-플루오로에톡시, 2-플루오로에톡시, 2,2-디플루오로에톡시, 2,2,2-트리플루오로에톡시, 2-클로로-2-플루오로에톡시, 2-클로로-2-디플루오로에톡시, 2,2-디클로로-2-플루오로에톡시, 2,2,2-트리클로로에톡시, 펜타플루오로에톡시, 시클로프로필옥시, 시클로부틸옥시, 시클로펜틸옥시, 시클로헥실옥시, 2-플루오로시클로헥실옥시, 2-클로로시클로헥실옥시, 2-플루오로시클로펜틸, 2-클로로시클로펜틸옥시, 가장 바람직하게는 시아노, 니트로, 플루오린, 염소, 포르밀, 플루오로메틸, 클로로메틸, 브로모메틸, 디클로로메틸, 트리클로로메틸, 디플루오로메틸, 트리플루오로메틸, 클로로플루오로메틸, 디클로로플루오로메틸, 클로로디플루오로메틸, 1-클로로에틸, 1-브로모에틸, 1-플루오로에틸, 2-플루오로에틸, 2,2-디플루오로에틸, 2,2,2-트리플루오로에틸, 2-클로로-2-플루오로에틸, 2-클로로-2-디플루오로에틸, 2,2-디클로로-2-플루오로에틸, 2,2,2-트리클로로에틸, 펜타플루오로에틸, 1,1,1-트리플루오로프로프-2-일이고,

[0156] Z^{1b} , Z^{1c} , Z^{1d} , Z^{1e} 는 동일 또는 상이하며 바람직하게는 각각 독립적으로 시아노, 할로젠, 니트로, NR^6R^7 , C_1-C_6 -알킬, C_1-C_6 -할로알킬, C_3-C_6 -시클로알킬, C_3-C_6 -시클로알킬- C_3-C_6 -시클로알킬, C_2-C_6 -알케닐, C_2-C_6 -할로알케닐, C_2-C_6 -알키닐, C_2-C_6 -할로알키닐, C_3-C_{12} -트리알킬실릴, 페닐, 히드록실, 옥소, C_1-C_6 -알콕시, C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_4 -알콕시, C_1-C_6 -할로알콕시, C_2-C_6 -알케닐옥시, C_2-C_6 -알키닐옥시, C_3-C_6 -시클로알킬옥시, C_2-C_8 -시클로알킬- C_1-C_4 -알킬옥시, C_3-C_6 -할로시클로알킬옥시, C_1-C_6 -알콕시카르보닐, C_1-C_6 -알킬카르보닐옥시, C_1-C_6 -알킬카르보닐, C_1-C_6 -알킬티오, C_1-C_6 -할로알킬티오 또는 페녹시, 보다 바람직하게는 시아노, 니트로, 플루오린, 염소, 포르밀, 메틸, 에틸, 프로필, 1-메틸에틸, 플루오로메틸, 클로로메틸, 브로모메틸, 디클로로메틸, 트리클로로메틸, 디플루오로메틸, 트리플루오로메틸, 클로로플루오로메틸, 디클로로플루오로메틸, 클로로디플루오로메틸, 1-클로로에틸, 1-브로모에틸, 1-플루오로에틸, 2-플루오로에틸, 2,2-디플루오로에틸, 2,2,2-트리플루오로에틸, 2-클로로-2-플루오로에틸, 2-클로로-2-디플루오로에틸, 2,2-디클로로-2-플루오로에틸, 2,2,2-트리클로로에틸, 펜타플루오로에틸, 1,1,1-트리플루오로프로프-2-일, 시클로프로필, 시클로펜틸, 시클로헥실, 1,1'-비(시클로프로프-2-일), 에테닐, 1-프로페닐, 2-프로페닐, 1-메틸에테닐, 1-부테닐, 2-부테닐, 3-부테닐, 1-메틸-1-프로페닐, 2-메틸-1-프로페닐, 1-메틸-2-프로페닐, 2-메틸-2-프로페닐, 2,2-디플루오로에테닐, 플루오로에테닐, 1-플루오로프로프-2-엔-1-일, 1-클로로프로프-2-엔-1-일, 3-플루오로프로프-1-엔-1-일, 3-클로로프로프-1-엔-1-일, 에티닐, 2-프로페닐, 1-프로페닐, 페닐, 옥소, 메톡시, 에톡시, 프로톡시, 1-메틸에톡시, 메톡시메톡시, 메톡시

에톡시, 메틸티오, 에틸티오, 프로필티오, 1-메틸에틸티오, 클로로메톡시, 브로모메톡시, 디클로로메톡시, 트리클로로메톡시, 플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 클로로플루오로메톡시, 디클로로플루오로메톡시, 클로로디플루오로메톡시, 1-클로로에톡시, 1-브로모에톡시, 1-플루오로에톡시, 2-플루오로에톡시, 2,2-디플루오로에톡시, 2,2,2-트리플루오로에톡시, 2-클로로-2-플루오로에톡시, 2-클로로-2-디플루오로에톡시, 2,2-디클로로-2-플루오로에톡시, 2,2,2-트리클로로에톡시, 펜타플루오로에톡시, 시클로프로필옥시, 시클로부틸옥시, 시클로펜틸옥시, 시클로헥실옥시, 2-플루오로시클로헥실옥시, 2-클로로시클로헥실옥시, 2-플루오로시클로펜틸, 2-클로로시클로펜틸옥시, 가장 바람직하게는 시아노, 니트로, 플루오린, 염소, 포르밀, 메틸, 에틸, 프로필, 1-메틸에틸, 플루오로메틸, 클로로메틸, 브로모메틸, 디클로로메틸, 트리클로로메틸, 디플루오로메틸, 트리플루오로메틸, 클로로플루오로메틸, 디클로로플루오로메틸, 클로로디플루오로메틸, 1-클로로에틸, 1-브로모에틸, 1-플루오로에틸, 2-플루오로에틸, 2,2-디플루오로에틸, 2,2,2-트리플루오로에틸, 2-클로로-2-플루오로에틸, 2-클로로-2-디플루오로에틸, 2,2-디클로로-2-플루오로에틸, 2,2,2-트리클로로에틸, 펜타플루오로에틸, 1,1,1-트리플루오로프로프-2-일, 시클로프로필, 시클로펜틸, 시클로헥실이고,

[0157] Z^{1f} 는 바람직하게는 C_2-C_6 -알케닐, C_2-C_6 -알케닐아미노, C_2-C_6 -알케닐옥시, C_2-C_6 -알케닐티오, C_2-C_6 -알키닐, C_2-C_6 -알키닐아미노, C_2-C_6 -알키닐옥시, C_2-C_6 -알키닐티오, C_1-C_6 -알콕시, C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_4 -알케닐, C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_4 -알키닐, C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_4 -알콕시, C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_4 -알콕시- C_1-C_4 -알킬, C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_4 -알콕시카르보닐, C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_4 -알킬, C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_4 -알킬아미노카르보닐, C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_4 -알킬카르보닐, C_1-C_6 -알콕시아미노, C_1-C_6 -알콕시카르보닐, C_1-C_6 -알콕시카르보닐- C_1-C_4 -알콕시, C_1-C_6 -알콕시카르보닐- C_1-C_4 -알킬, C_1-C_6 -알콕시카르보닐아미노, C_1-C_6 -알콕시할로- C_1-C_4 -알콕시, C_1-C_6 -알콕시할로- C_1-C_4 -알킬, C_1-C_6 -알킬, C_1-C_6 -알킬아미노, C_1-C_6 -알킬아미노- C_1-C_4 -알킬, C_1-C_6 -알킬아미노카르보닐, C_1-C_6 -알킬아미노카르보닐- C_1-C_4 -알킬아미노, C_1-C_6 -알킬아미노카르보닐아미노, C_1-C_6 -알킬아미노술포닐, C_1-C_6 -알킬아미노티오카르보닐, C_1-C_6 -알킬아미노티오카르보닐아미노, C_1-C_6 -알킬카르보닐, C_1-C_6 -알킬카르보닐- C_1-C_4 -알콕시, C_1-C_6 -알킬카르보닐아미노, C_1-C_6 -알킬카르보닐옥시, C_1-C_6 -알킬카르보닐티오, C_1-C_6 -알킬- C_3-C_6 -시클로알킬, C_1-C_6 -알킬- C_3-C_6 -시클로알킬- C_1-C_4 -알킬, C_1-C_6 -알킬술포닐, C_1-C_6 -알킬술포닐- C_1-C_4 -알킬, C_1-C_6 -알킬술포닐아미노, C_1-C_6 -알킬술포닐아미노카르보닐, C_1-C_6 -알킬티오, C_1-C_6 -알킬티오- C_1-C_4 -알킬, C_1-C_6 -알킬티오카르보닐, C_1-C_6 -알킬티오카르보닐옥시, 아미노, 아미노카르보닐, $C(=N-OR^7)R^8$, $C(=O)H$, $C(=O)NHCN$, $C(=O)OH$, 시아노, C_1-C_6 -시아노알콕시, C_1-C_6 -시아노알킬, C_3-C_8 -시클로알케닐, C_3-C_6 -시클로알케닐옥시- C_1-C_4 -알킬, C_3-C_8 -시클로알콕시, C_3-C_6 -시클로알콕시- C_1-C_4 -알킬, C_3-C_8 -시클로알콕시카르보닐, C_3-C_8 -시클로알킬, C_4-C_8 -시클로알킬- C_1-C_4 -알콕시, C_3-C_6 -시클로알킬- C_1-C_4 -알콕시카르보닐, C_3-C_6 -시클로알킬- C_1-C_4 -알킬, C_3-C_6 -시클로알킬- C_1-C_4 -알킬아미노, C_3-C_6 -시클로알킬- C_1-C_4 -알킬아미노- C_1-C_4 -알킬, C_3-C_6 -시클로알킬아미노, C_3-C_6 -시클로알킬아미노- C_1-C_4 -알킬, C_3-C_6 -시클로알킬아미노카르보닐, C_3-C_8 -시클로알킬카르보닐, C_3-C_6 -시클로알킬카르보닐옥시, C_3-C_6 -시클로알킬- C_3-C_6 -시클로알킬, C_3-C_8 -시클로알킬술포닐, C_3-C_8 -시클로알킬티오, C_2-C_8 -디알콕시- C_1-C_4 -알킬, C_2-C_8 -디알킬아미노, C_2-C_8 -디알킬아미노- C_1-C_4 -알킬, C_2-C_8 -디알킬아미노카르보닐, C_2-C_8 -디알킬아미노카르보닐아미노, C_2-C_8 -디알킬아미노술포닐, C_2-C_8 -디알킬아미노티오카르보닐, C_2-C_8 -디알킬아미노티오카르보닐아미노, 할로젠, C_2-C_8 -할로알케닐, C_2-C_8 -할로알케닐옥시, C_2-C_8 -할로알키닐, C_2-C_8 -할로알키닐옥시, C_1-C_6 -할로알콕시, C_1-C_6 -할로알콕시- C_1-C_4 -알콕시, C_1-C_6 -할로알콕시- C_1-C_4 -알킬, C_1-C_6 -할로알콕시아미노, C_1-C_6 -할로알콕시카르보닐, C_1-C_6 -할로알콕시카르보닐아미노, C_1-C_6 -할로알콕시- C_1-C_4 -할로알콕시, C_1-C_6 -할로알콕시- C_1-C_4 -할로알킬, C_1-C_6 -할로알킬, C_1-C_6 -할로알킬아미노, C_1-C_6 -할로알킬아미노- C_1-C_4 -알킬, C_1-C_6 -할로알킬카르보닐, C_1-C_6 -할로알킬카르보닐아미노, C_1-C_6 -할로알킬카르보닐옥시, C_1-C_6 -할로알킬술포닐, C_1-C_6 -할로알킬술포닐, C_1-C_6 -할로알킬술포닐아미노, C_1-C_6 -할로알킬술포닐아미노카르보닐, C_1-C_6 -할로알킬티오, C_3-C_8 -할로시클로알케닐, C_3-C_6 -할로시클로알케닐옥시- C_1-C_4 -알킬, C_3-C_8 -할로시클로알콕시, C_3-C_6 -할로시클로알콕시- C_1-C_4 -알킬, C_3-C_8 -할로시클로알킬, C_3-C_6 -할로시클로알킬- C_1-C_4 -알킬, C_3-C_8 -할로시클로알킬카르보닐옥시, C_2-C_8 -할로디알킬아미노, C_2-C_8 -할로디알킬아미노- C_1-C_4 -알킬, 히드록실, C_1-C_6 -히드록시알킬, $NHCHO$, $NHCN$, 니트로, 페닐술포닐아미노, SF_5 , SO_2NHCN , 티옥

시, C₃-C₁₂-트리알킬실릴, 수소이며,

- [0158] Z^{1f}는 보다 바람직하게는 수소, 플루오린, 염소, 니트로, 트리플루오로메틸, C(=O)H, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 프로프-2-인-1-일옥시, 부트-2-인-1-일옥시, 펜트-2-인-1-일옥시, 부트-3-인-1-일옥시, 부트-3-엔-1-일옥시, 3-클로로프로프-2-인-1-일옥시, 시아노메톡시, 알릴옥시이고,
- [0159] Z^{1g}는 바람직하게는 시아노, 니트로, 할로젠, NR⁶R⁷, C₁-C₆-알킬, C₁-C₄-할로알킬, C₃-C₆-시클로알킬, C₁-C₆-알케닐, C₁-C₆-할로알케닐, C₂-C₆-알키닐, C₂-C₆-할로알키닐, C₃-C₁₂-트리알킬실릴, 벤질, 페닐, 히드록실, SH, C₁-C₆-알콕시, C₁-C₆-할로알콕시, C₂-C₆-알케닐옥시, C₂-C₆-알키닐옥시, C₁-C₆-알킬티오 또는 C₁-C₆-할로알킬티오, 보다 바람직하게는 플루오린, 염소, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 시클로프로필, 시클로펜틸, 시클로헥실, 메틸렌, 디플루오로메틸렌, 디클로로메틸렌, 메톡시, 에톡시이고,
- [0160] Z^{1h}, Z^{1j} 및 Z¹ⁱ는 동일 또는 상이하하며 바람직하게는 각각 독립적으로 수소, 시아노, 니트로, 할로젠, -NR³R⁴, C₁-C₆-알킬, C₂-C₆-알케닐, C₂-C₆-알키닐, C₁-C₆-할로알킬, C₂-C₆-할로알케닐, C₂-C₆-할로알키닐, C₃-C₈-시클로알킬, C₃-C₈-할로시클로알킬, C₁-C₄-알킬-C₃-C₈-시클로알킬, C₃-C₈-시클로알킬-C₁-C₄-알킬, C₁-C₄-알콕시-C₁-C₄-알킬, C₃-C₈-시클로알콕시-C₁-C₄-알킬, C₁-C₄-알콕시-C₁-C₄-알콕시-C₁-C₄-알킬, C₁-C₄-알킬티오-C₁-C₄-알킬, C₁-C₆-알콕시, C₁-C₆-할로알콕시, C₃-C₈-시클로알콕시, C₃-C₈-할로시클로알콕시, C₃-C₈-시클로알킬-C₁-C₄-알콕시, C₂-C₆-알케닐옥시, C₂-C₆-할로알케닐옥시, C₂-C₆-알키닐옥시, C₂-C₆-할로알키닐옥시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₄-알콕시, C₁-C₆-알킬카르보닐옥시, C₁-C₆-할로알킬카르보닐옥시, C₃-C₈-시클로알킬카르보닐옥시, C₁-C₆-알킬카르보닐-C₁-C₆-알콕시, C₁-C₆-알킬티오, C₁-C₆-할로알킬티오, C₃-C₈-시클로알킬티오, 보다 바람직하게는 수소, 플루오린, 염소, 시아노, 메틸, 메톡시, 에톡시, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸 또는 메톡시메틸이거나, 또는 가장 바람직하게는 수소이고,
- [0161] Z¹ⁱ, Z^{1k} 및 Z^{1m}은 동일 또는 상이하하며 바람직하게는 각각 독립적으로 수소, -C(=O)H, C₁-C₃-알킬, C₁-C₆-알킬카르보닐, C₁-C₆-알콕시카르보닐, 벤질옥시카르보닐 또는 벤질, 보다 바람직하게는 수소, -C(=O)H, 메틸, 에틸, 메틸카르보닐, 에틸카르보닐, 메톡시카르보닐, tert-부톡시카르보닐, 벤질옥시카르보닐 또는 벤질이고,
- [0162] R¹⁰은 바람직하게는 수소, 옥소, 시아노, 할로젠, C₁-C₄-알킬, C₁-C₄-할로알킬, C₃-C₆-시클로알킬, C₁-C₄-알콕시, 보다 바람직하게는 수소, 옥소, 메틸, 메톡시이고,
- [0163] R¹¹은 바람직하게는 수소, -C(=O)H, C₁-C₃-알킬, C₁-C₆-알킬카르보닐, C₁-C₆-알콕시카르보닐, 벤질옥시카르보닐 또는 벤질, 보다 바람직하게는 수소, -C(=O)H, 메틸, 메틸카르보닐, 메톡시카르보닐, 벤질옥시카르보닐, 벤질이다.
- [0164] 본 발명에 따라 사용가능한 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체는 화학식 I에 의한 일반적인 용어로 정의된다. 상기의 라디칼 정의 및 화학식 I의 하기 명시된 라디칼 정의는 화학식 I의 최종 생성물에 적용되며, 또한 모든 중간체에도 동등하게 적용된다 (이하, "공정 및 중간체의 설명"을 참조한다).
- [0165] 일반적인 용어 또는 바람직한 예의 분야에서, 상기 및 하기 제시된 라디칼 정의 및 설명은 예를 들어 바람직한 분야 및 바람직한 예의 분야 사이의 조합을 비롯한, 목적하는 바에 따라 서로 조합될 수 있다. 이들은 최종 생성물 및 이에 따른 전구체 및 중간체 모두에 적용된다. 또한, 개별적인 정의는 적용되지 않을 수 있다.
- [0166] 모든 라디칼이 전술한 바람직한 정의를 갖는 화학식 I의 화합물이 바람직하다.
- [0167] 모든 라디칼이 전술한 더욱 바람직한 정의를 갖는 화학식 I의 화합물이 특히 바람직하다.
- [0168] 모든 라디칼이 전술한 가장 바람직한 정의를 갖는 화학식 I의 화합물이 매우 특히 바람직하다.
- [0169] 추가로, A가 3,5-비스(디플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일이거나, 또는 A가 5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일이거나, 또는 A가 5-클로로-2-메틸페닐이고;
- [0170] L¹이 -CH₂-이거나 또는 L¹이 -NH-이고;

- [0171] Y^1 이 산소이고;
- [0172] p가 0이고;
- [0173] G가 G^1 이고;
- [0174] R^{G1} 이 수소이고;
- [0175] Q^1 이 $Q^{24}-3$ 이고;
- [0176] R^5 가 수소이고;
- [0177] Y^2 가 산소이고;
- [0178] Y^3 이 산소 또는 $-(NR^{Y3})-$ 이고;
- [0179] R^{Y3} 이 수소 또는 메틸이고;
- [0180] R^1 이 2-플루오로시클로헥실이거나, 또는
- [0181] R^1 이 2-페닐시클로헥실이거나, 또는
- [0182] R^1 이 2-시아노시클로헥실이거나, 또는
- [0183] R^1 이 2-클로로시클로헥실이거나, 또는
- [0184] R^1 이 1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-1-일이거나, 또는
- [0185] R^1 이 2,6-디플루오로벤질이거나, 또는
- [0186] R^1 이 2-클로로벤질이거나, 또는
- [0187] R^1 이 2,4-디클로로벤질인 화학식 I의 화합물 및 그의 농약 활성 염, 금속 착물 및 N-옥시드가 바람직하다.
- [0188] 상기 명시된 라디칼 정의는 원하는 바에 따라 서로 조합될 수 있다. 게다가, 개개의 정의는 적용되지 않을 수 있다.
- [0189] 상기 정의된 치환기의 유형에 따라, 화학식 I의 화합물은 산성 또는 염기성 성질을 가질 수 있으며, 염, 가능하게는 또한 무기 또는 유기 산 또는 염기 또는 금속 이온과의 내부 염 또는 부가 염을 형성할 수 있다. 화학식 I의 화합물이 아미노, 알킬아미노 또는 염기성 성질을 유도하는 기타의 기를 갖는 경우, 이들 화합물은 산과 반응하여 염을 생성할 수 있거나, 또는 이들은 합성에 의하여 염으로서 직접 수득한다. 화학식 I의 화합물이 히드록실, 카르복실 또는 산성 성질을 유도하는 기타의 기를 갖는 경우, 이들 화합물은 염기와 반응하여 염을 생성할 수 있다. 염기의 적절한 예로는 알칼리 금속 및 알칼리 토금속, 특히 나트륨, 칼륨, 마그네슘 및 칼슘의 수산화물, 탄산염, 탄산수소염 및 또한 암모니아, C_1-C_4 -알킬 기를 갖는 1급, 2급 및 3급 아민, C_1-C_4 -알칸올의 모노-, 디- 및 트리알칸올아민, 콜린 및 클로로콜린을 들 수 있다.
- [0190] 이러한 방식으로 얻을 수 있는 염은 마찬가지로 살진균성 성질을 갖는다.
- [0191] 무기 산의 예로는 할로젠화수소산, 예컨대 플루오린화수소, 염화수소, 브로민화수소 및 아이오딘화수소, 황산, 인산 및 질산 및, 산성 염, 예컨대 $NaHSO_4$ 및 $KHSO_4$ 를 들 수 있다. 유기산의 유용한 예로는 포름산, 카본산 및 알칸산, 예컨대 아세트산, 트리플루오로아세트산, 트리클로로아세트산 및 프로피온산 및 또한 글리콜산, 티오시안산, 락트산, 숙신산, 시트르산, 벤조산, 신남산, 옥살산, 포화 또는 모노- 또는 디불포화 C_6-C_{20} 지방산, 알킬 황산 모노에스테르, 알킬술폰산 (1 내지 20개의 탄소 원자를 갖는 직쇄형 또는 분지형 알킬 라디칼을 갖는 술폰산), 아릴술폰산 또는 아릴디술폰산 (1개 또는 2개의 술폰산 기를 갖는 방향족 라디칼, 예컨대 페닐 및 나프틸), 알킬포스폰산 (1 내지 20개의 탄소 원자를 갖는 직쇄형 또는 분지형 알킬 라디칼을 갖는 포스폰산), 아릴 포스폰산 또는 아릴디포스폰산 (1개 또는 2개의 포스폰산 라디칼을 갖는 방향족 라디칼, 예컨대 페닐 및

나프틸)을 들 수 있으며, 여기서 알킬 및 아릴 라디칼은 추가의 치환기, 예를 들어 p-톨루엔술폰산, 살리실산, p-아미노살리실산, 2-페녹시벤조산, 2-아세톡시벤조산 등을 가질 수 있다.

- [0192] 유용한 금속 이온은 특히 제2 주족의 원소, 특히 칼슘 및 마그네슘, 제3 및 제4 주족의 원소, 특히 알루미늄, 주석 및 납 및 또한 제1 내지 제8 전이족의 원소, 특히 크롬, 망가니즈, 철, 코발트, 니켈, 구리, 아연 등의 이온이다. 제4 주기 원소의 금속 이온이 특히 바람직하다. 금속은 이들이 상정할 수 있는 상이한 원자가로 존재할 수 있다.
- [0193] 임의로 치환된 기는 모노- 또는 폴리치환될 수 있으며, 여기서 폴리치환의 경우에서의 치환기는 동일 또는 상이할 수 있다.
- [0194] 상기 식에서 제시된 부호의 정의에서, 일반적으로 하기 치환기의 대표예인 집합적 용어를 사용하였다:
- [0195] 할로겐: 플루오린, 염소, 브로민 및 아이오딘, 바람직하게는 플루오린, 염소, 브로민, 보다 바람직하게는 플루오린, 염소.
- [0196] 알킬: 1 내지 8개, 바람직하게는 1 내지 6개, 보다 바람직하게는 1 내지 3개의 탄소 원자를 갖는 포화, 직쇄형 또는 분지형 히드로카르빌 라디칼, 예를 들어 (비제한적인 예) C₁-C₆-알킬, 예컨대 메틸, 에틸, 프로필, 1-메틸에틸, 부틸, 1-메틸프로필, 2-메틸프로필, 1,1-디메틸에틸, 펜틸, 1-메틸부틸, 2-메틸부틸, 3-메틸부틸, 2,2-디메틸프로필, 1-에틸프로필, 헥실, 1,1-디메틸프로필, 1,2-디메틸프로필, 1-메틸펜틸, 2-메틸펜틸, 3-메틸펜틸, 4-메틸펜틸, 1,1-디메틸부틸, 1,2-디메틸부틸, 1,3-디메틸부틸, 2,2-디메틸부틸, 2,3-디메틸부틸, 3,3-디메틸부틸, 1-에틸부틸, 2-에틸부틸, 1,1,2-트리메틸프로필, 1,2,2-트리메틸프로필, 1-에틸-1-메틸프로필 및 1-에틸-2-메틸프로필. 이러한 정의는 또한 예를 들어 시클로알킬알킬, 히드록시알킬 등의 복합 치환기의 일부로서 알킬, 다른 방식으로 정의하지 않는다면, 예를 들어 알킬티오, 알킬술피닐, 알킬술포닐, 할로알킬 또는 할로알킬티오에 적용된다. 알킬이 예를 들어 알킬시클로알킬로서 복합 치환기의 끝부분에 있을 경우, 출발시의 복합 치환기의 일부, 예컨대 시클로알킬은 동일하게 또는 상이하게 및 독립적으로 알킬로 모노- 또는 폴리치환될 수 있다. 또한, 기타의 라디칼, 예를 들어 알케닐, 알키닐, 히드록실, 할로겐, 포르밀 등이 끝부분에 있는 복합 치환기에도 마찬가지로 적용된다.
- [0197] 알케닐: 2 내지 8개, 바람직하게는 2 내지 6개의 탄소 원자 및 임의의 위치에서 1개의 이중 결합을 갖는 불포화, 직쇄형 또는 분지형 히드로카르빌 라디칼, 예를 들어 (비제한적인 예) C₂-C₆-알케닐, 예컨대 에테닐, 1-프로페닐, 2-프로페닐, 1-메틸에테닐, 1-부테닐, 2-부테닐, 3-부테닐, 1-메틸-1-프로페닐, 2-메틸-1-프로페닐, 1-메틸-2-프로페닐, 2-메틸-2-프로페닐, 1-펜테닐, 2-펜테닐, 3-펜테닐, 4-펜테닐, 1-메틸-1-부테닐, 2-메틸-1-부테닐, 3-메틸-1-부테닐, 1-메틸-2-부테닐, 2-메틸-2-부테닐, 3-메틸-2-부테닐, 1-메틸-3-부테닐, 2-메틸-3-부테닐, 3-메틸-3-부테닐, 1,1-디메틸-2-프로페닐, 1,2-디메틸-1-프로페닐, 1,2-디메틸-2-프로페닐, 1-에틸-1-프로페닐, 1-에틸-2-프로페닐, 1-헥세닐, 2-헥세닐, 3-헥세닐, 4-헥세닐, 5-헥세닐, 1-메틸-1-펜테닐, 2-메틸-1-펜테닐, 3-메틸-1-펜테닐, 4-메틸-1-펜테닐, 1-메틸-2-펜테닐, 2-메틸-2-펜테닐, 3-메틸-2-펜테닐, 4-메틸-2-펜테닐, 1-메틸-3-펜테닐, 2-메틸-3-펜테닐, 3-메틸-3-펜테닐, 4-메틸-3-펜테닐, 1-메틸-4-펜테닐, 2-메틸-4-펜테닐, 3-메틸-4-펜테닐, 4-메틸-4-펜테닐, 1,1-디메틸-2-부테닐, 1,1-디메틸-3-부테닐, 1,2-디메틸-1-부테닐, 1,2-디메틸-2-부테닐, 1,2-디메틸-3-부테닐, 1,3-디메틸-1-부테닐, 1,3-디메틸-2-부테닐, 1,3-디메틸-3-부테닐, 2,2-디메틸-3-부테닐, 2,3-디메틸-1-부테닐, 2,3-디메틸-2-부테닐, 2,3-디메틸-3-부테닐, 3,3-디메틸-1-부테닐, 3,3-디메틸-2-부테닐, 1-에틸-1-부테닐, 1-에틸-2-부테닐, 1-에틸-3-부테닐, 2-에틸-1-부테닐, 2-에틸-2-부테닐, 2-에틸-3-부테닐, 1,1,2-트리메틸-2-프로페닐, 1-에틸-1-메틸-2-프로페닐, 1-에틸-2-메틸-1-프로페닐 및 1-에틸-2-메틸-2-프로페닐. 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 알케닐, 예를 들어 할로알케닐 등에 적용된다.
- [0198] 알키닐: 2 내지 8개, 바람직하게는 2 내지 6개의 탄소 원자를 가지며 임의의 위치에서 1개의 삼중 결합을 갖는 직쇄형 또는 분지형 히드로카르빌 기, 예를 들어 (비제한적인 예) C₂-C₆-알키닐, 예컨대 에티닐, 1-프로피닐, 2-프로피닐, 1-부티닐, 2-부티닐, 3-부티닐, 1-메틸-2-프로피닐, 1-펜티닐, 2-펜티닐, 3-펜티닐, 4-펜티닐, 1-메틸-2-부티닐, 1-메틸-3-부티닐, 2-메틸-3-부티닐, 3-메틸-1-부티닐, 1,1-디메틸-2-프로피닐, 1-에틸-2-프로피닐, 1-헥시닐, 2-헥시닐, 3-헥시닐, 4-헥시닐, 5-헥시닐, 1-메틸-2-펜티닐, 1-메틸-3-펜티닐, 1-메틸-4-펜티닐, 2-메틸-3-펜티닐, 2-메틸-4-펜티닐, 3-메틸-1-펜티닐, 3-메틸-4-펜티닐, 4-메틸-1-펜티닐, 4-메틸-2-펜티닐, 1,1-디메틸-2-부티닐, 1,1-디메틸-3-부티닐, 1,2-디메틸-3-부티닐, 2,2-디메틸-3-부티닐, 3,3-디메틸-1-부티닐, 1-에틸-2-부티닐, 1-에틸-3-부티닐, 2-에틸-3-부티닐 및 1-에틸-1-메틸-2-프로피닐. 이러한

정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 알킬닐, 예를 들어 할로알킬닐 등에 적용된다.

[0199] 알콕시: 1 내지 8개, 바람직하게는 1 내지 6개, 보다 바람직하게는 1 내지 3개의 탄소 원자를 갖는 포화, 직쇄형 또는 분지형 알킬옥시, 알케닐옥시 또는 알키닐옥시 라디칼, 예를 들어 (비제한적인 예) C₁-C₆-알콕시, 예컨대 메톡시, 에톡시, 프로폭시, 1-메틸에톡시, 부톡시, 1-메틸-프로폭시, 2-메틸프로폭시, 1,1-디메틸에톡시, 펜톡시, 1-메틸부톡시, 2-메틸부톡시, 3-메틸부톡시, 2,2-디메틸프로폭시, 1-에틸프로폭시, 헥소시, 1,1-디메틸프로폭시, 1,2-디메틸프로폭시, 1-메틸펜톡시, 2-메틸펜톡시, 3-메틸펜톡시, 4-메틸펜톡시, 1,1-디메틸부톡시, 1,2-디메틸부톡시, 1,3-디메틸부톡시, 2,2-디메틸부톡시, 2,3-디메틸부톡시, 3,3-디메틸부톡시, 1-에틸부톡시, 2-에틸부톡시, 1,1,2-트리메틸프로폭시, 1,2,2-트리메틸프로폭시, 1-에틸-1-메틸프로폭시 및 1-에틸-2-메틸프로폭시 또는 C₁-C₆-알케닐옥시, 예컨대 부트-3-엔-1-일옥시 및 알릴옥시 또는 C₁-C₆-알키닐옥시, 예컨대 프로프-2-인-1-일옥시, 부트-2-인-1-일옥시, 펜트-2-인-1-일옥시, 부트-3-인-1-일옥시. 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 알콕시, 예를 들어 할로알콕시, 알키닐알콕시 등에 적용된다.

[0200] 알킬티오: 1 내지 8개, 바람직하게는 1 내지 6개, 보다 바람직하게는 1 내지 3개의 탄소 원자를 갖는 포화, 직쇄형 또는 분지형 알킬티오 라디칼, 예를 들어 (비제한적인 예) C₁-C₆-알킬티오, 예컨대 메틸티오, 에틸티오, 프로필티오, 1-메틸에틸티오, 부틸티오, 1-메틸프로필티오, 2-메틸프로필티오, 1,1-디메틸에틸티오, 펜틸티오, 1-메틸부틸티오, 2-메틸부틸티오, 3-메틸부틸티오, 2,2-디메틸프로필티오, 1-에틸프로필티오, 헥실티오, 1,1-디메틸프로필티오, 1,2-디메틸프로필티오, 1-메틸펜틸티오, 2-메틸펜틸티오, 3-메틸펜틸티오, 4-메틸펜틸티오, 1,1-디메틸부틸티오, 1,2-디메틸부틸티오, 1,3-디메틸부틸티오, 2,2-디메틸부틸티오, 2,3-디메틸부틸티오, 3,3-디메틸부틸티오, 1-에틸부틸티오, 2-에틸부틸티오, 1,1,2-트리메틸프로필티오, 1,2,2-트리메틸프로필티오, 1-에틸-1-메틸프로필티오 및 1-에틸-2-메틸프로필티오. 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 알킬티오, 예를 들어 할로알킬티오 등에 적용된다.

[0201] 알콕시카르보닐: 1 내지 6개, 바람직하게는 1 내지 3개의 탄소 원자를 가지며 (상기 명시된 바와 같음) 카르보닐 기 (-CO-)를 통하여 골격에 결합된 알콕시 기. 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 알콕시카르보닐, 예를 들어 시클로알킬알콕시카르보닐 등에 적용된다.

[0202] 알킬술피닐: 1 내지 8개, 바람직하게는 1 내지 6개, 보다 바람직하게는 1 내지 3개의 탄소 원자를 갖는 포화, 직쇄형 또는 분지형 알킬술피닐 라디칼, 예를 들어 (비제한적인 예) C₁-C₆-알킬술피닐, 예컨대 메틸술피닐, 에틸술피닐, 프로필술피닐, 1-메틸에틸술피닐, 부틸술피닐, 1-메틸프로필술피닐, 2-메틸프로필술피닐, 1,1-디메틸에틸술피닐, 펜틸술피닐, 1-메틸부틸술피닐, 2-메틸부틸술피닐, 3-메틸부틸술피닐, 2,2-디메틸프로필술피닐, 1-에틸프로필술피닐, 헥실술피닐, 1,1-디메틸프로필술피닐, 1,2-디메틸프로필술피닐, 1-메틸펜틸술피닐, 2-메틸펜틸술피닐, 3-메틸펜틸술피닐, 4-메틸펜틸술피닐, 1,1-디메틸부틸술피닐, 1,2-디메틸부틸술피닐, 1,3-디메틸부틸술피닐, 2,2-디메틸부틸술피닐, 2,3-디메틸부틸술피닐, 3,3-디메틸부틸술피닐, 1-에틸부틸술피닐, 2-에틸부틸술피닐, 1,1,2-트리메틸프로필술피닐, 1,2,2-트리메틸프로필술피닐, 1-에틸-1-메틸프로필술피닐 및 1-에틸-2-메틸프로필술피닐. 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 알킬술피닐, 예를 들어 할로알킬술피닐 등에 적용된다.

[0203] 알킬술폰닐: 1 내지 8개, 바람직하게는 1 내지 6개, 보다 바람직하게는 1 내지 3개의 탄소 원자를 갖는 포화, 직쇄형 또는 분지형 알킬술폰닐 라디칼, 예를 들어 (비제한적인 예) C₁-C₆-알킬술폰닐, 예컨대 메틸술폰닐, 에틸술폰닐, 프로필술폰닐, 1-메틸에틸술폰닐, 부틸술폰닐, 1-메틸프로필술폰닐, 2-메틸프로필술폰닐, 1,1-디메틸에틸술폰닐, 펜틸술폰닐, 1-메틸부틸술폰닐, 2-메틸부틸술폰닐, 3-메틸부틸술폰닐, 2,2-디메틸프로필술폰닐, 1-에틸프로필술폰닐, 헥실술폰닐, 1,1-디메틸프로필술폰닐, 1,2-디메틸프로필술폰닐, 1-메틸펜틸술폰닐, 2-메틸펜틸술폰닐, 3-메틸펜틸술폰닐, 4-메틸펜틸술폰닐, 1,1-디메틸부틸술폰닐, 1,2-디메틸부틸술폰닐, 1,3-디메틸부틸술폰닐, 2,2-디메틸부틸술폰닐, 2,3-디메틸부틸술폰닐, 3,3-디메틸부틸술폰닐, 1-에틸부틸술폰닐, 2-에틸부틸술폰닐, 1,1,2-트리메틸프로필술폰닐, 1,2,2-트리메틸프로필술폰닐, 1-에틸-1-메틸프로필술폰닐 및 1-에틸-2-메틸프로필술폰닐. 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 알킬술폰닐, 예를 들어 할로알킬술폰닐 등에 적용된다.

[0204] 시클로알킬: 3 내지 10개, 바람직하게는 3 내지 8개, 보다 바람직하게는 3 내지 6개의 탄소 고리 원자를 갖는 모노시클릭, 포화 히드로카르빌기, 예를 들어 (비제한적인 예) 시클로프로필, 시클로펜틸 및 시클로헥실. 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 시클로알킬, 예를 들어 시클로알킬알킬

등에 적용된다.

- [0205] 시클로알케닐: 3 내지 10개, 바람직하게는 3 내지 8개, 보다 바람직하게는 3 내지 6개의 탄소 고리원을 갖는 모노시클릭, 부분 불포화 히드로카르빌 기, 예를 들어 (비제한적인 예) 시클로프로페닐, 시클로펜테닐 및 시클로헥세닐. 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 시클로알케닐, 예를 들어 시클로알케닐알킬 등에 적용된다.
- [0206] 시클로알콕시: 3 내지 10개, 바람직하게는 3 내지 8개, 보다 바람직하게는 3 내지 6개의 탄소 고리 원을 갖는 모노시클릭, 포화 시클로알킬옥시 기, 예를 들어 (비제한적인 예) 시클로프로필옥시, 시클로펜틸옥시 및 시클로헥실옥시. 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 시클로알콕시, 예를 들어 시클로알콕시알킬 등에 적용된다.
- [0207] 할로알킬: 1 내지 8개, 바람직하게는 1 내지 6개, 보다 바람직하게는 1 내지 3개의 탄소 원자를 갖고 (상기 명시된 바와 같음), 여기서 이들 기에서의 수소 원자의 일부 또는 전부는 상기 명시된 바와 같은 할로겐 원자에 의해 대체될 수 있는 직쇄형 또는 분지형 알킬 기, 예를 들어 (비제한적인 예) C₁-C₃-할로알킬, 예컨대 클로로메틸, 브로모메틸, 디클로로메틸, 트리클로로메틸, 플루오로메틸, 디플루오로메틸, 트리플루오로메틸, 클로로플루오로메틸, 디클로로플루오로메틸, 클로로디플루오로메틸, 1-클로로에틸, 1-브로모에틸, 1-플루오로에틸, 2-플루오로에틸, 2,2-디플루오로에틸, 2,2,2-트리플루오로에틸, 2-클로로-2-플루오로에틸, 2-클로로-2,2-디플루오로에틸, 2,2-디클로로-2-플루오로에틸, 2,2,2-트리클로로에틸, 펜타플루오로에틸 및 1,1,1-트리플루오로프로프-2-일. 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 할로알킬, 예를 들어 할로알킬아미노알킬 등에 적용된다.
- [0208] 할로알케닐 및 할로알키닐은, 알킬 기 대신에 알케닐 및 알키닐 기가 치환기의 일부로서 존재하는 것을 제외하고 할로알킬에 유사하게 정의된다.
- [0209] 할로알콕시: 1 내지 8개, 바람직하게는 1 내지 6개, 보다 바람직하게는 1 내지 3개의 탄소 원자를 갖고 (상기 명시된 바와 같음), 여기서 이들 기에서 수소 원자의 일부 또는 전부는 상기 명시된 바와 같은 할로겐 원자에 의해 대체될 수 있는 직쇄형 또는 분지형 알콕시 기, 예를 들어 (비제한적인 예) C₁-C₃-할로알콕시, 예컨대 클로로메톡시, 브로모메톡시, 디클로로메톡시, 트리클로로메톡시, 플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 클로로플루오로메톡시, 디클로로플루오로메톡시, 클로로디플루오로메톡시, 1-클로로에톡시, 1-브로모에톡시, 1-플루오로에톡시, 2-플루오로에톡시, 2,2-디플루오로에톡시, 2,2,2-트리플루오로에톡시, 2-클로로-2-플루오로에톡시, 2-클로로-2,2-디플루오로에톡시, 2,2-디클로로-2-플루오로에톡시, 2,2,2-트리클로로에톡시, 펜타플루오로에톡시 및 1,1,1-트리플루오로프로프-2-옥시. 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 할로알콕시, 예를 들어 할로알콕시알킬 등에 적용된다.
- [0210] 할로알킬티오: 1 내지 8개, 바람직하게는 1 내지 6개, 보다 바람직하게는 1 내지 3개의 탄소 원자를 갖고 (상기 명시된 바와 같음), 이들 기에서 수소 원자의 일부 또는 전부가 상기 명시된 바와 같은 할로겐 원자에 의해 대체될 수 있는 직쇄형 또는 분지형 알킬티오 기, 예를 들어 (비제한적인 예) C₁-C₃-할로알킬티오, 예컨대 클로로메틸티오, 브로모메틸티오, 디클로로메틸티오, 트리클로로메틸티오, 플루오로메틸티오, 디플루오로메틸티오, 트리플루오로메틸티오, 클로로플루오로메틸티오, 디클로로플루오로메틸티오, 클로로디플루오로메틸티오, 1-클로로에틸티오, 1-브로모에틸티오, 1-플루오로에틸티오, 2-플루오로에틸티오, 2,2-디플루오로에틸티오, 2,2,2-트리플루오로에틸티오, 2-클로로-2-플루오로에틸티오, 2-클로로-2,2-디플루오로에틸티오, 2,2-디클로로-2-플루오로에틸티오, 2,2,2-트리클로로에틸티오, 펜타플루오로에틸티오 및 1,1,1-트리플루오로프로프-2-일티오. 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 할로알킬티오, 예를 들어 할로알킬티오알킬 등에 적용된다.
- [0211] 헤테로아릴: 산소, 질소 및 황의 군으로부터의 1 내지 4개의 헤테로원자를 함유하는 5 또는 6-원, 완전 불포화 모노시클릭 고리계; 고리가 1개보다 많은 산소 원자를 함유할 경우, 이들은 직접 이웃하지 않는다.
- [0212] 1 내지 4개의 질소 원자 또는 1 내지 3개의 질소 원자 및 1개의 황 또는 산소 원자를 함유하는 5-원 헤테로아릴: 탄소 원자 이외에 1 내지 4개의 질소 원자 또는 1 내지 3개의 질소 원자 및 1개의 황 또는 산소 원자를 고리원으로서 함유할 수 있는 5-원 헤테로아릴 고리 기, 예를 들어 (비제한적인 예) 2-푸릴, 3-푸릴, 2-티에닐, 3-티에닐, 2-피롤릴, 3-피롤릴, 3-이속사졸릴, 4-이속사졸릴, 5-이속사졸릴, 3-이소티아졸릴, 4-이소티아졸릴, 5-이소티아졸릴, 3-피라졸릴, 4-피라졸릴, 5-피라졸릴, 2-옥사졸릴, 4-옥사졸릴, 5-옥사졸릴, 2-티아졸릴, 4-티아졸릴, 5-티아졸릴, 2-이미다졸릴, 4-이미다졸릴, 1,2,4-옥사디아졸-3-일, 1,2,4-옥사디아졸-

5-일, 1,2,4-티아디아졸-3-일, 1,2,4-티아디아졸-5-일, 1,2,4-트리아졸-3-일, 1,3,4-옥사디아졸-2-일, 1,3,4-티아디아졸-2-일 및 1,3,4-트리아졸-2-일.

[0213] 1 내지 4개의 질소 원자를 함유하는 질소-결합된 5-원 헤테로아릴 또는 1 내지 3개의 질소 원자를 함유하는 벤조융합된 질소-결합된 5-원 헤테로아릴: 탄소 원자 이외에, 1 내지 4개의 질소 원자 또는 1 내지 3개의 질소 원자를 고리원으로서 함유할 수 있으며 2개의 이웃하는 탄소 고리원 또는 1개의 질소 및 1개의 이웃하는 탄소 고리원이 1 또는 2개의 탄소 원자가 질소 원자에 의해 대체될 수 있는 부타-1,3-디엔-1,4-디일 기에 의하여 가교될 수 있으며, 여기서 이들 고리는 질소 고리원 중 하나를 경유하여 골격에 결합되는 5-원 헤테로아릴 고리 기, 예를 들어 (비제한적인 예) 1-피롤릴, 1-피라졸릴, 1,2,4-트리아졸-1-일, 1-이미다졸릴, 1,2,3-트리아졸-1-일 및 1,3,4-트리아졸-1-일.

[0214] 1 내지 4개의 질소 원자를 함유하는 6-원 헤테로아릴: 탄소 원자 이외에, 1 내지 3개의 또는 1 내지 4개의 질소 원자를 함유할 수 있는 6-원 헤테로아릴 고리 기, 예를 들어 (비제한적인 예) 2-피리디닐, 3-피리디닐, 4-피리디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐, 2-피리미디닐, 4-피리미디닐, 5-피리미디닐, 2-피라지닐, 1,3,5-트리아진-2-일, 1,2,4-트리아진-3-일 및 1,2,4,5-테트라진-3-일.

[0215] 1 내지 3개의 질소 원자 또는 1개의 질소 원자 및 1개의 산소 또는 황 원자를 함유하는 벤조융합된 5-원 헤테로아릴: 예를 들어 (비제한적인 예) 인돌-1-일, 인돌-2-일, 인돌-3-일, 인돌-4-일, 인돌-5-일, 인돌-6-일, 인돌-7-일, 벤즈이미다졸-1-일, 벤즈이미다졸-2-일, 벤즈이미다졸-4-일, 벤즈이미다졸-5-일, 인다졸-1-일, 인다졸-3-일, 인다졸-4-일, 인다졸-5-일, 인다졸-6-일, 인다졸-7-일, 인다졸-2-일, 1-벤조푸란-2-일, 1-벤조푸란-3-일, 1-벤조푸란-4-일, 1-벤조푸란-5-일, 1-벤조푸란-6-일, 1-벤조푸란-7-일, 1-벤조티오펜-2-일, 1-벤조티오펜-3-일, 1-벤조티오펜-4-일, 1-벤조티오펜-5-일, 1-벤조티오펜-6-일, 1-벤조티오펜-7-일, 1,3-벤조티아졸-2-일, 1,3-벤조티아졸-4-일, 1,3-벤조티아졸-5-일, 1,3-벤조티아졸-6-일, 1,3-벤조티아졸-7-일, 1,3-벤즈옥사졸-2-일, 1,3-벤즈옥사졸-4-일, 1,3-벤즈옥사졸-5-일, 1,3-벤즈옥사졸-6-일 및 1,3-벤즈옥사졸-7-일.

[0216] 1 내지 3개의 질소 원자를 함유하는 벤조융합된 6-원 헤테로아릴: 예를 들어 (비제한적인 예) 퀴놀린-2-일, 퀴놀린-3-일, 퀴놀린-4-일, 퀴놀린-5-일, 퀴놀린-6-일, 퀴놀린-7-일, 퀴놀린-8-일, 이소퀴놀린-1-일, 이소퀴놀린-3-일, 이소퀴놀린-4-일, 이소퀴놀린-5-일, 이소퀴놀린-6-일, 이소퀴놀린-7-일 및 이소퀴놀린-8-일.

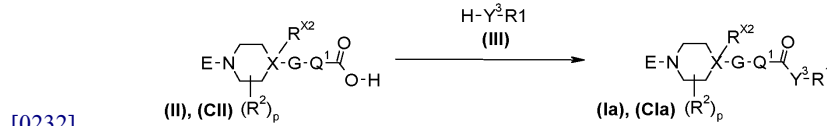
[0217] 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 헤테로아릴, 예를 들어 헤테로아릴알킬 등에 적용된다.

[0218] 헤테로시클릴: 산소, 질소 및 황의 군으로부터의 1 내지 4개의 헤테로원자를 함유하는 3- 내지 15-원, 바람직하게는 3- 내지 9-원, 포화 또는 부분 불포화 헤테로사이클: 탄소 고리원 이외에, 1 내지 3개의 질소 원자 및/또는 1개의 산소 또는 황 원자 또는 1 또는 2개의 산소 및/또는 황 원자를 함유하며; 고리가 1개보다 많은 산소 원자를 함유하는 경우, 이들은 직접 이웃하지 않는 모노, 비- 또는 트리시클릭 헤테로사이클: 예를 들어 (비제한적인 예) 옥시라닐, 아지리디닐, 2-테트라히드로푸라닐, 3-테트라히드로푸라닐, 2-테트라히드로티에닐, 3-테트라히드로티에닐, 2-피롤리디닐, 3-피롤리디닐, 3-이속사졸리디닐, 4-이속사졸리디닐, 5-이속사졸리디닐, 3-이소티아졸리디닐, 4-이소티아졸리디닐, 5-이소티아졸리디닐, 3-피라졸리디닐, 4-피라졸리디닐, 5-피라졸리디닐, 2-옥사졸리디닐, 4-옥사졸리디닐, 5-옥사졸리디닐, 2-티아졸리디닐, 4-티아졸리디닐, 5-티아졸리디닐, 2-이미다졸리디닐, 4-이미다졸리디닐, 1,2,4-옥사디아졸리딘-3-일, 1,2,4-옥사디아졸리딘-5-일, 1,2,4-티아디아졸리딘-3-일, 1,2,4-티아디아졸리딘-5-일, 1,2,4-트리아졸리딘-3-일, 1,3,4-옥사디아졸리딘-2-일, 1,3,4-티아디아졸리딘-2-일, 1,3,4-트리아졸리딘-2-일, 2,3-디히드로푸르-2-일, 2,3-디히드로푸르-3-일, 2,4-디히드로푸르-2-일, 2,4-디히드로푸르-3-일, 2,3-디히드로티엔-2-일, 2,3-디히드로티엔-3-일, 2,4-디히드로티엔-2-일, 2,4-디히드로티엔-3-일, 2-피롤린-2-일, 2-피롤린-3-일, 3-피롤린-2-일, 3-피롤린-3-일, 2-이속사졸린-3-일, 3-이속사졸린-3-일, 4-이속사졸린-3-일, 2-이속사졸린-4-일, 3-이속사졸린-4-일, 4-이속사졸린-4-일, 2-이속사졸린-5-일, 3-이속사졸린-5-일, 4-이속사졸린-5-일, 2-이소티아졸린-3-일, 3-이소티아졸린-3-일, 4-이소티아졸린-3-일, 2-이소티아졸린-4-일, 3-이소티아졸린-4-일, 4-이소티아졸린-4-일, 2-이소티아졸린-5-일, 3-이소티아졸린-5-일, 4-이소티아졸린-5-일, 2,3-디히드로피라졸-1-일, 2,3-디히드로피라졸-2-일, 2,3-디히드로피라졸-3-일, 2,3-디히드로피라졸-4-일, 2,3-디히드로피라졸-5-일, 3,4-디히드로피라졸-1-일, 3,4-디히드로피라졸-3-일, 3,4-디히드로피라졸-4-일, 3,4-디히드로피라졸-5-일, 4,5-디히드로피라졸-1-일, 4,5-디히드로피라졸-3-일, 4,5-디히드로피라졸-4-일, 4,5-디히드로피라졸-5-일, 2,3-디히드로옥사졸-2-일, 2,3-디히드로옥사졸-3-일, 2,3-디히드로옥사졸-4-일, 2,3-디히드로옥사졸-5-일, 3,4-디히드로옥사졸-2-일, 3,4-디히드로옥사졸-3-일, 3,4-디히드로옥사졸-4-일, 3,4-디히드로옥사졸-5-일, 3,4-디히드로옥사졸-2-일, 3,4-디히드로옥사졸-3-일, 3,4-

디히드로옥사졸-4-일, 2-피페리디닐, 3-피페리디닐, 4-피페리디닐, 1,3-디옥산-5-일, 2-테트라히드로피라닐, 4-테트라히드로피라닐, 2-테트라히드로티에닐, 3-헥사히드로피리다지닐, 4-헥사히드로피리다지닐, 2-헥사히드로피리미디닐, 4-헥사히드로피리미디닐, 5-헥사히드로피리미디닐, 2-피페라지닐, 1,3,5-헥사히드로트리아진-2-일 및 1,2,4-헥사히드로트리아진-3-일. 이러한 정의는 또한 다른 방식으로 정의되지 않는 한 복합 치환기의 일부로서 헤테로시클릴, 예를 들어 헤테로시클릴알킬 등에 적용된다.

- [0219] 이탈기: S_N1 또는 S_N2 이탈기, 예를 들어 염소, 브로민, 아이오딘, 알킬술포네이트 (-OSO₂-알킬, 예 -OSO₂CH₃, -OSO₂CF₃) 또는 아릴술포네이트 (-OSO₂-아릴, 예 -OSO₂Ph, -OSO₂PhMe).
- [0220] 자연의 법칙에 위배되며 그리하여 당업자가 그의 전문 지식에 기초하여 배제시킨 조합은 포함되지 않는다. 예를 들어 3개 이상의 이웃하는 산소 원자를 갖는 고리 구조는 제외한다.
- [0221] 제조 방법 및 중간체의 설명
- [0222] 화학식 I의 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체는 상이한 방식으로 생성될 수 있다. 우선, 가능한 공정을 하기에 개략적으로 제시한다. 달리 나타내지 않는 한, 명시한 라디칼은 각각 상기 정의한 바와 같다.
- [0223] 화학식 I의 화합물을 생성하기 위한 본 발명에 따른 방법은 1종 이상의 반응 보조제를 사용하여 임의로 실시된다.
- [0224] 유용한 반응 보조제는 필요한 경우 무기 또는 유기 염기 또는 산 수용체이다. 이의 예로는 바람직하게는 알칼리 금속 또는 알칼리 토금속 아세트산염, 아마이드, 탄산염, 수소탄산염, 수소화물, 수산화물 또는 알콕시드, 예를 들어 아세트산나트륨, 아세트산칼륨 또는 아세트산칼슘, 리튬 아마이드, 나트륨 아마이드, 칼륨 아마이드 또는 칼슘 아마이드, 탄산나트륨, 탄산칼륨 또는 탄산칼슘, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨 또는 탄산수소칼슘, 수소화리튬, 수소화나트륨, 수소화칼륨 또는 수소화칼슘, 수산화리튬, 수산화나트륨, 수산화칼륨 또는 수산화칼슘, 나트륨 메톡시드, 에톡시드, n- 또는 i-프로폭시드, n-, i-, s- 또는 t-부톡시드 또는 칼륨 메톡시드, 에톡시드, n- 또는 i-프로폭시드, n-, i-, s- 또는 t-부톡시드; 및 또한 염기성 유기 질소 화합물, 예를 들어 트리메틸아민, 트리에틸아민, 트리프로필아민, 트리부틸아민, 에틸디이소프로필아민, N,N-디메틸시클로헥실아민, 디시클로헥실아민, 에틸디시클로헥실아민, N,N-디메틸아닐린, N,N-디메틸벤질아민, 피리딘, 2-메틸-, 3-메틸-, 4-메틸-, 2,4-디메틸-, 2,6-디메틸-, 3,4-디메틸- 및 3,5-디메틸피리딘, 5-에틸-2-메틸피리딘, 4-디메틸아미노피리딘, N-메틸피페리딘, 1,4-디아자비시클로[2.2.2]-옥탄(DABCO), 1,5-디아자비시클로[4.3.0]-논-5-엔(DBN) 또는 1,8-디아자비시클로[5.4.0]-운데크-7-엔(DBU)을 들 수 있다.
- [0225] 본 발명에 따른 방법은 1종 이상의 희석제를 사용하여 임의로 실시된다. 희석제의 유용한 예로는 실질적으로 모든 불활성 유기 용매를 들 수 있다. 이들의 예로는 바람직하게는 지방족 및 방향족, 임의로 할로겐화된 탄화수소, 예컨대 펜탄, 헥산, 헵탄, 시클로헥산, 석유 에테르, 벤진, 리그로인, 벤젠, 톨루엔, 크실렌, 염화메틸렌, 염화에틸렌, 클로로포름, 사염화탄소, 클로로벤젠 및 o-디클로로벤젠, 에테르, 예컨대 디에틸 에테르 및 디부틸 에테르, 글리콜 디메틸 에테르 및 디글리콜 디메틸 에테르, 테트라히드로푸란 및 디옥산, 케톤, 예컨대 아세톤, 메틸 에틸 케톤, 메틸 이소프로필 케톤 및 메틸 이소부틸 케톤, 에스테르, 예컨대 메틸 아세테이트 및 에틸 아세테이트, 니트릴, 예를 들어 아세토니트릴 및 프로피오니트릴, 아마이드, 예를 들어 디메틸포름아미드, 디메틸아세트아미드 및 N-메틸피롤리돈, 및 또한 디메틸 술포시드, 테트라메틸렌술포 및 헥사메틸포스포르아미드 및 DMPU를 들 수 있다.
- [0226] 본 발명에 따른 방법에서 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변경될 수 있다. 일반적으로, 사용되는 온도는 0°C 내지 250°C, 바람직하게는 10°C 내지 185°C이다.
- [0227] 반응 시간은 반응의 규모 및 반응 온도를 기준으로 하여 변경되지만, 일반적으로는 수분 내지 48 시간이다.
- [0228] 본 발명에 따른 방법은 일반적으로 표준 압력하에서 실시된다. 그러나, 또한 고압 또는 감압 하에서 실시될 수 있다.
- [0229] 본 발명에 따른 방법의 실시의 경우, 각 경우에서 요구되는 출발 물질은 일반적으로 대략 등몰량으로 사용된다. 그러나, 각 경우에서 사용된 성분 중 하나는 비교적 큰 과잉량으로 사용될 수 있다.
- [0230] 공정 A

[0231] 반응식 1: 공정 A



[0233] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있음)

[0234] 해당 화합물 (II) 및 (CII)로부터 화학식 Ia 및 화학식 CIa의 화합물을 생성하는 한 방법을 반응식 1에 제시한다. E가 A-L¹(Y¹)인 경우, 화합물은 화학식 II 또는 화학식 Ia의 화합물이다. E가 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐인 경우, 화합물은 화학식 CII 또는 화학식 CIa의 화합물이다.

[0235] 화학식 Ia 및 화학식 CIa의 화합물은 문헌 (예, [Tetrahedron, 2005, 61, 10827-10852])으로부터 공지된 방법과 유사하게 커플링제의 존재 하에 화학식 III의 기재를 사용하여 해당 화합물 (II) 및 (CII)로부터 합성될 수 있다.

[0236] 커플링 시약의 적절한 예로는 펩티드 커플링 시약, 예를 들어 4-디메틸아미노피리딘과 혼합된 N-(3-디메틸아미노프로필)-N'-에틸카르보디이미드, 0-(7-아자벤조트리아졸-1-일)-N,N,N',N'-테트라메틸우로늄 헥사플루오로포스페이트, 브로모트리피롤리디노포스포늄 헥사플루오로포스페이트, 1-히드록시벤조트리아졸과 혼합된 N-(3-디메틸아미노프로필)-N'-에틸카르보디이미드 등을 들 수 있다.

[0237] 적절하게는, 염기, 예를 들어 트리에틸아민 또는 후니그(Huenig) 염기를 반응에 사용할 수 있다.

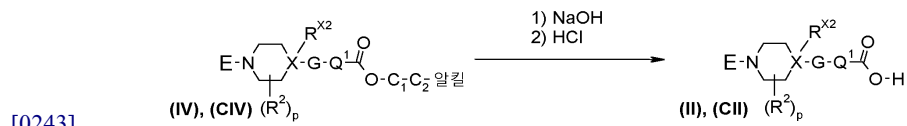
[0238] 대안적으로, 화학식 Ia의 화합물은 또한 임의로 산 스캐빈저/염기의 존재 하에 문헌 (예, [Tetrahedron, 2005, 61, 10827-10852])에 공지된 방법을 사용하는 2-단계 전환에 의하여 화학식 II의 화합물로부터 진행하여 합성될 수 있다. 통상적으로, 화학식 II 또는 화학식 CII의 화합물을 우선 해당 산 할로젠화물 또는 술포네이트로 전환시킨 후, 화학식 III의 기재와의 커플링 반응을 실시한다.

[0239] 화학식 III의 기재는 시판중이거나, 또는 문헌 (예를 들어 ["The Chemistry of Functional groups"; "The Chemistry of the Thiol Group"; John Wiley & Sons, 1974, 163-269; "The Chemistry of Functional groups"; "Supplement F2: The Chemistry of amino, nitroso, nitro and related groups"; John Wiley & Sons; "Science of Synthesis"; "Alcohols", Volume 36, Thieme, 2008; "Science of Synthesis"; "Amines and Ammonium Salts", Volume 40a, Thieme, 2008])에 기재된 방법에 의하여 생성할 수 있다.

[0240] 반응이 종료된 후, 화합물 (Ia) 및 (CIa)은 통상의 분리 기법 중 하나에 의하여 반응 혼합물로부터 분리된다. 필요한 경우, 화합물은 재결정, 증류 또는 크로마토그래피에 의하여 정제되거나 또는 임의로 또한 사전 정제 없이 그 다음 단계에 사용될 수 있다.

[0241] 공정 B

[0242] 반응식 2: 공정 B



[0244] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있음).

[0245] 해당 화합물 (IV) 및 (CIV)로부터 중간체 (II) 및 (CII)를 생성하는 한 방법은 반응식 2에 제시한다. E가 A-L¹(Y¹)인 경우, 화합물은 화학식 IV 또는 화학식 CIV의 화합물이다. E가 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐인 경우, 화합물은 화학식 CIV 또는 화학식 CII의 화합물이다.

[0246] 화학식 II 및 화학식 CII의 카르복실산은 화학식 IV 및 화학식 CIV의 해당 C₁-C₂-알킬 에스테르의 가수분해에 의하여 생성될 수 있다. 예를 들어 W02007/014290에 기재된 방법을 사용할 수 있다.

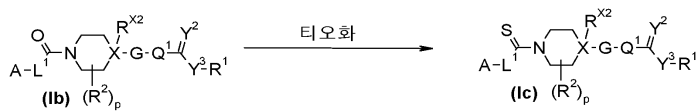
[0247] 사용된 용매는 반응 조건 하에 불활성인 모든 통상의 용매, 예를 들어 알콜 (예, 메탄올, 에탄올, 프로판올), 시클릭 및 비-시클릭 에테르 (예를 들어 디에틸 에테르, 테트라히드로푸란, 디옥산), 방향족 탄화수소 (예, 벤젠, 톨루엔, 크실렌), 할로겐화 탄화수소 (예, 디클로로메탄, 클로로포름, 사염화탄소) 및 할로겐화 방향족 탄화수소 (예, 클로로벤젠, 디클로로벤젠)일 수 있거나 또는 반응은 이들 용매 중 2종 이상의 혼합물 중에서 실시될 수 있다.

[0248] 적절한 알칼리 금속 수산화물은 예를 들어 에스테르의 용해를 단순화하기 위하여 일반적으로 공용매, 바람직하게는 THF 및/또는 메탄올과 함께 물의 존재 하에 LiOH, NaOH 또는 KOH이다. 출발 물질 및 알칼리 금속 수산화물을 등몰량으로 사용하지만, 알칼리 금속 수산화물은 필요한 경우 또한 과잉량으로 사용될 수 있다. 형성된 카르복실레이트 염은 약간 과잉량의 미네랄 산, 예를 들어 염산 또는 황산으로 처리하여 유리 산으로 전환된다.

[0249] 반응이 완료된 후, 화합물 (II) 및 (CII)은 통상의 분리 기법 중 하나에 의하여 반응 혼합물로부터 분리된다. 필요한 경우, 화합물은 재결정화, 증류 또는 크로마토그래피에 의하여 정제된다.

[0250] 공정 C

[0251] 반응식 3: 공정 C



[0252] 해당 화합물 (Ib)로부터 화학식 Ic의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 3에 제시한다.

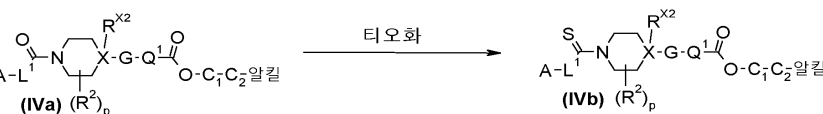
[0253] 본 발명에 따른 공정 E (반응식 5; Y¹=O)의 실시로 얻은 아미드 (Ib)는 해당 티오아미드 (Ic)로 문헌에 기재된 방법에 의하여 전환될 수 있다 (예, 문헌 [Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 2009, 19(2), 462-468]). 이는 화학식 Ib의 화합물을 통상적으로 오황화인 또는 2,4-비스(4-메톡시페닐)-1,3-디티아-2,4-디포스펜탄 2,4-디설피드 (로손(Lawesson's) 시약)와 반응시키는 것을 포함한다.

[0254] 본 발명에 따른 공정 C는 바람직하게는 1종 이상의 희석제를 사용하여 실시된다. 바람직한 용매는 톨루엔, 테트라히드로푸란 및 1,2-디메톡시에탄이다.

[0255] 반응이 완료된 후, 화합물 (Ic)은 통상의 분리 기법 중 하나에 의하여 반응 혼합물로부터 분리한다. 필요한 경우, 화합물은 재결정화 또는 크로마토그래피에 의하여 정제한다.

[0256] 공정 D

[0257] 반응식 4: 공정 D

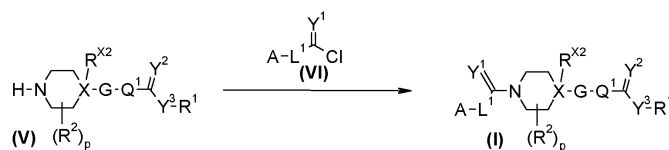


[0258] 해당 화합물 (IVa)로부터 화학식 IVb의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 4에 제시한다.

[0259] 반응식 3에 이미 기재된 바와 동일한 공정 (공정 C)을 사용한다.

[0260] 공정 E

[0261] 반응식 5: 공정 E



[0262] 공정 E는 산 염화물 (VI)과 화학식 V의 아민의 반응에 의하여 화학식 I의 화합물의 제조가 기재되어 있다. 마찬가지로, 출발 물질로서 아민 (V)의 염, 통상적으로 해당 염산염, 옥살산염 또는 트리플루오로아세트산염을 사용할 수 있다.

[0266] 본 발명에 따른 공정 E의 실시의 경우에서 얻은 아미드 (I)(Y¹=O)는 문헌에 기재된 방법에 의하여 해당 티오아미드로 전환시킬 수 있다 (예, 문헌 [Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (2009), 19(2), 462-468]). 이는 화학식 I의 화합물을 통상적으로 오황화인 또는 2,4-비스(4-메톡시페닐)-1,3-디티아-2,4-디포스펜탄 2,4-디설피드 (로손 시약)로 반응시키는 것을 포함한다.

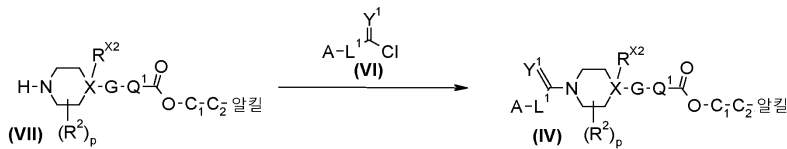
[0267] 본 발명에 따른 공정 E의 실시의 경우에서 사용된 염화카르보닐 (VI)은 해당 카르복실산 (VIII)으로부터 통상의 방법에 의하여 생성된다. 화학식 VIII의 카르복실산을 희석제 (예, 톨루엔 또는 염화메틸렌)의 존재 하에 염소화제 (예, 염화티오닐/염화옥살릴)와 반응시킨다. 염소화를 실시하기 위하여, 화학식 VIII의 화합물 1 몰당 일반적으로 0.5 내지 20 몰, 바람직하게는 1 내지 1.5 몰의 염소화제를 사용한다. 반응 시간은 1 내지 48 시간이다. 반응은 바람직하게는 보호 기체 대기, 예컨대 질소 또는 아르곤하에서 실시된다. 후처리는 통상의 방법에 의하여 실시된다.

[0268] 공정 E는 임의로 적절한 산 수용체의 존재 하에 실시된다. 유용한 산 수용체로는 모든 통상의 무기 또는 유기 염기를 들 수 있다. 이들은 바람직하게는 알칼리 토금속 또는 알칼리 금속의 수소화물, 수산화물, 아미드, 알콕시드, 아세트산염, 탄산염 또는 중탄산염, 예를 들어 수소화나트륨, 나트륨 아미드, 리튬 디이소프로필아미드, 나트륨 메톡시드, 나트륨 에톡시드, 칼륨 tert-부톡시드, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 아세트산나트륨, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소칼륨, 탄산수소나트륨 또는 탄산암모늄, 및 또한 3급 아민, 예컨대 트리메틸아민, 트리에틸아민, 트리부틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, N,N-디메틸아닐린, N,N-디메틸벤질아민, 피리딘, N-메틸피페리딘, N-메틸모르폴린, N,N-디메틸아미노피리딘, 디아자비스클로옥탄 (DABCO), 디아자비스클로노넨 (DBN) 또는 디아자비스클로운데센 (DBU) 및 또한 중합체-결합된 산 수용체, 예컨대 중합체-결합된 N,N-디이소프로필에틸아민 또는 중합체-결합된 N,N-디메틸아미노피리딘을 들 수 있다.

[0269] 반응은 바람직하게는 보호 기체 대기, 예컨대 질소 또는 아르곤하에서 실시된다. 후처리는 통상의 방법에 의하여 실시된다.

[0270] 공정 F

[0271] 반응식 6: 공정 F



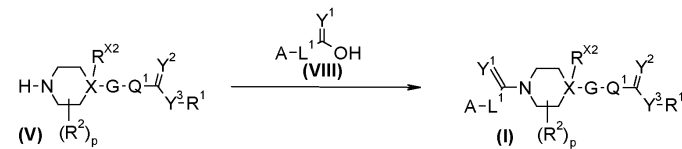
[0272]

[0273] 해당 화합물 (VII)로부터 화학식 IV의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 6에 제시한다.

[0274] 반응식 5에 이미 기재된 바와 동일한 공정 (공정 E)을 사용한다.

[0275] 공정 G

[0276] 반응식 7: 공정 G



[0277]

[0278] 공정 G에는 카르복실산 (VIII)과 화학식 V의 아민의 반응에 의한 화학식 I의 화합물의 제조가 기재되어 있다. 마찬가지로 출발 물질로서 아민 (V)의 염, 통상적으로 해당 염산염, 옥살산염 또는 트리플루오로아세트산염을 사용할 수 있다.

[0279] 본 발명에 따른 공정 G의 실시의 경우에서 얻은 아미드 (I)는 문헌에 기재된 방법에 의하여 해당 티오아미드로 전환시킬 수 있다 (예, [Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (2009), 19(2), 462-468; European Journal of Organic Chemistry (200), 19, 3273-3278]). 이는 화학식 I의 화합물을 통상적으로 오황화인 또는 2,4-비스(4-메톡시페닐)-1,3-디티아-2,4-디포스펜탄 2,4-디설피드 (로손 시약)와 반응시키는 것을 포함한다.

[0280] 본 발명에 따른 공정 G의 실시의 경우에 사용된 카르복실산 (VII)은 문헌에 기재된 방법에 의하여 생성될 수 있

다.

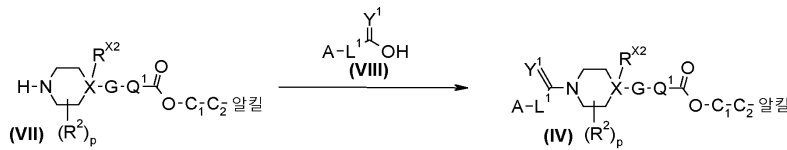
[0281] 적절한 커플링 시약으로는 모든 통상의 커플링 시약, 예를 들어 디시클로헥실카르보디이미드 (DCC), 1-(3-디메틸아미노프로필)-3-에틸카르보디이미드 염산염(EDC), 0-벤조트리아졸-1-일-N,N,N',N'-테트라메틸우로늄 헥사플루오로포스페이트(HBTU) 또는 중합체-결합된 시약, 예를 들어 중합체-결합된 시클로헥실카르보디이미드를 들 수 있다.

[0282] 공정 G는 임의로 적절한 산 수용체의 존재 하에 실시된다. 유용한 산 수용체로는 모든 통상의 무기 또는 유기 염기를 들 수 있다. 이는 바람직하게는 알칼리 토금속 또는 알칼리 금속의 수소화물, 수산화물, 아마이드, 알콕시드, 아세트산염, 탄산염 또는 중탄산염, 예를 들어 수소화나트륨, 나트륨 아마이드, 리튬 디이소프로필아미드, 나트륨 메톡시드, 나트륨 에톡시드, 칼륨 tert-부톡시드, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 아세트산나트륨, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소칼륨, 탄산수소나트륨 또는 탄산암모늄 및 또한 3급 아민, 예컨대 트리메틸아민, 트리에틸아민, 트리부틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, N,N-디메틸아닐린, N,N-디메틸벤질아민, 피리딘, N-메틸피페리딘, N-메틸모르폴린, N,N-디메틸아미노피리딘, 디아자비시클로옥탄(DABCO), 디아자비시클로노넨(DBN) 또는 디아자비시클로운데센(DBU) 및 또한 중합체-결합된 산 수용체, 예컨대 중합체-결합된 N,N-디이소프로필에틸아민 또는 중합체-결합된 N,N-디메틸아미노피리딘을 들 수 있다.

[0283] 본 발명에 따른 공정 G의 반응을 실시하기 위하여, 화학식 V의 화합물 1 몰당 화합물 (VIII) 일반적으로 0.5 내지 20 몰, 바람직하게는 1 내지 2 몰 및 산 수용체 0 내지 20 몰, 바람직하게는 1 내지 5 몰 및 또한 커플링제 1 내지 10 몰, 바람직하게는 1 내지 2 몰을 사용한다. 반응 시간은 1 내지 48 시간이다. 반응은 바람직하게는 보호 기체 대기, 예컨대 질소 또는 아르곤하에서 실시된다. 후처리는 통상의 방법에 의하여 실시된다.

[0284] 공정 H

[0285] 반응식 8: 공정 H



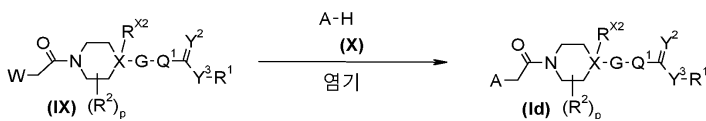
[0286]

[0287] 해당 화합물 (VII)로부터 화학식 IV의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 8에 제시한다.

[0288] 반응식 7에 이미 기재된 바와 동일한 공정 (공정 G)을 사용한다.

[0289] 공정 I

[0290] 반응식 9: 공정 I



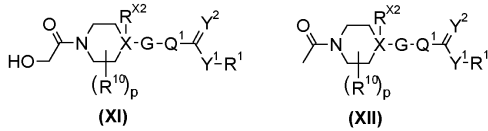
[0291]

[0292] (상기 식에서, A-H에서는 수소가 질소 원자에 결합되며, W는 이탈기임).

[0293] 해당 화합물 (IX) 및 화합물 (X)로부터 화학식 Id의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 9 (공정 I)에 제시한다.

[0294] W가 이탈기인 출발 물질 (IX)은 화합물 (XI), 화합물 (XII)(도 1)로부터 또는 화합물 (V)로부터 문헌에 기재된 방법에 의하여 생성될 수 있다 (예, 메실화: 문헌 [Organic Letters, 2003, 2539-2541]; 토실화: JP60156601; 할로겐화: 문헌 [Australian Journal of Chemistry, 1983, 2095-2110]). 통상적으로, 화학식 IX(W=염소)의 화합물은 화학식 V의 아마이드 및 염화클로로아세틸로부터 진행되어 생성된다. 하기 도 1에서의 화합물 (XI)은 화합물 (V)로부터 글리콜산 또는 염화히드록시아세틸을 사용하여 공정 G와 유사하게 생성된다 (예를 들어 W02007103187, W02006117521, 문헌 [Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 2007, 6326-6329] 참조).

[0295] 도 1



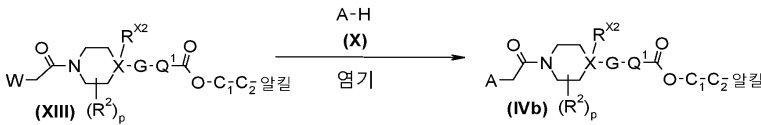
[0296]

[0297] 화학식 X의 출발 물질과 관련하여 1 당량 이상의 염기 (예, 수소화나트륨, 탄산칼륨)를 사용한다.

[0298] 반응이 완료된 후, 화합물 (Id)는 통상의 분리 기법 중 하나에 의하여 반응 혼합물로부터 분리한다. 필요한 경우, 화합물은 재결정화 또는 크로마토그래피에 의하여 정제하거나 또는, 원하는 경우 또한 사전 정제 없이 그 다음 단계에서 사용될 수 있다.

[0299] 공정 J

[0300] 반응식 10: 공정 J



[0301]

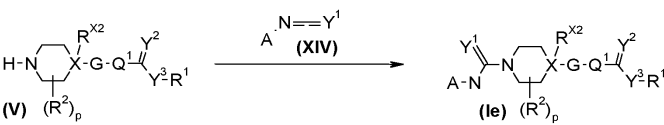
[0302] (상기 식에서, A-H에서는 수소가 질소 원자에 결합되며, W는 이탈기임).

[0303] 해당 화합물 (XIII)로부터 화학식 IVb의 화합물을 생성하는 한 방법은 공정 J (반응식 10)에 제시되어 있다.

[0304] 반응식 9에 이미 기재된 바와 동일한 공정 (공정 I)을 사용한다.

[0305] 공정 K

[0306] 반응식 11: 공정 K



[0307]

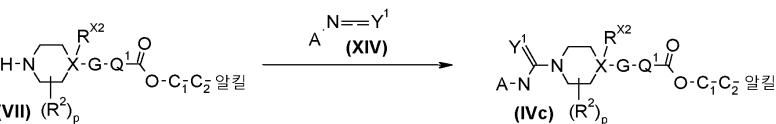
[0308] 화합물 (XIV)을 사용하여 해당 화합물 (V)로부터 화학식 Ie의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 11 (공정 K)에 제시되어 있다.

[0309] 화학식 Ie의 화합물은 해당 화학식 V의 화합물을 임의로 산 스캐빈저/염기, 예를 들어 트리에틸아민, 1,8-디아자비스클로[5.4.0]운데크-7-엔 또는 후니그 염기의 존재 하에 화학식 XIV의 기재와의 커플링 반응에 의하여 문헌 (예를 들어 W02009/055514 참조)에 기재된 방법과 유사하게 합성할 수 있다.

[0310] 반응이 완료된 후, 화합물 (Ie)은 통상의 분리 기법 중 하나에 의하여 반응 혼합물로부터 분리한다. 필요한 경우, 화합물은 재결정화 또는 크로마토그래피에 의하여 정제한다.

[0311] 공정 L

[0312] 반응식 12: 공정 L



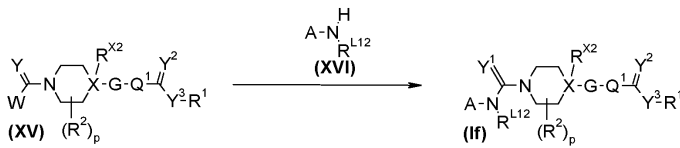
[0313]

[0314] 해당 화합물 (VII)로부터 화학식 IVc의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 12에 제시한다.

[0315] 반응식 11에 이미 기재된 바와 동일한 공정 (공정 K)을 사용한다.

[0316] 공정 M

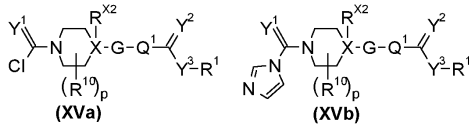
[0317] 반응식 13: 공정 M



[0318]

[0319] 해당 화합물 (XV)((XVa) 또는 (XVb) 하기 도 2 참조)과 화합물 (XVI)로부터 화학식 If의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 13 (공정 M)에 제시한다.

[0320] 도 2



[0321]

[0322] 출발 물질, 카르바모일 및 화학식 XVa의 염화티오카르바모일은 화합물 (V)로부터 문헌에 기재된 방법에 의하여 생성될 수 있다 (예, 문헌 [Tetrahedron, 2008, 7605]; [Journal of Organic Chemistry, 2004, 3787]; [Journal of Organic Chemistry, 1983, 4750]; [European Journal of Organic Chemistry, 2006, 1177]). 통상적으로, 화학식 XVa의 화합물은 화학식 V의 아민 및 포스젠, 티오포스젠 또는 그의 등가물로부터 진행하여 생성된다.

[0323] 대안의 출발 물질, 화학식 XVb의 카르바모일- 및 티오카르바모일이미다졸은 문헌에 기재된 방법에 의하여 생성될 수 있다 (예, 문헌 [Tetrahedron Letters, 2008, 5279]; [Tetrahedron, 2005, 7153] 참조). 통상적으로, 화학식 XVb의 화합물 (W는 이미다졸-1-일임)은 화학식 V의 아민 및 1,1'-카르보닐다이이미다졸 또는 1,1'-티오카르보닐다이이미다졸로부터 진행하여 생성된다.

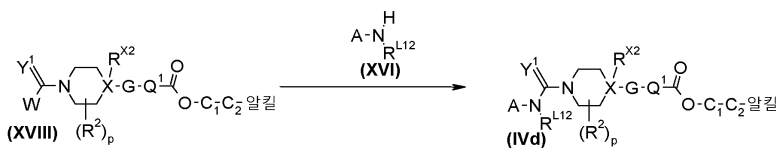
[0324] 공정 M은 임의로 적절한 산 수용체의 존재 하에 실시된다.

[0325] 본 발명에 따른 공정 M의 실시로 얻은 화합물 (If)은 대안적으로 일부의 경우에서 해당 산 염화물 [(If)-HCl]로서 산 수용체를 사용하지 않고 수득할 수 있다. 필요한 경우, 화합물 (If)은 통상의 방법에 의하여 방출된다.

[0326] 반응이 완료된 후, 화합물 (If)은 통상의 분리 기법 중 하나에 의하여 반응 혼합물로부터 분리한다. 필요한 경우, 화합물은 재결정화 또는 크로마토그래피에 의하여 정제한다.

[0327] 공정 N

[0328] 반응식 14: 공정 N



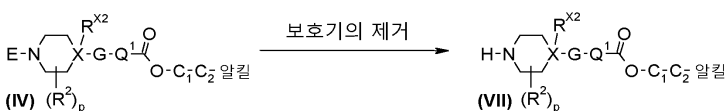
[0329]

[0330] 해당 화합물 (XVIII)로부터 화학식 IVd의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 14에 제시한다.

[0331] 반응식 13에 이미 기재된 바와 동일한 공정 (공정 M)을 사용한다.

[0332] 공정 O

[0333] 반응식 15: 공정 O



[0334]

[0335] (상기 식에서, E는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐임).

[0336] 해당 화합물 (IV)로부터 화학식 VII의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 15에 제시한다.

[0337] 화학식 IV의 화합물은 문헌에 기재된 보호기의 제거에 적절한 방법에 의하여 화학식 VII의 화합물로 전환된다 (문헌 ["Protective Groups in Organic Synthesis"; Third Edition; 494-653]).

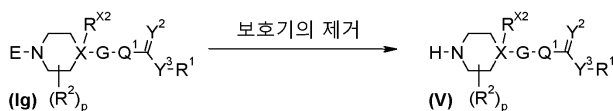
[0338] tert-부톡시카르보닐 및 벤질옥시카르보닐 보호기는 산성 매체 중에서 (예를 들어 염산 또는 트리플루오로아세트산을 사용하여) 제거될 수 있다. 아세틸 보호기는 염기성 조건 하에 (예를 들어 탄산칼륨 또는 탄산세슘을 사용하여) 제거될 수 있다. 벤질 보호기는 촉매 (예를 들어 활성탄상의 팔라듐)의 존재 하에 수소를 사용하여 가수소분해로 제거할 수 있다.

[0339] 이러한 반응의 경우 tert-부톡시카르보닐 및 벤질옥시카르보닐 기의 탈보호에 사용될 수 있는 산은 예를 들어 트리플루오로아세트산, 염산 또는, 문헌에 기재된 바와 같은 기타의 산을 들 수 있다 (예, 문헌 ["Protective Groups in Organic Synthesis"; Third Edition; pp. 494-653]).

[0340] 반응이 완료된 후, 화합물 (VII)은 통상의 분리 기법 중 하나에 의하여 반응 혼합물로부터 분리된다. 필요한 경우, 화합물은 재결정화, 증류 또는 크로마토그래피로 정제될 수 있거나 또는 원하는 경우 또한 사전 정제 없이 그 다음 단계에서 사용될 수 있다. 또한, 화학식 VII의 화합물을 염으로서, 예를 들어 염산 또는 트리플루오로아세트산의 염으로서 분리될 수 있다.

[0341] 공정 P

[0342] 반응식 16: 공정 P



[0343]

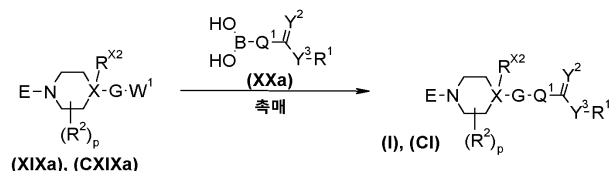
[0344] (상기 식에서, E는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐임).

[0345] 해당 화합물 (Ig)로부터 화학식 V의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 16에 제시한다.

[0346] 반응식 15에 이미 기재된 바와 동일한 공정 (공정 O)을 사용한다.

[0347] 공정 Q

[0348] 반응식 17: 공정 Q



[0349]

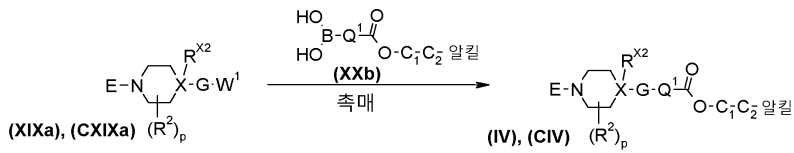
[0350] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있으며, W¹은 바람직한 결합을 형성하기에 적절한 관능기, 예를 들어 Br 또는 I를 나타냄).

[0351] 화학식 I 및 화학식 CI의 화합물은 일반적으로 해당 보론산 (XXa) 및 할로겐화물 (예, 아이오딘화물, 브로민화물)(XIXa) 또는 (CXIXa)로부터 진행될 수 있는 팔라듐-촉매화 Heck 반응에 의하여 공정 Q (반응식 17)에 따라 생성될 수 있다. 이러한 반응에는 다양한 촉매, 통상적으로 테트라키스(트리페닐포스핀)팔라듐(0)을 사용할 수 있다. 사용한 용매로는 예를 들어 테트라히드로푸란, 아세토니트릴, 디에틸 에테르 및 디옥산을 들 수 있다.

[0352] 스즈키(Suzuki) 반응 및 G-Q¹ 결합의 형성을 위한 관련 커플링 반응의 다양한 문헌의 예가 존재한다 (예, 문헌 [Tetrahedron, 2004, 60, 8991-9016]; [Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist, J. J. Li, G. W. Gribble, Elsevier, Oxford, 2000] 참조).

[0353] 공정 R

[0354] 반응식 18: 공정 R



[0355]

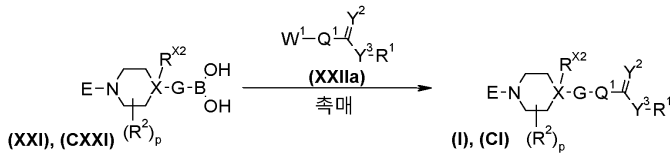
[0356] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있으며, W¹은 바람직한 결합을 형성하기에 적절한 관능기, 예를 들어 Br 또는 I를 나타냄).

[0357] 해당 화합물 (XIXa) 및 (CXIXa)로부터 화학식 IV 및 화학식 CIV의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 18에 제시한다.

[0358] 반응식 17에 이미 기재된 바와 동일한 공정 (공정 Q)을 사용한다.

[0359] 공정 S

[0360] 반응식 19: 공정 S



[0361]

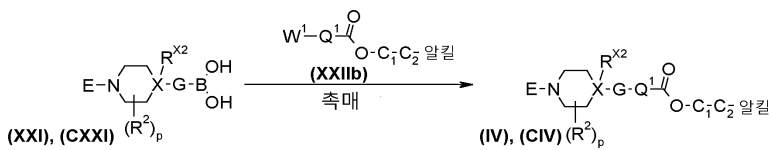
[0362] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있으며, W¹은 바람직한 결합을 형성하기에 적절한 관능기, 예를 들어 Br 또는 I를 나타냄).

[0363] 해당 화합물 (XXI) 및 (CXXI)로부터 화학식 I 및 화학식 CI의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 19에 제시한다.

[0364] 반응식 18에 이미 기재된 바와 동일한 공정 (공정 R)을 사용한다.

[0365] 공정 T

[0366] 반응식 20: 공정 T



[0367]

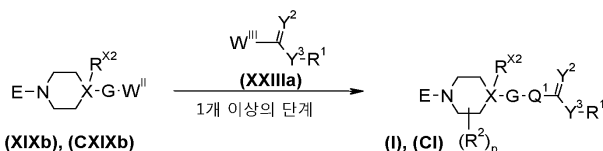
[0368] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있으며, W¹은 바람직한 결합을 형성하기에 적절한 관능기, 예를 들어 Br 또는 I를 나타냄).

[0369] 해당 화합물 (XXI) 및 (CXXI)로부터 화학식 IV 및 화학식 CIV의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 20에 제시한다.

[0370] 반응식 18에 이미 기재된 바와 동일한 공정 (공정 R)을 사용한다.

[0371] 공정 U

[0372] 반응식 21: 공정 U



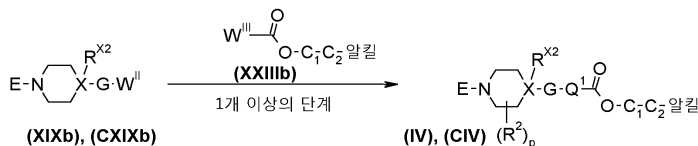
[0373]

[0374] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있으며, W^{II} 및 W^{III}은 바람직한 헤테로사이클의 형성에 적절한 관능기임).

[0375] 일반적으로, 적절한 관능기, W^{II} 및 W^{III}를 갖는 해당 화합물 (XIXb) 또는 (CXIXb) 및 화합물 (XXIIIa)로부터 화학식 I 및 화학식 CI의 화합물을 생성할 수 있다 (반응식 21, 공정 U 참조). W^{II} 및 W^{III}에 대한 가능한 관능기로는 예를 들어 적절한 반응 조건 하에 바람직한 헤테로사이클 Q¹을 형성할 수 있는 알데히드, 케톤, 에스테르, 카르복실산, 아마이드, 티오아미드, 니트릴, 아민, 알콜, 티올, 히드라진, 옥심, 아미딘, 아마이드 옥심, 올레핀, 아세틸렌, 할로젠화물, 알킬 할로젠화물, 메탄술포네이트, 트리플루오로메탄술포네이트, 보론산, 보로네이트 등을 들 수 있다. 헤테로사이클의 제조를 위한 다수의 문헌의 방법이 존재한다 (예, W02008/013622; W02008/013925; 문헌 [Comprehensive Heterocyclic Chemistry Vol. 4-6, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors, Pergamon Press, New York, 1984; Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, Vol 2-4, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. Scriven editors, Pergamon Press, New York, 1996; The Chemistry of Heterocyclic Compounds, E. C. Taylor, editor, Wiley, New York; Rodd's Chemistry of Carbon Compounds, Vol. 2-4, Elsevier, New York; Synthesis, 1982, 6, 508-509; Tetrahedron, 2000, 56, 1057-1094] 참조).

[0376] 공정 V

[0377] 반응식 22: 공정 V



[0378]

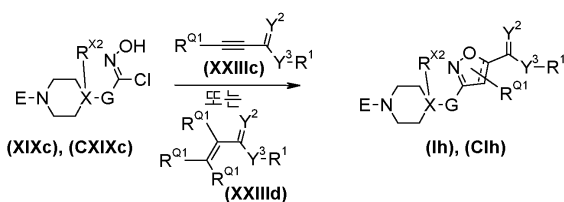
[0379] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있으며, W^{II} 및 W^{III}은 바람직한 헤테로사이클의 형성에 적절한 관능기임).

[0380] 해당 화합물 (XIXb) 및 (CXIXb)로부터 화학식 IV 및 화학식 CIV의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 22에 제시한다.

[0381] 반응식 21에 이미 기재된 바와 동일한 공정 (공정 U)을 사용한다.

[0382] 공정 W

[0383] 반응식 23: 공정 W



[0384]

[0385] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있음).

[0386] 반응식 23은 예를 들어 화학식 Ih 및 화학식 CIh의 이속사졸 및 이속사졸린이 해당 클로록심 (XIXc) 또는 (CXIXc) 및 화합물 (XXIIIc) 또는 (XXIIIId)로부터 생성될 수 있다는 것을 나타낸다.

[0387] 알켄 및 알킨 (XXIIIc) 및 (XXIIIId)은 시판중이거나 또는 문헌에 기재된 방법에 의하여 시판중인 전구체로부터 생성될 수 있다 (예, 문헌 [Hydrocarbon Processing, 1986, 65, 37-43; Science of Synthesis, Volume 43, Thieme, 2008]; [Science of Synthesis, Volume 47 a & b, Thieme, 2008] 참조).

[0388] 화학식 Ih 및 화학식 CIh의 화합물은 첨가고리화 반응에 의하여 화학식 XXIIIId의 알켄 또는 화학식 XXIIIc의 알킨 및 화합물 (XIXc) 또는 (CXIXc)로부터 수득한다 (예를 들어 W02008/013622 및 문헌 [Synthesis, 1987, 11,

998-1001] 참조).

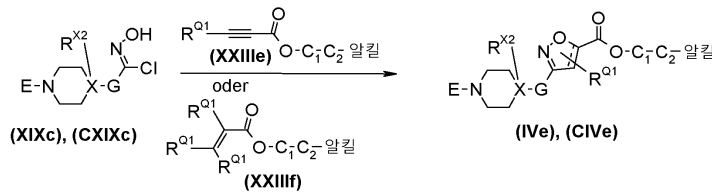
[0389] 공정 W는 적절한 염기의 존재 하에 실시된다. 바람직한 염기로는 3급 아민 (예, 트리에틸아민) 및 알칼리 금속 또는 알칼리 토금속 탄산염, 탄산수소염 및 인산염을 들 수 있다.

[0390] 공정 W는 바람직하게는 1종 이상의 희석제를 사용하여 실시된다. 공정 W의 실시에서, 불활성 유기 용매는 바람직한 선택이다 (예를 들어 톨루엔 및 헥산). 물도 마찬가지로 가능한 용매이다. 대안적으로, 공정 W는 과잉량의 알켄 (XXIIIId) 또는 알킨 (XXIIIC) 중에서 실시될 수 있다.

[0391] 후처리는 통상의 방법에 의하여 실시된다. 필요한 경우, 화합물은 재결정화, 증류 또는 크로마토그래피에 의하여 정제될 수 있거나 또는 임의로 또한 사전 정제 없이 다음 단계에 사용될 수 있다.

[0392] 공정 X

[0393] 반응식 24: 공정 X



[0394]

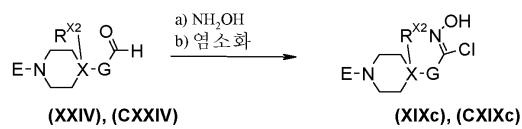
[0395] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있음).

[0396] 해당 화합물 (XIXc) 및 (CXIXc)로부터 화학식 IVe 및 화학식 CIVe의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 24에 제시한다.

[0397] 반응식 23에 이미 기재된 바와 동일한 공정 (공정 W)을 사용한다.

[0398] 공정 Y

[0399] 반응식 25: 공정 Y



[0400]

[0401] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있음).

[0402] 화합물 (XXIV) 및 (CXXIV)로부터 중간체 (XIXc) 및 (CXIXc)를 생성하는 한 방법은 반응식 25 (공정 Y)에 제시한다.

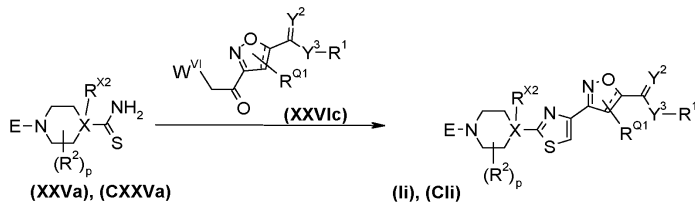
[0403] 화학식 XXIV 및 화학식 CXXIV의 일부 화합물은 문헌에 공지되어 있으며 공지의 방법에 의하여 생성될 수 있다 (예를 들어 W02008/013622; W02008/013925 참조).

[0404] 화학식 XIXc 및 화학식 CXIXc의 화합물은 히드록실아민을 사용하여 화학식 XXIV 또는 화학식 CXXIV의 알데히드를 축합시킨 후, 차후에 염소화시켜 수득한다 (예를 들어 W02005/0040159, W02008/013622 및 문헌 [Synthesis, 1987, 11, 998-1001] 참조).

[0405] 공정 Y에서, 알데히드 (XXIV) 또는 (CXXIV) 및 히드록실아민을 우선 반응시킨다 (단계 a). 그후, 해당 옥심을 적절한 염소화제의 존재 하에 염소화시킨다. 바람직한 염소화 시약으로는 N-클로로숙신이미드, HClO, NaClO 및 염소를 들 수 있다. 공정 Y의 단계 (a) 후, 반응 혼합물을 통상의 방법에 의하여 후처리 처리할 수 있거나 또는 단계 (b)에서 추가로 직접 전환시킬 수 있다.

[0406] 공정 Y는 바람직하게는 1종 이상의 희석제를 사용하여 실시한다. 본 발명에 따른 공정 Y의 단계 (a)에서, 용매로서 양성자성 용매, 예를 들어 에탄올을 사용하는 것이 바람직하다. 화합물 (XXIV) 또는 (CXXIV)로부터 해당 옥심의 형성후, 추가의 용매, 예를 들어 테트라히드로푸란을 사용하여 반응 혼합물을 단계 (b)에서 희석한 후, 수성 차아염소산나트륨을 첨가한다. 염소화는 마찬가지로 DMF 중의 N-클로로숙신이미드의 도움으로 실시할 수

[0420] 반응식 28: 공정 AB



[0421]

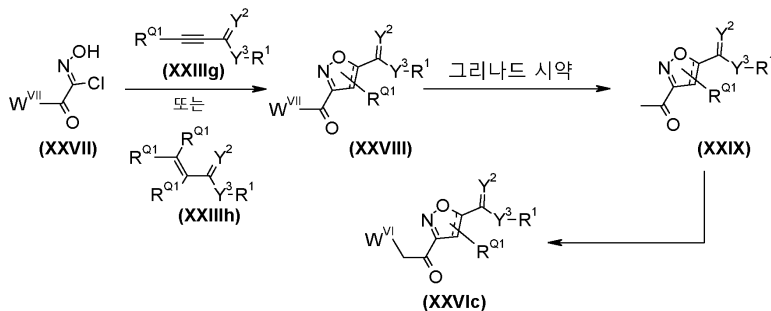
[0422] (상기 식에서, E는 $A-L^1(Y^1)$ 또는 아세틸, C_1-C_4 -알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있으며, W^{VI} 는 염소, 브로민, 아이오딘, 톨루엔술포닐옥시임).

[0423] 화합물 (XXVIc)을 사용하여 화합물 (XXVa) 및 (CXXVa)로부터 화학식 Ii 및 화학식 CIi의 화합물을 합성하는 특정한 방법은 반응식 28 (공정 AB)에 제시한다. E가 $A-L^1(Y^1)$ 일 때, 화합물은 화학식 XXVa 또는 화학식 Ii의 화합물이다. E가 아세틸, C_1-C_4 -알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐인 경우, 화합물은 화학식 CXXVa 또는 CIi의 화합물이다.

[0424] 티오카르복사미드 (XXVa) 및 (CXXVa)는 문헌에 공지된 방법에 의하여, 예를 들어 로손 시약 (W02008/013622, 문헌 [Org. Synth. Vol. 7, 1990, 372])을 사용하여 예를 들어 시판중인 해당 카르복사미드를 티오화시켜 수득할 수 있다.

[0425] α -할로 케톤(XXVIc) 또는 해당 등가물 (예, 톨루엔술포닐옥시)은 또한 문헌 (예를 들어 W02008/013622 참조) (도 3)에 공지된 방법에 의하여 수득할 수 있다

[0426] 도 3



[0427]

[0428] (상기 도 3에서, W^{VII} 는 N,N-디메틸아미노, N-메톡시-N-메틸아미노 또는 모르폴린-1-일임).

[0429] 티아졸 (I)은 티오카르복사미드 (XXVa) 또는 (CXXVa) 및 α -할로 케톤 또는 해당 등가물 (XXVIc)로부터 한츠 (Hantzsch) 티아졸 합성에 의하여 수득한다 (예를 들어 문헌 ["Comprehensive Heterocyclic Chemistry", Pergamon Press, 1984; vol. 6, pages 235-363], ["Comprehensive Heterocyclic Chemistry II", Pergamon Press, 1996; vol. 3, pages 373-474] 및 W007/014290 참조).

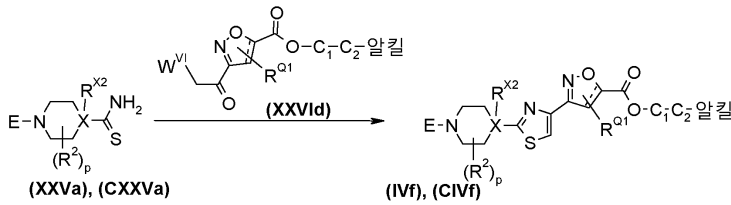
[0430] 공정 AB는 바람직하게는 1종 이상의 희석제를 사용하여 실시한다. 공정 AB의 실시에서, 불활성 유기 용매는 바람직한 선택이다 (예를 들어 N,N-디메틸포름아미드 및 에탄올).

[0431] 보조 염기, 예를 들어 트리에틸아민을 임의로 사용한다.

[0432] 필요한 경우, 화합물은 재결정화 또는 크로마토그래피에 의하여 정제하거나 또는, 임의로 또한 사전 정제 없이 다음 단계에 사용될 수 있다.

[0433] 공정 AC

[0434] 반응식 29: 공정 AC



[0435]

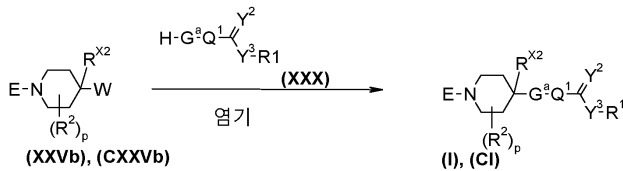
[0436] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있으며, W^{VI}는 염소, 브로민, 아이오딘, 톨루엔술포닐옥시임).

[0437] 해당 화합물 (XXVa) 및 (CXXVa)로부터 화학식 IVf 및 화학식 CIVf의 화합물을 생성하는 한 방법은 반응식 29에 제시한다.

[0438] 반응식 28에 이미 기재된 바와 동일한 공정 (공정 AB)을 사용한다.

[0439] 공정 AD

[0440] 반응식 30: 공정 AD



[0441]

[0442] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹) 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐일 수 있으며, W는 브로민, 아이오딘, 메틸술포닐옥시 또는 트리플루오로메틸술포닐옥시이고, G^a는 질소 원자를 통하여 결합된 피페리딘 라디칼임)

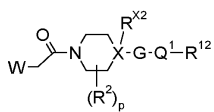
[0443] 화학식 I 및 화학식 CI의 화합물은 해당 화학식 XXVb 또는 화학식 CXXVb의 화합물을 임의로 염기의 존재 하에 화학식 XXX의 기재와의 커플링 반응에 의하여 문헌에 기재된 방법과 유사하게 합성할 수 있다 (반응식 30, 공정 AD) (예를 들어 Zn/Pd 커플링의 경우: WO2008/147831, WO2006/106423(피리딘), [Shakespeare, W. C. et al., Chem. Biol. Drug Design 2008, 71, 97-105](피리미딘 유도체), [Pasternak, A. et al., Bioorg. Med. Chem. Lett. 2008, 18, 994-998](디아진); [Coleridge, B. M.; Bello, C. S.; Leitner, A. Tetrahedron Lett. 2009, 50, 4475-4477]; [Bach, T., Heuser, S. Angew. Chem. Int. Ed. 2001, 40, 3184-3185](티아졸); 친핵성 치환의 경우: WO2008/104077; WO2006/084015 (N-치환을 갖는 피라졸) 참조).

[0444] 화학식 XXX의 출발 물질에 관하여 1 당량 이상의 염기 (예, 수소화나트륨, 탄산칼륨)를 사용한다.

[0445] 반응이 완료된 후, 화합물 (I) 및 (CI)은 통상의 분리 기법 중 하나에 의하여 반응 혼합물로부터 분리한다. 필요한 경우, 화합물은 재결정화 또는 크로마토그래피에 의하여 정제하거나 또는, 원하는 경우 또한 사전 정제 없이 그 다음 단계에서 사용될 수 있다.

[0446] 신규한 화합물은 하기 화학식 XXXI의 화합물, 그의 염, 금속 착물 및 N-옥시드이다:

[0447] <화학식 XXXI>



[0448]

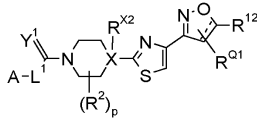
[0449] (상기 식에서, W는 이탈기이고, R¹²는 -C(=Y²)Y³-R¹ 또는 -C(=O)O-(C₁-C₂-알킬)이고, 부호 Y², Y³, Q¹, G, R^{X2}, R² 및 R¹은 상기 명시된 일반적인, 바람직한, 보다 바람직한 또는 가장 바람직한 정의를 가짐).

[0450] 바람직한 화합물 (XXXI)은 W가 염소, 브로민, 아이오딘, 메탄술포닐옥시 또는 톨루엔술포닐옥시인 화합물이다.

특히 바람직한 화합물 (XXXI)은 W가 염소인 화합물이다.

[0451] 신규한 화합물은 하기 화학식 XXXI의 화합물, 그의 염, 금속 착물 및 N-옥시드이다:

[0452] <화학식 XXXII>

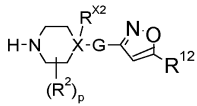


[0453]

[0454] (상기 식에서, A-L¹(Y¹)-은 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐이고, R¹²는 -C(=Y²)Y³-R¹ 또는 -C(=O)O-(C₁-C₂-알킬)이며, 부호 Y², Y³, R², R^{X2}, R⁰¹ 및 R¹은 상기 명시된 일반적인, 바람직한, 보다 바람직한 또는 가장 바람직한 정의를 가짐).

[0455] 신규한 화합물은 화학식 XXXIII의 화합물, 그의 염, 금속 착물 및 N-옥시드이다:

[0456] <XXXIII>

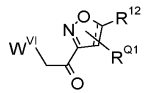


[0457]

[0458] (상기 식에서, R¹²는 -C(=Y²)Y³-R¹ 또는 -C(=O)O-(C₁-C₂-알킬)이고, 부호 X, R², R^{X2}, G, R¹, Y² 및 Y³은 상기 명시된 일반적인, 바람직한, 보다 바람직한 또는 가장 바람직한 정의를 가짐).

[0459] 신규한 화합물은 화학식 XXXIV의 화합물, 그의 염, 금속 착물 및 N-옥시드이다:

[0460] <화학식 XXXIV>

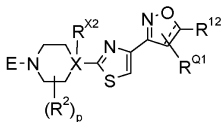


[0461]

[0462] (상기 식에서, R¹²는 -C(=Y²)Y³-R¹ 또는 -C(=O)O-(C₁-C₂-알킬)이고, W^{VI}는 염소, 브로민, 아이오딘, 툴루엔술포닐 옥시 또는 메탄술포닐옥시이며, 부호 Y², Y³, R⁰¹ 및 R¹은 상기 명시된 일반적인, 바람직한, 보다 바람직한 또는 가장 바람직한 정의를 가짐).

[0463] 신규한 화합물은 화학식 XXXV의 화합물, 그의 염, 금속 착물 및 N-옥시드이다:

[0464] <화학식 XXXV>

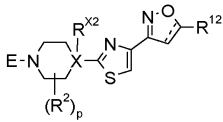


[0465]

[0466] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹)- 또는 아세틸, C₁-C₄-알콕시카르보닐, 벤질 또는 벤질옥시카르보닐이고, R¹²는 -C(=O)OH이며, 부호 A, L¹, Y¹, R², R^{X2} 및 R⁰¹은 상기 명시된 일반적인, 바람직한, 보다 바람직한 또는 가장 바람직한 정의를 가짐).

[0467] 신규한 화합물은 화학식 XXXVI의 화합물, 그의 염, 금속 착물 및 N-옥시드이다:

[0468] <화학식 XXXVI>

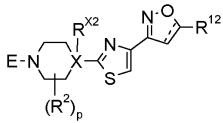


[0469]

[0470] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹)-이고, R¹²는 -C(=O)O-(C₁-C₂-알킬)이고, 단 R¹²가 -C(=O)OMe인 경우 E는 [5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에타노일이 아니어야 하며, 부호 A, L¹, Y¹ 및 R^{x2}는 상기 명시된 일반적인, 바람직한, 보다 바람직한 또는 가장 바람직한 정의를 가짐).

[0471] 신규한 화합물은 화학식 XXXVII의 화합물, 그의 염, 금속 착물 및 N-옥시드이다:

[0472] <화학식 XXXVII>

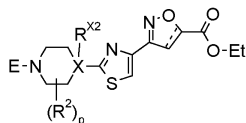


[0473]

[0474] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹)-이고, R¹²는 -C(=O)O-(C₁-C₂-알킬)이며, 단 R¹²가 -C(=O)OMe인 경우 E는 [3,5-비스(디플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에타노일이고, 부호 R² 및 R^{x2}는 상기 명시된 일반적인, 바람직한, 보다 바람직한 또는 가장 바람직한 정의를 가짐).

[0475] 신규한 화합물은 하기 화학식 XXXVIII의 화합물, 그의 염, 금속 착물 및 N-옥시드이다:

[0476] <화학식 XXXVIII>



[0477]

[0478] (상기 식에서, E는 A-L¹(Y¹)-이고, 부호 R² 및 R^{x2}는 상기 명시된 일반적인, 바람직한, 보다 바람직한 또는 가장 바람직한 정의를 가짐).

[0479] 추가로, 본 발명은 화학식 I의 화합물의 제조를 위한 화학식 XXXI, 화학식 XXXII, 화학식 XXXIII, 화학식 XXXIV, 화학식 XXXV, 화학식 XXXVI, 화학식 XXXVII 및/또는 화학식 XXXVIII의 화합물 1종 이상의 용도를 제공한다.

[0480] 추가로, 본 발명은 원치않는 미생물의 방제를 위한 본 발명의 화학식 I의 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체의 비-의학적 용도를 제공한다.

[0481] 추가로, 본 발명은 본 발명에 따른 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체 1종 이상을 포함하는, 원치않는 미생물의 방제용 조성물을 제공한다.

[0482] 또한, 본 발명은 본 발명의 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체를 미생물에 및/또는 그의 서식지내에 적용하는 것을 특징으로 하는 원치않는 미생물의 방제 방법에 관한 것이다.

[0483] 추가로, 본 발명은 1종 이상의 본 발명의 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체로 처리된 종자에 관한 것이다.

[0484] 마지막으로, 본 발명은 본 발명에 따른 1종 이상의 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체로 처리된 종자를 사용하여 원치않는 미생물로부터 보호하는 방법을 제공한다.

[0485] 본 발명의 물질은 작물 보호 또는 물질 보호에서 원치않는 미생물, 예를 들어 진균 및 박테리아를 방제하기 위하여 사용될 수 있다.

[0486] 본 발명의 화학식 I의 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체는 살진균성 성질이 매우 우수하며 작물 보호에서, 예를 들어 뿌리혹곰팡이류(Plasmodiophoromycetes), 난균류(Oomycetes), 호상균류(Chytridiomycetes), 접

합균류(Zygomycetes), 자낭균류(Ascomycetes), 담자균류(Basidiomycetes) 및 불완전균류(Deuteromycetes)의 방제에 사용될 수 있다.

- [0487] 살박테리아제는 작물 보호에서, 예를 들어 슈도모나다세아에(Pseudomonadaceae), 리조비아세아에(Rhizobiaceae), 엔테로박테리아세아에(Enterobacteriaceae), 코리네박테리아세아에(Corynebacteriaceae) 및 스트렙토마이세타세아에(Streptomycetaceae)의 방제에 사용될 수 있다.
- [0488] 본 발명의 살진균성 조성물은 식물병원성 진균의 치유적 또는 예방적 방제에 사용될 수 있다. 그러므로, 본 발명은 또한 종자, 식물 또는 식물 부분, 열매, 또는 식물이 자라고 있는 토양에 적용되는 본 발명의 활성 성분 또는 조성물의 사용에 의하여 식물병원성 진균을 치유적 또는 보호적으로 방제하는 방법에 관한 것이다.
- [0489] 작물 보호에서 식물병원성 진균을 방제하기 위한 본 발명의 조성물은 효과적이지만 비-식물독성 양의 본 발명의 활성 성분을 포함한다. "효과적이지만 비-식물독성 양"은 식물의 진균성 질병을 만족스러운 방식으로 방제하거나 또는 진균성 질병을 완전하게 근절하면서, 동시에 식물독성의 임의의 상당한 증상을 수반하지 않기에 충분한 본 발명의 조성물의 양을 의미한다. 일반적으로, 이러한 적용 비율은 비교적 넓은 범위내에서 변경될 수 있다. 이는 예를 들어 방제하고자 하는 진균, 식물, 기후 조건 및 본 발명의 조성물의 성분과 같은 다수 요인에 좌우된다.
- [0490] 본 발명에 따라 모든 식물 및 식물 부분을 처리할 수 있다. 여기서 식물은 예컨대 원하거나 원치않는 야생 식물 또는 작물 식물 (자연 발생 작물 식물 포함)과 같은 모든 식물 및 식물 집단을 의미하는 것으로 이해하여야 한다. 작물 식물은 식물 육종권자의 권리에 의하여 보호 가능한 그리고 보호 가능하지 않은 식물 품종 및 형질 전환(transgenic) 식물을 비롯한, 통상적인 육종 및 최적화 방법에 의하여, 생명공학 또는 유전자공학 방법에 의하여 또는 이들 방법의 조합에 의하여 얻을 수 있는 식물일 수 있다. 식물 부분은 식물의 모든 지상 및 지하 부분 및 기관, 예를 들어 싹, 잎, 꽃 및 뿌리를 의미하는 것으로 이해하여야 하며, 그의 예로는 잎, 침엽, 줄기, 자루, 꽃, 자실체, 과일, 종자, 뿌리, 괴경 및 뿌리 줄기를 들 수 있다. 식물 부분은 또한 수확 물질 및 영양 및 생식 번식 물질, 예를 들어 묘목, 괴경, 뿌리 줄기, 자른 가지 및 종자를 포함한다.
- [0491] 본 발명에 따라 처리될 수 있는 식물로는 목화, 아마, 덩굴식물, 과일, 채소류, 예컨대 장미 종(Rosaceae sp.) (예를 들어 사과 및 배 등의 이과 식물뿐 아니라, 살구, 체리, 아몬드 및 복숭아 등의 핵과, 딸기 등의 씨없는 작은 과일), 리베시오이디에 종(Ribesioideae sp.), 가래나무과 종(Juglandaceae sp.), 자작나무과 종(Betulaceae sp.), 윗나무과 종(Anacardiaceae sp.), 참나무과 종(Fagaceae sp.), 뽕나무과 종(Moraceae sp.), 물푸레나무과 종(Oleaceae sp.), 다래나무과 종(Actinidaceae sp.), 녹나무과 종(Lauraceae sp.), 파초과 종(Musaceae sp.) (예를 들어 바나나 나무 및 농장), 꼭두서니과 종(Rubiaceae sp.) (예를 들어 커피), 차나무과 종(Theaceae sp.), 벽오동과 종(Sterculiaceae sp.), 운향과 종(Rutaceae sp.) (예를 들어 레몬, 오렌지 및 자몽); 가지과 종(Solanaceae sp.) (예를 들어 토마토), 백합과 종(Liliaceae sp.), 국화과 종(Asteraceae sp.) (예를 들어 상추), 산형과 종(Umbelliferae sp.), 십자화과 종(Cruciferae sp.), 명아주과 종(Chenopodiaceae sp.), 박과 종(Cucurbitaceae sp.) (예를 들어 오이), 부추과 종(Alliaceae sp.) (예를 들어 부추, 양파), 콩과 종(Papilionaceae sp.) (예를 들어 완두), 주요 작물 식물, 예컨대 벼과 종(Gramineae sp.) (예를 들어 옥수수, 잔디, 곡물, 예컨대 밀, 호밀, 쌀, 보리, 귀리, 수수, 기장, 라이밀), 국화과 종(Asteraceae sp.) (예를 들어 해바라기), 십자화과 종(Brassicaceae sp.) (예를 들어 흰양배추, 적채, 브로콜리, 콜리플라워, 브루셀 양배추, 청경채, 콜라비, 래디쉬, 유채, 겨자, 양고추냉이, 큰다당냉이), 콩과 종(Fabaceae sp.) (예를 들어 콩, 완두, 땅콩), 콩과 종(Papilionaceae sp.) (예를 들어 대두), 가지과 종(Solanaceae sp.) (예를 들어 감자), 명아주과 종(Chenopodiaceae sp.) (예를 들어 사탕무, 사료용 비트, 스위스 근대, 근대뿌리); 유용 식물 및 관상용 식물; 및 이들 식물의 유전자 변형 품종을 들 수 있다.
- [0492] 본 발명에 따라 처리될 수 있는 진균성 질병의 병원균의 비제한적인 예로는 하기를 들 수 있다:
- [0493] 백분병 병원균, 예를 들어 블루메리아(Blumeria) 종, 예를 들어 블루메리아 그라미니스(Blumeria graminis); 포도스파에라(Podosphaera) 종, 예컨대 포도스파에라 류코트리차(Podosphaera leucotricha); 스파에로테카(Sphaerotheca) 종, 예를 들어 스파에로테카 풀리기네아(Sphaerotheca fuliginea); 운시놀라(Uncinula) 종, 예를 들어 운시놀라 넥카토르(Uncinula necator)에 의하여 야기되는 질병;
- [0494] 녹병 병원균, 예를 들어 김노스포란기움(Gymnosporangium) 종, 예를 들어 김노스포란기움 사비나에(Gymnosporangium sabinae); 헤밀레이아(Hemileia) 종, 예를 들어 헤밀레이아 바스타트릭스(Hemileia vastatrix); 파코프소라(Phakopsora) 종, 예를 들어 파코프소라 파키리지(Phakopsora pachyrhizi) 또는 파코프

소라 메이보미아에(*Phakopsora meibomia*); 푸치니아(*Puccinia*) 중, 예를 들어 푸치니아 레콘디타(*Puccinia recondita*), 푸치니아 그라미니스(*Puccinia graminis*) 또는 푸치니아 스트리이포르미스(*Puccinia striiformis*); 우로미세스(*Uromyces*) 중, 예를 들어 우로미세스 아펜디쿨라투스(*Uromyces appendiculatus*)에 의하여 야기되는 질병;

[0495] 난균류 균으로부터의 병원균, 예를 들어 알부고(*Albugo*) 중, 예를 들어 알부고 칸디다(*Albugo candida*); 브레미아(*Bremia*) 중, 예를 들어 브레미아 락투카에(*Bremia lactucae*); 페로노스포라(*Peronospora*) 중, 예를 들어 페로노스포라 피시(*Peronospora pisi*) 또는 피. 브라시카에(*P. brassicae*); 피토프토라(*Phytophthora*) 중, 예를 들어 피토프토라 인페스탄스(*Phytophthora infestans*); 플라스모파라(*Plasmopara*) 중, 예를 들어 플라스모파라 비티콜라(*Plasmopara viticola*); 슈도페로노스포라(*Pseudoperonospora*) 중, 예를 들어 슈도페로노스포라 후물리(*Pseudoperonospora humuli*) 또는 슈도페로노스포라 쿠벤시스(*Pseudoperonospora cubensis*); 피티움(*Pythium*) 중, 예를 들어 피티움 울티움(*Pythium ultimum*)에 의하여 야기되는 질병;

[0496] 예를 들어 알테르나리아(*Alternaria*) 중, 예를 들어 알테르나리아 솔라니(*Alternaria solani*); 세르코스포라(*Cercospora*) 중, 예를 들어 세르코스포라 베티콜라(*Cercospora beticola*); 클라디오스포리움(*Cladosporium*) 중, 예를 들어 클라디오스포리움 쿠쿠메리눔(*Cladosporium cucumerinum*); 코클리오볼루스(*Cochliobolus*) 중, 예를 들어 코클리오볼루스 사티부스(*obolus sativus*)(분생포자 형태: 드레크슬레라(*Drechslera*), syn: 헬민토스포리움(*Helminthosporium*)) 또는 코클리오볼루스 미야베아누스(*Cochliobolus miyabeanus*); 콜레토티리쿰(*Colletotrichum*) 중, 예를 들어 콜레토티리쿰 린데무타니움(*Colletotrichum lindemuthanium*); 시클로코니움(*Cycloconium*) 중, 예를 들어 시클로코니움 올레아기눔(*Cycloconium oleaginum*); 디아포르테(*Diaporthe*) 중, 예를 들어 디아포르테 시트리(*Diaporthe citri*); 엘시노에(*Elsinoe*) 중, 예를 들어 엘시노에 포세티이(*Elsinoe fawcettii*); 글로에오스포리움(*Gloeosporium*) 중, 예를 들어 글로에오스포리움 라에티콜로르(*Gloeosporium laeticolor*); 글로멜렐라(*Glomerella*) 중, 예를 들어 글로멜렐라 신굴라타(*Glomerella cingulata*); 구이그나르디아(*Guignardia*) 중, 예를 들어 구이그나르디아 비드웰리(*Guignardia bidwelli*); 랩토스파에리아(*Leptosphaeria*) 중, 예를 들어 랩토스파에리아 마쿨란스(*Leptosphaeria maculans*); 마그나포르테(*Magnaporthe*) 중, 예를 들어 마그나포르테 그리세아(*Magnaporthe grisea*); 미크로도치움(*Microdochium*) 중, 예를 들어 미크로도치움 니발레(*Microdochium nivale*); 미코스파에렐라(*Mycosphaerella*) 중, 예를 들어 미코스파에렐라 그라미니콜라(*Mycosphaerella graminicola*), 미코스파에렐라 아라키디콜라(*Mycosphaerella arachidicola*) 또는 미코스파에렐라 피지엔시스(*Mycosphaerella fijiensis*); 파에오스파에리아(*Phaeosphaeria*) 중, 예를 들어 파에오스파에리아 노도룸(*Phaeosphaeria nodorum*); 피레노포라(*Pyrenophora*) 중, 예를 들어 피레노포라 테레스(*Pyrenophora teres*) 또는 피레노포라 트리티키 레펜티스(*Pyrenophora tritici repentis*); 라물라리아(*Ramularia*) 중, 예를 들어 라물라리아 콜로-시그니(*Ramularia collo-cygni*) 또는 라물라리아 아레올라(*Ramularia areola*); 린코스포리움(*Rhynchosporium*) 중, 예를 들어 린코스포리움 세칼리스(*Rhynchosporium secalis*); 세프트로리아(*Septoria*) 중, 예를 들어 세프트로리아 아피이(*Septoria api*) 또는 세프트로리아 리코페르시키(*Septoria lycopersici*); 스타그노스포라(*Stagonospora*) 중, 예를 들어 스타그노스포라 노도룸(*Stagonospora nodorum*); 티폴라(*Typhula*) 중, 예를 들어 티폴라 인카르나타(*Typhula incarnata*); 벤투리아(*Venturia*) 중, 예를 들어 벤투리아 이나에쿠알리스(*Venturia inaequalis*)에 의하여 야기되는 잎 반점병 및 잎 시듦병;

[0497] 예를 들어 코르티시움(*Corticium*) 중, 예를 들어 코르티시움 그라미네아룸(*Corticium graminearum*); 푸사리움(*Fusarium*) 중, 예를 들어 푸사리움 옥시스포룸(*Fusarium oxysporum*); 가에우만노마이세스(*Gaeumannomyces*) 중, 예를 들어 가에우만노마이세스 그라미니스(*Gaeumannomyces graminis*); 플라스모디오포라(*Plasmodiophora*) 중, 예를 들어 플라스모디오포라 브라시카에(*Plasmodiophora brassicae*); 리족토니아(*Rhizoctonia*) 중, 예를 들어 리족토니아 솔라니(*Rhizoctonia solani*); 사로클라디움(*Sarocladium*) 중, 예를 들어 사로클라디움 오리자에(*Sarocladium oryzae*); 스크레로티움(*Sclerotium*) 중, 예를 들어 스크레로티움 오리자에(*Sclerotium oryzae*); 타페시아(*Tapesia*) 중, 예를 들어 타페시아 아쿠포르미스(*Tapesia acuformis*); 티엘라비오프시스(*Thielaviopsis*) 중, 예를 들어 티엘라비오프시스 바시콜라(*Thielaviopsis basicola*)에 의하여 야기되는 뿌리 및 줄기병;

[0498] 예를 들어 알테르나리아(*Alternaria*) 중, 예를 들어 알테르나리아(*Alternaria*) 중; 아스페르길루스(*Aspergillus*) 중, 예를 들어 아스페르길루스 플라부스(*Aspergillus flavus*); 클라도스포리움(*Cladosporium*) 중, 예를 들어 클라도스포리움 클라도스포리오이데스(*Cladosporium cladosporioides*); 클라비세프스(*Claviceps*) 중, 예를 들어 클라비세프스 푸르푸레아(*Claviceps purpurea*); 푸사리움(*Fusarium*) 중, 예를 들어 푸사리움 쿨모룸(*Fusarium culmorum*); 기베렐라(*Gibberella*) 중, 예를 들어 기베렐라 제아에(*Gibberella*

zeae); 모노그라펠라(Monographella) 종, 예를 들어 모노그라펠라 니발리스(Monographella nivalis); 스타고노스포라(Stagonospora) 종, 예를 들어 스타고노스포라 노도룸(Stagonospora nodorum)에 의하여 야기되는 (옥수수숙을 비롯한) 이삭 줄기 병;

[0499] 감부기균, 예를 들어 스파셀로테카(Sphacelotheca) 종, 예를 들어 스파셀로테카 레일리아나(Sphacelotheca reiliana); 킬레티아(Tilletia) 종, 예를 들어 킬레티아 카리에스(Tilletia caries) 또는 킬레티아 콘트로베르사(Tilletia controversa); 우로시스티스(Urocystis) 종, 예를 들어 우로시스티스 옥쿨타(Urocystis occulta); 우스틸라고(Ustilago) 종, 예를 들어 우스틸라고 누다(Ustilago nuda)에 의하여 야기되는 질병;

[0500] 예를 들어 아스페르길루스(Aspergillus) 종, 예를 들어 아스페르길루스 플라부스(Aspergillus flavus); 보트리티스(Botrytis) 종, 예를 들어 보트리티스 시네레아(Botrytis cinerea); 페니실리움(Penicillium) 종, 예를 들어 페니실리움 익스판숨(Penicillium expansum) 또는 페니실리움 푸르푸로게눔(Penicillium purpurogenum); 리조푸스(Rhizopus) 종, 예를 들어 리조푸스 스톨로니페르(Rhizopus stolonifer); 스크레로티니아(Sclerotinia) 종, 예를 들어 스크레로티니아 스크레로티오룸(Sclerotinia sclerotiorum); 베르티실리움(Verticillium) 종, 예를 들어 베르티실리움 알보아트룸(Verticillium alboatrum)에 의하여 야기되는 열매 역병;

[0501] 예를 들어 알테나리아(Alternaria) 종, 예를 들어 알테나리아 브라시시콜라(Alternaria brassicicola); 아파노미세스(Aphanomyces) 종, 예를 들어 아파노미세스 유테이케스(Aphanomyces euteiches); 아스코키타(Ascochyta) 종, 예를 들어 아스코키타 렌티스(Ascochyta lentis); 아스페르길루스(Aspergillus) 종, 예를 들어 아스페르길루스 플라부스(Aspergillus flavus); 클라도스포리움(Cladosporium) 종, 예를 들어 클라도스포리움 헤르바룸(Cladosporium herbarum); 코클리오볼루스(Cochliobolus) 종, 예를 들어 코클리오볼루스 사티부스(Cochliobolus sativus)(분생포자 형태: 드레크슬레라(Drechslera), 비폴라리스(Bipolaris) syn: 헬민토스포리움(Helminthosporium)); 콜레토티리움(Colletotrichum) 종, 예를 들어 콜레토티리움 콕코데스(Colletotrichum coccodes); 푸사리움(Fusarium) 종, 예를 들어 푸사리움 쿨모룸(Fusarium culmorum); 기브렐라(Gibberella) 종, 예를 들어 기브렐라 제아에(Gibberella zeae); 마크로포미나(Macrospora) 종, 예를 들어 마크로포미나 파세올리나(Macrospora phaseolina); 마이크로도키움(Microdochium) 종, 예를 들어 마이크로도키움 니발레(Microdochium nivale); 모노그라펠라(Monographella) 종, 예를 들어 모노그라펠라 니발리스(Monographella nivalis); 페니실리움(Penicillium) 종, 예를 들어 페니실리움 익스판숨(Penicillium expansum); 포마(Phoma) 종, 예를 들어 포마 링감(Phoma lingam); 포몹시스(Phomopsis) 종, 예를 들어 포몹시스 소자에(Phomopsis sojae); 피토프토라(Phytophthora) 종, 예를 들어 피토프토라 각토룸(Phytophthora cactorum); 피레노포라(Pyrenophora) 종, 예를 들어 피레노포라 그라미네아(Pyrenophora graminea); 피리쿨라리아(Pyricularia) 종, 예를 들어 피리쿨라리아 오리자에(Pyricularia oryzae); 피티움(Pythium) 종, 예를 들어 피티움 울티мум(Pythium ultimum); 리족토니아(Rhizoctonia) 종, 예를 들어 리족토니아 솔라니(Rhizoctonia solani); 리조푸스(Rhizopus) 종, 예를 들어 리조푸스 오리자에(Rhizopus oryzae); 스크레로티움(Sclerotium) 종, 예를 들어 스크레로티움 롤프시이(Sclerotium rolfsii); 세프트로리아(Septoria) 종, 예를 들어 세프트로리아 노도룸(Septoria nodorum); 티플라(Typhula) 종, 예를 들어 티플라 인카르나타(Typhula incarnata); 베르티실리움(Verticillium) 종, 예를 들어 베르티실리움 달리아에(Verticillium dahliae)에 의하여 야기되는 종자- 및 토양성 시들 썩음병 및 묘종병;

[0502] 예를 들어 넥트리아(Nectria) 종, 예를 들어 넥트리아 갈리게나(Nectria galligena)에 의하여 야기되는 암성 질병, 흑 및 빗자루병;

[0503] 예를 들어 모닐리니아(Monilinia) 종, 예를 들어 모닐리니아 락사(Monilinia laxa)에 의하여 야기되는 시들병;

[0504] 예를 들어 엑소바시디움(Exobasidium) 종, 예를 들어 엑소바시디움 벡산스(Exobasidium vexans); 타프리나(Taphrina) 종, 예를 들어 타프리나 데포르만스(Taphrina deformans)에 의하여 야기되는 잎, 꽃 및 열매 변형;

[0505] 예를 들어 에스카(Esca) 종, 예를 들어 파에오모니엘라 클라미도스포라(Phaeomoniella chlamydospora), 파에오아크레모니움 알레오필룸(Phaeoacremonium aleophilum) 또는 폼티포리아 메디테라네아(Fomitiporia mediterranea); 가노데르마(Ganoderma) 종, 예를 들어 가노데르마 보닌렌세(Ganoderma boninense)에 의하여 야기되는 목질 식물의 변성 질병;

[0506] 예를 들어 보트리티스(Botrytis) 종, 예를 들어 보트리티스 시네레아(Botrytis cinerea)에 의하여 야기되는 개화 및 종자 병;

[0507] 예를 들어 리족토니아(Rhizoctonia) 종, 예를 들어 리족토니아 솔라니(Rhizoctonia solani); 헬민토스포리움

(*Helminthosporium*) 종, 예를 들어 헬민토스포리움 솔라니(*Helminthosporium solani*)에 의하여 야기되는 식물 덩이줄기 병;

[0508] 박테리아 병원균, 예를 들어 크산토모나스(*Xanthomonas*) 종, 예를 들어 크산토모나스 캄페트리스 pv. 오리자에 (*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*); 슈도모나스(*Pseudomonas*) 종, 예를 들어 슈도모나스 시린자에 pv. 라크리만스(*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*); 에르위니아(*Erwinia*) 종, 예를 들어 에르위니아 아밀로보라(*Erwinia amylovora*)에 의하여 야기되는 질병.

[0509] 하기 대두 질병은 바람직하게 방제될 수 있다:

[0510] 알테르나리아 잎반점 (알테르나리아 종. 아트란스 테누이시마(*atrans tenuissima*)), 탄저병 (콜레토티리쿰 글로에오스포로이데스 데마티움 var. 트룬카툼(*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*)), 갈색 점 무늬병 (세프토리아 글리시네스(*Septoria glycines*)), 세르코스포라 잎점무늬 마름병 (세르코스포라 키쿠치(*Cercospora kikuchii*)), 코아네포라 잎마름병 (코아네포라 인퐁디불리페라 트리스포라(*Choanephora infundibulifera trispora* (Syn.)), 닥툴리오포라 잎마름병 (닥툴리오포라 글리시네스(*Dactuliophora glycines*)), 백분병 (페로노스포라 만수리카(*Peronospora manshurica*)), 드레크슬레라 마름병 (드레크슬레라 글리시니(*Drechslera glycini*)), 백성병 잎반점 (세르코스포라 소지나(*Cercospora sojae*)), 랩토스파에물리나 잎반점 (랩토스파에물리나 트리폴리이(*Leptosphaerulina trifolii*)), 필로스티카 잎반점 (필로스티카 소자에콜라(*Phyllosticta sojaecola*)), 꼬투리 줄기 마름병 (포몹시스 소자에(*Phomopsis sojae*)), 백분병 (미크로스파에라 디푸사(*Microsphaera diffusa*)), 피레노카에타 잎반점 (피레노카에타 글리시네스(*Pyrenochaeta glycines*)), 리족토니아 공중, 잎, 가지 마름병 (리족토니아 솔라니(*Rhizoctonia solani*)), 녹병 (파코프소라 파키리지(*Phakopsora pachyrhizi*)), 파코프소라 메이보미아에(*Phakopsora meibomiae*)), 반점병 (스파셀로마 글리시네스(*Sphaceloma glycines*)), 스템필리움 잎 마름병 (스템필리움 보트리오슘(*Stemphylium botryosum*)), 타겟 반점 (코리네스포라 카시이콜라(*Corynespora cassicola*)) 등에 의하여 야기되는 잎, 줄기, 꼬투리 및 종자 상의 진균성 질병;

[0511] 예를 들어 검은 근부병 (칼로넥트리아 크로탈라리아에(*Calonectria crotalariae*)), 탄저병 (마크로포미나 파세올리나(*Macrophomina phaseolina*)), 푸사리움 마름병 또는 시늬병, 근부병 및 꼬투리 썩음병 및 윤반병 (푸사리움 옥시스포룸(*Fusarium oxysporum*)), 푸사리움 오르토세라스(*Fusarium orthoceras*), 푸사리움 세미텍툼(*Fusarium semitectum*), 푸사리움 에쿠이세티(*Fusarium equiseti*)), 미코렙토디스쿠스 근부병 (미코렙토디스쿠스 테레스트리스(*Mycoleptodiscus terrestris*)), 네오코스모스포라 (네오코스모스포라 바신펙타(*Neocosmospora vasinfecta*)), 꼬투리 및 줄기 마름병 (디아포르테 파세올로룸(*Diaporthe phaseolorum*)), 줄기 암종병 (디아포르테 파세올로룸 var. 카울리보라(*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*)), 피토프토라 썩음병 (피토프토라 메가스페르마(*Phytophthora megasperma*)), 갈색 줄기 썩음병 (피알로포라 그레가타(*Phialophora gregata*)), 피티움 썩음병 (피티움 아파니데르마툼(*Pythium aphanidermatum*)), 피티움 이레귤라레(*Pythium irregulare*), 피티움 데바리아눔(*Pythium debaryanum*), 피티움 미리오틸룸(*Pythium myriotylum*), 피티움 울티뎀(*Pythium ultimum*)), 리족토니아 근부병, 줄기 썩음병 및 잎잘록병 (리족토니아 솔라니(*Rhizoctonia solani*)), 스크레로티니아 줄기 썩음병 (스크레로티니아 스크레로티오룸(*Sclerotinia sclerotiorum*)), 스크레로티니아 백견병 (스크레로티니아 롤프시이(*Sclerotinia rolfsii*)), 티엘라비오프시스 근부병 (티엘라비오프시스 바시콜라(*Thielaviopsis basicola*))에 의하여 야기되는 뿌리 및 줄기 기부상의 진균성 질병.

[0512] 또한, 본 발명의 활성 성분은 식물에서의 강화 작용이 매우 우수하다. 그러므로, 이들은 바람직하지 못한 미생물에 의한 공격에 대한 식물의 방어를 동원하기에 적절하다.

[0513] 식물-강화 (내성-유도) 물질은 본 명세서에서는 처리된 식물이 바람직하지 못한 미생물로 차후에 접촉시 이들 미생물에 대한 높은 정도의 내성을 생성하도록 식물의 방어계를 자극할 수 있는 물질을 의미하는 것으로 이해하여야 한다.

[0514] 이러한 경우에서, 바람직하지 못한 미생물은 식물병원성 진균 및 세균을 의미하는 것으로 이해하여야 한다. 그래서, 본 발명의 물질은 언급한 병원균에 의한 공격에 대하여 치료후 일정 기간 동안 식물을 보호하는데 사용될 수 있다. 보호가 제공되는 기간은 일반적으로 식물을 활성 성분으로 처리한 후 1 내지 10 일간, 바람직하게는 1 내지 7 일간이다.

[0515] 식물병을 방제하는데 필요한 농도에서 식물이 활성 성분을 잘 견딘다는 사실은 식물의 지상 부분, 번식 스탁 및 종자 및 토양의 처리를 가능케 한다.

- [0516] 본 발명의 활성 성분은 예를 들어 특히 백분병 진균, 난균류(Oomycetes), 예를 들어 피토프토라(Phytophthora), 플라스포파라(Plasmopara), 슈도페로노스포라(Pseudoperonospora) 및 피티움(Pythium) 종에 대하여 자라고 있는 포도재배 및 감자, 과실 및 채소에서 질병을 특히 성공적으로 방제하는데 사용될 수 있다.
- [0517] 본 발명의 활성 성분은 또한 작물의 수확량을 향상시키기에 적절하다. 게다가, 이들은 독성이 낮으며 식물이 잘 견딘다.
- [0518] 일부 경우에서, 본 발명의 화합물은 특정한 농도 또는 적용 비율에서 또한 제초제, 약해경감제, 성장 조절제 또는, 식물 성질을 개선시키기 위한 조성물로서 또는 살미생물제, 예를 들어 살진균제, 항진균제, 살박테리아제, 살바이러스제 (바이로이드에 대한 조성물 포함)로서 또는 MLO (미코플라스마형 유기체) 및 RLO (리케차형 유기체)에 대한 조성물로서 사용될 수 있다. 적절한 경우, 이들은 또한 살충제로서 사용될 수 있다. 적절한 경우, 이들은 또한 기타 활성 성분의 합성을 위한 중간체 또는 전구체로서 사용될 수 있다.
- [0519] 본 발명의 활성 성분은 식물이 잘 견디는 경우 바람직한 항온동물 독성을 가지며 환경에 의하여 잘 견디며, 식물 및 식물 기관을 보호하고, 수확량을 향상시키고, 저장된 제품 및 물질의 보호 및 위생 부분, 레저 시설, 정원, 삼림, 축산업, 원예 및 농업에서 수확된 물질의 품질을 개선시키기에 적절하다. 이들은 바람직하게는 작물 보호제로서 사용될 수 있다. 이들은 통상적으로 민감성 및 내성 종에 대하여 및 발생의 모든 또는 일부 단계에 대하여 효과적이다.
- [0520] 본 발명의 활성 성분 또는 조성물로 식물 및 식물 부분을 처리하는 것은 통상의 처리 방법에 의하여, 예를 들어 침지, 분무, 분사, 관개, 증발, 살분, 분사, 살포, 포밍, 도포, 뿌리기, 급수 (드레징), 세류 관개에 의하여 그리고, 전과 물질, 특히 종자의 경우에는 또한 건조 종자 처리, 습식 종자 처리, 슬러리 종자 처리, 외피형성, 1 종 이상의 피막을 사용한 피복에 의하여 그의 주변, 서식지 또는 저장 공간에 작용시켜 또는 직접 실시된다. 또한, 활성 성분을 극소 용적법으로 적용하거나, 활성 성분 제제 또는 활성 성분 그 자체를 토양에 주입하는 것 또한 가능하다.
- [0521] 본 발명의 활성 성분 또는 조성물은 또한 물질의 보호에서 원치않는 미생물, 예를 들어 진균에 의한 공격 및 파괴로부터 공업용 물질을 보호하기 위하여 사용될 수 있다.
- [0522] 본원에서 공업용 물질이란 산업적 용도로 제조된 무생 물질을 의미하는 것으로 이해하여야 한다. 예를 들어 미생물에 의한 변화 또는 파괴로부터 본 발명의 활성 성분에 의하여 보호하고자 하는 공업용 물질은 접착제, 아교, 종이 및 보드, 식물, 가죽, 목재, 페인트 및 플라스틱 제품, 냉각 윤활제 및 미생물에 의하여 감염 또는 파괴될 수 있는 기타 물질일 수 있다. 보호되는 물질의 범위내에 포함되는 것으로는 또한 미생물의 증식에 의하여 손상될 수 있는 생산 플랜트, 예를 들어 냉각수 회로를 들 수 있다. 본 발명의 범주내에 포함되는 공업용 물질은 바람직하게는 접착제, 아교, 종이 및 카드보드, 가죽, 목재, 페인트, 냉각 윤활제 및 열 전달 유체, 보다 바람직하게는 목재이다. 본 발명의 활성 성분 또는 조성물은 예컨대 부식, 부패, 변색, 탈색 또는 곰팡이 형성과 같은 불리한 효과를 방지할 수 있다.
- [0523] 원치않는 진균을 방제하기 위한 본 발명의 방법은 또한 저장 제품을 보호하는데 사용될 수 있다. 저장 제품이란 장기 보호가 요구되는, 식물 또는 동물 기원의 천연 물질 또는 천연 기원의 그의 가공 제품으로 이해하여야 한다. 식물성 기원의 저장 제품, 예를 들어 식물 또는 식물 부분, 예컨대 줄기, 잎, 피경, 종자, 과실, 낱알 등이 새로이 수확된 상태로 또는 (전)건조, 습윤화, 세분화, 분쇄, 압축 또는 굽기에 의하여 가공된 후 보호될 수 있다. 저장 제품은 또한 건축용 목재, 전신주 및 배리어와 같은 비가공 형태 또는, 가구와 같은 완성품 형태 모두의 목재를 포함한다. 동물 기원의 저장 제품은 예를 들어 하이드, 가죽, 모피 및 털 등이다. 본 발명의 활성 성분은 예컨대 부식, 부패, 변색, 탈색 또는 곰팡이 형성과 같은 불리한 효과를 방지할 수 있다.
- [0524] 공업용 물질을 분해 또는 변화시킬 수 있는 미생물로는 예를 들어 세균, 진균, 효모, 조류 및 점균류를 들 수 있다. 본 발명의 활성 성분은 바람직하게는 진균, 특히 사상균, 목재 변색 및 목재 파괴 진균 (바시디오미세테스), 점균류 및 조류에 작용한다. 미생물의 예로는 알테르나리아(Alternaria), 예를 들어 알테르나리아 테누이스(Alternaria tenuis), 아스페르길루스(Aspergillus), 예를 들어 아스페르길루스 니거(Aspergillus niger), 캐토미움(Chaetomium), 예를 들어 캐토미움 글로보숨(Chaetomium globosum), 코니오포라(Coniophora), 예를 들어 코니오포라 푸에타나(Coniophora puetana), 렌티누스(Lentinus), 예를 들어 렌티누스 티그리누스(Lentinus tigrinus), 페니실리움(Penicillium), 예를 들어 페니실리움 글라우쿰(Penicillium glaucum), 폴리포루스(Polyporus), 예를 들어 폴리포루스 버시컬러(Polyporus versicolor), 아우레오바시디움(Aureobasidium), 예를 들어 아우레오바시디움 풀루란스(Aureobasidium pullulans), 스클레오포마(Sclerophoma), 예를 들어 스클레오

포마 피타이오피라(Sclerophoma pityophila), 트리코더마(trichoderma), 예를 들어 트리코더마 비리데(Trichoderma viride), 에세리키아(Escherichia), 예를 들어 에세리키아 콜리(Escherichia coli), 슈도모나스(Pseudomonas), 예를 들어 슈도모나스 아에루기노사(Pseudomonas aeruginosa) 및 스태필로코쿠스(Staphylococcus), 예를 들어 스태필로코쿠스 아우레우스(Staphylococcus aureus) 속을 들 수 있다.

- [0525] 추가로, 본 발명은 본 발명의 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체 중 1종 이상을 포함하는 원치않는 미생물의 방제용 조성물에 관한 것이다. 그러한 조성물은 바람직하게는 농업용으로 적절한 보조제, 용매, 담체, 계면활성제 또는 증량제를 포함하는 살진균성 조성물이다.
- [0526] 본 발명에 따르면, 담체는 더 우수한 적용 가능성을 위하여, 특히 식물 또는 식물 부분 또는 종자에 적용하기 위하여 활성 성분을 혼합 또는 조합한 천연 또는 합성, 유기 또는 무기 물질이다. 고체 또는 액체일 수 있는 담체는 일반적으로 불활성이며, 농업에 사용하기에 적절하여야만 한다.
- [0527] 유용한 고체 담체로는 예를 들어 암모늄 염 및 천연 암석 분말, 예컨대 카올린, 점토, 활석, 백악, 석영, 아타플라이트, 몬트모릴로나이트 또는 규조토 및, 합성 암석 분말, 예컨대 미분 실리카, 알루미늄 및 실리케이트; 과립용으로 유용한 고체 담체로는 예를 들어 분쇄 및 분류된 천연 암석, 예컨대 방해석, 대리석, 경석, 해포석 및 백운석 및, 또한 무기 및 유기 분말의 합성 과립 및, 유기 물질의 과립, 예컨대 종이, 톱밥, 코코넛 껍질, 옥수수 속대 및 담배줄기; 유용한 유화제 및/또는 발포 형성제로는 예를 들어 비이온성 및 음이온성 유화제, 예컨대 폴리옥시에틸렌 지방산 에스테르, 폴리옥시에틸렌 지방 알콜 에테르, 예를 들어 알킬아릴 폴리글리콜 에테르, 알킬술포네이트, 알킬 술페이트, 아릴술포네이트 및 또한 단백질 가수분해물을 들 수 있으며; 적절한 분산제의 예로는 알콜-POE 및/또는 -POP 에테르, 산 및/또는 POP POE 에스테르, 알킬아릴 및/또는 POP POE 에테르, 지방 및/또는 POP POE 부가물, POE- 및/또는 POP-폴리올 유도체, POE- 및/또는 POP-소르비탄 또는 -당 부가물, 알킬 또는 아릴 술페이트, 알킬- 또는 아릴술포네이트 및 알킬 또는 아릴 포스페이트 또는 해당 PO-에테르 부가물의 부류로부터의 비이온성 및/또는 이온성 물질이 있다. 추가의 적절한 올리고머 또는 중합체로는 예를 들어 비닐 단량체, 아크릴산, EO 및/또는 PO 단독으로 또는 예를 들어 (폴리)알콜 또는 (폴리)아민과 조합된 것으로부터 유래한 것을 들 수 있다. 또한 리그닌 및 그의 술폰산 유도체, 비변형 및 변형 셀룰로스, 방향족 및/또는 지방족 술폰산 및 또한 그의 포름알데히드와의 부가물을 사용할 수 있다.
- [0528] 활성 성분은 통상의 제제, 예컨대 액제, 에멀전, 습윤성 분말, 수계 및 유기 현탁액, 분말, 산분, 페이스트, 가용성 분말, 가용성 과립, 살포용 과립, 유현탁 농축액, 활성 성분으로 함침된 천연 생성물, 활성 성분으로 함침된 합성 물질, 비료 및 또한 중합체 물질 중의 마이크로캡슐화제로 전환될 수 있다.
- [0529] 활성 성분은 그 상태대로, 그의 제제 형태 또는 그로부터 생성된 사용 형태, 예컨대 사용 준비가 된 액제, 에멀전, 수계 또는 유기 현탁액, 분말, 습윤성 분말, 페이스트, 가용성 분말, 산분, 가용성 과립, 살포용 과립, 유현탁 농축액, 활성 성분으로 함침된 천연 생성물, 활성 성분으로 함침된 합성 물질, 비료 및 또한 중합체 물질 중의 마이크로캡슐화제의 형태로 적용될 수 있다. 적용은 통상의 방식으로, 예를 들어 살수, 분무, 분사, 살포, 살분, 포밍, 뿌리기 등에 의하여 달성된다. 또한, 활성 성분을 극소 용적법으로 적용하거나 또는 활성 성분 제제 또는 활성 성분 그 자체를 토양에 주입하는 것도 가능하다. 또한, 식물의 종자를 처리할 수 있다.
- [0530] 언급된 제제는 그 자체로 공지된 방법에 의하여, 예를 들어 활성 성분을 1종 이상의 통상의 증량제, 용매 또는 희석제, 유화제, 분산제 및/또는 결합제 또는 고정제, 습윤제, 발수제, 적절한 경우 건조제 및 UV 안정화제 및 적절한 경우 염료 및 안료, 소포제, 보존제, 2차 증점제, 점착제, 지베렐린 및 또한 기타 가공 보조제와 혼합하여 제조될 수 있다.
- [0531] 본 발명은 사용 준비가 되어 있고 그리고 식물 또는 종자에 적절한 장치를 사용하여 적용될 수 있는 제제뿐 아니라, 사용전 물로 희석되어야 하는 시판 농축물도 포함한다.
- [0532] 본 발명의 활성 성분은 그 상태대로 또는 그의 (시판) 제제로 및 기타 (공지의) 활성 성분, 예컨대 살충제, 유인제, 소독제, 살박테리아제, 살비제, 살선충제, 살진균제, 성장조절제, 제초제, 비료, 약해경감제 및/또는 신호 정보 물질과의 혼합물로서 이들 제제로부터 생성된 사용 형태로 존재할 수 있다.
- [0533] 사용된 보조제는 조성물 그 자체에 및/또는 그로부터 유도된 제제 (예를 들어 분무액, 종자 분의)에 특정한 성질, 예컨대 특정 기술적 성질 및/또는 또한 특정한 생물학적 성질을 부여하기에 적절한 물질일 수 있다. 통상의 보조제로는 증량제, 용매 및 담체를 들 수 있다.
- [0534] 적절한 증량제로는 예를 들어 물, 극성 및 비극성 유기 화학물질 액체, 예를 들어 방향족 및 비방향족 탄화수소 (예컨대 파라핀, 알킬벤젠, 알킬나프탈렌, 클로로벤젠), (임의로 또한 치환, 에테르화 및/또는 에스테르화될 수

있는) 알콜 및 폴리올, 케톤 (예컨대 아세톤, 시클로헥사논), 에스테르 (지방 및 오일 포함) 및 (폴리)에테르, 비치환 및 치환 아민, 아미드, 락탐 (예컨대 N-알킬피롤리돈) 및 락톤, 술폰 및 술폭시드 (예컨대 디메틸 술폭시드)의 부류로부터의 것을 들 수 있다.

- [0535] 액화 기체 증량제 또는 담체는 표준 온도에서 및 표준 압력하에서 기체인 액체, 예를 들어 에어로졸 추진제, 예컨대 할로탄화수소 또는 그밖에 부탄, 프로판, 질소 및 이산화탄소를 의미하는 것으로 이해한다.
- [0536] 제제에서, 점착부여제, 예컨대 카르복시메틸셀룰로스, 분말, 과립 또는 라텍스의 형태로 천연 및 합성 중합체, 예컨대 아라비아 검, 폴리비닐 알콜 및 폴리비닐 아세테이트 또는 그밖에 천연 인지질, 예컨대 세팔린 및 레시틴 및 합성 인지질을 사용할 수 있다. 추가의 첨가제는 미네랄 및 식물성 오일일 수 있다.
- [0537] 사용된 증량제가 물인 경우, 또한 보조 용매로서 예를 들어 유기 용매를 사용할 수 있다. 유용한 액체 용매로는 본질적으로 방향족, 예컨대 크실렌, 톨루엔 또는 알킬나프탈렌, 염소화 방향족 또는 염소화 지방족 탄화수소, 예컨대 클로로벤젠, 클로로에틸렌 또는 염화메틸렌, 지방족 탄화수소, 예컨대 시클로헥산 또는 파라핀, 예를 들어 석유 유분, 알콜, 예컨대 부탄올 또는 글리콜 및 그의 에테르 및 에스테르, 케톤, 예컨대 아세톤, 메틸 에틸 케톤, 메틸 이소부틸 케톤 또는 시클로헥사논, 강한 극성 용매, 예컨대 디메틸포름아미드 및 디메틸 술폭시드 또는 그 밖에 물을 들 수 있다.
- [0538] 본 발명의 조성물은 추가의 성분, 예를 들어 계면활성제를 추가로 포함할 수 있다. 유용한 계면활성제는 유화제 및/또는 발포 형성제, 분산제 또는, 이온성 또는 비이온성 성질을 갖는 습윤제 또는 이들 계면활성제의 혼합물을 들 수 있다. 그의 예로는 폴리아크릴산의 염, 리그노술포산의 염, 페놀술포산 또는 나프탈렌술포산의 염, 에틸렌 옥시드와 지방 알콜 또는 지방 산 또는 지방 아민의 중축합물, 치환 페놀 (바람직하게는 알킬페놀 또는 아릴페놀), 술포숙신산 에스테르의 염, 타우린 유도체 (바람직하게는 알킬 타우레이트), 폴리에톡실화 알콜 또는 페놀의 인산 에스테르, 폴리올의 지방 에스테르 및, 술페이트, 술포네이트 및 포스페이트 함유 화합물의 유도체, 예를 들어 알킬아릴 폴리글리콜 에테르, 알킬술포네이트, 알킬 술페이트, 아릴술포네이트, 단백질 가수분해물, 리그노술포아이트 페액 및 메틸셀룰로스를 들 수 있다. 계면활성제의 존재는 활성 성분 중 하나 및/또는 불활성 담체 중 하나가 물 중에서 불용성일 경우 및 적용을 물 중에서 실시할 때 필요하다. 계면활성제의 비율은 본 발명의 조성물의 5 내지 40 중량%이다.
- [0539] 염료, 예컨대 무기 안료, 예를 들어 산화철, 산화티탄 및 프리시안 블루 및 유기 염료, 예컨대 알리자린 염료, 아조 염료 및 금속 프탈로시아닌 염료 및 미량의 영양분, 예컨대 철, 망가니즈, 붕소, 구리, 코발트, 몰리브데넘 및 아연의 염을 사용할 수 있다.
- [0540] 추가의 첨가제로는 향료, 미네랄 또는 식물성, 임의로 개질 오일, 왁스 및 영양분 (미량의 영양분 포함), 예컨대 철, 망가니즈, 붕소, 구리, 코발트, 몰리브데넘 및 아연의 염을 들 수 있다.
- [0541] 추가의 성분으로는 안정화제, 예컨대 저온 안정화제, 보존제, 항산화제, 광 안정화제 또는, 화학적 및/또는 물리적 안정성을 개선시키는 기타의 물질을 들 수 있다.
- [0542] 적절한 경우, 기타 추가의 성분, 예를 들어 보호 콜로이드, 결합제, 접착제, 점착부여제, 요변성 물질, 침투제, 안정화제, 격리제, 착화제가 존재할 수 있다. 일반적으로, 활성 성분은 제제의 목적에 통상적으로 사용되는 임의의 고체 또는 액체 첨가제와 조합될 수 있다.
- [0543] 제제는 일반적으로 0.05 내지 99 중량%, 0.01 내지 98 중량%, 바람직하게는 0.1 내지 95 중량%, 보다 바람직하게는 0.5 내지 90 중량%, 가장 바람직하게는 10 내지 70 중량%의 활성 성분을 함유한다.
- [0544] 상기 기재된 제제는 원치않는 미생물을 방제하기 위한 본 발명의 방법에 사용될 수 있으며, 여기서 본 발명의 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체를 미생물에게 및/또는 그의 서식지내에 적용한다.
- [0545] 본 발명의 활성 성분은 또한 그 상태로 또는 그의 제제로서, 공지의 살진균제, 살박테리아제, 살비제, 살선충제 또는 살충제와의 혼합물로 사용되어 예를 들어 활성 스펙트럼을 확장시키거나 또는 내성의 발생을 방지할 수 있다.
- [0546] 유용한 혼합 파트너로는 예를 들어 공지의 살진균제, 살충제, 살비제, 살선충제 또는 그밖의 살박테리아제를 들 수 있다 (또한 문헌 [Pesticide Manual, 14th ed.] 참조).
- [0547] 기타 공지의 활성 성분, 예컨대 제초제 또는 비료 및 성장 조절제, 약해경감제 및/또는 신호 정보 물질과의 혼합물도 또한 가능하다.

- [0548] 적용은 사용 형태에 적절한 통상의 방식으로 달성된다.
- [0549] 본 발명은 추가로 종자의 처리 방법을 포함한다.
- [0550] 본 발명의 추가의 구체예는 특히 본 발명의 헤테로아릴피페리딘 및 -피페라진 유도체 중 1종 이상으로 처리한 종자에 관한 것이다. 본 발명의 종자는 식물병원성 유해 진균으로부터 종자를 보호하는 방법에 사용된다. 이러한 방법에서, 1종 이상의 본 발명의 활성 성분으로 처리한 종자를 사용한다.
- [0551] 본 발명의 활성 성분 또는 조성물은 또한 종자 처리에 적절하다. 유해 유기체에 의해 야기되는 대부분의 작물 피해는 종자가 저장되는 동안 또는 종자 파종 후 및 또한 식물이 발아하는 동안 및 발아후 종자 감염으로 촉발된다. 이러한 현상은 성장중인 식물의 뿌리 및 싹이 특히 민감하고 심지어 약간의 피해에도 전체 식물이 고사할 수 있기 때문에 특히 중요하다. 따라서, 적절한 조성물을 사용하여 종자 및 발아 식물을 보호하는 것이 특히 중요하다.
- [0552] 식물의 종자를 처리하여 식물병원성 유해 진균을 방제하는 것은 예전부터 공지되어 왔으며 지속적인 개선 과제가 된다. 그러나, 종자 처리는 항상 만족스러운 방식으로 해결할 수 없는 일련의 문제를 갖고 있다. 예를 들어 파종후 또는 식물 출현후 작물 보호 조성물의 추가 적용을 필요로 하지 않거나 또는 추가 적용이 적어도 상당히 감소된 종자 및 발아 식물의 보호방법을 개발하는 것이 바람직하다. 또한, 사용된 활성 성분에 의하여 식물 자체는 피해를 입히지 않으면서 식물병원성 진균의 공격으로부터 종자 및 발아 식물을 최대한 보호하는 방식으로 사용되는 활성 성분의 양을 최적화시키는 것이 또한 바람직하다. 특히, 종자의 처리 방법은 또한 작물 보호 조성물을 최소 비용으로 사용하여 종자 및 발아 식물을 최적으로 보호하기 위하여 형질전환 식물의 고유 살진균성을 고려하여야 한다.
- [0553] 그러므로, 본 발명은 또한 종자를 본 발명에 따른 조성물로 처리하여 종자 및 발아 식물을 동물 해충 및/또는 식물병원성 유해 진균의 공격으로부터 보호하는 방법에 관한 것이다. 마찬가지로, 본 발명은 또한 종자 및 발아 식물을 식물병원성 진균으로부터 보호하기 위하여 종자를 처리하기 위한 본 발명에 따른 조성물의 용도에 관한 것이다. 추가로, 본 발명은 식물병원성 진균으로부터 보호되도록 본 발명에 따른 조성물로 처리된 종자에 관한 것이다.
- [0554] 출현후 식물에 피해를 입히는 동물 해충 및/또는 식물병원성 유해 진균은 주로 작물 보호 조성물로 토양 및 식물의 노출부를 처리하여 방제된다. 작물 보호 조성물이 환경과 인간 및 동물의 건강에 타격을 줄 수 있다는 우려로 인하여, 활성 성분의 적용량을 감소시키고자 시도하였다.
- [0555] 본 발명의 이점 중 하나는 본 발명의 조성물의 특정 전신성으로 인하여, 이들 조성물로 종자를 처리하는 것이 동물 해충 및/또는 식물병원성 유해 진균으로부터 종자 자체뿐 아니라 출현후 식물도 보호한다는 것이다. 이러한 방식으로, 파종시 또는 그 직후 작물을 즉시 처리할 필요가 없다.
- [0556] 마찬가지로, 본 발명의 활성 성분 또는 조성물은 특히 형질전환 종자에 사용되어 이 종자로부터 성장하는 식물이 해충에 대항하여 작용하는 단백질을 발현시킬 수 있는 것이 유리한 것으로 간주된다. 본 발명의 활성 성분 또는 조성물로 종자를 처리하여 단백질, 예를 들어 살충 단백질의 발현만으로도 특정 해충을 방제할 수 있다. 놀랍게도, 해충 공격에 대한 보호 효과를 또한 추가로 증가시키는 추가의 상승 효과를 관찰할 수 있다.
- [0557] 본 발명의 조성물은 농업, 온실, 삼림 또는 원예에 사용되는 임의의 식물 품종의 종자를 보호하는데 적절하다. 특히, 종자는 곡물 (예컨대 밀, 보리, 호밀, 수수, 귀리), 옥수수, 목화, 대두, 벼, 감자, 해바라기, 콩, 커피, 비트 (예컨대 사탕무 및 사료용 비트), 땅콩, 채소 (예컨대 토마토, 오이, 양파 및 상치), 잔디 및 관상 식물의 종자이다. 곡물 (예컨대 밀, 보리, 호밀 및 귀리), 옥수수 및 벼 종자의 처리가 특히 중요하다.
- [0558] 또한 하기 기재한 바와 같이, 본 발명의 활성 성분 또는 조성물로 형질전환 종자를 처리하는 것이 특히 중요하다. 이는 살충성을 갖는 폴리펩티드 또는 단백질을 발현시킬 수 있는 1종 이상의 이종 유전자를 함유하는 식물의 종자에 관한 것이다. 형질전환 종자내 이종 유전자는 바실루스(Bacillus), 리조비움(Rhizobium), 슈도모나스(Pseudomonas), 세타리아(Serratia), 트리코더마(Trichoderma), 클라비박터(Clavibacter), 글로무스(Glomus) 또는 글리오클라듐(Gliocladium)과 같은 종의 미생물로부터 유래될 수 있다. 바람직하게, 이종 유전자는 바실루스 종(Bacillus sp.)으로부터 유래되며, 그의 유전자 산물은 유럽 조명충나방 및/또는 옥수수 뿌리벌레에 대하여 효과적이다. 이종 유전자는 바실루스 투링기엔시스(Bacillus thuringiensis)로부터 유래되는 것이 보다 바람직하다.
- [0559] 본 발명과 관련하여, 본 발명의 조성물은 단독으로 또는 적절한 제제로 종자에 적용된다. 바람직하게는, 종자

는 처리 중에 어떠한 피해도 발생하지 않도록 충분히 안정한 상태로 처리된다. 일반적으로, 종자는 수확과 파종 사이 어느 시점에서든 처리가 가능하다. 식물로부터 분리되며 식물의 속, 껍질, 줄기, 외피, 털 또는 과육을 함유하지 않는 종자를 사용하는 것이 통상적이다. 예를 들어 수확하였거나, 세정하였거나, 15 중량% 미만의 수분 함량으로 건조된 종자를 사용하는 것이 가능하다. 대안적으로, 건조후 예를 들어 물로 처리한 다음, 다시 건조시킨 종자를 사용할 수도 있다.

- [0560] 종자 처리시, 종자에 적용되는 본 발명의 조성물의 양 및/또는 추가의 첨가제의 양은 종자 발아가 손상되지 않거나 또는 발생된 식물이 손상되지 않도록 주의를 기울여야 한다. 이는 특히 특정 적용 비율에서 식물독성 작용을 가질 수 있는 활성 성분의 경우에 명심하여야 한다.
- [0561] 본 발명의 조성물은 직접, 즉 임의의 기타 성분 없이 희석되지 않고 적용될 수 있다. 일반적으로, 조성물을 적절한 제제 형태로 하여 종자에 적용하는 것이 바람직하다. 적절한 제제 및 종자 처리 방법은 당업자들에게 공지되어 있으며, 예를 들어 US 4,272,417, US 4,245,432, US4,808,430, US 5,876,739, US 2003/0176428, W02002/080675, W02002/028186에 기재되어 있다.
- [0562] 본 발명에 따라 사용가능한 활성 성분은 통상의 종자 분의 제제, 예컨대 액제, 에멀전, 현탁액, 산제, 포움, 슬러리 또는 기타 종자용 코팅 물질 및 ULV 제제로 전환될 수 있다.
- [0563] 이들 제제는 활성 성분 또는 활성 성분 조합물을 통상의 첨가제, 예를 들어 통상의 증량제 및 용매 또는 희석제, 염료, 습윤제, 분산제, 유화제, 소포제, 보존제, 2차 증점제, 점착부여제, 지베렐린 및 또한 물과 혼합하여 공지된 방식으로 생성된다.
- [0564] 본 발명에 따라 사용가능한 종자 분의 제제에 존재할 수 있는 유용한 염료는 이러한 목적에 통상적인 모든 염료이다. 난수용성 안료 또는 수용성 염료를 사용할 수 있다. 예로는 명칭 로다민(Rhodamine) B, C.I. 피그먼트 레드 112 및 C.I. 솔벤트 레드 1로 공지된 염료를 들 수 있다.
- [0565] 본 발명에 따라 유용한 종자 분의 제제 중에 존재할 수 있는 유용한 습윤제는 습윤성을 촉진하고 활성 농화학 성분의 제제에 통상적으로 사용되는 모든 물질이다. 알킬나프탈렌술포네이트, 예컨대 디이소프로필 또는 디이소부틸 나프탈렌술포네이트를 사용하는 것이 바람직하다.
- [0566] 본 발명에 따라 사용가능한 종자 분의 제제 중에 존재할 수 있는 유용한 분산제 및/또는 유화제는 활성 농화학 성분의 제제에 통상적으로 사용되는 모든 비이온성, 음이온성 및 양이온성 분산제이다. 비이온성 또는 음이온성 분산제 또는 비이온성 및 음이온성 분산제의 혼합물을 사용하는 것이 유용할 수 있다. 적절한 비이온성 분산제로는 특히 에틸렌 옥시드/프로필렌 옥시드 블록 중합체, 알킬페놀 폴리글리콜 에테르 및 트리스티릴페놀 폴리글리콜 에테르 및 그의 포스페이팅화 또는 술페이팅화 유도체이다. 적절한 음이온성 분산제는 특히 리그노술포네이트, 폴리아크릴산 염 및 아릴술포네이트/포름알데히드 축합물이다.
- [0567] 본 발명에 따라 유용한 종자 분의 제제 중에 존재할 수 있는 소포제는 활성 농화학 성분의 제제에 통상적으로 사용되는 모든 기포 억제 화합물이다. 실리콘 소포제 및 스테아르산마그네슘을 사용하는 것이 바람직하다.
- [0568] 본 발명에 따라 유용한 종자 분의 제제 중에 존재할 수 있는 보존제는 농화학 조성물에서 이러한 목적으로 사용될 수 있는 모든 화합물이다. 그의 예로는 디클로로펜 및 벤질 알콜 헤미포르말을 들 수 있다.
- [0569] 본 발명에 따라 유용한 종자 분의 제제 중에 존재할 수 있는 2차 증점제는 농화학 조성물에서 이러한 목적으로 사용될 수 있는 모든 물질이다. 바람직한 예로는 셀룰로즈 유도체, 아크릴산 유도체, 크산탄, 개질 점토 및 미분 실리카를 들 수 있다.
- [0570] 본 발명에 따라 유용한 종자 분의 제제 중에 존재할 수 있는 첨가제는 종자 분의 제품에 사용될 수 있는 모든 통상의 결합제이다. 바람직한 예로는 폴리비닐피롤리돈, 폴리비닐 아세테이트, 폴리비닐알콜 및 킬로스룰 들 수 있다.
- [0571] 본 발명에 따라 유용한 종자 분의 제제 중에 존재할 수 있는 지베렐린은 바람직하게는 지베렐린 A1, A3 (=지베렐린산), A4 및 A7이며; 지베렐린산을 사용하는 것이 특히 바람직하다. 지베렐린은 공지되었다 (문헌 [R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- and Schaedlingsbekaempfungsmittel" [Chemistry of the Crop Protection Compositions and Pesticides], vol. 2, Springer Verlag, 1970, p. 401-412] 참조).
- [0572] 본 발명에 따라 유용한 종자 분의 제제를 사용하여 직접 또는 물로 사전 희석후 광범위한 상이한 유형의 종자를 처리할 수 있다. 예를 들어 물을 사용한 희석에 의하여 이로부터 얻을 수 있는 농축액 또는 제제를 사용하여

곡물, 예컨대 밀, 보리, 호밀, 귀리 및 라이밀의 종자 및 또한 옥수수, 쌀, 유채, 완두, 콩, 목화, 해바라기 및 비트 또는 그 밖에 광범위하게 상이한 식물성 종자를 분의할 수 있다. 본 발명에 따라 사용가능한 종자 분의 제제 또는 그의 희석 제제는 또한 형질전환 식물의 종자를 분의하는데 사용될 수 있다. 이러한 경우에서, 추가의 상승 효과는 또한 형질발현에 의하여 형성된 물질과의 상호작용이 발생한다.

- [0573] 본 발명에 따라 사용가능한 종자 분의 제제 또는 물을 첨가하여 이로부터 생성된 제제를 사용한 종자 처리의 경우, 종자 분의에 대하여 통상적으로 사용 가능한 모든 혼합 유닛이 유용하다. 구체적으로, 종자 분의에서의 절차는 종자를 혼합기에 넣고, 특정한 소정량의 종자 분의 제제를 그 상태대로 또는 물로 사전 희석후 첨가하고, 제제가 종자에 균질하게 분포될 때까지 혼합한다. 적절한 경우, 그후 건조 작업을 실시한다.
- [0574] 본 발명에 따라 사용가능한 종자 분의 제제의 적용 비율은 비교적 넓은 범위내에서 변경 가능하다. 이는 제제 내의 활성 성분의 특정 함유량 및 종자에 의하여 안내된다. 활성 성분 조합의 적용 비율은 일반적으로 종자 1 kg당 0.001 내지 50 g, 바람직하게는 종자 1 kg당 0.01 내지 15 g이다.
- [0575] 게다가, 본 발명의 화학식 I의 화합물은 또한 항진균성 효과가 매우 우수하다. 이들은 특히 피부사상균 및 효모, 곰팡이 및 2상성 진균 (예를 들어 캔디다(Candida) 중, 예컨대 캔디다 알비칸스(Candida albicans), 캔디다 글라브라타(Candida glabrata) 및 에피더모파이톤 플로코숨(Epidermophyton floccosum), 아스페르길루스 (Aspergillus) 중, 예컨대 아스페르길루스 니거(Aspergillus niger) 및 아스페르길루스 푸미가투스 (Aspergillus fumigatus), 트리코파이톤(Trichophyton) 중, 예컨대 트리코파이톤 멘타그로파이트(Trichophyton mentagrophyte), 마이크로스포론(Microsporion) 중, 예컨대 마이크로스포론 카니스(Microsporion canis) 및 아우도우이니(audouinii)에 대해 매우 광범위한 항균 활성 스펙트럼을 갖는다. 이들 진균의 열거는 결코 포함되는 항균 스펙트럼의 한정을 의미하는 것이 아니며, 단지 예시의 특징이 된다.
- [0576] 그러므로, 본 발명의 화학식 I의 활성 성분은 의학적 및 비-의학적 적용 모두에 사용될 수 있다.
- [0577] 활성 성분은 그 상태대로, 그의 제제의 형태 또는 이로부터 생성된 사용 형태, 예컨대 사용 준비가 된 액제, 현탁액, 습윤성 분말, 페이스트, 가용성 분말, 산분, 과립의 형태로 사용될 수 있다. 적용은 통상의 방식으로, 예를 들어 살수, 분무, 분사, 살포, 살분, 포밍, 뿌리기 등에 의하여 달성된다. 또한, 활성 성분을 극소 용적법으로 적용하거나 또는 활성 성분 제제 또는 활성 성분 그 자체를 토양에 주입하는 것도 가능하다. 또한, 식물의 종자를 처리할 수 있다.
- [0578] 본 발명의 활성 성분이 살진균제로 사용되는 경우, 적용 비율은 비교적 넓은 범위내에서 적용의 유형에 의존하여 변경될 수 있다. 본 발명의 활성 성분의 적용 비율은
- [0579] - 식물 부분, 예를 들어 잎 처리의 경우: 0.1 내지 10,000 g/ha, 바람직하게는 10 내지 1,000 g/ha, 보다 바람직하게는 50 내지 300 g/ha (적용이 관주 또는 점적으로 수행되는 경우, 특히 암면 또는 펄라이트 등의 불활성 기재 사용시 적용 비율을 감소시킬 수 있음);
- [0580] - 종자 처리의 경우: 종자 100 kg당 2 내지 200 g, 바람직하게는 종자 100 kg당 3 내지 150 g, 특히 바람직하게는 종자 100 kg당 2.5 내지 25 g, 매우 특히 바람직하게는 종자 100 kg당 2.5 내지 12.5 g;
- [0581] - 토양 처리의 경우: 0.1 내지 10,000 g/ha, 바람직하게는 1 내지 5,000 g/ha.
- [0582] 이러한 적용 비율은 단지 예시를 위한 것이며, 본 발명의 목적을 한정하고자 하는 것이 아니다.
- [0583] 본 발명의 활성 성분은 수의학 분야 및 축산업에서, 예를 들어 정제, 캡슐, 포션, 드렌치, 과립제, 페이스트제, 거환제, 사료를 통한 방법, 좌약의 형태로, 비경구 투여, 예를 들어 주사 (근육내, 피하, 정맥내 및 복강내 등)에 의하여, 임플란트, 비강내 투여에 의하여, 예를 들어 침지 또는 목욕, 분무, 도포(pouring-on), 스폿온 (spotting-on), 세척, 가루뿌리기의 형태에 의하여 및 또한 활성 성분을 함유하는 성형품 형태, 예를 들어 목걸이, 귀표식(ear mark), 꼬리 표식, 다리 밴드, 고삐, 표시장치 등의 형태로 피부 적용에 의하여 공지된 방식으로 사용된다.
- [0584] 가축, 가금류, 애완동물 등에 사용하는 경우, 화학식 I의 활성 성분은 활성 성분을 1 내지 80 중량%의 양으로 포함하는 제제 (예를 들어 산제, 에멀전, 유동제)로서 직접 또는 100 내지 10,000 배 희석하여 사용될 수 있거나 또는 약품 베쓰의 형태로 사용될 수 있다.
- [0585] 사용 준비가 된 조성물은 임의로 또한 기타 살충제 및 임의로 또한 1종 이상의 살진균제를 포함할 수 있다.
- [0586] 가능한 추가의 혼합 파트너에 관하여서는 상기 언급한 살충제 및 살진균제를 참조한다.

- [0587] 동시에, 본 발명의 화합물은 염수 또는 기수와 접촉하고 있는 물체, 예를 들어 선박 선체, 스크린, 그물, 구조물, 정박장 및 신호 시스템을 오염물로부터 보호하기 위하여 사용될 수 있다.
- [0588] 게다가, 본 발명의 화합물은 방오성 조성물로서 단독으로 또는 기타 활성 성분과 조합하여 사용될 수 있다.
- [0589] 본 발명의 처리 방법은 유전자 변형 유기체 (GMO), 예를 들어 식물 또는 종자의 처리에 사용될 수 있다. 유전자 변형된 식물 (또는 형질전환 식물)은 이종 유전자가 게놈에 안정하게 통합된 식물이다. "이종 유전자"라는 표현은 본질적으로 식물 외부에서 제공되거나 또는 어셈블되고, 핵, 엽록체 또는 미토콘드리아 게놈에 도입된 경우 해당 단백질 또는 폴리펩티드를 발현시키거나 또는 식물중에 존재하는 기타 유전자(들)를 하향조절 또는 사일런싱 처리하여 (예를 들어 안티센스 기술, 공동억제 기술 또는 RNAi [RNA 간섭]을 사용하여) 형질전환된 식물에 새롭거나 또는 개선된 작물학적 특성 또는 기타 특성을 제공하는 유전자를 의미한다. 게놈에 존재하는 이종 유전자는 또한 이식유전자(transgene)로도 불린다. 식물 게놈에서 그의 특정 존재로 정의되는 이식유전자는 형질전환 또는 유전자이식 이벤트로 불리운다.
- [0590] 식물 종 또는 식물 품종, 그들의 위치 및 성장 조건 (토양, 기후, 성장 기간, 영양분)에 따라서, 본 발명에 따른 처리는 또한 초상가적 ("상승작용적") 효과를 일으킬 수도 있다. 따라서, 예를 들어 본 발명에 따라 사용될 수 있는 활성 성분 및 조성물의 적용 비율의 감소 및/또는 활성 스펙트럼의 확장 및/또는 활성 증가, 식물 성장성 향상, 고온 또는 저온 내성 증가, 가뭄 또는 물 또는 토양 염분 함량에 대한 내성 증가, 개화성 증가, 수확 용이성, 성숙성 촉진, 수확량 증가, 더 큰 과실, 더 큰 식물 높이, 더 푸른 잎 색깔, 더 이른 개화, 수확산물의 더 높은 품질 및/또는 더 큰 영양가, 과실내의 더 높은 당도, 수확산물의 더욱 우수한 저장 안정성 및/또는 가공성의 효과가 가능하고, 이는 실제로 예상되는 효과를 능가한다.
- [0591] 본 발명의 활성 성분 조합은 또한 특정 적용 비율에서 식물에 강화 효과를 발휘할 수 있다. 그러므로, 이들은 원치않는 식물병원성 진균 및/또는 미생물 및/또는 바이러스 공격에 대하여 식물의 방어계를 구축하는데 적절하다. 이는 예를 들어 진균에 대한 본 발명의 조합물의 활성이 향상된 이유가 될 수 있다. 여기에서, 식물 강화 (내성-유도) 물질은 원치않는 식물병원성 진균 및/또는 미생물 및/또는 바이러스로 접촉시 처리된 식물에 이들 원치않는 식물병원성 진균 및/또는 미생물 및/또는 바이러스에 대하여 상당한 정도의 저항성이 생기도록 식물의 방어계를 자극할 수 있는 물질 또는 물질의 조합물을 의미하는 것으로 이해하여야 한다. 이러한 경우에서, 원치않는 식물병원성 진균 및/또는 미생물 및/또는 바이러스는 식물병원성 진균, 세균 및 바이러스를 의미하는 것으로 이해하여야 한다. 따라서, 본 발명의 물질은 처리후 일정 기간동안 언급된 병원균에 의한 공격으로부터 식물을 보호하기 위하여 사용될 수 있다. 보호 기간은 식물을 활성 성분으로 처리한 후 일반적으로 1 내지 10 일, 바람직하게는 1 내지 7 일에 이른다.
- [0592] 본 발명에 따라 바람직하게 처리되는 식물 및 식물 품종은 이들 식물에 특히 유리하고 유용한 특성을 부여하는 유전자를 갖는 모든 식물이다 (육종 및/또는 생명공학 수단에 상관없이).
- [0593] 본 발명에 따라 또한 바람직하게 처리되는 식물 및 식물 품종은 1종 이상의 생물적 스트레스에 대하여 내성이 있는 것으로, 즉, 상기 식물은 동물 및 미생물 해충, 예를 들어 선충류, 곤충, 응애, 식물병원성 진균, 박테리아, 바이러스 및/또는 바이로이드에 대한 방어성이 더욱 우수하다.
- [0594] 본 발명에 따라 마찬가지로 처리될 수 있는 식물 및 식물 품종은 1종 이상의 비생물적 스트레스에 대하여 내성이 있는 식물이다. 비생물적 스트레스 조건의 예로는 가뭄, 냉온 노출, 열 노출, 삼투성 스트레스, 홍수, 증가된 토양 염분, 증가된 광물 노출, 오존 노출, 강한 광 조건, 질소 영양분의 제한적 이용가능성, 인 영양분의 제한적 이용가능성, 음지 회피성(shade avoidance)을 들 수 있다.
- [0595] 본 발명에 따라 마찬가지로 처리될 수 있는 식물 및 식물 품종은 수확량 증가를 특징으로 하는 식물이다. 상기 식물에서 수확량 증가는 예를 들어 개선된 식물 생리성, 개선된 성장 및 발달, 예를 들어 물 이용 효율, 물 보유 효율, 개선된 질소 이용, 강화된 탄소 동화, 개선된 광합성, 증가된 발아 효율 및 가속화된 성숙의 결과일 수 있다. 수확량은 또한 이른 개화, 잡종 종자 생산용 개화 조절, 모종 성장력, 식물 크기, 절간 개수 및 거리, 뿌리 성장, 종자 크기, 과실 크기, 꼬투리 크기, 꼬투리 또는 이삭 개수, 꼬투리 또는 이삭당 종자 개수, 종자 질량, 강화된 종자 필링성(filling), 종자 이산성 감소, 꼬투리 열개(dehiscence) 감소 및 내도복성(lodging resistance)을 비롯한 개선된 식물 아키텍처(architecture)에 의하여 (스트레스 및 비스트레스 조건 하에) 영향을 받을 수 있다. 추가의 수확량 특성으로는 종자 조성, 예를 들어 탄수화물 함유량, 단백질 함유량, 오일 함유량 및 조성, 영양가, 반-영양적 화합물의 감소, 개선된 가공성 및 더 우수한 저장 안정성을 들 수 있다.

- [0596] 본 발명에 따라 처리될 수 있는 식물은 일반적으로 더 높은 수확량, 생장력, 활력 및 생물적 및 비생물적 스트레스 요인에 대한 내성을 초래하는 잡종강세 또는 잡종 생장력의 특성을 이미 발현시킨 잡종 식물이다. 이러한 식물은 통상적으로 근교 수컷-불임 어버이 계통 (암컷 어버이)을 다른 근교 수컷-번식성 어버이 계통 (수컷 어버이)과 이종교배시켜 생성된다. 잡종 종자는 통상적으로 수컷 불임 식물로부터 수확되어 재배자들에게 판매된다. 수컷 불임 식물은 때때로 (예, 옥수수에서) 수꽃이삭제거(detasseling) (즉 수컷 생식 기관 또는 수컷 꽃의 기계적 제거)에 의하여 생성될 수 있으나, 보다 통상적으로 수컷 불임성은 식물 게놈에서 유전 결정기의 결과이다. 이 경우 및 특히, 종자가 잡종 식물로부터 수확하고자 하는 바람직한 산물인 경우, 이는 통상적으로 수컷 불임성에 관여하는 유전 결정기를 함유하는 잡종 식물에서 수컷 번식성을 완전히 회복시키는 것을 보장하는데 유용하다. 이는 수컷 어버이가 수컷 불임성에 관여하는 유전 결정기를 함유하는 잡종 식물에서 수컷 생식성을 회복시킬 수 있는 적절한 생식성 회복 유전자를 갖도록 보장함으로써 달성될 수 있다. 수컷 불임성에 대한 유전 결정기는 세포질에 위치할 수 있다. 세포질 수컷 불임성 (CMS)의 예는 브라시카(Brassica) 종에서 기재되어 있다. 그러나, 수컷 불임성에 대한 유전 결정기는 또한 핵 게놈에 위치할 수도 있다. 수컷 불임 식물은 또한 식물 생명공학 방법, 예컨대 유전자 공학으로 수득할 수 있다. 수컷-불임 식물을 얻는 특히 유용한 수단은 W089/10396에 기재되어 있으며, 여기에서는 예를 들어 리보뉴클레아제, 예를 들어 바르나제(barnase)가 수술의 융단 세포에서 선택적으로 발현된다. 그 후, 생식성이 리보뉴클레아제 억제제, 예를 들어 바르스타(barstar)의 융단 세포에서의 발현으로 회복될 수 있다.
- [0597] 본 발명에 따라 처리될 수 있는 (유전자 공학과 같은 식물 생명공학 방법으로 얻은) 식물 또는 식물 품종은 제조 내성 식물, 즉 1종 이상의 주어진 제조제에 대하여 내성을 갖도록 생성된 식물일 수 있다. 이러한 식물은 유전자 형질전환 또는 이러한 제조제 내성을 부여하는 돌연변이를 함유하는 식물의 선별에 의하여 수득할 수 있다.
- [0598] 제조제-내성 식물은 예를 들어 글리포세이트-내성 식물, 즉 제조제 글리포세이트 또는 그의 염에 대하여 내성을 갖도록 생성된 식물이다. 예를 들어 글리포세이트-내성 식물은 식물을 효소 5-에놀피루빌시킴에이트-3-포스페이트 신타제(EPSPS)를 인코딩하는 유전자로 형질전환시켜 수득할 수 있다. 이러한 EPSPS 유전자의 예로는 살모넬라 티피무리움(*Salmonella typhimurium*) 박테리아의 AroA 유전자 (돌연변이 CT7), 아그로박테리움 종 (*Agrobacterium* sp.) 박테리아의 CP4 유전자, 페투니아(*Petunia*) EPSPS를 인코딩하는 유전자, 토마토 EPSPS 또는 엘레우신(*Eleusine*) EPSPS를 들 수 있다. 이는 또한 돌연변이 EPSPS일 수 있다. 글리포세이트-내성 식물은 또한 글리포세이트 옥시도리덕타제 효소를 인코딩하는 유전자를 발현시켜 수득할 수 있다. 글리포세이트-내성 식물은 또한 글리포세이트 아세틸 트랜스퍼라제 효소를 인코딩하는 유전자를 발현시켜 수득할 수 있다. 글리포세이트-내성 식물은 또한 상기 언급된 유전자의 자연-발생 돌연변이 식물을 선택하여 얻을 수도 있다.
- [0599] 기타 제조제 내성 식물은 효소 글루타민 신타제를 억제하는 제조제, 예를 들어 비알라포스, 포스포노트리신 또는 글루포시네이트에 대하여 내성이 갖도록 생성된 식물이다. 이러한 식물은 제조제를 해독하는 효소 또는 억제에 대한 내성이 있는 돌연변이 글루타민 신타제 효소를 발현시켜 수득할 수 있다. 이러한 유효한 해독 효소 중 하나는 포스포노트리신 아세틸트랜스퍼라제 (예를 들어 스트렙토미세스 종(*Streptomyces* species)으로부터의 바(bar) 또는 팻(pat) 단백질)을 인코딩하는 효소이다. 외인성 포스포노트리신 아세틸트랜스퍼라제를 발현시키는 식물이 또한 기재되어 있다.
- [0600] 추가의 제조제-내성 식물은 또한 효소 히드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 억제하는 제조제에 대한 내성을 갖도록 생성된 식물이다. 히드록시페닐피루베이트 디옥시게나제는 파라-히드록시페닐피루베이트 (HPP)가 호모젠티세이트(homogentisate)로 전환되는 반응을 촉매화하는 효소이다. HPPD 억제제에 내성이 있는 식물은 자연 발생 내성 HPPD 효소를 인코딩하는 유전자 또는 돌연변이 HPPD 효소를 인코딩하는 유전자로 형질전환될 수 있다. HPPD 억제제에 대한 내성은 또한 HPPD 억제제에 의한 고유 HPPD 효소의 억제에도 불구하고 식물을 호모젠티세이트 형성을 가능하게 하는 특정 효소를 인코딩하는 유전자로 형질전환시켜 수득할 수 있다. 식물의 HPPD 억제제에 대한 내성은 또한 식물을 HPPD-내성 효소를 인코딩하는 유전자 외에 효소 프레페네이트 데히드로게나제를 인코딩하는 유전자로 형질전환시켜 개선될 수도 있다.
- [0601] 추가의 제조제-내성 식물은 아세트락테이트 신타제 (ALS) 억제제에 내성을 갖도록 생성된 식물이다. 공지된 ALS-억제제의 예로는 술폰일우레아, 이미다졸리논, 트리아졸로피리미딘, 피리미디닐 옥시(티오)벤조에이트 및/또는 술폰일아미노카보닐트리아졸리논 제조제를 들 수 있다. ALS 효소에서 상이한 돌연변이 (아세트히드록시산 신타제, AHAS로도 공지됨)는 상이한 제조제 및 제조제 군에 내성을 부여하는 것으로 공지되어 있다. 술폰일우레아-내성 식물 및 이미다졸리논-내성 식물의 생성은 국제 공보 W01996/033270에 기재되었다. 추가의 술폰일

우레아 및 이미다졸리논-내성 식물은 또한 예를 들어 WO2007/024782에 기재되어 있다.

- [0602] 이미다졸리논 및/또는 술폰일우레아에 대한 내성을 갖는 기타 식물은 돌연변이생성 유도, 제조제의 존재하에 세포 배양물에서의 선별 또는 돌연변이 육종에 의하여 획득할 수 있다.
- [0603] 또한, 본 발명에 따라 처리될 수 있는 (유전자 공학과 같은 식물 생명공학 방법에 의하여 얻은) 식물 또는 식물 품종은 곤충-내성 형질전환 식물, 즉 특정 표적 곤충에 의한 공격에 대한 내성을 갖도록 생성된 식물이다. 이러한 식물은 유전자 형질전환 또는 이러한 곤충 내성을 부여하는 돌연변이를 함유하는 식물 선별로 획득할 수 있다.
- [0604] 본원에서, 용어 "곤충-내성 형질전환 식물"은 하기 1) 내지 8)을 인코딩하는 코딩 시퀀스를 포함하는 하나 이상의 이식유전자를 함유하고 있는 임의의 식물을 포함한다:
- [0605] 1) 바실루스 투링기엔시스 유래 살충성 결정 단백질 또는 그의 살충성 부분, 예컨대 온라인 (http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/)에 편성된 살충성 결정 단백질 또는 그의 살충성 부분, 예를 들어 Cry 단백질 클래스 Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae 또는 Cry3Bb의 단백질, 또는 그의 살충성 부분; 또는
- [0606] 2) 바실루스 투링기엔시스로서 제2의 기타 결정 단백질 또는 그의 부분의 존재 하에 살충성인 바실루스 투링기엔시스 유래의 결정 단백질 또는 그의 부분, 예를 들어 Cy34 및 Cy35 결정 단백질로 이루어진 이원성 독소; 또는
- [0607] 3) 바실루스 투링기엔시스 유래의 2종의 상이한 살충성 결정 단백질 부분을 포함하는 잡종 살충성 단백질, 예를 들어 상기 1)의 단백질 잡종 또는 상기 2)의 단백질 잡종, 예를 들어 옥수수 이벤트 MON98034 (WO2007/027777)에 의하여 생성된 Cry1A.105 단백질; 또는
- [0608] 4) 표적 곤충 종에 대한 고도의 살충 활성을 얻고 및/또는 영향을 받는 표적 곤충 종의 범위를 확대하기 위하여 및/또는 복제 또는 형질전환 중에 인코딩 DNA로 유도되는 변화로 인하여 일부, 특히 1 내지 10개의 아미노산이 또다른 아미노산에 의해 대체되는 상기 1) 내지 3) 중 임의의 하나의 단백질, 예를 들어 옥수수 이벤트 MON863 또는 MON88017에서 Cry3Bb1 단백질 또는 옥수수 이벤트 MIR604에서 Cry3A 단백질; 또는
- [0609] 5) 바실루스 투링기엔시스 또는 바실루스 세레우스(*Bacillus cereus*)로부터 분비된 살충성 단백질 또는 그의 살충성 부분, 예를 들어 http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html에 열거된 식물성 살충성(VIP) 단백질, 예를 들어 VIP3Aa 단백질 부류의 단백질; 또는
- [0610] 6) 바실루스 투링기엔시스 또는 바실루스 세레우스로부터 분비된 제2 단백질의 존재 하에 살충성인 바실루스 투링기엔시스 또는 바실루스 세레우스로부터 분비된 단백질, 예를 들어 VIP1A 및 VIP2A 단백질로 이루어진 이원성 독소; 또는
- [0611] 7) 바실루스 투링기엔시스 또는 바실루스 세레우스로부터 분비된 상이한 단백질의 부분을 포함하는 잡종 살충성 단백질, 예를 들어 상기 1)에서의 단백질 잡종 또는 상기 2)에서의 단백질 잡종; 또는
- [0612] 8) 표적 곤충 종에 대한 고도의 살충 활성을 얻고 및/또는 영향을 받는 표적 곤충 종의 범위를 확대하기 위하여 및/또는 복제 또는 형질전환중에 (여전히 살충성 단백질을 인코딩하면서) 인코딩 DNA로 유도되는 변화로 인하여 일부, 특히 1 내지 10개의 아미노산이 또다른 아미노산에 의해 대체되는 상기 1) 내지 3) 중 임의의 하나의 단백질, 예를 들어 목화 이벤트 COT102에서 VIP3Aa 단백질.
- [0613] 물론, 본원에 사용된 바와 같이 곤충-내성 형질전환 식물은 또한 전술한 1 내지 8 부류중 임의의 하나의 단백질을 인코딩하는 유전자 조합을 포함하는 임의의 식물도 포함한다. 하나의 구체예에서, 곤충-내성 식물은 영향을 받는 표적 곤충 종의 범위를 확대하거나 또는 곤충에서 상이한 수용체 결합 부위에 결합되는 바와 같이 작용 모드는 상이하지만 동일한 표적 곤충 종에 대하여 상이한 단백질 살충성을 사용하여 식물에 대한 곤충 내성 발생을 지연시키기 위하여 전술한 1 내지 8 부류 중 임의의 하나의 단백질을 인코딩하는 1 초과개의 이식유전자를 함유한다.
- [0614] 또한, 본 발명에 따른 처리될 수 있는 (유전자 공학과 같은 식물 생명공학 방법에 의해 얻은) 식물 또는 식물 품종은 비생물적 스트레스 인자에 대하여 내성을 갖는다. 그러한 식물은 유전자 형질전환에 의하여 또는 그러한 스트레스 내성을 부여하는 돌연변이를 함유하는 식물의 선택에 의하여 획득할 수 있다. 특히 유용한 스트레스-내성 식물로는 하기를 들 수 있다:

- [0615] a. 식물 세포 또는 식물에서 폴리(ADP-리보스)폴리머라제 (PARP) 유전자의 발현 및/또는 활성을 감소시킬 수 있는 이식유전자를 함유하는 식물.
- [0616] b. 식물 또는 식물 세포의 PARG-인코딩 유전자의 발현 및/또는 활성을 감소시킬 수 있는 스트레스 내성-강화 이식유전자를 함유하는 식물.
- [0617] c. 니코틴아미다제, 니코티네이트 포스포리보실트랜스퍼라제, 니코틴산 모노뉴클레오티드 아데닐트랜스퍼라제, 니코틴아미드 아데닌 디뉴클레오티드 신데타제 또는 니코틴아미드 포스포리보실트랜스퍼라제를 비롯한 니코틴아미드 아데닌 디뉴클레오티드 셀비지(salvage) 생합성 경로의 식물-기능성 효소를 코딩하는 스트레스 내성-강화 이식유전자를 함유하는 식물.
- [0618] 또한, 본 발명에 따라 처리될 수 있는 (유전자 공학과 같은 식물 생명공학 방법에 의해 얻은) 식물 또는 식물 품종은 하기와 같이 수확 산물의 변경된 양, 품질 및/또는 저장 안정성 및/또는 수확 산물의 특정 성분의 변경된 특성을 나타낸다:
- [0619] 1) 야생형 식물 세포 또는 식물에서 합성된 전분에 비하여 그의 물리화학적 특성, 특히 아밀로스 함유량 또는 아밀로스/아밀로펙틴 비, 분지도, 평균 쇄 길이, 측쇄 분포, 점도 거동, 겔 내성, 전분의 그레인 크기 및/또는 그레인 형태가 변경된 변성 전분을 합성하며, 이러한 변형 전분이 특정 적용예에 대하여 더 적합한 형질전환 식물.
- [0620] 2) 비-전분 탄수화물 중합체를 합성하거나, 또는 유전적 변형 없이 야생형 식물에 비하여 특성이 변경된 비-전분 탄수화물 중합체를 합성하는 형질전환 식물. 그의 예로는 특히 이눌린 및 레반-타입의 폴리프룩토스를 생성하는 식물, 알파-1,4-글루칸을 생성하는 식물, 알파-1,6 분지형 알파-1,4-글루칸을 생성하는 식물, 알터난을 생성하는 식물을 들 수 있다.
- [0621] 3) 히알루로난을 생성하는 형질전환 식물.
- [0622] 또한, 본 발명에 따른 처리될 수 있는 (유전자 공학과 같은 식물 생명공학 방법에 의해 얻은) 식물 또는 식물 품종은 섬유 특성이 변경된 식물, 예컨대 목화 식물이다. 이러한 식물은 유전자 형질전환에 의하여 또는 이와 같은 변경된 섬유 특성을 부여하는 돌연변이를 함유하는 식물을 선별하여 얻을 수 있으며, 하기를 포함한다:
- [0623] a) 셀룰로스 신타제 유전자의 변형된 형태를 함유하는 식물, 예컨대 목화 식물,
- [0624] b) rsw2 또는 rsw3 상동성 핵산의 변형된 형태를 함유하는 식물, 예컨대 목화 식물;
- [0625] c) 수크로스 포스페이트 신타제의 발현이 증가된 식물, 예컨대 목화 식물;
- [0626] d) 수크로스 신타제 발현이 증가된 식물, 예컨대 목화 식물;
- [0627] e) 섬유 세포에 기초한 예를 들어 섬유-선택적 β -1,3-글루카나제의 하향조절을 통하여 플라즈모데스마탈 게이팅(plasmodesmatal gating) 시기가 변경된 식물, 예컨대 목화 식물;
- [0628] f) 예를 들어 nodC 및 키틴 신타제 유전자를 포함하는 N-아세틸글루코사민트랜스퍼라제 유전자의 발현을 통하여 반응성이 변경된 섬유를 갖는 식물, 예컨대 목화 식물.
- [0629] 또한, 본 발명에 따라 처리될 수 있는 (유전자 공학과 같은 식물 생명공학 방법에 의해 얻은) 식물 또는 식물 품종은 오일 프로파일 특성이 변경된 식물, 예컨대 유채 또는 관련 브라시카(Brassica) 식물이다. 이러한 식물은 유전자 형질전환에 의하여 또는 그러한 오일 특성 변경을 부여하는 돌연변이를 함유하는 식물의 선택에 의하여 얻을 수 있으며, 하기를 포함한다:
- [0630] a) 올레산 함유량이 높은 오일을 생성하는 식물, 예컨대 유채 식물;
- [0631] b) 리놀렌산 함량이 낮은 오일을 생산하는 식물, 예컨대 유채 식물;
- [0632] c) 포화 지방산의 레벨이 낮은 오일을 생성하는 식물, 예컨대 유채 식물.
- [0633] 본 발명에 따라 처리될 수 있는 특히 유용한 형질전환 식물은 1종 이상의 독소를 인코딩하는 유전자를 하나 이상 포함하며 상표명 일드 가드(YIELD GARD)[®] (예를 들어 옥수수, 목화, 대두), 녹아웃(KnockOut)[®] (예를 들어 옥수수), 바이트가드(BiteGard)[®] (예를 들어 옥수수), Bt-Xtra[®] (예를 들어 옥수수), 스타링(StarLink)[®] (예를 들어 옥수수), 볼가드(Bollgard)[®] (목화), 누코튼(Nucotn)[®] (목화), 누코튼 33B[®] (목화), 네이처가드(NatureGard)[®] (예

를 들어 옥수수), 프로텍타[®] 및 뉴리프[®] (Protecta and NewLeaf)(감자)로 시판중인 형질전환 식물이다. 제초제-내성 식물의 예로 상표명 라운드업 레디(Roundup Ready)[®](글리포세이트에 대한 내성, 예를 들어 옥수수, 목화, 대두), 리버티 링크(Liberty Link)[®](포스포노트리신에 대한 내성, 예를 들어 유채), IMI[®](이미다졸리논에 대한 내성) 및 SCS[®](솔포닐우레아에 대한 내성, 예를 들어 옥수수)로 시판되고 있는 옥수수 품종, 목화 품종 및 대두 품종을 들 수 있다. 언급되어야 하는 제초제-내성 식물 (제초제 내성을 위하여 통상적인 방식으로 육종된 식물)의 예로는 클리어필드(Clearfield)[®]로 시판되고 있는 품종 (예를 들어 옥수수)을 들 수 있다.

[0634] 본 발명에 따라 처리될 수 있는 특히 유용한 형질전환 식물은 다양한 국가 또는 지역의 감독 기관의 데이터베이스에서 예에 대하여 제시되어 있는 형질전환 이벤트 또는 형질전환 이벤트 조합을 함유하는 식물이다 (예를 들어 http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx 및 <http://www.agbios.com/dbase.php>를 참조한다).

[0635] 제시된 식물은 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물 및/또는 활성 성분 혼합물로 특히 유리한 방식으로 본 발명에 따라 처리될 수 있다. 또한, 활성 성분 또는 혼합물에 대하여 상기 명시된 바람직한 범위는 이들 식물의 처리에 적용된다. 본 명세서에서 구체적으로 언급된 화합물 또는 혼합물을 사용한 식물의 처리를 특히 강조한다.

[0636] 그래서, 본 발명의 활성 성분 또는 조성물은 처리후 특정 시간 동안 언급된 병원균에 의한 공격으로부터 식물을 보호하는데 사용될 수 있다. 보호가 제공되는 기간은 일반적으로 활성 성분으로 식물을 처리한 후 1 내지 28 일, 바람직하게는 1 내지 14 일, 보다 바람직하게는 1 내지 10 일, 보다 더 바람직하게는 1 내지 7 일 또는 종자 처리후 200 일까지이다.

[0637] 본 발명의 화학식 I의 활성 성분의 제조 및 용도는 하기의 실시예에 의하여 예시된다. 그러나, 본 발명은 이러한 실시예에 한정되지 않는다.

[0638] 주: 달리 나타내지 않는 한, 모든 크로마토그래피 정제 및 분리 단계는 실리카 겔에서 0:100 에틸 아세테이트/시클로헥산 내지 100:0 에틸 아세테이트/시클로헥산으로부터의 용매 구배를 사용하여 실시한다.

[0639] 출발 물질의 제조:

[0640] tert-부틸 4-{4-[(히드록시이미노)메틸]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-카르복실레이트(A)

[0641] 에탄올(110 ml) 중의 tert-부틸 4-(4-포르밀-1,3-티아졸-2-일)피페리딘-1-카르복실레이트(10.0 g)의 용액에 히드록실아민(물 중의 50%, 2.48 ml)을 적가하였다. 혼합물을 2 시간 동안 환류 가열하였다. 그후, 휘발성 물질을 감압 하에서 제거하였다. 이는 tert-부틸 4-{4-[(히드록시이미노)메틸]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-카르복실레이트(10.5 g, 100%)를 생성하였다.

logP (pH 2.7): 2.25, 2.38

¹H NMR (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1.41 (s, 9H), 1.49-1.60 (m, 2H), 1.99-2.06 (m, 2H), 2.82-2.96 (m, 2H), 3.16-3.24 (m, 1H), 3.96-4.05 (m, 2H), 7.62 (s, 0.15 H), 7.76 (s, 0.85 H), 8.13 (s, 0.85H), 8.39 (s, 0.15H), 11.22 (s, 0.85H), 11.95 (s, 0.15H)

[0642] MS (ESI): 312 ([M+H]⁺)

[0643] tert-부틸 4-{4-[5-(에톡시카르보닐)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-카르복실레이트(B)

[0644] 디메틸포름아미드(40 ml) 중의 tert-부틸 4-{4-[(히드록시이미노)메틸]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-카르복실레이트(A, 2.00 g)의 용액에 N-클로로숙신아미드(0.90 g)를 실온에서 첨가하였다. 반응 혼합물을 40°C에서 3 시간 동안 교반하였다. 그후, 실온에서 테트라히드로푸란(20 ml) 중의 에틸 아크릴레이트(0.77 g) 및 트리에틸아민(0.98 g)의 용액을 혼합물에 연속적으로 적가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 밤새 교반한 후, 물을 첨가하였다. 수성 상을 제거하고, 에틸 아세테이트로 추출하였다. 그후, 합한 유기 상을 황산나트륨의 위에서 건조시켰다. 고체를 여과하고, 용매를 증발시켰다. 잔류물을 크로마토그래피로 정제하였다. 이에 의하여 tert-부틸 4-{4-[5-(에톡시카르보닐)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-카르복실레이트(2.30 g, 79%)를 수득하였다.

logP (pH 2.7): 3.14

¹H NMR (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm} : 1.22 (t, 3H), 1.41 (s, 9H), 1.46-1.63 (m, 2H), 1.97-2.09 (m, 2H), 2.80-2.97 (m, 2H), 3.52-3.61 (m, 1H), 3.68-3.80 (m, 1H), 3.96-4.05 (m, 2H), 4.16 (q, 2H), 5.20-5.27 (m, 1H), 8.05 (s, 1H)

MS (ESI): 310 ([M+H-C(CH₃)₃]⁺)

[0645]

[0646] 4-{4-[5-(메톡시카르보닐)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리디늄 클로라이드(C)

[0647]

아르곤 분위기 하에서, 0°C에서 디옥산(11.4 ml) 중의 염화수소의 4 N 용액을 디옥산(12 ml) 중의 tert-부틸 4-{4-[5-(메톡시카르보닐)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-카르복실레이트(B, 1.20 g)의 용액에 적가하였다. 반응 혼합물을 0°C에서 교반한 후, 점진적으로 실온으로 가온시켰다. 4 시간 후, 용매 및 과잉의 염화수소를 제거하였다. 이에 의하여 4-{4-[5-(메톡시카르보닐)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리디늄 클로라이드(1.10 g, 98%)을 수득하였다.

¹H NMR (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1.85-2.02 (m, 2H), 2.11-2.22 (m, 2H), 2.92-3.10 (m, 2H), 3.30-3.38 (m, 2H), 3.71 (s, 3H), 5.23-5.31 (m, 1H), 8.09 (s, 1H), 8.90 (bs, 1H), 9.20 (bs, 1H)

[0648]

[0649] 메틸 3-[2-(1-{[3,5-비스(디플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸}피페리딘-4-일)-1,3-티아졸-4-일]-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-5-카르복실레이트(I-1)

[0650]

디클로로메탄(10 ml) 중의 [3,5-비스(디플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세트산(0.83 g)의 용액에 0°C에서 염화옥살릴(1.26 g) 및 1 방울의 N,N-디메틸포름아미드를 첨가하였다. 혼합물을 실온에서 60 분 동안 교반하였다. 용매 및 과잉의 시약을 감압 하에서 제거하였다. 고체 잔류물을 다시 디클로로메탄에 용해시키고, 0°C에서 디클로로메탄(14 ml) 중의 염화4-{4-[5-(메톡시카르보닐)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리디늄(C) 및 트리에틸아민(4.6 ml)의 용액에 적가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 3 시간 동안 교반하였다. 그후, 진한 탄산수소나트륨 용액을 이에 첨가하고, 수성 상을 제거하고, 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 상을 황산나트륨의 위에서 건조시키고, 농축시켰다. 컬럼 크로마토그래피로 정제하여 메틸 3-[2-(1-{[3,5-비스(디플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸}피페리딘-4-일)-1,3-티아졸-4-일]-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-5-카르복실레이트(1.1 g, 57%)를 수득하였다.

logP (pH 2.7): 2.26

¹H NMR (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm} : 1.51-1.60 (m, 1H), 1.74-1.85 (m, 1H), 2.05-2.14 (m, 2H), 2.80-2.88 (m, 2H), 3.21-3.30 (m, 1H), 3.58-3.65 (m, 1H), 3.71 (s, 3H), 3.70-3.79 (m, 1H), 3.92-3.98 (m, 1H), 4.30-4.37 (m, 1H), 5.26-5.30 (m, 1H), 5.35-5.46 (m, 2H), 6.91 (s, 1H), 7.04 (t, 1H), 7.18 (t, 1H), 8.08 (s, 1H)

[0651]

MS (ESI): 504 ([M+H]⁺)

[0652]

3-[2-(1-{[3,5-비스(디플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸}피페리딘-4-일)-1,3-티아졸-4-일]-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-5-카르복실산(D)

[0653]

테트라히드로푸란(7 ml) 및 물(2 ml) 중의 메틸 3-[2-(1-{[3,5-비스(디플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸}피페리딘-4-일)-1,3-티아졸-4-일]-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-5-카르복실레이트(I-1)(1.1 g)의 용액에 실온에서 수산화리튬 일수화물(0.28 g)을 첨가하였다. 혼합물을 실온에서 20 분 동안 교반한 후, 빙냉 1N HCl 용액을 첨가하였다. 수성 상을 에틸 아세테이트로 추출하고, 합한 유기 상을 황산나트륨의 위에서 건조시켰다. 고체를 여과하고, 용매를 증류시켰다. 이에 의하여 3-[2-(1-{[3,5-비스(디플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸}피페리딘-4-일)-1,3-티아졸-4-일]-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-5-카르복실산(0.82 g, 73%)을 수득하였다.

logP (pH 2.7): 1.77

¹H NMR (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm} : 1.50-1.63 (m, 1H), 1.74-1.88 (m, 1H), 2.05-2.17 (m, 2H), 2.79-2.89 (m, 1H), 3.52-3.60 (m, 1H), 3.66-3.75 (m, 1H), 3.92-4.00 (m, 1H), 4.31-4.38 (m, 1H), 5.12-5.16 (m, 1H), 5.32-5.45 (m, 2H), 6.90 (s, 1H), 7.02 (t, 1H), 7.16 (t, 1H), 8.06 (s, 1H)

[0654]

MS (ESI): 490 ([M+H]⁺)

[0655] 화학식 I의 화합물의 제조:

[0656] 2-클로로시클로헥실 3-[2-(1-([3,5-비스(디플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸)피페리딘-4-일)-1,3-티아졸-4-일]-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-5-카르복실레이트(I-5)

[0657] 디클로로메탄(5 ml) 중의 3-[2-(1-([3,5-비스(디플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸)피페리딘-4-일)-1,3-티아졸-4-일]-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-5-카르복실산(E, 160 mg)의 용액에 실온에서 2-클로로시클로헥산올(57 mg), 4-디메틸아미노피리딘(4 mg) 및 1-에틸-3-(3'-디메틸아미노프로필)카르보디이미드 염산염(94 mg)을 첨가하였다. 혼합물을 밤새 교반한 후, 물을 첨가하였다. 수성 상을 제거하고, 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 상을 황산나트륨의 위에서 건조시켰다. 고체를 여과하고, 용매를 증류시켰다. 잔류물을 크로마토그래피로 정제하였다. 이에 의하여 2-클로로시클로헥실 3-[2-(1-([3,5-비스(디플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸)피페리딘-4-일)-1,3-티아졸-4-일]-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-5-카르복실레이트(100 mg, 50%)를 수득하였다.

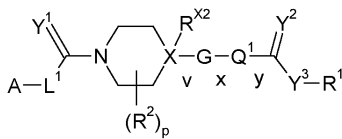
logP (pH 2.7): 3.43

¹H NMR (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm} : 1.29-2.21 (m, 12H), 2.78-2.89 (m, 2H), 3.54-3.63 (m, 1H), 3.75-3.88 (m, 1H), 3.92-4.03 (m, 1H), 4.06-4.17 (m, 1H), 4.30-4.39 (m, 1H), 4.78-4.86 (m, 1H), 5.24-5.47 (m, 3H), 6.89 (s, 1H), 7.02 (t, 1H), 7.16 (t, 1H), 8.08 (s, 1H)

[0658] MS (ESI): 606 ([M+H]⁺)

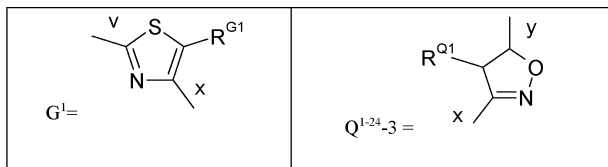
[0659] 상기 실시예와 유사하게 그리고 본 발명에 따른 방법의 일반적인 설명에 의하여 하기 표 1에 제시된 화학식 I의 화합물을 수득할 수 있다.

[0660] <화학식 I>



[0661]

[0662] 하기 표 1에 제시된 구조 성분 G 및 Q¹은 하기와 같이 정의한다:



[0663]

[0664] 하기 표 1에 제시된 모든 화합물의 경우, p는 0이다.

[0665] Y³이 0인 경우, R^{Y3}은 비워져야만 한다.

실시예	A	L1	Y ¹	XR ²	G	R ^{G1}	Q1	R ^{Q1}	Y ²	Y ³	R ^{Y3}	R ¹	log p
I-1	3-5-비스(디플루오로메틸)-III-피리졸-1-일	CH ₂	O	CH	G ¹	H	Q ¹²⁴ :3	H	O	O		CH ₃	2.28 ^(a) 2.28 ^(b)
I-2	3-5-비스(디플루오로메틸)-III-피리졸-1-일	CH ₂	O	CH	G ¹	H	Q ¹²⁴ :3	H	O	O		2-플루오로시클로헥실	3.17 ^(a) 3.19 ^(b)
I-3	3-5-비스(디플루오로메틸)-III-피리졸-1-일	CH ₂	O	CH	G ¹	H	Q ¹²⁴ :3	H	O	O		(1R,2S)-2-페닐시클로헥실	4.11 ^(a) 4.02 ^(b)
I-4	3-5-비스(디플루오로메틸)-III-피리졸-1-일	CH ₂	O	CH	G ¹	H	Q ¹²⁴ :3	H	O	O		(1S,2R)-2-시아노시클로헥실	2.95 ^(a) 2.91 ^(b)
I-5	3-5-비스(디플루오로메틸)-III-피리졸-1-일	CH ₂	O	CH	G ¹	H	Q ¹²⁴ :3	H	O	O		2-클로로시클로헥실	3.42 ^(a) 3.51 ^(b)
I-6	3-5-비스(디플루오로메틸)-III-피리졸-1-일	CH ₂	O	CH	G ¹	H	Q ¹²⁴ :3	H	O	O		1,2,3,4-테트라하이드로나프탈렌-1-일	3.73 ^(a) 3.79 ^(b)

표 1

[0666]

[0667]

실시예	A	L1	Y ¹	XR ²	G	R ⁶¹	Q1	R ⁰¹	Y ²	Y ³	R ^{Y3}	R ¹	log p
I-7	3-5-비스(디플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G ¹	H	Q1-24-3	H	O	O		2,6-디플루오로벤질	3.23 ¹⁰ ; 3.22 ¹⁰
I-8	3-5-비스(디플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G ¹	H	Q1-24-3	H	O	NR ^{Y3}	H	2-클로로벤질	2.88 ¹⁰ ; 2.89 ¹⁰
I-9	3-5-비스(디플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G ¹	H	Q1-24-3	H	O	NR ^{Y3}	H	2,4-디클로로벤질	3.33 ¹⁰ ; 3.29 ¹⁰
I-10	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	O		2-클로로시클로헥실	
I-11	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	NR ^Y	CH	시클로프로필	
I-12	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	O		2-메틸시클로헥실	
I-13	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	NR ^Y	H	시클로헥실메틸	
I-14	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	NR ^Y	CH	벤질	
I-15	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	NR ^Y	H	시클로프로필메틸	
I-16	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	O		2-브로모-4-플루오로 벤질	
I-17	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	O		시클로헥실	
I-18	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	O		시클로헥실메틸	
I-19	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	NR ^Y	CH	시클로헥실메틸	
I-20	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	NR ^Y	CH	페닐	
I-21	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	NR ^Y	H	에틸	
I-22	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	O		1,2,3,4-테트라히드로 나프탈렌-1-일	
I-23	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-III- 페리플-1-일	CH ₂	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH	O	O		헥실	

실시예	A	L1	Y ¹	XR ²	G	R ^{G1}	Q1	R ⁰¹	Y ²	Y ³	R ^{Y3}	R ¹	log p
I-24	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-11-1		O	NR ^Y ₃	H	벤질	
I-25	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-11-1		O	NR ^Y ₃	CH ₃	시클로프로필	
I-26	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	NR ^Y ₃	CH ₃	에틸	
I-27	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	O		나프탈렌-1-일	
I-28	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-11-1		O	NR ^Y ₃	CH ₃	벤질	
I-29	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-11-1		O	NR ^Y ₃	H	2-메틸시클로hexyl	
I-30	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	NR ^Y ₃	H	페닐	
I-31	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	O		시클로헥틸	
I-32	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	NR ^Y ₃	H	시클로hexyl	
I-33	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	NR ^Y ₃	CH ₃	시클로hexyl	
I-34	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	NR ^Y ₃	H	시클로프로필	
I-35	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	NR ^Y ₃	H	2-메틸시클로hexyl	
I-36	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	O		시클로hex-2-엔-1-일	
I-37	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	NR ^Y ₃	H	hexyl	
I-38	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	O		2-프로판릴	
I-39	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-11-1		O	NR ^Y ₃	CH ₃	에틸	
I-40	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리졸-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-11-1		O	NR ^Y ₃	H	에틸	

실시예	A	L1	Y ¹	XR ²	G	R ⁰¹	Q1	R ⁰¹	Y ²	Y ³	R ^{Y3}	R ¹	log p
141	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리azol-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	O		시클로헥릴메틸	
142	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리azol-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	NR ^Y ₃	H	부틸	
143	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리azol-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	NR ^Y ₃	H	벤질	
144	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리azol-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	O		벤질	
145	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리azol-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-11-1		O	NR ^Y ₃	H	시클로헥실	
146	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리azol-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	O		에틸	
147	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리azol-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	O		무틸	
148	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리azol-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	O		시클로프로필메틸	
149	5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피리azol-1-일	CH2	O	CH	G1	H	Q1-24-3	CH ₃	O	O		H	

[0670]

[0671] 키랄 라디칼의 아스타틴-중심 입체화학 설명: 키랄 라디칼이 마치 아스타틴에 결합된 것과 같이 명시한다.

[0672] logP 값은 하기 방법에 의하여 역상 컬럼 (C18)을 사용하여 HPLC (고 성능 액체 크로마토그래피)에 의하여 EEC Directive 79/831 Annex V.A8에 의하여 측정하였다.

[0673] ^[a] 측정은 용출제로서 0.1% 수성 인산 및 아세트니트릴을 사용하여 pH 2.3의 산 범위내에서 10% 아세트니트릴 내지 95% 아세트니트릴의 선형 구배로 실시한다.

[0674] ^[b] 중성 범위내에서의 LC-MS 측정은 용출제로서 0.001 몰 탄산수소암모늄 수용액 및 아세트니트릴을 사용하며, 10% 아세트니트릴 내지 95% 아세트니트릴의 구배로 pH 7.8에서 실시한다.

[0675] 보정은 공지의 logP 값 (2개의 연속하는 알카논 사이의 선형 내삽에 의한 보유 시간에 기초하여 측정된 logP 값)을 갖는 비분지형 알칸-2-온 (3 내지 16개의 탄소 원자를 가짐)으로 실시한다.

[0676] λ_{max} 값은 200 nm 내지 400 nm의 UV 스펙트럼을 사용하여 크로마토그래피 시그날의 최대값으로 측정하였다.

[0677] 선택한 실시예의 NMR 데이터

[0678] NMR 피크 리스트 방법

[0679] 실시예 I-1 내지 I-9의 ¹H NMR 데이터는 ¹H-NMR 피크 리스트 (DMSO-d₆)의 형태로 보고한다. 각각의 시그널 피크의 경우, δ 값(ppm) 및 괄호안의 시그널 강도를 제시한다:

<p>실시예 I-1</p> <p>8.7783 (1.07) 8.4335 (1.65) 8.0683 (5.48) 7.3089 (1.21) 7.1756 (2.75) 7.1706 (0.76) 7.1602 (1.5) 7.0424 (1.62) 7.0327 (0.44) 7.0242 (3.3) 6.9 (3.19) 6.8883 (1.96) 5.5064 (0.33) 5.4534 (0.5) 5.4102 (1.91) 5.3978 (0.5) 5.3687 (2.13) 5.326 (0.54) 5.2942 (1.05) 5.2783 (1.34) 5.2651 (1.17) 5.2491 (1.1) 4.3622 (0.55) 4.3248 (0.85) 4.3069 (1.24) 4.2891 (1.16) 4.2715 (0.37) 4.0569 (0.47) 4.0391 (1.48) 4.0213 (1.49) 4.0035 (0.59) 3.9826 (0.58) 3.9491 (0.63) 3.7902 (1.08) 3.7591 (0.82) 3.7448 (1.43) 3.7119 (16) 3.6418 (1.37) 3.6259 (1.39) 3.5983 (0.96) 3.5823 (1.43) 3.4154 (0.41) 3.3958 (0.48) 3.3871 (0.79) 3.3776 (0.46) 3.3581 (0.42) 3.3 (357.7) 3.2414 (0.67) 2.881 (0.39) 2.873 (0.41) 2.849 (0.66) 2.8424 (0.66) 2.8151 (0.37) 2.6734 (0.48) 2.6688 (0.67) 2.6642 (0.47) 2.5388 (0.68) 2.5221 (1.97) 2.5173 (3.24) 2.5087 (38.98) 2.5043 (74.96) 2.4997 (99.82) 2.4953 (68.34) 2.4908 (32.24) 2.3357 (0.37) 2.3311 (0.63) 2.3265 (0.81) 2.3219 (0.6) 2.3173 (0.34) 2.1321 (0.66) 2.0997 (1.25) 2.0846 (0.76) 2.0694 (1.47) 1.9867 (6.72) 1.8391 (0.34) 1.8175 (0.62) 1.8096 (0.61) 1.7877 (0.63) 1.6173 (0.35) 1.6079 (0.36) 1.5793 (0.59) 1.5559 (0.54) 1.5471 (0.52) 1.3985 (1.44) 1.3197 (1.24) 1.3019 (2.6) 1.2842 (1.25) 1.2367 (0.33) 1.1927 (1.95) 1.1748 (3.82) 1.1571 (1.89) -0.0002 (2.15)</p>
<p>실시예 I-2</p> <p>8.7769 (0.81) 8.4701 (0.75) 8.0868 (6.22) 8.0799 (10.12) 7.3077 (2.36) 7.1744 (5.45) 7.1593 (2.79) 7.0411 (2.65) 7.0233 (6.62) 6.8999 (5.12) 6.8874 (3.24) 5.4528 (0.97) 5.4099 (3.75) 5.3671 (3.81) 5.3205 (1.64) 5.3059 (2.17) 5.2901 (2.97) 5.2766 (2.38) 5.2603 (1.8) 4.9071 (0.34) 4.8953 (0.53) 4.8811 (0.91) 4.874 (0.86) 4.869 (1.12) 4.8599 (1.03) 4.8477 (1.22) 4.8337 (0.52) 4.8213 (0.5) 4.6283 (0.61) 4.6234 (0.34) 4.616 (0.62) 4.6073 (0.47) 4.6021 (0.68) 4.5949 (0.45) 4.59 (0.57) 4.5812 (0.39) 4.5685 (0.34) 4.5011 (0.54) 4.496 (0.35) 4.4888 (0.64) 4.4799 (0.42) 4.4749 (0.66) 4.4676 (0.45) 4.4625 (0.61) 4.4539 (0.36) 4.4412 (0.36) 4.3623 (1.03) 4.33 (1.1) 4.057 (1.13) 4.0392 (3.47) 4.0214 (3.53) 4.0036 (1.3) 3.9835 (0.99) 3.9493 (1.09) 3.8384 (0.77) 3.8216 (1.23) 3.8088 (0.91) 3.7946 (1.51) 3.7923 (1.7) 3.778 (2.05) 3.7653 (1.01) 3.7486 (1.63) 3.6022 (1.86) 3.5857 (1.85) 3.5589 (1.79) 3.5425 (1.7) 3.5171 (0.86) 3.5011 (0.82) 3.4252 (0.45) 3.4167 (0.82) 3.4069 (0.6) 3.3974 (0.99) 3.3879 (1.72) 3.3784 (1.01) 3.3689 (0.69) 3.3593 (1.05) 3.3534 (0.62) 3.3519 (0.63) 3.3497 (0.73) 3.3468 (0.65) 3.3453 (0.6) 3.3431 (0.69) 3.3423 (0.73) 3.3394 (0.84) 3.3387 (0.86) 3.3379 (0.89) 3.3372 (0.91) 3.3365 (0.93) 3.3358 (0.95) 3.3093 (1157.8) 3.2859 (4.56) 3.2691 (2.03) 3.2397 (0.99) 2.8705 (0.73) 2.8407 (1.33) 2.8129 (0.72) 2.6787 (0.33) 2.6741 (0.71) 2.6694 (0.98) 2.6648 (0.71) 2.6602 (0.34) 2.5395 (1.39) 2.5228 (2.29) 2.5181 (3.44) 2.5094 (51.39) 2.5049 (102.77) 2.5004 (140.72) 2.4959 (96.35) 2.4914 (45.37) 2.3361 (0.37) 2.3317 (0.74) 2.3271 (1.01) 2.3225 (0.73) 2.3179 (0.35) 2.1352 (0.99) 2.1003 (2.13) 2.0691 (3.86) 2.0494 (1.49) 2.0211 (0.59) 2.0093 (0.46) 1.9977 (0.39) 1.9868 (16) 1.9777 (0.56) 1.9719 (0.57) 1.9569 (0.81) 1.9398 (0.93) 1.9318 (0.85) 1.9081 (0.4) 1.8381 (0.44) 1.8161 (0.9) 1.808 (0.93) 1.7865 (0.88) 1.7779 (0.81) 1.7568 (0.35) 1.6668 (1.04) 1.6612 (1.12) 1.6474 (1.2) 1.638 (1.39) 1.6284 (1.3) 1.6188 (1.51) 1.6092 (1.51) 1.5862 (1.25) 1.5771 (1.25) 1.5559 (1.47) 1.5471 (1.32) 1.5251 (1.14) 1.5059 (0.71) 1.5003 (0.71) 1.4744 (0.33) 1.4305 (0.34) 1.409 (0.9) 1.3984 (4.75) 1.3829 (0.97) 1.3533 (1.06) 1.3459 (0.83) 1.3317 (1.43) 1.3268 (1.53) 1.3202 (1.19) 1.3016 (2) 1.2706 (0.79) 1.2368 (0.46) 1.1928 (4.57) 1.175 (9.03) 1.1572 (4.47) 0.008 (0.36) -0.0001 (12.1) -0.0085 (0.39)</p>

[0680]

<p>실시예 I-3</p> <p>7.9337 (9.17) 7.7849 (8.41) 7.3131 (2.83) 7.2308 (1.17) 7.2264 (1.77) 7.2096 (5.45) 7.206 (4.65) 7.2006 (5) 7.1799 (8.22) 7.1609 (3.49) 7.1486 (0.9) 7.1436 (1.97) 7.1391 (2.31) 7.1233 (3.81) 7.1198 (3.73) 7.0906 (1.11) 7.0841 (1.43) 7.0796 (0.8) 7.0701 (4.55) 7.0532 (4.82) 7.0484 (5.47) 7.0318 (1.79) 7.0244 (6.65) 7.0146 (0.79) 6.9027 (5.9) 6.8885 (3.48) 6.8765 (0.31) 5.4682 (1.22) 5.4254 (4.24) 5.3777 (2.84) 5.3361 (0.95) 5.3066 (0.87) 5.0335 (0.48) 5.0239 (1.92) 5.0091 (2.77) 4.994 (2.8) 4.9793 (2.96) 4.97 (1.17) 4.9539 (0.63) 4.946 (1.87) 4.9302 (1.96) 4.9162 (1.91) 4.9002 (1.66) 4.378 (1.23) 4.3434 (1.34) 4.0569 (1.06) 4.0391 (3.24) 4.0213 (3.34) 4.0034 (2.07) 3.9645 (1.33) 3.6161 (1.28) 3.5861 (1.49) 3.5728 (1.68) 3.5428 (1.33) 3.4733 (1.24) 3.4431 (1.6) 3.4297 (2.02) 3.4181 (0.72) 3.4091 (1.04) 3.3995 (2.61) 3.3909 (1.25) 3.3819 (1.42) 3.3711 (1.24) 3.3629 (0.99) 3.3545 (1.13) 3.346 (1.12) 3.3042 (2609.58) 3.2649 (2.09) 3.1759 (0.36) 3.1636 (0.31) 3.0368 (2.29) 2.8903 (0.85) 2.8567 (2.73) 2.8497 (2.48) 2.8406 (2.19) 2.8133 (1.56) 2.7973 (1.5) 2.7479 (0.52) 2.7388 (0.6) 2.717 (0.98) 2.7084 (1.24) 2.6973 (0.76) 2.6905 (0.76) 2.6785 (2.06) 2.6736 (2.89) 2.669 (3.72) 2.6645 (2.44) 2.6598 (1.13) 2.651 (0.63) 2.6411 (0.59) 2.539 (3.97) 2.5223 (7.24) 2.5176 (11.19) 2.5089 (158.52) 2.5045 (312.78) 2.5 (423.07) 2.4955 (291.22) 2.491 (137.64) 2.4634 (2.02) 2.4488 (1.62) 2.4326 (0.36) 2.3358 (1.08) 2.3313 (2.11) 2.3267 (2.98) 2.322 (2.14) 2.3176 (1.09) 2.1467 (1.2) 2.1153 (2.36) 2.0799 (1.36) 2.0691 (3.47) 2.0493 (0.95) 2.0189 (1.51) 2.0096 (1.7) 1.9976 (1.58) 1.9867 (15) 1.8175 (2.41) 1.7969 (3.45) 1.7266 (1.28) 1.6911 (1.4) 1.6654 (0.67) 1.6278 (1.7) 1.5973 (2.23) 1.5658 (1.47) 1.5447 (0.6) 1.5373 (0.53) 1.518 (0.6) 1.5103 (0.66) 1.486 (1.9) 1.4654 (2.76) 1.4447 (1.61) 1.3985 (8.39) 1.3781 (0.66) 1.3555 (1.09) 1.3496 (1.07) 1.3313 (0.73) 1.3235 (0.84) 1.317 (0.83) 1.3017 (0.45) 1.2921 (0.49) 1.285 (0.34) 1.236 (0.87) 1.1926 (4.09) 1.1748 (8.08) 1.1571 (4.03) 0.8885 (0.39) 0.8717 (0.43) 0.0081 (1.19) -0.0001 (34.78) -0.0083 (1.13)</p>
<p>실시예 I-4</p> <p>10.7328 (0.4) 9.003 (0.32) 8.7769 (0.84) 8.6923 (0.56) 8.6796 (0.59) 8.505 (0.42) 8.2225 (0.43) 8.2104 (0.4) 8.0753 (7.22) 8.0651 (6.28) 7.9976 (0.38) 7.9927 (0.67) 7.9874 (0.41) 7.6637 (0.61) 7.3072 (1.98) 7.2908 (0.4) 7.2828 (0.33) 7.1738 (4.52) 7.159 (2.85) 7.1485 (0.77) 7.0405 (2.25) 7.023 (6.11) 7.0128 (0.74) 6.9573 (0.39) 6.8996 (5.18) 6.8871 (3.34) 6.8767 (0.5) 6.8416 (0.32) 5.7462 (2.71) 5.4516 (0.85) 5.4082 (3.26) 5.389 (0.55) 5.3668 (3.47) 5.3498 (1.27) 5.3339 (2.22) 5.3264 (16) 5.3119 (15.12) 5.3047 (2.36) 5.296 (1.74) 5.2795 (1.48) 4.9718 (0.49) 4.9613 (0.75) 4.9483 (1.2) 4.9377 (1.34) 4.9249 (0.76) 4.9142 (0.63) 4.357 (0.94) 4.3249 (1) 3.9835 (0.9) 3.9483 (1) 3.8795 (0.73) 3.8495 (1.69) 3.8359 (1.2) 3.8196 (1.03) 3.8058 (2.26) 3.776 (1.15) 3.7121 (0.78) 3.6228 (1.26) 3.6097 (1.3) 3.6064 (1.47) 3.5939 (1.03) 3.5793 (0.96) 3.5659 (0.94) 3.563 (1.03) 3.5502 (1.09) 3.547 (1.08) 3.5037 (0.86) 3.4896 (1.23) 3.4792 (2.82) 3.4652 (2.5) 3.4551 (2.95) 3.4452 (1.17) 3.441 (1.29) 3.4311 (1.01) 3.4164 (0.53) 3.4075 (0.33) 3.3965 (0.61) 3.3874 (1.2) 3.3785 (0.61) 3.3593 (0.42) 3.3083 (1161.47) 3.2848 (14.7) 3.2404 (1.48) 3.1922 (0.53) 3.1631 (0.45) 3.1104 (0.4) 3.0883 (0.66) 3.0784 (0.73) 3.0596 (1.11) 3.0503 (1.21) 3.037 (2.66) 3.0257 (1.33) 3.0079 (0.72) 2.9978 (0.75) 2.8727 (0.8) 2.8498 (2.34) 2.8153 (0.79) 2.6786 (0.42) 2.6743 (0.91) 2.6695 (1.27) 2.6649 (0.95) 2.5395 (1.15) 2.5228 (2.6) 2.5181 (4.06) 2.5094 (67.94) 2.5049 (137.72) 2.5004 (190.11) 2.4959 (133.69) 2.4914 (65.57) 2.4781 (5.44) 2.4639 (3.86) 2.4589 (4.38) 2.4542 (4.05) 2.4495 (4.08) 2.4352 (3.38) 2.4258 (3.37) 2.4019 (0.4) 2.3364 (0.63) 2.3317 (1.08) 2.3272 (1.46) 2.3225 (1.12) 2.3179 (0.62) 2.1375 (1.08) 2.1002 (2.05) 2.0691 (3.74) 2.0552 (1.84) 2.0496 (1.5) 2.0275 (1.16) 2.0175 (1.35) 2.01 (1.74) 2.001 (2.88) 1.9962 (2.84) 1.9919 (3.01) 1.9868 (3.03) 1.9774 (2.08) 1.9728 (1.7) 1.968 (2.87) 1.9637 (3.32) 1.9589 (3.21) 1.9542 (3.34) 1.9452 (2.06) 1.9368 (1.46) 1.9262 (1.08) 1.9072 (0.74) 1.8988 (0.42) 1.8503 (2.74) 1.8406 (2.94) 1.8298 (2.68) 1.8196 (2.94) 1.816 (3.15) 1.8094 (3.43) 1.801 (2) 1.7811 (0.99) 1.7665 (0.55) 1.7558 (0.49) 1.7169 (0.61) 1.7077 (0.8) 1.688 (1.54) 1.6798 (2.02) 1.6539 (3.07) 1.6467 (3.42) 1.6363 (2.54) 1.6261 (3.34) 1.6179 (3.79) 1.6132 (3.95) 1.6084 (3.26) 1.6036 (2.66) 1.5862 (3.33) 1.5773 (4.07) 1.5688 (2.83) 1.5549 (3.01) 1.5512 (2.81) 1.5453 (3.58) 1.5359 (2.71) 1.5272 (1.36) 1.517 (2.75) 1.508 (1.2) 1.4885 (4.32) 1.485 (2.66) 1.4797 (2.78) 1.4595 (2.79) 1.4559 (3.99) 1.4507 (2.33) 1.4471 (2.73) 1.4268 (2.3) 1.4179 (2.4) 1.3911 (2.58) 1.3677 (1.64) 1.3385 (0.56) 1.2977 (1.21) 1.2894 (1.6) 1.2813 (1.33) 1.2676 (2.38) 1.2597 (3.64) 1.2519 (2.05) 1.2373 (3.58) 1.2301 (4.87) 1.2234 (2.57) 1.2113 (1.92) 1.2026 (5.84) 1.1929 (2.7) 1.1879 (3.07) 1.1798 (4.5) 1.1729 (3.71) 1.1601 (3.51) 1.1556 (3.55) 1.1483 (3.46) 1.1428 (1.94) 1.1309 (2.82) 1.1251 (1.9) 1.1176 (1.45) 1.1101 (0.7) 1.1012 (0.97) 1.0922 (0.6) 0.008 (0.54) -0.0001 (16.73) -0.0083 (0.65)</p>

[0681]

<p>실시예 I-5</p> <p>8.7769 (0.4) 8.0798 (8.92) 8.0773 (15) 7.3066 (3.02) 7.2814 (0.5) 7.1733 (6.93) 7.1591 (3.75) 7.1483 (1.76) 7.04 (3.4) 7.023 (8.79) 7.0126 (1.5) 6.8996 (6.79) 6.8872 (4.99) 6.8767 (0.73) 5.4519 (1.33) 5.4087 (5.01) 5.3661 (5.05) 5.3366 (1.55) 5.3209 (2.68) 5.3066 (4.04) 5.2978 (2.72) 5.2911 (1.63) 5.2815 (3.17) 5.2684 (2.92) 5.2519 (2.62) 4.8489 (0.9) 4.8381 (1.65) 4.8253 (1.9) 4.8147 (2.66) 4.8015 (1.28) 4.7902 (1.3) 4.3596 (1.45) 4.3294 (1.49) 4.1628 (0.51) 4.1514 (0.7) 4.135 (0.78) 4.1277 (1.61) 4.1166 (1.3) 4.101 (1.86) 4.0935 (1.45) 4.0779 (1.06) 4.0664 (1.15) 4.0568 (1.01) 4.039 (2.73) 4.0212 (2.73) 4.0033 (1.07) 3.9817 (1.41) 3.9472 (1.51) 3.8598 (0.86) 3.838 (1.79) 3.8303 (1.28) 3.8164 (1.6) 3.8083 (2.23) 3.7943 (3.07) 3.7872 (1.39) 3.7651 (2.38) 3.6133 (3.28) 3.5968 (3.41) 3.5698 (2.32) 3.5535 (2.49) 3.4248 (0.81) 3.4159 (1.44) 3.3961 (1.91) 3.3875 (2.76) 3.3767 (2.17) 3.3683 (2.29) 3.3568 (3.33) 3.3093 (7524.94) 3.2766 (6.54) 3.2729 (6.7) 3.2472 (2.11) 3.2428 (2.3) 3.2135 (0.88) 3.2002 (0.74) 3.1822 (0.68) 3.1632 (0.64) 3.1302 (0.47) 3.0802 (0.35) 3.0613 (0.35) 3.055 (0.36) 3.0368 (7.05) 3.0216 (0.36) 2.9608 (0.32) 2.9368 (0.32) 2.8903 (0.56) 2.872 (1.16) 2.8495 (6.62) 2.8129 (1.11) 2.7309 (0.33) 2.6949 (0.56) 2.6784 (2.06) 2.674 (4.46) 2.6693 (6.13) 2.6647 (4.47) 2.6599 (2.13) 2.5393 (8.67) 2.5227 (14.86) 2.5179 (22.21) 2.5092 (324.46) 2.5048 (648.61) 2.5003 (887.69) 2.4958 (611.23) 2.4913 (289.86) 2.4386 (0.65) 2.4052 (0.36) 2.3859 (0.33) 2.3722 (0.33) 2.3361 (2.1) 2.3316 (4.39) 2.327 (6.19) 2.3223 (4.46) 2.3178 (2.2) 2.2075 (0.37) 2.1913 (1.03) 2.1793 (1.42) 2.1727 (1.31) 2.1478 (2.18) 2.1372 (2.21) 2.099 (2.87) 2.069 (5.51) 2.0494 (2.12) 2.0312 (0.34) 2.0087 (1.17) 1.9977 (1.34) 1.9867 (13.38) 1.9793 (1.76) 1.9402 (0.37) 1.9254 (0.32) 1.9075 (1.26) 1.8405 (0.66) 1.8051 (1.29) 1.7831 (1.28) 1.7399 (0.83) 1.7332 (0.79) 1.7128 (1.48) 1.704 (1.51) 1.6725 (4.02) 1.653 (3.19) 1.6438 (2.94) 1.5753 (1.38) 1.5546 (1.21) 1.5455 (1.24) 1.5226 (0.57) 1.5111 (0.5) 1.4996 (0.32) 1.4832 (0.59) 1.4538 (1.28) 1.4285 (2.55) 1.3985 (4.15) 1.3726 (2.17) 1.3463 (1.75) 1.3138 (0.92) 1.2924 (0.69) 1.2647 (0.38) 1.2586 (0.36) 1.2365 (1.58) 1.1926 (3.56) 1.1749 (7.02) 1.157 (3.5) 1.1518 (0.54) 1.0703 (0.49) 0.008 (0.44) -0.0001 (14.82) -0.0083 (0.39)</p>
<p>실시예 I-6</p> <p>19.1128 (0.36) 17.393 (0.35) 16.9053 (0.37) 16.5966 (0.34) 14.3354 (0.34) 8.7772 (1.51) 8.4106 (1.87) 8.0749 (12.87) 8.0722 (14.62) 7.6634 (1.05) 7.3898 (0.87) 7.381 (0.89) 7.3678 (1.13) 7.344 (0.42) 7.3082 (3.98) 7.2812 (2.81) 7.262 (3.86) 7.2577 (3.83) 7.2537 (2.86) 7.2474 (4.08) 7.2392 (3.41) 7.2357 (2.43) 7.2299 (4.6) 7.1963 (2.62) 7.1875 (3.02) 7.175 (11.76) 7.1674 (7.41) 7.1603 (7.46) 7.1485 (4.65) 7.1359 (1.8) 7.133 (1.79) 7.1234 (2.3) 7.1165 (1.55) 7.1103 (1.54) 7.0982 (0.74) 7.0846 (0.46) 7.0417 (5.24) 7.0346 (2.19) 7.0242 (11.69) 6.9879 (0.5) 6.9607 (0.59) 6.9504 (0.45) 6.9296 (0.49) 6.9004 (9.18) 6.8883 (5.82) 6.8768 (0.64) 6.853 (0.56) 6.8335 (0.4) 6.8243 (0.42) 6.7725 (0.34) 6.1256 (0.42) 5.9626 (1.35) 5.951 (3.48) 5.9378 (3.9) 5.9258 (1.37) 5.4526 (1.68) 5.41 (6.26) 5.3908 (0.97) 5.3678 (6.61) 5.324 (1.8) 5.3061 (1.29) 5.2886 (2.07) 5.279 (2.6) 5.2723 (2.64) 5.2625 (3.41) 5.2597 (2.6) 5.2498 (2.74) 5.2431 (2.12) 5.2335 (2.43) 5.1282 (0.37) 5.0532 (0.37) 5.0361 (0.4) 5.0303 (0.36) 4.5584 (0.78) 4.5424 (0.5) 4.3619 (2.01) 4.329 (2.25) 4.2786 (0.48) 4.172 (0.35) 4.1611 (0.41) 4.0569 (0.7) 4.0391 (1.98) 4.0212 (2.31) 4.0033 (0.96) 3.9798 (1.88) 3.9459 (2.21) 3.9059 (0.34) 3.829 (0.44) 3.8098 (0.37) 3.7978 (1.35) 3.7841 (1.8) 3.7686 (1.58) 3.7632 (0.69) 3.7544 (4.27) 3.7404 (2.84) 3.7251 (2.21) 3.7115 (2.68) 3.685 (0.61) 3.6281 (2.29) 3.6109 (4.46) 3.5936 (2.79) 3.5849 (1.74) 3.5676 (3.05) 3.5499 (2.45) 3.5471 (2.46) 3.5259 (0.53) 3.5069 (0.48) 3.4906 (0.6) 3.483 (0.54) 3.4151 (1.84) 3.3957 (2.67) 3.3866 (3.78) 3.3767 (3.35) 3.3678 (2.59) 3.3582 (4.26) 3.3074 (4729.97) 3.278 (6.72) 3.2496 (2.16) 3.2415 (2.27) 3.1987 (0.68) 3.1755 (0.41) 3.1619 (0.43) 3.1375 (0.43) 3.1119 (0.44) 3.089 (0.41) 3.06 (0.35) 3.0369 (3.1) 3.0197 (0.38) 2.899 (0.41) 2.8906 (0.74) 2.8717 (1.42) 2.8494 (4.81) 2.815 (2.88) 2.8025 (3.15) 2.7879 (1.74) 2.7505 (1.71) 2.7317 (2.24) 2.7103 (2) 2.6949 (1.58) 2.6785 (2.47) 2.6738 (5.15) 2.6692 (6.58) 2.6646 (4.82) 2.6601 (2.66) 2.6154 (0.76) 2.5984 (0.69) 2.577 (0.77) 2.5392 (8.23) 2.5225 (16.89) 2.5178 (25.25) 2.5091 (315.14) 2.5047 (618.23) 2.5002 (835.42) 2.4957 (569.99) 2.4912 (265.67) 2.4276 (0.36) 2.3359 (1.94) 2.3315 (3.97) 2.327 (5.42) 2.3223 (4.08) 2.3177 (1.86) 2.1862 (0.36) 2.1303 (1.94) 2.0993 (3.64) 2.069 (16) 2.0494 (2.19) 2.0311 (0.96) 2.0091 (1.41) 1.9976 (2.37) 1.9867 (10.67) 1.9741 (3.56) 1.963 (5) 1.9511 (3.48) 1.9386 (1.56) 1.9248 (1.2) 1.914 (1.05) 1.8986 (1.14) 1.8736 (1.47) 1.8691 (1.51) 1.8485 (1.98) 1.8393 (2.22) 1.8245 (2.68) 1.8094 (3.96) 1.7966 (3.4) 1.783 (3.9) 1.7493 (1.3) 1.7112 (0.56) 1.6925 (1) 1.6773 (1.02) 1.671 (1.07) 1.6537 (1.14) 1.6049 (1) 1.5785 (1.73) 1.5555 (1.73) 1.5458 (1.76) 1.5269 (1.13) 1.493 (0.53) 1.4651 (0.37) 1.4056 (0.39) 1.3985 (2.95) 1.3615 (0.38) 1.3487 (0.37) 1.2937 (0.47) 1.2796 (0.44) 1.259 (0.72) 1.2363 (1.75) 1.1926 (2.45) 1.1748 (5.09) 1.1571 (2.75) 1.1107 (0.36) 1.0372 (0.34) 1.0183 (0.43) 0.9995 (0.36) 0.8967 (0.38) 0.8884 (1.16) 0.8781 (0.61) 0.8716 (1.12) 0.8587 (0.49) 0.1454 (0.37) 0.0593 (1.72) 0.008 (3.52) -0.0001 (103.04) -0.0085 (3.3) -0.1494 (0.5) -0.842 (0.35) -2.6762 (0.35) -3.4649 (0.34)</p>

[0682]

<p>실시예 I-7</p> <p>8.7765 (0.48) 8.0716 (16) 7.5675 (0.68) 7.5507 (1.48) 7.5463 (1.31) 7.5339 (0.93) 7.5296 (2.92) 7.5253 (1.03) 7.5129 (1.33) 7.5084 (1.71) 7.4918 (0.78) 7.308 (2.31) 7.2024 (0.46) 7.1985 (0.64) 7.1893 (4.3) 7.1746 (6.03) 7.1692 (6.82) 7.1597 (3.28) 7.1488 (3.71) 7.1392 (0.57) 7.0414 (2.6) 7.0236 (6.28) 6.9005 (4.67) 6.8877 (3.03) 5.4518 (0.93) 5.4092 (3.52) 5.3671 (3.63) 5.3241 (1.01) 5.3156 (2.83) 5.2997 (3.5) 5.2864 (3.18) 5.2705 (9.89) 5.2384 (0.61) 4.359 (1.01) 4.3255 (1.06) 4.0569 (0.61) 4.0391 (1.84) 4.0213 (1.88) 4.0036 (0.71) 3.9817 (0.97) 3.946 (1.13) 3.7901 (1.92) 3.7608 (2.19) 3.7465 (3.28) 3.7173 (2.65) 3.6029 (3.06) 3.5869 (3.11) 3.5594 (2.16) 3.5435 (2.11) 3.4225 (0.61) 3.413 (1.06) 3.4041 (0.84) 3.3939 (1.3) 3.3843 (2.09) 3.3741 (1.56) 3.3557 (2.19) 3.3131 (3081.89) 3.2897 (10.95) 3.2715 (2.41) 3.2494 (0.77) 3.2398 (1.03) 2.8786 (0.63) 2.8721 (0.75) 2.8435 (1.27) 2.8138 (0.7) 2.6788 (0.73) 2.6743 (1.6) 2.6697 (2.24) 2.665 (1.62) 2.6605 (0.77) 2.5397 (3.33) 2.523 (5.48) 2.5183 (8.17) 2.5096 (116.16) 2.5051 (231.84) 2.5006 (317.64) 2.4961 (217.01) 2.4916 (102.18) 2.3365 (0.71) 2.332 (1.56) 2.3273 (2.2) 2.3227 (1.57) 2.3183 (0.67) 2.1317 (0.93) 2.0979 (1.86) 2.0689 (4.95) 2.0494 (1.11) 1.9867 (8.34) 1.8436 (0.35) 1.8345 (0.42) 1.8138 (0.81) 1.8057 (0.89) 1.7838 (0.81) 1.7768 (0.74) 1.7534 (0.33) 1.614 (0.33) 1.6031 (0.41) 1.5816 (0.82) 1.5739 (0.87) 1.5517 (0.82) 1.5436 (0.74) 1.5215 (0.33) 1.3984 (2.8) 1.2399 (0.63) 1.2368 (0.58) 1.2229 (0.41) 1.1928 (2.37) 1.1749 (4.81) 1.1572 (2.37) -0.0001 (6.12)</p>
<p>실시예 I-8</p> <p>8.7992 (0.48) 8.7843 (0.97) 8.7696 (0.49) 8.0814 (5.74) 7.443 (0.62) 7.4374 (1) 7.4307 (0.77) 7.4276 (0.81) 7.4239 (0.71) 7.419 (1.05) 7.3092 (1.07) 7.3042 (0.74) 7.2906 (5.07) 7.287 (2.53) 7.2824 (3.92) 7.2737 (1.03) 7.1761 (2.15) 7.16 (1.05) 7.0428 (1.04) 7.0239 (2.49) 6.9004 (1.94) 6.888 (1.2) 5.7464 (16) 5.4533 (0.36) 5.4107 (1.44) 5.37 (1.47) 5.3276 (0.37) 5.229 (0.91) 5.2125 (1.19) 5.2009 (1.03) 5.1842 (0.97) 4.3849 (2.87) 4.3699 (3.12) 4.3291 (0.44) 3.9859 (0.38) 3.9522 (0.43) 3.7376 (0.57) 3.7092 (0.65) 3.6944 (1.32) 3.6662 (1.07) 3.6259 (1.17) 3.6092 (1.26) 3.5826 (0.64) 3.5661 (0.6) 3.4219 (0.33) 3.4032 (0.38) 3.3936 (0.68) 3.384 (0.4) 3.3649 (0.39) 3.307 (224.31) 3.2835 (0.84) 3.2735 (0.71) 3.2454 (0.33) 2.847 (0.51) 2.5226 (0.66) 2.5179 (1.01) 2.5092 (13.72) 2.5048 (27.07) 2.5002 (36.66) 2.4958 (25.11) 2.4913 (11.74) 2.1399 (0.36) 2.107 (0.76) 2.0691 (0.88) 1.9868 (1.3) 1.8242 (0.33) 1.8164 (0.34) 1.594 (0.33) 1.5848 (0.35) 1.5645 (0.34) 1.5552 (0.32) 1.1927 (0.37) 1.1749 (0.73) 1.1571 (0.36) -0.0001 (5.31)</p>
<p>실시예 I-9</p> <p>8.8772 (0.36) 8.8371 (1.19) 8.8228 (2.79) 8.8082 (1.32) 8.2158 (1.73) 8.0772 (16) 8.0284 (0.33) 8.0075 (0.36) 7.7383 (0.38) 7.6473 (0.41) 7.6415 (0.53) 7.6334 (2.32) 7.6282 (2.45) 7.6143 (1) 7.609 (1.08) 7.5968 (8.19) 7.5917 (7.34) 7.5753 (3.12) 7.5438 (0.35) 7.5346 (0.43) 7.525 (0.45) 7.508 (0.49) 7.5007 (2.11) 7.4955 (1.84) 7.4798 (1.37) 7.4746 (1.31) 7.4598 (0.44) 7.454 (0.55) 7.4498 (0.46) 7.44 (0.44) 7.4287 (0.87) 7.4237 (0.97) 7.4068 (4.26) 7.4015 (3.75) 7.3859 (4.62) 7.3805 (4.68) 7.3477 (1.08) 7.3295 (1.09) 7.3108 (7.26) 7.2901 (3.9) 7.1753 (5.74) 7.1594 (2.95) 7.0421 (2.93) 7.0234 (6.97) 6.9003 (5.55) 6.8875 (3.43) 6.341 (0.32) 5.4507 (1.09) 5.4093 (3.85) 5.3695 (4.24) 5.3268 (1.1) 5.2193 (2.43) 5.2031 (3.05) 5.191 (2.59) 5.1745 (2.53) 4.9071 (0.58) 4.5418 (0.35) 4.5108 (0.7) 4.4962 (0.74) 4.3811 (0.74) 4.3548 (5.26) 4.3363 (5.18) 4.3116 (0.72) 4.2833 (1.37) 4.2687 (1.34) 4.2593 (0.4) 4.191 (0.37) 4.1065 (0.33) 4.0328 (0.34) 4.0012 (0.74) 3.9789 (2.02) 3.9485 (1.52) 3.933 (6.63) 3.8871 (0.4) 3.8696 (0.42) 3.8596 (0.51) 3.8443 (0.39) 3.8356 (0.48) 3.8113 (0.41) 3.8028 (0.41) 3.7896 (0.49) 3.7492 (0.71) 3.7347 (1.96) 3.7061 (2.31) 3.6914 (3.82) 3.663 (3.32) 3.6139 (3.47) 3.5975 (3.58) 3.5703 (2.32) 3.5596 (1.29) 3.5544 (2.37) 3.5371 (1.12) 3.4987 (0.76) 3.4892 (0.94) 3.4757 (1.22) 3.4612 (0.98) 3.4457 (0.98) 3.4206 (1.88) 3.4015 (2.37) 3.392 (3.44) 3.382 (2.87) 3.3725 (3) 3.3108 (3647.99) 3.2873 (63.99) 3.2442 (1.36) 2.8768 (1.06) 2.849 (1.64) 2.819 (0.95) 2.7518 (0.7) 2.7331 (0.33) 2.6951 (0.53) 2.6789 (1.62) 2.6742 (3.15) 2.6696 (4.46) 2.665 (3.14) 2.6604 (1.49) 2.6373 (0.57) 2.6256 (0.53) 2.5396 (6.88) 2.5229 (12.65) 2.5182 (18.74) 2.5095 (230.52) 2.505 (453.99) 2.5005 (618.72) 2.496 (419.29) 2.4914 (195.01) 2.3367 (1.22) 2.3318 (2.88) 2.3273 (3.97) 2.3226 (2.9) 2.3179 (1.25) 2.1549 (0.51) 2.142 (1.18) 2.1048 (2.11) 2.0692 (9.97) 2.0495 (1.01) 1.9356 (0.36) 1.9181 (0.51) 1.9079 (0.59) 1.8965 (6.08) 1.8798 (0.37) 1.8432 (0.65) 1.8123 (1.14) 1.7824 (1.01) 1.751 (0.57) 1.7308 (0.33) 1.6668 (0.43) 1.6517 (0.49) 1.6139 (0.8) 1.593 (1.07) 1.5823 (1.08) 1.5528 (0.93) 1.5217 (0.4) 1.3982 (0.51) 1.3561 (0.58) 1.2357 (1.15) 1.1954 (0.33) 1.1251 (0.64) 1.1065 (1.25) 1.0879 (0.51) 0.008 (1.62) -0.0001 (50.3) -0.0084 (1.51)</p>

[0683]

[0684]

예리한 시그널의 강도는 NMR 스펙트럼의 인쇄된 예에서의 시그널의 높이(cm)와 상관 관계를 가지며, 시그널 강도의 진정한 비를 나타낸다. 넓은 시그널의 경우, 스펙트럼에서 가장 강한 시그널에 대한 다수의 피크 또는 중간 시그널 및 그의 상대적 강도가 표시될 수 있다.

[0685]

¹H NMR 피크의 리스트는 통상의 ¹H NMR 프린트아웃과 유사하며, 그리하여 일반적으로 통상의 NMR 해석으로 제시되는 모든 피크를 포함한다.

[0686]

게다가, 통상의 ¹H NMR 프린트아웃과 같이, 이들은 용매 시그널, 마찬가지로 본 발명의 대상의 부분을 형성하는 표적 화합물의 입체이성질체의 시그널 및/또는 불순물의 피크를 나타낼 수 있다.

[0687]

용매 및/또는 물의 델타 범위내에서 화합물 시그널의 보고에서, 본원의 ¹H NMR의 리스트는 통상의 용매 피크, 예를 들어 DMSO-d₆에서 DMSO의 피크 및 물의 피크를 나타내며, 이는 일반적으로 평균적으로 높은 강도를 갖는다.

[0688]

표적 화합물의 입체이성질체의 피크 및/또는 불순물의 피크는 일반적으로 표적 화합물 (예를 들어 90% 초과 순도)의 피크보다 평균적으로 더 낮은 강도를 갖는다.

[0689]

이러한 입체이성질체 및/또는 불순물은 특정 제조 공정에서 통상적일 수 있다. 그의 피크는 "부산물-지문"을 참조하여 본 발명의 제조 공정을 재현하는데 도움이 될 수 있다.

[0690]

공지 방법 (Mestrec, ACD-시뮬레이션, 또한 실험으로 평가된 예상치와 함께)으로 표적 화합물의 피크를 계산하는 전문가라면 필요한 경우 임의로 추가의 강도 필터를 사용하여 표적 화합물의 피크를 분리할 수 있다. 이같은 분리는 통상의 ¹H NMR 해석으로 선택한 관련 피크와 유사할 수 있다.

- [0691] 하기 표는 최종 화합물 및 중간체 모두에 대한 모든 NMR 데이터를 제시한다.
- [0692] NMR 데이터
- [0693] 실시예 I-10, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
- δ 7.646 (d, 1H), δ 6.359(s, 1H), δ 5.025 (m, 2H), δ 4.974 (m, 1H), δ 4.613(d, 1H), δ 4.058~3.918 (m, 4H), δ 3.329 (m, 3H), δ 2.941 (m, 1H), δ 2.372~2.224 (m, 9H), δ 1.835~1.606 (m, 7H).
- [0694]
- [0695] 실시예 I-11, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
- δ 7.472 (s, 1H), δ 6.267 (s, 1H), δ 4.920 (s, 2H), δ 4.494 (d, 1H), δ 4.228 (d, 1H), δ 3.964 (d, 1H), δ 3.230~3.130 (m, 5H), δ 2.841 (m, 1H), δ 2.256 (s, 3H), δ 2.129 (m, 2H), δ 1.719 (m, 2H), δ 1.651 (m, 3H), δ 1.185 (s, 2H), δ 0.785~0.725 (m, 4H).
- [0696]
- [0697] 실시예 I-12, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
- δ 7.561 (s, 1H), δ 6.268 (s, 1H), δ 4.923 (s, 2H), δ 4.551 (d, 1H), δ 4.038 (d, 2H), δ 3.843 (dd, 1H), δ 3.284 (m, 3H), δ 2.841 (m, 1H), δ 2.258 (s, 3H), δ 2.135 (m, 2H), δ 1.646 (d, 4H), δ 1.516 (m, 11H), δ 1.185 (s, 3H).
- [0698]
- [0699] 실시예 I-13, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
- δ 7.468 (s, 1H), δ 6.824 (s, 1H), δ 6.267 (s, 1H), δ 4.915 (s, 2H), δ 4.518 (d, 1H), δ 4.047 (d, 1H), δ 3.794 (d,1H), δ 3.216 (m, 4H), δ 2.734 (s, 2H), δ 2.256 (s, 3H), δ 2.124 (m, 4H), δ 1.755~1.518 (m, 13H).
- [0700]
- [0701] 실시예 I-14, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
- δ 7.502 (s, 1H), δ 7.274~7.156 (m, 5H), δ 6.268 (s, 1H), δ 4.922 (s, 2H), δ 4.648 (d, 1H), δ 4.426 (dd, 2H), δ 3.960 (d,1H), δ 3.238 (s, 2H), δ 3.127 (s, 2H), δ 2.780 (s, 1H), δ 2.258 (s, 3H), δ 2.132 (m, 2H), δ 1.730 (s, 2H), δ 1.686 (m, 3H), δ 1.185(s, 3H).
- [0702]
- [0703] 실시예 I-15, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
- δ 7.477 (s, 1H), δ 7.902 (s, 1H), δ 6.268 (s, 1H), δ 4.922 (s, 2H), δ 4.648 (d, 1H), δ 4.006 (d, 1H), δ 3.960 (d,1H), δ 3.591(m, 3H), δ 3.247 (s, 2H), δ 2.850 (m, 1H), δ 2.256 (s, 3H), δ 2.175 (m, 3H), δ 1.662 (s, 3H), δ 1.803 (m, 3H), δ 0.485 (d, 2H), δ 0.13(s, 2H).
- [0704]
- [0705] 실시예 I-16, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
- δ 7.561 (s, 1H), δ 7.353 (m, 1H), 7.266 (d, 1H), δ 6.961 (s, 1H), δ 6.266 (s, 1H), δ 5.190 (s, 2H), δ 4.908 (d, 2H), δ 4.502 (d,1H), δ 3.992(d, 1H), δ 3.882 (d, 1H), δ 3.275~3.217 (m, 3H), δ 2.818 (m, 1H), δ 2.257 (s, 3H), δ 2.110 (m, 2H), δ 1.772~1.673 (m, 5H).
- [0706]
- [0707] 실시예 I-17, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
- δ 7.628 (s, 1H), δ 6.340 (s, 1H), δ 5.006~4.980 (m, 3H), δ 4.792 (d, 1H), δ 3.936 (d, 1H), δ 3.893 (d, 1H), δ 3.459 (m, 1H), δ 3.302~3.259 (m,3H), δ 2.914 (m, 1H), δ 2.329 (s, 3H), δ 2.204 (m, 2H), δ 1.745~1.698 (m, 14H).
- [0708]
- [0709] 실시예 I-18, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
- δ 7.629 (s, 1H), δ 6.337 (s, 1H), δ 4.991 (m, 2H), δ 4.575 (d, 1H), δ 4.014~3.902 (m, 4H), δ 3.314~3.257 (m, 2H), δ 2.893 (m, 1H), δ 2.382 (s,3H), δ 2.187 (m, 2H), δ 1.739 (s, 2H), δ 1.573 (s, 6H), δ 1.222~0.879 (m, 8H).
- [0710]

- [0711] 실시예 I-19, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.542 (s, 1H), δ 6.338 (s, 1H), δ 4.991 (s, 2H), δ 4.576 (d, 1H), δ 4.367 (d, 1H), δ 4.040 (d, 1H), δ 3.328~3.180 (m, 6H), δ 2.935 (s, 1H), δ 2.326 (s, 3H), δ 2.200 (m, 2H), δ 1.817~1.605 (m, 10H), δ 1.284~1.122 (m, 8H).
- [0712] 실시예 I-20, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.496 (s, 1H), δ 7.406~7.369 (m, 6H), δ 6.339 (s, 1H), δ 4.992 (d, 2H), δ 4.559 (d, 1H), δ 4.281 (d, 1H), δ 4.037 (d, 1H), δ 3.303 (m, 3H), δ 3.191 (d, 1H), δ 2.327 (s, 3H), δ 2.187 (m, 2H), δ 1.804 (m, 3H), δ 1.379~1.333 (m, 4H).
- [0713] 실시예 I-21, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.471 (s, 1H), δ 6.783 (s, 1H), δ 6.268 (s, 1H), δ 4.915 (d, 2H), δ 4.486 (d, 1H), δ 3.979 (d, 1H), δ 3.247 (m, 4H), δ 2.817 (m, 1H), δ 2.257 (s, 1H), δ 2.124 (m, 2H), δ 1.652 (s, 3H), δ 1.457~1.371 (m, 4H), δ 1.079 (m, 3H).
- [0714] 실시예 I-22, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.624 (s, 1H), δ 7.265 (s, 1H), δ 7.158 (m, 2H), δ 6.339 (s, 1H), δ 6.052 (m, 1H), δ 4.992 (m, 2H), δ 4.570 (d, 1H), δ 4.047 (d, 1H), δ 3.918 (m, 1H), δ 3.474 (m, 1H), δ 3.297 (m, 3H), δ 2.867 (m, 2H), δ 2.775 (m, 1H), δ 2.327 (s, 3H), δ 2.150 (m, 2H), δ 2.298~1.923 (m, 7H), δ 1.803 (s, 3H).
- [0715] 실시예 I-23, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.559 (s, 1H), δ 6.266 (s, 1H), δ 4.921 (m, 2H), δ 4.539 (d, 1H), δ 4.117 (m, 2H), δ 3.994 (d, 2H), δ 3.921 (d, 2H), δ 3.247~3.188 (d, 1H), δ 3.918 (m, 3H), δ 2.828 (m, 1H), δ 2.256 (s, 3H), δ 2.157 (m, 2H), δ 1.637 (m, 2H), δ 1.608 (s, 3H), δ 1.255~1.185 (m, 10H), δ 0.801 (m, 3H).
- [0716] 실시예 I-24, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.816 (s, 1H), δ 7.361 (m, 7H), δ 6.343 (s, 1H), δ 5.004 (d, 2H), δ 4.664 (m, 2H), δ 4.038 (d, 1H), δ 3.392 (m, 2H), δ 3.188 (m, 1H), δ 2.884 (m, 1H), δ 2.334 (s, 3H), δ 2.256 (m, 2H), δ 1.871 (m, 2H).
- [0717] 실시예 I-25, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.828 (s, 1H), δ 7.158 (m, 7H), δ 6.345 (s, 1H), δ 5.017 (m, 2H), δ 4.587 (d, 1H), δ 4.070 (d, 1H), δ 3.489 (s, 1H), δ 3.349 (m, 2H), δ 3.142 (s, 3H), δ 2.927 (m, 1H), δ 2.332 (s, 3H), δ 2.220 (m, 2H), δ 1.835 (m, 3H), δ 0.626 (m, 2H).
- [0718] 실시예 I-26, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.476 (s, 1H), δ 6.265 (s, 1H), δ 4.921 (s, 2H), δ 4.483 (d, 1H), δ 4.298 (dd, 1H), δ 3.951~3.587 (m, 5H), δ 2.861 (m, 2H), δ 2.255 (s, 1H), δ 2.100 (m, 2H), δ 1.644~1.581 (m, 6H), δ 1.453~1.363 (m, 4H), δ 1.079 (m, 3H).
- [0719] 실시예 I-27, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.835 (dd, 2H), δ 7.707~7.638 (m, 2H), δ 7.460~7.396 (m, 3H), δ 7.391 (m, 1H), δ 6.265 (s, 1H), δ 4.920 (m, 2H), δ 4.521 (d, 1H), δ 4.156 (d, 1H), δ 3.987 (d, 1H), δ 3.422 (d, 1H), δ 3.248 (m, 2H), δ 2.843 (m, 1H), δ 2.253 (s, 3H), δ 2.180 (m, 2H), δ 1.992 (s, 3H), δ 1.726 (m, 2H).
- [0720] 실시예 I-28, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.831 (d, 1H), δ 7.483 (m, 1H), δ 7.414~7.310 (m, 5H), δ 6.341 (s, 1H), δ 5.009 (m, 2H), δ 4.762 (s, 2H), δ 4.572 (d, 1H), δ 4.071 (d, 1H), δ 3.351 (m, 2H), δ 2.932 (m, 1H), δ 2.802 (s, 3H), δ 2.572 (s, 2H), δ 2.330 (s, 3H), δ 1.847 (m, 2H).
- [0721] 실시예 I-29, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.831 (d, 1H), δ 7.483 (m, 1H), δ 7.414~7.310 (m, 5H), δ 6.341 (s, 1H), δ 5.009 (m, 2H), δ 4.762 (s, 2H), δ 4.572 (d, 1H), δ 4.071 (d, 1H), δ 3.351 (m, 2H), δ 2.932 (m, 1H), δ 2.802 (s, 3H), δ 2.572 (s, 2H), δ 2.330 (s, 3H), δ 1.847 (m, 2H).

- [0731] 실시예 I-29, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.818 (d, 1H), δ 7.302 (s, 1H), δ 6.344 (s, 1H), δ 5.008 (m, 2H), δ 4.489 (d, 1H), δ 4.073 (d, 1H), δ 3.672 (m, 1H), δ 3.252 (m, 2H), δ 3.099 (m, 1H), δ 2.936 (m, 1H), δ 2.335 (s, 3H), δ 2.252 (m, 2H), δ 2.002 (m, 2H), δ 1.676 (m, 4H), δ 1.437 (m, 2H), δ 1.394 (m, 4H), δ 0.994 (s, 3H).
- [0732] 실시예 I-30, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.657 (s, 1H), δ 7.571 (m, 3H), δ 7.331 (m, 2H), δ 7.163 (m, 1H), δ 6.333 (s, 1H), δ 4.983 (m, 2H), δ 4.565 (d, 1H), δ 4.126~3.961 (m, 2H), δ 3.403~3.251 (m, 3H), δ 2.913 (m, 1H), δ 2.320 (s, 3H), δ 2.204 (m, 2H), δ 1.824 (s, 3H), δ 1.630 (m, 2H).
- [0733] 실시예 I-31, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.554 (s, 1H), δ 6.269 (s, 1H), δ 5.192 (s, 1H), δ 4.923 (m, 2H), δ 4.532 (d, 1H), δ 3.983 (d, 1H), δ 3.867 (d, 1H), δ 3.223 (m, 3H), δ 2.834 (m, 1H), δ 2.259 (s, 3H), δ 2.162 (m, 2H), δ 1.678 (m, 2H), δ 1.608 (s, 3H), δ 1.506 (m, 8H).
- [0736] 실시예 I-32, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.465 (s, 1H), δ 6.665 (d, 1H), δ 6.267 (s, 1H), δ 4.924 (m, 2H), δ 4.497 (d, 1H), δ 3.984 (d, 1H), δ 3.807~3.581 (m, 3H), δ 3.178 (m, 3H), δ 2.824 (m, 1H), δ 2.256 (s, 3H), δ 2.130 (m, 2H), δ 1.635 (s, 3H), δ 1.557~1.361 (m, 4H), δ 1.300~1.049 (m, 10H).
- [0737] 실시예 I-33, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.540 (s, 1H), δ 6.337 (s, 1H), δ 4.991 (m, 2H), δ 4.482~4.210 (m, 3H), δ 4.057 (d, 1H), δ 3.326~3.159 (m, 3H), δ 3.109 (s, 1H), δ 2.924~2.821 (m, 3H), δ 2.325 (s, 3H), δ 2.223 (m, 2H), δ 1.844~1.758 (m, 9H), δ 1.485~1.379 (m, 4H).
- [0740] 실시예 I-34, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.471 (s, 1H), δ 6.817 (s, 1H), δ 6.267 (s, 1H), δ 4.919 (d, 2H), δ 4.502 (d, 1H), δ 3.987 (d, 1H), δ 3.797 (d, 1H), δ 3.241 (m, 3H), δ 2.824 (m, 1H), δ 2.257 (s, 3H), δ 2.117 (m, 2H), δ 1.748 (m, 2H), δ 1.634 (s, 3H), δ 0.798 (m, 2H), δ 0.719 (m, 2H).
- [0742] 실시예 I-35, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.473 (s, 1H), δ 6.819 (d, 1H), δ 6.549 (d, 1H), δ 6.266 (s, 2H), δ 4.918 (s, 2H), δ 4.515 (d, 1H), δ 3.953 (d, 1H), δ 3.763 (d, 1H), δ 3.195 (m, 3H), δ 2.825 (m, 1H), δ 2.733 (s, 1H), δ 2.257 (s, 3H), δ 2.174 (m, 2H), δ 1.745~1.641 (m, 6H), δ 1.385~1.362 (m, 4H), δ 1.187 (m, 5H).
- [0744] 실시예 I-36, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.629 (s, 1H), δ 6.340 (s, 1H), δ 5.989 (d, 1H), δ 5.731 (d, 1H), δ 5.384 (s, 1H), δ 4.994 (d, 2H), δ 4.602 (d, 1H), δ 4.433 (d, 1H), δ 3.915 (d, 1H), δ 3.489 (m, 1H), δ 3.305 (m, 3H), δ 3.112 (m, 3H), δ 2.879 (m, 1H), δ 2.329 (s, 3H), δ 1.957~1.755 (m, 8H), δ 1.699 (s, 3H).
- [0746] 실시예 I-37, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.468 (s, 1H), δ 6.790 (d, 1H), δ 6.267 (s, 1H), δ 4.919 (d, 2H), δ 4.472 (d, 1H), δ 4.005 (d, 1H), δ 3.788 (d, 1H), δ 3.242~3.088 (m, 5H), δ 2.284 (m, 1H), δ 2.257 (s, 3H), δ 2.128 (m, 3H), δ 1.741~1.651 (m, 5H), δ 1.194 (m, 11H).
- [0748] 실시예 I-38, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.564 (s, 1H), δ 7.502~7.366 (dd, 2H), δ 7.271 (s, 1H), δ 6.267 (s, 1H), δ 5.227 (s, 2H), δ 4.921 (d, 2H), δ 4.518 (d, 1H), δ 3.915 (d, 1H), δ 3.253 (d, 1H), δ 2.841 (m, 1H), δ 2.257 (s, 3H), δ 2.114 (m, 2H), δ 1.689 (s, 3H).
- [0750]

- [0751] 실시예 I-39, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.814 (s, 1H), δ 7.152 (d, 1H), δ 6.343 (s, 1H), δ 5.013 (m, 2H), δ 4.573 (d, 1H), δ 4.078 (d, 1H), δ 3.652 (m, 2H), δ 3.360 (m, 2H), δ 2.251 (m, 2H), δ 1.823 (m, 2H), δ 1.615~1.528 (m, 4H), δ 1.289 (m, 6H).
- [0752] 실시예 I-40, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.813 (s, 1H), δ 7.307 (s, 1H), δ 6.593 (s, 1H), δ 6.344 (s, 1H), δ 5.007 (m, 2H), δ 4.581 (d, 1H), δ 4.071 (d, 1H), δ 3.670 (m, 2H), δ 3.360 (m, 2H), δ 2.251 (m, 2H), δ 1.881 (m, 2H), δ 1.289 (m, 6H).
- [0753] 실시예 I-41, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.631 (s, 1H), δ 6.337 (s, 1H), δ 4.991 (d, 2H), δ 4.568 (d, 1H), δ 4.092 (m, 3H), δ 3.902 (s, 1H), δ 3.303 (m, 3H), δ 2.895 (m, 1H), δ 2.263~2.189 (m, 6H), δ 1.781~1.743 (m, 8H), δ 1.225 (m, 5H).
- [0754] 실시예 I-42, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.468 (s, 1H), δ 6.776 (s, 1H), δ 6.267 (s, 1H), δ 4.914 (s, 2H), δ 4.488 (d, 1H), δ 3.982 (d, 1H), δ 3.244 (m, 4H), δ 2.824 (m, 1H), δ 2.256 (s, 3H), δ 2.130 (m, 2H), δ 1.650 (s, 3H), δ 1.423~1.234 (m, 5H), δ 0.839 (m, 3H).
- [0755] 실시예 I-43, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.484 (s, 1H), δ 7.228 (m, 3H), δ 7.159 (s, 1H), δ 6.266 (s, 1H), δ 4.918 (d, 2H), δ 4.459 (m, 2H), δ 4.324 (m, 1H), δ 4.012 (d, 1H), δ 3.836 (d, 2H), δ 3.242 (m, 3H), δ 2.757 (m, 1H), δ 2.257 (s, 3H), δ 2.159 (m, 2H), δ 1.625~1.587 (m, 6H).
- [0756] 실시예 I-44, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.554 (s, 1H), δ 7.285 (s, 5H), δ 6.267 (s, 1H), δ 5.164 (s, 2H), δ 4.922 (d, 2H), δ 4.519 (d, 1H), δ 4.024 (d, 1H), δ 3.837 (d, 1H), δ 3.613 (m, 1H), δ 3.228 (m, 3H), δ 3.102 (m, 1H), δ 2.842 (m, 1H), δ 2.255 (s, 3H), δ 2.134 (m, 2H), δ 1.649 (s, 3H).
- [0757] 실시예 I-45, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.811 (s, 1H), δ 7.297 (s, 1H), δ 6.325 (d, 1H), δ 6.350 (s, 1H), δ 5.341 (m, 1H), δ 5.094 (m, 2H), δ 4.580 (d, 1H), δ 4.088 (d, 1H), δ 3.992 (m, 1H), δ 3.759 (m, 1H), δ 3.332 (m, 2H), δ 3.103 (m, 1H), δ 2.904 (m, 1H), δ 2.334 (s, 3H), δ 2.282 (m, 2H), δ 2.048 (m, 2H), δ 1.851 (m, 2H), δ 1.793 (m, 4H), δ 1.258 (s, 3H).
- [0758] 실시예 I-46, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.633 (s, 1H), δ 6.339 (s, 1H), δ 4.996 (m, 2H), δ 4.596 (d, 1H), δ 4.259 (m, 2H), δ 4.137 (d, 1H), δ 3.939 (d, 1H), δ 3.306 (m, 1H), δ 2.327 (s, 3H), δ 2.213 (m, 2H), δ 1.785 (m, 3H), δ 1.710 (s, 3H), δ 1.318 (m, 3H).
- [0759] 실시예 I-47, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.631 (s, 1H), δ 6.340 (s, 1H), δ 5.002 (m, 2H), δ 4.554 (d, 1H), δ 4.201 (m, 2H), δ 4.119 (d, 1H), δ 4.946 (d, 1H), δ 3.318 (m, 3H), δ 2.894 (m, 1H), δ 2.328 (s, 3H), δ 2.213 (m, 2H), δ 1.785 (m, 3H), δ 1.710 (s, 2H), δ 1.400 (m, 3H), δ 0.932 (m, 3H).
- [0760] 실시예 I-48, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.566 (s, 1H), δ 6.267 (s, 1H), δ 4.921 (m, 2H), δ 4.554 (d, 1H), δ 3.980~3.848 (m, 4H), δ 3.234 (m, 3H), δ 2.733 (m, 1H), δ 2.257 (s, 3H), δ 2.094 (d, 2H), δ 1.741 (m, 2H), δ 1.654 (s, 4H), δ 0.815 (m, 1H), δ 0.509 (d, 2H), δ 0.239 (d, 2H).
- [0770]

[0771] 실시예 I-49, 용매: CDCl_3 , 분광계: 300 MHz
 δ 7.582 (s, 1H), δ 6.270 (s, 1H), δ 4.955~4.866 (m, 2H), δ 4.487 (d, 1H), δ 3.994 (d, 1H), δ 3.876 (d, 1H), δ 3.280~3.225 (m, 3H), δ 2.818 (m, 1H), δ 2.256 (s, 3H), δ 2.097 (m, 2H), δ 1.706 (s, 5H).

[0772] 사용 실시예

[0773] 피토프토타(Phytophthora) 시험(토마토)/보호

[0774] 용매: 24.5 중량부의 아세톤

[0775] 24.5 중량부의 디메틸아세트아미드

[0776] 유화제: 1 중량부의 알킬아릴 폴리글리콜 에테르

[0777] 적절한 활성 성분 제제를 생성하기 위하여, 1 중량부의 활성 성분을 소정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축액을 물로 바람직한 농도로 희석한다.

[0778] 보호 효능을 시험하기 위하여, 어린 식물에 명시된 적용 비율로 활성 성분 제제를 분무한다. 분무 코팅이 표면에서 건조된 후, 피토프토타 인페스탄스(Phytophthora infestans)의 수성 포자 현탁액으로 접종한다. 그후, 식물을 약 20°C 및 100%의 상대 대기 습도에서 접종 캐빈에 넣는다.

[0779] 접종 3일후 평가를 실시한다. 0%는 대조군의 것에 해당하는 효율을 의미하는 한편, 100%의 효율은 감염이 관찰되지 않는다는 것을 의미한다.

[0780] 이러한 시험에서, 하기 본 발명의 화합물은 10 ppm의 활성 성분 농도에서 효율이 70% 이상인 것으로 나타난다:

화합물	Eff
I-5	93
I-3	91
I-7	91
I-8	96
I-2	70
I-6	95
I-9	98
I-4	94
I-1	75

[0781]