



(19) 대한민국특허청(KR)
 (12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2015-0097513
 (43) 공개일자 2015년08월26일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)

A01N 43/40 (2006.01) *C07D 213/24* (2006.01)
C07D 213/60 (2006.01) *C07D 213/61* (2006.01)
C07D 213/62 (2006.01) *C07D 213/70* (2006.01)
C07D 213/72 (2006.01) *C07D 213/73* (2006.01)
C07D 213/74 (2006.01) *C07D 213/75* (2006.01)
C07D 401/02 (2006.01)

(52) CPC특허분류(Coo. Cl.)

A01N 43/40 (2013.01)
C07D 213/24 (2013.01)

(21) 출원번호 10-2015-7016011

(22) 출원일자(국제) 2013년12월19일

심사청구일자 없음

(85) 번역문제출일자 2015년06월16일

(86) 국제출원번호 PCT/JP2013/085022

(87) 국제공개번호 WO 2014/098259

국제공개일자 2014년06월26일

(30) 우선권주장

JP-P-2012-280207 2012년12월21일 일본(JP)

(뒷면에 계속)

(71) 출원인

이시하라 산교 가부시끼가이샤

일본 오오사카시 니시구에 도보리1초메3방15고

(72) 발명자

기리야마 가즈히사

일본 525-0025 시가켄 구사쓰시 니시시부카와
 2-3-1 쥬오 켄큐쇼 이시하라 산교 가부시끼가이샤
 나이

마츠모토 마사히로

일본 525-0025 시가켄 구사쓰시 니시시부카와
 2-3-1 쥬오 켄큐쇼 이시하라 산교 가부시끼가이샤
 나이

(뒷면에 계속)

(74) 대리인

김진희, 김태홍

전체 청구항 수 : 총 8 항

(54) 발명의 명칭 유해생물 방제제

(57) 요 약

본 발명의 목적은 유해생물들에 대한 활성이 큰 화합물을 제공하는 것, 이 화합물을 포함하는 유해생물 방제제를 제공하는 것, 그리고 이 화합물을 사용함으로써 유해생물을 방제하는 방법을 제공하는 것이다. 본 발명은 4-(아릴에티닐)페리딘 또는 이의 염, 상기 4-(아릴에티닐)페리딘 또는 이의 염을 유효 성분으로서 포함하는 유해생물 방제제, 그리고 상기 4-(아릴에티닐)페리딘 또는 이의 염을 유효량으로 사용하여 유해생물을 방제하는 방법을 제공한다.

(52) CPC특허분류(Coo. Cl.)

C07D 213/60 (2013.01)
C07D 213/61 (2013.01)
C07D 213/62 (2013.01)
C07D 213/70 (2013.01)
C07D 213/72 (2013.01)
C07D 213/73 (2013.01)
C07D 213/74 (2013.01)
C07D 213/75 (2013.01)
C07D 401/02 (2013.01)

(72) 발명자

요시다 고타로

일본 525-0025 시가켄 구사쓰시 니시시부카와
 2-3-1 쥬오 겐큐쇼 이시하라 산교 가부시끼가이샤
 나이

볼드바타르 담딘수렌

일본 525-0025 시가켄 구사쓰시 니시시부카와
 2-3-1 쥬오 겐큐쇼 이시하라 산교 가부시끼가이샤
 나이

주쿠로기 다츠야

일본 525-0025 시가켄 구사쓰시 니시시부카와
 2-3-1 쥬오 겐큐쇼 이시하라 산교 가부시끼가이샤
 나이

우메모토 나오

일본 525-0025 시가켄 구사쓰시 니시시부카와
 2-3-1 쥬오 겐큐쇼 이시하라 산교 가부시끼가이샤
 나이

가니 다츠야

일본 525-0025 시가켄 구사쓰시 니시시부카와
 2-3-1 쥬오 겐큐쇼 이시하라 산교 가부시끼가이샤
 나이

마츠다 요코

일본 525-0025 시가켄 구사쓰시 니시시부카와
 2-3-1 쥬오 겐큐쇼 이시하라 산교 가부시끼가이샤
 나이

다나카 구미코

일본 525-0025 시가켄 구사쓰시 니시시부카와
 2-3-1 쥬오 겐큐쇼 이시하라 산교 가부시끼가이샤
 나이

가누마 미치코

일본 525-0025 시가켄 구사쓰시 니시시부카와
 2-3-1 쥬오 겐큐쇼 이시하라 산교 가부시끼가이샤
 나이

시마다 다츠야

일본 525-0025 시가켄 구사쓰시 니시시부카와
 2-3-1 쥬오 겐큐쇼 이시하라 산교 가부시끼가이샤
 나이

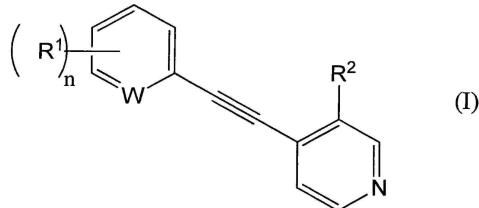
(30) 우선권주장

JP-P-2013-162860 2013년08월06일 일본(JP)
 JP-P-2013-212795 2013년10월10일 일본(JP)

특허청구의 범위

청구항 1

하기 일반식 (I)로 표시되는 화합물 또는 이의 염:



[상기 식 중,

R^1 은 할로겐 원자, 아미노기, 하이드록실기, 머캅토기, 시아노기, 니트로기, (C_1-C_6)알킬기, (C_2-C_6)알케닐기, (C_2-C_6)알카닐기, (C_3-C_6)사이클로알킬기, (C_1-C_6)할로알킬기, (C_1-C_6)알콕시기, (C_2-C_6)알케닐옥시기, (C_2-C_6)알카닐옥시기, (C_3-C_6)사이클로알콕시기, (C_1-C_6)할로알콕시기, (C_1-C_6)알킬티오기, (C_2-C_6)알케닐티오기, (C_2-C_6)알카닐티오기, (C_3-C_6)사이클로알킬티오기, (C_1-C_6)할로알킬티오기, (C_1-C_6)알킬아미노기, (C_2-C_6)알케닐아미노기, (C_2-C_6)알카닐아미노기, 디(C_1-C_6)알킬아미노기, 디(C_2-C_6)알케닐아미노기, 디(C_2-C_6)알카닐아미노기, (C_1-C_6)알킬설플루스틸기, (C_2-C_6)알카닐설플루스틸기, (C_3-C_6)사이클로알킬설플루스틸기, (C_1-C_6)할로알킬설플루스틸기, (C_1-C_6)알킬설플루스틸기, (C_2-C_6)알케닐설플루스틸기, (C_2-C_6)알카닐설플루스틸기, 카복실기, (C_1-C_6)알킬카보닐기, (C_1-C_6)알콕시카보닐기, (C_1-C_6)알킬아미노카보닐기, 디(C_1-C_6)알킬아미노카보닐기, (C_1-C_6)알킬카보닐옥시기, (C_1-C_6)알킬카보닐아미노기이고;

R^2 는 할로겐 원자, 아미노기, 하이드록실기, 머캅토기, 시아노기, 니트로기, (C_1-C_6)알킬기, (C_2-C_6)알케닐기, (C_2-C_6)알카닐기, (C_1-C_6)할로알킬기, (C_1-C_6)알콕시기, (C_2-C_6)알케닐옥시기, (C_2-C_6)알카닐옥시기, (C_1-C_6)알킬티오기, (C_2-C_6)알케닐티오기, (C_1-C_6)알킬아미노기, (C_2-C_6)알케닐아미노기, (C_2-C_6)알카닐아미노기, 디(C_1-C_6)알킬아미노기, 디(C_2-C_6)알케닐아미노기, 디(C_2-C_6)알카닐아미노기, (C_1-C_6)알킬설플루스틸기, (C_2-C_6)알케닐설플루스틸기, (C_2-C_6)알카닐설플루스틸기, (C_1-C_6)알킬카보닐옥시(C_1-C_6)알킬기, (C_1-C_6)알킬티오(C_1-C_6)알킬기, (C_1-C_6)알킬아미노(C_1-C_6)알킬기, 디(C_1-C_6)알킬아미노(C_1-C_6)알킬기, 하이드록실(C_1-C_6)알킬기, 포르밀기, 카복실기, (C_1-C_6)알킬카보닐기, (C_1-C_6)알콕시카보닐기, (C_1-C_6)알킬아미노카보닐기, 디(C_1-C_6)알킬아미노카보닐기, (C_1-C_6)알킬카보닐옥시기, (C_1-C_6)알킬카보닐티오기, (C_1-C_6)알킬카보닐아미노기, 또는 디(C_1-C_6)알킬카보닐아미노기이며;

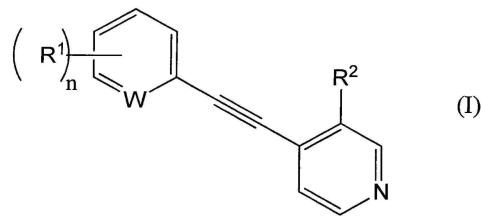
W 는 CH 또는 질소 원자이고;

n 은 1 ~ 4의 정수이며;

n 이 2 이상일 때, R^1 모이어티들은 동일하거나 상이할 수 있음].

청구항 2

제1항에 있어서, 하기 일반식 (I)로 표시되는 화합물 또는 이의 염:



[상기 식 중,

R^1 은 할로겐 원자, 아미노기, 하이드록실기, 머캅토기, 시아노기, 니트로기, (C_1-C_6)알킬기, (C_2-C_6)알케닐기, (C_2-C_6)알카닐기, (C_3-C_6)사이클로알킬기, (C_1-C_6)할로알킬기, (C_1-C_6)알콕시기, (C_2-C_6)알케닐옥시기, (C_2-C_6)알카닐옥시기, (C_3-C_6)사이클로알콕시기, (C_1-C_6)할로알콕시기, (C_1-C_6)알킬티오기, (C_2-C_6)알케닐티오기, (C_2-C_6)알카닐티오기, (C_3-C_6)사이클로알킬티오기, (C_1-C_6)할로알킬티오기, (C_1-C_6)알킬아미노기, (C_2-C_6)알케닐아미노기, (C_2-C_6)알카닐아미노기, (C_1-C_6)알킬설페닐기, (C_2-C_6)알케닐설페닐기, (C_3-C_6)사이클로알킬설페닐기, (C_1-C_6)할로알킬설페닐기, (C_1-C_6)알킬설포닐기, (C_2-C_6)알케닐설포닐기, (C_2-C_6)알카닐설포닐기, 카복실기, (C_1-C_6)알킬카보닐기, (C_1-C_6)알콕시카보닐기, (C_1-C_6)알킬아미노카보닐기, (C_1-C_6)알킬카보닐옥시기, (C_1-C_6)알킬카보닐아미노기, 또는 (C_1-C_6)알킬카보닐(C_1-C_6)알킬아미노기이고;

R^2 는 할로겐 원자, 하이드록실기, 머캅토기, 니트로기, (C_1-C_6)알킬기, (C_2-C_6)알케닐기, (C_2-C_6)알카닐기, (C_1-C_6)할로알킬기, (C_1-C_6)알콕시기, (C_2-C_6)알케닐옥시기, (C_1-C_6)알킬티오기, (C_2-C_6)알케닐티오기, (C_1-C_6)알킬아미노기, (C_2-C_6)알케닐아미노기, (C_2-C_6)알카닐아미노기, (C_1-C_6)알킬설페닐기, (C_2-C_6)알케닐설페닐기, (C_3-C_6)사이클로알킬설페닐기, (C_1-C_6)할로알킬설페닐기, (C_2-C_6)알킬설포닐기, (C_2-C_6)알케닐설포닐기, (C_2-C_6)알카닐설포닐기, (C_1-C_6)알킬카보닐기, (C_1-C_6)알킬티오(C_1-C_6)알킬기, (C_1-C_6)알킬아미노(C_1-C_6)알킬기, (C_1-C_6)알킬아미노(C_1-C_6)알킬기, 하이드록실(C_1-C_6)알킬기, 카복실기, (C_1-C_6)알킬카보닐기, (C_1-C_6)알킬아미노카보닐기, (C_1-C_6)알킬카보닐옥시기, (C_1-C_6)알킬카보닐티오기, (C_1-C_6)알킬카보닐아미노기, 또는 (C_1-C_6)알킬카보닐아미노기이며;

W 는 CH 또는 질소 원자이고;

n 은 1 ~ 4의 정수이며;

n 이 2 이상일 때, R^1 모이어티들은 동일하거나 상이할 수 있고;

R^2 가 (C_1-C_6)알킬기일 때, R^1 모이어티는 오르토 위치에서 치환되지 않음].

청구항 3

제1항에 따른 화합물 또는 이의 염을 유효 성분으로서 포함하는 유해생물 방제제.

청구항 4

제1항에 따른 화합물 또는 이의 염을 유효 성분으로서 포함하는 농원예용 유해생물 방제제.

청구항 5

제1항에 따른 화합물 또는 이의 염을 유효 성분으로서 포함하는 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제.

청구항 6

제1항에 따른 화합물 또는 이의 염을 유효 성분으로서 포함하는 살충제 또는 살비제.

청구항 7

제1항에 따른 화합물 또는 이의 염을 유효 성분으로서 포함하는 살동물기생생물제.

청구항 8

제1항에 따른 화합물 또는 이의 염을 유효량으로 사용하는 것을 포함하는, 유해생물을 방제하는 방법.

명세서

기술 분야

[0001] 본 발명은 신규 4-(아릴에티닐)페리딘 화합물 또는 이의 염을 유효 성분으로서 포함하는 유해생물 방제제에 관한 것이다.

배경기술

[0002] PLT1에는, 특이 4-(아릴)페리딘 유도체가 농원예용 살충제로서 유용하다고 개시되어 있으며, PLT2에는, 특이 페리딘 화합물이 유해생물을 방제하는데 효과적이라고 개시되어 있다. 뿐만 아니라, PLT3에는, 살충 작용과 살비 작용을 가지는 페리디 유도체 및 이의 염이 개시되어 있다. 그러나, 상기 PLT1, 2 및 3은, 본 발명의 화합물에 관한 설명은 전혀 포함하고 있지 않다. 간염 바이러스 치료제인 페롤로페리딘 화합물에 관한 PLT4에는, 이 화합물을 합성하는 계획에 사용된 소정의 4-(아릴에티닐)페리딘 유도체가 개시되어 있다.

선행기술문현

특허문현

[0003] (특허문현 0001) [PLT 1] : WO 2010/064711

(특허문현 0002) [PLT 2] : WO 2012/008526

(특허문현 0003) [PLT 3] : JP-A-1-316359

(특허문현 0004) [PLT 4] : WO 2010/115901

발명의 내용

해결하려는 과제

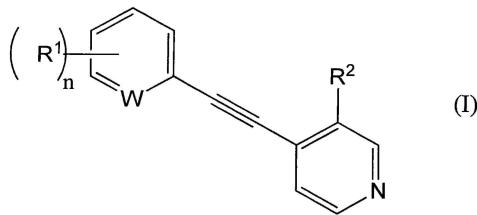
[0004] 다수의 유해생물 방제제들이 다년간 사용되고 있으나, 이와 같은 방제제들 중 다수는, 예를 들어 효능이 충분하지 못하고, 해충 등이 내성을 얻었으며, 또한 사용에 제한이 따르는 것과 같은 여러 가지 문제점들을 가진다. 그러므로, 이와 같은 단점들이 경감된 신규 유해생물 방제제를 개발하는 것이 요망된다. 본 발명의 목적들은 유해생물에 대한 활성이 큰 화합물을 제공하는 것, 이 화합물을 포함하는 유해생물 방제제를 제공하는 것, 그리고 이 화합물을 사용함으로써 유해생물을 방제하는 방법을 제공하는 것이다.

과제의 해결 수단

[0005] 본 발명의 발명자들은 한층 더 우수한 유해생물 방제제를 찾고자 다양한 페리딘 유도체들을 대상으로 연구를 수행하였다. 결국, 본 발명의 발명자들은 신규 4-(아릴에티닐)페리딘 화합물이 소량으로 사용될 때 유해생물을 방제하는데 매우 큰 효과를 발휘한다는 것을 발견하게 되었다. 이로써 본 발명이 완성되었다.

[0006] 다시 말해서, 본 발명은 다음과 같은 (1) ~ (8)로서 요약된다.

[0007] (1) 하기 일반식 (I)로 표시되는 화합물 또는 이의 염:



[0008]

[0009] [상기 식 중,

[0010] R^1 은 할로겐 원자, 아미노기, 하이드록실기, 머캅토기, 시아노기, 니트로기, (C_1-C_6)알킬기, (C_2-C_6)알케닐기, (C_2-C_6)알키닐기, (C_3-C_6)사이클로알킬기, (C_1-C_6)할로알킬기, (C_1-C_6)알콕시기, (C_2-C_6)알케닐옥시기, (C_2-C_6)알카닐옥시기, (C_3-C_6)사이클로알콕시기, (C_1-C_6)할로알콕시기, (C_1-C_6)알킬티오기, (C_2-C_6)알케닐티오기, (C_2-C_6)알카닐티오기, (C_3-C_6)사이클로알킬티오기, (C_1-C_6)할로알킬티오기, (C_1-C_6)알킬아미노기, (C_2-C_6)알케닐아미노기, (C_2-C_6)알카닐아미노기, 디(C_1-C_6)알킬아미노기, 디(C_2-C_6)알케닐아미노기, 디(C_2-C_6)알카닐아미노기, (C_1-C_6)알킬설피닐기, (C_2-C_6)알케닐설피닐기, (C_2-C_6)사이클로알킬설피닐기, (C_1-C_6)할로알킬설피닐기, (C_1-C_6)알킬설포닐기, (C_2-C_6)알케닐설포닐기, (C_2-C_6)알카닐설포닐기, 카복실기, (C_1-C_6)알킬카보닐기, (C_1-C_6)알콕시카보닐기, (C_1-C_6)알킬아미노카보닐기, 디(C_1-C_6)알킬아미노카보닐기, (C_1-C_6)알킬카보닐옥시기, (C_1-C_6)알킬카보닐아미노기, 또는 (C_1-C_6)알킬카보닐(C_1-C_6)알킬아미노기이고;

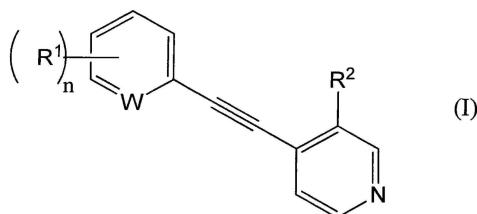
[0011] R^2 는 할로겐 원자, 아미노기, 하이드록실기, 머캅토기, 시아노기, 니트로기, (C_1-C_6)알킬기, (C_2-C_6)알케닐기, (C_2-C_6)알키닐기, (C_1-C_6)할로알킬기, (C_1-C_6)알콕시기, (C_2-C_6)알케닐옥시기, (C_2-C_6)알키닐옥시기, (C_1-C_6)알킬티오기, (C_2-C_6)알케닐티오기, (C_2-C_6)알카닐티오기, (C_3-C_6)사이클로알킬티오기, (C_1-C_6)알킬아미노기, (C_2-C_6)알케닐아미노기, (C_2-C_6)알카닐아미노기, 디(C_1-C_6)알킬아미노기, 디(C_2-C_6)알케닐아미노기, 디(C_2-C_6)알카닐아미노기, (C_1-C_6)알킬설피닐기, (C_2-C_6)알케닐설피닐기, (C_2-C_6)사이클로알킬설피닐기, (C_1-C_6)할로알킬설피닐기, (C_2-C_6)알키닐설포닐기, (C_1-C_6)알킬옥시(C_1-C_6)알킬기, (C_1-C_6)알킬티오(C_1-C_6)알킬기, (C_1-C_6)알킬아미노(C_1-C_6)알킬기, 디(C_1-C_6)알킬아미노(C_1-C_6)알킬기, 하이드록실(C_1-C_6)알킬기, 포르밀기, 카복실기, (C_1-C_6)알킬카보닐기, (C_1-C_6)알콕시카보닐기, (C_1-C_6)알킬아미노카보닐기, 디(C_1-C_6)알킬아미노카보닐기, (C_1-C_6)알킬카보닐옥시기, (C_1-C_6)알킬카보닐티오기, (C_1-C_6)알킬카보닐아미노기, 또는 디(C_1-C_6)알킬카보닐아미노기이며;

[0012] W 는 CH 또는 질소 원자이고;

[0013] n은 1 ~ 4의 정수이며;

[0014] n이 2 이상일 때, R^1 모이어티들은 동일하거나 상이할 수 있음].

[0015] (2) 상기 (1)에 있어서, 하기 일반식 (I)로 표시되는 화합물 또는 이의 염:



[0016]

[0017] [상기 식 중,

[0018] R^1 은 할로겐 원자, 아미노기, 하이드록실기, 머캅토기, 시아노기, 니트로기, (C_1-C_6)알킬기, (C_2-C_6)알케닐기,

(C₂-C₆)알키닐기, (C₃-C₆)사이클로알킬기, (C₁-C₆)할로알킬기, (C₁-C₆)알콕시기, (C₂-C₆)알케닐옥시기, (C₂-C₆)알키닐옥시기, (C₃-C₆)사이클로알콕시기, (C₁-C₆)할로알콕시기, (C₁-C₆)알킬티오기, (C₂-C₆)알케닐티오기, (C₂-C₆)알키닐티오기, (C₃-C₆)사이클로알킬티오기, (C₁-C₆)할로알킬티오기, (C₁-C₆)알킬아미노기, (C₂-C₆)알케닐아미노기, (C₂-C₆)알키닐아미노기, 디(C₁-C₆)알킬아미노기, 디(C₂-C₆)알케닐아미노기, 디(C₂-C₆)알키닐아미노기, (C₁-C₆)알킬설피닐기, (C₂-C₆)알케닐설피닐기, (C₂-C₆)알키닐설피닐기, (C₃-C₆)사이클로알킬설피닐기, (C₁-C₆)할로알킬설피닐기, (C₁-C₆)알킬설포닐기, (C₂-C₆)알케닐설포닐기, (C₂-C₆)알키닐설포닐기, 카복실기, (C₁-C₆)알킬카보닐기, (C₁-C₆)알콕시카보닐기, (C₁-C₆)알킬아미노카보닐기, 디(C₁-C₆)알킬아미노카보닐기, (C₁-C₆)알킬카보닐옥시기, (C₁-C₆)알킬카보닐아미노기, 또는 (C₁-C₆)알킬카보닐(C₁-C₆)알킬아미노기이고;

R^2 는 할로겐 원자, 하이드록실기, 멀캅토기, 니트로기, (C_1-C_6)알킬기, (C_2-C_6)알케닐기, (C_2-C_6)알키닐기, (C_1-C_6)할로알킬기, (C_1-C_6)알콕시기, (C_2-C_6)알케닐옥시기, (C_2-C_6)알키닐옥시기, (C_1-C_6)알킬티오기, (C_2-C_6)알케닐티오기, (C_1-C_6)알킬아미노기, (C_2-C_6)알케닐아미노기, (C_2-C_6)알키닐아미노기, 디(C_1-C_6)알킬아미노기, 디(C_2-C_6)알케닐아미노기, 디(C_2-C_6)알키닐아미노기, (C_1-C_6)알킬설피닐기, (C_2-C_6)알케닐설피닐기, (C_2-C_6)알키닐설피닐기, (C_1-C_6)알킬설포닐기, (C_2-C_6)알케닐설포닐기, (C_2-C_6)알키닐설포닐기, (C_1-C_6)알킬옥시(C_1-C_6)알킬기, (C_1-C_6)알킬티오(C_1-C_6)알킬기, (C_1-C_6)알킬아미노(C_1-C_6)알킬기, 디(C_1-C_6)알킬아미노(C_1-C_6)알킬기, 하이드록실(C_1-C_6)알킬기, 카복실기, (C_1-C_6)알킬카보닐기, (C_1-C_6)알킬아미노카보닐기, 디(C_1-C_6)알킬아미노카보닐기, (C_1-C_6)알킬카보닐옥시기, (C_1-C_6)알킬카보닐티오기, (C_1-C_6)알킬카보닐아미노기, 또는 디(C_1-C_6)알킬카보닐아미노기이며;

W는 CH 또는 질소 원자이고;

n 은 1 ~ 4의 정수이며;

$n \geq 2$ 이상일 때, R^1 모이어티들은 동일하거나 상이할 수 있고;

R^2 가 $(C_1 - C_6)$ 알킬기일 때, R^1 모이어티는 오르토 위치에서 치환되지 않음].

(3) 상기 (1)에 따른 화합물 또는 이의 염을 유효 성분으로서 포함하는 유해생물 방제제.

(4) 상기 (1)에 따른 화합물 또는 이의 염을 유효 성분으로서 포함하는 농원예용 유해생물 방제제.

(5) 상기 (1)에 따른 화합물 또는 이의 염을 유효 성분으로서 포함하는 살충제, 살미제, 살선충제 또는 살토양 해충제.

(6) 상기 (1)에 따른 화합물 또는 이의 염을 유효 성분으로서 포함하는 살충제 또는 살비제.

(7) 상기 (1)에 따른 화합물 또는 이의 염을 유효 성분으로서 포함하는 살동물기생생물제.

(8) 상기 (1)에 따른 화합물 또는 이의 염을 유효량으로 사용하는 것을 포함하는, 유해생물을 방제하는 방법.

발명의 효과

일반식 (I)의 화합물 또는 이의 염을 유효 성분으로서 포함하는 유해생물 방제제는 소량으로 사용될 때 유해생물을 방제하는데 매우 큰 효과를 발휘한다.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

일반식 (I) 중 치환체들로서 일반식 (I)의 할로겐 원자들 또는 할로겐들의 예들로서는 플루오르, 염소, 브롬 또는 요오드 원자를 포함할 수 있다. 치환체(들)로서의 할로겐 원자의 수는 1 이상일 수 있다. 상기 할로겐 원자의 수가 2 이상인 경우, 할로겐 원자들은 동일하거나 상이할 수 있다. 각각의 할로겐 원자는 임의의 위치에서 치환될 수 있다.

일반식 (I)에 있어서 알킬 또는 알킬 도이어티에 관한 예들로서는 선형 또는 분지형 C_1-C_6 기들, 예를 들어 메틸,

에틸, 노르말 프로필, 이소프로필, 노르말 부틸, 이소부틸, 2차 부틸, 3차 부틸, 노르말 펜틸, 이소펜틸, 네오펜틸, 노르말 헥실 및 네오헥실을 포함할 수 있다.

[0033] 본 설명에 있어서, "3차"는 "tert-"로 표시되는 경우가 있다.

[0034] 일반식 (I)에 있어서 알케닐 또는 알케닐 모이어티에 관한 예들로서는 선형 또는 분지형 C₂–C₆기들, 예를 들어 비닐, 1-프로페닐, 2-프로페닐, 이소프로페닐, 2-메틸-1-프로페닐, 1-메틸-1-프로페닐, 2-메틸-2-프로페닐, 1-메틸-2-프로페닐, 1-부테닐, 2-부테닐, 3-부테닐, 1-펜테닐, 2-펜테닐, 2-메틸-2-부테닐, 1-헥세닐 및 2,3-디메틸-2-부테닐을 포함할 수 있다.

[0035] 일반식 (I)에 있어서 알키닐 또는 알키닐 모이어티에 관한 예들로서는 선형 또는 분지형 C₂–C₆기들, 예를 들어 에티닐, 1-프로피닐, 2-프로피닐, 1-부티닐, 2-부티닐, 3-부티닐, 1-메틸-2-프로피닐, 2-메틸-3-부티닐, 3,3-디메틸-1-부티닐, 1-헥시닐, 2-헥시닐, 3-헥시닐, 4-헥시닐 및 5-헥시닐을 포함할 수 있다.

[0036] 일반식 (I)에 있어서 사이클로알킬 또는 사이클로알킬 모이어티에 관한 예들로서는 C₃–C₆기들, 예를 들어 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸 및 사이클로헥실을 포함할 수 있다.

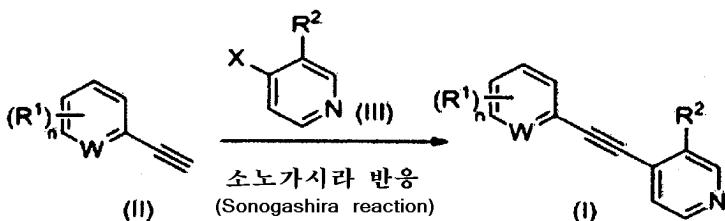
[0037] 일반식 (I)의 화합물의 염은, 이 염이 본 기술 분야에서 허용 가능한 것인 한 임의의 염일 수 있다. 이에 관한 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 암모늄 염, 예를 들어 디메틸암모늄 염 및 트리에틸암모늄 염; 무기산 염, 예를 들어 염화수소산염, 과염소산염, 황산염 및 질산염; 그리고 유기산 염, 예를 들어 아세트산염, 트리플루오로아세트산염, 옥살산염, p-톨루엔설폰산염 및 메탄설폰산염.

[0038] 일반식 (I)의 화합물 또는 이의 염이 이성체, 예를 들어 광학 이성체를 포함하는 경우가 있는데, 이 경우 이성체와 이 이성체들의 혼합물 둘 다 본 발명에 포함된다. 본 설명에 있어서, 이성체들은 달리 지정되지 않는 한 이성체들의 혼합물로서 제공된다. 부수적으로, 상기 보인 이성체들 이외의 다양한 이성체들은, 해당 이성체들이 본 기술 분야의 통상적인 지식 범위 내에 있는 한, 본 발명에 포함된다. 몇 가지 종류의 이성체들이 일반식 (I)과는 상이한 화학 구조를 가지는 경우가 있지만, 당업자는 이와 같은 화합물이 이성체임을 충분히 인식할 수 있다. 그러므로 이러한 이성체들은 본 발명의 범위 내에 포함된다.

[0039] 일반식 (I)의 화합물 또는 이의 염(이하 "본 발명의 화합물"이라고 약칭됨)은 다음과 같은 제조 방법들과, 염을 제조하기 위한 보통의 방법들에 의해 제조될 수 있다. 그러나, 본 발명의 화합물을 제조하기에 유용한 방법들은 이와 같은 방법들에 한정되지 않는다.

제조 방법[1]

[0041] 본 발명의 화합물은, 팔라듐 촉매, 구리 염 및 염기의 존재 하에 하기 일반식 (II)의 화합물과 하기 일반식 (III)의 화합물을 반응시킴으로써 제조될 수 있다.



[0042]

[0043] (상기 제조 방법[1]에 있어서, X는 할로겐 원자이고, n, R¹, R² 및 W는 상기 정의된 바와 같음)

[0044] 팔라듐 촉매의 예들로서는 테트라카이스(트리페닐포스핀)팔라듐(0) 및 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II) 디클로라이드를 포함할 수 있다.

[0045] 구리 염의 예들로서는 요오드화제1구리를 포함할 수 있다.

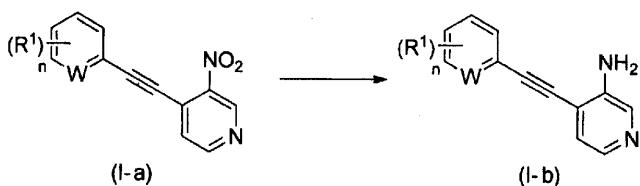
[0046] 염기는 유기 염기 또는 무기 염기 중 어느 하나일 수 있다. 유기 염기의 예들로서는 아민 염기들, 예를 들어 트리에틸아민 및 디이소프로필아민을 포함할 수 있다. 무기 염기의 예들로서는 알칼리 금속 탄산염, 예를 들어 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산세슘을 포함할 수 있다.

반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매는 반응에 비활성인 임의의 용매일 수 있다. 예를 들어 1개 이상의 용매가 다음과 같은 것들로부터 적당히 선택될 수 있다: 아민 염기; 비 양자성 극성 용매, 예를 들어 N,N-디메틸포름아미드 및 아세토니트릴; 에테르, 예를 들어 테트라하이드로푸란 등.

반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 20°C에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 24시간에 이를 수 있다.

제조 방법[2]

R^2 가 NH_2 일 때의 일반식 (I)의 화합물인 하기 일반식 (I-b)의 화합물은, R^2 가 NO_2 인 하기 일반식 (I-a)의 화합물의, 금속 또는 염기가 사용되는 환원이나, 유사한 반응에 의해 제조될 수 있다.



(상기 제조 방법[2]에 있어서, n , R^1 및 W 는 상기 정의된 바와 같음)

금속의 예들로서는 철, 아연 및 주석을 포함할 수 있다.

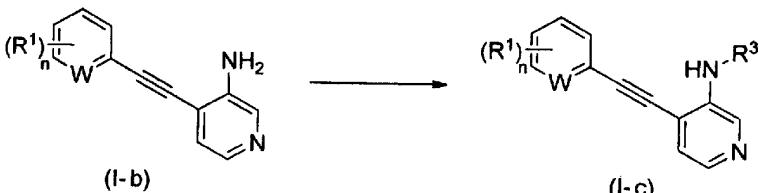
산의 예들로서는 무기산, 예를 들어 염화수소산 및 황산, 그리고 유기산, 예를 들어 아세트산을 포함할 수 있다.

반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매는 반응에 비활성인 입의의 용매일 수 있다. 예를 들어 1개 이상의 용매는 에테르, 예를 들어 테트라하이드로푸란, 에틸렌 글리콜 디메틸 에테르 및 1,4-디옥산, 에스테르, 예를 들어 아세트산메틸, 아세트산에틸 및 물 등으로부터 적당히 선택될 수 있으며, 이것들은 혼합되어 사용될 수도 있다.

반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 20°C에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 24시간에 이를 수 있다.

제조 방법[3]

R^2 가 NHR^3 일 때의 일반식 (I)의 화합물인 하기 일반식 (I-c)의 화합물은, 염기의 존재 하에 R^3X 와 하기 일반식 (I-b)의 화합물을 반응시킴으로써 제조될 수 있다.



(상기 제조 방법[3]에 있어서, R^3 은 (C_1-C_6) 알킬기, (C_2-C_6) 알케닐기 또는 (C_2-C_6) 알키닐기를 나타냄. 기호 n , R^1 , W 및 X 는 상기 정의된 바와 같음)

염기의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 알칼리 금속 수소화물, 예를 들어 수소화나트륨; 알칼리 금속 탄산염, 예를 들어 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산세슘; 그리고 알칼리 금속 수산화물, 예를 들어 수산화리튬, 수사화나트륨 및 수사화칼륨.

반응을 필요에 따라서 용매의 종류 하에 수해될 수 있다. 용매는 반응에 비활성인 위의의 용매일 수 있다. 예를

들어 1개 이상의 용매가 에테르, 예를 들어 테트라하이드로푸란, 에틸렌 글리콜 디메틸 에테르 및 1,4-디옥산, 산 아미드, 예를 들어 N,N-디메틸포름아미드 및 N-메틸피롤리디논 등으로부터 적당히 선택될 수 있으며, 이것들은 혼합되어 사용될 수도 있다.

[0063]

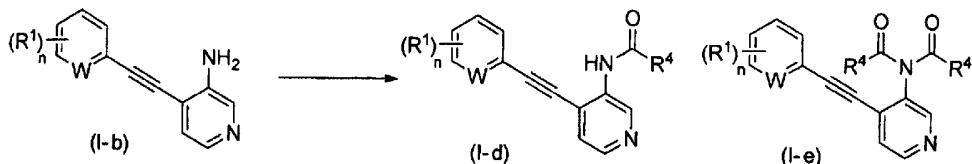
반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 20°C에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 48시간에 이를 수 있다.

[0064]

제조 방법[4]

[0065]

R^2 가 $NHCOR^4$ 일 때의 일반식 (I)의 화합물인 하기 일반식 (I-d)의 화합물과, R^2 가 $N(COR^4)_2$ 일 때의 일반식 (I)의 화합물인 하기 일반식 (I-e)의 화합물은, 하기 일반식 (I-b)의 화합물과 카복실산 할로겐화물 R^4COX 또는 카복실산 무수물 $(R^4CO)_2O$ 의 반응에 의해 제조될 수 있다.



[0066]

(제조 방법[4]에 있어서, R^4 는 (C_1-C_6) 알킬기를 나타냄. 기호 n, R^1 , W 및 X는 상기 정의된 바와 같음)

[0068]

반응은 필요에 따라서 염기의 존재 하에 수행될 수 있다. 염기의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 알칼리 금속 수소화물, 예를 들어 수소화나트륨; 알칼리 금속 탄산염, 예를 들어 탄산칼륨; 알칼리 금속 수산화물, 예를 들어 수산화나트륨; 그리고 아민, 예를 들어 트리에틸아민.

[0069]

반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매는 반응에 비활성인 임의의 용매일 수 있다. 예를 들어 1개 이상의 용매가 에테르, 예를 들어 디에틸에테르, 테트라하이드로푸란, 에틸렌 글리콜 디메틸 에테르 및 1,4-디옥산, 산 아미드, 예를 들어 N,N-디메틸포름아미드 및 N-메틸피롤리디논, 할로겐화된 지방족 탄화수소, 예를 들어 디클로로메탄 및 클로로포름 등으로부터 적당히 선택될 수 있으며, 이것들은 혼합되어 사용될 수도 있다.

[0070]

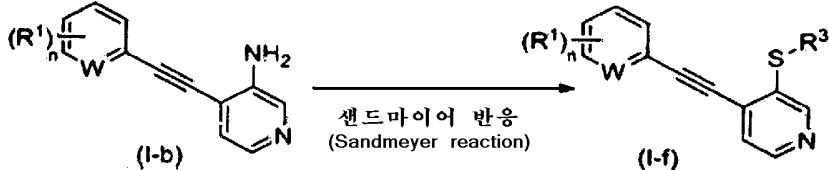
반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 -20°C에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 48시간에 이를 수 있다.

[0071]

제조 방법[5]

[0072]

R^2 가 SR^3 일 때의 일반식 (I)의 화합물인 하기 일반식 (I-f)의 화합물은, 하기 일반식 (I-b)의 화합물을 무기 아질산염 또는 아질산염 에스테르와 반응시켜, 하기 일반식 (I-b)의 화합물을 디아조늄 화합물로 전환시키고 나서, 이 디아조늄 화합물과 R^3SH 또는 $(R^3S)_2$ 를 반응시킴으로써 제조될 수 있다.



[0073]

(제조 방법[5]에 있어서, n, R^1 , R^3 및 W는 상기 정의된 바와 같음)

무기 아질산염의 예들로서는 아질산나트륨과 아질산칼륨을 포함할 수 있다.

아질산염 에스테르의 예들로서는 아질산 tert-부틸 및 아질산이소아밀을 포함할 수 있다.

반응은 필요에 따라서 구리 촉매의 존재 하에 수행될 수 있다. 구리 촉매의 예들로서는 산화구리(I) 및 황산구

리(II) 5 수화물을 포함한다.

[0078] 반응은 필요에 따라서 산의 존재 하에 수행될 수 있다. 산의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 무기산, 예를 들어 염화수소산 및 황산; 그리고 유기산, 예를 들어 아세트산 및 메탄설판산.

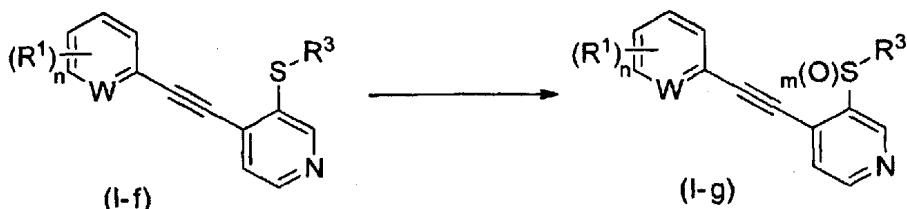
[0079] 반응은 필요에 따라서 염기의 존재 하에 수행될 수 있다. 염기의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 알칼리 금속 수소화물, 예를 들어 수소화나트륨; 알칼리 금속 탄산염, 예를 들어 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산세슘; 그리고 알칼리 금속 수산화물, 예를 들어 수산화리튬, 수산화나트륨 및 수산화칼륨.

[0080] 반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매는, 예를 들어 다음과 같은 것들로부터 적당히 선택된 용매 1개 이상일 수 있다: 할로겐화 지방족 탄화수소, 예를 들어 디클로로메탄 및 클로로포름; 방향족 탄화수소, 예를 들어 톨루엔 및 자일렌; 비 양자성 극성 용매, 예를 들어 아세토니트릴, N,N-디메틸포름아미드 및 셀록시화디메틸; 그리고 물 등.

[0081] 반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 -20 ~ 200°C 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 24시간에 이를 수 있다.

제조 방법[6]

하기 일반식 (I-g)의 화합물은, 하기 일반식 (I-f)의 화합물을 산화제와 반응시킴으로써 제조될 수 있다.



[0084]

(상기 제조 방법[6]에 있어서, m은 1 또는 2이고, n, R¹, R³ 및 W는 상기 정의된 바와 같음)

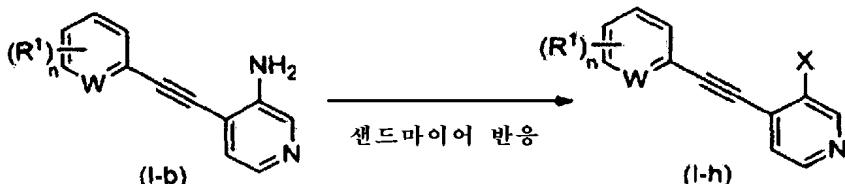
[0086] 산화제의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 카복실산의 과산화물, 예를 들어 3-클로로파벤조산; 그리고 과산화수소 용액.

[0087] 용매의 예들로서는 할로겐화 지방족 탄화수소, 예를 들어 디클로로메탄 및 클로로포름을 포함할 수 있다.

[0088] 반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 -20°C에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 24시간에 이를 수 있다.

제조 방법[7]

[0090] R²가 X일 때의 일반식 (I)의 화합물인 하기 일반식 (I-h)의 화합물은, 하기 일반식 (I-b)의 화합물을 무기 아질산염 또는 아질산염 에스테르와의 반응을 통해 디아조늄으로 전환한 다음, 이 디아조늄염과 할로겐화제를 반응시킴으로써 제조될 수 있다.



[0091]

(상기 제조 방법[7]에 있어서, n, R¹, W 및 X는 상기 정의된 바와 같음)

[0093] 무기 아질산염의 예들 및 아질산염 에스테르의 예들로서는 상기 제조 방법[5]에 사용된 것과 동일한 염들 및 에스테르들을 포함할 수 있다.

[0094] 할로겐화제의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 할로젠, 예를 들어 염소, 브롬 및 요오드; 할로

겐화수소산, 예를 들어 염화수소산, 브롬화수소산 및 요오드화수소산; 구리(I) 할로겐화물, 예를 들어 염화구리(I), 브롬화구리(I) 및 요오드화제1구리; 구리(II) 할로겐화물, 예를 들어 염화구리(II) 및 브롬화구리(II); 그리고 4 플루오르화 붕산.

[0095] 반응은 필요에 따라서 구리 촉매의 존재 하에 수행될 수 있다. 구리 촉매의 예로서는 상기 나열된 바와 같은 구리(I) 할로겐화물 및 구리(II) 할로겐화물, 그리고 황산 구리(II) 5 수화물을 포함할 수 있다.

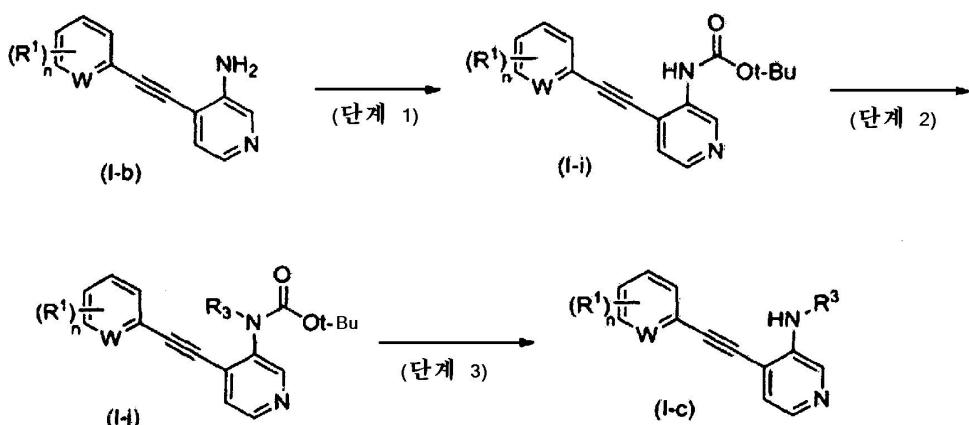
[0096] 반응은 필요에 따라서 산의 존재 하에 수행될 수 있다. 산의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 무기산, 예를 들어 상기 나열된 바와 같은 할로겐화수소산 및 황산; 그리고 유기산, 예를 들어 아세트산 및 메탄설폰산.

[0097] 반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매의 예들로서는 상기 제조 방법[5]에 사용된 용매들과 동일한 용매들을 포함할 수 있으며, 이와 같은 용매들 중 1개 이상은 적당히 선택되어, 함께 혼합 사용될 수도 있다.

[0098] 반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 -20 ~ 200°C 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수분에서 24시간에 이를 수 있다.

제조 방법[8]

[0100] R^2 가 NHR^3 일 때의 일반식 (I)의 화합물인 하기 일반식 (I-c)의 화합물은 하기 반응식에 보인 방법에 의해 제조될 수 있다.



[0101]

[0102] (상기 제조 방법[8]에 있어서, t-Bu는 3차 부틸을 나타냄. 기호 n, R^1 , R^3 및 W는 상기 정의된 바와 같음)

[0103] (단계 1)

[0104] 상기 일반식 (I-i)의 화합물은, 염기의 존재 하에 상기 일반식 (I-b)의 화합물을 중탄산 디-tert-부틸과 반응시킴으로써 제조될 수 있다.

[0105] 염기의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 알칼리 금속 수소화물, 예를 들어 수소화나트륨; 알칼리 금속 탄산염, 예를 들어 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산세슘; 그리고 알칼리 금속 수산화물, 예를 들어 수산화리튬, 수산화나트륨 및 수산화칼륨; 그리고 알칼리 금속 아미드, 예를 들어 리튬 비스(트리메틸실릴)아미드, 나트륨 비스(트리메틸실릴)아미드 및 칼륨 비스(트리메틸실릴)아미드.

[0106] 반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매는 반응에 비활성인 임의의 용매일 수 있다. 이의 예들로서는 제조 방법[3]에 사용된 용매들과 동일한 용매들을 포함할 수 있으며, 이것들 중 1개 이상은 적당히 선택되어, 함께 혼합 사용될 수 있다.

[0107] 반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 -20°C에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수분에서 48시간에 이를 수 있다.

[0108] (단계 2)

[0109] 상기 일반식 (I-j)의 화합물은, 염기의 존재 하에 상기 일반식 (I-i)의 화합물과 R^3X (X는 상기 정의된 바와 같음)를 반응시킴으로써 제조될 수 있다.

[0110] 염기의 예들로서는 제조 방법[3]에 사용된 염기들과 동일한 염기들을 포함할 수 있다.

[0111] 반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매의 예들로서는 상기 단계 1에서 사용된 것과 동일한 용매들을 포함할 수 있고, 이것들 중 1개 이상은 적당히 선택되어, 함께 혼합 사용될 수 있다.

[0112] 반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 -20°C 에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 48시간에 이를 수 있다.

[0113] (단계 3)

[0114] 상기 일반식 (I-c)의 화합물은, 상기 일반식 (I-j)의 화합물을 산과 반응시킴으로써 제조될 수 있다.

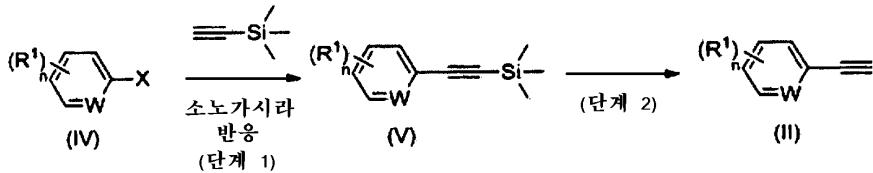
[0115] 산의 예들로서는 무기산, 예를 들어 염화수소산 및 황산과, 유기산, 예를 들어 아세트산을 포함할 수 있다.

[0116] 반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매는 반응에 비활성인 임의의 용매일 수 있다. 이것의 예들로서는 제조 방법[2]에 사용된 용매들과 동일한 용매들을 포함할 수 있으며, 이것들 중 1개 이상은 적당히 선택되어, 함께 혼합 사용될 수 있다.

[0117] 반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 0°C 에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 24시간에 이를 수 있다.

중간체 제조 방법[1]

[0118] 하기 일반식 (II)의 화합물은, 이하 반응식에 보인 방법에 의해 제조될 수 있다.



[0119]

[0120] (중간체 제조 방법[1]에 있어서, n, X, W 및 R^1 은 상기 정의된 바와 같음)

[0121] (단계 1)

[0122] 상기 일반식 (V)의 화합물은, (제조 방법[1]에 따라서) 트리메틸실릴아세틸렌과 상기 일반식 (IV)의 화합물의 소노가시라 반응을 통하여 제조될 수 있다.

[0123] (단계 2)

[0124] 상기 일반식 (II)의 화합물은, 염기 또는 플루오르화테트라부틸암모늄(TBAF)과 상기 일반식 (V)의 화합물의 반응을 통하여 제조될 수 있다.

[0125] 염기의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 알칼리 금속 탄산염, 예를 들어 탄산칼륨; 그리고 알칼리 금속 수산화물, 예를 들어 수산화나트륨.

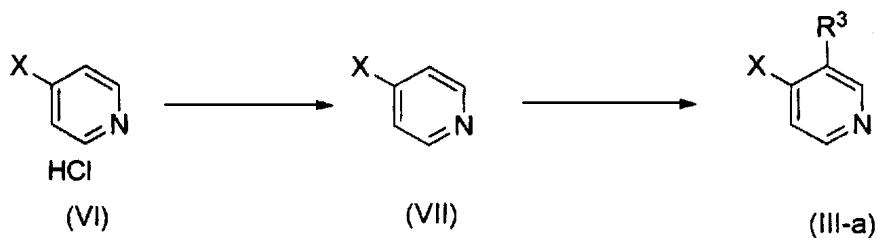
[0126] 반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매는 반응에 비활성인 임의의 용매일 수 있다. 예를 들어 1개 이상의 용매는 비 양자성 극성 용매, 예를 들어 아세톤 및 아세토니트릴, 할로겐화 지방족 탄화수소, 예를 들어 디클로로메탄 및 1,2-디클로로에탄, 에스테르, 예를 들어 아세트산에틸, 에테르, 예를 들어 테트라하이드로푸란 및 디옥산, 양자성 용매, 예를 들어 메탄올 등으로부터 선택될 수 있으며, 이것들은 함께 혼합되어 사용될 수도 있다.

[0127] 반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 $-90 \sim 50^{\circ}\text{C}$ 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 24시간에 이를 수 있다.

중간체 제조 방법[2]

[0128] 하기 일반식 (III-a)의 화합물은, 하기 일반식 (VI)의 화합물을 염기와 반응시켜, 하기 일반식 (VII)로 표시되

는 4-할로페리딘을 제조한 다음, 4-할로페리딘과 알킬리튬 또는 리튬 디알킬아미드와 반응시키고 나서, 이로부터 생성된 중간체와 R^3X 를 반응시킴으로써 제조될 수 있다.



[0131]

(상기 중간체 제조 방법[2]에 있어서, X 및 R^3 은 상기 정의된 바와 같음)

염기의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 알칼리 금속 탄산염, 예를 들어 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산세슘; 그리고 알칼리 금속 수산화물, 예를 들어 수산화리튬, 수산화나트륨 및 수산화칼륨.

알킬리튬의 예들로서는 n-부틸리튬, sec-부틸리튬 및 tert-부틸리튬을 포함할 수 있다.

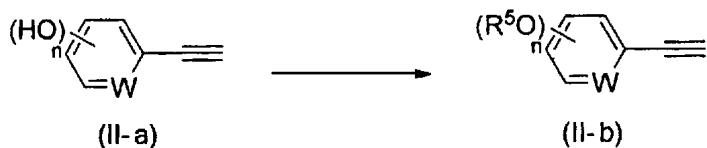
리튬 디알킬아미드의 예들로서는 리튬 디이소프로필아미드를 포함할 수 있다.

반응은, 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매는 반응에 비활성인 임의의 용매일 수 있다. 예를 들어 1개 이상의 용매는, 에테르, 예를 들어 디에틸에테르, 테트라하이드로푸란, 에틸렌 글리콜 디메틸 에테르 및 1,4-디옥산, 방향족 탄화수소, 예를 들어 톨루엔 및 자일렌, 지방족 탄화수소, 예를 들어 헥산, 헵탄, 옥탄 및 사이클로헥산 등으로부터 적당히 선택될 수 있으며, 이것들은 함께 혼합되어 사용될 수도 있다.

반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 $-90 \sim -50^\circ\text{C}$ 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수분에서 24시간에 이를 수 있다.

중간체 제조 방법[3]

R^1 이 OR^5 일 때의 일반식 (II)의 화합물인 하기 일반식 (II-b)의 화합물은, 염기의 존재 하에 하기 일반식 (II-a)의 화합물과 R^5X 의 반응을 통해 제조될 수 있다.



[0140]

(중간체 제조 방법[3]에 있어서, R^5 는 (C_1-C_6)알킬기, (C_2-C_6)알케닐기, (C_2-C_6)알키닐기, (C_1-C_6)할로알킬기 또는 (C_3-C_6)사이클로알킬기를 나타냄. 기호 n, W 및 X는 상기 정의된 바와 같음)

염기의 예들로서는 제조 방법[3]에서 사용된 것들과 동일한 염기들을 포함할 수 있다.

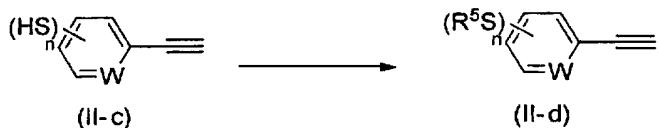
반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매는 반응에 비활성인 임의의 용매일 수 있다. 이에 관한 예들로서는 제조 방법[3]에 사용된 용매들과 동일한 용매들을 포함할 수 있으며, 이러한 것들 중 1개 이상은 적당히 선택되어, 함께 혼합 사용될 수 있다.

반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 20°C 에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수분에서 48시간에 이를 수 있다.

중간체 제조 방법[4]

R^1 이 SR^5 일 때의 일반식 (II)의 화합물인 하기 일반식 (II-d)의 화합물은, 염기의 존재 하에 하기 일반식 (II-

c)의 화합물과 R^5X 의 반응을 통해 제조될 수 있다.



[0147]

(중간체 제조 방법[4]에 있어서, n , R^5 , W 및 X 는 상기 정의된 바와 같음)

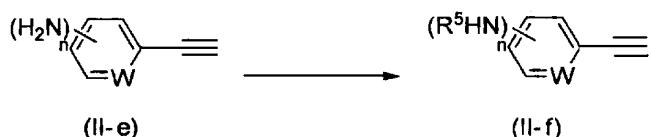
염기의 예들로서는 상기 제조 방법[3]에서 사용된 것들과 동일한 염기들을 포함할 수 있다.

반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매는 반응에 비활성인 임의의 용매일 수 있다. 이에 관한 예들로서는 제조 방법[3]에 사용된 용매들과 동일한 용매들을 포함할 수 있으며, 이러한 것들 중 1개 이상은 적당히 선택되어, 함께 혼합 사용될 수 있다.

반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 20°C에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 48시간에 이를 수 있다.

중간체 제조 방법[5]

R^1 이 NHR^5 일 때의 일반식 (II)의 화합물인 하기 일반식 (II-f)의 화합물은, 염기의 존재 하에 하기 일반식 (II-e)의 화합물과 R^5X 의 반응을 통해 제조될 수 있다.



(중간체 제조 방법[5]에 있어서, n , R^5 , W 및 X 는 상기 정의된 바와 같음)

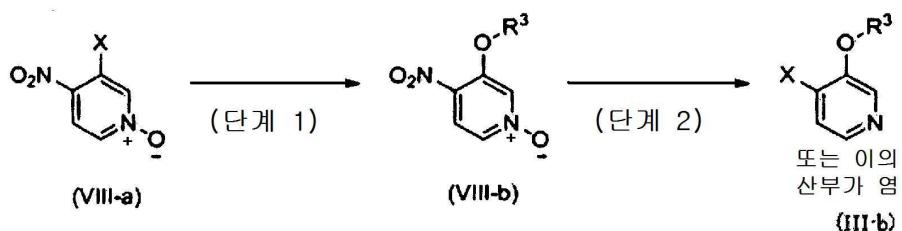
영기의 예들로서는 상기 제조 방법[3]에서 사용된 것들과 동일한 영기들을 포함할 수 있다.

반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매는 반응에 비활성인 임의의 용매일 수 있다. 이에 관한 예들로서는 제조 방법[3]에 사용된 용매들과 동일한 용매들을 포함할 수 있으며, 이러한 것들 중 1개 이상은 적당히 선택되어, 함께 혼합 사용될 수 있다.

반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 20°C에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 48시간에 이를 수 있다.

중간체 제조 방법[6]

R^2 가 OR³일 때의 일반식 (III)의 화합물인 하기 일반식 (III-b)의 화합물은, 하기 반응식에 보인 방법을 통하여 하기 일반식 (VIII-a)의 화합물[예를 들어 WO 2005/101989호에 개시된 방법에 따라서 제조될 수 있음]로부터 제조될 수 있다. 하기 일반식 (III-b)의 화합물은, 이 화합물을 산으로 처리하여 이 화합물의 산부가 염으로서 획득될 수 있다.



[0161]

(중간체 제조 방법[6]에 있어서, X 및 R^3 은 상기 정의된 바와 같음)

(답례 1)

상기 일반식 (VIII-b)의 화합물은, 상기 일반식 (VIII-a)의 화합물을 R^3OM (식 중, M은 Na, K 또는 Cs임)과 반응 시키거나, 또는 염기의 존재 하에 상기 일반식 (VIII-a)의 화합물을 R^3OH 와 반응시킴으로써 제조될 수 있다. 상기 염기의 예들로서는 제조 방법[3]에서 사용된 염기들과 동일한 염기들을 포함할 수 있다.

[0165]

반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매로서는 알코올, 예를 들어 메탄올, 에탄올 및 2-프로판올, 에테르, 예를 들어 디에틸 에테르, 테트라하이드로푸란, 에틸렌 글리콜 디메틸 에테르, 그리고 1,4-디옥산, 산 아미드, 예를 들어 N,N-디메틸포름아미드 및 N-메틸피롤리디논 등으로부터 적당히 선택된 용매 1개 이상이 사용될 수 있으며, 이것들은 함께 혼합되어 사용될 수도 있다.

[0166]

반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 -20°C 에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 48시간에 이를 수 있다.

[0167]

(단계 2)

상기 일반식 (III-b)의 화합물은, 상기 일반식 (VIII-b)를 대상으로 3 할로겐화 인을 작용시켜 제조될 수 있다. 원하던 화합물은 또한 앞서 제조된 상기 일반식 (III-b)의 화합물을 산으로 처리함으로써 염의 형태로도 제조될 수 있다.

[0169]

3 할로겐화 인의 예들로서는 3 염화 인과 3 브롬화 인을 포함할 수 있다.

[0170]

반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매로서는, 에스테르, 예를 들어 아세트산에틸, 할로겐화 지방족 탄화수소, 예를 들어 디클로로메탄 및 클로로포름 등으로부터 적당히 선택된 용매 1개 이상이 사용될 수 있으며, 이것들은 함께 혼합되어 사용될 수도 있다.

[0171]

반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 -5°C 에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 48시간에 이를 수 있다.

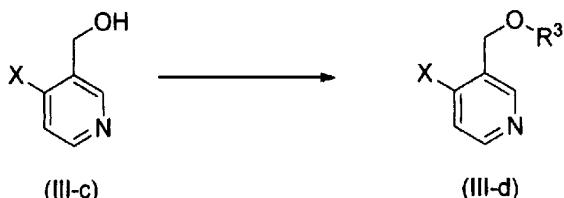
[0172]

일반식 (III-b)의 화합물의 산부가 염의 예들로서는 염화수소산염, 황산염 및 아세트산염을 포함할 수 있고, 처 리용 산의 예들로서는 염화수소산, 황산 및 아세트산을 포함할 수 있다.

중간체 제조 방법[7]

[0174]

R^2 가 CH_2OR^3 일 때의 일반식 (I)의 화합물인 하기 일반식 (III-d)의 화합물은, 염기의 존재 하에 예를 들어 문헌 [Org. Lett., 2008, 10, 2701]에 기술된 방법에 따라서 제조될 수 있는 하기 일반식 (III-c)의 화합물을 R^3X 와 반응시킴으로써 제조될 수 있다.



[0175]

[0176] (중간체 제조 방법[7]에 있어서, X 및 R³은 상기 정의된 바와 같음)

[0177] 열기의 예들로서는 제조 방법[3]에서 사용된 것들과 동일한 열기들을 포함할 수 있다.

[0178] 반응은 필요에 따라서 용매의 존재 하에 수행될 수 있다. 용매는 반응에 비활성인 임의의 용매일 수 있다. 이것의 예들로서는 제조 방법[3]에서 사용된 것들과 동일한 용매들을 포함할 수 있으며, 이러한 것들 중 1개 이상은 적당히 선택되어 함께 혼합 사용될 수 있다.

[0179] 반응 온도에 관하여 말하자면, 반응은 보통 약 -20°C 에서 반응에 사용된 용매의 비점에 이르는 범위의 온도에서 수행될 수 있다. 반응 시간은 보통 수 분에서 48시간에 이르 수 있다.

[0180] 본 발명의 화합물을 포함하는 유해생물 방제제에 관한 바람직한 구체예들이 이하에 기술되어 있다. 본 발명의 화합물을 포함하는 유해생물 방제제는, 예를 들어 농업 및 원예 현장에서 문제를 일으키는 해충, 진드기, 선충 또는 토양 해충을 방제하기 위한 제제, 다시 말해서 농원예용 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제로서 유용하다. 뿐만 아니라, 본 발명의 유해생물 방제제는 동물의 기생충을 방제하기 위한 제제, 즉 살동물기생생물 제로서 유용하다.

[0181] 본 발명의 화합물은 농원예용 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제로서 유용하다. 본 발명의 화합물은 해충, 예를 들어 진딧물, 예를 들어 복숭아 혹 진딧물 및 목화 진딧물, 농업 해충, 예를 들어 배추 좀 나방, 야도충, 슷 무 밤나방, 코들링 나방, 목화 다래 별레, 회색 담배 나방, 매미 나방, 혹 명 나방, 차 애모 무늬 잎 말이 나방, 콜로라도 감자 잎 별레, 오이 잎 별레, 목화 바구미, 멸구, 매미충, 개각충, 노린재, 가루 이, 삽주 별레, 메뚜기, 꽃파리류, 소똥구리류, 검 거세미 나방, 순무 나방(turnip moth) 및 개미, 복족류, 예를 들어 민달팽이 및 달팽이, 위생 해충, 예를 들어 집 참 진드기, 바퀴별레, 집 파리 및 보통 집 모기, 저곡 해충, 예를 들어 곡식 나방, 팥 바구미, 붉은 밀가루 갑충 및 기저릿과, 및 의류 또는 가옥 해충, 예를 들어 옷 좀 나방, 블랙 카펫 비틀(black carpet beetle) 및 흰개미; 진드기, 예를 들어 식물 기생성 진드기, 예를 들어 점박이 응애, 카민 잎 응애, 차 응애(kanzawa spider mite), 감귤 진드기, 사과 나뭇잎 진드기, 차 먼지 응애, 꿀 독 응애 및 뿌리 응애, 그리고 집 먼지 진드기, 예를 들어 타이로파구스 푸트레센티아에(*Tyrophagus putrescentiae*), 더모토파고이데스 파리나에(*Dermotophagoides farinae*) 및 켈라카롭시스 무레이(*Chelacaropsis moorei*); 선충, 예를 들어 식물 기생성 선충, 예를 들어 뿌리 혹 선충, 시스트 선충, 뿌리 씩이 선충, 벼 이삭 선충, 딸기 눈선충 및 소나무 선충; 그리고 토양 해충, 예를 들어 등각류, 예를 들어 쥐 머느리 및 공 별레를 방제하는데 특히 유효하다. 본 발명의 화합물을 포함하는 농원예용 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제는 식물 기생성 진드기, 농업 해충 또는 식물 기생성 선충 등을 방제하는데 특히 유효하고, 무엇보다도 식물 기생성 진드기 및 농업 해충을 방제하는데 더욱더 유효하다. 결과적으로, 본 발명에 의한 제제는 살충제 또는 살비제로서 매우 유용하다. 뿐만 아니라, 본 발명의 화합물을 포함하는 농원예용 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제는 또한 약제, 예를 들어 유기인계 살해충제, 카밤산염 살해충제, 합성 퍼페스린 살해충제 또는 네오니코티노이드 살해충제 등에 대해 내성인, 다수의 해충을 방제하는데에도 유효하다. 또한, 본 발명의 화합물은 침투성과 이행성의 관점에서 우수하므로, 토양 유해 곤충, 진드기, 선충, 복각류 또는 등각류 등과, 줄기와 잎에 서식하는 해충은, 본 발명의 화합물을 포함하는 농원예용 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제로 토양을 처리함으로써 방제될 수 있다.

[0182] 본 발명의 화합물을 포함하는 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제에 관한 기타 바람직한 구체예는, 상기에 보인 식물 기생성 진드기, 농업 해충, 식물 기생성 선충, 복족류 또는 토양 해충 등을 포괄적으로 방제하기 위한, 농원예용 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제를 포함할 수 있다.

[0183] 보통 본 발명의 화학물을 포함하는 농워예용 살충제, 살비제, 살선품제 또는 살토약해충제는, 본 발명의 화학물

과 다수의 농업용 첨가제들을 혼합하여, 상기 화합물을 다양한 형태, 예를 들어 분체, 입체, 과립 수화체, 수화제, 수성 혼탁제, 유성 혼탁제, 과립 수용제, 수용제, 유제, 액제, 페이스트제, 에어로졸제 또는 미량 산포제 등으로 제제화함으로써 제조된 후 사용된다. 본 발명에 의한 제제는, 해당 제제가 본 발명의 목적에 적합한 한, 당 업계에 통상적으로 사용되고 있는 임의의 제제로 제제화될 수 있다. 이러한 제제에 사용되는 첨가제의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 고형 담체, 예를 들어 규조토, 소석회, 탄산칼슘, 활석, 화이트 카본(white carbon), 카울린, 벤토나이트, 카울리나이트, 견운모, 점토, 탄산나트륨, 중탄산나트륨, 황산나트륨, 제올라이트 및 전분; 용매, 예를 들어 물, 툴루엔, 자일렌, 흡착성 나프타, 디옥산, 아세톤, 이소포론, 메틸 이소부틸 캐톤, 클로로벤젠, 사이클로헥산, 설포시화디메틸, N,N-디메틸포름아미드, N,N-디메틸아세타미드, N-메틸-2-피롤리돈 및 알코올; 음 이온계 계면활성제, 예를 들어 지방산염, 벤조산염, 알킬설포숙신산염, 디알킬설포숙신산염, 폴리카복실산염, 알킬황산 에스테르의 염, 알킬황산염, 알킬아릴황산염, 알킬 디글리콜 에테르 황산염, 알코올 황산 에스테르의 염, 알킬설폰산염, 알킬아릴설폰산염, 아릴설폰산염, 리그닌설폰산염, (알킬디페닐 에테르)디설폰산염, 폴리스티렌설폰산염, 알킬인산 에스테르의 염, 알킬아릴인산염, 스티릴아릴인산염, 폴리옥시에틸렌 알킬 에테르 황산 에스테르의 염, 폴리옥시에틸렌 알킬아릴 에테르 황산염, 폴리옥시에틸렌 알킬아릴 에테르 황산 에스테르의 염, 폴리옥시에틸렌 알킬 인산염, 폴리옥시에틸렌 알킬아릴 인산 에스테르의 염, 그리고 포름알데히드와 축합된 나프탈렌설폰산의 염; 비 이온계 계면활성제, 예를 들어 솔비탄 지방산 에스테르, 글리세린 지방산 에스테르, 지방산 폴리글리세리드, 지방산 알코올 폴리글리콜 에테르, 아세틸렌 글리콜, 아세틸렌 알코올, 옥시알킬렌 블록 중합체, 폴리옥시에틸렌 알킬 에테르, 폴리옥시에틸렌 알킬아릴 에테르, 폴리옥시에틸렌 스티릴아릴 에테르, 폴리(옥시에틸렌 글리콜)알킬 에테르, 폴리에틸렌 글리콜, 폴리옥시에틸렌 지방산 에스테르, 폴리옥시에틸렌 솔비탄 지방산 에스테르, 폴리옥시에틸렌 글리세린 지방산 에스테르, 폴리옥시에틸렌 수소화 피마자유, 그리고 폴리옥시프로필렌 지방산 에스테르; 그리고 식물유 및 광물유, 예를 들어 올리브유, 케이폭유, 피마자유, 팜유, 카멜라유, 코코넛유, 참기름, 옥수수유, 미강유, 낙화생유, 면실유, 대두유, 채종유, 아마인유, 동유 및 유동 파라핀. 이와 같은 추가의 성분들 중 1개 이상은, 그것의 사용이 본 발명의 목적들을 벗어나지 않는 한, 적당히 선택되어 사용될 수 있다. 또한 상기에 보인 첨가제들 이외에 당 업계에 알려져 있는 첨가제들로부터 적당히 선택된 첨가제들이 사용될 수도 있다. 예를 들어 보통 사용되는 다양한 첨가제들, 예를 들어 충전제, 중점제, 침강 방지제, 동결 방지제, 분산 안정화제, 약해 경감제 및 항곰팡이제가 사용될 수 있다. 본 발명의 화합물 대 이와 같은 다수의 첨가제들의 혼합비(중량비)는 0.001:99.999 ~ 95:5, 바람직하게는 0.005:99.995 ~ 90:10일 수 있다. 이와 같은 제제들이 실제 사용될 때, 이 제제들은 그대로 사용될 수 있거나, 또는 희석제, 예를 들어 물로 소정의 농도로 희석된 후 사용될 수 있으며, 필요에 따라서 다양한 전작제(계면활성제, 식물유 또는 광물유 등)이 이에 첨가된다.

[0184] 본 발명의 방법들은 기상 조건, 제제의 유형, 시용 시간, 시용 위치, 질병과 해충의 종류 또는 발생 상황 등에 의존적이므로, 본 발명의 화합물을 포함하는 농원예용 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제를 사용하는 방법은 절대적으로 특정될 수 없다. 그러나, 유효 성분 농도가 일반적으로 0.05 ~ 800,000ppm, 바람직하게는 0.5 ~ 500,000ppm이 되도록 제조된 제제가 사용될 수 있으며, 단위 면적당 사용될 제제의 양은, 본 발명의 화합물의 관점에서 1 헥타르당 0.05 ~ 50,000 g, 바람직하게는 1 ~ 30,000 g일 수 있다. 이러한 시용 방법에 의해 해충, 진드기, 선충 또는 토양 해충을 방제하는 방법, 특히 식물 기생성 진드기, 농업 해충 또는 식물 기생성 선충을 방제하는 방법은 본 발명에 포함된다.

[0185] 본 발명의 화합물을 포함하는 농원예용 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제와 같은 다양한 제제들 또는 이의 희석물들은 보통 일반적으로 실시되는 시용 방법에 의해 사용될 수 있다. 다시 말해서, 제제들 또는 희석물들은 항공 살포법(예를 들어 분사, 미스팅(misting), 분무, 산립, 수면 시용 등), 토양에의 시용(흔입 또는 관주 등), 표면 시용(도포, 분의, 퍼복 등), 독소 침지 먹이의 사용 등에 의해 사용될 수 있다. 뿐만 아니라, 유효 성분이, 해충, 특히 유해 곤충이 배설물에서 발생하는 것과 생육하는 것을 억제하기 위해 사료와의 혼합물로서 가축에 공급되는 방법도 사용될 수 있다. 또한 본 발명의 화합물은 소위 초고농도 소량 산포법(ultra low volume application method)에 의해 사용될 수 있다. 이와 같은 방법에서, 유효 성분은 농도 100%로 포함될 수 있다.

[0186] 본 발명의 화합물을 포함하는 농원예용 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제는 다른 농약, 비료 또는 약해 경감제 등과의 혼합물로서 사용될 수 있거나, 또는 이것들과 병용될 수 있고, 이와 같은 방식으로 사용될 때 본 발명에 의한 제제는 한층 우수한 효과 또는 작용성을 보이는 경우가 있다. 상기 다른 농약의 예로서는 제초제, 살충제, 살비제, 살선충제, 살토양해충제, 살균제, 항바이러스제, 유인제, 항생제, 식물 호르몬 및 식물 성장 조정제를 포함할 수 있다. 특히 본 발명의 화합물이, 기타 농약에 대한 1개 이상의 유효 성분 화합물과의 혼합물로서 사용되거나, 이것들과 병용되는 살충용 조성물, 살비용 조성물, 살선충용 조성물 또는 살토양해충용

조성물은, 시용 범위, 약제 처리 시간 또는 방제 활성 등을 바람직한 방향으로 개선하는 것이 가능하다. 부수적으로, 본 발명의 화합물과 기타 농약들에 대한 유효 성분 화합물(들)은 별도로 제제화된 후 시용 직전에 혼합될 수 있거나, 아니면 합하여져 제제화되어 사용될 수 있다. 이와 같은 살충용 조성물, 살비용 조성물, 살선충용 조성물 또는 살토양해충용 조성물은 본 발명에 포함된다.

[0187] 여느 농약들 중에서도 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제에 대한 유효 성분 화합물들(일반명; 일부 신청중인 것 포함; 또는 일본 식물 방역 협회 시험 코드)의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함한다:

[0188] 유기 인산 에스테르계 화합물, 예를 들어 프로페노포스, 디클로르보스, 페나미포스, 페니트로티온, EPN, 디아지논, 클로르피리포스, 클로르피리포스-메틸, 아세페이트, 프로티오포스, 포스티아제이트, 카두사포스, 디슬루포톤, 이속사티온, 이소펜포스, 에티온, 에트림포스, 퀴날포스, 디메틸빈포스, 디메토에이트, 셀프로포스, 티오메톤, 바미도티온, 피라클로포스, 피리다펜티온, 피리미포스-메틸, 프로파포스, 포살론, 포르모티온, 말라티온, 테트라클로르빈포스, 클로르펜빈포스, 시아노포스, 트리클로르폰, 메티다티온, 웨토에이트, ESP, 아진포스-메틸, 웬티온, 헵테노포스, 메톡시클로르, 파라티온, 포스포카브, 테메톤-S-메틸, 모노크로토포스, 메타미도포스, 이미시아포스, 파라티온-메틸, 터부포스, 포스파미돈, 포스맷, 포레이트, 폭심 및 트리아조포스;

[0189] 카bam염계 화합물, 예를 들어 카바릴, 프로폭수르, 알디카브, 카보푸란, 티오디카브, 메토밀, 옥사밀, 에티오펜카브, 피리미카브, 페노부카브, 카보설판, 벤푸라카브, 벤디오카브, 푸라티오카브, 이소프로카브, 메톨카브, 자일릴카브, XMC 및 폐노티오카브;

[0190] 네레이스톡신 유도체, 예를 들어 카르탑, 티오시클람, 벤설탑, 티오설탑-나트륨, 티오설탑-2 나트륨, 모노설탑, 비설탑 및 티오시클람 수소 옥살산염;

[0191] 유기 염소계 화합물, 예를 들어 디코풀, 테트라디폰, 엔도설판, 디에노클로르 및 디엘드린;

[0192] 유기 금속계 화합물, 예를 들어 웨부타틴 산화물 및 사이헥사타틴;

[0193] 페레트로이드계 화합물, 예를 들어 웜발레레이트, 퍼메트린, 사이퍼메트린, 델타메트린, 사이할로트린, 테플루트린, 에토펜프록스, 플루펜프록스, 사이플루트린, 웜프로파트린, 플루사이트리네이트, 플루발리네이트, 사이클로프로트린, 람다-사이할로트린, 페레트린스, 에스웬발레레이트, 테트라메트린, 레스메트린, 프로트리瘟부트, 비瘟트린, 제타-사이퍼메트린, 아크리나트린, 알파-사이퍼메트린, 알레트린, 감마-사이할로트린, 세타-사이퍼메트린, 토우-플루발리네이트, 트랄로메트린, 프로플루트린, 베타-사이퍼메트린, 베타-사이플루트린, 메토플루트린, 폐노트린, 플루메트린 및 데카메트린;

[0194] 벤조일우레아계 화합물, 예를 들어 디플루벤주론, 클로르플루아주론, 테플루벤주론, 플루페녹수론, 트리플루무론, 헥사플루무론, 루페누론, 노발루론, 노비플루무론, 비스트리플루론 및 플루아주론;

[0195] 유충 호르몬 유사 화합물, 예를 들어 메토프렌, 피리프록시펜, 폐녹시카브 및 디오페놀란;

[0196] 피리다지논계 화합물, 예를 들어 피리다벤;

[0197] 피라졸계 화합물, 예를 들어 웜피록시메이트, 피프로닐, 테부谶파라드, 에티프롤, 톨谶파라드, 아세토프롤, 피라플루프롤 및 피리프롤;

[0198] 네오니코티노이드계 화합물, 예를 들어 이미다클로프리드, 니텐피람, 아세타미프리드, 티아클로프리드, 티아메톡삼, 클로티아니딘, 니디노테푸란, 디노테푸란 및 니티아진;

[0199] 히드라진계 화합물, 예를 들어 테부페노지드, 메톡시페노지드, 크로마페노지드 및 할로페노지드;

[0200] 피리딘계 화합물, 예를 들어 피리달릴 및 플로니카미드;

[0201] 환형 캐토-에놀계 화합물, 예를 들어 스피로디클로펜, 스피로메시펜 및 스피로테트라_xt;

[0202] 스트로빌루린계 화합물, 예를 들어 플루아크리피람;

[0203] 피리디나미드계 화합물, 예를 들어 플루페네립;

[0204] 디니트로계 화합물;

[0205] 유기 황계 화합물;

[0206] 우레아계 화합물;

- [0207] 트리아진계 화합물;
- [0208] 히드라존계 화합물; 및
- [0209] 기타 화합물, 예를 들어 플로메토퀸, 부프로페진, 헥시티아족스, 아미트라즈, 클로르디메포름, 실라플루오펜, 트리아자메이트, 피메트로진, 피리미디펜, 클로르페나피르, 인독사카브, 아세퀴노실, 에톡사졸, 사이로마진, 1,3-디클로로프로펜, 디아펜티우론, 벤클로티아즈, 비페나제이트, 프로파자이트, 클로펜테진, 메타플루미존, 플루벤디아미드, 사이플루메토펜, 클로란트라닐리프롤, 사이안트라닐리프롤, 사이클라닐리프롤, 사이에노피라펜, 피리플루퀴나존, 페나자퀸, 아미도플루벳, 설플루라미드, 히드라메틸논, 메탈데히드, HGW-86, 리아노딘, 베부틴, AKD-1022, 클로로벤조산염, 티아졸릴신나노니트릴, 설폴사플로르, 플루엔셜폰, 트리플루메조피림, 아피도피로펜, 플루피라디푸론, 3-브로모-N-(4-클로로-2-(1-사이클로프로필에틸카바모일)-6-메틸페닐)-1-(3-클로로페리딘-2-일)-1H-피라졸-5-카복사미드, 3-브로모-N-(2-브로모-4-클로로-6-(사이클로프로필메틸카바모일)페닐)-1-(3-클로로페리딘-2-일)-1H-피라졸-5-카복사미드, 3-브로모-N-(4-클로로-2-메틸-6-(메틸카바모일)페닐)-1-(3-클로로페리딘-2-일)-1H-피라졸-5-카복사미드 및 3-브로모-1-(3-클로로페리딘-2-일)-N-(4-시아노-2-메틸-6-(메틸카바모일)페닐)-1H-피라졸-5-카복사미드.
- [0210] 뿐만 아니라, 본 발명의 화합물은 항생제 및 반합성 항생제, 예를 들어 바실러스 투린지엔시스(*Bacillus thuringiensis*), 예를 들어 바실러스 투린지엔시스 아이자와이(*Bacillus thuringiensis aizawai*), 바실러스 투린지엔시스 쿠르스타키(*Bacillus thuringiensis kurstaki*), 바실러스 투린지엔시스 이스라엘레니시스(*Bacillus thuringiensis israelensis*), 바실러스 투린지엔시스 자포넨시스(*Bacillus thuringiensis japonensis*) 및 바실러스 투린지엔시스 테네브리오니스(*Bacillus thuringiensis tenebrionis*)에 의해 생산된 살충성 결정 단백질, 미생물 해충제, 예를 들어 곤충 병원성 바이러스 제제, 곤충 병원성 사상균 제제 및 선충 병원성 사상균 제제, 아버멕틴, 에마멕틴 벤조산염, 밀베멕틴, 밀베마이신, 스피노사드, 이버멕틴, 레피멕틴, DE-175, 아바멕틴, 에마멕틴 및 스피네토탄; 천연 물질, 예를 들어 아자디라크틴 및 로테논; 기피제, 예를 들어 디에틸톨루아미드 등 과의 혼합물로서 사용될 수 있거나, 아니면 이것들과 병용될 수 있다.
- [0211] 다른 농약들 중에서도 살균제에 대한 유효 성분 화합물(일반명; 일부 신청중인 것 포함; 또는 일본 식물 방역 협회에 의한 시험 코드)은 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다:
- [0212] 아닐리노피리미딘계 화합물, 예를 들어 메파니피립, 피리메타닐, 사이프로디닐 및 폐럼존;
- [0213] 트리아졸로피리미딘계 화합물, 예를 들어 5-클로로-7-(4-메틸페리딘-1-일)-6-(2,4,6-트리플루오로페닐)[1,2,4]트리아졸로[1,5-a]피리미딘;
- [0214] 피리디나민계 화합물, 예를 들어 플루아지남;
- [0215] 아졸계 화합물, 예를 들어 트리아디메온, 비터타놀, 트리플루미졸, 에타코나졸, 프로피코나졸, 펜코나졸, 플루실라졸, 마이클로부타닐, 사이프로코나졸, 테부코나졸, 헥사코나졸, 푸르코나졸-시스, 프로클로라즈, 엣코나졸, 에폭시코나졸, 테트라코나졸, 옥스포코나졸 푸마르산염, 시프코나졸, 프로티오코나졸, 트리아디메놀, 플루트리아폴, 디펜코나졸, 플루퀸코나졸, 펜부코나졸, 브로무코나졸, 디니코나졸, 트리사이클라졸, 프로베나졸, 시메코나졸, 폐푸라조에이트, 입코나졸 및 이미벤코나졸;
- [0216] 퀴녹살린계 화합물, 예를 들어 퀴노메티오네이트;
- [0217] 디티오카밤산염 화합물, 예를 들어 마네브, 지네브, 만코제브, 폴리카밤산염, 메티람, 프로피네브 및 티람;
- [0218] 유기 염소계 화합물, 예를 들어 푸사라이드, 클로로탈로닐 및 퀸토젠;
- [0219] 이미다졸계 화합물, 예를 들어 베노밀, 사이아조파미드, 티오파네이트-메틸, 카벤다짐, 티아벤다졸 및 푸베리아졸;
- [0220] 시아노아세타미드계 화합물, 예를 들어 사이목사닐;
- [0221] 아닐리드계 화합물, 예를 들어 메탈락실, 메탈락실-M, 메페녹삼, 옥사더실, 오후레이스, 베날락실, 베날락실-M(키랄락실, 카이랄락실), 푸랄락실, 사이프로푸람, 카복신, 옥시카복신, 티플루자미드, 보스칼리드, 빅사펜, 이소티아닐, 티아디닐 및 세단산;
- [0222] 설파미드계 화합물, 예를 들어 디클로플루아니드;
- [0223] 구리계 화합물, 예를 들어 수산화 제2 구리 및 옥신 코퍼(oxine copper);

- [0224] 이속사졸계 화합물, 예를 들어 하이멕사졸;
- [0225] 유기 인계 화합물, 예를 들어 포세틸-A1, 툴클로포스-메틸, S-벤질 0,0-디이소프로필 포스포로티오에이트, 0-에틸 S,S-디페닐 포스포로디티오에이트, 알루미늄 에틸 수소 포스폰산염, 에디펜포스 및 이프로벤포스;
- [0226] 프탈리미드계 화합물, 예를 들어 캡탄, 캡타폴 및 폴랫;
- [0227] 디카복시미드계 화합물, 예를 들어 프로시미돈, 이프로디온 및 빈클로졸린;
- [0228] 벤자닐리드계 화합물, 예를 들어 플루톨라닐 및 메프로닐;
- [0229] 아미드계 화합물, 예를 들어 웨티오피라드, 3-(디플루오로메틸)-1-메틸-N-[(1RS,4SR,9RS)-1,2,3,4-테트라하이드로-9-이소프로필-1,4-메타노나프탈렌-5-일]피라졸-4-카복사미드 및 3-(디플루오로메틸)-1-메틸-N-[(1RS,4SR,9SR)-1,2,3,4-테트라하이드로-9-이소프로필-1,4-메타노나프탈렌-5-일]피라졸-4-카복사미드(이소피라졸)의 혼합물, 실티오팜, 폐녹사닐 및 푸라멧피르;
- [0230] 벤자미드계 화합물, 예를 들어 플루오피람 및 족사미드;
- [0231] 피페라진계 화합물, 예를 들어 트리포린;
- [0232] 피리딘계 화합물, 예를 들어 피리페녹스;
- [0233] 카비놀계 화합물, 예를 들어 폐나리몰;
- [0234] 피페리딘계 화합물, 예를 들어 웨프로피딘;
- [0235] 모폴린계 화합물, 예를 들어 웨프로피모프 및 트리데모프;
- [0236] 유기 주석계 화합물, 예를 들어 수산화펜틴 및 아세트산펜틴;
- [0237] 우레아계 화합물, 예를 들어 웨시큐론;
- [0238] 신남산계 화합물, 예를 들어 디메토모프 및 플루모프;
- [0239] 페닐 카밤산염계 화합물, 예를 들어 디에토펜카브;
- [0240] 시아노피롤계 화합물, 예를 들어 플루디옥소닐 및 웬피클로닐;
- [0241] 스트로빌루린계 화합물, 예를 들어 아족시스트로빈, 크레속심-메틸, 메토미노스트로빈, 트리폴록시스트로빈, 피록시스트로빈, 오리자스트로빈, 디목시스트로빈, 피라클로스트로빈 및 플루옥사스트로빈;
- [0242] 옥사졸리디논계 화합물, 예를 들어 파목사돈;
- [0243] 티아졸카복사미드계 화합물, 예를 들어 에타복삼;
- [0244] 발린 아미드계 화합물, 예를 들어 이프로발리카브 및 벤티아발리카브-이소프로필;
- [0245] 아실아미노산계 화합물, 예를 들어 메틸 N-(이소프로폭시카보닐)-L-발릴-(3RS)-3-(4-클로로페닐)- β -알라니네이트(발리페날레이트);
- [0246] 이미다졸리논계 화합물, 예를 들어 폐나미돈;
- [0247] 하이드록시스아닐리드계 화합물, 예를 들어 웬헥사미드;
- [0248] 벤젠설론아미드계 화합물, 예를 들어 플루설파미드;
- [0249] 옥심 에테르계 화합물, 예를 들어 시플루페나미드;
- [0250] 안트라퀴논계 화합물;
- [0251] 크로톤산계 화합물;
- [0252] 항생제, 예를 들어 발리다마이신, 카스가마이신 및 폴리옥신;
- [0253] 구아닌딘계 화합물, 예를 들어 이미녹타딘 및 도다인;
- [0254] 퀴놀린계 화합물, 예를 들어 6-tert-부틸-8-플루오로-2,3-디메틸퀴놀린-4-일 아세트산염(테부플로퀸);
- [0255] 티아졸리딘계 화합물, 예를 들어 (Z)-2-(2-플루오로-5-(트리플루오로메틸)페닐티오)-2-(3-(2-메톡시페닐)티아졸

리딘-2-일텐)아세토니트릴(플루티아닐)); 및

[0256] 기타 화합물, 예를 들어 피리벤카브, 이소프로티올란, 피로킬론, 디클로메진, 퀴녹시펜, 프로파모카브 염화수소 산염, 클로로피크린, 다조멧, 메탐-나트륨, 니코비펜, 메트라페논, UBF-307, 디클로시멧, 프로퀴나지드, 아미설 브롬(아미브롬돌), 3-(2,3,4-트리메톡시-6-메틸벤조일)-5-클로로-2-메톡시-4-메틸피리딘, 4-(2,3,4-트리메톡시-6-메틸벤조일)-2,5-디클로로-3-트리플루오로메틸피리딘, 피리오페논, 이소페타미드, 만디프로파미드, 플루오페 콜리드, 카프로파미드, 맵틸디노캅, N-[(3',4'-디클로로-1,1-디메틸)페나실]-3-트리플루오로메틸-2-피리딘카복사미드, N-[(3',4'-디클로로-1,1-디메틸)페나실]-3-메틸-2-티오펜카복사미드, N-[(3',4'-디클로로-1,1-디메틸)페나실]-1-메틸-3-트리플루오로메틸-4-피라졸카복사미드, N-[[2'-메틸-4'-(2-프로필옥시)-1,1-디메틸]페나실]-3-트리플루오로메틸-2-피리딘카복사미드, N-[[2'-메틸-4'-(2-프로필옥시)-1,1-디메틸]페나실]-1-메틸-3-트리플루오로메틸-4-피라졸카복사미드, N-[[4'-(2-프로필옥시)-1,1-디메틸]페나실]-3-트리플루오로메틸-2-피리딘카복사미드, N-[[4'-(2-프로필옥시)-1,1-디메틸]페나실]-3-메틸-2-티오펜카복사미드, N-[[4'-(2-프로필옥시)-1,1-디메틸]페나실]-3-메틸-2-티오펜카복사미드, N-[[4'-(2-프로필옥시)-1,1-디메틸]페나실]-3-트리플루오로메틸-2-피리딘카복사미드, N-[[4'-(2-프로필옥시)-1,1-디메틸]페나실]-3-트리플루오로메틸-2-피리딘카복사미드, 스피록사민, S-2188(펜피라자민), S-2200, ZF-9646, BCF-051, BCM-061 및 BCM-062.

[0257] 본 발명의 화합물과 혼합물로서 사용될 수 있거나, 병용될 수 있는 농약의 다른 예들은, 제초제들, 특히 토양 시용형 제초제들, 예를 들어 제초제 매뉴얼(The Pesticide Manual)(제15판)에 제시된 것들에 대한 유효 성분 화합물을 포함할 수 있다.

[0258] 본 발명의 화합물이 살동물기생생물제로서 사용되는 경우, 해당 제제는 숙주 동물의 표면(등, 세모판, 복부 또는 넓적 다리 안쪽 등)에 기생하는 유해 외부 기생충과, 숙주 동물의 체 내(위, 소장, 폐, 심장, 간, 혈관, 피하 조직 또는 림프 조직 등)에 기생하는 유해 내부 기생충 방제에 특히 효과적이다. 특히 상기 제제는 외부 기생충 방제에 효과적이다.

[0259] 외부 기생충의 예들로서는 동물 기생성 진드기 및 벼룩을 포함할 수 있다. 이와 같은 기생충 종류의 수는 매우 많아서, 모두 열거하기는 어려우므로, 이에 관한 예들이 이하에 제시되어 있다.

[0260] 동물 기생성 진드기의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다:

[0261] 참 진드기, 예를 들어 부필루스 마이크로플러스(*Boophilus microplus*), 리피세팔루스 생귀네우스(*Rhipicephalus sanguineus*), 해마피살리스 롱기코르니스(*Haemaphysalis longicornis*), 해마피살리스 플라바(*Haemaphysalis flava*), 해마피살리스 캄파놀라타(*Haemaphysalis campanulata*), 해마피살리스 콘신나(*Haemaphysalis concinna*), 해마피살리스 자포니카(*Haemaphysalis japonica*), 해마피살리스 키타오카이(*Haemaphysalis kitaokai*), 해마피살리스 이아스(*Haemaphysalis ias*), 익소데스 오바투스(*Ixodes ovatus*), 익소데스 낭폰넨시스(*Ixodes nipponensis*), 익소데스 페르설카투스(*Ixodes persulcatus*), 암블리옴마 테스투디나리움(*Amblyomma testudinarium*), 해마피살리스 메가스피노사(*Haemaphysalis megaspinosa*), 더마센터 레티큘라투스(*Dermacentor reticulatus*) 및 더마센터 타이와네시스(*Dermacentor taiwanensis*); 더마니서스 갈리나에(*Dermanyssus gallinae*); 북방 닭 진드기(northern fowl mites), 예를 들어 오르니토니서스 실비아룸(*Ornithonyssus sylviarum*) 및 오르니토니서스 별사(*Ornithonyssus bursa*); 텔 진드기, 예를 들어 유트롬비콜라 위크마니(*Eutrombicula wichmanni*), 웹토트롬비디움 아카무시(*Leptotrombidium akamushi*), 웹토트롬비디움 팔리듐(*Leptotrombidium pallidum*), 웹토트롬비디움 후지(*Leptotrombidium fuji*), 웹토트롬비디움 토사(*Leptotrombidium tosa*), 네오프트롬비콜라 오텀날리스(*Neotrombicula autumnalis*), 유트롬비콜라 알프레두게시(*Eutrombicula alfreddugesi*) 및 헬레니콜라 미야가와이(*Helenicula miyagawai*); 발톱 진드기, 예를 들어 체일 레티엘라 야스구리(*Cheyletiella yasguri*), 체일레티엘라 파라시티보락스(*Cheyletiella parasitivora*) 및 체일 레티엘라 블라케이(*Cheyletiella blakei*); 옴 진드기, 예를 들어 소로프테스 큐니쿨리(*Psoroptes cuniculi*), 코리오프테스 보비스(*Chorioptes bovis*), 옥토렉테스 사이노티스(*Otodectes cynotis*), 사르코프테스 스카비에이(*Sarcoptes scabiei*) 및 노토에드레스 카티(*Notoedres cati*); 및 도랑이 모낭충, 예를 들어 데모데스 카니스(*Demodex canis*). 본 발명의 화합물을 포함하는 살동물기생생물제는 상기된 것들 중 참 진드기를 방제하는데 특히 유효하다.

[0262] 동물 기생성 벼룩의 예들로서는 시포나프테라(*Siphonaptera*) 목에 속하는 체외 기생성 무시 곤충들을 포함할 수 있다. 이에 관한 더욱 구체적인 예들로서는 풀리시다에(*Pulicidae*) 과 및 세라테필루스(*Ceratophyllus*) 과에 속하는 벼룩들을 포함할 수 있다. 풀리시다에 과에 속하는 벼룩들의 예로서는 크테노세팔리테스 카니스

(*Ctenocephalides canis*), 크테노세팔리데스 펠리스(*Ctenocephalides felis*), 풀렉스 이리탄트스(*Pulex irritants*), 에키드노파가 갈리나세아(*Echidnophaga gallinacea*), 제놈실라 케오피스(*Xenopsylla cheopis*), 렙톱실라 세그니스(*Leptopsylla segnis*), 노솝사일루스 파시아투스(*Nosopsyllus fasciatus*) 및 모놉사일루스 아니서스(*Monopsyllus anisus*)를 포함할 수 있다. 본 발명의 화합물을 포함하는 살동물기생생물제는 이것들 중 풀리시다에 과에 속하는 벼룩, 특히 크테노세팔리데스 카니스 및 크테노세팔리데스 펠리스 등을 방제하는데 특히 유효하다.

[0263]

기타 체외 기생충의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 이, 예를 들어 소이, 말이, 양이, 긴 코소이 및 머릿니; 식모류, 예를 들어 개 식모류; 및 흡혈 쌍시류 해충, 예를 들어 말파리, 등에 모기 및 잔디 등에. 내부 기생충의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 선충, 예를 들어 폐충, 편충, 결절충, 위내 기생충, 회충 및 사상충; 촌충, 예를 들어 스피로메트라 에리나세이유로파에이(*Spirometra erinaceieuropaei*), 디필로보트리움 라툼(*Diphyllobothrium latum*), 디필리디움 카니눔(*Dipylidium caninum*), 타에니아 멀티셉스(*Taenia multiceps*), 에키노코커스 그라눌로서스(*Echinococcus granulosus*) 및 에키노코커스 멀티로클라리스(*Echinococcus multilocularis*); 흡충, 예를 들어 쉬스토소마 자포니쿰(*Schistosoma japonicum*) 및 쉬스토소마 파시ول라에(*Schistosoma fasciolae*); 및 원생 동물, 예를 들어 콕시디아, 말라리아 기생충, 소장 근육 포자충, 톡소플라스마(*Toxoplasma*) 및 크립토스포리디아(*Cryptosporidium*).

[0264]

숙주 동물의 예들로서는 다양한 애완 동물, 가축류 및 가금류를 포함할 수 있다. 이에 관한 더욱 구체적인 예로서는 개, 고양이, 마우스, 래트, 햄스터, 기니아 피그, 다람쥐, 토끼, 폐럿, 새(예를 들어 비둘기, 앵무새, 구관조, 문조, 잉꼬, 십자매 또는 카나리아 등), 소, 말, 돼지, 양, 오리 및 닭을 포함할 수 있다. 본 발명의 화합물을 포함하는 살동물기생생물제는 무엇보다도 애완 동물 또는 가축의 체외에 기생하는 해충 또는 진드기를 방제하는데 유효하다. 상기 제제는 애완 동물들 및 가축들 중에서도 개, 고양이, 소 또는 말에 특히 유효하다.

[0265]

본 발명의 화합물이 살동물기생생물제로서 사용되는 경우, 이 화합물은 그대로 사용될 수 있거나, 아니면 적당한 첨가제들과 함께 다양한 형태, 예를 들어 분제, 입제, 정제, 산제, 캡슐제, 액상제, 유제, 수성 혼탁제, 유성 혼탁제 등으로 제제화된 후 사용될 수 있다. 이와 같은 형태들로 제제화되는 이외에도, 본 발명의 화합물은, 해당 제제가 본 발명의 목적에 적합한 한, 당 업계에 통상적으로 사용되고 있는 임의의 제제로 제제화될 수 있다. 이와 같은 제제들에 사용될 첨가제의 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 농원예용 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제를 제제화하기 위한 첨가제들의 예로서 상기 예시된 음 이온계 계면활성제 및 비 이온계 계면활성제; 양 이온계 계면활성제, 예를 들어 세틸트리메틸암모늄 브롬화물; 용매, 예를 들어 물, 아세톤, 아세토니트릴, N-메틸아세타미드, N,N-디메틸아세타미드, N,N-디메틸포름아미드, 2-피롤리돈, N-메틸-2-피롤리돈, 케로센, 트리아세틴, 메탄올, 에탄올, 이소프로판올, 벤질 알코올, 에틸렌 글리콜, 프로필렌 글리콜, 폴리에틸렌 글리콜, 지방 폴리옥시에틸렌 글리콜, 부틸 디글리콜, 에틸렌 글리콜 모노메틸 에테르, 에틸렌 글리콜 모노에틸 에테르, 디에틸렌 글리콜 모노에틸 에테르, 디에틸렌 글리콜 n-부틸 에테르, 디프로필렌 글리콜 모노메틸 에테르 및 디프로필렌 글리콜 n-부틸 에테르; 항산화제, 예를 들어 부틸하이드록시아이솔, 부틸하이드록시톨루엔, 아스코르브산, 메타아황산수소나트륨, 프로필갈레이트 및 티오황산나트륨; 막 형성제, 예를 들어 폴리비닐파리론, 폴리비닐 알코올, 그리고 아세트산비닐과 비닐파리론의 공중합체; 농원예용 살충제, 살비제, 살선충제 또는 살토양해충제를 제제화하기 위한 첨가제들의 예로서 상기 예시된 식물유 및 광물유; 그리고 담체, 예를 들어 락토스, 수크로스, 글루코스, 전분, 밀가루, 옥수수 가루, 대두유 케이크, 탈지 미강, 탄산칼슘 및 기타 시판중인 사료용 원료. 상기된 바와 같은 첨가 성분들 중 1개 이상은, 이것들의 사용이 본 발명의 목적들을 벗어나지 않는 한, 적당히 선택되어 사용될 수 있다. 또한 당 업계에 알려져 있는 첨가제들로부터 적당히 선택된 첨가제로서 상기 나열된 첨가제들을 제외한 것들도 사용될 수 있다. 뿐만 아니라, 농업 및 원예 분야에서 사용되는 것으로 상기 예시된 다수의 첨가제들로부터 적당히 선택된 성분 1개 이상도 사용될 수 있다.

[0266]

본 발명의 화합물 대 이와 같은 다수의 첨가제들의 혼합비(중량비)는 보통 약 0.1:99.9 ~ 90:10이다. 이와 같은 제제들이 실제로 사용될 때, 제제들은 그대로 사용될 수 있거나, 아니면 해당 제제가 희석제, 예를 들어 물이 사용되어 소정의 농도로 희석되어 사용될 수 있으며, 필요에 따라서는 다양한 전착제(계면활성제, 식물유 또는 광물유 등)가 첨가될 수 있다.

[0267]

본 발명의 화합물은 숙주 동물에 경구 또는 비 경구 투여된다. 경구 투여 방법에 관한 예들로서는, 본 발명의 화합물을 포함하는 정제, 액상 제제, 캡슐제, 웨이퍼, 비스킷, 다진 고기 또는 기타 사료 등을 투여하는 방법을 포함할 수 있다. 비 경구 투여 방법에 관한 예들로서는 다음과 같은 것들을 포함할 수 있다: 본 발명의 화합물이 적당한 제제로 제제화된 후, 이 제제가 정맥 내 주사, 근육 내 투여, 피 내 투여, 피하 투여 등에 의해 제

내에 도입되는 방법; 본 발명의 화합물이 스팟-온 처리(spot-on treatment), 푸어-온 처리(pour-on treatment) 또는 분사 등에 의해 체 표면에 투여되는 방법; 그리고 본 발명의 화합물을 포함하는 수지 조각 등이 숙주 동물의 피부 속에 매립되는 방법.

[0268] 숙주 동물에 투여될 본 발명의 화합물의 양은, 투여 방법, 투여 목적 또는 질병의 상태 등에 따라서 달라진다. 그러나 본 발명의 화합물을, 숙주 동물 체중 1 kg당 보통 0.01 mg ~ 100 g, 바람직하게는 0.1 mg ~ 10 g의 투여량으로 투여하는 것이 적당하다.

[0269] 전술된 방법 또는 투여량을 시용하여 동물 기생충을 방제하는 방법, 특히 외부 기생충 또는 내부 기생충을 방제하는 방법은 본 발명에 포함된다.

[0270] 본 발명에 있어서, 이와 같이 유해 동물 기생충을 방제함으로써 기생충이 원인이 되는 숙주 동물의 다양한 질병이 예방 또는 치료될 수 있는 경우가 있다. 결과적으로, 본 발명의 화합물을 유효 성분으로서 포함하는 기생충성 동물 질병 예방제 또는 치료제와, 이와 같은 화합물로써 기생충성 동물 질병을 예방 또는 치료하는 방법은 본 발명에 포함된다.

[0271] 본 발명의 화합물이 살동물기생생물체로서 사용될 때, 이 화합물은 첨가제들과 함께, 다양한 종류의 비타민, 무기질, 아미노산, 영양제, 효소 제제, 해열제, 진정제, 소염제, 살균제, 착색제, 방향제 또는 보존제등과의 혼합물로서 사용될 수 있거나, 또는 이것들과 병용될 수 있다. 본 발명의 화합물은, 필요에 따라서, 기타 다양한 동물용 약물들 또는 다양한 농약들, 예를 들어 구충제, 항콕시듐제, 살충제, 살비제, 벼룩 사멸 제제, 살선충제, 살균제 또는 항균제 등과의 혼합물로서 사용될 수 있거나, 또는 이것들과 병용될 수 있으며, 이와 같은 방식으로 사용될 때 본 발명의 화합물이 더욱 우수한 효과를 발휘하는 경우가 있다. 동물 기생충을 방제하기 위한 조성물로서, 본 발명의 화합물을 다양한 성분들, 예를 들어 상기 제시된 성분들과의 혼합물로서 포함하는 조성물, 또는 이것들과 병용되는 조성물, 그리고 이 조성물을 사용하여 동물 기생충, 특히 외부 기생충 또는 내부 기생충을 방제하는 방법은 본 발명에 포함된다.

실시예

[0272] 본 발명의 실시예들이 이하에 제시되어 있는데, 다만 본 발명은 이하 실시예들에 한정되는 것으로 해석되어서는 안 된다. 우선, 본 발명의 화합물의 합성예들이 제시되어 있다.

합성 예 1

4-((4-tert-부틸)페닐)에티닐)-3-니트로페리딘(화합물 13)의 합성

[0273] 질소 대기 중에, 4-클로로-3-니트로페리딘(5.0 g, 31.6 mmol), 4-tert-부틸페닐아세틸렌(5.0 g, 31.6 mmol), 트리에틸아민(1.3 mL, 93.3 mmol), 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II) 디클로라이드(1.1 g, 1.6 mmol), 요오드화제1구리(0.3 g, 1.6 mmol) 그리고 N,N-디메틸포름아미드(60 mL)를 실온에서 15시간 동안 교반하였다. 이 반응 용액에, 물과 아세트산에틸을 첨가하였다. 그 다음, 상기 혼합 용액을 셀라이트로 여과하고 나서, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 염수로 세정한 후, 무수 황산나트륨으로 건조하였다. 여과에 의해 무수 황산나트륨을 건조한 후, 감압 하에서 용매를 중류 제거하였으며, 이때 잔류물을 실리카 겔 컬럼 크로마토그래피(용리액:n-헵тан/아세트산에틸 = 95/5→80/20(부피 부))로 정제한 결과, 원하는 물질(7.6 g; 수율 85%)이 제조되었다.

합성 예 2

3-알릴-4-((4-tert-부틸페닐)에티닐)페리딘(화합물 17)의 합성

(1) 3-알릴-4-브로모페리딘의 합성

[0274] 얼음으로 냉각하면서 톨루엔(25 mL)과 3M 수산화나트륨 수용액(15 mL)을 4-브로모페리딘 염화수소산염(5.0 g, 27.7 mmol)에 첨가한 다음, 계속해서 얼음으로 냉각하면서 30분 동안 교반하였다. 반응 혼합물이 분리되었는데, 유기층에 무수 황산나트륨을 첨가하여 상기 유기층을 건조하였다. 그 다음, 상기 무수 황산나트륨을 여과에 의해 제거하였다. 이때 생성된 4-브로모페리딘의 톨루엔 용액에 테트라하이드로푸란(50 mL)을 첨가하였다. 질소 대기 중에, 이로부터 생성된 혼합물을 -78°C로 냉각한 다음, 여기에 리튬 디이소프로필아미드의 1M 헥산/테트라하이드로푸란 용액(25 mL)을 적가하였으며, 이후 이 반응 혼합물을 상기 온도에서 1시간 동안 교반하였다. 여기에 요오드화알릴(2.5 mL, 27.4 mmol)을 적가하고 나서(-78°C), 상기 혼합물을 3시간에 걸쳐 실온으로 가열하였다. 상기 반응 혼합물에 염수를 첨가한 후, 이로부터 생성된 혼합물을 분리하였다. 유기층에 무수 황산나트륨을 첨가하여 상기 유기층을 건조하였다. 무수 황산나트륨을 여과로 제거한 후, 감압 하에서 용매를 중류 제거하였

으며, 이때 잔류물을 실리카 겔 컬럼 크로마토그래피(용리액:n-헵탄/아세트산에틸 = 90/10(부피 부))로 정제한 결과, 3-알릴-4-브로모파리딘(0.95 g; 수율 19%)이 제조되었다.

[0281] (2) 원하는 물질의 합성

[0282] 3-알릴-4-브로모파리딘(500 mg, 2.5 mmol), 4-tert-부틸페닐아세틸렌(400 mg, 2.5 mmol), 요오드화제1구리(30 mg, 0.16 mmol), 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II) 디클로라이드(90 mg, 0.13 mmol), 트리에틸아민(1 mL, 7.2 mmol) 및 N,N-디메틸포름아미드(5 mL)를 90°C에서 5시간 동안 질소 대기 중에 반응시켰다. 상기 반응 용액을 실온으로 냉각한 다음, 여기에 물을 첨가하고 나서, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 물과 염수로 세정한 다음, 이 세정된 유기층에 무수 황산나트륨을 첨가하여 상기 유기층을 건조하였다. 여과로 무수 황산나트륨을 제거한 후, 감압 하에서 용매를 증류 제거하였으며, 이때 잔류물을 실리카 겔 컬럼 크로마토그래피(용리액:n-헵탄/아세트산에틸 = 90/10(부피 부))로 정제한 결과, 원하는 물질(500 mg; 수율 72%)이 제조되었다.

[0283] 합성 예 3

[0284] 4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)파리딘-3-아민(화합물 30)의 합성

[0285] 4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)-3-니트로파리딘(7.6 g, 27.0 mmol)과 철(4.5 g, 81.0 mmol)을, 아세트산에틸(30 mL), 아세트산(15 mL) 및 물(15 mL)의 혼합 용액에 첨가하였다. 이 혼합물을 환류시키면서 1시간 동안 반응시켰다. 상기 반응 용액을 셀라이트로 여과한 후, 감압 하에서 용매를 증류 제거하였으며, 이때 잔류물을 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 포화 탄산수소나트륨 수용액과 염수로 세정한 다음, 무수 황산나트륨으로 건조하였다. 여과에 의해 무수 황산나트륨을 제거한 다음, 감압 하에서 용매를 증류 제거하였으며, 이때 잔류물을 실리카 겔 컬럼 크로마토그래피(용리액:n-헵탄/아세트산에틸 = 30/70(부피 부))로 정제한 결과, 원하는 물질(7.2 g; 수율 100%)이 제조되었다.

[0286] 합성 예 4

[0287] 4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)-3-(메틸티오)파리딘(화합물 26)의 합성

[0288] 4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)파리딘-3-아민(400 mg, 1.6 mmol)과 이황화디메틸(301 mg, 3.2 mmol)을 클로로포름(3 mL) 중에 용해하고 나서, 얼음으로 상기 혼합물을 냉각하였다. 상기 용액에 클로로포름(2 mL) 중 아질산tert-부틸(214 mg, 2.1 mmol) 용액을 적가하였다. 이후, 상기 혼합물을 얼음으로 냉각하면서 10분 동안 교반하고 나서, 80°C로 가열한 다음, 1시간 동안 교반하였다. 상기 반응 혼합물을 실온으로 냉각한 후, 감압 하에서 용매를 증류 제거하였으며, 이때 잔류물을 플래시 크로마토그래피로 정제한 결과, 원하는 물질(184 mg; 수율 41%)이 제조되었다.

[0289] 합성 예 5

[0290] 4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)-N-프로필파리딘-3-아민(화합물 32)의 합성

[0291] 4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)파리딘-3-아민(300 mg, 1.2 mmol)을 N,N-디메틸포름아미드(5 mL) 중에 용해하고 나서, 얼음으로 냉각하였다. 이 용액에 60% 수소화나트륨(60 mg, 1.5 mmol)을 첨가한 다음, 이 혼합물을 얼음으로 냉각하면서 20분 동안 교반하였다. 그 다음, 여기에 1-요오디도프로판(300 mg, 1.8 mmol)을 첨가하였으며, 이로부터 생성된 혼합물을 80°C에서 5시간 동안 교반하였다. 상기 반응 용액을 실온으로 냉각하고 나서, 여기에 물을 첨가한 다음, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 염수로 세정한 후 무수 황산나트륨으로 건조하였다. 여과로 무수 황산나트륨을 제거한 후, 감압 하에서 용매를 증류 제거하였으며, 이때 잔류물을 실리카 겔 컬럼 크로마토그래피(용리액:n-헵탄/아세트산에틸 = 70/30(부피 부))로 정제한 결과, 원하는 물질(45 mg; 수율 13%)이 제조되었다.

[0292] 합성 예 6

[0293] 4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)-3-(메틸설피닐)파리딘(화합물 37) 및 4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)-3-(메틸설포닐)파리딘(화합물 41)의 합성

[0294] 클로로포름(2 mL) 중에 4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)-3-(메틸티오)파리딘(83 mg, 0.3 mmol)을 용해한 다음, 이를 얼음으로 냉각하였다. 여기에 3-클로로파렌조산(100 mg, 0.6 mmol)을 첨가한 다음, 이 혼합물을 얼음으로 냉각하면서 2시간 동안 교반하였다. 이로부터 생성된 반응 용액에 물을 첨가하고 나서, 이를 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 무수 황산나트륨으로 건조하였다. 상기 무수 황산나트륨을 여과에 의해 제거한 후, 감압 하에서 용매를 증류 제거하였으며, 이때 잔류물을 플래시 크로마토그래피로 정제한 결과, 화합물 37(26 mg; 수율

30%) 및 화합물 41(31 mg,; 수율 33%)이 제조되었다.

[0295] 합성예 7

N-(4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)파리딘-3-일)프로파온아미드(화합물 59) 및 N-(4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)파리딘-3-일)-N-프로파오닐프로파온아미드(화합물 60)의 합성

[0297] N,N-디메틸포름아미드(10 mL) 중에 4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)파리딘-3-아민(300 mg, 1.2 mmol)과 트리에틸아민(1.0 mL, 7.2 mmol)을 용해하고 나서, 열음으로 냉각하였다. 이 용액에 염화프로파오닐(550 mg, 6.0 mmol)을 적가한 다음, 이로써 생성된 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 상기 반응 용액에 물을 첨가한 후, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 염수로 세정하고 나서, 무수 황산나트륨으로 건조하였다. 여과에 의해 무수 황산나트륨을 제거한 후, 감압 하에서 용매를 증류 제거하였으며, 이때 잔류물을 실리카 젤 컬럼 크로마토그래피(용리액: n-헵탄/아세트산에틸 80/20→60/40(부피 부))로 정제하였는데, 그 결과 화합물 59(73 mg; 수율 20%) 및 화합물 60(91 mg,; 수율 20%)이 제조되었다.

[0298] 합성예 8

1-(4-((3-알킬파리딘-4-일)에티닐)페닐)에타논(화합물 92)의 합성

[0300] (1) 1-(4-((트리메틸실릴)에티닐)페닐)에타논의 합성

[0301] 질소 대기 중에, 80°C에서 16시간 동안 4-요오도아세토페논(1.2 g, 4.9 mmol), 트리메틸실릴아세틸렌(1.0 g, 10 mmol), 요오드화제1구리(50 mg, 0.26 mmol), 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II) 디클로라이드(170 mg, 0.24 mmol), 트리에틸아민(2.0 mL, 14 mmol) 및 N,N-디메틸포름아미드(10 mL)를 반응시켰다. 이 반응 용액을 실온으로 냉각한 다음, 여기에 물을 첨가하고 나서, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 물과 염수로 세정하였으며, 여기에 무수 황산나트륨을 첨가하여 상기 유기층을 건조하였다. 무수 황산나트륨을 여과에 의해 제거하고 나서, 감압 하에 용매를 증류 제거하였으며, 이때 잔류물을 플래시 크로마토그래피로 정제한 결과, 1-(4-((트리메틸실릴)에티닐)페닐)에타논(0.91 g; 수율 84%)이 제조되었다.

[0302] (2) 1-(4-에티닐페닐)에타논의 합성

[0303] 실온에서 1시간 동안 1-(4-((트리메틸실릴)에티닐)페닐)에타논(0.86 g, 4.0 mmol), 탄산칼륨(1.1 g, 8.0 mmol) 및 메탄올(8 mL)을 반응시켰다. 감압 하에서 용매를 증류 제거한 다음, 여기에 물을 첨가하고 나서, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 물과 염수로 세정한 후, 여기에 무수 황산나트륨을 첨가하여 상기 유기층을 건조하였다. 여과에 의해 무수 황산나트륨을 제거한 다음, 감압 하에서 용매를 증류 제거하였으며, 이때 잔류물을 플래시 크로마토그래피로 정제한 결과, 1-(4-에티닐페닐)에타논(0.53 g; 수율 91%)이 제조되었다.

[0304] (3) 원하는 물질의 합성

[0305] 질소 대기 중에서, 3-알릴-4-브로모파리딘(200 mg, 1 mmol), 1-(4-에티닐페닐)에타논(160 mg, 1.1 mmol), 요오드화제1구리(10 mg, 0.05 mmol), 테트라카스(트리페닐포스핀)팔라듐(0)(60 mg, 0.05 mmol), 트리에틸아민(4 mL) 및 N,N-디메틸포름아미드(4 mL)를 50°C에서 24시간 동안 반응시켰다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시킨 다음, 여기에 물을 첨가하고 나서, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 물과 염수로 세정하고, 여기에 무수 황산나트륨을 첨가하여 상기 유기층을 건조하였다. 무수 황산나트륨을 여과로 제거한 후, 감압 하에서 용매를 증류 제거하였으며, 이때 잔류물을 플래시 크로마토그래피로 정제한 결과, 원하는 물질(90 mg; 수율 34%)이 제조되었다.

[0306] 합성예 9

3-브로모-4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)파리딘(화합물 10)의 합성

[0308] 아질산 tert-부틸(0.61 g, 5.92 mmol) 및 아세토니트릴(5 mL)의 혼합 용액을, 4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)파리딘-3-아민(1.0 g, 3.99 mmol) 및 아세토니트릴(25 mL)의 혼합 용액에 열음으로 냉각하면서 적가하였다. 적가 후, 상기 혼합물을 상기 온도에서 30분 동안 교반하였다. 여기에 브롬화구리(II)(1.12 g, 5.01 mmol)를 첨가하였다. 그 다음, 이로부터 생성된 혼합물을 실온으로 가열하고 나서, 이 온도에서 15시간 동안 교반하였다. 이 반응 혼합물에 아세트산에틸(50 mL) 및 물(50 mL)을 첨가하였으며, 용해되지 않은 물질을 셀라이트를 사용하는 여과에 의해 제거하였다. 상기 반응 혼합물을 아세트산에틸로 추출한 후, 유기층을 염수로 세정한 다음, 무수 황산나트륨으로 상기 유기층을 건조하였다. 여과에 의해 무수 황산나트륨을 제거한 후, 감압 하에서 용매를 증류 제거하였다. 잔류물을 플래시 크로마토그래피로 정제한 결과, 원하는 물질(0.36 g; 수율 29%)이 제조되었다.

- [0309] 합성 예 10
- [0310] 4-((4-(tert-부틸)페닐)에티닐)-3-메톡시피리딘(화합물 21)의 합성
- (1) 산화 3-메톡시-4-니트로피리딘-1의 합성
- [0312] 얼음으로 냉각하면서, 산화 3-플루오로-4-니트로피리딘-1(9.75 g, 61.7 mmol) 및 메탄올(145 mL)의 혼합 혼탁액에 28% 메톡시화나트륨 메탄올 용액(11.9 g, 61.7 mmol)을 첨가하였다. 이 혼합물을 실온으로 가열하고 나서, 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 감압 하에서 메탄올을 증류 제거하였다. 잔류물에 물(50 mL)을 첨가한 다음, 클로로포름으로 추출하였다. 유기층을 염수로 세정하고 나서, 여기에 무수 황산나트륨을 첨가하여 상기 유기층을 건조하였다. 여과에 의해 무수 황산나트륨을 제거한 후, 감압 하에서 용매를 증류 제거한 결과, 산화 3-메톡시-4-니트로피리딘-1(9.54 g; 수율 91%)이 제조되었다.
- (2) 4-브로모-3-메톡시피리딘 염화수소산염의 합성
- [0314] 실온에서, 산화 3-메톡시-4-니트로피리딘-1(9.54 g, 56.1 mmol) 및 아세트산에틸(100 mL)의 혼합 혼탁액에 3 브롬화 인(45 mL, 477 mmol)을 적가하였으며, 이때 반응 계의 온도는 40°C를 넘지 않도록 하였다. 적가를 마친 후, 이때 생성된 혼합물을 실온에서 10분 동안 교반한 다음, 용매가 환류되는 온도로 가열하고 나서, 이 온도에서 17시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시킨 후, 얼음 물(500 mL)에 부었다. 상기 혼합물이 분리되었는데, 이때 생성된 수성 층을 얼음으로 냉각하였으며, 이와 같은 조건에서 반응 계의 pH를 10 이상으로 조정하였다. 반응 혼합물을 아세트산에틸로 추출하고 나서, 유기층을 염수로 세정한 다음, 여기에 무수 황산나트륨을 첨가하여 상기 유기층을 건조하였다. 여과에 의해 무수 황산나트륨을 제거한 후, 감압 하에서 용매를 증류 제거한 결과, 4-브로모-3-메톡시피리딘이 제조되었다. 제조된 4-브로모-3-메톡시피리딘을 아세트산에틸 100 mL 중에 용해한 다음, 이 용액에 1.0M 염화수소 에테르 용액(60 mL, 60 mmol)을 첨가하였다. 감압 하에서 용매를 증류 제거한 결과, 4-브로모-3-메톡시피리딘 염화수소산염(7.80 g; 수율 62%)이 제조되었다.
- (3) 원하는 물질의 합성
- [0316] 질소 대기 중에 60°C에서 15시간 동안, 4-브로모-3-메톡시피리딘 염화수소산염(4.8 g, 21.4 mmol), 4-tert-부틸 페닐아세틸렌(5.1 g, 32.1 mmol), 요오드화제1구리(0.68 g, 3.2 mmol), 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II) 디클로라이드(0.75 g, 1.1 mmol), 트리에틸아민(12 mL, 85.5 mmol) 및 N,N-디메틸포름아미드(100 mL)를 반응시켰다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고 나서, 여기에 물을 첨가한 다음, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 물과 염수로 세정한 다음, 여기에 무수 황산나트륨을 첨가하여 상기 유기층을 건조하였다. 여과에 의해 무수 황산나트륨을 제거한 후, 감압 하에서 유기층을 농축하였으며, 이때 잔류물을 실리카 젤 컬럼 크로마토그래피(용리액: n-헵탄/아세트산에틸 = 67/33(부피 부))로 정제한 결과, 원하는 물질(3.2 g; 수율 56%)이 제조되었다.
- 합성 예 11
- [0318] 4-((4-tert-부틸)페닐)에티닐-3-(메톡시메틸)피리딘(화합물 46)의 합성
- (1) 4-브로모-3-(메톡시메틸)피리딘의 합성
- [0320] 얼음으로 냉각하면서, (4-브로모피리딘-3-일)메탄올(304 mg, 1.62 mmol) 및 테트라하이드로푸란(10 mL)의 혼합 용액에 60% 수소화나트륨(434 mg, 10.9 mmol)을 첨가하였다. 이 혼합물을 얼음으로 냉각하면서 10분 동안 교반한 후, 실온으로 가열한 다음, 이 온도에서 7시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 얼음으로 냉각한 후, 여기에 요오드화메틸(0.11 mL, 1.78 mmol)을 첨가하였다. 이 혼합물을 실온으로 가열한 후, 이 온도에서 7시간 동안 교반하였다. 상기 혼합물을 얼음으로 냉각하고 나서, 여기에 물(20 mL)을 첨가한 후, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 염수로 세정한 다음, 여기에 무수 황산나트륨을 첨가하여 상기 유기층을 건조하였다. 여과에 의해 무수 황산나트륨을 제거한 다음, 감압 하에서 용매를 증류 제거하고 나서, 잔류물을 플래시 크로마토그래피로 정제한 결과, 4-브로모-3-(메톡시메틸)피리딘(275 mg; 수율 84%)이 제조되었다.
- (2) 원하는 물질의 합성
- [0322] 질소 대기 중에 80°C에서 11시간 동안, 4-브로모-3-(메톡시메틸)피리딘(275 mg, 1.36 mmol), 4-tert-부틸페닐아세틸렌(247 mg, 1.56 mmol), 트리에틸아민(0.6 mL, 4.3 mmol), 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II) 디클로라이드

(48 mg, 0.07 mmol), 요오드화제1구리(20 mg, 0.11 mmol) 및 N,N-디메틸포름아미드(4 mL)를 반응시켰다. 상기 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고 나서, 여기에 물을 첨가한 다음, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 염수로 세정한 다음, 여기에 무수 황산나트륨을 첨가하여 상기 유기층을 건조하였다. 무수 황산나트륨을 여과로 제거한 다음, 감압 하에서 용매를 증류 제거하였으며, 이때 잔류물을 실리카 젤 컬럼 크로마토그래피(용리액: n-헵탄/아세트산에틸 = 85/15(부피 부))로 정제한 결과, 원하는 물질(219 mg; 수율 58%)이 제조되었다.

[0323] 합성 예 12

[0324] 4-((4-tert-부틸페닐)에티닐)-N-에틸파리딘-3-아민(화합물 112)의 합성

[0325] (1) 카밤산 tert-부틸 (4-((4-tert-부틸페닐)에티닐)파리딘-3-일)의 합성

[0326] 얼음으로 냉각하면서, 테트라하이드로푸란(50 mL) 및 나트륨 비스(트리메틸실릴)아미드(24 mL)의 1.0M 테트라하이드로푸란 용액을 4-((4-tert-부틸페닐)에티닐)파리딘-3-아민(2.5 g, 10 mmol)에 첨가한 다음, 계속해서 얼음 냉각하면서 10분 동안 교반하였다. 이 반응 용액을 실온으로 가열하고 나서, 이 온도에서 1시간 동안 교반하였다. 반응 용액을 다시 얼음으로 냉각한 후, 여기에 중탄산 디-tert-부틸(2.6 g, 11.9 mmol)을 첨가한 다음, 이를 15분 동안 교반하였다. 상기 반응 용액을 실온으로 가열하고 나서, 이 온도에서 4시간 동안 교반하였다. 이 반응 혼합물을 염화암모늄 수용액에 첨가한 후, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 염수로 세정한 후, 여기에 무수 황산나트륨을 첨가하여 상기 유기층을 건조하였다. 여과에 의해 상기 무수 황산나트륨을 제거하고 나서, 감압 하에서 이 유기층을 농축하였으며, 이때 잔류물을 실리카 젤 컬럼 크로마토그래피(용리액: n-헵탄/아세트산에틸 = 90/10(부피 부))로 정제한 결과, 비결정질 카밤산 tert-부틸 (4-((4-tert-부틸페닐)에티닐)파리딘-3-일)(0.87 g; 수율 25%)이 제조되었다.

[0327] (2) 카밤산 tert-부틸 (4-((4-tert-부틸페닐)에티닐)파리딘-3-일)(에틸)의 합성

[0328] 카밤산 tert-부틸 (4-((4-tert-부틸페닐)에티닐)파리딘-3-일)(200 mg, 0.57 mmol)에, N,N-디메틸포름아미드(10 mL), 요오드화에틸(180 mg, 1.15 mmol) 및 60% 수소화나트륨(48 mg, 1.2 mmol)을 첨가하고 나서, 이를 실온에서 2시간 30분 동안 교반하였다. 이 반응 혼합물을 물에 첨가한 다음, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 염수로 세정하고 나서, 여기에 무수 황산나트륨을 첨가하여, 상기 유기층을 건조하였다. 여과에 의해 무수 황산나트륨을 제거한 다음, 감압 하에서 유기층을 농축하였으며, 이때 잔류물을 실리카 젤 컬럼 크로마토그래피(용리액: n-헵탄/아세트산에틸 = 95/5(부피 부))로 정제한 결과, 비결정질 카밤산 tert-부틸 (4-((4-tert-부틸페닐)에티닐)파리딘-3-일)(에틸)(190 mg; 수율 88%)이 제조되었다.

[0329] (3) 원하는 물질의 합성

[0330] 카밤산 tert-부틸 (4-((4-tert-부틸페닐)에티닐)파리딘-3-일)(에틸)(130 mg, 0.34 mmol)에 아세트산에틸(5 mL) 및 10% 염화수소산(5 mL)을 첨가하고 나서, 이를 60°C에서 1시간 동안 교반하였다. 상기 반응 용액을 실온으로 냉각한 다음, 여기에 수산화나트륨 수용액을 첨가하여 이 혼합물을 중화하고 나서, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 염수로 세정한 다음, 여기에 무수 황산나트륨을 첨가하여, 상기 유기층을 건조하였다. 여과에 의해 무수 황산나트륨을 제거한 다음, 감압 하에서 유기층을 농축하였으며, 이때 잔류물을 실리카 젤 컬럼 크로마토그래피(용리액: n-헵탄/아세트산에틸 = 85/15(부피 부))로 정제한 결과, 원하는 물질(73 mg; 수율 77%)이 고체로서 제조되었다.

[0331] 이하, 본 발명에 의한 화합물의 각각의 예들을 표 1에 나열하였다. 이 화합물들은 상기 제시된 합성예들 또는 전술된 다양한 제조 방법들을 기초로 하여 합성될 수 있다. 표 1에서, "특성" 컬럼에 제시된 숫자들은 융점 (°C)을 나타내고, "NMR"로 표시된 화합물들은 표 2와 표 3에 제시된 ¹H-NMR 스펙트럼 데이터 화합물이다. 표 1, 표 2 및 표 3에서, "No."는 화합물 번호를 나타낸다. 또한 이하 표들에서, Me는 메틸기를 나타내고, Et는 에틸기를 나타내며, n-Pr은 노르말 프로필기를 나타내고, i-Pr은 이소프로필기를 나타내며, cyc-Pr은 사이클로프로필기를 나타내고, n-Bu는 노르말 부틸기를 나타내며, i-Bu는 이소부틸기를 나타내고, sec-Bu는 2차 부틸기를 나타내며, tert-Bu는 3차 부틸기를 나타내고, n-Pen은 노르말 펜틸기를 나타내며, i-Pen은 이소펜틸기를 나타내고, cyc-Pen은 사이클로펜틸기를 나타내며, neo-Pen은 네오펜틸기를 나타내고, n-Hex는 노르말헥실기를 나타내며, neo-Hex는 네오헥실기를 나타내고, cyc-Hex는 사이클로헥실기를 나타낸다. 컬럼 R¹에 관해서, 예를 들어 "4-F"는 이와 같이 표시된 해당 화합물이 표에 제시된 화학 구조식 상 치환 위치들 중 표시된 위치에서만 R¹으로 치환되었음[즉 해당 화합물이 4-번 위치에서만 플루오르 원자로 치환되었음]을 의미하고; "2,4-F₂"는 이와 같이 표시된 화합물이 2-번 위치와 4-번 위치에서 플루오르 원자들로 치환되었음을 의미한다. 다른 유사 표

현들에도 동일한 원칙이 적용된다. 화합물이 염의 형태를 가졌을 때, 해당 염의 명칭은 "비고"란에 기술하였다.

표 1

[화학식 (I)]					
No.	R ¹	R ²	W	n	특 성
1	4-F	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
2	4-Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
3	4-Br	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
4	4-I	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
5	4-NO ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
6	4-CN	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
7	4-Me	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
8	4-tert-Bu	F	CH	1	91
9	4-tert-Bu	Cl	CH	1	NMR
10	4-tert-Bu	Br	CH	1	109
11	4-tert-Bu	I	CH	1	
12	4-tert-Bu	CN	CH	1	NMR
13	4-tert-Bu	NO ₂	CH	1	NMR
14	4-tert-Bu	Me	CH	1	NMR
15	4-tert-Bu	n-Pr	CH	1	NMR
16	4-tert-Bu	n-Bu	CH	1	
17	4-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
18	4-tert-Bu	CH ₂ C≡CH	CH	1	
19	4-tert-Bu	CF ₃	CH	1	NMR
20	4-tert-Bu	OH	CH	1	142
21	4-tert-Bu	OMe	CH	1	93
22	4-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1	NMR
23	4-tert-Bu	OCH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
24	4-tert-Bu	OCH ₂ C≡CH	CH	1	
25	4-tert-Bu	SH	CH	1	
26	4-tert-Bu	SMe	CH	1	NMR
27	4-tert-Bu	S-n-Pr	CH	1	NMR
28	4-tert-Bu	SCH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
29	4-tert-Bu	SCH ₂ C≡CH	CH	1	
30	4-tert-Bu	NH ₂	CH	1	149
31	4-tert-Bu	NHMe	CH	1	161

No.	R ¹	R ²	W	n	특성
32	4-tert-Bu	NH-n-Pr	CH	1	NMR
33	4-tert-Bu	NHCH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
34	4-tert-Bu	NHCH ₂ C≡CH	CH	1	130
35	4-tert-Bu	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂	CH	1	NMR
36	4-tert-Bu	N(CH ₂ C≡CH) ₂	CH	1	117
37	4-tert-Bu	SOMe	CH	1	NMR
38	4-tert-Bu	SO-n-Pr	CH	1	
39	4-tert-Bu	SOCH ₂ CH=CH ₂	CH	1	69
40	4-tert-Bu	SOCH ₂ C≡CH	CH	1	
41	4-tert-Bu	SO ₂ Me	CH	1	NMR
42	4-tert-Bu	SO ₂ -n-Pr	CH	1	NMR
43	4-tert-Bu	SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	144
44	4-tert-Bu	SO ₂ CH ₂ C≡CH	CH	1	
45	4-tert-Bu	CH ₂ OH	CH	1	NMR
46	4-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1	82
47	4-tert-Bu	CH ₂ SMe	CH	1	NMR
48	4-tert-Bu	CH ₂ NHMe	CH	1	NMR
49	4-tert-Bu	CH ₂ NMe ₂	CH	1	NMR
50	4-tert-Bu	CHO	CH	1	NMR
51	4-tert-Bu	CO ₂ H	CH	1	101
52	4-tert-Bu	CO ₂ Et	CH	1	NMR
53	4-tert-Bu	COEt	CH	1	NMR
54	4-tert-Bu	CONHMe	CH	1	NMR
55	4-tert-Bu	CONMe ₂	CH	1	
56	4-tert-Bu	OCOMe	CH	1	NMR
57	4-tert-Bu	SCOMe	CH	1	
58	4-tert-Bu	NHCOMe	CH	1	NMR
59	4-tert-Bu	NHCOEt	CH	1	NMR
60	4-tert-Bu	N(COEt) ₂	CH	1	NMR
61	4-tert-Bu	NHCO-i-Pr	CH	1	NMR

[0333]

No.	R ¹	R ²	W	n	특성
62	4-tert-Bu	N(CO-i-Pr) ₂	CH	1	123
63	4-n-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
64	4-cyc-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
65	4-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
66	4-OH	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
67	4-OMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
68	4-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
69	4-O-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
70	4-O-sec-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
71	4-O-i-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
72	4-O-cyc-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
73	4-OCH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
74	4-OCH ₂ C≡CH	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
75	4-OCF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
76	4-OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
77	4-OCF(CF ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
78	4-SH	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
79	4-SMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
80	4-S-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
81	4-S(O)Me	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
82	4-S(O)-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
83	4-S(O) ₂ Me	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
84	4-S(O) ₂ -i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
85	4-NH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
86	4-NHMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
87	4-NH-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
88	4-NMe ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
89	4-CO ₂ H	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
90	4-CO ₂ Me	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
91	4-CO ₂ Et	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	

No.	R ¹	R ²	W	n	특성
92	4-COMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	56
93	4-CONHMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
94	4-CONMe ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
95	4-OCOMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
96	4-NHCOMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
97	4-NMeCOMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
98	2-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
99	3-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
100	2,4-F ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR
101	2-NO ₂ -4-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR
102	2-NH ₂ -4-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	
103	2-Cl-4-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	
104	2-Br-4-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	
105	2-F-4-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR
106	2,6-F ₂ -4-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	3	
107	3-F-4-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR
108	3-Cl-4-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	
109	4-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	N	1	NMR
110	2-Cl-4-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	N	2	
111	4-tert-Bu	NMe ₂	CH	1	NMR
112	4-tert-Bu	NHEt	CH	1	90
113	4-tert-Bu	NH-n-Bu	CH	1	81
114	4-tert-Bu	NH-n-Pen	CH	1	102
115	4-tert-Bu	NH-n-Hex	CH	1	73
116	4-tert-Bu	NH-i-Pr	CH	1	76
117	4-tert-Bu	NH-i-Bu	CH	1	73
118	4-tert-Bu	S-i-Pr	CH	1	NMR
119	4-tert-Bu	S-i-Bu	CH	1	NMR
120	4-tert-Bu	OEt	CH	1	NMR
121	4-tert-Bu	O-i-Pr	CH	1	NMR
122	4-tert-Bu	O-i-Bu	CH	1	NMR
123	4-tert-Bu	O-n-Pent	CH	1	NMR

No.	R ¹	R ²	W	n	특성	비고
124	4-CH=C(CH ₃) ₂	OMe	CH	1	NMR	
125	4-C≡C-tert-Bu	OMe	CH	1	NMR	
126	4-Me	OMe	CH	1	NMR	
127	4-CF ₃	OMe	CH	1	NMR	
128	4-F	OMe	CH	1	63	
129	4-O-i-Pr	OMe	CH	1	107	
130	4-O-sec-Bu	OMe	CH	1	NMR	
131	4-O-tert-Bu	OMe	CH	1	69	
132	4-O-neo-Pen	OMe	CH	1	NMR	
133	4-OCF ₃	OMe	CH	1	NMR	
134	4-O-cyc-Pen	OMe	CH	1	NMR	
135	4-S-tert-Bu	OMe	CH	1	NMR	
136	4-SCF ₃	OMe	CH	1	94	
137	4-COOMe	OMe	CH	1	143	
138	3-tert-Bu	OMe	CH	1	NMR	
139	4-O-tert-Bu	OEt	CH	1	NMR	
140	4-O-n-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
141	4-O-CH(CH ₂ CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
142	4-O-CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
143	4-CF(CF ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
144	3-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
145	3-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
146	3-O-sec-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
147	3-O-i-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
148	3-O-i-Pen	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
149	3,4-(MeO) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR	
150	3,5-(MeO) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR	
151	3,5-(tert-Bu) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR	
152	3-Me-4-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR	
153	4-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
154	4-CF ₃	NHEt	CH	1	89	
155	4-tert-Bu	OMe	CH	1	164	염화수소산염
156	4-tert-Bu	CH(OH)CH ₂ CH ₃	CH	1	NMR	
157	4-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	염화수소산염

No.	R ¹	R ²	W	n	특 성	비 고
158	4-S-cyc-Pen	OMe	CH	1	NMR	
159	4-F	CH=CHCH ₃	CH	1	NMR	
160	4-OCF ₃	CH=CHCH ₃	CH	1	NMR	
161	4-neo-Hex	OMe	CH	1		
162	4-cyc-Hex	OMe	CH	1	110	
163	4-SMe	OMe	CH	1	101	
164	4-SOMe	OMe	CH	1		
165	4-SO ₂ Me	OMe	CH	1	152	
166	4-CN	OMe	CH	1	88	
167	4-NH-i-Pr	OMe	CH	1	145	
168	4-CONHMe	OMe	CH	1		
169	4-CONMe ₂	OMe	CH	1		
170	4-NHCOMe	OMe	CH	1	181	
171	4-NMeCOMe	OMe	CH	1	172	
172	4-OCOMe	OMe	CH	1		
173	4-O-tert-Bu	OMe	CH	1	130	염화수소산염
174	4-tert-Bu	OEt	CH	1	194	염화수소산염
175	4-O-tert-Bu	OEt	CH	1	141	염화수소산염
176	4-CF ₃	OEt	CH	1	NMR	
177	4-OCF ₃	OEt	CH	1	52	
178	4-SCF ₃	OEt	CH	1	92	
179	4-Me	OEt	CH	1	NMR	
180	4-F	OEt	CH	1	NMR	
181	2-SEt-4-CF ₃	OEt	CH	2		
182	2-S(O)Et-4-CF ₃	OEt	CH	2		
183	2-S(O) ₂ Et-4-CF ₃	OEt	CH	2		
184	4-Me	O-n-Pr	CH	1	NMR	
185	4-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1	196	염화수소산염
186	4-O-tert-Bu	C-n-Pr	CH	1	NMR	
187	4-O-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1	141	염화수소산염
188	4-CF ₃	O-n-Pr	CH	1	NMR	
189	4-OCF ₃	O-n-Pr	CH	1	NMR	
190	4-SCF ₃	O-n-Pr	CH	1	99	
191	4-F	O-n-Pr	CH	1	NMR	

No.	R ¹	R ²	W	n	특성	비고
192	4-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1	134	염화수소산염
193	4-O-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1	NMR	
194	4-O-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		염화수소산염
195	4-CF ₃	CH ₂ OMe	CH	1	NMR	
196	4-OCF ₃	CH ₂ OMe	CH	1	NMR	
197	4-SCF ₃	CH ₂ OMe	CH	1	NMR	
198	4-Me	CH ₂ OMe	CH	1	NMR	
199	4-F	CH ₂ OMe	CH	1	NMR	
200	4-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1	74	염화수소산염
201	4-O-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
202	4-O-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1		염화수소산염
203	4-CF ₃	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
204	4-OCF ₃	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
205	4-SCF ₃	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
206	4-Me	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
207	4-F	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
208	4-tert-Bu	CH ₂ O-i-Pr	CH	1		
209	4-tert-Bu	CH ₂ O-n-Pr	CH	1	NMR	
210	4-tert-Bu	CH ₂ O-i-Bu	CH	1		
211	4-tert-Bu	SEt	CH	1	NMR	
212	4-tert-Bu	CH ₂ Cl	CH	1	177	염화수소산염
213	3-tert-Bu	NO ₂	CH	1	NMR	
214	4-O-tert-Bu	NO ₂	CH	1	NMR	
215	4-O-sec-Bu	NO ₂	CH	1	NMR	
216	4-S-tert-Bu	NO ₂	CH	1		
217	4-S-sec-Bu	NO ₂	CH	1		
218	4-Me	NH ₂	CH	1	254	
219	3-tert-Bu	NH ₂	CH	1	NMR	
220	4-O-tert-Bu	NH ₂	CH	1	NMR	
221	4-O-sec-Bu	NH ₂	CH	1		
222	4-S-tert-Bu	NH ₂	CH	1		
223	4-S-sec-Bu	NH ₂	CH	1		
224	4-Me	NHEt	CH	1	NMR	

[0338]

No.	R ¹	R ²	W	n	특 성	비 고
225	4-tert-Bu	NHEt	CH	1	154	염화수소산염
226	3-tert-Bu	NHEt	CH	1	NMR	
227	4-S-sec-Bu	NHEt	CH	1		
228	4-S-tert-Bu	NHEt	CH	1		
229	4-Et	NHEt	CH	1		
230	4-n-Pr	NHEt	CH	1		
231	4-n-Bu	NHEt	CH	1		
232	4-F	NHEt	CH	1		
233	4-OMe	NHEt	CH	1		
234	4-OCF ₃	NHEt	CH	1		
235	4-O-sec-Bu	NHEt	CH	1		
236	4-O-tert-Bu	NHEt	CH	1		
237	2-SEt-4-CF ₃	NHEt	CH	2		
238	2-S(O)Et-4-CF ₃	NHEt	CH	2		
239	2-S(O) ₂ Et-4-CF ₃	NHEt	CH	2		
240	4-tert-Bu	N(Me)Et	CH	1	NMR	
241	4-tert-Bu	Et	CH	1	NMR	
242	4-OMe	CH ₂ OMe	N	1		
243	4-OEt	CH ₂ OMe	N	1		
244	4-O-n-Pr	CH ₂ OMe	N	1		
245	4-O-i-Pr	CH ₂ OMe	N	1	NMR	
246	4-O-tert-Bu	CH ₂ OMe	N	1		
247	4-OMe	CH ₂ OEt	N	1		
248	4-OEt	CH ₂ OEt	N	1		
249	4-O-n-Pr	CH ₂ OEt	N	1		
250	4-O-i-Pr	CH ₂ OEt	N	1	NMR	
251	4-O-tert-Bu	CH ₂ OEt	N	1		
252	4-OMe	OMe	N	1		
253	4-OEt	OMe	N	1	NMR	
254	4-O-n-Pr	OMe	N	1		
255	4-O-i-Pr	OMe	N	1	NMR	
256	4-O-tert-Bu	OMe	N	1		

[0339]

No.	R ¹	R ²	W	n	특 성	비 고
257	4-tert-Bu	OMe	CH	1		옥살산염
258	4-tert-Bu	OMe	CH	1		트리플루오로아세트산염
259	4-tert-Bu	OMe	CH	1		p-톨루엔설폰산염
260	4-O-i-Pr	OMe	CH	1		염화수소산염
261	4-O-i-Pr	OMe	CH	1		옥살산염
262	4-O-i-Pr	OMe	CH	1		트리플루오로아세트산염
263	4-O-i-Pr	OMe	CH	1		p-톨루엔설폰산염
264	4-O-tert-Bu	OMe	CH	1		옥살산염
265	4-O-tert-Bu	OMe	CH	1		트리플루오로아세트산염
266	4-O-tert-Bu	OMe	CH	1		p-톨루엔설폰산염
267	4-SCF ₃	OMe	CH	1		염화수소산염
268	4-SCF ₃	OMe	CH	1		옥살산염
269	4-SCF ₃	OMe	CH	1		트리플루오로아세트산염
270	4-SCF ₃	OMe	CH	1		p-톨루엔설폰산염
271	4-tert-Bu	OEt	CH	1		옥살산염
272	4-tert-Bu	OEt	CH	1		트리플루오로아세트산염
273	4-tert-Bu	OEt	CH	1		p-톨루엔설폰산염
274	4-O-tert-Bu	OEt	CH	1		옥살산염
275	4-O-tert-Bu	OEt	CH	1		트리플루오로아세트산염
276	4-O-tert-Bu	OEt	CH	1		p-톨루엔설폰산염
277	4-OCF ₃	OEt	CH	1		염화수소산염
278	4-OCF ₃	OEt	CH	1		옥살산염
279	4-OCF ₃	OEt	CH	1		트리플루오로아세트산염
280	4-OCF ₃	OEt	CH	1		p-톨루엔설폰산염
281	4-SCF ₃	OEt	CH	1		염화수소산염
282	4-SCF ₃	OEt	CH	1		옥살산염
283	4-SCF ₃	OEt	CH	1		트리플루오로아세트산염
284	4-SCF ₃	OEt	CH	1		p-톨루엔설폰산염
285	4-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1	149	옥살산염
286	4-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1	96	트리플루오로아세트산염
287	4-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1	141	p-톨루엔설폰산염
288	4-O-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1		옥살산염
289	4-O-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1		트리플루오로아세트산염
290	4-O-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1		p-톨루엔설폰산염

[0340]

No.	R ¹	R ²	W	n	특 성	비 고
291	4-CF ₃	O-n-Pr	CH	1		염화수소산염
292	4-CF ₃	O-n-Pr	CH	1		옥살산염
293	4-CF ₃	O-n-Pr	CH	1		트리플루오로아세트산염
294	4-CF ₃	O-n-Pr	CH	1		p-톨루엔설폰산염
295	4-SCF ₃	O-n-Pr	CH	1		염화수소산염
296	4-SCF ₃	O-n-Pr	CH	1		옥살산염
297	4-SCF ₃	O-n-Pr	CH	1		트리플루오로아세트산염
298	4-SCF ₃	O-n-Pr	CH	1		p-톨루엔설폰산염
299	4-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		옥살산염
300	4-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		트리플루오로아세트산염
301	4-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		p-톨루엔설폰산염
302	4-O-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		옥살산염
303	4-O-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		트리플루오로아세트산염
304	4-O-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		p-톨루엔설폰산염
305	4-tert-Bu	Et	CH	1	NMR	염화수소산염
306	4-tert-Bu	Et	CH	1		옥살산염
307	4-tert-Bu	Et	CH	1		트리플루오로아세트산염
308	4-tert-Bu	Et	CH	1		p-톨루엔설폰산염
309	4-tert-Bu	n-Pr	CH	1		염화수소산염
310	4-tert-Bu	n-Pr	CH	1		옥살산염
311	4-tert-Bu	n-Pr	CH	1		트리플루오로아세트산염
312	4-tert-Bu	n-Pr	CH	1		p-톨루엔설폰산염
313	4-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1		옥살산염
314	4-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1		트리플루오로아세트산염
315	4-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1		p-톨루엔설폰산염
316	4-tert-Bu	O-i-Pr	CH	1		염화수소산염
317	4-tert-Bu	O-i-Pr	CH	1		옥살산염
318	4-tert-Bu	O-i-Pr	CH	1		트리플루오로아세트산염
319	4-tert-Bu	O-i-Pr	CH	1		p-톨루엔설폰산염
320	4-tert-Bu	NHEt	CH	1		옥살산염
321	4-tert-Bu	NHEt	CH	1		트리플루오로아세트산염
322	4-tert-Bu	NHEt	CH	1		p-톨루엔설폰산염
323	4-tert-Bu	NMe ₂	CH	1		염화수소산염
324	4-tert-Bu	NMe ₂	CH	1		옥살산염

No.	R ¹	R ²	W	n	특 성	비 고
325	4-tert-Bu	NMe ₂	CH	1		트리플루오로아세트산염
326	4-tert-Bu	NMe ₂	CH	1		p-톨루엔설폰산염
327	4-tert-Bu	N(Me)Et	CH	1		염화수소산염
328	4-tert-Bu	N(Me)Et	CH	1		옥살산염
329	4-tert-Bu	N(Me)Et	CH	1		트리플루오로아세트산염
330	4-tert-Bu	N(Me)Et	CH	1		p-톨루엔설폰산염
331	4-tert-Bu	SEt	CH	1		염화수소산염
332	4-tert-Bu	SEt	CH	1		옥살산염
333	4-tert-Bu	SEt	CH	1		트리플루오로아세트산염
334	4-tert-Bu	SEt	CH	1		p-톨루엔설폰산염
335	4-tert-Bu	S-n-Pr	CH	1		염화수소산염
336	4-tert-Bu	S-n-Pr	CH	1		옥살산염
337	4-tert-Bu	S-n-Pr	CH	1		트리플루오로아세트산염
338	4-tert-Bu	S-n-Pr	CH	1		p-톨루엔설폰산염
339	4-tert-Bu	S-i-Pr	CH	1		염화수소산염
340	4-tert-Bu	S-i-Pr	CH	1		옥살산염
341	4-tert-Bu	S-i-Pr	CH	1		트리플루오로아세트산염
342	4-tert-Bu	S-i-Pr	CH	1		p-톨루엔설폰산염
343	4-tert-Bu	S-i-Bu	CH	1		염화수소산염
344	4-tert-Bu	S-i-Bu	CH	1		옥살산염
345	4-tert-Bu	S-i-Bu	CH	1		트리플루오로아세트산염
346	4-tert-Bu	S-i-Bu	CH	1		p-톨루엔설폰산염
347	4-tert-Bu	S-sec-Bu	CH	1		염화수소산염
348	4-tert-Bu	S-sec-Bu	CH	1		옥살산염
349	4-tert-Bu	S-sec-Bu	CH	1		트리플루오로아세트산염
350	4-tert-Bu	S-sec-Bu	CH	1		p-톨루엔설폰산염
351	4-tert-Bu	SCH ₂ CH=CH ₂	CH	1		염화수소산염
352	4-tert-Bu	SCH ₂ CH=CH ₂	CH	1		옥살산염
353	4-tert-Bu	SCH ₂ CH=CH ₂	CH	1		트리플루오로아세트산염
354	4-tert-Bu	SCH ₂ CH=CH ₂	CH	1		p-톨루엔설폰산염

표 2

No	1H-NMR δ 값 ppm 측정 기구 : JEOL-ECX(500 MHz), 용매 : CDCl ₃
1	3.60 (2H, d), 5.14 (2H, m), 6.01 (1H, d), 7.08 (2H, d), 7.35 (1H, d), 7.53 (2H, d), 8.46 (1H, d), 8.50 (1H, s)
5	3.63 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.01 (1H, m), 7.40 (1H, d), 7.70 (2H, d), 8.26 (2H, d), 8.53 (1H, s), 8.56 (1H, s)
7	2.38 (3H, s), 3.61 (2H, d), 5.14 (2H, m), 6.02 (1H, m), 7.18 (2H, d), 7.34 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.45 (1H, d), 8.48 (1H, s)
9	1.34 (9H, s), 7.43 (2H, d), 7.55 (2H, d), 7.59 (1H, br), 8.52 (1H, br), 8.70 (1H, br)
12	1.34 (9H, s), 7.43 (2H, d), 7.55 (1H, br), 7.58 (2H, d), 8.6-9.2 (2H, br)
13	1.34 (9H, s), 7.44 (2H, d), 7.57 (2H, d), 7.59 (1H, d), 8.77 (1H, d), 9.31 (1H, s)
14	1.34 (9H, s), 2.65 (3H, s), 7.47 (2H, d), 7.54 (2H, d), 7.83 (1H, d), 8.50 (1H, d), 8.51 (1H, s)
15	1.05 (3H, t), 1.34 (9H, s), 1.80 (2H, m), 2.95 (2H, t), 7.48 (2H, d), 7.54 (2H, d), 7.82 (1H, d), 8.48 (1H, d), 8.53 (1H, s)
17	1.34 (9H, s), 3.60 (2H, d), 5.14 (2H, m), 6.00 (1H, m), 7.35 (1H, d), 7.40 (2H, d), 7.48 (2H, d), 8.45 (1H, d), 8.49 (1H, s)
19	1.34 (9H, s), 7.42 (2H, d), 7.52 (2H, d)
22	1.12 (3H, t), 1.33 (9H, s), 1.90 (2H, tq), 4.13 (2H, t), 7.40 (2H, d), 7.40 (1H, br), 7.49 (2H, d), 8.0-8.6 (2H, br)
26	1.33 (9H, s), 2.59 (3H, s), 7.32 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.53 (2H, d), 7.35 (1H, d), 8.42 (1H, s)
27	1.13 (3H, t), 1.34 (9H, s), 1.82 (2H, m), 3.05 (2H, t), 7.47 (2H, d), 7.57 (2H, d), 7.73 (1H, d), 8.45-8.33 (2H, m)
32	1.04 (3H, t), 1.33 (9H, s), 1.73 (2H, m), 3.23 (2H, br), 4.61 (1H, br), 7.25 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.47 (2H, d), 7.91 (2H, d), 8.03 (1H, s)
33	1.32 (9H, s), 3.94 (2H, br), 4.78 (1H, br), 5.22 (1H, d), 5.33 (1H, d), 5.96 (1H, m), 7.41 (2H, d), 7.48 (2H, d), 7.94 (1H, d), 8.02 (1H, s)
35	1.34 (9H, s), 4.18 (4H, d), 5.29 (2H, d), 5.35 (2H, d), 5.89 (2H, m), 7.44 (2H, d), 7.49 (2H, d), 7.70 (1H, d), 7.97 (1H, d), 8.06 (1H, s)
37	1.34 (9H, s), 2.97 (3H, s), 7.44-7.55 (5H, m), 8.74 (1H, d), 9.12 (1H, s)
41	1.34 (9H, s), 3.32 (3H, s), 7.45 (2H, d), 7.57-7.59 (3H, m), 8.82 (1H, d), 9.25 (1H, d)
42	1.03 (3H, t), 1.34 (9H, s), 1.79 (2H, tq), 3.45 (2H, t), 7.46 (2H, d), 7.59 (2H, d), 7.69 (1H, d), 8.86 (1H, d), 9.23 (1H, s)
52	1.33 (9H, s), 1.43 (3H, d), 4.46 (4H, t), 7.42 (2H, d), 7.55 (2H, d)
53	1.26 (3H, t), 1.36 (9H, s), 3.17 (2H, q), 7.42 (2H, d), 7.47-7.51 (3H, m), 8.65 (1H, d), 8.92 (1H, s)

[0343]

No.	1H-NMR δ 값 ppm 측정 기구 : JEOL-ECX(500 MHz), 용매 : CDCl ₃
58	1.36 (9H, s), 2.36 (3H, s), 7.51 (2H, d), 7.56 (2H, d), 7.81 (1H, d), 8.08 (1H, S), 8.41 (1H, d), 9.86 (1H, s)
59	1.30 (3H, t), 1.35 (9H, s), 2.53 (2H, q), 7.42-7.46 (3H, m), 7.50 (2H, d), 7.87 (1H, s), 8.36 (1H, d), 9.73 (1H, s)
60	1.15 (6H, t), 1.32 (9H, s), 2.64 (4H, q), 7.40 (4H, br), 7.56 (1H, d), 8.48 (1H, s), 8.63 (1H, d)
61	1.33 (6H, d), 1.34 (9H, s), 2.65 (1H, m), 7.29 (2H, d), 7.45-7.46 (3H, m), 7.96 (1H, s), 8.35 (1H, d), 9.73 (1H, s)
63	0.93 (3H, t), 1.36 (2H, sext), 1.60 (2H, quin), 2.64 (2H, t), 3.61 (2H, d), 5.14 (2H, m), 6.02 (1H, m), 7.19 (2H, d), 7.35 (1H, d), 7.46 (2H, d), 8.45 (1H, d), 8.90 (1H, s),
65	3.62 (2H, d), 5.14 (2H, m), 6.01 (1H, d), 7.38 (1H, d), 7.65 (4H, s), 8.50 (1H, d), 8.54 (1H, s)
67	3.59 (2H, d), 3.81 (3H, s), 5.13 (2H, m), 6.00 (1H, m), 6.89 (2H, d), 7.33 (1H, d), 7.48 (2H, d), 8.43 (1H, d), 8.48 (1H, s)
68	1.35 (6H, d), 3.60 (2H, d), 4.59 (1H, d), 5.13 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.87 (2H, d), 7.33 (1H, d), 7.46 (2H, d), 8.43 (1H, d), 8.48 (1H, s)
69	1.36 (9H, s), 3.60 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.02 (1H, m), 7.00 (2H, d), 7.34 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.44 (1H, d), 8.49 (1H, s)
70	0.98 (3H, t), 1.31 (3H, d), 1.70 (2H, m), 3.60 (2H, d), 4.35 (1H, m), 5.14 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.88 (2H, d), 7.34 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.48 (2H, br)
71	1.03 (6H, d), 2.10 (1H, m), 3.60 (2H, d), 3.74 (2H, d), 5.14 (2H, m), 6.02 (1H, m), 6.89 (2H, d), 7.32 (1H, d), 7.47 (2H, d), 8.43 (1H, d), 8.48 (1H, s)
75	3.60 (2H, d), 5.12 (2H, m), 6.00 (1H, m), 7.23 (2H, d), 7.36 (1H, d), 7.58 (2H, d), 8.46 (1H, d), 8.51 (1H, s)
79	2.50 (3H, s), 3.60 (2H, d), 5.15 (2H, m), 5.98 (1H, m), 7.22 (2H, d), 7.34 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.44 (1H, d), 8.49 (1H, s)
85	3.59 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.02 (1H, m), 6.59 (4H, m), 7.32 (3H, m), 8.41 (1H, d), 8.46 (1H, s)
88	3.01 (6H, s), 3.60 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.02 (1H, m), 6.67 (2H, d), 7.31 (1H, d), 7.42 (2H, d), 8.41 (1H, d), 8.45 (1H, s)
98	3.62 (2H, d), 5.11 (2H, m), 6.02 (1H, m), 7.38 (1H, d), 7.48 (1H, t), 7.55 (1H, t), 7.70 (2H, t), 8.48 (1H, d), 8.53 (1H, s)
99	3.62 (2H, d), 5.16 (2H, m), 6.01 (1H, m), 7.37 (1H, d), 7.52 (1H, t), 7.65 (1H, d), 7.72 (1H, d), 7.80 (1H, s), 8.50 (1H, d), 8.54 (1H, s)
100	3.61 (2H, d), 5.12 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.90 (2H, d), 7.36 (1H, d), 7.50 (1H, d), 8.48 (1H, s), 8.52 (1H, s)

No.	1H-NMR δ 값 ppm 측정 기구 : JEOL-ECX(500 MHz), 용매 : CDCl ₃
101	1.38 (9H, s), 3.66 (2H, d), 5.13 (2H, m), 6.03 (1H, m), 7.41 (1H, d), 7.66 (2H, s), 8.13 (1H, s), 8.49 (1H, d), 8.53 (1H, s)
105	1.36 (6H, d), 3.61 (2H, d), 4.56 (1H, m), 5.16 (2H, m), 6.02 (1H, m), 6.68 (2H, m), 7.35 (1H, d), 7.40 (1H, m), 8.44 (1H, d), 8.49 (1H, s)
107	1.38 (6H, d), 3.59 (2H, d), 4.61 (1H, m), 5.14 (2H, m), 6.00 (1H, m), 6.95 (1H, m), 7.25 (2H, d), 7.34 (1H, d), 8.47 (2H, br)
109	3.65 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.01 (1H, m), 7.37 (1H, d), 7.67 (1H, d), 7.96 (1H, d), 8.52 (1H, d), 8.56 (1H, s), 8.92 (1H, s)
111	1.33 (9H, s), 3.06 (6H, s), 7.28 (1H, d), 7.39 (2H, d), 7.48 (2H, d), 8.10 (1H, d), 8.26 (1H, s)
118	1.33 (9H, s), 1.35 (6H, d), 3.62-3.66 (1H, m), 7.36 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.52 (2H, d), 8.42 (1H, br), 8.62 (1H, br)
119	1.07 (6H, d), 1.33 (9H, s), 1.89-1.94 (1H, m), 2.92 (2H, d), 7.31 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.52 (2H, d), 8.49 (1H, d), 8.53 (1H, s)
120	1.33 (9H, s), 1.51 (3H, t), 4.24 (2H, q), 7.34 (1H, br), 7.39 (2H, d), 7.50 (2H, d), 8.22 (1H, br), 8.31 (1H, br)
121	1.33 (9H, s), 1.42 (6H, d), 4.66 (1H, m), 4.38 (1H, br), 7.40 (2H, d), 7.49 (2H, d), 8.06 (1H, br), 8.27 (1H, br)
122	1.14 (6H, d), 1.34 (9H, s), 2.27 (1H, m), 3.97 (2H, d), 7.46 (2H, d), 7.53 (2H, d), 7.78 (1H, d), 8.25 (1H, d), 8.27 (1H, s)
123	0.94 (3H, t), 1.33 (9H, s), 1.43 (2H, qt), 1.54 (2H, tt), 1.88 (2H, tt), 4.16 (2H, t), 7.33 (1H, br), 7.37 (2H, d), 7.49 (2H, d), 8.22 (1H, br), 8.31 (1H, br)
126	2.38 (3H, s), 4.01 (3H, s), 7.17 (2H, d), 7.42 (1H, br), 7.47 (2H, d), 8.0-8.7 (2H, br)
127	4.03 (3H, s), 7.38 (1H, br), 7.63 (2H, d), 7.68 (2H, d), 8.29 (1H, d), 8.39 (1H, br)
130	0.99 (3H, t), 1.31 (3H, d), 1.70 (2H, m), 4.01 (3H, s), 4.35 (1H, m), 6.87 (2H, d), 7.34 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.24 (1H, d), 8.32 (1H, s)
132	1.03 (9H, d), 3.60 (2H, s), 4.00 (3H, s), 6.88 (2H, d), 7.49 (2H, d)
133	4.00 (3H, s), 7.22 (2H, d), 7.35 (1H, d), 7.60 (2H, d), 8.26 (1H, s), 8.35 (1H, s)
134	1.76 (8H, m), 4.00 (3H, s), 4.77 (1H, m), 6.85 (2H, d), 7.33 (1H, d), 7.48 (2H, d), 8.23 (1H, d), 8.31 (1H, s)
135	1.29 (9H, s), 4.00 (3H, s), 7.35 (1H, d), 7.53 (4H, s), 8.25 (1H, s), 8.35 (1H, s)
138	1.31 (9H, s), 4.01 (3H, s), 7.39 (3H, m), 7.60 (1H, s), 8.25 (1H, s), 8.35 (1H, s)
139	1.37 (9H, s), 1.48 (3H, t), 4.23 (2H, q), 6.97 (2H, d), 7.47 (2H, d)
140	1.03 (3H, t), 1.80 (2H, sext), 3.59 (2H, d), 3.92 (2H, t), 5.14 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.89 (2H, d), 7.32 (1H, d), 7.44 (2H, d), 8.43 (1H, d), 8.48 (1H, s)
141	0.88 (3H, t), 0.94 (3H, t), 1.68 (4H, m), 3.60 (2H, d), 5.15 (2H, m), 5.98 (2H, m), 6.89 (2H, d), 7.47 (3H, m), 8.41 (2H, br)

No.	1H-NMR δ 값 ppm 측정 기구 : JEOL-ECX(500 MHz), 용매 : CDCl ₃
142	3.61 (2H, d), 4.54 (1H, d), 4.86 (1H, d), 5.12 (2H, m), 6.03 (1H, m), 6.66 (1H, m), 7.01 (2H, d), 7.35 (1H, d), 7.50 (2H, d), 8.45 (1H, s), 8.50 (1H, s)
143	3.61 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.00 (1H, m), 7.43 (1H, s), 7.65 (4H, m), 8.51 (2H, br)
144	1.34 (9H, s), 3.63 (2H, d), 5.16 (2H, m), 6.03 (1H, m), 7.33 (1H, d), 7.37 (2H, d), 7.43 (1H, d), 7.57 (1H, s), 8.47 (1H, s), 8.51 (1H, s)
145	1.35 (6H, d), 3.60 (2H, d), 4.57 (1H, m), 5.14 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.93 (1H, d), 7.05 (1H, s), 7.11 (1H, d), 7.27 (1H, m), 7.35 (1H, d), 8.45 (2H, br)
146	0.99 (3H, t), 1.31 (3H, d), 1.70 (2H, m), 3.51 (2H, d), 4.33 (1H, m), 5.15 (2H, m), 5.98 (1H, m), 6.93 (1H, dd), 7.05 (1H, s), 7.11 (1H, d), 7.27 (1H, m), 7.49 (1H, d), 8.43 (2H, br)
147	1.04 (6H, d), 2.01 (1H, m), 3.74 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.00 (1H, m), 6.94 (1H, d), 7.07 (1H, s), 7.12 (1H, d), 7.27 (1H, m), 8.43 (2H, br)
148	0.97 (6H, d), 1.69 (2H, q), 1.82 (1H, m), 3.62 (2H, d), 4.01 (2H, t), 5.16 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.94 (1H, d), 7.06 (1H, s), 7.13 (1H, d), 7.26 (1H, m), 7.39 (1H, s), 8.49 (2H, br)
149	3.60 (2H, d), 3.88 (3H, s), 3.89 (3H, s), 5.15 (2H, m), 6.02 (1H, m), 6.83 (1H, d), 7.03 (1H, s), 7.15 (1H, d), 7.32 (1H, d), 8.44 (1H, d), 8.49 (1H, s)
150	3.60 (2H, d), 3.80 (6H, s), 5.14 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.51 (1H, d), 6.69 (2H, d), 7.35 (1H, d), 8.46 (1H, s), 8.50 (1H, s)
151	1.32 (18H, s), 3.64 (2H, d), 5.16 (2H, m), 6.03 (1H, m), 7.39 (3H, m), 7.47 (1H, t), 8.50 (2H, br)
152	1.36 (6H, d), 2.20 (3H, s), 3.60 (2H, d), 4.58 (1H, m), 5.15 (2H, m), 6.02 (1H, m), 6.81 (1H, d), 7.35 (3H, m), 8.42 (2H, br)
153	1.26 (3H, t), 1.32 (9H, s), 3.64 (2H, q), 4.72 (2H, s), 7.34 (1H, d), 7.40 (2H, m), 7.47 (2H, m), 8.50 (1H, d), 8.70 (1H, s)
157	1.35 (9H, s), 3.71 (2H, d), 5.25 (2H, m), 5.98 (1H, m), 7.45 (2H, d), 7.53 (2H, d), 7.71 (1H, s), 8.59 (1H, br)
158	1.61 (4H, m), 1.77 (2H, m), 2.07 (2H, m), 3.63 (1H, m), 3.98 (3H, s), 7.27 (2H, d), 7.32 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.22 (1H, d), 8.31 (1H, s)
159	1.98 (3H, d), 6.48 (1H, m), 6.77 (1H, d), 7.09 (2H, m), 7.31 (1H, d), 7.55 (2H, m), 8.39 (1H, d), 8.76 (1H, s)
160	1.98 (3H, d), 6.48 (1H, m), 6.78 (1H, d), 7.24 (2H, d), 7.32 (1H, d), 7.60 (2H, d), 8.40 (1H, d), 8.77 (1H, s)
28	1.33 (9H, s), 3.68 (2H, d), 5.11-5.15 (2H, m), 5.86-5.91 (1H, m), 7.33 (1H, d), 7.39- 7.41 (2H, m), 7.53 (2H, d), 8.38 (1H, d), 8.54 (1H, s)
45	1.33 (9H, s), 4.92 (2H, d), 7.39 (1H, br), 7.41 (2H, d), 7.48 (2H, d), 8.55 (1H, br), 8.72 (1H, br)
47	1.34 (9H, s), 2.07 (3H, s), 3.88 (2H, s), 7.38 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.51 (2H, , d), 8.48 (1H, d), 8.57 (1H, s)

No.	1H-NMR δ 값 ppm 측정 기구 : JEOL-ECX(500 MHz), 용 배 : CDCl ₃
48	1.33 (9H, s), 2.47 (3H, s), 3.96 (2H, s), 7.37 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.49 (2H, d), 8.49 (1H, d), 8.60 (1H, s)
49	1.34 (9H, s), 2.33 (6H, s), 3.66 (2H, s), 7.37 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.50 (2H, d), 8.48 (1H, d), 8.64 (1H, s)
50	1.34 (9H, s), 7.44 (2H, d), 7.49 (1H, d), 7.54 (2H, d), 8.76 (1H, d), 9.11 (1H, s), 10.64 (1H, s)
54	1.35 (9H, s), 3.09(3H, d), 7.41-7.50 (5H, m), 8.66 (1H, br), 9.22 (1H, br)
56	1.33 (9H, s), 2.40 (3H, s), 7.39-7.47 (5H, m), 8.44 (1H, s), 8.47 (1H, d)
124	1.88 (3H, s), 1.92 (3H, s), 4.01 (3H, s), 6.26 (1H, s), 7.22 (2H, d), 7.36 (1H, s), 7.51 (2H, d), 8.23-8.41 (2H, br)
125	1.30 (9H, s), 4.00 (3H, s), 7.37 (2H, d), 7.48 (2H, d)
176	1.53 (3H, t), 4.23 (2H, q), 7.35 (1H, d), 7.64 (4H, m), 8.23 (1H, d), 8.34 (1H, s)
179	1.51 (3H, t), 2.36 (3H, s), 4.23 (2H, q), 7.17 (2H, d), 7.33 (1H, d), 7.44 (2H, d), 8.22 (1H, s), 8.30 (1H, s)
180	1.51 (3H, t), 4.24 (2H, q), 7.07 (2H, m), 7.34 (1H, s), 7.55 (2H, m), 8.23 (1H, s), 8.33 (1H, s)
184	1.11 (3H, t), 1.90 (2H, sext), 4.12 (2H, t), 7.17 (2H, d), 7.33 (1H, d), 7.44 (2H, d), 8.21 (1H, s), 8.30 (1H, s)
186	1.11 (3H, t), 1.38 (9H, s), 1.90 (2H, sext), 4.13 (2H, t), 6.98 (2H, d), 7.32 (1H, d), 7.46 (2H, d), 8.22 (1H, s), 8.30 (1H, s)
188	1.11 (3H, t), 1.89 (2H, sext), 4.13 (2H, t), 7.35 (1H, d), 7.64 (4H, m), 8.24 (1H, s), 8.34 (1H, s)
189	1.10 (3H, t), 1.91 (2H, sext), 4.13 (2H, t), 7.22 (2H, d), 7.34 (1H, d), 7.58 (2H, d), 8.22 (1H, s), 8.33 (1H, s)
191	1.11 (t, 3H), 1.90 (2H, sext), 4.13 (2H, t), 7.06 (2H, m), 7.32 (1H, d), 7.54 (2H, m), 8.22 (1H, s), 8.32 (1H, s)
193	1.38 (9H, s), 3.49 (3H, s), 4.68 (2H, s), 6.99 (2H, d), 7.36 (1H, s), 7.46 (2H, d), 8.61 (2H, br)
195	3.50 (3H, s), 4.69 (2H, s), 7.40 (1H, d), 7.66 (4H, m), 8.57 (1H, d), 8.73 (1H, s)
196	3.49 (3H, s), 4.68 (2H, s), 7.24 (2H, d), 7.26 (1H, s), 7.59 (2H, d), 8.60 (1H, s), 8.76 (1H, s)
197	3.50 (3H, s), 4.68 (2H, s), 7.40 (1H, s), 7.60 (2H, d), 7.66 (2H, d), 8.61 (2H, br)
198	2.39 (3H, s), 3.48 (3H, s), 4.69 (2H, s), 7.19 (2H, d), 7.36 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.53 (1H, s), 8.70 (1H, s)

No.	1H-NMR δ 값 ppm 측정 기구 : JEOL-ECX(500 MHz), 용매 : CDCl ₃
199	3.49 (3H, s), 4.68 (2H, s), 7.09 (2H, m), 7.36 (1H, d), 7.54 (2H, m), 8.54 (1H, d), 8.70 (1H, s)
201	1.29 (3H, t), 1.38 (9H, s), 3.65 (2H, q), 4.73 (2H, s), 7.00 (2H, d), 7.35 (1H, br), 7.45 (2H, d), 8.53 (1H, br), 8.73 (1H, br)
203	1.29 (3H, t), 3.65 (2H, q), 4.72 (2H, s), 7.38 (1H, d), 7.65 (4H, s), 8.35 (1H, d), 8.72 (1H, s)
204	1.28 (3H, t), 3.65 (2H, q), 4.71 (2H, s), 7.24 (2H, d), 7.36 (1H, d), 7.57 (2H, d), 8.54 (1H, d), 8.72 (1H, s)
205	1.29 (1H, t), 3.65 (2H, q), 4.71 (2H, s), 7.25 (1H, s), 7.58 (2H, d), 7.67 (2H, d), 8.55 (1H, d), 8.73 (1H, s)
206	1.28 (3H, t), 2.39 (3H, s), 3.65 (2H, q), 4.73 (2H, s), 7.19 (2H, d), 7.36 (1H, d), 7.44 (2H, d), 8.35 (1H, br), 8.72 (1H, br)
207	1.28 (3H, t), 3.65 (2H, q), 4.72 (2H, s), 7.06-7.11 (2H, m), 7.36 (1H, d), 7.51-7.55 (2H, m), 8.53 (1H, br), 8.72 (1H, br)
209	0.96 (3H, t), 1.33 (9H, s), 1.67 (2H, m), 3.54 (2H, t), 4.72 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.41 (2H, d), 7.47 (2H, d), 8.52 (1H, br), 8.73 (1H, br)
211	1.33 (9H, s), 1.38 (3H, t), 3.08 (2H, q), 7.32 (1H, d), 7.40 (2H, d), 7.52 (2H, d), 8.37 (1H, d), 8.52 (1H, s)
213	1.35 (9H, s), 7.33-7.36 (1H, m), 7.45 (1H, d), 7.49 (1H, d), 7.60 (1H, d), 7.63 (1H, d), 8.77 (1H, d), 9.31 (1H, s)
214	1.40 (9H, s), 7.01 (2H, d), 7.53-7.56 (3H, m), 8.75 (1H, d), 9.30 (1H, s)
215	0.98 (3H, t), 1.31 (3H, d), 1.60-1.69 (1H, m), 1.72-1.79 (1H, m), 4.34-4.40 (1H, m), 6.89 (2H, d), 7.53-7.57 (3H, m), 8.73 (1H, d), 9.29 (1H, s)
219	1.34 (9H, s), 4.25 (2H, br), 7.20 (1H, d), 7.29-7.32 (1H, m), 7.35-7.37 (1H, m), 7.41-7.43 (1H, m), 7.55-7.56 (1H, m), 7.97 (1H, d), 8.16 (1H, s)
220	1.38 (9H, s), 4.23 (2H, br), 6.99 (2H, d), 7.17 (1H, d), 7.45 (2H, d), 7.96 (1H, d), 8.15 (1H, s)
224	1.33 (3H, t), 2.83 (3H, s), 3.22 (2H, q), 4.39 (1H, br), 7.16-7.19 (3H, m), 7.42 (2H, d), 7.92 (1H, d), 8.05 (1H, s)
226	1.34 (9H, s), 1.34 (3H, t), 3.32 (2H, q), 4.41 (1H, br), 7.19 (1H, d), 7.30-7.36 (3H, m), 7.41-7.43 (1H, m), 7.93 (1H, d), 8.09 (1H, s)
240	1.24 (3H, t), 1.32 (9H, s), 2.97 (3H, s), 4.11 (2H, q), 7.28 (1H, d), 7.38 (2H, d), 7.47 (2H, d), 8.07 (1H, d), 8.24 (1H, s)
241	1.32 (3H, t), 1.34 (9H, s), 2.86 (2H, q), 7.33 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.49 (2H, d), 8.43 (1H, d), 8.50 (1H, s)
245	1.34 (6H, d), 3.46 (3H, s), 4.60 (1H, m), 4.68 (2H, s), 7.15 (2H, m), 7.44 (1H, d), 7.65 (1H, d), 8.28 (1H, d), 8.53 (1H, br), 8.70 (1H, br)
250	1.25 (3H, t), 1.33 (6H, d), 3.62 (2H, q), 4.58 (1H, m), 4.73 (2H, s), 7.13 (1H, m), 7.37 (1H, d), 7.43 (1H, d), 8.27 (1H, d), 8.50 (1H, br), 8.70 (1H, br)

[0348]

No.	1H-NMR δ 값 ppm 측정 기구 : JEOL-ECX(500 MHz), 용매 : CDCl ₃
253	1.43 (3H, t), 4.07 (3H, s), 4.08 (2H, q), 7.14 (1H, m), 7.36 (1H, d), 7.48 (1H, d), 8.22-8.31 (3H, m)
255	1.35 (6H, d), 3.99 (3H, s), 4.59 (1H, m), 7.13 (1H, m), 7.36 (1H, d), 7.48 (1H, d), 8.22 (1H, br), 8.27 (1H, d), 8.32 (1H, br)

[0349]

표 3

No.	1H-NMR δ 값 ppm 측정 기구 : JEOL-ECX(500 MHz), 용매 : DMSO-d ₆
156	0.90 (3H, t), 1.28 (9H, s), 1.68 (2H, m), 4.95 (1H, m), 5.47 (1H, d), 7.50 (5H, m), 8.29 (1H, br), 8.64 (1H, br)
305	1.29 (12H, m), 2.96 (2H, q), 7.53 (2H, d), 7.62 (2H, d), 8.09 (1H, br), 8.60-9.20 (2H, br)

[0350]

[0351] 실험예 1

[0352] 벼멸구에 대한 효과 관찰 실험

모(rice seedling)들을 대상으로, 본 발명의 화합물 각각의 농도가 200ppm이 되도록 함유하도록 제조된 약액을 사용하여 침지 처리를 수행하였다. 약액을 공기 건조한 후, 모들을 시험관에 담고 이 모의 뿌리 부분을 젖은 흡착 면으로 감쌌다. 약 10마리의 2 ~ 3령(instar) 벼멸구 유충들을 시험관에 방출한 후, 시험관 입구를 거즈로 덮었다. 이 시험관을 25°C의 항온실 내에 집어넣고 조명을 비추었다. 유충을 시험관에 방출한 지 5일 경과시, 각각의 벼멸구 성충이 살아있는지 아니면 죽었는지 여부를 살폈다. 다음과 같은 계산식에 의해 사충률(%)을 측정하였다. 결과적으로, 화합물 1, 7, 8, 9, 10, 14, 15, 17, 19, 21, 22, 26, 27, 28, 30, 31, 32, 33, 35, 36, 39, 46, 53, 63, 65, 67, 68, 69, 70, 71, 75, 79, 98, 99, 100, 101, 105, 107, 111, 112, 113, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 134, 136, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 151, 152, 153, 154, 155, 156, 157, 159, 160, 162, 163, 165, 167, 171, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 184, 185, 186, 187, 188, 189, 190, 191, 192, 193, 197, 198, 199, 200, 201, 209, 211, 212, 224, 225, 226, 240, 241, 253, 285, 286, 287 및 305는 사충률을 90% 이상 보였다.

$$\text{사충률(%)} = ((\text{사멸한 곤충의 수}) / (\text{방출한 곤충의 수})) \times 100$$

[0355] 실험예 2

[0356] 담배 가루 이에 대한 효과 관찰 실험

핸드 스프레이(handspray)를 사용하여, 본 발명의 화합물 각각의 농도가 200ppm이 되도록 함유하도록 제조된 약액을 화분에 심어진 오이 유식물(1 ~ 2령 담배 가루 이 유충이 기생하고 있음)에 살포하였다. 약액을 공기 건조한 후, 상기 화분에 심어진 오이 유식물을 25°C의 항온실에 넣은 후 조명을 비추었다. 처리 후 10일 경과시 노령 유충의 수를 계수한 다음, 다음과 같은 계산식을 이용하여 방제가(preventive value)를 구하였다. 결과적으로, 화합물 1, 7, 9, 10, 12, 15, 17, 19, 20, 21, 22, 26, 27, 28, 31, 32, 33, 35, 36, 39, 46, 47, 49, 51, 52, 53, 56, 58, 61, 63, 65, 67, 68, 69, 70, 71, 75, 79, 88, 100, 101, 105, 107, 109, 111, 112, 113, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 124, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 135, 136, 138, 139, 140, 141, 143, 144, 149, 150, 151, 152, 153, 154, 155, 156, 157, 160, 162, 163, 165, 166, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 185, 186, 187, 188, 189, 190, 191, 192, 193, 197, 199, 200, 201, 203, 204, 206, 207, 209, 211, 212, 224, 225, 226, 240, 241, 253, 255, 285, 286, 287 및 305는 방제가를 90 이상 보였다.

$$\text{방제가} = (1 - (Ta \times Cb) / (Tb \times Ca)) \times 100$$

[0359] Ta: 처리 후 계수된, 처리 오이 유식물 중 노령 유충의 수

[0360] Tb: 처리 전 계수된, 처리 오이 유식물 중 1 ~ 2령 유충의 수

[0361] Ca: 처리 후 계수된, 미처리 오이 유식물 중 노령 유충의 수

[0362] Cb: 처리 전 계수된, 미처리 오이 유식물 중 1 ~ 2령 유충의 수

[0363] 실험예 3

[0364] 해마피살리스 룽기코르니스에 대한 효과 관찰 실험

[0365] 본 발명의 화합물 각각의 농도가 100ppm이 되도록 함유하도록 제조된 용액을 플라스틱 바이알에 처리하였다. 약액을 공기 건조한 후, 20마리의 어린 진드기들을 상기 바이알에 투입하였다. 이 바이알을, 온도 25°C 및 상대습도 80 ~ 100%인 상암 조건에 방치하여 두었다. 약제와 접촉시킨 지 24시간 경과시, 사멸한 진드기의 수를 기록하였다. 다음과 같은 계산식을 사용하여 사충률(%)을 구하였다. 결과적으로 화합물 7, 15, 17, 65, 67, 68, 69, 75, 79, 99, 100, 109, 140, 159, 160, 179, 191, 196, 203, 204, 206 및 207은 사충률을 90% 이상 보였다.

$$\text{사충률(%)} = ((\text{사멸한 참 진드기의 수}) / (\text{모든 참 진드기의 수})) \times 100$$

[0366] 이하, 제제예가 제시되어 있다.

[0367] 제제예 1

[0368] (1) 본 발명의 화합물 20 중량 부

[0369] (2) 점토 70 중량 부

[0370] (3) 화이트 카본 5 중량 부

[0371] (4) 폴리카복실산나트륨 3 중량 부

[0372] (5) 알킬나프탈렌설폰산나트륨 2 중량 부

[0373] 상기 성분들을 고르게 혼합하여 습윤성 분말을 만든다.

[0374] 제제예 2

[0375] (1) 본 발명의 화합물 5 중량 부

[0376] (2) 활석 60 중량 부

[0377] (3) 탄산칼슘 34.5 중량 부

[0378] (4) 유동 파라핀 0.5 중량 부

[0379] 상기 성분들을 고르게 혼합하여 분체를 만든다.

[0380] 제제예 3

[0381] (1) 본 발명의 화합물 20 중량 부

[0382] (2) N,N-디메틸아세타미드 20 중량 부

[0383] (3) 폴리옥시에틸렌 트리스티릴페닐 에테르 10 중량 부

[0384] (4) 도데실벤젠설폰산칼슘 2 중량 부

[0385] (5) 자일렌 48 중량 부

[0386] 상기 성분들을 고르게 혼합하여 용해시켜 유제를 만든다.

[0387] 제제예 4

[0388] (1) 점토 68 중량 부

[0389] (2) 리그닌설폰산나트륨 2 중량 부

[0390] (3) 폴리황산옥시에틸렌 알킬아릴 5 중량 부

[0391] (4) 화이트 카본 25 중량 부

[0392] 상기 성분들의 혼합물을 본 발명의 화합물과 중량비 4:1이 되도록 혼합하여 수화제를 만든다.

[0393] 제제예 5

[0394] (1) 본 발명의 화합물 50 중량 부

- [0396] (2) 포름알데히드와 축합된 알킬나프탈렌설판산나트륨 2 중량 부
- [0397] (3) 실리콘 오일 0.2 중량 부
- [0398] (4) 물 47.8 중량 부
- [0399] 상기 성분들을 고르게 혼합하여 분쇄함으로써 원액으로 만든다.
- [0400] 다시 여기에
- [0401] (5) 폴리카복실산나트륨 5 중량 부
- [0402] (6) 무수 황산나트륨 42.8 중량 부
- [0403] 를 첨가하여 고르게 혼합한다. 이 혼합물을 입자로 만든 후 건조하여 과립 수화제를 만든다.
- [0404] 제제예 6
- [0405] (1) 본 발명의 화합물 5 중량 부
- [0406] (2) 폴리옥시에틸렌 옥틸페닐 에테르 1 중량 부
- [0407] (3) 폴리인산옥시에틸렌 알킬 에테르 0.1 중량 부
- [0408] (4) 입상 탄산칼슘 93.9 중량 부
- [0409] 상기 (1) ~ (3)을 미리 고르게 혼합하고나서, 이 혼합물을 적당 량의 아세톤으로 희석한다. 그 다음, 희석된 혼합물을 (4) 위에 분사하고, 아세톤을 제거하여 입제를 만든다.
- [0410] 제제예 7
- [0411] (1) 본 발명의 화합물 2.5 중량 부
- [0412] (2) N,N-디메틸아세타미드 2.5 중량 부
- [0413] (3) 대두유 95.0 중량 부
- [0414] 상기 성분들을 고르게 혼합한 후 용해하여, 미량 산포제를 만든다.
- [0415] 제제예 8
- [0416] (1) 본 발명의 화합물 10 중량 부
- [0417] (2) 디에틸렌 글리콜 모노에틸 에테르 80 중량 부
- [0418] (3) 폴리옥시에틸렌 알킬 에테르 10 중량 부
- [0419] 상기 성분들을 고르게 혼합하여 액체를 만든다.
- [0420] 지금까지 본 발명은 특정 구체예들을 참고로 하여 상세히 기술되었는데, 다양한 변화와 변형이 본 발명의 사상과 범위를 벗어나지 않고 가하여질 수 있음은 당 업자에게 분명할 것이다. 본원에 인용된 모든 참고 문헌들은 전체로서 인용되어 있는 것이다. 본 출원은, 전체 내용이 본원에 참고 문헌으로서 인용되어 있는, 일본 특허 출원 제2012-280207호(2012년 12월 21일 출원), 일본 특허 출원 제2013-162860호(2013년 8월 6일 출원) 및 일본 특허 출원 제2013-212795호(2013년 10월 10일)를 기반으로 한다.