

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁶
C07D 239/46

(11) 공개번호 특 1995-0032141
(43) 공개일자 1995년 12월 20일

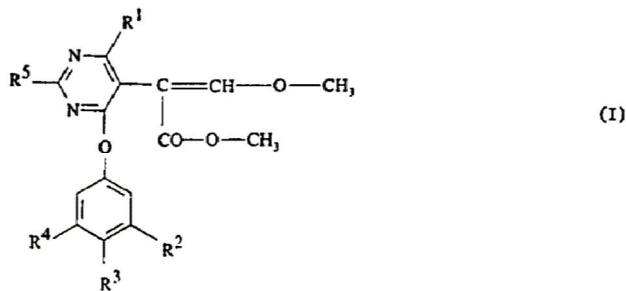
(21) 출원번호 특 1995-0000314
(22) 출원일자 1995년 01월 10일
(30) 우선권주장 9400889.3 1994년 01월 18일 영국(GB)
(71) 출원인 산도즈 리미티드 피터 라스, 한스 루돌프 하우스
스위스연방, 바슬, 리히트스트라쎄 35(우 : 체하-4002)
(72) 발명자 마르틴 에벌레
스위스연방, 보트밍겐, 아스터하그스트라쎄 22
프리츠 샤웁
스위스연방, 애쉬, 키르쉬카르텐스트라쎄 62
제랄드 웨인 그래이그
스위스연방, 바슬, 하젠마트스트라쎄 1
(74) 대리인 이상섭, 나영환

심사청구 : 없음

(54) 알파-피리미디닐 아크릴산 유도체

요약

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



상기 식중, R¹은 C₁₋₄알콕시 또는 -NR⁸R⁹이고; R²은 C₁₋₄알킬, C₁₋₄할로알킬, 아릴, 아릴옥시, C₃₋₅알케닐옥시, C₃₋₅알키닐옥시, 할로겐, 아릴-C₁₋₄알콕시, 아릴옥시-C₁₋₄알킬, 아릴옥시-C₁₋₄알콕시, 아릴-C₃₋₅알케닐옥시, 헤테로아릴, 헤테로아릴옥시, C₁₋₄알콕시, C₂₋₅알케닐, C₂₋₅알키닐, C₁₋₄알콕시카르보닐, -CONR¹⁰R¹¹, -O-CONR¹⁰R¹¹, -CR⁷=N-NR⁶R¹², -CR⁷=N-O-R⁶ 또는 기 이고; R³은 수소, C₁₋₄알킬, C₁₋₄알콕시, 시아노, 니트로 또는 할로겐 이고; R⁴은 수소, 할로겐, C₁₋₄알콕시 또는 C₁₋₄알킬이고; R⁵은 수소 또는 메틸이고; R⁶은 C₁₋₁₂알킬, C₃₋₁₂알케닐, C₃-C₁₂알키닐, 아릴-C₁₋₄알킬, 아릴 또는 헤테로아릴이고; R⁷은 수소 또는 메틸이고; R⁸ 및 R⁹은 각각 C₁₋₄알킬이거나 또는 모두 C₃₋₆알킬렌이고; R¹⁰ 및 R¹¹은 각각 C₁₋₄알킬이거나 또는 모두 산소 또는 황에 의해 차단된 C₃₋₆알킬렌이고; R¹²은 수소 또는 메틸이고; E는 C₁₋₃알킬렌이고; X는 CH 또는 질소이며; Y는 OCH₃, NH₂, NHCH₃ 또는 N(CH₃)₂이다.

명세서

[발명의 명칭]

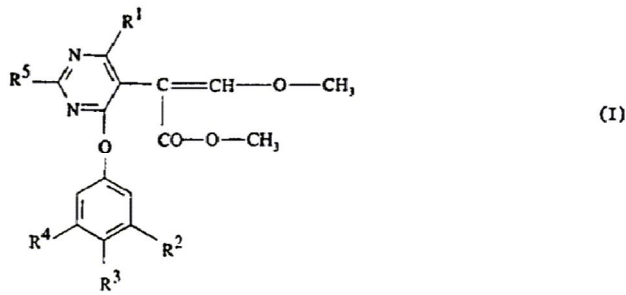
α-피리미디닐 아크릴산 유도체

본 건은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 일반식(1)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-C_5 알킬닐옥시, 할로겐, 아릴- C_{1-4} 알콕시, 아릴옥시- C_{1-4} 알킬, 아릴옥시- C_{1-4} 알콕시, 아릴- C_{3-5} 알케닐옥시, 헤테로아릴, 헤테로아릴옥시, C_{1-4} 알콕시, C_{2-5} 알케닐, C_{2-5} 알킬닐, 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 할로겐 이고; 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} 알킬닐, 아릴- C_{1-4} 알킬, 아릴 또는 헤테로아릴이고; 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; E는 C_{1-3} 알킬렌이고; X는 CH 또는 질소이며; Y는 OCH_3 , NH_2 , $NHCH_3$ 또는 $N(CH_3)_2$ 이다.

청구항 2

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

청구항 4

제1항에 있어서, R^3 가 수소인 일반식(1)의 화합물.

청구항 5

제1항에 있어서, R^4 가 수소 또는 메틸인 일반식(1)의 화합물.

청구항 6

제1항에 있어서, R^5 가 수소 또는 메틸인 일반식(1)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 이소옥사졸일이고; R^3 는 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(1)의 화합물.

청구항 8

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

미딘-5-일]-β-메톡시아크릴레이트; 메틸 α-[4-(3-페녹시페녹시)-6-메톡시-피리미딘-5-일]-β-메톡시아크릴레이트; 메틸 α-[4-(3-(1-(3-클로로벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-(1-메톡시이미노)-에틸)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 α-[4-(3-(1-메톡시이미노)-에틸)-페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]-β-메톡시아크릴레이트; 메틸 2-[4-(3-(1-메톡시이미노)-에틸)-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-(1-(2,5-디메틸벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-(1-(3-클로로벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-(1-(2,5-디메틸벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-β-메톡시아미노-아세테이트; 메틸 α-[4-(3-(1-(2,5-디메틸벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]-β-메톡시아크릴레이트; 메틸 α-[4-(3-(1-(2-3-클로로벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]-β-메톡시아크릴레이트; 메틸 α-[4-(3-(1-(2,5-디메틸벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]-β-메톡시아크릴레이트; 메틸 2-[4-(3-(1-(3-클로로벤질옥시이미노)-에틸)-페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-(3-(3-크리플루오로메틸이소옥사졸)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-(페녹시페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일)-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(5-메틸-3-이소프로필페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(5-메틸-3-이소프로필페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-(2-메틸벤질옥시)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-(2-메틸벤질옥시)-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; N-메틸 2-[4-(3-(1-페닐에톡시)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-페닐에톡시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-(2-페닐티아졸-4-일)-페녹시)-6-디메틸아미노-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-(2-페닐티아졸-4-일)-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-(3-트리플루오로메틸이소옥사졸-5-일)-페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 2-[4-(3-페닐페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; N-메틸 2-[4-(3-페닐페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-2-메톡시이미노-아세테이트; 메틸 α-[4-(3-페닐페녹시)-6-디메틸아미노-2-메틸-피리미딘-5-일]-β-메톡시아크릴레이트; 메틸 α-[4-(3-(3-트리플루오로메틸이소옥사졸-5-일)-페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]-β-메톡시아크릴레이트; 메틸 α-[4-(3-(3-트리플루오로메틸이소옥사졸-5-일)-페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]-β-메톡시아크릴레이트; 메틸 α-[4-(5-메틸-3-이소프로필페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]-β-메톡시아크릴레이트; 및 메틸 α-[4-(3-(2-메틸페녹시)-페녹시)-6-메톡시-2-메틸-피리미딘-5-일]-β-메톡시아크릴레이트로 이루어진 군중에서 선택된 일반식(1)의 화합물.

청구항 9

진균류 또는 이들의 자생지에 제1항의 일반식(1)의 화합물을 살균적 유효량 살포하여 식물 병원성 진균류를 멸균시키는 방법.

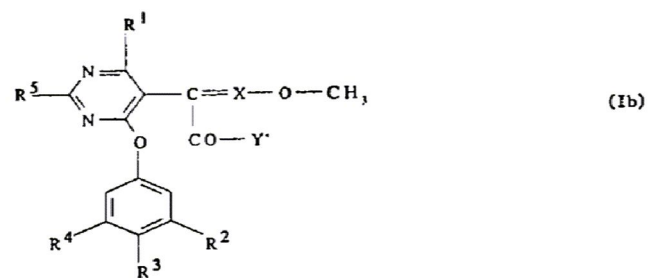
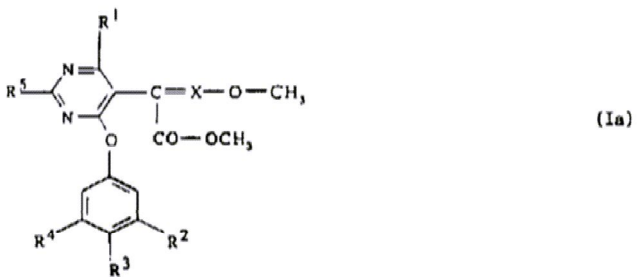
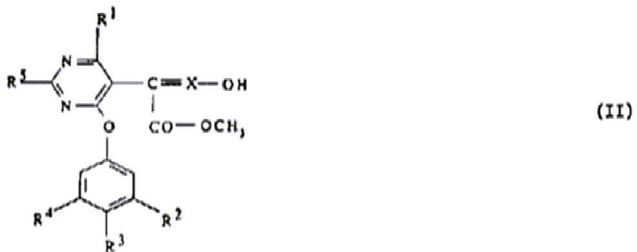
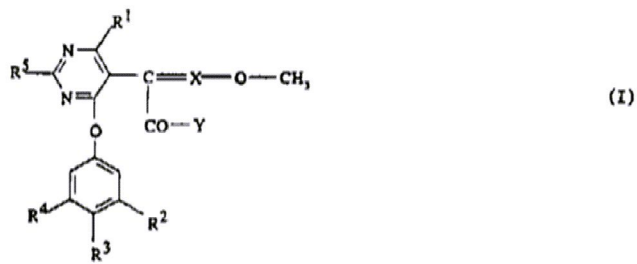
청구항 10

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

청구항 11

하기 일반식(II)의 화합물을 0-메틸화하여 하기 일반식(1a)의 화합물을 형성하는 단계; 각각 NH_3 , NH_2CH_3 또는 $\text{NH}(\text{CH}_3)_2$ 와의 아미드화 반응을 통해 일반식(1a)의 화합물을 하기 일반식(1b)의 화합물로 전환시키는

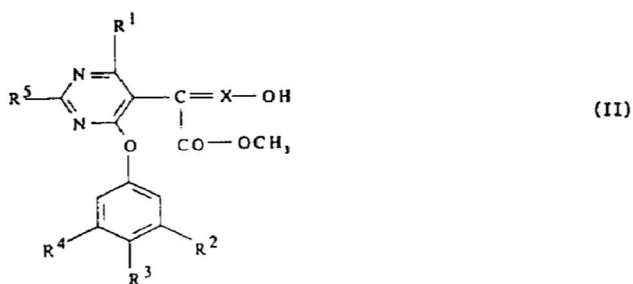
임의의 단계를 포함하는, 제1항의 일반식(I)의 화합물을 제조하는 방법:



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

청구항 12

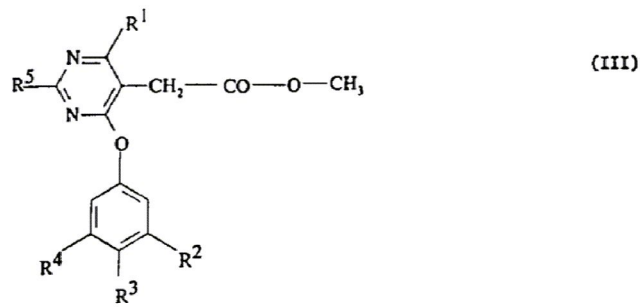
하기 일반식(II)의 화합물:



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

청구항 13

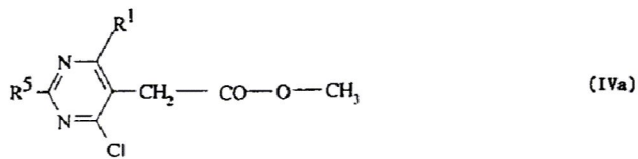
하기 일반식(III)의 화합물:



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

청구항 14

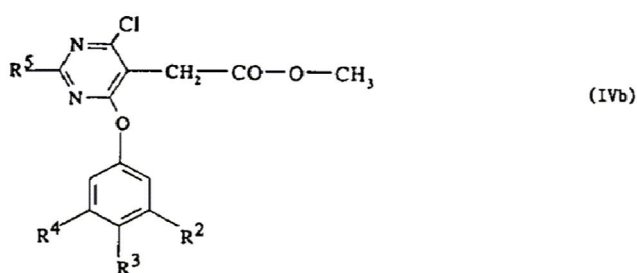
하기 일반식(IVa)의 화합물:



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

청구항 15

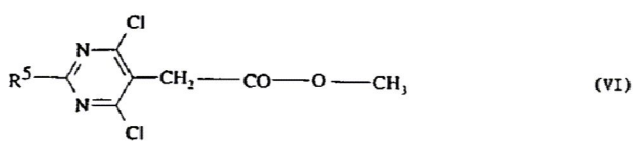
하기 일반식(IVb)의 화합물:



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

청구항 16

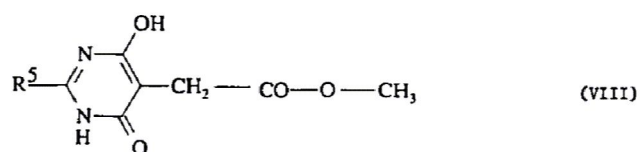
하기 일반식(VI)의 화합물:



상기 식중, R^5 는 제1항에 정의된 바와 같다.

청구항 17

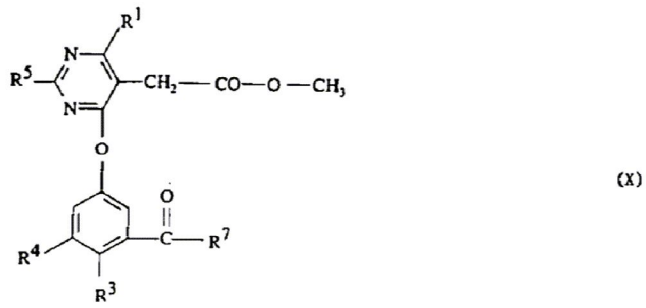
하기 일반식(VIII)의 화합물:



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.