

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 등록특허공보(B1)

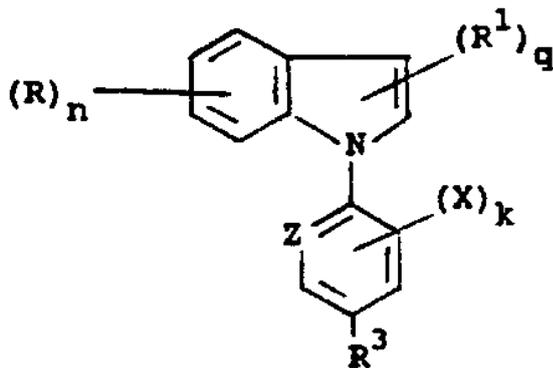
(51) Int. Cl. <sup>6</sup> C07D 401/02 C07D 209/04	(45) 공고일자 (11) 등록번호 (24) 등록일자	2000년11월01일 10-0269399 2000년07월20일
(21) 출원번호 (22) 출원일자 번역문제출일자 (86) 국제출원번호 (86) 국제출원일자 (81) 지정국	10-1994-0702504 1994년07월21일 1994년07월21일 PCT/US 93/00501 1993년01월21일 AP ARIPO특허 : 말라위 수단 EA EURASIAN특허 : 러시아 EP 유럽특허 : 핀란드 국내특허 : 오스트레일리아 바베이도스 불가리아 브라질 캐나다 체코 헝가리 일본 북한 대한민국 스리랑카 마다가스카르 몽골 노르웨이 뉴질랜드 폴란드 루마니아 슬로바키아 우크라이나 미국	(65) 공개번호 (43) 공개일자 (87) 국제공개번호 (87) 국제공개일자
(30) 우선권주장	07/823.635 1992년01월22일 미국(US) 07/987.854 1992년12월09일 미국(US) 07/991.617 1992년12월31일 미국(US)	
(73) 특허권자	제네카 리미티드 사라 엔 람베쓰	
(72) 발명자	영국 런던 에스더블유1피 3제이에프 말뱅크 9 임페리얼 케미칼 하우스 페렌크 엠. 팔로스 미합중국 캘리포니아주 94595 월넛 크릭 트윈 픽스 드라이브 136 크리스토퍼 제이. 매튜스	
(74) 대리인	미합중국 캘리포니아주 94133 샌프란시스코 그린위치 스트리트 1040 박종길	

심사관 : 유인경

(54) N-아릴인돌 및 이를 이용한 제초제 조성물

요약

본 발명은 치환된 N-아릴인돌, 이들의 제조방법 및 이들을 이용한 제초제에 관한 것이다. 특히, 본 발명은 다음 식의 치환된 N-아릴인돌과 농업적으로 허용되는 그 염에 관한 것이다:



상기 식에서, R은 수소; 할로겐; 니트로; 시아노; 알킬; 알콕시; 알케닐옥시; 알킬닐옥시; 알콕시알킬; 카르보닐알콕시; 알킬옥시알콕시; 시아노알콕시; 벤질옥시; 알콕시카르보닐알콕시; 알킬카르보닐알콕시; 할로알킬; 히드록시알킬; 포르밀; 아지도; 카르복시 또는 그 염; 아미노; 치환된 아미노-여기서 치환체는 알킬, 알콕시, 히드록시, 포르밀, 알킬카르보닐, 카르복시 또는 알콕시카르복시로 치환된 알킬카르보닐, 알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 아미노카르보닐, (디)알킬아미노카르보닐, 알콕시카르보닐, 알콕시알킬, 히드록시카르보닐알킬, 알콕시카르보닐알킬, 아미노 및 (디)알킬 아미노로부터 선택된 최소한 하나임-; 카르복시아미도; 치환된 카르복시아미도-여기서 치환체는 알킬, 알킬술포닐 및 할로알킬술포닐에서 선택된 최소한 하나임-; 술폰아미도-여기서 N은 수소 및/또는 알킬로 치환됨-; 또는 YR<sup>4</sup>-여기서 Y는 O 또는 S(O)<sub>m</sub> 이고, R<sup>4</sup>는 수소, 알킬, 할로알킬, 시아노알킬, 알콕시카르보닐알킬, 히드록시카르보닐알킬 및 아미노카르보닐알킬로서 그중 N은 수소 및/또는 알킬로 치환되는 군에서 선택됨-이고; n은 0~4이고; m은 0~2이고; R<sup>1</sup>

은 0~4이고; m은 0~20이고; R<sup>1</sup>은 수소, 알킬, 할로겐, 시아노, 할로알킬, 알콕시 및 카르복시와 그 염 또는 에스테르이고; q는 0~20이고; X는 수소, 할로겐, 시아노, 니트로, 알킬티오, 알킬술피닐, 알킬술포닐 및 알콕시이고; k는 0~20이고; Z는 N 또는 C-R<sup>2</sup>-여기서 R<sup>2</sup>는 수소, 할로겐, 할로알킬, 시아노, 니트로, 알킬티오, 알킬술피닐, 알킬술포닐 또는 알콕시임-이고, R<sup>3</sup>는 수소, 할로알킬, 할로알콕시, 시아노, 할로겐 또는 SO<sub>y</sub>R<sup>5</sup>-여기서 R<sup>5</sup>는 알킬 또는 할로알킬이고, y는 0, 1 또는 2임-이다.

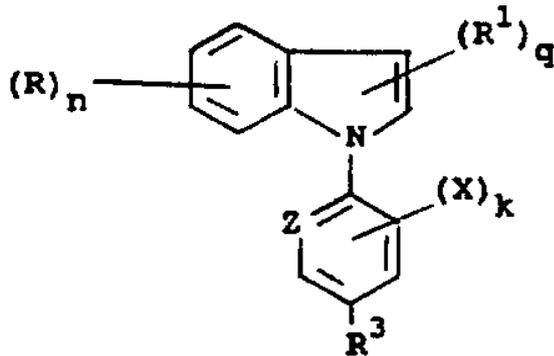
## 명세서

### [발명의 명칭]

N-아릴인돌 및 이를 이용한 제초제 조성물

### [기술분야 및 발명의 개시]

본 발명은 치환된 N-아릴인돌, 이들의 제조방법 및 이들을 이용한 제초제에 관한 것이다. 특히, 본 발명은 다음 식의 치환된 N-아릴인돌과 농업적으로 허용되는 그 염에 관한 것이다:



상기 식에서, R은 수소; 할로겐; 니트로; 시아노; 알킬; 알콕시; 알케닐옥시; 알킬닐옥시; 알콕시알킬; 카르보닐알콕시; 알킬옥시알콕시; 시아노알콕시; 벤질옥시; 알콕시카르보닐알콕시; 알킬카르보닐알콕시; 할로알킬; 히드록시알킬; 포르밀; 아지도; 카르복시 또는 그 염; 아미노; 치환된 아미노-여기서 치환체는 알킬, 알콕시, 히드록시, 포르밀, 알킬카르보닐, 카르복시 또는 알콕시카르복시로 치환된 알킬카르보닐, 알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 아미노카르보닐, (디)알킬아미노카르보닐, 알콕시카르보닐, 알콕시알킬, 히드록시카르보닐알킬, 알콕시카르보닐알킬, 아미노 및 (디)알킬 아미노로부터 선택된 최소한 하나임-; 카르복시아미도; 치환된 카르복시아미도-여기서 치환체는 알킬, 알킬술포닐 및 할로알킬술포닐에서 선택된 최소한 하나임-; 술폰아미도-여기서 N은 수소 및/또는 알킬로 치환됨-; 또는 YR<sup>4</sup>-여기서 Y는 O 또는 S(O)<sub>m</sub>

이고, R<sup>4</sup>는 수소, 알킬, 할로알킬, 시아노알킬, 알콕시카르보닐알킬, 히드록시카르보닐알킬 및 아미노카르보닐알킬로서 그중 N은 수소 및/또는 알킬로 치환되는 군에서 선택됨-이고; n은 0~4이고; m은 0~20이고; R<sup>1</sup>은 수소, 알킬, 할로겐, 시아노, 할로알킬, 알콕시 및 카르복시와 그 염 또는 에스테르이고; q는 0~20이고; X는 수소, 할로겐, 시아노, 니트로, 알킬티오, 알킬술피닐, 알킬술포닐 및 알콕시이고; k는 0~20이고; Z는 N 또는 C-R<sup>2</sup>-여기서 R<sup>2</sup>는 수소, 할로겐, 할로알킬, 시아노, 니트로, 알킬티오, 알킬술피닐, 알킬술포닐 또는 알콕시임-이고, R<sup>3</sup>는 수소, 할로알킬, 할로알콕시, 시아노, 할로겐 또는 SO<sub>y</sub>R<sup>5</sup>-여기서 R<sup>5</sup>는 알킬 또는 할로알킬이고, y는 0, 1 또는 2임-이다.

### [발명의 상세한 설명]

상기 식의 범위내에서 다음과 같은 특정한 실시예가 바람직하다.

R은 바람직하게는 할로겐, 니트로, 알콕시, 시아노, 저급 알킬, 저급 할로알킬, 아미노, 치환된 아미노, 술폰아미도, 알킬술폰아미도, 알킬티오, 알킬술포닐, 카르복시알콕시 및 알콕시카르보닐알콕시이다. 특히 바람직한 기(基)는 플루오로, 클로로, 메톡시, 알콕시아세톡시, 알콕시-2-프로피온옥시, 아미노, 술폰아미도, 시아노 및 니트로이다.

n은 바람직하게는 1 또는 2이다.

R<sup>1</sup>은 바람직하게는 수소, 메틸, 할로겐 및 시아노이다. 더욱 바람직하게는 R<sup>1</sup>은 수소 및 할로겐이다.

X는 바람직하게는 수소, 염소 및 불소이다.

Z는 바람직하게는 N, C-H 또는 C-할로겐이다.

R<sup>3</sup>는 바람직하게는 트리플루오로메틸이다.

“알킬”과 알킬부분을 포함하는 모든 기는 직쇄, 분기쇄 및 환기 식이다. 예로서는 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, 시클로프로필, n-부틸 및 t-부틸이었다. 각 알킬부분은 1~6개의 탄소원자를 함유할 수 있다. 예를 들면, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알콕시(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알콕시, 아미노(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬카르보닐이 있다. “알콕시카르보닐알콕

시”는 1~6개의 탄소원자를 가지는 직쇄, 분기쇄 및 환식의 알킬기를 포함한다. 예로서는 에톡시아세톡시, 에톡시-2-프로피온옥시 및 메톡시-2-프로피온옥시가 있다.

상기 정의에 있어서, “할로겐”은 플루오로, 클로로, 브로모 및 요도기를 포함한다. “할로알킬”은 1개 이상의 할로겐원자로 치환된 알킬기를 말한다.

본 발명의 화합물은 발아전 및 발아후 활성제초제로서의 실용성을 가지고, 광엽이나 그라스(grass)류의 종류를 포함하는 광범위한 식물종에 대하여 유용한 것이 밝혀졌다. 다음에 설명하는 바와 같이, 일부의 화합물은 벼, 옥수수 및 콩과 같은 특정의 식물종에 대하여 선택적인 억제를 나타낸다.

따라서, 본 발명은 바람직하지 않은 식물을 억제하는 방법으로서, 식물의 억제를 요하는 곳에 이러한 식물의 발아전 또는 발아후에 여기에 기술한 바와 같은 화합물을 제초적 유효량으로 제초제에 사용하기에 적합한 불활성 희석제 또는 캐리어와 함께 투여한다.

“제초제” 및 “제초”는 여기에서는 원하지 않는 식물생장의 억제 또는 변태를 가리키는데 사용된다. 억제 및 변태는 모두 예를 들면 총량 치사, 성장저지, 낙엽, 건조, 조절, 발육저해, 분열, 자극, 고엽 및 발육방해 등과 같은 자연적인 성장으로부터의 모든 변형을 포함한다. “제초적 유효량”은 원하지 않는 식물 자체에 또는 이들 식물이 성장하는 영역에 투여하였을 때 이러한 억제 또는 변태가 이루어지는 임의의 양을 나타내는데 사용된다. “식물”은 발아된 종자, 발아후의 묘목 및 정착된 식물을 포함하며, 뿌리와 지상부분을 모두 포함한다. “농업적으로 허용되는 염”은 나트륨, 칼륨, 칼슘, 암모늄 및 마그네슘 염을 나타낸다.

본 발명의 화합물은 다음의 절차에 의해 제조된다.

#### [일반적인 제조방법]

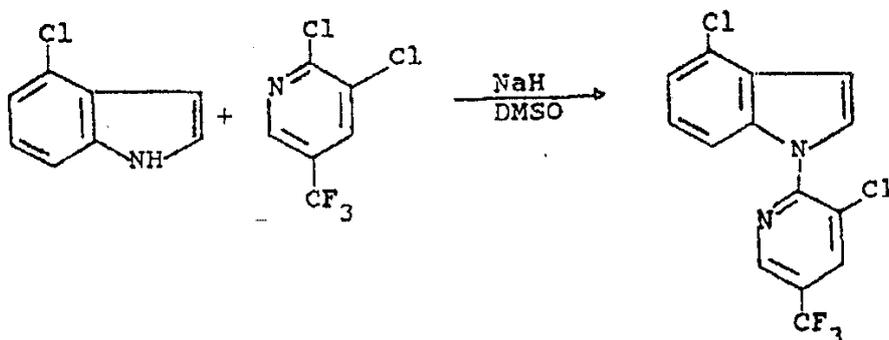
본 발명의 개시물질로서의 아릴화되지 않은 인돌은 일반적으로 새로운 것이 아니고, 일반적으로 이 기술 분야에 숙련된 자에게 잘 알려진 방법에 의해 제조되거나, 또는 구입할 수도 있다. 인돌은 수소화나트륨, 수산화칼륨 및 수산화나트륨 등의 염기 존재하에서 질소상에서 적절한 할로아릴 또는 할로-헤테로아릴기와 함께 아릴화될 수 있다. 신규의 아릴화된 인돌의 한 그룹은 문헌(Organic Synthesis Collective, Vol. VII, pg. 34, A.D. Batcho와 W. Leimgruber)에 기재된 바와 유사한 방법에 의해 적절한 2-메틸니트로벤젠을 개시물질로 이용하여 제조될 수 있다.

다음의 예는 본 발명의 대표적인 화합물의 합성을 나타낸다.

#### [예 1]

[1-(3'-클로로-5'-트리플루오로메틸-피리딘-2'-)-4-클로로인돌]

[표 1에서의 화합물 34]



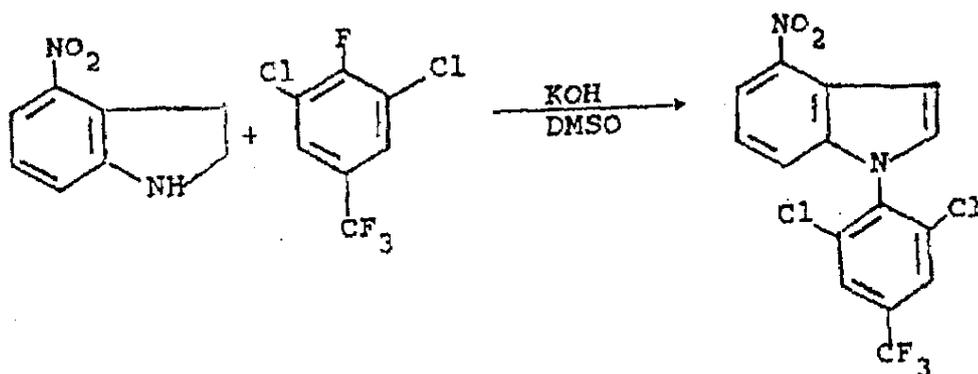
디메틸술폰 20.2ml 및 오일에서의 80% 수소화나트륨 현탁액 0.25g(8.3밀리몰[mmol])의 혼합물을 실온에서 교반하였다. 이 혼합물에 4-클로로인돌 1.0g(6.6mmol)을 가하고, 실온에서 30분동안 계속 교반하였다. 2,3-디클로로-5-트리플루오로메틸 피리딘 1.4g(6.6mmol)을 천천히 가하고, 약간 발열반응이 진행되었다. 혼합물을 실온에서 2시간동안 교반하였다.

메탄올(2.0ml)을 가하고, 5분동안 교반하였다. 그 후, 물과 염화메틸렌을 가하였다. 유기상을 분리하고, 물로 세척하고, 무수 황산마그네슘상에서 건조시키고, 진공하에서 스트립핑하여, 호박색 반고체 1.4g을 회수하였다. 그 구조는 적외스펙트로스코피, 질량스펙트로메트리 및 핵자기공명스펙트로스코피에 의해 확인하였다.

#### [예 2]

[1-[2',6'-디클로로-4'-트리플루오로메틸페닐]-4-니트로인돌]

[표 1에서의 화합물 14]



디메틸술폰 40.0ml에서의 4-니트로인돌(0.5g, 3.0mmol), 수산화칼륨 펠렛(0.7g, 12.0mmol)의 혼합물을 실온에서 30분동안 교반하였다. 그 후, 3,5-디클로로-4-플루오로벤조트리플루오라이드를 가하고, 실온에서 3시간동안 교반하였다. 물과 염화메틸렌을 가하고, 혼합물을 10분동안 교반하였다. 유기상을 분리하고, 물로 세척하고, 건조시키고, 진공하에서 스트립핑하여, 황색 고체의 원하는 생성물 1.0g을 회수하였다. 그 구조는 적외선스펙트로스코피, 질량스펙트로메트리 및 핵자기공명스펙트로스코피에 의해 확인하였다.

[예 3]

[1-[2'-클로로-6'-플루오로-4'-트리플루오로메틸페닐]-4-메톡시인돌]

[표 1에서의 화합물 18]

4-메톡시인돌(0.5g, 3.4mmol) 및 수산화나트륨(오일중에서 80% 분산, 0.1g, 3.9mmol)을 디메틸 술폰사이드(10ml)와 함께 실온에서 30분동안 교반하고, 3-클로로-4,5-디플루오로벤조트리플루오라이드(0.73g, 3.4mmol)을 가하였다. 혼합물을 실온에서 2시간동안 교반한 후, 메탄올(2ml)을 가하였다. 혼합물을 디클로로메탄과 물 사이에서 분리시켰다. 유기용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 진공내에서 여과 증발시키고, 잔류물은 플래쉬 콜럼 크로마토그래피에 의해 실리카겔상에서 더욱 정화하여, 상기 제목과 같은 화합물을 왁스상 고체(0.4g)로서 회수하였다. 그 구조는 적외선스펙트로스코피, 질량스펙트로메트리 및 핵자기공명스펙트로스코피에 의해 확인하였다.

[예 4]

[1[3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일]-6-메톡시인돌]

[표 1에서의 화합물 32]

종래의 방법(P.L. Feldman과 H. Rapoport의 방법, Synthesis 735, 1986)에 따라서 6-메톡시인돌을 제조하였다.

6-메톡시인돌(2.6g, 18mmol)과 수산화칼륨(4.0g, 72mmol)을 디메틸 술폰사이드(60ml)와 함께 실온에서 30분동안 교반한 후, 2,3-디클로로-5-트리플루오로메틸피리딘(4.0g, 18mmol)을 천천히 가하였다. 혼합물을 실온에서 4시간동안 교반한 후, 디에틸 에테르와 물 사이에서 분리시켰다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 진공내에서 여과 증발시켜서, 검은색 고체 잔류물(4.0g)을 회수하였다. 플래쉬 콜럼 크로마토그래피에 의해 실리카겔 상에서 더욱 정화하여, 상기 제목과 같은 화합물(3.0g)을 융점이 68-70°C인 연한 황색 고체로서 회수하였다.

[예 5]

[1-[3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일]-6-히드록시인돌]

[표 1에서의 화합물 64]

1-[3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일]-6-메톡시인돌(1.9g, 5.8mmol)을 디클로로메탄(50ml)에 용해시키고, 혼합물을 질소분위기하에서 -70°C로 냉각하였다. 디클로로메탄(10ml)중의 보론 트리브로마이드(1.0ml, 11mmol) 용액을 적가하고, -70°C에서 45분동안 교반한 후, 보론 트리브로마이드(0.5ml, 5.5mmol)를 더 가하였다. 혼합물을 15분동안 교반한 후, 온도를 0°C로 조정하고, 메탄올(10ml)을 가하였다. 혼합물을 30분동안 교반하고, 실온으로 올렸다. 진공내에서 용제를 제거하고, 잔류물을 디에틸에테르와 물 사이에서 분리시켰다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 감압상태에서 여과증발시켜서, 상기 제목과 같은 화합물(1.3g)을 왁스상 고체로서 회수하였다. 그 구조는 적외선스펙트로스코피, 질량스펙트로메트리 및 핵자기공명스펙트로스코피에 의해 확인하였다.

[예 6]

[메틸 2-[1-(3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일)-인돌-6-일옥시]프로피오네이트]

[표 1에서의 화합물 46]

1-[3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일]-6-히드록시인돌(2.35g, 7mmol) 및 탄산칼륨(2.4g, 17.5mmol)을 N,N-디메틸포름아미드(40ml)와 함께 15분동안 교반한 후, 메틸 2-브로모프로피오네이트(1.2g, 7mmol)를 가하였다. 혼합물을 실온에서 18시간동안 교반한 후, 디에틸 에테르와 물 사이에서 분리시켰다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 감압상태에서 여과 증발시켜

서, 상기 제목과 같은 화합물(1.4g)을 왁스상 고체로서 회수하였다. 그 구조는 적외스펙트로스코피, 질량스펙트로메트리 및 핵자기공명스펙트로스코피에 의해 확인하였다.

[예 7]

[2-[1-(3' -클로로-5' -트리플루오로메틸피리딘-2-일)-인돌-6-일옥시]프로피온산]

[표 1에서의 화합물 47]

수산화나트륨(4% 수용액, 25ml)을 이소프로판올(25ml)중의 메틸 2-[1-(3' -클로로-5' -트리플루오로메틸피리딘-2-일옥시)프로피오네이트(0.6g, 1.5mmol) 용액에 가하고, 박막 크로마토그래피에서 개시물질이 남아 있지 않을 때까지 혼합물을 교반하였다. 진공내에서 증발에 의해 이소프로판올을 제거하고, 나머지 수용액을 2N 염산 수용액으로 산성화하고, 디에틸에테르로 추출하였다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 감압상태에서 여과 증발시켜서, 상기 제목과 같은 화합물(0.5g)을 융점이 155~158°C인 연한 황색 고체로서 회수하였다. 그 구조는 적외스펙트로스코피, 질량스펙트로메트리 및 핵자기공명스펙트로스코피에 의해 확인하였다.

[예 8]

[1-[2' ,6' -디클로로-4' -트리플루오로메틸페닐]-6-메톡시인돌]

[표 1에서의 화합물 16]

6-메톡시인돌(1.0g, 6.8mmol) 및 수산화칼륨(1.5g, 27mmol)을 디메틸술폰(40ml)와 함께 실온에서 30분동안 교반한 후, 3,5-디클로로-4-플루오로벤조트리플루오라이드(1.6g, 6.8mmol)을 천천히 가하였다. 혼합물을 실온에서 17시간동안 교반한 후, 디에틸 에테르와 물 사이에서 분리시켰다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 진공내에서 여과증발시켜서, 상기 제목과 같은 화합물을 왁스상 고체(2.3g)로서 회수하였다. 그 구조는 적외스펙트로스코피, 질량스펙트로메트리 및 핵자기공명스펙트로스코피에 의해 확인하였다.

[예 9]

[에틸 2-[1-(2' ,6' -디클로로-4' -트리플루오로메틸페닐)인돌-6-일옥시]프로피오네이트]

[표 1에서의 화합물 48]

1-(2' ,6' -디클로로-4' -트리플루오로메틸페닐)-6-히드록시인돌(0.9g, 2.6mmol) 및 탄산칼륨(1.4g, 10mmol)을 N,N-디메틸포름아미드(50ml)와 함께 5분동안 교반한 후, 에틸 2-브로모프로피오네이트(0.5g, 2.6mmol)를 가하였다. 혼합물을 실온에서 18시간동안 교반한 후, 디에틸에테르와 물 사이에서 분리시켰다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 감압상태에서 여과증발시켜서, 상기 제목과 같은 화합물(1.2g)을 호박색 오일로서 회수하였다.

그 구조는 적외스펙트로스코피, 질량스펙트로메트리 및 핵자기공명 스펙트로스코피에 의해 확인하였다.

[예 10]

[2-[1-(2' -6' -디클로로-4' -트리플루오로메틸페닐)인돌-6-일옥시]프로피온산]

[표 1에서의 화합물 49]

수산화나트륨(4% 수용액, 25ml)을 이소프로판올(25ml)중의 에틸 2-[1-(2' ,6' -디클로로-4' -트리플루오로메틸페닐)인돌-6-일옥시]프로피오네이트(0.5g, 1.5mmol)용액에 가하고, 혼합물을 실온에서 10분동안 교반하였다. 진공내에서 증발에 의해 이소프로판올을 제거하고, 나머지 수용액을 2N염산수용액으로 산성화하고, 디에틸에테르로 추출하였다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 감압상태에서 여과증발시켜서, 상기 제목과 같은 화합물(0.4g)을 융점이 170~174°C인 연한 황색 고체로서 회수하였다. 그 구조는 적외스펙트로스코피, 질량스펙트로메트리 및 핵자기공명스펙트로스코피에 의해 확인하였다.

[예 11]

[1-(2' ,6' -디클로로-4' -트리플루오로메틸페닐)-6-프로파길옥시인돌]

[표 1에서의 화합물 56]

1-(2' ,6' -디클로로-4' -트리플루오로메틸페닐)-6-히드록시인돌(1.3g, 4mmol) 및 탄산칼륨(1.4g, 10mmol)을 N,N'-디메틸포름아미드(50ml)와 함께 15분동안 교반한 후, 프로파길 브로마이드(1.1g, 8mmol)를 가하였다. 혼합물을 실온에서 4시간동안 교반한 후, 디에틸에테르와 물사이에서 분리시켰다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 감압상태에서 여과증발시켰다. 잔류물을 플래쉬 컬럼 크로마토그래피에 의해 실리카겔상에서 더욱 정화하여, 상기 제목과 같은 화합물(0.8g)을 왁스상 고체로서 회수하였다. 그구조는 적외스펙트로스코피, 질량스펙트로메트리 및 핵자기공명스펙트로스코피에 의해 확인하였다.

[예 12]

[에틸 2[1-(2' ,6' -디클로로-4' -트리플루오로메틸페닐)인돌-6-일옥시]아세테이트]

[표 1에서의 화합물 54]

1-(2' ,6' -디클로로-4' -트리플루오로메틸페닐)-6-히드록시인돌(3.5g, 10mmol) 및 탄산칼륨(3.6g, 26mmol)을 N,N-디메틸포름아미드(50ml)와 함께 30분동안 교반한 후, 에틸 브로모아세테이트(1.5g, 10mmol)를 가하였다. 혼합물을 실온에서 18시간동안 교반한 후, 디에틸에테르와 물 사이에서 분리시켰다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 감압상태에서 여과증발시켜서, 상기

제목과 같은 화합물(3.0g)을 왁스상 고체로서 회수하였다. 그 구조는 적외스펙트로스코피, 질량스펙트로메트리 및 핵자기공명스펙트로스코피에 의해 확인하였다.

[예 13]

[2-[1-(2',6'-디클로로-4'-트리플루오로메틸페닐)인돌-6-일옥시]아세트산]

[표 1에서의 화합물 57]

수산화나트륨(4% 수용액, 50ml)을 이소프로판올(50ml)중의 에틸 2-[1-(2',6'-디클로로-4'-트리플루오로메틸페닐)인돌-6-일옥시]아세테이트(3.0g, 6.9mmol)용액에 가하고, 혼합물을 실온에서 5분동안 교반하였다. 진공내에서 증발에 의해 이소프로판올을 제거하고, 나머지 수용액을 2N 염산수용액으로 산성화하고, 디에틸에테르로 추출하였다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 감압상태에서 여과증발시켰다. 잔류물을 플래쉬 컬럼 크로마토그래피에 의해 실리카겔상에서 더욱 정화하여, 상기 제목과 같은 화합물(1.0g)을 용점이 120~123°C인 무색 고체로서 회수하였다. 그 구조는 적외스펙트로스코피, 질량스펙트로메트리 및 핵자기공명스펙트로스코피에 의해 확인하였다.

[예 14]

[2-[1-(2',6'-디클로로-4'-트리플루오로메틸페닐)인돌-6-일옥시]아세트아미드]

[표 1에서의 화합물 62]

옥살릴 클로라이드(0.8ml, 9mmol)를 디클로로메탄(25ml)중의 2-[1-(2',6'-디클로로-4'-트리플루오로메틸페닐)인돌-6-일옥시]아세트산(1.7g, 4mmol)과 N,N-디메틸포름아미드(1방울)의 혼합물에 가하고, 혼합물을 실온에서 18시간 동안 교반하였다. 용제를 진공내에서 증발시키고, 잔여물은 디에틸에테르에서 처리하였다. 용제를 진공내에서 증발시키고, 잔여물은 디에틸에테르에서 처리하였다. 수산화암모늄(수용액, 비중 0.898, 20ml)을 하고, 혼합물을 1시간 동안 격렬하게 교반하였다. 혼합물을 물에 부어넣고, 에틸아세테이트로 추출하였다. 유기추출물을 결합시키고, 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 감압상태에서 여과증발시켜서, 상기 제목과 같은 화합물(1.3g)을 용점이 72~75°C인 연한 황색 고체로서 회수하였다.

[예 15]

[1-(3'-디클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일)-4-시아노인돌]

[표 1에서의 화합물 61]

[스텝 1]

N,N-디메틸포름아미드 디메틸아세탈(26.3ml, 198mmol) 및 피롤리딘(6.9ml, 83mmol)을 N,N-디메틸포름아미드(200ml)중의 2-시아노-6-니트로톨루엔(10.8g, 66mmol)용액을 가하고, 혼합물을 질소분위기하에서 3시간 동안 105°C로 가열하였다. 혼합물을 실온으로 냉각하고, 물과 디에틸에테르 사이에서 분리시켰다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 감압상태에서 여과증발시켜서, 다음 단계에서 더 정화시키지 않고 사용된 진한 적색 오일(10.6g)을 회수하였다.

[스텝 2]

스텝 1에서의 생성물을 에틸아세테이트(150ml)에 용해시키고, 탄소에서의 10% 팔라듐(1.0g)을 가하였다. 혼합물을 2.76bar(40 p.s.i.)에서 2시간동안 수소분위기하에서 교반하였다. 여과에 의해 촉매를 제거한 후, 여과증발시키고, 잔류물을 플래쉬 컬럼 크로마토그래피에 의해 실리카겔상에서 더 정화하여, 4-시아노인돌(4.0g)을 용점이 115~116°C인 황색 고체로서 회수하였다.

[스텝 3]

4-시아노인돌(4.0g, 28mmol) 및 수산화칼륨(6.3g, 112mmol)을 디메틸술폰(60ml)와 함께 실온에서 10분동안 교반한 후, 2,3-디클로로-5-트리플루오로메틸피리딘(4.0g, 18mmol)을 천천히 가하였다. 혼합물을 실온에서 18시간동안 교반한 후, 디에틸에테르와 물 사이에서 분리시켰다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 진공내에서 여과증발시켜서, 황색 고체 잔류물(6.3g)을 회수하였다. 플래쉬 컬럼 크로마토그래피에 의해 실리카겔상에서 더 정화하여, 1-(3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일)-4-시아노인돌(5.3g)을 용점이 109~111°C인 연한 황색 고체로서 회수하였다.

[예 16]

[4-아미노-1-(3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일)인돌]

[표 1에서의 화합물 78]

[스텝 1]

N,N-디메틸포름아미드 디메틸 아세탈(61ml, 460mmol) 및 피롤리딘(15.9ml, 190mmol)을 N,N-디메틸포름아미드(200ml)중의 2,6-디니트로톨루엔(25.0g, 140mmol) 용액에 가하고, 혼합물을 질소분위기 하에서 30분 동안 120°C로 가열하였다. 혼합물을 실온으로 냉각하고, 물과 디에틸에테르 사이에서 분리시켰다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 감압상태에서 여과증발시켜서, 다음 단계에서 더 정화시키지 않고 사용된 진한 적색 오일(18.5g)을 회수하였다.

[스텝 2]

스텝 1에서의 생성물을 에틸아세테이트(200ml)에 용해시키고, 탄소에서의 10% 팔라듐(1.8g)을 가하였다. 혼합물을 2.76bar(40 p.s.i.)에서 1시간동안 수소분위기하에서 교반하였다. 여과에 의해 촉매를 제거한 후, 여과증발시키고, 잔류물을 플래쉬 컬럼 크로마토그래피에 의해 실리카겔상에서 더 정화하여, 4-아미노인돌(5.8g)을 암흑색 무정형고체로서 회수하였다.

## [스텝 3]

4-아미노인돌(5.8g, 44mmol) 및 수소화나트륨(광물성 오일중의 80% 분산체, 1.3g, 44mmol)을 N,N-디에틸포름아이드(60ml)와 함께 얼음수조에서 냉각하면서 5분동안 교반한 후, 2,3-디클로로-5-트리플루오로메틸피리딘(5.8g, 44mmol)을 천천히 가하였다. 혼합물을 실온에서 18시간동안 교반한 후, 소량의 메탄올을 가하였다. 혼합물을 디에틸에테르와 물 사이에서 분리시켰다. 에테르를 함유한 용액을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 진공내에서 여과증발시켜서, 암흑색 고체로서 4-아미노-1-(3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일)인돌(6.5g)을 회수하였다.

## [예 17]

[4-아세트아미도-1-(3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일)인돌]

## [표 1에서의 화합물 80]

아세트산 무수물(1.3g, 13mmol)을 디클로로메탄(50ml)중의 냉각(얼음수조)된 4-아미노-1-(3'-클로로-5'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일)인돌(2.0g, 6.4mmol) 용액에 가하고, 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. 여과에 의해 침전물을 수집하고, 헥산으로 세정하여, 상기 제목과 같은 화합물(1.5g)을 융점이 208℃인 핑크색 고체로서 회수하였다.

## [예 18]

[4-아지도-1-(3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일)인돌]

## [표 1에서의 화합물 87]

4-아미노-1-(3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일)인돌(1.7g, 5mmol)을 아세트산 수용액(100ml)에 용해시키고, 혼합물을 얼음-염 수조에서 0℃로 냉각하였다. 물(1ml)중의 질산나트륨(0.4g, 6mmol)을 적가하고, 첨가가 끝나면 혼합물을 5분동안 교반하였다. 물(1ml)중의 아조화나트륨(0.4g, 6mmol) 용액을 가하고, 1시간동안 교반하였다. 진공내에서 아세트산을 제거하고, 잔류물을 물과 디에틸에테르 사이에서 분리시켰다. 에테르를 함유한 추출물을 중탄산나트륨 포화수용액으로 세척하고, 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 감압상태에서 여과증발시켜서, 상기 제목과 같은 화합물(1.1g)을 융점이 93-95℃인 연한 브라운색 고체로서 회수하였다.

## [예 19]

[3-클로로-1-(3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일)-4-메톡시인돌]

## [표 1에서의 화합물 63]

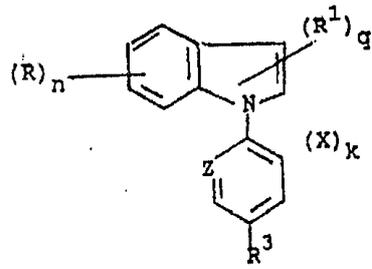
염화설퍼릴(0.4g, 3mmol)을 디에틸에테르(25ml)중의 냉각(얼음수조)된 1-(3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일)-4-메톡시인돌(1.0g, 3mmol)용액에 가하고, 첨가가 끝나면, 냉각수조를 제거하고, 혼합물을 18시간동안 교반하였다. 염화설퍼릴(0.04g, 0.3mmol)을 제거하고, 혼합물을 환류하에서 3시간동안 가열하였다. 혼합물을 냉각시키고, 물로 2회 세정하고, 황산마그네슘상에서 건조시키고, 여과하고, 진공내에서 여과증발시켰다. 플래쉬 컬럼 크로마토그래피에 의해 실리카겔상에서 더 정화하여, 상기 제목과 같은 화합물(0.6g)을 황색의 왁스상 고체로서 회수하였다. 그 구조는 적외스펙트로스코피, 질량스펙트로메트리 및 핵자기공명스펙트로스코피에 의해 확인하였다.

화합물 60으로서, 융점이 140~142℃인 1-(3'-클로로-5'-트리플루오로메틸피리딘-2-일)2,3-디클로로-4-메톡시인돌은 과잉의 염화설퍼릴을 이용하여 유사한 방법으로 제조될 수 있다.

다음의 표 1은 본 발명의 각 화합물을 나타낸 것이다.

## [표 1]

## 화합물



## 화합물

No.	R	Z	X	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	물리적 특성
1	H	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
2	5-메톡시	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	70.0-73.0°C
3	6-NO <sub>2</sub>	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
4	5-NO <sub>2</sub>	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	결정
5	5-F	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
6	5-벤질옥시	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
7	5,6-디메톡시	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	118.0-120.0°C
8	4-F	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	오일
9	6-F	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	오일
10	5-CH <sub>3</sub>	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
11	4-메톡시	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
12	4-Cl	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
13	4-CH <sub>3</sub>	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
14	4-NO <sub>2</sub>	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	125.0-130.0°C
15	6-메톡시	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
16	6-CH <sub>3</sub>	C-Cl	6-F	H	CF <sub>3</sub>	반고체

17	4-F	C-Cl	6-F	H	CF <sub>3</sub>	오일
18	4-메톡시	C-Cl	6-F	H	CF <sub>3</sub>	반고체
19	4-Cl	C-Cl	6-F	H	CF <sub>3</sub>	오일
20	6-메톡시	C-Cl	6-F	H	CF <sub>3</sub>	반고체
21	H	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
22	5-Br	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
23	5-NO <sub>2</sub>	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
24	5-메톡시	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	98.0-100.0°C
25	5-F	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
26	5-벤질옥시	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
27	4-F	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	오일
28	6-F	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	오일
29	5,6-디메톡시	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	143.0-148.0°C
30	5-CH <sub>3</sub>	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
31	4-CH <sub>3</sub>	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
32	6-메톡시	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	65.0-70.0°C
33	6-CH <sub>3</sub>	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
34	4-Cl	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
35	4-CH <sub>3</sub> COO	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
36	4-메톡시	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
37	5-벤질옥시	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	83.0-84.0°C
38	5-OCH <sub>3</sub>	C-Cl	6-Cl	2-CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	반고체
39	5-OCH <sub>3</sub>	N	3-Cl	2-CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	반고체
40	5-F	N	H	H	CF <sub>3</sub>	65.0-70.0°C
41	4-CH <sub>3</sub>	N	H	H	CF <sub>3</sub>	83.0-85.0°C
42	4-Cl	N	H	H	CF <sub>3</sub>	반고체
43	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{6-OCHC-OC}_2\text{H}_5 \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	오일
44	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{6-OCH}_2\text{-C-O-C}_2\text{H}_5 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
45	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{6-OCH}_2\text{-C-OH} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	110.0-115.0°C
46	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{6-OCHC-OCH}_3 \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
47	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{6-OCH-COH} \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	155.0-158.0°C
48	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{6-OCHC-OC}_2\text{H}_5 \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	오일

49	$\begin{array}{c} 6\text{-OCH}-\text{C}-\text{OH} \\   \quad    \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	170.0-174.0°C
50	$\begin{array}{c} 6\text{-OCHC}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\   \quad    \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	C-Cl	6-F	H	CF <sub>3</sub>	오일
51	$\begin{array}{c} 4\text{-OCHC}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\   \quad    \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
52	6-NO <sub>2</sub>	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	132.0-133.0°C
53	6-NHSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	218.0-222.0°C
54	$\begin{array}{c} 6\text{-OCH}_2-\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\    \\ \text{O} \end{array}$	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
55	$\begin{array}{c} 6\text{-OCHC}-\text{OCH}_3 \\   \quad    \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	C-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>	반고체
56	6-OCH <sub>2</sub> CCH	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	반고체
57	$\begin{array}{c} 6\text{-OCH}_2-\text{C}-\text{OH} \\    \\ \text{O} \end{array}$	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	120.0-123.0°C
58	$\begin{array}{c} 6\text{-NHC}-\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\    \quad    \\ \text{O} \quad \text{O} \end{array}$	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	113.0-120.0°C
59	$\begin{array}{c} 6\text{-NHC}-\text{N}-\text{SO}_2-\text{C}_6\text{H}_4 \\    \\ \text{O} \end{array}$	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	160.0-170.0°C
60	4-OCH <sub>3</sub>	N	3-Cl	2,3-diCl	CF <sub>3</sub>	140.0-142.0°C
61	4-CN	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	109.0-111.0°C
62	$\begin{array}{c} 6\text{-OCH}_2-\text{C}-\text{NH}_2 \\    \\ \text{O} \end{array}$	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	72.0-75.0°C
63	4-OCH <sub>3</sub>	N	3-Cl	3-Cl	CF <sub>3</sub>	반고체
64	6-OH	N	3-Cl	F	CF <sub>3</sub>	반고체
65	$\begin{array}{c} 6\text{-OCHC}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\   \quad    \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	C-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>	반고체
66	5-CN	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	93.0-95.0°C
67	5-CN	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	145.0-147.0°C
68	4-NO <sub>2</sub>	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	135.0-137.0°C
69	5-Cl	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	50.0°C
70	5-Cl	C-Cl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	95.0-96.0°C
71	$\begin{array}{c} 6\text{-NHC}-\text{CH}_2-\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\    \quad    \\ \text{O} \quad \text{O} \end{array}$	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	133.0-135.0°C
72	4-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	180.0-182.0°C
73	H	N	3-Cl	3-CN	CF <sub>3</sub>	125.0-128.0°C

74	$6\text{-OSO}_2\text{CH}_3$	N	3-C1	H	CF <sub>3</sub>	반고체
75	$4\text{-C-OCH}_3$ $\parallel$ O	N	3-C1	H	CF <sub>3</sub>	105.0-107.0°C
76	$4\text{-C-OCH}_3$ $\parallel$ O	C-C1	6-C1	H	CF <sub>3</sub>	반고체
77	$4\text{-C-OH}$ $\parallel$ O	C-C1	6-C1	H	CF <sub>3</sub>	222.0-224.0°C
78	4-NH <sub>2</sub>	N	3-C1	H	CF <sub>3</sub>	반고체
79	$4\text{-NHC-CH}_3$ $\parallel$ O	N	3-C1	H	CF <sub>3</sub>	208.0°C
80	$4\text{-N-C-CH}_3$ $\parallel$ O   CH <sub>3</sub>	N	3-C1	H	CF <sub>3</sub>	반고체
81	$4\text{-N-C-CF}_3$ $\parallel$ O   CH <sub>3</sub>	N	3-C1	H	CF <sub>3</sub>	반고체
82	4-C1	C-C1	6-C	H	CF <sub>3</sub>	오일
83	4-OCH <sub>3</sub>	C-C1	6-C	H	CF <sub>3</sub>	오일
84	4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	N	3-C1	H	CF <sub>3</sub>	80.0-82.0°C
85	4-NHCH <sub>3</sub>	N	3-C1	H	CF <sub>3</sub>	85.0°C
86	4-CF <sub>3</sub>	N	3-C1	H	CF <sub>3</sub>	오일
87	4-N <sub>3</sub>	N	3-C1	H	CF <sub>3</sub>	95-95°C
88	4-CN, 6-NH <sub>2</sub>	N	3-C1	H	CF <sub>3</sub>	190°C

## [제조 선별시험]

상기 표에 기재된 화합물을 각종 방법으로 여러 투여율에서 제조활성에 대하여 시험하였다. 이들 시험중 일부의 결과를 다음에 나타낸다. 이 기술분야에 숙련된 자이면 알 수 있는 바와 같이, 제조 선별시험에서 얻어진 결과는 용이하게 제어할 수 없는 많은 인자에 의해 영향을 받는다. 일광 및 물의 양, 토양의 타입, 토양의 pH, 온도 및 습도 등과 같은 환경조건이 이러한 인자의 예이다. 시험 결과에 영향을 미칠 수 있는 다른 인자는 재배종의 깊이 및 제조제의 투여율과, 시험되는 농작물의 성질이다. 결과는 또한 각 농작물마다 또한 농작물의 변종에서 다양하게 된다.

## [발아전 제조 선별시험]

수종의 각각 다른 잡초종의 종자를 전날 미리 처리한 상태에서 모래질흙(loam) 토양에 각 열마다 1종씩 각각의 열로 플랫의 폭에 걸쳐 심었다. 심은 그라스(grass) 잡초는 그린 폭스테일(Setaria viridis), 야생귀리(Avena fatua) 및 워터그라스(Echinochloa crusgalli)이었다. 이용된 광엽 잡초는 와일드 머스타드(Brassica kaber), 벨벳리프(Abutilon theophrasti) 및 일년생 모닝글로리(Ipomoea purpurea)이었다. 또한, 옐로 너시지(Cyperus esculentus)도 파종하였다. 충분한 종자를 심하여 발아후에 식물의 크기에 따라서 각 열당 20-40개의 묘목을 얻었다.

시험화합물 용액은 시험호합물 400mg을 주둥이가 넓은 60ml병에 넣고, 화합물을 아세톤 함유 1% TWEEN 20<sup>㉑</sup> (폴리옥시에틸렌 소르비탄 모노라우레이트 에멀전화제) 25ml에 용해시켜서 제조하였다. 화합물을 용해시키는데 필요한 경우에는 5ml를 초과하지 않는 범위에서 추가의 용제를 더 사용하였다. 용액에서 20.5ml의 양을 취하여 1% TWEEN 20<sup>㉑</sup>을 함유하는 아세톤:물 혼합물(19:1) 25ml로 희석하여 분무가능한 용액을 얻었다.

플랫을 온실에서 21-29.5°C로 하여 놓고, 분무에 의해 물을 주었다. 재배 1일 후에, 400 L/ha를 분무하도록 조정된 분무용액으로 플랫에 분무하였다. 투여율은 4.0kg/ha이었다.

그 후, 플랫을 온실로 다시 보내고, 매일 분무에 의해 물을 주었다. 처리 3주 후에 동일한 연령의 처리하지 않은 검사용 플랫에서의 동일한 종의 성장과 비교하여 억제백분율로서 잡초 억제정도를 평가 및 기록하였다.

억제백분율은 발육방해, 발아후의 식물조직의 치사, 발육저해, 기형, 백화현상 및 기타 형태의 손상을 포함하는 모든 인자로 인한 식물의 모든 손상을 나타낸다. 억제율은 0~100%로 하고, 여기서 0은 처리하지 않은 억제율과 동일하나 성장으로 아무런 영향이 없는 것을 나타내고, 100은 완전히 치사된 것을 나타내고, 대시는 그 투여량에서 시험하지 않은 것을 나타낸다.

## [발아후 제조평가]

발아전 시험에서 기술한 바와 동일하게 토양을 준비하고 종자를 심었다. 플랫을 온실에서 21-29°C로 하여 놓고, 분무에 의해 물을 주었다. 잡초종의 종자를 파종하고, 10-12일 후 처리하였다. 발아전 시험에서 제조한 것과 같은 분무용액을 사용하여 플랫에 4kg/ha의 투여율로 용액을 분무하였다.

분무 후에 플랫을 온실로 다시 보내고, 잎이 젖지 않게 하면서 매일 물을 주었다. 처리 3주 후에 동일한 연령의 처리하지 않은 검사용 플랫에서의 동일한 종의 성장과 비교하여 억제백분율로서 잡초 억제정도를

평가 및 기록하였다. 억제백분율은 발아전 평가에 대한 것과 같은 근거로 정하였다.

표 2는 이들의 시험결과로서, 발아전 및 발아후 평가에서 그라스 및 광엽 잡초에 대하여는 평균으로 나타내고, 옐로 넛지시는 별도로 기재하였다.

[표 2]

**발아전 재초활성**

무어율 - 4.0 kg/ha

약어 : AVG : 평균 그라스 잡초

AVB : 평균 광엽 잡초

YNS : 옐로 넛지시

화합물 번호	발아전			발아후		
	AVG	AVB	YNS	AVG	AVB	YNS
1	30	71	0	8	61	0
2	41	58	0	40	70	0
3	3	3	0	20	51	0
4	63	10	0	51	63	5
5	86	30	0	33	73	10
6	0	0	0	5	8	0
7	75	86	0	23	95	10
8	96	91	0	41	70	10
9	3	6	0	5	61	0

10	70	66	5	13	70	5
11	95	95	0	60	99	5
12	98	100	0	76	100	5
13	86	86	0	20	78	5
14	5	0	0	1	51	0
15	100	100	0	86	100	10
16	73	100	5	33	100	10
17	93	99	5	70	71	10
18	96	100	5	81	100	30
21	71	36	0	26	43	0
22	15	0	0	13	36	0
23	95	61	0	26	63	0
24	6	0	0	3	0	0
25	100	56	0	86	68	10
26	0	0	0	0	3	0
27	100	66	5	81	86	20
28	40	3	0	20	48	0
29	61	48	5	23	61	5
30	68	5	0	38	55	5
31	96	73	0	56	71	10
32	100	86	5	92	68	25
33	70	48	0	26	66	10
34	100	100	30	100	100	25
35	0	3	0	10	6	0
36	100	96	10	93	98	30
37	0	3	0	0	13	0
38	0	0	0	3	0	0
39	6	10	0	8	40	0
40	5	0	0	3	8	0
41	16	1	0	5	1	0
42	85	48	5	38	81	5
60	1	1	0	5	38	0
61	93	100	5	65	83	5
63	25	5	0	6	63	5
64	0	0	0	3	26	5
68	30	15	0	6	3	0
72	0	0	0	5	6	0
73	0	0	0	1	6	0
78	0	0	0	16	26	0
79	0	0	0	0	8	0
80	0	0	0	5	11	0
81	6	3	0	3	43	0
82	98	100	0	68	96	10

다음의 표 3에 있어서, 식물을 기본적으로 표 2에서의 식물과 동일하게 처리하였고, 단 플렛에는 1kg/ha의 투여율로 용액을 분무하였다. 이 표에 나타난 결과는 제초결과를 평균한 것이 아니다. 발아전 및 발아후 모두에 대하여 그라스 및 광엽 잡초를 분리하여 기재하였다. 잡초종은 다음과 같이 약어로 나타낸다. 그린 폭스테일:SET, 야생귀리:AVF, 워터그라스:ECH, 머스타드:SIN, 벨벳리프:ABT, 일년생 모닝글로리:IPOSS, 옐로 넛시지:YNS.

[표 3]

회 합 순 번	부 업	AVF	ECH	SET	ABT	IPOSS	SIN	YNS
43	지 부	60	100	100	100	85	100	20
		30	100	100	100	100	100	85
44	지 부	0	0	50	100	100	70	5
		5	100	100	100	100	100	95
45	지 부	0	10	10	60	100	70	15
		10	100	100	100	100	100	80
46	지 부	60	100	100	100	60	100	10
		85	85	100	100	100	100	65
47	지 부	30	30	100	100	50	80	5
		90	90	100	100	100	100	100
48	지 부	5	15	100	100	80	100	0
		20	60	60	100	100	100	5
49	지 부	30	10	100	100	70	100	5
		10	95	60	100	100	100	30
50	지 부	5	5	75	100	30	100	0
		100	100	100	100	100	100	75

51	전후	0 0	0 0	0 10	0 60	0 10	0 0	0 0
52	전후	5 0	5 5	50 30	20 10	0 100	5 0	0 0
53	전후	5 10	15 40	25 75	100 100	85 100	100 100	0 10
54	전후	0 10	0 60	5 70	100 100	70 100	100 100	0 40
55	전후	0 5	0 15	25 60	100 100	50 100	100 100	0 20
56	전후	0 5	0 60	60 60	100 100	100 100	100 100	0 0
57	전후	10 15	40 30	100 60	10 100	5 100	0 15	0 5
58	전후	0 5	0 100	75 100	0 90	50 100	100 100	5 25
59	전후	0 5	5 5	15 60	100 95	10 30	100 60	0 5
62	전후	0 5	0 15	50 30	100 100	100 100	100 100	0 0
65	전후	5 15	10 50	75 60	100 100	90 100	100 100	0 10
66	전후	5 10	10 30	100 70	15 100	75 100	0 15	0 5
67	전후	0 10	0 15	15 60	60 100	50 100	75 40	0 5
69	전후	5 0	10 20	100 10	0 70	10 75	0 0	0 0
70	전후	0 0	5 0	50 10	15 80	40 80	5 25	0 0
71	전후	0 0	5 25	100 85	0 100	30 100	30 100	0 10
74	전후	25 10	90 10	100 60	90 100	100 100	5 25	5 30
75	전후	0 5	0 5	5 10	10 60	0 95	10 5	0 0
76	전후	0 0	0 0	5 10	0 50	0 60	0 10	0 0
77	전후	0 0	0 0	5 0	0 0	0 5	0 0	0 0

본 발명의 화합물은 제초제로서 유용하고, 이 기술분야에 숙련된 자에게 공지된 다양한 방법으로 다양한 농도로 투여될 수 있다. 실용에 있어서, 화합물은 분산을 용이하게 하기 위하여 산업적으로 공지되었거나 사용되는 다양한 보조제 및 캐리어를 함유하는 조함물로서 투여된다. 임의의 주어진 화합물에 대한 조합 및 사용모드의 선택은 그 활성에 영향을 미칠 수 있고, 따라서 선택을 요한다. 이와 같이, 본 발명의 화합물은 과립으로서, 흡수가능한 분말로서, 에멀전화가능한 농축물로서, 분말 또는 더스트로서, 유동체로서, 용액으로서, 현탁액 또는 에멀전으로서, 또는 마이크로캡슐과 같은 제어된 방출형태로서 제조될 수 있다. 이들 조합물은 활성성분을 약 0.5중량%의 소량으로부터 95중량% 이상의 많은 양까지 함유할 수 있다. 임의의 주어진 화합물에 대한 최적량은 억제될 종자 및 식물의 성질에 따라서 다르다. 투여율은 일반적으로 약 0.01~약 10파운드/에이커로 다양하며, 바람직하게는 약 0.02~약4파운드/에이커이다.

흡수가능한 분말은 물 또는 기타 액체캐리어에서 용이하게 분산되는 미세하게 분쇄된 입자의 형태이다. 이 입자는 고체매트릭스에 유지되는 활성성분을 함유한다. 전형적인 고체매트릭스로는 백토(白土), 카올린, 실리카 및 기타 용이하게 흡수되는 유기 또는 무기고체가 있다. 흡수가능한 분말은 통상적으로 활성

성분 약 5%-약 95%와 소량의 습윤제, 분산제 또는 에멀전화제를 함유한다.

에멀전화가능한 농축물은 물 또는 다른 액체에 분산가능한 균질의 액체조성물이고, 액체 또는 고체 에멀전화제를 가지는 활성 화합물로 전부 구성되거나, 크실렌, 헤비방향족 나프타, 이소포론 및 다른 비휘발성 유기용제 등의 액체캐리어를 함유할 수 있다. 사용시에는, 이들 농축물은 물 또는 다른 액체에 분산되고, 통상적으로 처리될 영역에 분무로서 투여된다. 활성성분의 양은 농축물의 약 0.5%-약 95%의 범위일 수 있다.

과립 조합물은 사출물과 비교적 거친 입자를 모두 포함하고, 보통 식물의 액체를 요하는 곳에 희석시키지 않고 투여된다. 과립 조합물의 전형적인 캐리어로는 모래, 백토, 아타풀가이드 점토, 벤토나이트 점토, 몬모릴로라이트 점토, 질석(蛭石), 펄라이트 및 기타 활성 화합물로 코팅될 수 있거나 흡수하는 유기 또는 무기재료가 있다. 과립 조합물은 통상적으로 약 5%-약 25%의 활성성분을 함유할 수 있으며, 이들은 헤비 방향족 나프타, 케로센 및 기타 석유 분류물(分溜物), 또는 식물성 오일 등의 표면활성제 및/또는 덱스트린, 아교 또는 합성수지 등의 스티커를 함유할 수 있다.

더스트는 활석, 점토, 분말 및 기타 분산제 및 캐리어로서 작용하는 유기 또는 무기고체 등의 미세하게 분쇄된 고체를 가지는 활성성분의 유동가능한 혼합물이다.

마이크로캡슐은 전형적으로 수용된 물질을 조절된 속도로 주위로 방출시킬 수 있는 불활성의 다공성 셸(shell)내에 수용된 활성물질의 액적(液滴) 또는 과립이다. 캡슐화된 액적은 전형적으로 직경이 약 1~50 마이크로미터이다. 수용된 액체는 전형적으로 캡슐이 약 50-95중량%를 구성하고, 활성 화합물외에 용제를 함유할 수 있다. 캡슐화된 과립은 일반적으로 다공성 막이 과립의 세공(細孔)을 밀봉하고, 과립의 세공내측에 액체형태의 활성종을 함유하는 다공성 과립이다. 과립은 전형적으로 직경이 1mm~1cm, 바람직하게는 1~2mm이다. 과립은 사출, 단괴(團塊) 또는 프릴링(prilling)으로 형성되거나, 자연적으로 발생하는 것이다. 이러한 물질의 예로서는 질석, 소결된 점토, 카올린, 아타풀가이드 점토, 톱밥 및 과립 카본이 있다. 셸 또는 막 물질로는 천연 또는 합성고무, 셀룰로스 물질, 스티렌-부타디엔 공중합체, 폴리아크릴로니트릴, 폴리아크릴레이트, 폴리에스테르, 폴리아미드, 폴리우레아, 폴리우레탄 및 전분 크산토겐산염이 있다.

제조용도에 유용한 다른 조합물로는 원하는 농도로 완전히 용해되는 아세톤, 알킬화된 나프탈렌, 크실렌 및 기타 유기용제 등의 용제내의 활성성분의 단순용액을 포함한다. 또한, 프레온(Freon<sup>®</sup>) 등의 저비등의 분산성 용제캐리어의 증발의 결과로서 활성성분이 미세하게 분쇄된 형태로 분산되는 가압된 분무기로 사용될 수 있다.

이들의 조합물은 대부분 습윤제, 분산제 또는 에멀전화제를 함유한다. 그예로서는 알킬 및 알킬아릴술폰네이트 및 설페이트와 그 염, 다가(多價)알콜, 폴리에톡실화 알콜, 에스테르 및 지방 아민이 있다. 이들 시약은 통상적으로 조합물의 0.1중량%~15중량%로 포함하여 사용된다.

본 발명의 화합물은 또한 다른 제초제 및/또는 고엽제, 건조제, 성장억제제 등과 결합될 때에도 유용하다. 이들 다른 물질은 조성물내의 활성성분의 약 5%-약 95%로 포함될 수 있다. 이들 조합물은 종종 잡초를 억제하는데 보다 높은 레벨의 효과를 제공하고, 종종 각각의 제초제의 단일의 조합물로는 얻을 수 없는 결과를 제공한다.

본 발명의 화합물과 결합될 수 있는 다른 제초제, 고엽제, 건조제 및 식물생장억제제의 예는 다음과 같다.

알라클로르, 2-클로로-2',6'-디에틸-N-(메톡시메틸)아세트아닐리드, 아세토클로르, 2-클로로-N(에톡시메틸)-6'-에틸-0-아세토톨루리디드, 메톨라클로르, 2-클로로-2'-에틸-6'-에틸-N-메톡시이소프로필-2-아세트아닐리드 등의 아세트아닐리드 제초제.

2,4-D, 2,4,5-T, MCPA, PCPB, 2,4-DB, 2,4-DEB, 4-CPA, 2,4,5-TB 및 실백스 등의 클로로페녹시 제초제, 프로팜, 클로로프로팜, 스위프(sweep) 및 바반(barban) 등의 카르바메이트 제초제,

CDEC, 메탐-나트륨, EPTC, 디알레이트, PEBC 및 버놀레이트(vernalate) 등의 티오카르바메이트 및 디티오카르바메이트 제초제,

노레아, 디클로랄, 우레아, 클로록스우론, 시클우론, 핀우론, 문우론, 문우론 TCA, 디우론, 린우론, 모놀린우론, 네부론, 부투론 및 트리메투론 등의 치환된 우레아 제초제,

시마진, 클로로아진, 데스메트린, 노라진, 이파진, 프로메트린, 아트라진, 트리에타진, 시메톤, 프로메톤, 프로파진 및 아메트린 등의 대칭형 트리아진 제초제,

TCA 및 달라폰 등의 염소화 지방족산 제초제,

2,3,6-TBA, 디캄바, 트리캄바, 클로람벤, 페낙, PBA, 2-메톡시-3,6-디클로로페닐아세트산, 3-메톡시-2,6-디클로로페닐아세트산, 2-메톡시-3,5,6-트리클로로페닐아세트산 및 2,4-디클로로-3-니트로벤조산 등의 염소화벤조산 및 페닐아세트산 제초제,

아미노트리아졸, 말레인산 히드라지드, 페닐-수은 아세테이트, 엔도탈, 테크니칼 클로르단, CDCPA, 디퀴트, 에르본, DNC, DNBP, 디클로베닐, DPA, 디펜아미드, 디프로팔린, 트라플루랄린, 솔란, 디크릴, 머포스, DMPA, DSMA, MSMA, 아조화칼륨, 아크롤레인, 베네펜, 벤솔리드, AMS, 브로마실, 2(3,4-디클로로페닐)-4-메틸-1, 2,4-옥사졸리딘-3,5-디온, 브롬옥시닐, 카코디산, CMA, CPMF, 시프로미드, DCB, DCPA, 디클론, 디페나트릴, DMTT, DNAP, EBEP, EXD, HCA, 이옥시닐, IPX, 이소실, 시안산칼륨, MAA, MAMA, MCPES, MCPP, MH, 몰리네이트, NPA, OCH, 파라퀴트, PCP, 피클로람, DPA, PCA, 세손, 터바실, 터부톨, TCBA, 니트랄린, 테트라봉산나트륨, 칼슘시안아미드, S,S,S-트리부틸포스포트리티오에이트 및 프로파닐, N-포스포노메틸글리신의 이소프로필아민염, N-포스포노메틸글리신의 트리메틸술포늄염과 같은 화합물.

이들 조합물은 종래의 방법에 의해 액체를 요하는 곳에 투여될 수 있다. 더스트 및 액체조성물은 예를 들

면 동력 살포기(power duster), 붐 앤드 핸드 분무기 및 분무 살포기를 이용하여 투여될 수 있다. 이 조합물은 또한 비행기에서 더스트 또는 스프레이로서 또는 로프 위크(rope wick)에 의해 투여될 수도 있다. 발아하는 종자 또는 발아후의 묘목의 성장을 변태 또는 억제하기 위하여, 더스트 및 액체조합물을 토양에 그 표면 아래로 최소한 1/2 인치의 깊이까지 살포하거나 토양 표면에 단지 분무 또는 살포에 의해 투여할 수 있다. 이 조합물은 또한 관개수에 첨가하여 투여할 수도 있다. 이 방법에 의하면 조합물이 관개수와 함께 토양내로 침투할 수 있다. 토양의 표면에 투여되는 더스트 조성물, 과립 조성물 또는 액체조합물을 디스킹, 드래킹 또는 혼합작업 등과 같은 종래의 수단에 의해 토양의 표면 아래에 살포될 수 있다.

다음에, 전형적인 조합물의 예를 나타낸다.

**5% 더스트 : 5부 활성 화합물**

**95부 활석**

**2% 더스트 : 2부 활성 화합물**

**1부 고도로 분산된 규산**

**97부 활석**

이들 더스트는 성분들을 혼합한 후 원하는 입자크기로 분쇄함으로써 형성된다.

**5% 과립 : 5부 활성 화합물**

**0.25부 에피클로로히드린**

**0.25부 세틸 폴리글리콜 에테르**

**3.5부 폴리에틸렌 글리콜**

**91부 카울린(입자크기 0.3~0.8 mm)**

과립은 활성 화합물과 에피클로로히드린을 혼합하고, 혼합물을 6부의 아세톤에 용해시킴으로써 형성된다. 그 후, 폴리에틸렌 글리콜과 세틸 폴리글리콜 에테르를 가한다. 얻어진 용액을 카울린상에 분무하고, 진공내에서 아세톤 증발시킨다.

흡수가능한 분말 :

70% : 70부 활성 화합물

5부 디부틸나프틸술폰산 나트륨

3부 나프탈렌술폰산 / 페놀술폰산 / 포름알데히드 농축물

(3:2:1)

10부 카울린

12부 샴페인 초크 (Champagne chalk)

40% : 40부 활성 화합물

5부 리그닌술폰산 나트륨

1부 디부틸나프탈렌술폰산 나트륨

54부 규산

25% : 25부 활성 화합물

4.5부 리그닌술폰산 칼슘

1.9부 샴페인 초크 / 히드록시에틸 셀룰로스 (1:1)

1.5부 디부틸나프탈렌술폰산 나트륨

19.5부 규산

19.5부 샴페인 초크

28.1부 카울린

25% : 25부 활성 화합물

2.5부 아소옥틸페녹시-폴리에틸렌-에탄올

1.7부 샴페인 초크 / 히드록시에틸셀룰로스 (1:1)

8.3부 알루미늄 규산나트륨

16.5부 구조토

46부 카울린

10% : 10부 활성 화합물

3부 포화지방 알콜 황산의 나트륨염의 혼합물

5부 나프탈렌술폰산 / 포름알데히드 농축물

82부 카울린

이들 흡수가능한 분말은 활성 화합물과 첨가제를 적합한 믹서에서 충분히 혼합하고, 얻어진 혼합물을 밀

또는 롤러에서 분쇄한다.

에멀전화가 가능한 농축물:

**25% : 25부 활성 물질**

**2.5부 에폭시화된 식물성 오일**

**10부 알킬아릴술포네이트 / 지방 알콜 폴리글리콜 에테르**

**혼합물**

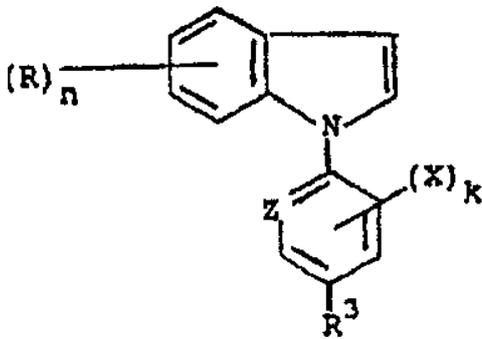
**5부 디메틸포름아미드**

**57.5부 크실렌**

**(57) 청구의 범위**

청구항 1

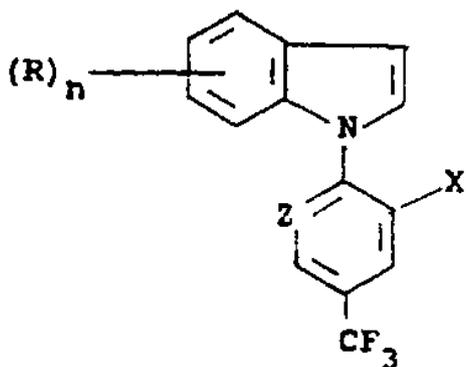
다음 식의 화합물 또는 농업적으로 허용되는 그 염:



상기 식에서, R 은 수소; 할로겐; 니트로, 시아노; (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬; (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시; (C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)알케닐옥시 ; (C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)알킬닐옥시 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시 , 알킬옥시 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시; 시아노(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시; 벤질옥시, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시 , (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시; 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬; 히드록시(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬; 포르밀; 아지도, 카르복시 또는 그 염; 아미노, 치환된 아미노-여기서 치환체는 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시, 히드록시, 포르밀, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬카르보닐, 카르복시 또는 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시카르복시로 치환된 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬카르보닐, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐, 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐, 아미노카르보닐, (디)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬아미노카르보닐, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시 카르보닐, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 히드록시카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 아미노 및 (디)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬아미노중에서 선택된 최소한 하나임-; 카르복시아미도; 치환된 카르복시아미도-여기서 치환체는 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐 및 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐중에서 선택된 최소한 하나임-; 술포아미도-여기서 N 은 수소 및 /또는 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬로 치환됨-; 또는 YR<sup>4</sup>-여기서 Y 는 0 또는 S(O)<sub>m</sub>이고, R<sup>4</sup>는 수소, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 시아노(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 히드록시카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬 및 아미노카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬로서 그중 N은 수소 및/또는 알킬로 치환되는 군에서 선택됨-이고; n 은 0 ~4 이고, m 은 0~2 이고; X 는 수소, 할로겐, 시아노, 니트로, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐 또는 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시이고; k 는 0~2 이고; Z 는 N 또는 C-R<sup>2</sup>-여기서 R<sup>2</sup>는 수소, 할로겐, 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 시아노, 니트로, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐 또는 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시임-이고, R<sup>3</sup>는 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시, 시아노, 할로겐 또는 SO<sub>y</sub>R<sup>5</sup>-여기서 R<sup>5</sup>는 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬 또는 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬이고, y 는 0, 1 또는 2임.

청구항 2

제1항에 있어서, 상기 화합물이 다음 식으로 나타내어지는 화합물:



상기 식에서, R 은 수소, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시, (C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)알케닐옥시, (C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)알키닐옥시, 아세톡시, 아미노, 치환된 아미노, 술폰아미도, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술폰아미도, 카르복시(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시카르보닐아미드, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시, 시아노, 시아노(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시, 할로겐, 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 니트로, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬티오 및 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포네이트이고; n 은 0~2 이고; X 는 수소, 할로겐 또는 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬이고; Z 는 N 또는 C-R<sup>2</sup>-여기서 R<sup>2</sup>는 수소, 할로겐 또는 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬임.

### 청구항 3

제2항에 있어서, n 은 1 또는 2 이고, X 는 수소, 염소 또는 불소이고, Z는 N,C-할로겐, C-수소 또는 C-트리플루오로메틸인 화합물.

### 청구항 4

제3항에 있어서, R 은 할로겐, (C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)알콕시, 아미노, 치환된 아미노, 시아노, 니트로, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시 또는 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시카르보닐아미드인 화합물.

### 청구항 5

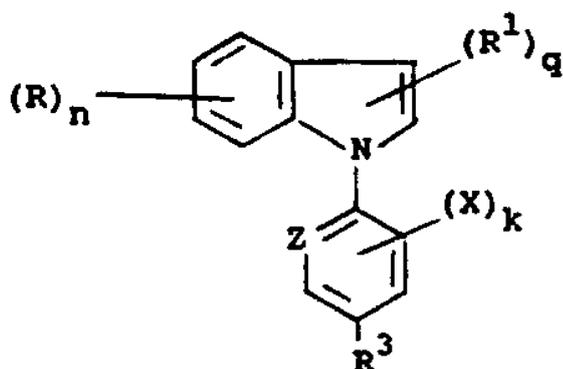
제4항에 있어서, R은 플루오로, 클로로, 메톡시 또는 메틸인 화합물.

### 청구항 6

제3항에 있어서, R은 4-, 5- 또는 6-위치에서 치환되고, n은 1인 화합물.

### 청구항 7

제초제 조성물에 있어서, (a) 다음 식을 가지는 제조적으로 유효량의 치환된 훈-아릴인들:



(상기 식에서, R 은 수소; 할로겐, 니트로, 시아노; (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시; (C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)알케닐옥시; (C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)알키닐옥시 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬; 카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬옥시(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시, 시아노(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시; 벤질옥시; (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시 카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시; (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시, 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬; 히드록시(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬; 포르밀, 아지도, 카르복시 또는 그 염; 아미노, 치환된 아미노-여기서 치환체는(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시, 히드록시, 포르밀, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬카르보닐, 카르복시 또는 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시카르복시로 치환된 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬카르보닐, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐, 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐, 아미노카르보닐, (디)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬아미노카르보닐, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시 카르보닐, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 히드록시 카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 아미노 및

(디)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬 아미노중에서 선택된 최소한 하나임-; 카르복시아미도; 치환된 카르복시아미도-여기서 치환체는 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐 및 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐중에서 선택된 최소한 하나임-; 술폰아미도-여기서 N 은 수소 및/또는 알킬로 치환됨-; 또는 YR<sup>4</sup>-여기서 Y 는 O 또는 S(O)<sub>m</sub>이고, R<sup>4</sup>는 수소, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 시아노(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 히드록시카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬 및 아미노카르보닐(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬로서 그중 N 은 수소 및/또는 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬로 치환되는 군에서 선택됨-이고; n 은 0~4 이고; m 은 0~2 이고; R<sup>1</sup> 은 수소, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 할로겐, 시아노, 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시 또는 카르복시 또는 그 염 또는 에스테르이고; q 는 0~2 이고; X 는 수소, 할로겐, 시아노, 니트로, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술피닐, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐 또는 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시이고; k 는 0~2 이고, Z 는 N 또는 C-R<sup>2</sup>-여기서 R<sup>2</sup>는 수소, 할로겐, 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 시아노, 니트로, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술피닐, (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬술포닐 또는 (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시임-이고; R<sup>3</sup>는 수소, 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알킬, 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)알콕시, 시아노, 할로겐 또는 SO<sub>y</sub>R<sup>5</sup>-여기서 R<sup>5</sup>는 알킬 또는 할로(C<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>)알킬이고, y 는 0, 1 또는 2임); 및 (b) 1 이상의 희석제로 이루어지는 제초제 조성물.