

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.<sup>6</sup>

C07D 239/46

(11) 공개번호 특 1995-0032141

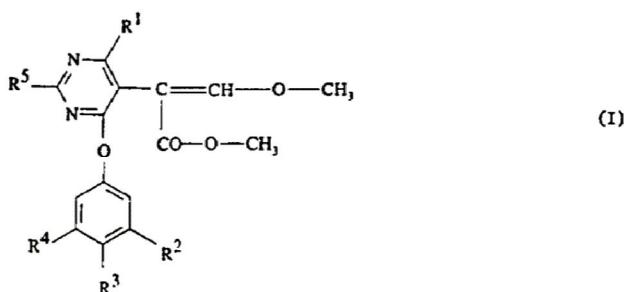
(43) 공개일자 1995년 12월 20일

(21) 출원번호 특 1995-0000314  
(22) 출원일자 1995년 01월 10일

(30) 우선권주장 9400889.3 1994년 01월 18일 영국(GB)  
(71) 출원인 산도즈 리미티드 피터 라스, 한스 루돌프 하우스  
스위스연방, 바슬, 리히트스트라쎄 35(우 : 체하-4002)  
(72) 발명자 마르틴 에벌레  
스위스연방, 보트밍겐, 아스터하그스트라쎄 22  
프리츠 샤웁  
스위스연방, 애쉬, 키르쉬카르텐스트라쎄 62  
제랄드 웨인 그레이그  
스위스연방, 바슬, 하젠마트스트라쎄 1  
(74) 대리인 이상섭, 나영환

**심사청구 : 없음****(54) 알파-피리미디닐 아크릴산 유도체****요약**

본 발명은 하기 일반식(I)의 화합물, 식물 병원체의 억제를 위해 상기 화합물을 사용하는 방법, 그러한 사용을 용이하게 하는 조성물, 및 하기 일반식(I)의 화합물의 제조방법에 관한 것이다.



상기 식중, R<sup>1</sup>은 C<sub>1-4</sub>알콕시 또는 -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>이고; R<sup>2</sup>은 C<sub>1-4</sub>알킬, C<sub>1-4</sub>할로알킬, 아릴, 아릴옥시, C<sub>3-5</sub>알케닐옥시, C<sub>3-5</sub>알키닐옥시, 할로겐, 아릴-C<sub>1-4</sub>알콕시, 아릴옥시-C<sub>1-4</sub>알킬, 아릴옥시-C<sub>1-4</sub>알콕시, 아릴-C<sub>3-5</sub>알케닐옥시, 헤테로아릴, 헤테로아릴옥시, C<sub>1-4</sub>알콕시, C<sub>2-5</sub>알케닐, C<sub>2-5</sub>알키닐, C<sub>1-4</sub>알콕시카르보닐, -CONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, -O-CONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, -CR<sup>7</sup>=N-NR<sup>6</sup>R<sup>12</sup>, -CR<sup>7</sup>=N-O-R<sup>6</sup> 또는 기이고; R<sup>3</sup>는 수소, C<sub>1-4</sub>알킬, C<sub>1-4</sub>알콕시, 시아노, 니트로 또는 할로겐이고; R<sup>4</sup>는 수소, 할로겐, C<sub>1-4</sub>알콕시 또는 C<sub>1-4</sub>알킬이고; R<sup>5</sup>는 수소 또는 메틸이고; R<sup>6</sup>는 C<sub>1-12</sub>알킬, C<sub>3-12</sub>알케닐, C<sub>3-12</sub>알키닐, 아릴-C<sub>1-4</sub>알킬, 아릴 또는 헤테로아릴이고; R<sup>7</sup>는 수소 또는 메틸이고; R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>은 각각 C<sub>1-4</sub>알킬이거나 또는 모두 C<sub>3-6</sub>알킬렌이고; R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 각각 C<sub>1-4</sub>알킬이거나 또는 모두 산소 또는 황에 의해 차단된 C<sub>3-6</sub>알킬렌이고; R<sup>12</sup>는 수소 또는 메틸이고; E는 C<sub>1-3</sub>알킬렌이고; X는 CH 또는 질소이며; Y는 OCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub> 또는 N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>이다.

**명세서**

[발명의 명칭]

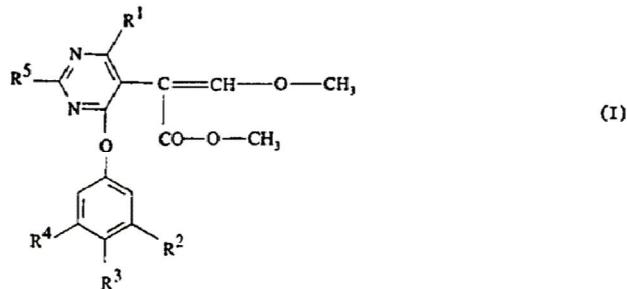
**α-피리미디닐 아크릴산 유도체**

본 건은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

## (57) 청구의 범위

## 청구항 1

하기 일반식(I)의 2(4-페녹시피리미딘-5-일)-아크릴산 유도체:



상기 식중,  $R^1$ 은  $C_{1-4}$ 알콕시 또는  $-NR^8R^9$ 이고;  $R^2$ 은  $C_{1-4}$ 알킬,  $C_{1-4}$ 할로알킬, 아릴, 아릴옥시,  $C_{3-5}$ 알케닐옥시,  $C_{3-5}$ 알키닐옥시, 할로겐, 아릴- $C_{1-4}$ 알콕시, 아릴옥시- $C_{1-4}$ 알킬, 아릴옥시- $C_{1-4}$ 알콕시, 아릴- $C_{3-5}$ 알케닐옥시, 헤테로아릴, 헤�테로아릴옥시,  $C_{1-4}$ 알콕시,  $C_{2-5}$ 알케닐,  $C_{1-4}$ 알키닐,  $C_{1-4}$ 알콕시카르보닐,  $-CONR^{10}R^{11}$ ,  $-OCONR^{10}R^{11}$ ,  $-CR^7=N-NR^6R^{12}$ ,  $-CR^7=N-O-R^6$  또는 기 이고;  $R^3$ 은 수소  $C_{1-4}$ 알킬,  $C_{1-4}$ 알콕시, 시아노, 니트로 또는 할로겐이고;  $R^4$ 는 수소, 할로겐,  $C_{1-4}$ 알콕시 또는  $C_{1-4}$ 알킬이고;  $R^5$ 는 수소 또는 메틸이고;  $R^6$ 는  $C_{1-12}$ 알킬,  $C_{3-12}$ 알케닐,  $CC_{3-12}$ 알키닐, 아릴- $C_{1-4}$ 알킬, 아릴 또는 헤�테로아릴이고;  $R^7$ 는 수소 또는 메틸이고;  $R^8$  및  $R^9$ 은 각각  $C_{1-4}$ 알킬이거나 또는 모두  $C_{3-6}$ 알킬렌이고;  $R^{10}$  및  $R^{11}$ 은 각각  $C_{1-4}$ 알킬이거나 또는 모두 산소 또는 황에 의해 차단된  $C_{3-6}$ 알킬렌이고;  $R^{12}$ 는 수소 또는 메틸이고;  $E$ 는  $C_{1-3}$ 알킬렌이고;  $X$ 는 CH 또는 질소이며;  $Y$ 는  $OCH_3$ ,  $NH_2$ ,  $NHCH_3$  또는  $N(CH_3)_2$ 이다.

## 청구항 2

제1항에 있어서,  $R^1$ 이 메톡시 또는 디메틸아미노인 일반식(I)의 화합물.

## 청구항 3

제1항에 있어서,  $R^2$ 가 페닐, 페녹시,  $C_{1-4}$ 알킬,  $-C(CH_3)=N-O-R^6$  또는  $CF_3$ 이거나, 또는 페닐,  $C_{1-4}$ 알킬 또는  $CF_3$ 로 각각 임의 치환된 티아졸 또는 이소옥사졸릴이고;  $R^6$ 이  $C_{1-6}$ 알킬 또는 아릴이거나, 또는 페닐고리가  $C_{1-4}$ 알킬,  $C_{1-4}$ 알콕시킬, 할로겐 또는  $CF_3$ 로 각각 임의 치환된 벤질 또는 2-페닐에틸인 일반식(I)의 화합물.

## 청구항 4

제1항에 있어서,  $R^3$ 가 수소인 일반식(I)의 화합물.

## 청구항 5

제1항에 있어서,  $R^4$ 가 수소 또는 메틸인 일반식(I)의 화합물.

## 청구항 6

제1항에 있어서,  $R^5$ 가 수소 또는 메틸인 일반식(I)의 화합물.

## 청구항 7

제1항에 있어서,  $R^1$ 이 메톡시 또는 디메틸아미노이고;  $R^2$ 는 페닐, 페녹시,  $C_{1-4}$ 알킬,  $-C(CH_3)=N-O-R^6$  또는  $CF_3$ 이거나, 또는 페닐,  $C_{1-4}$ 알킬, 할로겐 또는  $CF_3$ 로  $CF_3$ 로 각각 임의 치환된 티아졸 또는 이소옥사졸릴이고;  $R^3$ 은 수소이고;  $R^4$ 는 수소 또는 메틸이고;  $R^5$ 는 수소 또는 메틸이며;  $R^6$ 이  $C_{1-6}$ 알킬, 또는 아릴이거나, 또는 페닐고리가  $C_{1-4}$ 알킬,  $C_{1-4}$ 알콕시, 할로겐 또는  $CF_3$ 로 각각 임의 치환된 벤질 또는 2-페닐에틸인 일반식(I)의 화합물.

## 청구항 8

제1항에 있어서, 메틸  $\alpha$ -[4(3-메틸-5-이소프로필페녹시)-6-메톡시-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트; 메틸  $\alpha$ -[4-(3-t.부틸페녹시)-6-메톡시-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트 메틸  $\alpha$ -[4-(3-t.부틸페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트; 메틸  $\alpha$ -[4-(3-이소프로필페녹시)-6-메톡시-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트; 메틸  $\alpha$ -[4-(3-트리플루오로메틸페녹시)-6-메톡시-피리

미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트; 메틸  $\alpha$ -[4-(3-페녹시페녹시)-6-메톡시-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트;  
 $\alpha$ -[4-(3-(1-(3-클로로벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-(1-에톡시이미노)-에틸)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸  $\alpha$ -[4-(3-(1-메톡시이미노)-에틸)-페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트; 메틸  $\alpha$ -[4-(3-트리플루오로메틸페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트; 메틸2-[4-(3-(1-에톡시이미노)-에틸)-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(3-(1-(2,5-디메틸벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(3-(1-(3-클로로벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(3-(1-(2,5-디메틸벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(3-(1-(2,5-디메틸벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트;  
 $\alpha$ -[4-(3-(1-(2-3-클로로벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트;  
 $\alpha$ -[4-(3-(1-(2,5-디메틸벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-메톡시-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트; 메틸2-[4-(3-(1-(3-클로로벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-메톡시-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(3-(3-(3-크리풀루오로메틸이소옥사졸)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-일-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(3-(페녹시페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(5-메틸-3-이소프로필페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(5-메틸-3-이소프로필-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(3-(2-메틸벤질옥시)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(3-(2-메틸벤질옥시)-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; N-메틸2-[4-(3-(1-페닐에톡시)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(3-페닐에톡시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(3-(2-페닐티아졸-4-일)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(3-(2-페닐티아졸-4-일)-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(3-(3-트리플루오로메틸이소옥사졸-5-일)-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸2-[4-(3-페닐페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; N-메틸2-[4-(3-페닐페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸  $\alpha$ -[4-(3-페닐페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트; 메틸  $\alpha$ -[4-(3-(3-트리플루오로메틸이소옥사졸-5-일)-페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트; 메틸  $\alpha$ -[4-(3-(3-트리플루오로메틸이소옥사졸-5-일)-페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트; 메틸  $\alpha$ -[4-(5-메틸-3-이소프로필페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트; 및  
 $\alpha$ -[4-(3-(2-메틸페녹시)-페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]- $\beta$ -메톡시아크릴레이트로 이루어진 군중에서 선택된 일반식(1)의 화합물.

## 청구항 9

진균류 또는 이들의 자생지에 제1항의 일반식(I)의 화합물을 살균적 유효량 살포하여 식물 병원성 진균류를 멸균시키는 방법.

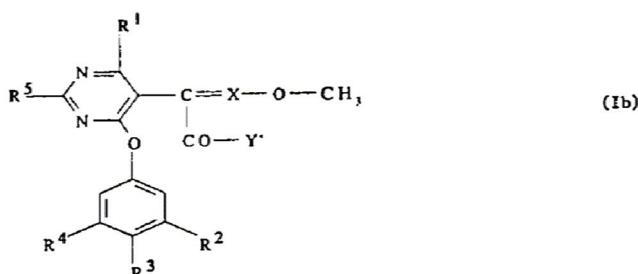
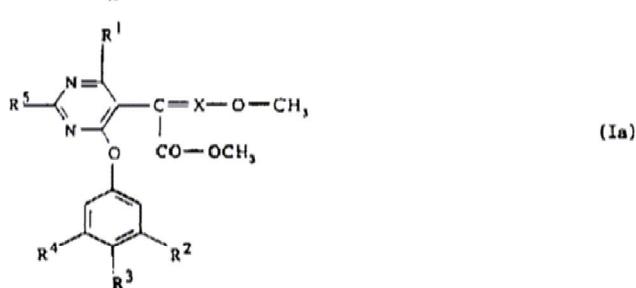
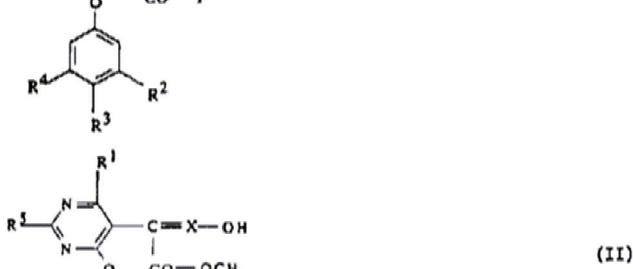
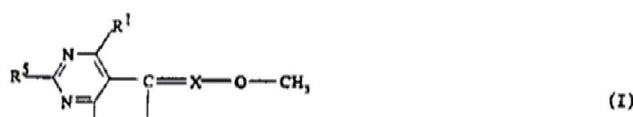
### 청구항 10

제1항의 일반식(1)의 화합물 및 경작 허용성 희석제를 포함하는 살균 조성물.

청구항 11

하기 일반식 (II)의 화합물을 0-메틸화하여 하기 일반식 (Ia)의 화합물을 형성하는 단계; 각각  $\text{NH}_3$ ,  $\text{NH}_2\text{CH}_3$  또는  $\text{NH}(\text{CH}_3)_2$ 와의 아미드화 반응을 통해 일반식 (Ia)의 화합물을 하기 일반식 (Ib)의 화합물로 전환시키는

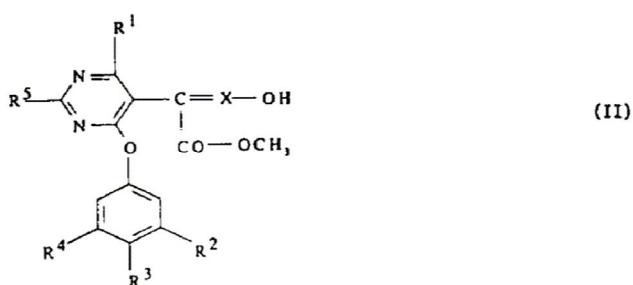
임의의 단계를 포함하는, 제1항의 일반식(I)의 화합물을 제조하는 방법:



상기 식중,  $R^1$  내지  $R^5$  및  $X$ 는 제1항에서 정의한 바와 같고;  $Y^1$ 는  $NH_2$ ,  $NHCH_3$  또는  $N(CH_3)_2$ 이다.

### 청구항 12

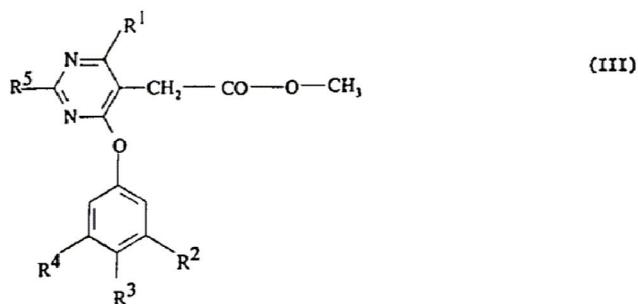
하기 일반식(II)의 화합물:



상기 식중,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  및  $X$ 는 제1항에 정의된 바와 같다.

### 청구항 13

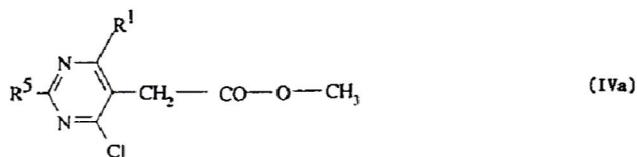
하기 일반식(III)의 화합물:



상기 식중,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  제1항에 정의된 바와 같다.

청구항 14

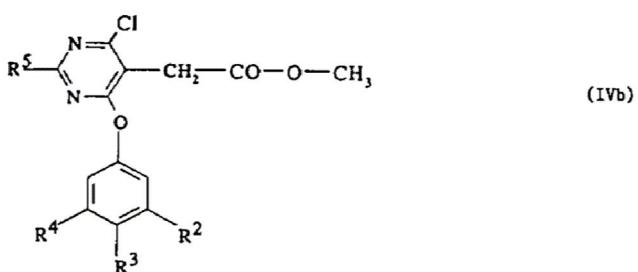
하기 일반식(IVa)의 화합물:



상기 식중,  $R^1$ 은  $C_{1-4}$ 알콕시이고;  $R^5$ 는 제1항에 정의된 바와 같다.

청구항 15

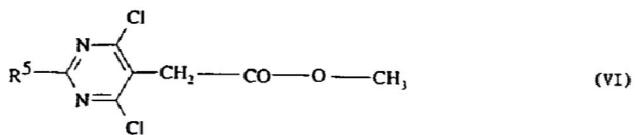
하기 일반식(IVb)의 화합물:



상기 식중,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  및  $R^5$ 는 제1항에 정의된 바와 같다.

청구항 16

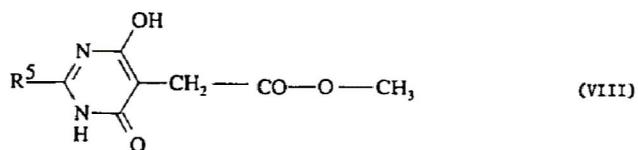
하기 일반식(VI)의 화합물:



상기 식중,  $R^5$ 는 제1항에 정의된 바와 같다.

청구항 17

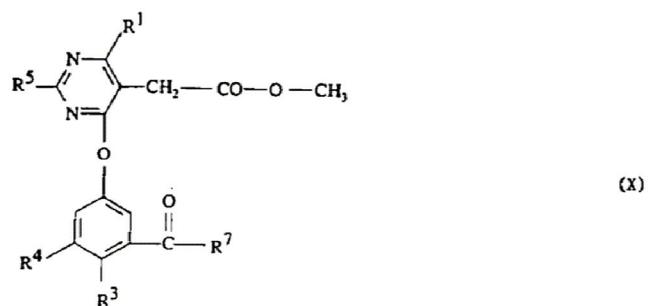
하기 일반식(VIII)의 화합물:



상기 식중,  $R^5$ 는 제1항에 정의된 바와 같다.

청구항 18

하기 일반식(X)의 화합물:



상기 식중,  $R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  및  $R^7$ 는 제1항에 정의된 바와 같다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.