(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(51) Int. Cl.[6]
C07C 271/22

(45) 공고일자 1999년06월15일
(11) 등록번호 10-0195347
(24) 등록일자 1999년02월11일

(21) 출원번호 10-1991-0019827
(22) 출원일자 1991년11월08일
(65) 공개번호 특1992-0009782
(43) 공개일자 1992년06월25일

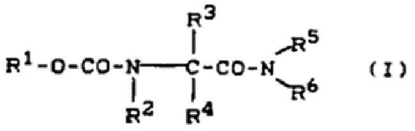
(30) 우선권주장 P4035851.8 1990년11월10일 독일(DE)
(73) 특허권자 바이엘 악티엔게젤샤프트 클라우드 리우터, 군터 슈마처
독일연방공화국 디-51368 레버크센-바이엘베르크
(72) 발명자 토마스 자이츠
독일연방공화국 데 4019 몬하임 모짜르트스트라쎄 32
하인쯔-빌헬름 데네
독일연방공화국 데 4019 몬하임 크리쉐르 스트라쎄 81
(74) 대리인 최규팔

심사관 : 김지수

(54) 치환된 아미노산 아미드 유도체, 그의 제조방법 및 용도

요약

본 발명은 하기 일반식(I)의 아미노산 아미드 유도체의 그의 제조 방법 및 살충제로서의 그의 용도에 관한 것이다.



상기 식에서, R^1은 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로게노알킬, 할로게노알케닐, 할로게노알키닐, 사이클로알킬, 사이클로알케닐, 비치환 또는 치환된 아릴, 비치환 또는 치환된 아르알킬, 비치환 또는 치환된 헤테로아릴, 비치환 또는 치환된 헤테로아릴알킬을 나타내고, R^2 및 R^5는 동일 또는 상이하며, 수소 또는 저급 알킬을 나타내고, R^3 및 R^4는 수소, 사이클로알킬 또는 알킬을 나타내거나, R^3과 R^4가 이들이 결합되어 있는 탄소 원자와 함께하는 사이클로알킬환을 형성하며, R^6은 비치환 또는 치환된 직쇄 또는 측쇄 사이클로알킬알킬, 비치환 또는 치환된 직쇄 또는 측쇄 사이클로알케닐알킬 또는 알킬-가교된 사이클로알킬알킬을 나타낸다.

명세서

[발명의 명칭]

치환된 아미노산 아미드 유도체, 그의 제조방법 및 용도

[발명의 상세한 설명]

본 발명은 신규한 아미노산 아미드 유도체, 그의 제조를 위한 다수의 방법 및 살충제로서의 그의 용도에 관한 것이다.

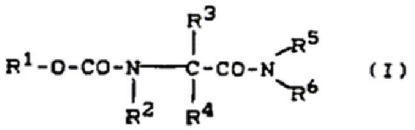
본 발명에 따른 물질은 해충을 퇴치하기 위해 사용하는 경우에 우수한 작용을 갖는다. 특히, 본 발명에 따른 물질은 주로 식물 보호를 위한 살진균제로서 사용할 수 있다.

예를 들면, N-3급-부톡시카르보닐-L-로이실-벤질-아미드와 같은 특정의 아미노산 아미드는 이미 공지되어 있다(참조 : EP-A-236,874).

그러나 살충제로서의 이들 화합물의 용도는 기술되어 있지 않다.

따라서, 본 발명은 하기 일반식(I)의 신규한 아미노산 아미드 유도체에 관한 것이다.

화학식 1



(I)

상기식에서, R^1은 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로게노알킬, 할로게노알케닐, 할로게노알키닐, 사이클로알킬, 사이클로알케닐, 비치환 또는 치환된 아릴, 비치환 또는 치환된 아르알킬, 비치환 또는 치환된 헤테로아릴, 비치환 또는 치환된 헤테로아릴알킬을 나타내고, R^2 및 R^5는 동일 또는 상이하며, 수소 또는 저급 알킬을 나타내고, R^3 과 R^4는 수소, 사이클로알킬 또는 알킬을 나타내거나, R^3 과 R^4가 결합되어 있는 탄소 원자와 함께는 상이클로알킬환을 형성하며, R^6은 비치환 또는 치환된 직쇄 또는 측쇄 사이클로알킬알킬, 비치환 또는 치환된 직쇄 또는 측쇄 사이클로알케닐알킬, 또는 알킬-가교된 사이클로알킬알킬을 나타낸다.

또한, 일반식(I)의 화합물은 하나 이상의 키랄 중심을 포함할 수 있으며, 따라서 거울상 이성체와 부분입체 이성체의 여러가지 혼합물로 존재할 수 있고, 이들은 적합하다면 통상적인 방식으로 분할할 수 있다. 본 발명은 이러한 이성체들의 혼합물뿐 아니라 순수한 거울상 이성체와 부분입체 이성체들도 청구대상으로 한다.

간단히 표시하기 위해서, 하기에서는 항상 일반식(I)의 화합물이라고 언급되지만, 이는 순수한 화합물뿐만 아니라, 다양한 비율의 이성체, 거울상 이성체 및 부분입체 이성체 화합물을 함유하는 혼합물도 의미하는 것으로 이해되어야 한다.

일반식(I)은 본 발명에 따른 치환된 아미노산 아미드 유도체의 일반적인 정의를 제공한다.

다르게 정의되지 않는 한, 다음 일반식에서의 바람직한 의미는 다음과 같다: 알킬은 그 자체로 또는 복합 라디칼에서 탄소수 1 내지 6, 특히 1 내지 4의 직쇄 또는 측쇄 알킬을 나타낸다. 예를들면 바람직한 것으로서 메틸, 에틸, n- 및 i-프로필, n-, i-, s- 및 t-부틸이 언급될 수 있다.

알케닐은 탄소수 2 내지 6, 특히 2 내지 4의 직쇄 또는 측쇄 알케닐을 나타낸다. 예를 들면 바람직한 것으로서 임의 치환된 에티닐, 1-프로피닐, 2-프로피닐 및 3-부테닐이 언급될 수 있다.

알키닐은 탄소수 2 내지 6, 특히 2 내지 4의 직쇄 또는 측쇄 알키닐을 나타낸다. 예를 들면 바람직한 것으로서 임의 치환된 에티닐, 1-프로피닐, 2-프로피닐 및 3-부티닐이 언급될 수 있다.

할로게노알킬은 1 내지 6, 특히 1 내지 4개의 탄소 원자와 1 내지 9, 특히 1 내지 5 및 더욱 특히는 1 내지 3개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자, 예를들면 불소, 염소, 브롬, 요오드 특히 불소 및 염소를 갖는 직쇄 또는 측쇄 할로게노알킬을 나타낸다. 예를 들면 바람직한 것으로서 플루오로메틴, 플루오로에틸, 플루오로프로필, 클로로프로필, 풀루오로부틸, 클로로부틸, 디플루오로메틸, 디플루오로에틸, 디클로로에틸, 디플루오로프로필, 디클로로프로필, 디플루오로부틸, 디클로로부틸, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로에틸, 트리클로로에틸, 트리플루오로프로필, 트리클로로프로필, 트리플루오로부틸 및 트리클로로부틸이 언급될 수 있다.

할로게노알케닐 및 할로게노알키닐은 2 내지 6, 특히 2 내지 4개의 탄소 원자와 1 내지 9, 특히 1 내지 5 및 더욱 특히는 1 내지 3개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자, 예를들면 불소, 염소, 브롬, 요오드, 특히 불소 및 염소를 갖는 임의 치환된 직쇄 또는 측쇄 할로게노알케닐 또는 할로게노알키닐을 나타낸다. 예를들면 바람직한 것으로서 플루오로알릴, 클로로알릴, 플루오로부테닐, 클로로부테닐, 플루오로프로파르길, 클로로프로파르길, 플루오로부티닐 및 클로로부티닐이 언급될 수 있다.

사이클로알킬은 치환 또는 비치환된 3 내지 7 원환, 특히 탄소수 3, 5 또는 6 의 환을 나타낸다. 예를들면 바람직한 것으로서 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸,사이클로헥실 및 사이클로헵틸이 언급될 수 있다.

사이클로알케닐은 1 또는 2개의 이중 결합을 갖는 탄소수 3 내지 7, 특히 3 내지 6의 치환 또는 비치환된 사이클로알케닐을 나타낸다.

아릴은 탄소수 6 내지 10의 비치환 또는 치환된 아릴을 나타낸다. 예를들면 바람직한 것으로서 각 경우에 비치환 또는 치환된 페닐 및 나프틸 특히 비치환 또는 치환된 페닐이 언급될 수 있다.

아르알킬은 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 4, 특히 1 또는 2개의 탄소원자를 가지며 아릴 부위가 6 내지 10개의 탄소원자를 갖는, 바람직하게는 페닐인 비치환 또는 치환된 아르알킬을 나타낸다. 예를들면 바람직한 것으로서 벤질, 1,1- 및 1,2-펜에틸, 및 1,1-, 1,2-, 1,3- 및 2,2-페닐프로필이 언급될 수 있다.

헤테로아릴은 1 내지 4, 바람직하게는 1 내지 3개의 동일 또는 상이한 헤테로 원자를 함유하는 비치환 또는 치환된 5 내지 9 원환, 특히 5 내지 7 원환을 나타낸다. 바람직한 헤테로 원자로는 산소, 황 및 질소가 언급될 수 있다. 예를들면 바람직한 것으로서 피리미디닐, 티에닐, 푸릴, 피라지닐, 티아졸릴 및,

특히 피리딜이 언급될 수 있다.

헤테로아릴알킬에서 헤테로아릴 부위는 상기언급된 정의 및 바람직한 범주와 일치한다. 알킬부위는 직쇄 또는 측쇄이고 1 내지 4, 특히 1 또는 2개의 탄소원자를 함유한다. 예를들면 바람직한 것으로서 헤테로아릴메틸, 1,1- 및 1,2-헤테로아릴에틸이 언급될 수 있다.

일반식에서의 임의 치환된 라디칼은 하나이상, 바람직하게는 1 내지 3, 특히 1 또는 2개의 동일 또는 상이한 치환체를 가질 수 있다. 예를들면 바람직한 것으로서 다음과 같은 치환체들이 언급될 수 있다 : 바람직하게는 1 내지 4, 특히 1 또는 2개의 탄소원자를 갖는 알킬, 예를들면 메틸, 에틸, n- 및 i-프로필, 및 n-, i-, sec- 및 t-부틸; 바람직하게는 1 내지 4, 특히 1 또는 2개의 탄소원자를 갖는 알콕시, 예를들면 메톡시, 에톡시, n- 및 i-프로필옥시, 및 n-, i-, sec- 및 t-부틸옥시; 바람직하게는 1 내지 4, 특히 1 또는 2개의 탄소원자를 갖는 알킬티오, 예를들면 메틸티오, 에틸티오, n- 및 i-프로필티오, 및 n-, i-, sec- 및 t-부틸티오; 바람직하게는 1 내지 4, 특히 1 또는 2개의 탄소원자와 바람직하게는 1 내지 9, 특히 1 내지 5개의 할로겐 원자(여기에서, 할로겐 원자는 동일 또는 상이하며, 바람직하게는 불소, 염소 또는 브롬, 특히 불소를 나타낸다)를 갖는 할로게노알킬, 할로게노알콕시 및 할로게노알킬티오, 예를들면 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 펜타플루오로에틸, 테트라플루오로에틸, 트리플루오로클로로에틸, 트리플루오로에틸, 트리플루오로에톡시, 디플루오로메톡시, 펜타플루오로에톡시, 테트라플루오로에톡시, 디플루오로메톡시, 펜타플루오로에톡시, 테트라플루오로에톡시, 트리플루오로클로로에톡시, 트리플루오로메톡시 및 트리플루오로메틸티오; 할로겐, 바람직하게는 불소, 염소, 브롬 및 요오드, 특히 불소, 염소 및 브롬; 각 알킬 부위에 1 내지 4, 특히 1 또는 2개의 탄소원자를 갖는 알킬알콕시; 알킬 부위에 1 내지 4, 특히 1 또는 2개의 탄소원자를 갖는 카르보닐알콕시, 예를들면 카르보닐메톡시 및 카르보닐에톡시.

상기에서 예시된 정의들은 또한 다음 라디칼의 바람직한 조합에서의 정의에도 유사하게 적용된다.

바람직한 일반식(I)의 화합물은 R^1 이 1 내지 6개의 탄소원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 알킬, 2 내지 6개의 탄소원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 알케닐 또는 알키닐, 1 내지 6개의 탄소원자와 1 내지 9개의 동일 또는 상이한 할로겐원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 할로게노알킬, 2 내지 6개의 탄소원자와 1 내지 9개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 할로게노알케닐 또는 할로게노알키닐, 또는 3 내지 7개위 탄소원자를 갖는 치환 또는 비치환된 사이클로알킬 또는 사이클로알케닐을 나타내거나, 각 경우에 비치환 또는 치환된 페닐 도는 피리딜, 또는 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소 원자를 가지며 비치환되거나 페닐 부위에서 치환된 페닐알킬을 나타내고, 여기에서 각 경우에 피리딜 또는 페닐 부위에 적합한 치환체는 각 경우에 1 내지 4개의탄소 원자를 갖는 알킬, 알콕시 및 알킬티오; 각 경우에 1 내지 4개의 탄소 원자와 1 내지 9개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 할로게노알킬, 할로게노알콕시 및 할로게노알킬티오; 할로겐, 각각의 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 알킬알콕시; 및 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 카르보닐알콕시이며; R^2 및 R^5가 수소 또는 메틸을 나타내고, R^3 및 R^4 가 동일 또는 상이하며, 수소 3 내지 7개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬, 또는 1 내지 6개의 탄소원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 알킬을 나타내거나, 또는 R^3 및 R^4 가 이들이 결합되어 있는 탄소원자와 함께는 탄소수 3 내지 7의 사이클로알킬환을 형성하고, R^6 이 사이클로알킬 부위에 3 내지 7개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 6개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬, 또는 사이클로알케닐 부위에 5 내지 8개의 탄소 원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 6개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬을 나타내거나, 사이클로알킬 부위에 5 내지 8개의 탄소원자를 가지며 알킬에 의해 가교되고 가교 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 6개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬알킬을 나타내며, 여기에서 적합한 치환체는 각 경우에 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 알킬, 알콕시 및 알킬티오; 각 경우에 1 내지 4개의 탄소원자와 1 내지 9개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 할로게노알킬, 할로게노알콕시 및 할로게노알킬티오; 하이드록실; 알킬기당 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 디알킬아미노; 및 각각의 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 알킬알콕시인 화합물이다.

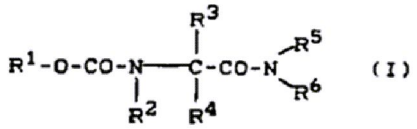
특히 바람직한 일반식(I)의 화합물은 R^1 이 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 알킬, 2 내지 4개의 탄소원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 알케닐 또는 알키닐, 1 내지 4개의 탄소원자와 1 내지 5개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 할로게노알킬, 2 내지 4개의 탄소원자와 1 내지 5개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 할로게노알케닐 또는 할로게노알키닐, 또는 3 내지 6개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬 또는 사이클로알케닐을 나타내거나, 또한 비치환되거나 동일 또는 상이한 치환체로 일치환 내지 삼치환된 페닐을 나타내고, 여기에서 적합한 치환체는 각 경우에 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 알킬, 알콕시 및 알킬티오; 1 또는 2개의 탄소원자와 1 내지 5개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 할로게노알킬, 할로게노알콕시 및 할로게노알킬티오; 불소, 염소, 브롬 및 요오드; 각각의 알킬 부위에 1 또는 2개의 탄소원자를 갖는 알킬알콕시; 및 알킬 부위에 1 또는 2개의 탄소원자를 갖는 카르보닐알콕시이며; R^2 및 R^5 가 수소이고, R^3 및 R^4 가 동일 또는 상이하며, 수소, 3 내지 6개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬, 또는 1 내지 5개의 탄소원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 알킬을 나타내거나, 또는 R^3 및 R^4 가 이들이 결합되어 있는 탄소원자와 함께는 탄소수 3 내지 6 의 사이클로알킬환을 형성하고, R^6 이 사이클로알킬 부위에 3 내지 6개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬알킬, 또는 사이클로알케닐 부위에 5 내지 7개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알케닐알킬을 나타내거나, 사이클로알킬 부위에 5 내지 7개의 탄소원자를 가지며 알킬에 의해 가교되고 가교 알킬 부위에 1 내지 3개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬알킬을 나타내며, 여기에서 적합한 치환체는 각 경우에 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 알킬, 알콕시 및 알킬티오; 1 또는 2개의 탄소원

자와 1 내지 5개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 할로게노알킬, 할로게노알콕시 및 할로게노알킬티오; 하이드록실; 알킬기당 1 또는 2개의 탄소원자를 갖는 디알킬아미노; 및 각각의 알킬 부위에 1 또는 2개의 탄소원자를 갖는 알킬알콕시인 화합물이다.

더욱 특히 바람직한 일반식(I)의 화합물은 R^1 이 메틸, 에틸, n- 및 i-프로필, n-, i-, s- 및 t-부틸, 플루오로메틸, 플루오로에틸, 플루오로프로필, 클로로프로필, 플루오로부틸, 클로로부틸, 디플루오로메틸, 디플루오로프로필, 디클로로프로필, 디플루오로부틸, 디클로로부틸, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로에틸, 트리클로로에틸 트리플루오로프로필, 트리클로로프로필, 트리플루오로부틸, 트리클로로부틸, 알릴, 부테닐, 프로파르길, 부티닐, 플루오로- 또는 클로로알릴, -부테닐, -프로파르길, -부티닐, 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로펜테닐 또는 사이클로헥세닐을 나타내거나, 비치환되거나 동일 또는 상이한 치환체로 일치한 또는 이치환된 페닐을 나타내고, 여기에서 적합한 치환체는 메틸, 에틸, n- 및 i-프로필, n-, i-, s-, 및 t-부틸, 메톡시, 에톡시, i- 및 n-프로폭시, n-, i-, s- 및 t-부톡시, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 펜타플루오로에틸, 테트라플루오로에틸, 트리플루오로클로로에틸, 트리플루오로에틸, 트리플루오로에톡시, 트리플루오로클로로에톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로메틸티오, 염소, 브롬 및 불소이며, R^2 및 R^5 가 수소를 나타내고, R^3 및 R^4 가 동일 또는 상이하며, 수소, 메틸, 에틸, n- 또는 i-프로필, n-, i-, s- 또는 t-부틸, 3-펜틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나, R^3 및 R^4 가 이들이 결합되어 있는 탄소원자와 함께는 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실환을 형성하거나, 또는 특히 R^3 이 i-프로필, s-부틸 또는 사이클로펜틸을 나타내고, R^4 가 수소를 나타내며, R^6 이 사이클로아킬 부위에 3, 5 또는 6개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 3개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬알킬, 또는 사이클로알케닐 부위에 5 내지 7개의 탄소원자와 비치환 또는 치환된 사이클로알케닐알킬을 나타내거나, 알킬에 의해 가교되고 사이클로알킬 부위에 5 내지 7개의 탄소원자를 가지며 가교 알킬 부위에 1 또는 2개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 3개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬알킬을 나타내며, 여기에서 적합한 치환체는 메틸, 에틸, n- 및 i-프로필, n-, i-, s- 및 t-부틸, 메톡시, 에톡시, i- 및 n-프로폭시, n-, i-, s- 및 t-부톡시, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 펜타플루오로에틸, 테트라플루오로에틸, 트리플루오로클로로에틸, 트리플루오로에틸, 트리플루오로에톡시,디플루오로메톡시, 펜타플루오로에톡시, 테트라플루오로에톡시, 트리플루오로클로로에톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로메틸티오, 하이드록실, 메틸티오, 에틸티오, n- 및 i-프로필티오, 디메틸아미노 및 디에틸아미노인 화합물이다.

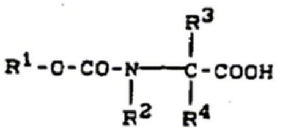
하기 일반식(I)의 치환된 아미노산 아미드 유도체는 A) 일반식(II)의 치환된 아미노산 또는 그의 카르복실-활성화 유도체를, 적합하다면 촉매의 존재하에, 필요에 따라 산-결합제의 존재하 및 적합하다면 희석제의 존재하에서, 일반식(III)의 아민과 반응시키거나, B) 일반식(IV)의 치환된 아미노산 아미드 유도체를 촉매의 존재하에서, 적합하다면 불활성 기체의 존재하 및 수소의 존재하에, 필요에 따라 희석제의 존재하 및 적합하다면 가압하에서 수소화시켜 수득한다.

화학식 2



(I)

화학식 3



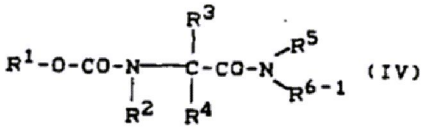
(II)

화학식 4



(III)

화학식 5

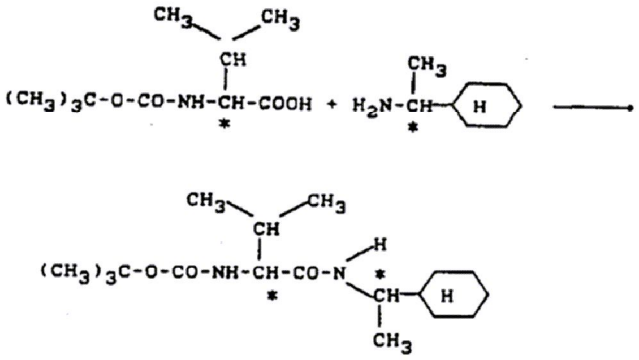


(IV)

상기 식에서, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 및 R^6 은 상기언급한 의미를 가지며, R^{6-1} 은 비치환 또는 치환된 페닐을 나타내고, 여기에서 적합한 치환체는 R^6 의 경우에서 상기에 언급돈 치환체이다.

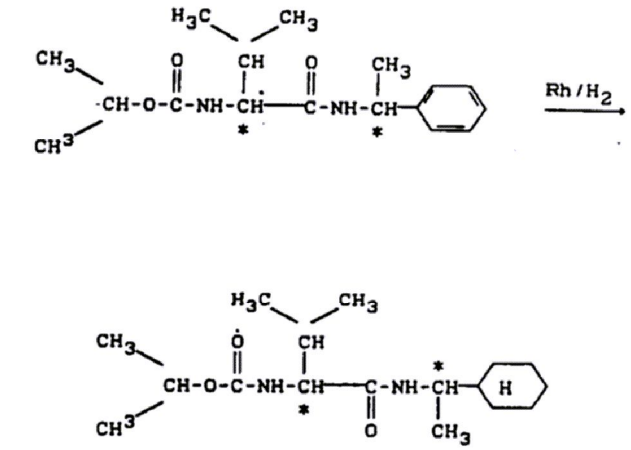
예를들어, 3 급-부톡시카르보닐-D/L-발린과 1-사이클로헥실에틸아민을 사용하는 경우에, 본 발명에 따른 방법 A의 과정은 다음 반응식으로 나타낼 수 있다 :

반응식 1



예를들어, N-(i-프로필옥시-카르보닐)-L-발린-페닐에틸아미드와 수소를, 촉매인 로듐과 함께 사용하는 경우에, 본 발명에 따른 방법 B의 과정은 다음 반응식으로 나타낼 수 있다 :

반응식 2



일반식(II)는 본 발명에 따른 방법(A)를 수행하는데 출발물질로서 사용되는 아미노산 유도체의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, R^1, R^2, R^3, 및 R^4 는 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식(I)의 물질의

설명과 관련하여 이들 치환체에 대해 바람직한 것으로서 앞에서 언급된 의미를 갖는다.

일반식(II)의 아미노산 유도체는 일반적으로 공지된 화합물이거나(참조 : Houber-Weyl, Methoden der organischen Chemie [Methods in Organic Chemisty], Volume XV, part 1 및 2, pages 46 이하 참조 및 112 이하 참조, Georg Thieme Verlag, Stuttgart 1974; D. Keller et al., Org. Synth. 60, 2145(1981); 또는 R.C. Sheppard, A Specialist Periodical Report, Amino-acids, Peptides and Proteins, The Royal Society of Chemistry, Burlington House, London 1978, 또는 I.P. Greenstein 및 M. Winitz, Chemistry of Amino Acids, I. Wiley Sons Inc. New York, London 1961; 또는 E. Schroder 및 K. Lubke, The Peptides Vol. I, Academic Press, New York, London 1965), 상기 문헌에 제시된 방법으로 수득할 수 있다.

본 발명에 따른 방법을 수행하는데 출발 물질로서 또한 사용되는 일반식(II)의 아미노산의 카르복실-활성화 유도체는 일반적으로 공지된 화합물이다.

일반식(II)의 아미노산의 적합한 카르복실-활성화 유도체는 모든 카르복실-활성화 유도체, 예를들면 산 클로라이드와 같은 산 할라이드, 산 아지드, 혼합 O-알킬카본산 무수물과 같은 대칭 및 혼합 무수물, 또한 p-니트로페닐 에스테르 또는 N-하이드록시숙신이미드 에스테르와 같은 활성화 에스테르, 및 디사이클로헥실카르보디이미드 또는 카르보닐 디이미다졸과 같은 축합제를 사용하여 동일 반응계내에서 제조되는 아미노산의 활성화 형태이다.

바람직하게 사용되는 물질은 일반식(II)의 아미노산에 상응하는 산 클로라이드 또는 혼합 무수물이다. 이들 화합물은 일반식(II)의 아미노산 또는 그의 염을 일반적인 통상의 방식으로, 할로겐화제 또는 혼합 무수물의 제조를 위해 일반적으로 공지된 시약중의 하나, 예를들면 오염화 인, 티오닐 클로라랬, 옥살릴 클로라이드 또는 이소부틸 클로로포르네이트와 반응시킴으로써 제조할 수 있다. 이소부틸 클로로포르메이트를 사용하는 것이 바람직하다.

반응은 방향족, 비-방향족 또는 할로겐화 탄화수소류, 예를들면 아세톤과 같은 케톤류; 에틸 아세테이트와 같은 에스테르류; 디메틸포름아미드와 같은 아미드류; 아세토니트릴과 같은 니트릴류; 메틸렌클로라이드와 같은 염소화탄화수소류; 톨루엔과 같은 탄화수소류; 또는 테트라하이드로푸란과 같은 에테르류 또는 이들의 혼합물과 같은 불활성 희석제의 존재하 및/또는 산 결합제, 예를들면 바람직하게는 트리에틸아민, 피리딘 또는 N-메틸피페리딘과 같은 3급 아민의 존재하에 -78℃ 내지 100℃, 바람직하게는 -60℃ 내지 25℃에서 수행할 수 있다.

일반식(III)은 본 발명에 따른 방법을 수행하는데 출발 물질로서 또한 사용되는 아민의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, R^5 및 R^6상기언급된 의미를 갖는다.

일반식(III)의 아민은 유기 화학 분야에서 일반적으로 공지된 화합물이다.

본 발명에 따른 방법(A)에 적합한 희석제는 불활성 유기 용매, 예를들면 아세톤 또는 에틸 메틸 케톤과 같은 케톤류; 에틸 아세테이트 또는 메틸 아세테이트와 같은 에스테르류; 디메틸포름아미드와 같은 아미드류; 아세토니트릴과 같은 니트릴류; 메틸렌 클로라이드 또는 사염화 탄소와 같은 염소화탄화수소류; 톨루엔과 같은 탄화수소류; 또는 테트라하이드로푸란과 같은 에테르류 및 또한 적합하다면 물 및 이들의 혼합물이다.

본 발명에 따른 방법에 적합한 산-결합제는 통상적인 무기 및 유기 산 결합제이다. 이러한 산-결합제에는 바람직하게는 3급 아민류, 예르들면 트리에틸아민, 피리딘 또는 N-메틸피페리딘 및 또한 무기 염기류, 예를들면 수산화 나트륨 및 수산화 칼류과 같은 금속 수산화물 또는 탄산 나트륨 또는 탄산 칼슘과 같은 금속 탄산염이 포함된다.

적합하다면, 본 발명에 따른 방법(A)는 촉매의 존재하에서 수행한다. 촉매의 예로는 4-디메틸아미노피리딘, 1-하이드록시벤조트리아졸 또는 디메틸포름아미드가 언급될 수 있다.

본 발명에 따른 방법(A)를 수행하는 경우에, 온도는 상당한 범위내에서 변화시킬 수 있다. 일반적으로, 공정은 -78℃ 내지 +120℃, 바람직하게는 -60℃ 내지 +40℃ 에서 수행한다.

본 발명에 따른 방법(A)를 수행하는 경우에, 반응물은 동몰량으로 사용하는 것이 바람직하다.

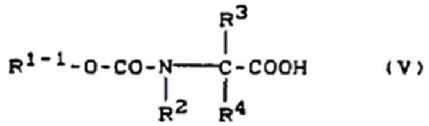
이 방법과 관련해서, 일반식(II)의 아미노산 유도체는 순수한 광학 이성체(D 또는 R 형태) 또는 라세미체로서 사용한다.

일반식(IV)는 본 발명에 따른 방법(B)를 수행하는데 출발 물질로서 사용되는 아미노산 아미드 유도체의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 및 R^{6-1} 은 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식(I)의 물질의 설명과 관련해서 이들 치환체에 대해 앞에서 언급된 의미를 갖는다.

일반식(IV)의 치환된 아미노산 아미드 유도체는 신규한 화합물로서, 본 출원인 회사의 비공개된 특허 출원 (참조 : 독일 특허 출원 제 P 4,026,966, P 3,915,755 호)의 대상이다.

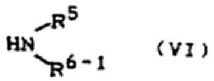
하기 일반식(IV)의 신규한 아미노산 아미드 유도체는 예를들면, 일반식(V)의 치환된 아미노산 또는 그의 카르복실-활성화 유도체를 디클로로메탄중에서 예를들어 산 결합제인 N-메틸피페리딘, 및 이소부틸 클로로포르메이트의 존재하에, -60℃ 내지 -10℃의 온도에서 일반식(VI)의 아민과 반응시켜 수득한다.

화학식 6



(V)

화학식 7



(VI)

상기 식에서, R^2, R^3, R^4 및 R^5 는 상기언급된 의미를 가지며, R^{1-1}은 알킬 또는 사이클로알킬을 나타내고, R^{6-1} 비치환 또는 치환된 페닐이며, 여기에서 적합한 페닐 치환체는 R^6 의 경우에서 상기에 언급된 치환체이다.

일반식(V)의 포름산과 일반식(IV)의 아민은 유기 화학분야에서 일반적으로 공지된 화합물이다.

본 발명에 따른 방법(B)에 적합한 희석제는 불활성 유기 용매, 예를들면 에탄올, 이소프로판올 또는 s-부탄올과 같은 알코올류; 또는 n-헥산 또는 사이클로헥산과 같은 포화 탄화수소류이다.

본 발명에 따른 방법(B)를 수행하는 경우에, 온도는 상당한 범위내에서 변화시킬 수 있다. 일반적으로, 공정은 50℃ 내지 250℃, 바람직하게는 0℃ 내지 200℃에서 수행한다.

일반식(I)의 신규한 아미노산 아미드 유도체를 제조하는 방법(B)는 일반적으로 승압하에서 수행한다.

일반적으로, 공정은 50 내지 250 바, 바람직하게는 100 내지 200 바의 압력에서 수행한다.

그러나, 특정 조건하에서는, 공정은 또한 대기압 또는 감압하에서 수행할 수도 있다.

이러한 목적에 적합한 불활성 기체는 질소 및 실질적인 모든 0 족 기체, 특히 아르곤이다.

본 발명에 따른 방법(B)를 수행하기 위해서는, 일반식(IV)의 치환된 아미노산 아미드 유도체 1 몰당 0.001 내지 1 몰, 바람직하게는 0.005 내지 0.5 몰의 촉매가 일반적으로 사용된다.

본 발명에 따른 방법(B)는 이러한 형태의 반응에 통상적인 촉매하에서 수행한다. 촉매로는 금속 및/또는 원소의 주기율표의 VIII 아족금속의 염 또는 착물이 바람직하게 사용되며; 루테늄, 로듐, 팔라듐 및 백금이 특히 언급된다.

본 발명은 순수한 이성체 뿐만 아니라 이들의 혼합물도 포함한다. 이들 혼합물은 통상적인 방법에 의해, 예를들면 적합한 용매로 분별 결정하거나 실리카 겔 또는 산화 알루미늄상에서 크로마토그래피함으로써 분리하여 각 성분을 수득할 수 있다. 라세미체는 통상적인 방법으로, 예를들면 캄포르술폰산 또는 디벤조일타르타르산과 같은 광학 활성산으로 염을 형성시키고 분별 결정하거나, 적합한 광학 활성 시약을 사용하여 유도체를 형성하고 부분입체 이성체 유도체를 분할한 후 역-전화시키거나, 또는 광학적 활성 컬럼 물질상에서 분할하는 방법에 의해 각각의 거울상 이성체로 분할할 수 있다.

본 발명에 따른 일반식(I)의 활성 화합물은 해충에 대해 강력한 작용을 가지며 원치않는 유해한 유기체를 퇴치하는데 실제적으로 사용할 수 있다. 본 발명의 활성 화합물은 식물 보호제, 특히 살진균제로 사용하기에 적합하다.

식물 보호에 있어서 살진균제는 플라스모디오포로마이세테스(Plasmodiophoromycetes), 난균류(Oomycetes), 키트리디오마이세테스(Chytridiomycetes), 접합균류(Zygomycetes), 자낭균류(Ascomycetes), 담자균류(Basidiomycetes) 및 불완전균류(Deuteromycetes)를 퇴치하는데 사용된다.

상기에 기재된 속명에 속하는 진균성 질병의 원인균들의 예로는 하기의 것들이 언급될 수 있으나, 이는 제한의 목적으로 주어진 것은 아니다: 피티움 울티뭄(Pythium ultimum)과 같은 피티움 종: 파이토프토라 인페스탄스(Phytophthora infestans)와 같은 파이토프토라 종; 슈도페로노스포라 휴뮬리(Pseudoperonospora humuli) 또는 슈도페로노스포라 쿠벤시스(Pseudoperonospora cubensis)와 같은 슈도페로노스포라 종; 플라스모파라 비티콜라(Plasmopara viticola)와 같은 플라스모파라 종; 페로노스포라 피시(Peronospora pisi) 또는 페로노스포라 브라시카(P. brassicae)와 같은 페로노스포라 종; 에리시페 그라미니스(Erysiphe graminis)와 같은 에리시페 종; 스페로테카 풀리기니아(Sphaerotheca fuliginea)와 같은 스페로테카 종; 포도스페라 류코트리챠(Podosphaera leucotricha)와 같은 포도스페라 종; 벤투리아

이네쿠알리스(Venturia inaequalis)와 같은 벤투리아 종; 피레노포라 테레스(Pyrenophora teres) 또는 피레노포라 그라미니아(P. graminea)(분생자 형태 : 드레크슬레라(Drechslera), 동의어 : 헬민 토스포리움(Helminthosporium))와 같은 피레노포라 종; 코클리오볼루스 사티부스(Cochliobolus sativus)(분생자 형태 : 드레크슬레라, 동의어 : 헬민토스포리움)와 같은 코클리오볼루스 종; 유로마이세스 아펜디쿨라투스(Uromyces appendiculatus)와 같은 유로마이세스 종; 푸치니아 레콘디타(Puccinia recondita)와 같은 푸치니아 종; 틸레티아 카리스(Tilletia caries)와 같은 틸레티아 종; 유스틸라고 누다(Ustilago nuda) 또는 유스틸라고 아베나(Ustilago avenae)와 같은 유스틸라고 종; 펠리쿨라리아 사사키(Pellicularia sasakii)와 같은 피리쿨라리아 종; 피리쿨라리아 오리자(Pyricularia oryzae)와 같은 피리쿨라리아 종; 푸사리움 쿨모룸(Fusarium culmorum)과 같은 푸사리움 종; 보트리티스 시네레아(Botrytis cinerea)와 같은 보트리티스 종; 셉토리아 노도룸(Septoria nodorum)과 같은 셉토리아 종; 렙토스페리아 노도룸(Leptosphaeria nodorum)과 같은 렙토스페리아 종; 세르코스포라 카네센스(Cercospora canescens)와 같은 세르코스포라 종; 알터나리아 브라시카(Alternaria brassicae)와 같은 알터나리아 종 및 슈도세르코스포렐라 헤르포트리코이데스(Pseudocercosporella herpotrichoides)와 같은 슈도세르코스폴렐라 종.

식물 질병을 퇴치하는데 필요한 농도의 활성 화합물에 대해 식물은 우수한 내성을 가지므로 식물의 지상부, 영양 번식 줄기와 종자, 및 토양의 처리가 가능하다.

이와 관련해서, 본 발명에 따른 활성 화합물은 보호적으로 토마토에 대해서는 파이토프토라 종 및 포도나무에 대해서는 플라스모파라 종을 퇴치하는데 특히 성공적으로 사용할 수 있다.

본 발명의 활성 화합물은 그들의 특별한 물리적 및/또는 화학적 특성에 따라, 용액제, 유제, 현탁제, 산제, 거품제, 페이스트, 과립제, 에어로졸, 중합물질 및 종자용 피복 조성물중의 극미세 캅셀제, ULV 냉무제 및 온무제와 같은 통상의 제제로 전환시킬 수 있다.

이러한 제제는 공지의 방법으로 예를들면, 임의로 계면-활성제, 즉 유화제 및/또는 분산제 및/또는 포움-형성제를 사용하여, 활성화합물을 증량제, 즉 액상 용매, 가압 액화 가스 및/또는 고형 담체와 혼합하여 제조한다. 증량제로 물을 사용하는 경우에는, 예를들어 유기 용매를 또한 보조 용매로 사용할 수 있다. 액상 용매로는 주로 크실렌, 톨루엔 또는 알킬나프탈렌과 같은 방향족류, 클로로벤젠, 클로로에틸렌 도는 메틸렌 클로라이드와 같은 염소화 방향족 또는 염소화 지방족 탄화수소류, 사이클로헥산 또는 파라핀, 예를들면 광유 분류물과 같은 지방족 탄화수소류, 부탄올 또는 글리콜과 같은 알코올류 및 이들의 에테르류 및 에스테르류, 아세톤, 메틸 에틸 케톤, 메틸 이소부틸 케톤 또는 사이클로헥사논과 같은 케톤류, 디메틸포름아미드 및 디메틸술폭시드와 같은 강한 극성 용매류 및 물이 적합하고; 액화 가스상 증량제 또는 담체란 주위온도 및 대기압하에서 가스상태인 액체, 예를들면 할로겐화 탄화수소, 부탄, 프로판, 질소 및 이산화 탄소와 같은 에어로졸 추진제를 의미하며; 고형 담체로서는 예를들면 카올린, 점토, 활석, 백악, 석영, 아타펄기트(attapulgite), 몬모릴로나이트 또는 규조토와 같은 분쇄 천연 광물류, 및 고-분산 실리카, 알루미나 및 실리케이트와 같은 분쇄 합성 광물류가 적합하고; 과립제용 고형 담체로는 예를들면, 방해석, 대리석, 경석, 해포석 및 백운석과 같은 분쇄 및 파쇄된 천연 광석, 무기 및 유기 가루의 합성 과립, 및 톱밥, 코코넛 껍질, 옥수수 속 및 담배줄기와 같은 유기 물질의 과립이 적합하며; 유화제 및/또는 포움-형성제로서는, 예를들면 폴리옥시에틸렌 지방산 에스테르류, 폴리옥시에틸렌 지방 알코올 에테르류, 예를들면 알킬아릴 폴리글리콜 에테르류, 알킬 술포네이트류, 아릴 술포네이트류와 같은 비이온성 및 음이온성 유화제 및 알부민 가수분해 산물이 적합하고; 분산제로서는 예를들면 리그닌-설파이트 폐액 및 메틸셀룰로오스가 적합하다.

접착제, 예를들면 카르복시메틸셀룰로오스, 및 아라비아 고무, 폴리비닐 알코올 및 폴리비닐 아세테이트와 같은 분말, 과립 또는 유액 형태의 천연 및 합성 중합체, 세팔린 및 레시틴과 같은 천연 인지질류 및 합성 인지질류가 제제에 사용될 수 있다. 그외의 다른 첨가제로 광유 및 식물유가 사용될 수도 있다.

산화 철, 산화 티탄 및 프루시안 블루와 같은 무기 안료, 및 알리자린 염료, 아조 염료 및 금속 프탈로시아닌 염료와 같은 유기염료와 같은 착색제 및 철, 망간, 붕소, 구리, 코발트, 몰리브덴 및 아연의 염들과 같은 미량 영양소를 사용하는 것도 가능하다.

제제는 일반적으로 0.1 내지 95 중량%, 바람직하게는 0.5 내지 90 중량%의 활성 화합물을 함유한다.

본 발명에 따른 활성 화합물은 살진균제, 살충제, 살비제 및 제초제와 같은 다른 공지의 활성 화합물과의 혼합물, 및 비료 및 생장 조절제와의 혼합물로서 제제중에 존재할 수 있다.

활성 화합물들은 그대로, 또는 제제의 형태로 또는 즉석 사용 용액제, 현탁제, 수화성 산제, 페이스트, 가용성 산제, 분제 및 과립제와 같이 그들의 제제형태로부터 제조된 사용형으로 이용될 수 있다. 그들은 통상적인 방법으로, 예를들면 관수, 스프레이, 분무, 살포, 산포, 발포, 솔질 등에 의해 사용된다. 또한, 활성 화합물들을 초저량법으로 적용하거나 활성 화합물 제제 또는 활성 화합물 그 자체를 토양에 주입할 수도 있다. 또한, 식물의 종자를 처리할 수도 있다.

식물의 부분 처리시, 사용형중의 활성 화합물의 농도는 상당한 범위내에서 변화시킬 수 있다. 이 농도는 일반적으로 1 내지 0.0001 중량%, 바람직하게는 0.5 내지 0.001 중량%이다.

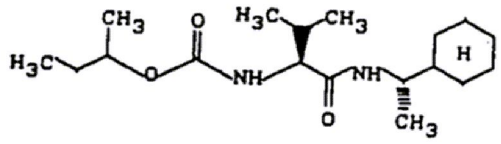
종자 처리시, 종자 1kg 당 0.001 내지 50g, 바람직하게는 0.01 내지 10g의 활성 화합물의 양이 일반적으로 필요하다.

토양 처리시, 0.00001 내지 0.1 중량%, 바람직하게는 0.0001 내지 0.02 중량%의 활성 화합물의 농도가 작용 장소에 필요하다.

[제조실시예]

[실시예]

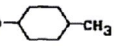
화학식 8



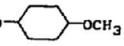
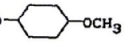
오오토클레이브중에서, N^2 -2급-부틸옥시카르보닐-N^1-(S(-)-1-페닐에틸)-L-발린아미드 3.2g (10밀리몰)을 2급-부탄올 50ml에 용해시키고 촉매로서 로듐 블랙 0.5g을 가한다. 혼합물을 150 바의 수소압 및 150℃의 온도에서 12 시간동안 수소화시킨다. 후처리 공정으로, 촉매를 여과하여 제거하고, 진공하에서 여액으로부터 용매를 제거한다. 정제 공정으로 잔류물을 디이소프로필 에테르와 함께 1 회 교반한다. 융점 186℃인 무색의 N^2 -2급-부틸옥시카르보닐-N^1 -(S(+)-1-사이클로헥실에틸)-L-발린아미드 2.93g (이론치의 90%)을 수득한다.

다음 일반식(I)의 화합물을 실시예 1 과 유사한 방법으로 수득한다 :

[표 1a]

번호	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	물리적 상수
2	-CH(CH$_3$)-CH$_2$CH$_3$	H	-CH(CH$_3$)$_2$	H	H	-CH(CH$_3$)-	mp.: 186° C
3		H	-CH(CH$_3$)$_2$	H	H	-CH(CH$_3$)-	mp.: 146-147° C
4	-CH(CH$_3$)$_2$	H	-CH(CH$_3$)$_2$	H	H	-CH(CH$_3$)-	mp.: 190° C
5	-CH(CH$_3$)-CH$_2$CH$_3$	H	-CH(CH$_3$)$_2$	H	H	-CH(CH$_3$)-	mp.: 178° C (R-)-아민
6	-CH(CH$_3$)$_2$	H	-CH(CH$_3$)$_2$	H	H	-CH(CH$_3$)-	mp.: 111° C

[표 1b]

번호	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	물리적 상수
7	-CH(CH$_3$)$_2$	H	-CH(CH$_3$)$_2$	H	H	-CH(CH$_3$)-	mp.: 165° C (R-)-아민
8	-CH(CH$_3$)$_2$	H	-CH(CH$_3$)$_2$	H	H	-CH(CH$_3$)-	mp.: 145° C
9	-CH(CH$_3$)$_2$	H	-CH(CH$_3$)$_2$	H	H	-CH(CH$_3$)-	mp.: 123° C
10	-CH(CH$_3$)-CH$_2$CH$_3$	H	-CH(CH$_3$)$_2$	H	H	-CH(CH$_3$)-	mp.: 125° C
11	-CH(CH$_3$)$_2$	H	-CH(CH$_3$)$_2$	H	H	-CH(CH$_3$)-	mp.: 127° C

[표 1c]

번호	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	물리적 상수
12	$-CH(CH_3)-CH_2CH_3$	H	$-CH(CH_3)_2$	H	H	$-CH(CH_3)$-Ph-CH_3	mp.: 100°C
13	$-CH(CH_3)_2$	H	$-CH(CH_3)_2$	H	H	$-CH(CH_3)$-Ph-CH_2-CH_3	mp.: 150°C
14	$-CH(CH_3)_2$	H	$-CH(CH_3)_2$	H	H	$-CH(CH_3)$-Ph-CH_3	mp.: 153°C (R+)-아민
15	$-CH(CH_3)_2$	H	$-CH(CH_3)_2$	H	H	$-CH(CH_3)$-Ph-CH_2-CH_3	mp.: 118°C (R+)-아미드
16	$-CH(CH_3)CH_2CH_3$	H	$-CH(CH_3)_2$	H	H	$-CH(CH_3)$-Ph-CH_3	mp.: 90°C (R+)-아미드

[표 1d]

번호	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	물리적 상수
17	$-CH(CH_3)_2$	H	$-CH(CH_3)_2$	H	H	$-CH(CH_3)$-Ph-OCH_3	mp.: 115°C (R+)-아미드
18	$-CH(CH_3)-CH_2CH_3$	H	$-CH(CH_3)_2$	H	H	$-CH(CH_3)$-Ph-OCH_3	라세미체
19	$-CH(CH_3)-CH_2CH_3$	H	$-CH(CH_3)_2$	H	H	$-CH(CH_3)$-Ph-CH_2CH_3	라세미체 (R+)-아민
20	$-CH(CH_3)-CH_2CH_3$	H	$-CH(CH_3)_2$	H	H	$-CH(CH_3)$-Ph-CH_2CH_3	(R+)-아미드

[실시예 A]

파이토프토라 시험(토마토) / 보호활성

용 매 : 4.7 중량부의 아세톤

유화제 : 0.3 중량부의 알킬-아릴폴리글리콜 에테르

적합한 활성 화합물의 제제를 제조하기 위해서, 1 중량부의 활성화합물을 상기 량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적 농도가 되도록 물로 희석시킨다.

보호 활성에 대한 시험을 위해, 어린 식물에 활성 화합물의 제제를 촉촉히 젖을 정도까지 분무한다. 분무 피복층이 건조되면, 파이토프토라 인페스탄스의 포자 수성 현탁액으로 식물을 접종시킨다.

식물을 100% 의 상대 대기 습도 및 약 20℃의 온도의 배양실에 놓아둔다.

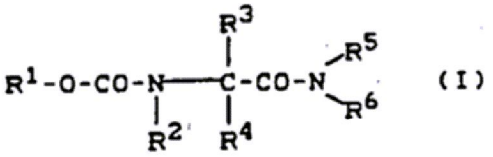
접종 3 일후 평가를 실시한다.

이 실험에서는, 선행 기술과 비교하여 명백히 월등한 활성이 예를들면 제조실시예 1, 7, 12, 13 및 14에 따른 화합물에 의해 나타났다.

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 일반식(I)의 아미노산 아미드 유도체 :



상기 식에서, R^1 은 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로게노알킬, 할로게노알케닐, 할로게노알키닐, 사이클로알킬, 사이클로알케닐, 비치환 또는 치환된 아릴, 비치환 또는 치환된 아르알킬, 비치환 또는 치환된 헤테로아릴, 또는 비치환 또는 치환된 헤테로아릴알킬을 나타내고, R^2 및 R^5 는 동일 또는 상이하며, 수소 도는 저급 알킬을 나타내고, R^3 및 R^4 는 수소, 사이클로알킬 또는 알킬을 나타내거나, R^3 과 R^4 가 이들이 결합되어 있는 탄소 원자와 함께는 사이클로알킬환을 형성하며, R^6 은 비치환 또는 치환된 직쇄 또는 측쇄 사이클로알킬알킬, 비치환 또는 치환된 직쇄 또는 측쇄 사이클로알케닐알킬 또는 알킬-가교된 사이클로알킬알킬을 나타낸다.

청구항 2

제1항에 있어서, R^1 이 1 내지 6개의 탄소원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 알킬, 2 내지 6개의 탄소원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 알케닐 도는 알키닐, 1 내지 6개의 탄소원자와 1 내지 9개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 할로게노알킬, 2 내지 6개의 탄소원자와 1 내지 9개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 할로게노알케닐 또는 할로게노알키닐, 또는 3 내지 7개의 탄소원자를 갖는 치환 또는 비치환된 사이클로알킬 또는 사이클로알케닐을 나타내거나, 각 경우 비치환 또는 치환된 페닐 또는 피리딜, 또는 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소 원자를 가지며 비치환되거나 페닐 부위에서 치환된 페닐알킬을 나타내고, 여기에서 각 경우에 피리딜 또는 페닐 부위에 치환체는 각 경우에 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 알킬, 알콕시 및 알킬티오; 각 경우에 1 내지 4개의 탄소 원자와 1 내지 9개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 할로게노알킬, 할로게노알콕시 및 할로게노알킬티오; 할로겐; 각각의 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 알킬알콕시; 및 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 카르보닐알콕시이며; R^2 및 R^5가 수소 또는 메틸을 나타내고, R^3 및 R^4가 동일 또는 상이하며, 수소, 3 내지 7개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬, 또는 1 내지 6개의 탄소원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 알킬을 나타내거나, 또는 R^3과 R^4가 이들이 결합되어 있는 탄소원자와 함께는 탄소수 3 내지 7의 사이클로알킬환을 형성하고, R^6이 사이클로알킬 부위에 3 내지 7개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 6개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬알킬, 또는 사이클로알케닐 부위에 5 내지 8개의 탄소 원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 6개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알케닐알킬을 나타내거나, 사이클로알킬 부위에 5 내지 8개의 탄소원자를 가지며 알킬에 의해 가교 되고 가교 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 6개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬알킬을 나타내며, 여기에서 치환체는 각 경우에 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 알킬, 알콕시 및 알킬티오; 각 경우에 1 내지 4개의 탄소원자와 1 내지 9개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 할로게노알킬, 할로게노알콕시 및 할로게노알킬티오; 하이드록실; 알킬기당 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 디알킬아미노; 및 각각의 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 알킬알콕시인 일반식(I)의 화합물.

청구항 3

제1항에 있어서, R^1 이 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 알킬, 2 내지 4개의 탄소원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 알케닐 또는 알키닐, 1 내지 4개의 탄소원자와 1 내지 5개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 할로게노알킬, 2 내지 4개의 탄소원자와 1 내지 5개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 할로게노알케닐 또는 할로게노알키닐, 또는 3 내지 6개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬 또는 사이클로알케닐을 나타내거나, 또한 비치환되거나 동일 상이한 치환체로 일치환 내지 삼치환된 페닐을 나타내고, 여기에 치환체는 각 경우에 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 알킬, 알콕시 및 알킬티오; 1 또는 2개의 탄소원자와 1 내지 5개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 할로게노알킬, 할로게노알콕시 및 할로게노알킬티오; 불소, 염소, 브롬 및 요오드; 각각의 알킬 부위에 1 또는 2개의 탄소원자를 갖는 알킬 알콕시; 및 알킬 부위에 1 또는 2개의 탄소원자를 갖는 카르보닐알콕시이며; R^2 및 R^5 가 수소이고, R^3 및 R^4 가 동일 또는 상이하며, 수소, 3 내지 6개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬, 또는 1 내지 5개의 탄소원자를 갖는 직쇄 또는 측쇄 알킬을 나타내거나, 또는 R^3 과 R^4 가 이들이 결합되어 있는 탄소원자와 함께하는 탄소수 3 내지 6의 사이클로알킬환을 형성하고, R^6 이 사이클로알킬 부위에 3 내지 6개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬알킬, 또는 사이클로알케닐 부위에 5 내지 7개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알케닐알킬을 나타내거나, 사이클로알킬 주위에 5 내지 7개의 탄소원자를 가지며 알킬에 의해 가교 되고 가교 알킬 부위에 1 내지 3개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 4개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬알킬을 나타내며, 여기에서 치환체는 각 경우에 1 내지

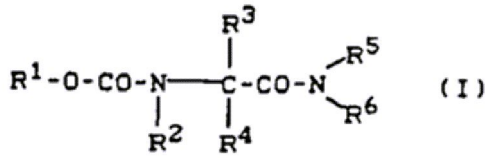
4개의 탄소원자를 갖는 알킬, 알콕시 및 알킬티오; 1 또는 2개의 탄소원자와 1 내지 5개의 동일 또는 상이한 할로겐 원자를 갖는 할로게노알킬, 할로게노알콕시 및 할로게노알킬티오; 하이드록실; 알킬기당 1 또는 2개의 탄소원자를 갖는 디알킬아미노; 및 각각의 알킬 부위에 1 또는 2개의 탄소원자를 갖는 알킬 알콕시의 일반식(I) 화합물.

청구항 4

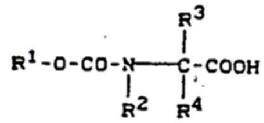
제1항에 있어서, R^1 이 메틸, 에틸, n- 및 i-프로필, n-, i-, s- 및 t-부틸, 플루오로메틸, 플루오로에틸, 플루오로프로필, 클로로프로필, 플루오로부틸, 클로로부틸, 디플루오로메틸, 디플루오로프로필, 디클로로프로필, 디플루오로부틸, 디클로로부틸, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로에틸, 트리클로로에틸, 트리플루오로프로필, 트리클로로프로필, 트리플루오로부틸, 트리클로로부틸, 알릴, 부테닐, 프로파르길, 부티닐 플루오로- 또는 클로로알릴, -부테닐, -프로파르길, -부티닐, 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로펜테닐 또는 사이클로엑세닐을 나타내거나, 비치환되거나 동일 또는 상이한 치환체로 일치환 또는 이치환된 페닐을 나타내고, 여기에서 치환체는 메틸, 에틸, n- 및 i-프로필, n-,i-, s- 및 t-부틸, 메톡시, 에톡시, i- 및 n-프로폭시, n-, i-, s- 및 t-부톡시, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 펜타플루오로에틸, 테트라플루오로에틸, 트리플루오로클로로에틸, 트리플루오로에틸, 트리플루오로에톡시, 디플루오로메톡시, 펜타플루오로에톡시, 테트라플루오로에톡시, 트리플루오로클로로에톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로메틸티오, 염소, 브롬 및 불소이며, R^2 및 R^5 가 수소를 나타내고, R^3 및 R^4 가 동일 또는 상이하며, 수소, 메틸, 에틸, n- 또는 i-프로필, n-, i-, s- 또는 t-부틸, 3-펜틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나, R^3 과 R^4 가 이들이 결합되어 있는 탄소원자와 함께는 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실환을 형성하고, R^6 이 사이클로알킬 부위에 3, 5 또는 6개의 탄소원자의 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 3개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬알킬, 또는 사이클로알케닐 부위에 5 내지 7개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 3개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알케닐알킬을 나타내거나, 알킬에 의해 가교되고 사이클로알킬 부위에 5 내지 7개의 탄소원자를 가지며 가교 알킬 부위에 1 또는 2개의 탄소원자와 직쇄 또는 측쇄 알킬 부위에 1 내지 3개의 탄소원자를 갖는 비치환 또는 치환된 사이클로알킬알킬을 나타내며, 여기에서 치환체는 메틸, 에틸 n- 또는 i-프로필, n-, i-, s- 또는 t-부틸, 메톡시, 에톡시, i- 및 n-프로폭시, n-, i-, s- 또는 t-부톡시, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 펜타플루오로에틸, 테트라플루오로에틸, 트릴플루오로클로로에틸, 트리플루오로에틸, 트리플루오로에톡시, 디플루오로메톡시, 펜타플루오로에톡시, 테트라플루오로에톡시, 트리플루오로클로로에톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로메틸티오, 하이드록실, 메틸티오, 에틸티오, n- 및 i-프로필티오, 디메틸아미노 및 디에틸아미노인 일반식(I)의 화합물.

청구항 5

일반식(II)의 치환된 아미노산 또는 카르복실-활성화 유도체를 촉매의 존재 또는 부재하, 산-결합제의 존재 또는 부재하 및 희석제의 존재 또는 부재하에서 일반식(III)의 아민과 반응시키거나; 일반식(IV)의 치환된 아미노산 아미드 유도체를 촉매의 존재하에, 불활성 기체의 존재 또는 부재하에서, 수소의 존재하에, 희석제의 존재 또는 부재하 및 가압 도는 비가압하에서 수소화시킴을 특징으로 하여, 하기 일반식(I)의 아미노산 아미드 유도체를 제조하는 방법.



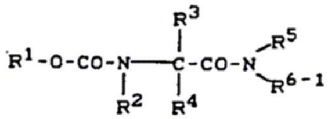
(I)



(II)



(III)



(IV)

상기 식에서, R^1, R^2, R^3,R^4, R^5 및 R^6 은 제 1 항에 제시된 의미를 가지며, R^{6-1} 은 비치환 또는 치환된 페닐을 나타내고, 여기에서 페닐 치환체는 R^6 에 대해 제 1 항에서 언급된 치환체이다.

청구항 6

제1 내지 5 항중 어느 하나에 따른 일반식(I)의 아미노산 아미드 유도체를 하나 이상 함유함을 특징으로 하는 살충제.

청구항 7

제1 내지 5 항중 어느 하나에 다른 일반식(I)의 아미노산 아미드 유도체를 해충 또는 이들의 환경에 적용시킴을 특징으로 하여 해충을 퇴치하는 방법.

청구항 8

제1 내지 5 항중 어느 하나에 따른 일반식(I)의 아미노산 아미드 유도체를 증량제 및 계면활성제로 구성된 그룹중에서 선택된 하나이상의 성분과 혼합함을 특징으로 하여 살충제를 제조하는 방법.