



(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2010-0105890  
(43) 공개일자 2010년09월30일

(51) Int. Cl.

*C07D 417/14* (2006.01) *C07D 417/04* (2006.01)

*A01N 43/78* (2006.01) *A01P 1/00* (2006.01)

(21) 출원번호 10-2010-7018518

(22) 출원일자(국제출원일자) 2009년01월22일

심사청구일자 없음

(85) 번역문제출일자 2010년08월20일

(86) 국제출원번호 PCT/US2009/031618

(87) 국제공개번호 WO 2009/094407

국제공개일자 2009년07월30일

(30) 우선권주장

61/062,367 2008년01월25일 미국(US)

(71) 출원인

이 아이 듀폰 디 네모아 앤드 캄파니

미합중국 델라웨어주 (우편번호 19898) 월밍톤시  
마아캣트 스트리트 1007

(72) 발명자

하나간, 마리, 앤

미국 19711 텔라웨어주 네워크 컨트리 플라워 로  
드 108

파스테리스, 로버트, 제임스

미국 19713 텔라웨어주 네워크 콜로라도 드라이브  
842

(74) 대리인

양영준, 양영환, 김영

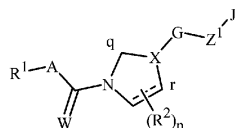
전체 청구항 수 : 총 11 항

(54) 살균제 아미드

(57) 요약

화학식 1 및 1A의 화합물 (모든 기하 이성질체 및 입체 이성질체 포함), 이들의 N-옥사이드, 및 이들의 염이 개시되어 있다.

[화학식 1]



또는

[화학식 1A]



상기 식에서,

$R^1$ ,  $R^2$ , A, G, M, W,  $Z^1$ , X, J,  $J^1$  및 n은 제 1 항에서 정의한 바와 같다.

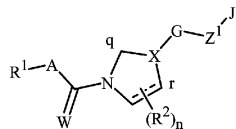
화학식 1의 화합물을 함유하는 조성물, 및 유효량의 본 발명의 화합물 또는 조성물을 적용하는 것을 포함하는, 균류 병원체에 의한 식물병을 방제하는 방법도 개시된다.

## 특허청구의 범위

### 청구항 1

화학식 1의 화합물, 및 이의 N-옥사이드 및 이의 염 중에서 선택되는 화합물:

[화학식 1]



상기 식에서,

R<sup>1</sup>은 임의로 치환된 페닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환 (heteroaromatic ring) 또는 임의로 치환된 나프탈레닐이고;

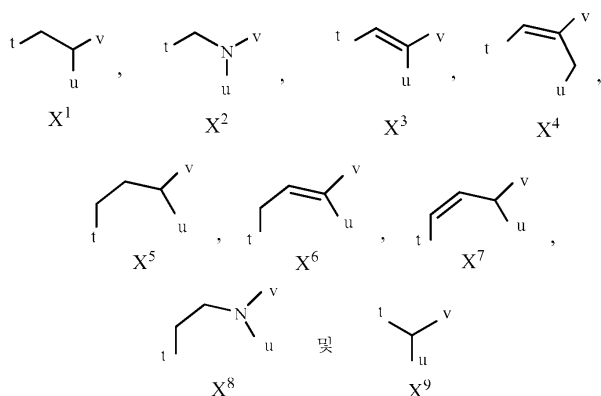
A는 CHR<sup>15</sup> 또는 NR<sup>16</sup>이며;

R<sup>15</sup>은 H, 할로젠, 시아노, 하이드록시, -CHO, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알키닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 할로알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 할로알키닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬티오알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설퍼닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설포닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 알콕시카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 알콕시카르보닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 알킬아미노카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 다이알킬아미노카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설포닐 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬설포닐이고;

R<sup>16</sup>은 H, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알키닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 할로알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 할로알키닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬티오알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설퍼닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설포닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 알콕시카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 알콕시카르보닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 알킬아미노카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 다이알킬아미노카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설포닐 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬설포닐이며;

W는 O 또는 S이고;

X는:



(여기서, "t"로 특정된 X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, X<sup>5</sup>, X<sup>6</sup>, X<sup>7</sup>, X<sup>8</sup> 또는 X<sup>9</sup>의 결합은 화학식 1의 "q"로 특정된 탄소 원자에 연결되고, "u"로 특정된 결합은 화학식 1의 "r"로 특정된 탄소 원자에 연결되며, "v"로 특정된 결합은 G에 연결된다) 중에서 선택되는 라디칼이며;

각 R<sup>2</sup>는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알케닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, 할로젠, 시아노 또는 하이드록시이

거나;

2개의  $R^2$ 는 함께  $C_1-C_4$  알킬렌 또는  $C_2-C_4$  알케닐렌으로서 취해 가교 이환계 (bicyclic ring system) 또는 융합 이환계를 형성하거나;

이중 결합으로 결합된 인접한 환 탄소 원자에 부착되는 2개의  $R^2$ 는 함께,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $C_1-C_4$  할로알콕시, 할로젠, 하이드록시, 아미노, 시아노 및 니트로 중에서 선택되는 1 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는  $-CH=CH-CH=CH-$ 로서 취해지고;

G는 임의로 치환된 5원 복소환이며;

J는 각각 탄소, 2개 이하의 O, 2개 이하의 S 및 4개 이하의 N 중에서 선택되는 4개 이하의 헤테로 원자, 및  $C(=O)$ ,  $C(=S)$ ,  $S(=O)_a(=NR^{23})_b$  및  $SiR^{17}R^{18}$  중에서 선택되는 3개 이하의 환 구성원 (ring member) 중에서 선택되는 환 구성원을 포함하고,  $-Z^2Q$  중에서 독립적으로 선택되는 1 내지 2개의 치환기로 치환되며,  $R^5$  중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환되는 5원, 6원 또는 7원 환, 8원 내지 11원 이환계 또는 7원 내지 11원 스피로환계 (spirocyclic ring system)이고;

각  $R^5$ 는 독립적으로 H, 할로젠, 시아노, 하이드록시, 아미노, 니트로,  $-CHO$ ,  $-C(=O)OH$ ,  $-C(=O)NH_2$ ,  $-NR^{25}R^{26}$ ,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_2-C_6$  알케닐,  $C_2-C_6$  알키닐,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_2-C_6$  할로알케닐,  $C_2-C_6$  할로알키닐,  $C_3-C_8$  사이클로알킬,  $C_3-C_8$  할로사이클로알킬,  $C_4-C_{10}$  알킬사이클로알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알킬알킬,  $C_6-C_{14}$  사이클로알킬사이클로알킬,  $C_4-C_{10}$  할로사이클로알킬알킬,  $C_5-C_{10}$  알킬사이클로알킬알킬,  $C_3-C_8$  사이클로알케닐,  $C_3-C_8$  할로사이클로알케닐,  $C_2-C_6$  알콕시알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알콕시알킬,  $C_3-C_8$  알콕시알콕시알킬,  $C_2-C_6$  알킬티오알킬,  $C_2-C_6$  알킬설피닐알킬,  $C_2-C_6$  알킬설포닐알킬,  $C_2-C_6$  알킬아미노알킬,  $C_3-C_8$  다이알킬아미노알킬,  $C_2-C_6$  할로알킬아미노알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알킬아미노알킬,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐,  $C_2-C_6$  할로알킬카르보닐,  $C_4-C_8$  사이클로알킬카르보닐,  $C_2-C_6$  알콕시카르보닐,  $C_4-C_8$  사이클로알콕시카르보닐,  $C_5-C_{10}$  사이클로알킬알콕시카르보닐,  $C_2-C_6$  알킬아미노카르보닐,  $C_3-C_8$  다이알킬아미노카르보닐,  $C_4-C_8$  사이클로알킬아미노카르보닐,  $C_2-C_6$  할로알콕시알킬,  $C_1-C_6$  하이드록시알킬,  $C_1-C_6$  알콕시,  $C_1-C_6$  할로알콕시,  $C_3-C_8$  사이클로알콕시,  $C_3-C_8$  할로사이클로알콕시,  $C_4-C_{10}$  사이클로알킬알콕시,  $C_2-C_6$  알케닐옥시,  $C_2-C_6$  할로알케닐옥시,  $C_2-C_6$  알키닐옥시,  $C_2-C_6$  할로알키닐옥시,  $C_2-C_6$  알콕시알콕시,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐옥시,  $C_2-C_6$  할로알킬카르보닐옥시,  $C_4-C_8$  사이클로알킬카르보닐옥시,  $C_3-C_6$  알킬카르보닐알콕시,  $C_1-C_6$  알킬티오,  $C_1-C_6$  할로알킬티오,  $C_3-C_8$  사이클로알킬티오,  $C_1-C_6$  알킬설피닐,  $C_1-C_6$  할로알킬설피닐,  $C_1-C_6$  알킬설포닐,  $C_1-C_6$  할로알킬설포닐,  $C_3-C_8$  사이클로알킬설포닐,  $C_3-C_{10}$  트라이알킬설피릴,  $C_1-C_6$  알킬설포닐아미노 또는  $C_1-C_6$  할로알킬설포닐아미노이며;

$R^{25}$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_3-C_8$  사이클로알킬,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐,  $C_2-C_6$  할로알킬카르보닐,  $C_2-C_6$  알콕시카르보닐 또는  $C_2-C_6$  할로알콕시카르보닐이고;

$R^{26}$ 는  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_3-C_8$  사이클로알킬,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐,  $C_2-C_6$  할로알킬카르보닐,  $C_2-C_6$  알콕시카르보닐,  $C_2-C_6$  할로알콕시카르보닐 또는  $-Z^4Q$ 이며;

각  $R^{17}$  및  $R^{18}$ 은 독립적으로  $C_1-C_5$  알킬,  $C_2-C_5$  알케닐,  $C_2-C_5$  알키닐,  $C_3-C_5$  사이클로알킬,  $C_3-C_6$  할로사이클로알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알킬알킬,  $C_4-C_7$  알킬사이클로알킬,  $C_5-C_7$  알킬사이클로알킬알킬,  $C_1-C_5$  할로알킬,  $C_1-C_5$  알콕시 또는  $C_1-C_5$  할로알콕시이고;

각 Q는 독립적으로, 각각 탄소 또는 질소 원자 환 구성원 상에서  $R^7$  중에서 독립적으로 선택되는 1 내지 2개의 치환기로 치환되며, 탄소 원자 환 구성원 상에서  $R^{7a}$ , 질소 원자 환 구성원 상에서  $R^{12}$  중에서 독립적으로 선택되

는 1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐, 벤질, 나프탈레닐, 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환 또는 8원 내지 11원 헤테로 방향족 (heteroaromatic) 이환계이거나;

각각 C(=O), C(=S), S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 환 구성원을 임의로 포함하고, 탄소 또는 질소 원자 환 구성원 상에서 R<sup>7</sup> 중에서 독립적으로 선택되는 1 내지 2개의 치환기로 치환되며, 탄소 원자 환 구성원 상에서 R<sup>7a</sup>, 질소 원자 환 구성원 상에서 R<sup>12</sup> 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환되는 3원 내지 7원 비방향족 탄소환, 5원, 6원 또는 7원 비방향족 복소환 또는 8원 내지 11원 비방향족 이환계이고;

각 R<sup>7</sup>은 독립적으로 -Z<sup>3G<sup>A</sup></sup>, -Z<sup>3G<sup>N</sup></sup> 또는 -Z<sup>3G<sup>P</sup></sup>이며;

각 G<sup>A</sup>는 독립적으로, 각각 탄소 원자 환 구성원 상에서 R<sup>v</sup>, 질소 원자 환 구성원 상에서 R<sup>22</sup> 중에서 독립적으로 선택되는 5개 이하의 치환기로 치환되는 페닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환이고;

각 G<sup>N</sup>은 독립적으로, (CR<sup>v</sup>)<sub>2</sub>, O, S, NR<sup>22</sup>, -C(R<sup>v</sup>)=C(R<sup>v</sup>)-, -C(R<sup>v</sup>)=N-, -N=N-, C(=O), C(=S), C(=NR<sup>23</sup>), S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 환 구성원을 포함하는 3원 내지 7원 비방향족 환이며;

각 G<sup>P</sup>는 독립적으로, (CR<sup>v</sup>)<sub>2</sub>, O, S, NR<sup>22</sup>, -C(R<sup>v</sup>)=C(R<sup>v</sup>)-, -C(R<sup>v</sup>)=N-, -N=N-, C(=O), C(=S), C(=NR<sup>23</sup>), S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 환 구성원을 포함하는 8원 내지 10원 방향족 또는 7원 내지 11원 비방향족 이환계이고;

각 R<sup>v</sup>는 독립적으로 H, 할로젠, 시아노, 하이드록시, 아미노, 니트로, -CHO, -C(=O)OH, -C(=O)NH<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -C(=S)NH<sub>2</sub>, -C(=O)NHCN, -C(=O)NHOH, -SH, -SO<sub>2</sub>NHCN, -SO<sub>2</sub>NHOH, -OCN, -SCN, -SF<sub>5</sub>, -NHCHO, -NHNH<sub>2</sub>, -N<sub>3</sub>, -NHOH, -NHCN, -NHC(=O)NH<sub>2</sub>, -N=C=O, -N=C=S, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알키닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시카르보닐, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알콕시카르보닐, C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub> 사이클로알킬알콕시카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬아미노카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알킬아미노카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알키닐, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 할로사이클로알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 알킬사이클로알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬알킬, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> 사이클로알킬사이클로알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 할로사이클로알킬알킬, C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub> 알킬사이클로알킬알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알케닐, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 할로사이클로알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알콕시알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시알콕시알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬티오알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬설퍼닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬설포닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬아미노알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알킬아미노알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알킬아미노알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬아미노알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬카르보닐, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬아미노카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> 시아노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 하이드록시알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알케닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알콕시알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시할로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알콕시할로알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 할로사이클로알콕시알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알케닐옥시알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 할로사이클로알케닐옥시알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알콕시알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>12</sub> 트라이알콕시알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시알케닐, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시알키닐, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 할로다이알킬아미노알킬, C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub> 사이클로알킬(알킬)아미노알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬(티오카르보닐), C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시알킬카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시카르보닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알콕시카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시알콕시카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> (알킬티오)카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시(티오카르보닐), C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬티오(티오카르보닐), C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬아미노(티오카르보닐), C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알킬아미노(티오카르보닐), C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시(알킬)아미노카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬설퍼닐아미노카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알킬설퍼닐아미노카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬아미디노, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알킬아미디노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬카르보닐옥시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬아미노설포닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노설포닐, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 트라이알킬설퍼닐, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알콕시, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 할로사이클로알콕시, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알케닐옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알케닐옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알키닐옥시, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 할로알키닐옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알킬카르보

닐옥시, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬카르보닐옥시, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알킬카르보닐알콕시, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬티오, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬설폰, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알케닐옥시, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 할로사이클로알케닐옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알콕시알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시할로알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알콕시할로알콕시, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시카르보닐알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬(티오카르보닐)옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬카르보닐티오, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬(티오카르보닐)티오, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬설피닐, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 할로트라이알킬설피닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬카르보닐아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬설폰아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로다이알킬아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알킬카르보닐아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬설폰아미노, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬알킬아미노, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬(알킬)아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시카르보닐알킬아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알콕시아미노, C<sub>4</sub>-C<sub>12</sub> 다이알킬이미도, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시카르보닐아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알콕시카르보닐아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬아미노카르보닐아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알킬아미노카르보닐아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알킬아미노카르보닐알킬아미노, C<sub>4</sub>-C<sub>12</sub> 다이알킬아미노카르보닐알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬아미노(티오카르보닐)아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알킬아미노(티오카르보닐)아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알킬아미노(티오카르보닐)알킬아미노 또는 C<sub>4</sub>-C<sub>12</sub> 다이알킬아미노(티오카르보닐)알킬아미노이며;

각 R<sup>7a</sup>는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알키닐, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 사이클로알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 알킬사이클로알킬, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 알킬사이클로알킬알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알키닐, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 할로사이클로알킬, 할로젠, 하이드록시, 아미노, 시아노, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설피닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설폰, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬설피닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬설폰, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 사이클로알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 하이드록시알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬카르보닐옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬카르보닐티오, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬아미노카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노카르보닐 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 트라이알킬설피닐이거나;

R<sup>5</sup> 및 R<sup>7a</sup>는 R<sup>5</sup> 및 R<sup>7a</sup>를 연결하는 원자와 함께, 탄소, 1개 이하의 O, 1개 이하의 S 및 1개 이하의 N 중에서 선택되는 3개 이하의 헤테로 원자, 및 C(=O), C(=S), S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 3개 이하의 환 구성원 중에서 선택되는 환 구성원을 포함하는 임의로 치환된 5원 내지 7원 환을 형성하고;

R<sup>12</sup>는 H, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 알킬카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 알콕시 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 알콕시카르보닐이며;

각 Z<sup>1</sup> 및 Z<sup>2</sup>는 독립적으로 직접 결합, O, C(=O), S(O)<sub>m</sub>, CHR<sup>20</sup> 또는 NR<sup>21</sup>이고;

각 Z<sup>3</sup>는 독립적으로 직접 결합, O, NR<sup>22</sup>, C(=O), C(=S), S(O)<sub>m</sub>, CHR<sup>20</sup>, CHR<sup>20</sup>-CHR<sup>20</sup>, CR<sup>24</sup>=CR<sup>27</sup>, C≡C, OCHR<sup>20</sup> 또는 CHR<sup>20</sup>이며;

각 Z<sup>4</sup>는 독립적으로 O, C(=O), S(O)<sub>m</sub> 또는 CHR<sup>20</sup>이고;

각 R<sup>20</sup>는 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬이며;

각 R<sup>21</sup>은 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알콕시카르보닐이고;

각 R<sup>22</sup>는 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬이며;

각 R<sup>23</sup>는 독립적으로 H, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 할로사이클로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬아미노 또는 페닐이고;

각  $R^{24}$  및  $R^{27}$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_4$  알킬 또는  $C_1-C_4$  할로알킬이며;

각 m은 독립적으로 0, 1 또는 2이고;

n은 0, 1 또는 2이며;

a 및 b는  $S(=O)_a(=NR^{23})_b$ 의 각 경우에, 독립적으로 0, 1 또는 2이되, 단 a와 b의 합계는 1 또는 2이다.

## 청구항 2

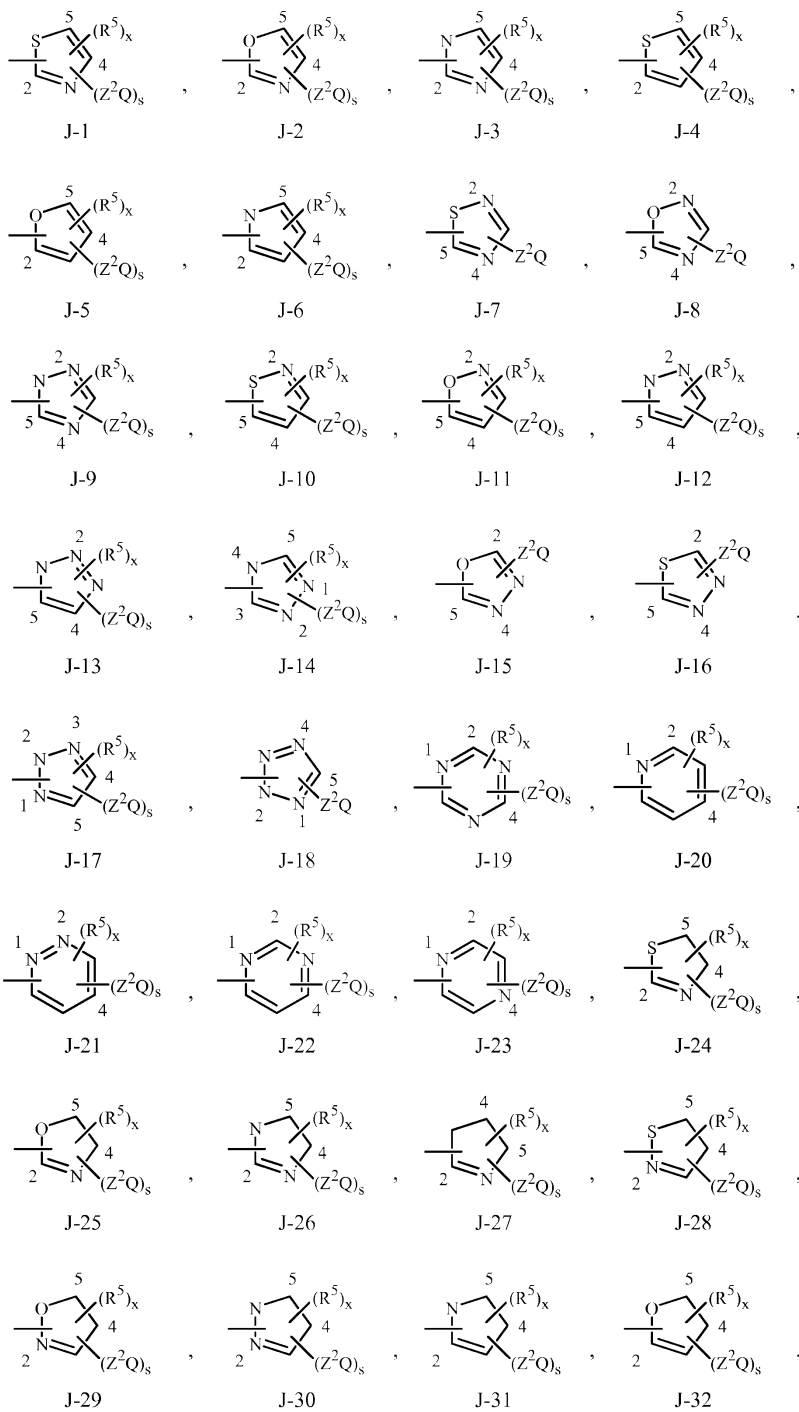
제 1 항에 있어서,

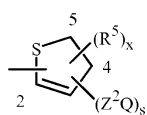
$R^1$ 은 탄소 환 구성원 상에서  $R^{4a}$ , 질소 환 구성원 상에서  $R^{4b}$  중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환된 페닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환이고;

G는 탄소 환 구성원 상에서  $R^3$  중에서 선택되고, 질소 환 구성원 상에서  $R^{11}$  중에서 선택되는 2개 이하의 치환기로 임의로 치환된 5원 복소환이며;

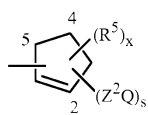
J는 J-1 내지 J-82 (증거 3에 나타냄) (여기서, 좌측으로 돌출되게 나타낸 결합은  $Z^1$ 에 결합된다):

증거 3

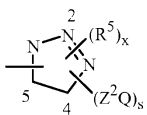




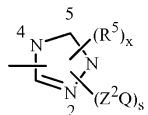
J-33



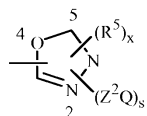
J-34



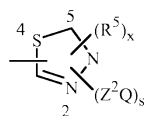
J-35



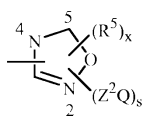
J-36



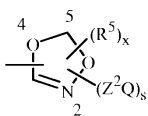
J-37



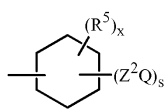
J-38



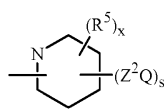
J-39



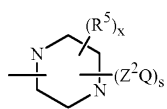
J-40



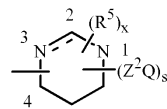
J-41



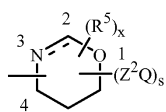
J-42



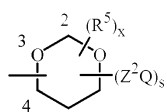
J-43



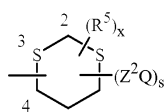
J-44



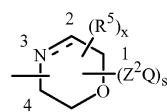
J-45



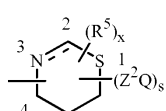
J-46



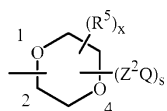
J-47



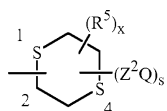
J-48



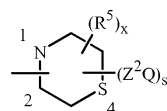
J-49



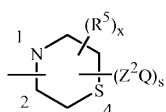
J-50



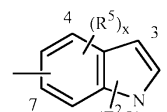
J-51



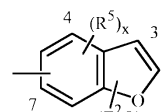
J-52



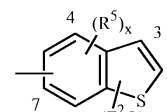
J-53



J-54

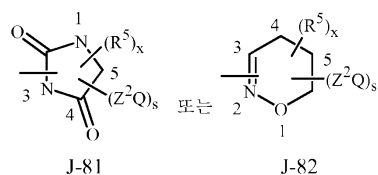
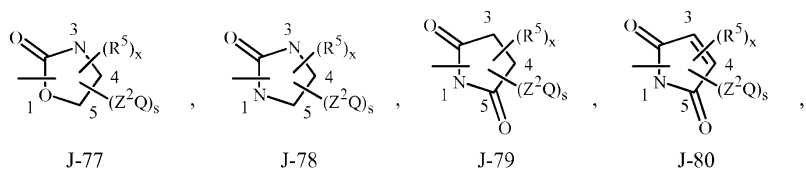
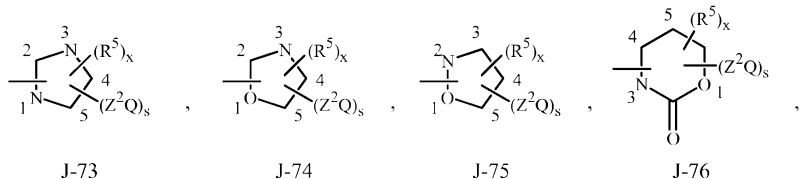
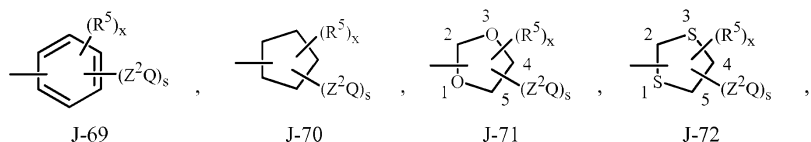
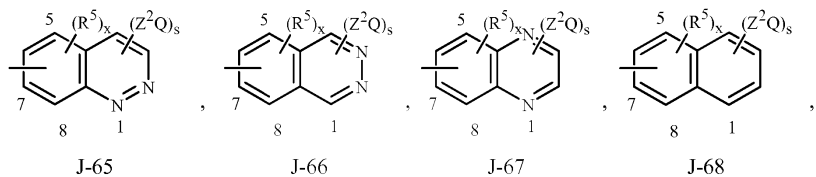
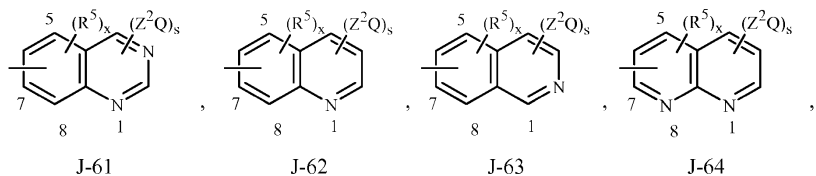
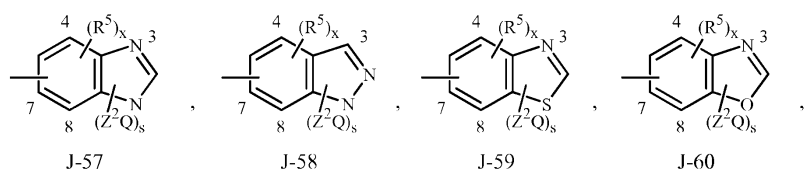


J-55



J-56





중의 하나이고;

각  $R^2$ 는 독립적으로  $C_1$ - $C_2$  알킬,  $C_1$ - $C_2$  할로알킬,  $C_1$ - $C_2$  알콕시, 할로젠, 시아노 또는 하이드록시이며;

각  $R^3$ 는 독립적으로  $C_1$ - $C_3$  알킬,  $C_1$ - $C_3$  할로알킬 또는 할로젠이고;

각  $R^{4a}$ 는 독립적으로  $C_1$ - $C_6$  알킬,  $C_2$ - $C_6$  알케닐,  $C_2$ - $C_6$  알키닐,  $C_3$ - $C_6$  사이클로알킬,  $C_4$ - $C_{10}$  사이클로알킬알킬,  $C_4$ - $C_{10}$  알킬사이클로알킬,  $C_5$ - $C_{10}$  알킬사이클로알킬알킬,  $C_1$ - $C_6$  할로알킬,  $C_2$ - $C_6$  할로알케닐,  $C_2$ - $C_6$  할로알키닐,  $C_3$ - $C_6$  할로사이클로알킬, 할로젠, 하이드록시, 아미노, 시아노, 니트로,  $C_1$ - $C_4$  알콕시,  $C_1$ - $C_4$  할로알콕시,  $C_1$ - $C_4$  알킬티오,  $C_1$ - $C_4$  알킬설퍼닐,  $C_1$ - $C_4$  알킬설포닐,  $C_1$ - $C_4$  할로알킬티오,  $C_1$ - $C_4$  할로알킬설퍼닐,  $C_1$ - $C_4$  할로알킬설포닐,  $C_1$ - $C_4$  알킬아미노,  $C_2$ - $C_8$  다이알킬아미노,  $C_3$ - $C_6$  사이클로알킬아미노,  $C_2$ - $C_4$  알콕시알킬,  $C_1$ - $C_4$  하이드록시알킬,  $C_2$ - $C_4$

알킬카르보닐,  $C_2-C_6$  알콕시카르보닐,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐옥시,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐티오,  $C_2-C_6$  알킬아미노카르보닐,  $C_3-C_8$  다이알킬아미노카르보닐 또는  $C_3-C_6$  트라이알킬실릴이며;

각  $R^{4b}$ 는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_3-C_6$  알케닐,  $C_3-C_6$  알키닐,  $C_3-C_6$  사이클로알킬,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_3-C_6$  할로알케닐,  $C_3-C_6$  할로알키닐,  $C_3-C_6$  할로사이클로알킬 또는  $C_2-C_4$  알콕시알킬이고;

각  $R^{11}$ 은 독립적으로  $C_1-C_3$  알킬이며;

$R^{15}$ 은 H, 할로겐, 시아노, 하이드록시,  $-CHO$ ,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬 또는  $C_2-C_5$  알콕시카르보닐이고;

$R^{16}$ 은 H,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_2-C_4$  알킬카르보닐,  $C_2-C_4$  할로알킬카르보닐 또는  $C_2-C_4$  알콕시카르보닐이며;

x는 0 내지 5의 정수이고;

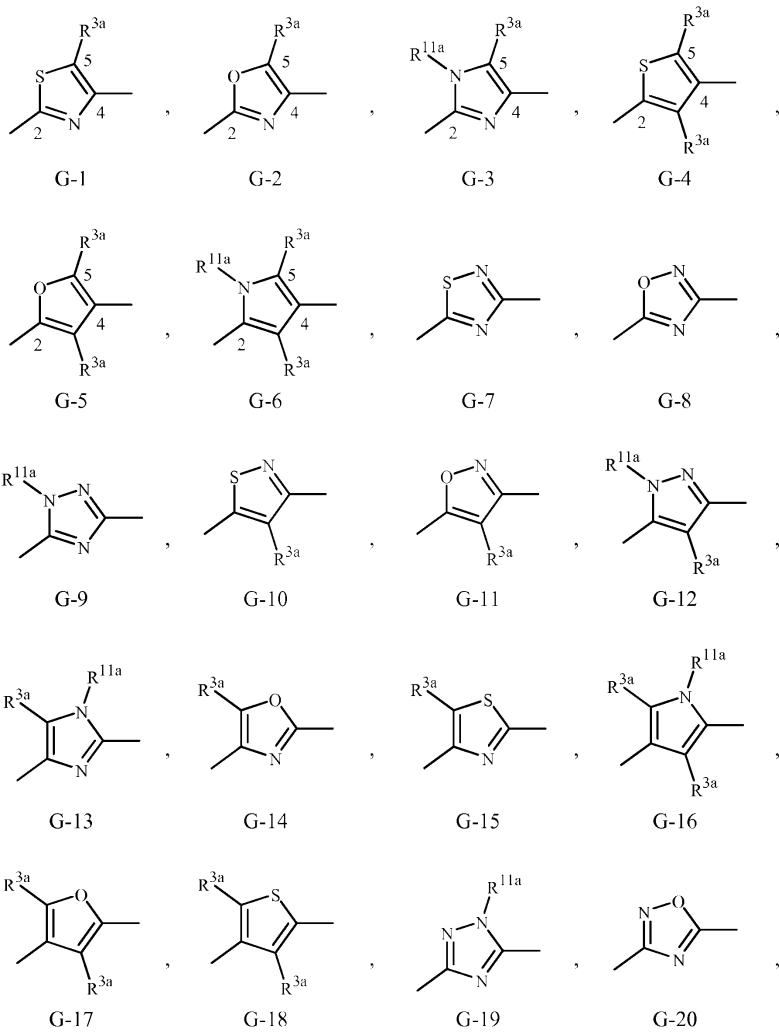
s는 1 내지 2의 정수인 화합물.

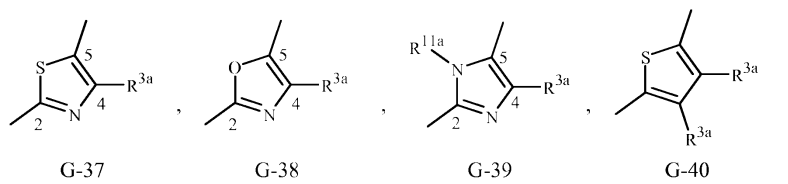
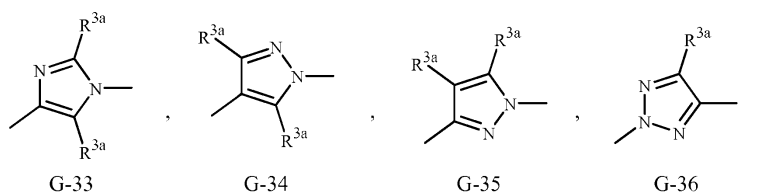
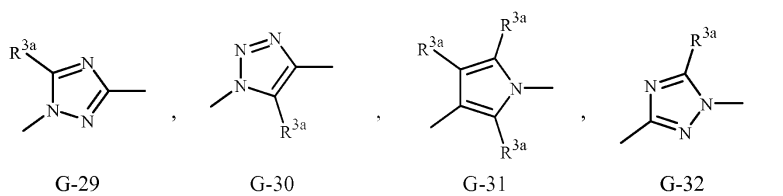
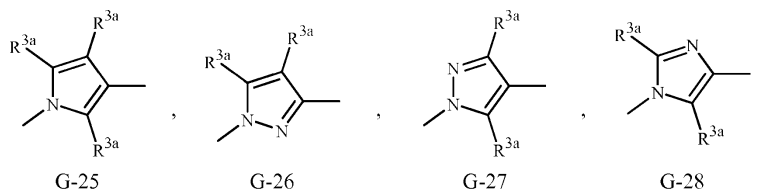
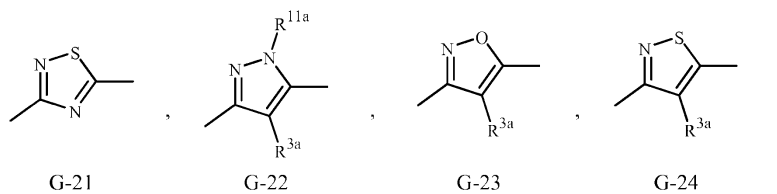
### 청구항 3

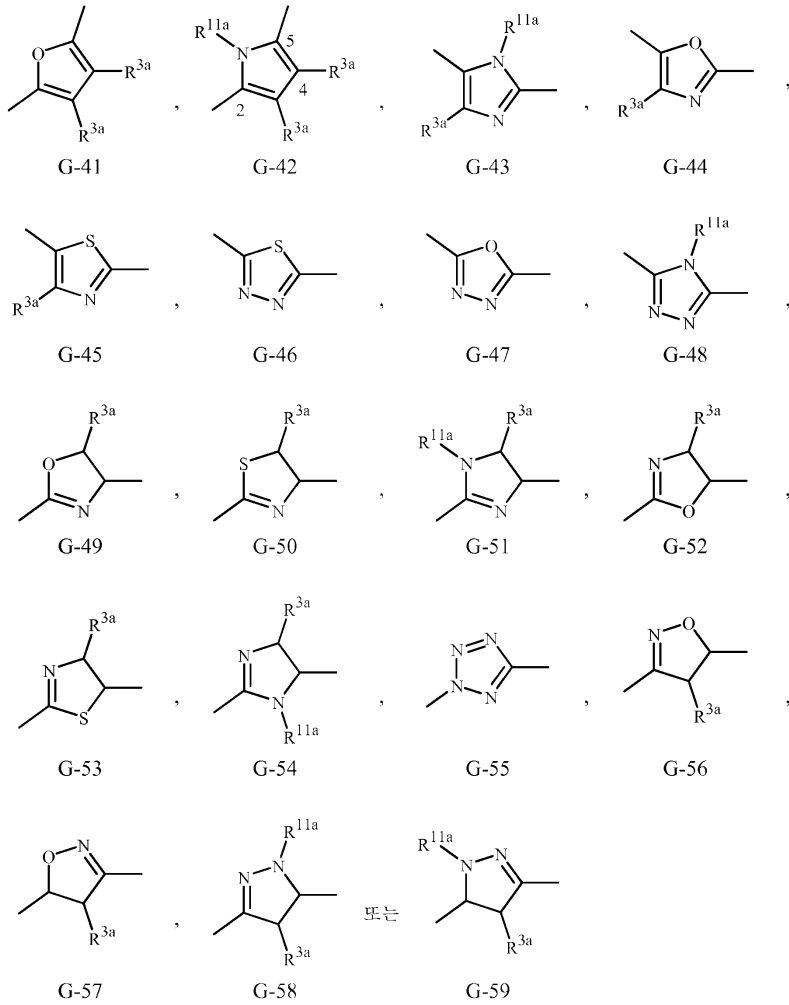
제 2 항에 있어서,

G는 G-1 내지 G-59 (증거 2에 나타냄) (여기서, 좌측으로 돌출하는 결합은 X에 결합되고, 우측으로 돌출하는 결합은  $Z^1$ 에 결합된다):

증거 2





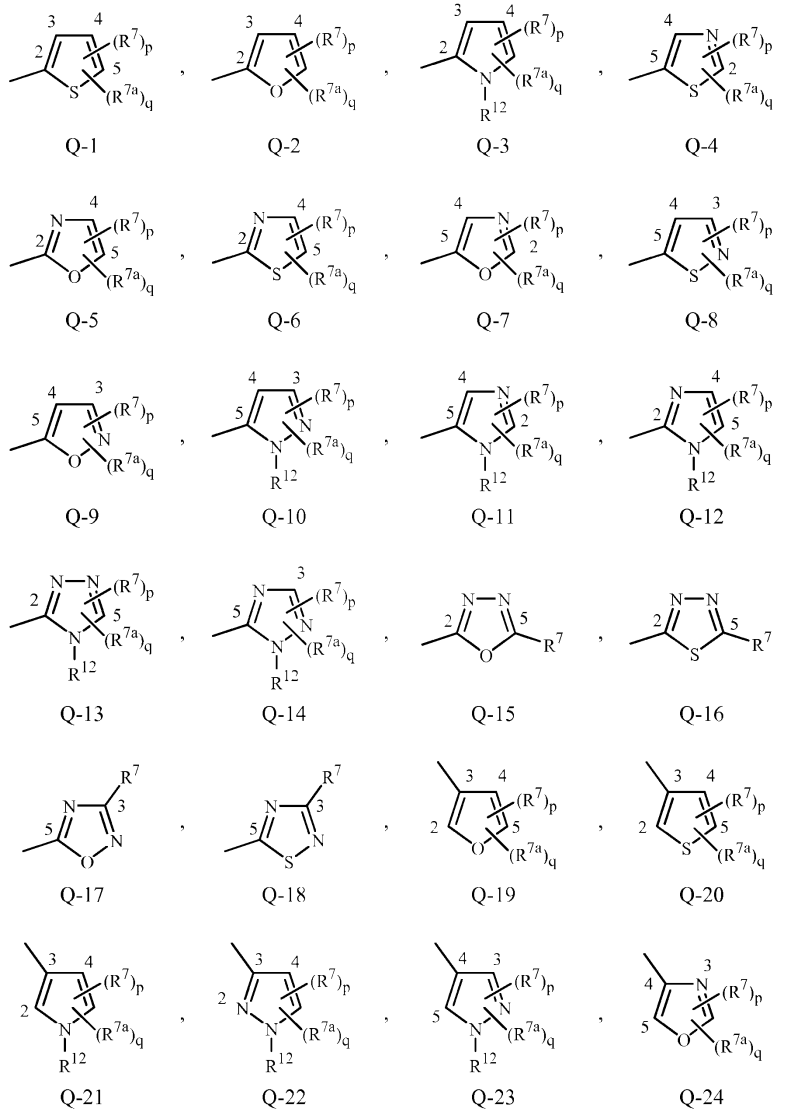


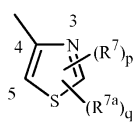
중의 하나이고;

J는 J-1, J-2, J-3, J-4, J-5, J-7, J-8, J-9, J-10, J-11, J-12, J-14, J-15, J-16, J-20, J-24, J-25, J-26, J-29, J-30, J-37, J-38, J-45 및 J-69 중에서 선택되며;

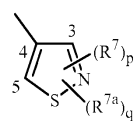
Q는 Q-1 내지 Q-106 (증거 4에 나타냄):

증거 4

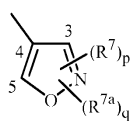




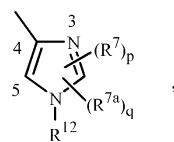
Q-25



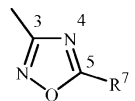
Q-26



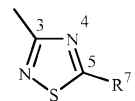
Q-27



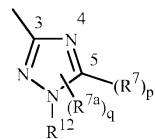
Q-28



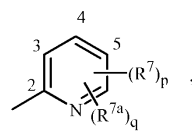
Q-29



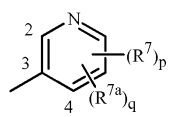
Q-30



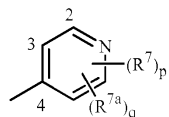
Q-31



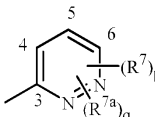
Q-32



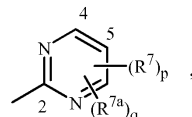
Q-33



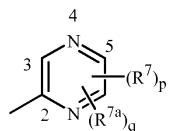
Q-34



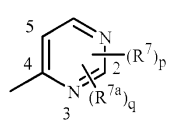
Q-35



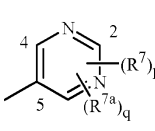
Q-36



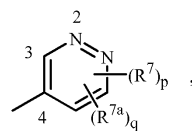
Q-37



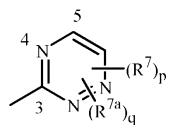
Q-38



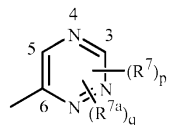
Q-39



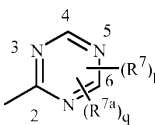
Q-40



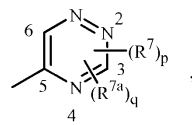
Q-41



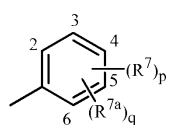
Q-42



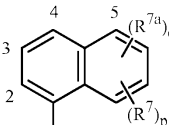
Q-43



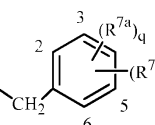
Q-44



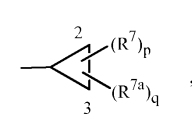
Q-45



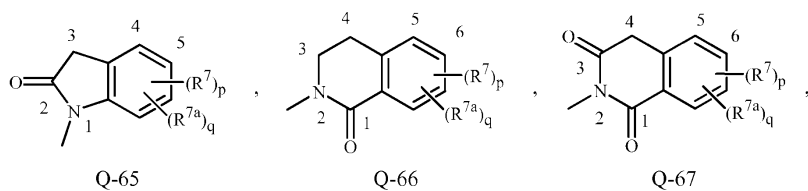
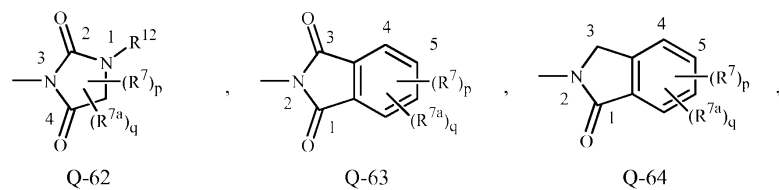
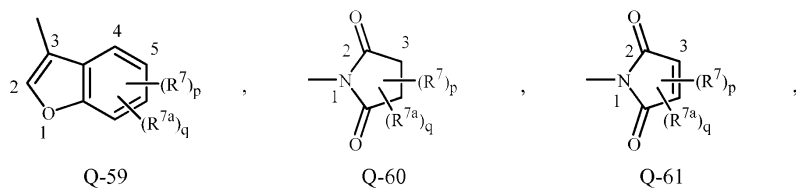
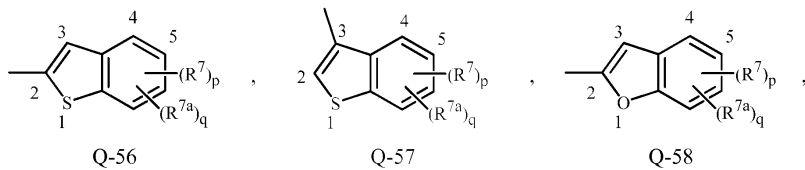
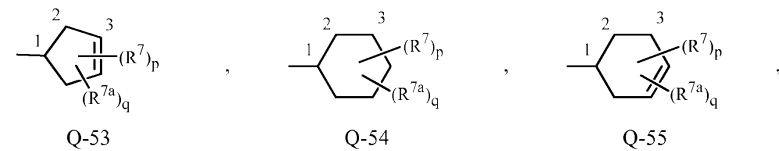
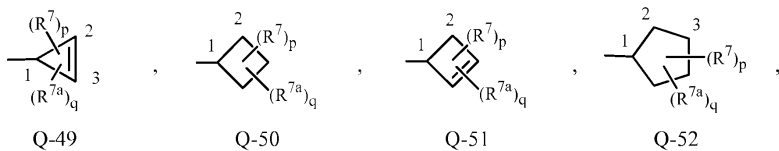
Q-46



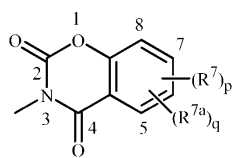
Q-47



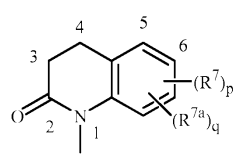
Q-48



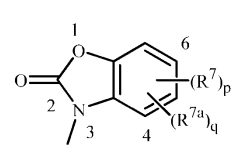




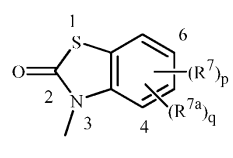
Q-68



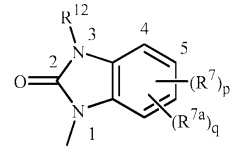
Q-69



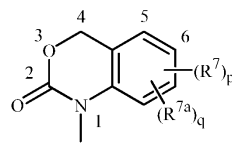
Q-70



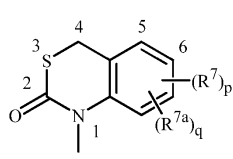
Q-71



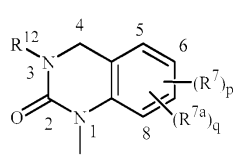
Q-72



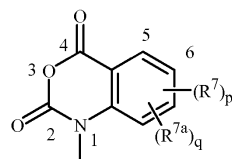
Q-73



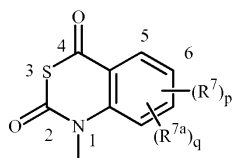
Q-74



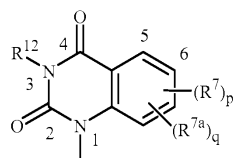
Q-75



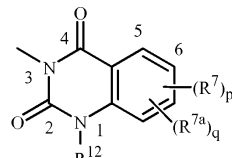
Q-76



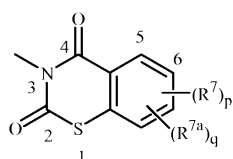
Q-77



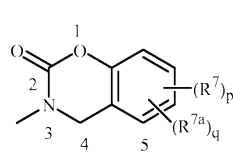
Q-78



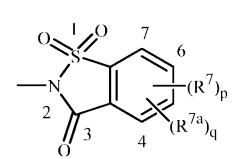
Q-79



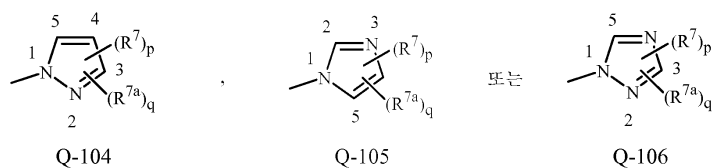
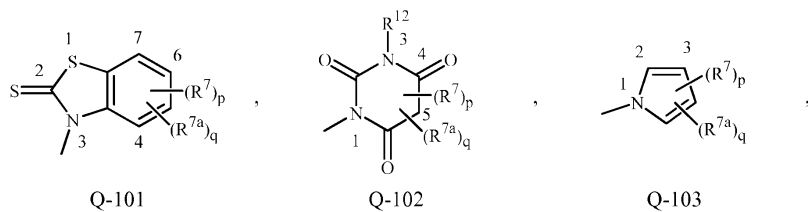
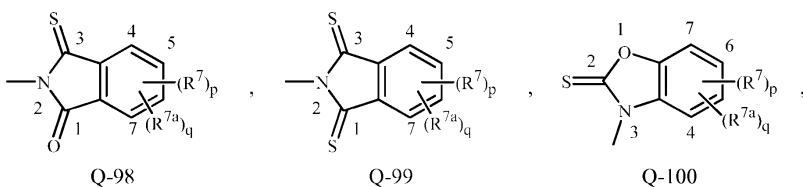
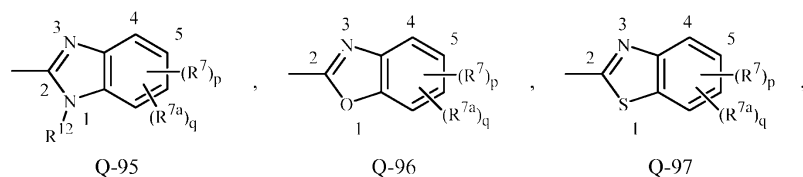
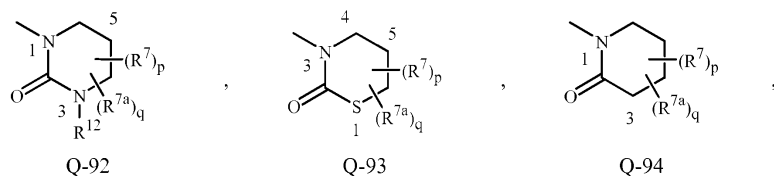
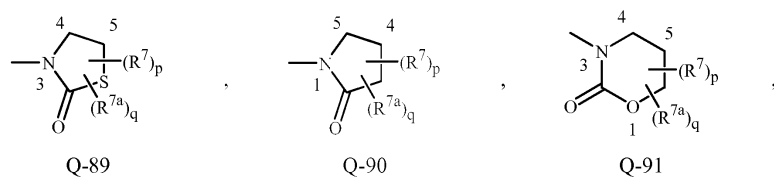
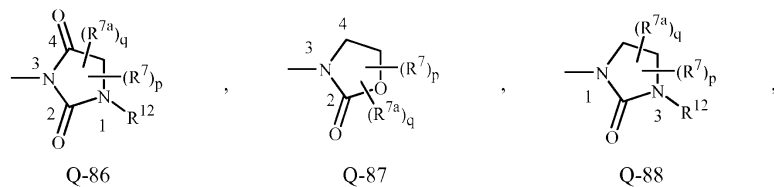
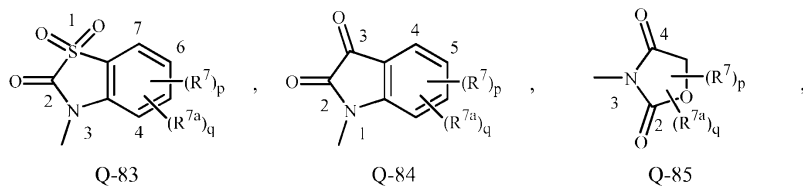
Q-80



Q-81



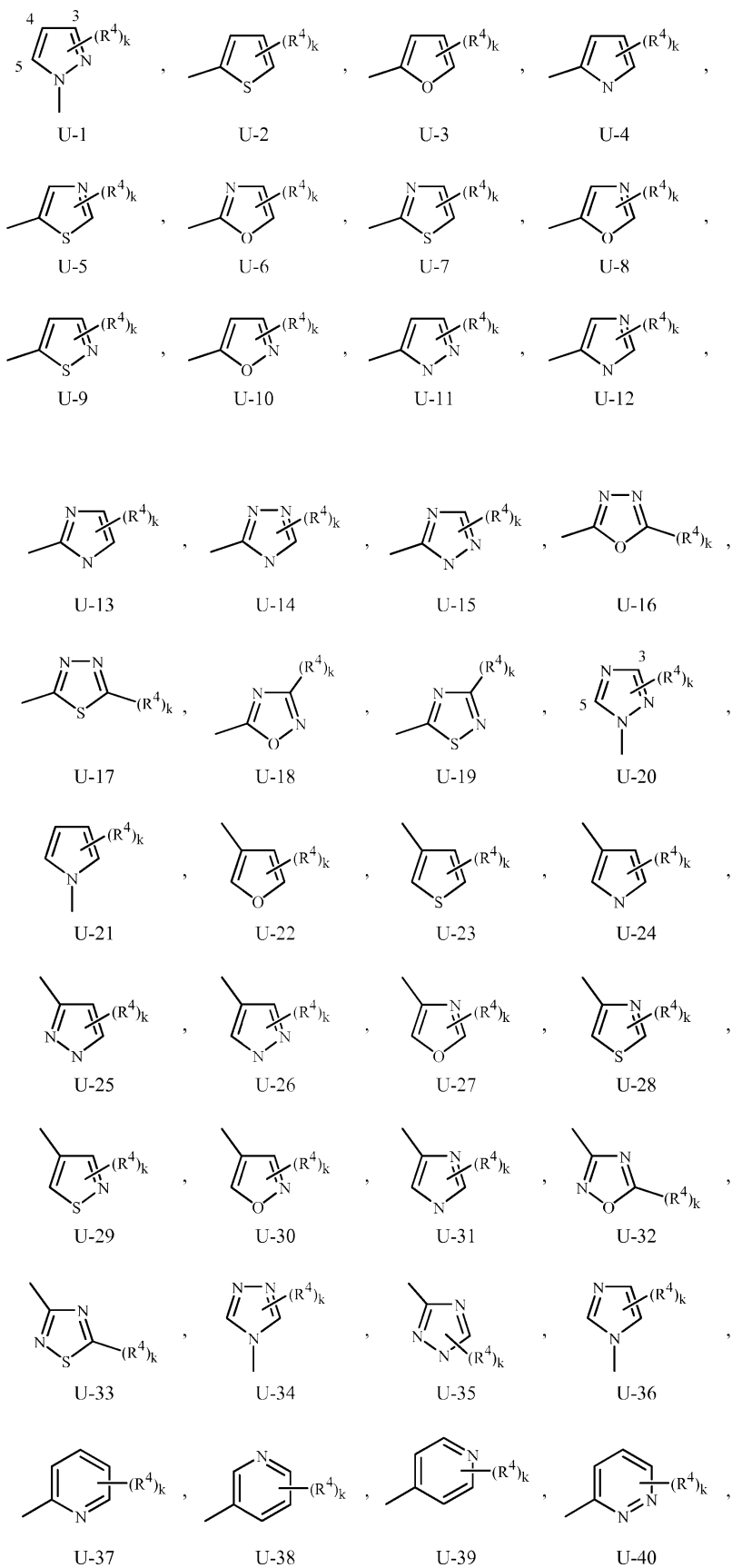
Q-82

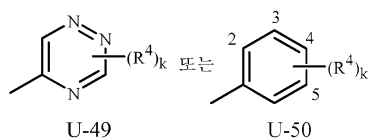
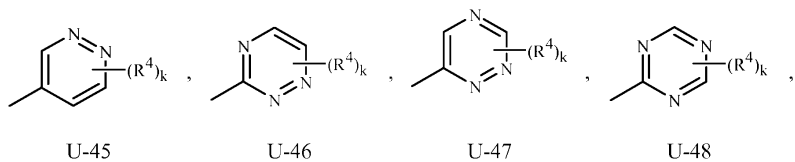
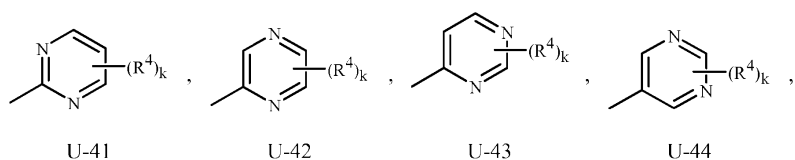


중의 하나이고;

R<sup>1</sup>은 U-1 내지 U-50 (증거 1에 나타냄):

증거 1





중의 하나이며;

여기서,  $R^4$ 가 탄소 환 구성원에 결합되면, 상기  $R^4$ 는  $R^{4a}$  중에서 선택되고,  $R^4$ 가 질소 환 구성원에 결합되면 (예를 들어, U-4, U-11 내지 U-15, U-24 내지 U-26, U-31 또는 U-35에서), 상기  $R^4$ 는  $R^{4b}$  중에서 선택되고;

각  $R^2$ 는 독립적으로 메틸, 메톡시, 시아노 또는 하이드록시이며;

각  $R^{3a}$ 는 H 및  $R^3$  중에서 독립적으로 선택되고;

각  $R^5$ 는 독립적으로 H, 시아노,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_3-C_8$  사이클로알킬,  $C_3-C_8$  할로사이클로알킬,  $C_2-C_6$  알콕시알킬,  $C_1-C_6$  알콕시,  $C_1-C_6$  할로알콕시,  $C_3-C_8$  사이클로알콕시,  $C_2-C_6$  알케닐옥시,  $C_2-C_6$  할로알케닐옥시,  $C_2-C_6$  알키닐옥시,  $C_2-C_6$  알콕시알콕시,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐옥시,  $C_2-C_6$  할로알킬카르보닐옥시,  $C_1-C_6$  알킬티오,  $C_1-C_6$  할로알킬티오,  $C_3-C_{10}$  트라이알킬실릴 또는  $-NR^{25}R^{26}$ 이며;

$R^{11a}$ 는 H 및  $R^{11}$  중에서 선택되고;

$R^{15}$ 은 H, 시아노, 하이드록시, 메틸 또는 메톡시카르보닐이며;

$R^{16}$ 은 H, 메틸, 메틸카르보닐 또는 메톡시카르보닐이고;

각  $Z^4$ 는  $C(=O)$ 이며;

$k$ 는 0, 1 또는 2이고;

$p$ 는 1 또는 2이며;

$q$ 는 0, 1, 2, 3, 4 또는 5이고;

$s$ 는 1인 화합물.

#### 청구항 4

제 3 항에 있어서,

G는 G-1, G-2, G-7, G-8, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26, G-27, G-36, G-37, G-38, G-49, G-50 및 G-55 중에서 선택되고;

J는 J-4, J-5, J-8, J-11, J-15, J-16, J-20, J-29, J-30, J-37, J-38 및 J-69 중에서 선택되며;

각 Q는 독립적으로 Q-1, Q-20, Q-32 내지 Q-34, Q-45 내지 Q-47, Q-60 내지 Q-73, Q-76 내지 Q-79, Q-84 내지

Q-94 및 Q-98 내지 Q-106이고;

A는  $\text{CH}_2$  또는  $\text{NH}$ 이며;

W는 O이고;

X는  $X^1$ ,  $X^2$  또는  $X^3$ 이며;

$Z^1$ 은 직접 결합이고;

$Z^2$ 는 직접 결합 또는  $\text{NR}^{21}$ 이며;

$R^1$ 은 U-1 내지 U-3, U-11, U-13, U-20, U-22, U-23, U-36 내지 U-39 및 U-50 중에서 선택되고;

각  $R^3$ 는 독립적으로 메틸 또는 할로겐이며;

각  $R^{4a}$ 는 독립적으로  $\text{C}_1\text{-C}_2$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_2$  할로알킬, 할로젠,  $\text{C}_1\text{-C}_2$  알콕시 또는  $\text{C}_1\text{-C}_2$  할로알콕시이고;

각  $R^{4b}$ 는 독립적으로  $\text{C}_1\text{-C}_2$  알킬 또는  $\text{C}_1\text{-C}_2$  할로알킬이며;

각  $R^{7a}$ 는 독립적으로  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_3\text{-C}_6$  사이클로알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  할로알킬, 할로젠, 시아노,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알콕시,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알콕시 또는  $\text{C}_2\text{-C}_6$  알콕시카르보닐이고;

k는 1 또는 2이며;

n은 0인 화합물.

## 청구항 5

제 4 항에 있어서,

A는  $\text{CH}_2$ 이고;

G는 G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 및 G-38 중에서 선택되며; G는 비치환되고;

J는 J-29이며;

Q는 Q-1, Q-45, Q-63, Q-64, Q-65, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72, Q-73, Q-76, Q-78, Q-79, Q-84, Q-85, Q-98, Q-99, Q-100 및 Q-101 내지 Q-106 중에서 선택되고;

X는  $X^1$  또는  $X^2$ 이며; X를 포함하는 환은 포화되고;

$R^1$ 은 U-1, U-20 또는 U-50이며;

각  $R^{4a}$ 는 독립적으로  $\text{C}_1\text{-C}_2$  알킬, 트라이플루오로메틸, Cl, Br, I 또는 메톡시이고;

각  $R^{4b}$ 는 독립적으로  $\text{C}_1\text{-C}_2$  알킬 또는 트라이플루오로메틸이며;

각  $R^5$ 는 독립적으로 H, 시아노,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  할로알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  할로알콕시 또는  $-\text{NR}^{25}\text{R}^{26}$ 인 화합물.

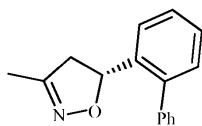
## 청구항 6

제 5 항에 있어서,

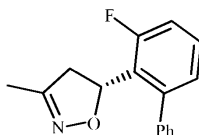
G는 G-1, G-2, G-15, G-26 및 G-36 중에서 선택되고;

J는 J-29-1 내지 J-29-60 (증거 A로 나타냄):

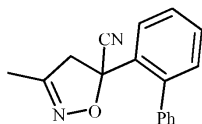
증거 A



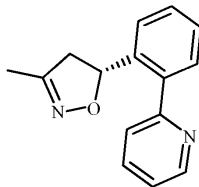
J-29-1



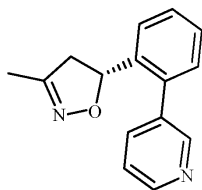
J-29-2



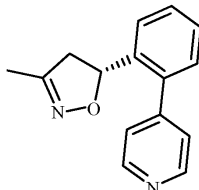
J-29-3



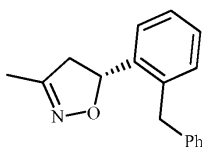
J-29-4



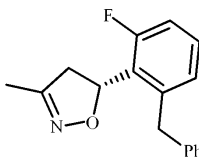
J-29-5



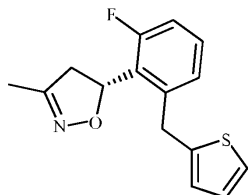
J-29-6



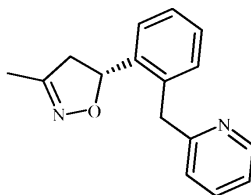
J-29-7



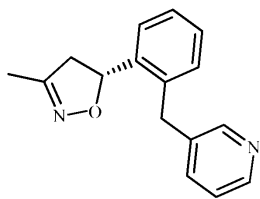
J-29-8



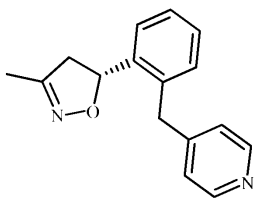
J-29-9



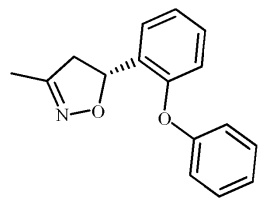
J-29-10



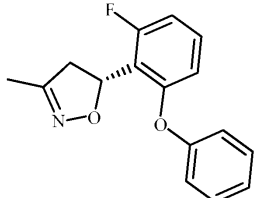
J-29-11



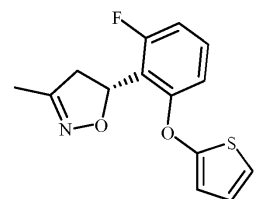
J-29-12



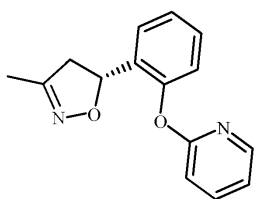
J-29-13



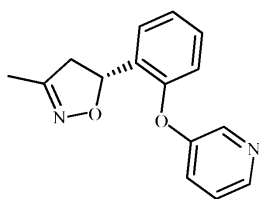
J-29-14



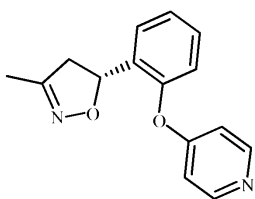
J-29-15



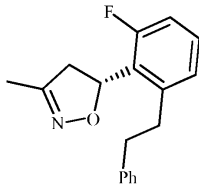
J-29-16



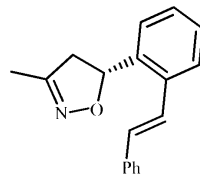
J-29-17



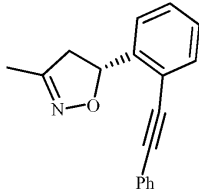
J-29-18



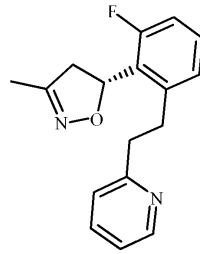
J-29-19



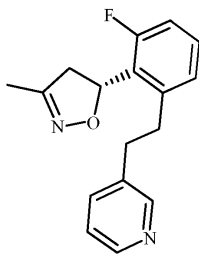
J-29-20



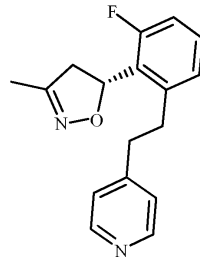
J-29-21



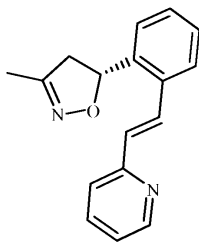
J-29-22



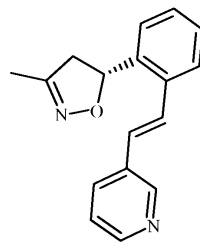
J-29-23



J-29-24

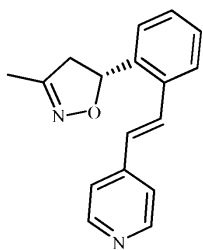


J-29-25

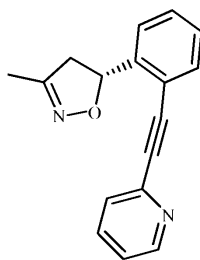


J-29-26

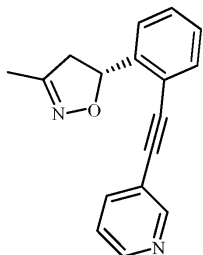




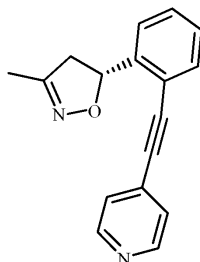
J-29-27



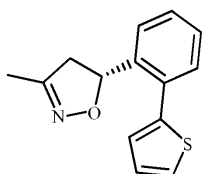
J-29-28



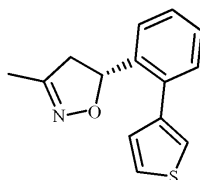
J-29-29



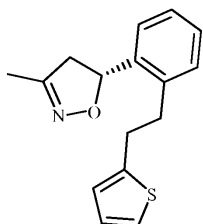
J-29-30



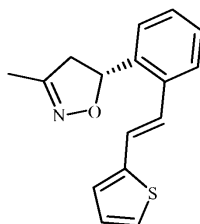
J-29-31



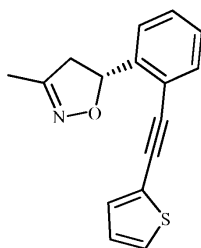
J-29-32



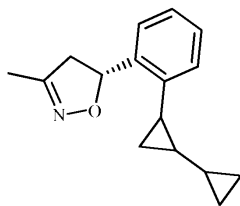
J-29-33



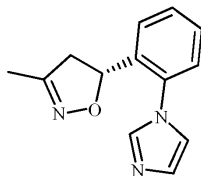
J-29-34



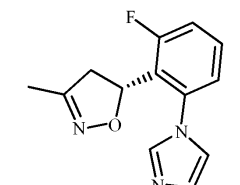
J-29-35



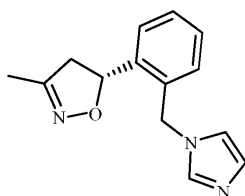
J-29-36



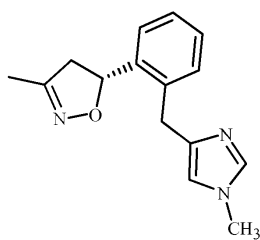
J-29-37



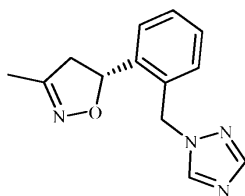
J-29-38



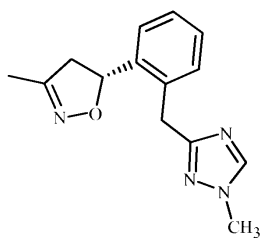
J-29-39



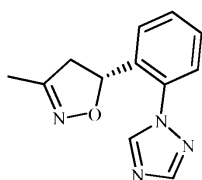
J-29-40



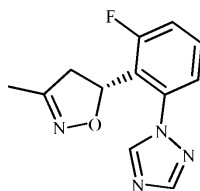
J-29-41



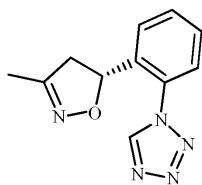
J-29-42



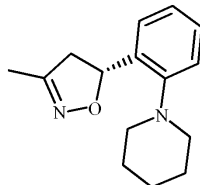
J-29-43



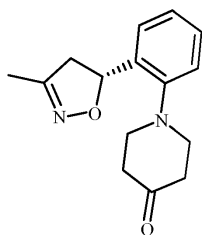
J-29-44



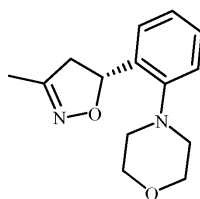
J-29-45



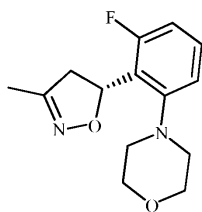
J-29-46



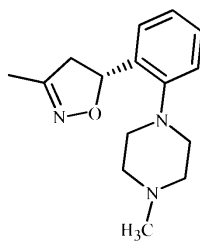
J-29-47



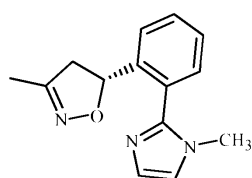
J-29-48



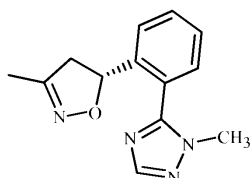
J-29-49



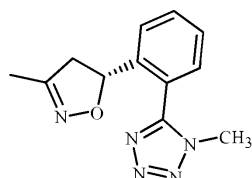
J-29-50



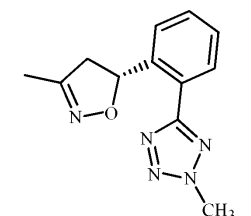
J-29-51



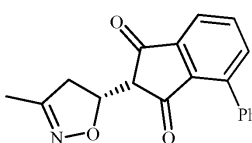
J-29-52



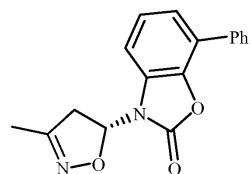
J-29-53



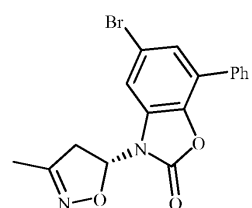
J-29-54



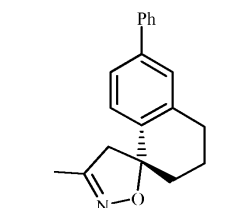
J-29-55



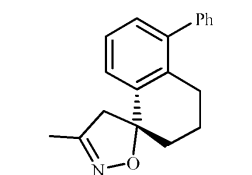
J-29-56



J-29-57

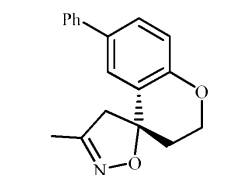


J-29-58



J-29-59

또는



J-29-60

(여기서, 좌측으로 돌출되게 나타낸 결합은  $Z^1$ 에 결합되고, Ph는 페닐이다) 중의 어느 하나이며;

Q는 Q-45, Q-63, Q-64, Q-65, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72 및 Q-85 중에서 선택되고;

X는  $X^1$ 인 화합물.

## 청구항 7

제 1 항에 있어서,

1-[4-[4-[4,5-다이하이드로-5-[3-(1*H*-1,2,4-트리아졸-1-일)페닐]-3-아이속사졸릴]-2-티아졸릴]-1-피페리디닐]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1*H*-피라졸-1-일]에탄온,

1-[4-[4-(5-[1,1'-바이페닐]-4-일-4,5-다이하이드로-3-아이속사졸릴)-2-티아졸릴]-1-피페리디닐]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1*H*-피라졸-1-일]에탄온,

4-[4-(5-[1,1'-바이페닐]-2-일-4,5-다이하이드로-3-아이속사졸릴)-2-티아졸릴]-*N*-(2,5-다이메틸페닐)-1-피페리딘카복스아미드,

4-[4-(4,5-다이하이드로-5-[2-(1*H*-1,2,4-트리아졸-1-일)페닐]-3-아이속사졸릴)-2-티아졸릴]-*N*-(2,5-다이메

틸페닐)-1-피페리딘카르복스아미드,

1-[4-[4-[4,5-다이하이드로-5-[2-(1*H*-1,2,4-트리아졸-1-일)페닐]-3-아이속사졸릴]-2-티아졸릴]-1-피페리디닐]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1*H*-피라졸-1-일]에탄온,

1-[4-[4-[5-[2-플루오로-6-(1*H*-1,2,4-트리아졸-1-일)페닐]-4,5-다이하이드로-3-아이속사졸릴]-2-티아졸릴]-1-피페리디닐]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1*H*-피라졸-1-일]에탄온, 및

1-[4-[4-(5-[1,1'-바이페닐]-2-일-4,5-다이하이드로-3-아이속사졸릴)-2-티아졸릴]-1-피페리디닐]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1*H*-피라졸-1-일]에탄온으로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 화합물.

#### 청구항 8

화학식 1A의 화합물, 및 이의 *N*-옥사이드 및 이의 염 중에서 선택되는 화합물:

[화학식 1A]



상기 식에서,

M은 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 할로알킬, 하이드록시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노, 1-피페리디닐, 1-피롤리디닐 또는 4-모르폴리닐이고;

J<sup>1</sup>은 제 6 항에 나타난 J-29-1 내지 J-29-60 (여기서, 좌측으로 돌출되게 나타난 결합은 화학식 1A의 -C(=O)M에 결합된다) 중의 어느 하나이다.

#### 청구항 9

살균적 유효량의 제 1 항의 화합물을 식물 또는 이의 부분, 또는 식물 종자 또는 모종에 적용하는 것을 포함하는, 난균류 식물 병원체에 의한 식물병을 방제하는 방법.

#### 청구항 10

(1) 제 1 항의 화합물; 및 (2) 적어도 하나의 다른 살균제를 포함하는 살균제 조성물.

#### 청구항 11

(1) 제 1 항의 화합물; 및 (2) 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 살균제 조성물.

### 명세서

#### 기술분야

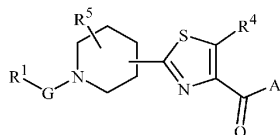
[0001] 본 발명은 특정한 카르복스아미드, 및 이의 *N*-옥사이드, 염 및 조성물, 및 살균제로서의 이들의 사용 방법에 관한 것이다.

#### 배경기술

[0002] 균류 식물 병원체에 의한 식물병의 방제는 높은 작물 효율의 달성에 있어서 매우 중요하다. 관상용 작물, 야채 작물, 농작물, 곡물, 및 과일 작물에 대한 식물 병해는 현저한 생산성 저하를 야기하므로, 소비자에게 가격 상승을 전가할 수 있다. 이 때문에 다수의 제품이 시판되고 있으나, 더욱 효과적이고, 보다 저렴하며, 독성이 낮고, 환경적으로 보다 안전하거나 작용 부위가 상이한 신규 화합물이 계속해서 요구되고 있다.

[0003] 국제 특허 공개 제WO 2005/003128호는 특정한 화학식 i의 티아졸릴피페리딘 및 마이크로솜 트라이글리세라이드 전달 단백질 저해제로서의 이의 용도를 개시하고 있다.

[0004] [화학식 i]

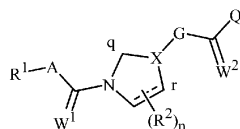


[0005]

[0006] 국제 특허 공개 제WO 2004/058751호는 혈관 긴장도를 변화시키기 위한 특정한 피페리딘-티아졸 카르복스아미드를 개시하고 있다.

[0007] 국제 특허 공개 제WO 2007/014290호는 특정한 화학식 ii의 아조사이클릭 아미드:

[0008] [화학식 ii]



[0009]

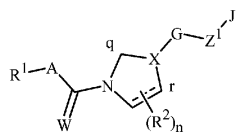
[0010] 및 살균제로서의 이의 용도를 개시하고 있다.

## 발명의 내용

[0011] (발명의 요약)

[0012] 본 발명은 화학식 1의 화합물 (모든 기하 이성질체 및 입체 이성질체 포함), 이의 N-옥사이드, 이의 염, 이들을 함유하는 농업용 조성물 및 살균제로서의 이들의 용도에 관한 것이다:

[0013] [화학식 1]



[0014]

[0015] 상기 식에서,

[0016] R<sup>1</sup>은 임의로 치환된 페닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환 (heteroaromatic ring) 또는 임의로 치환된 나프탈레닐이고;

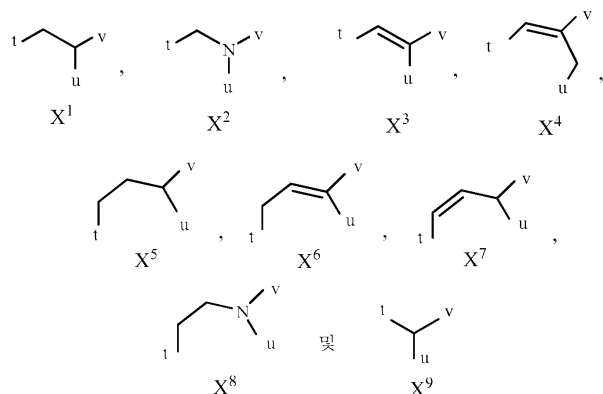
[0017] A는 CHR<sup>15</sup> 또는 NR<sup>16</sup>이며;

[0018] R<sup>15</sup>은 H, 할로젠, 시아노, 하이드록시, -CHO, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알키닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 할로알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 할로알키닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬티오알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설퍼닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설포닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 알콕시카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 알콕시카르보닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 알킬아미노카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 다이알킬아미노카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설포닐 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬설포닐이고;

[0019] R<sup>16</sup>은 H, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알키닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 할로알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 할로알키닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬티오알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설퍼닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설포닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 알콕시카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 알콕시카르보닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 알킬아미노카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 다이알킬아미노카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설포닐 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬설포닐이며;

[0020] W는 O 또는 S이고;

[0021] X는:



[0022]

[0023] (여기서, "t"로 특정된  $X^1$ ,  $X^2$ ,  $X^3$ ,  $X^4$ ,  $X^5$ ,  $X^6$ ,  $X^7$ ,  $X^8$  또는  $X^9$ 의 결합은 화학식 1의 "q"로 특정된 탄소 원자에 연결되고, "u"로 특정된 결합은 화학식 1의 "r"로 특정된 탄소 원자에 연결되며, "v"로 특정된 결합은 G에 연결된다) 중에서 선택되는 라디칼이며;

[0024] 각  $R^2$ 는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알케닐,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로젠, 시아노 또는 하이드록시이거나;

[0025] 2개의  $R^2$ 는 함께  $C_1-C_4$  알킬렌 또는  $C_2-C_4$  알케닐렌으로서 취해 가교 이환계 (bicyclic ring system) 또는 융합 이환계를 형성하거나;

[0026] 이중 결합으로 결합된 인접한 탄소 원자에 부착되는 2개의  $R^2$ 는 함께,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $C_1-C_4$  할로알콕시, 할로젠, 하이드록시, 아미노, 시아노 및 니트로 중에서 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는  $-CH=CH-CH=CH-$ 로서 취해지고;

[0027] G는 임의로 치환된 5원 복소환이며;

[0028] J는 각각 탄소, 2개 이하의 O, 2개 이하의 S 및 4개 이하의 N 중에서 선택되는 4개 이하의 헤테로 원자, 및  $C(=O)$ ,  $C(=S)$ ,  $S(=O)_a(=NR^{23})_b$  및  $SiR^{17}R^{18}$  중에서 선택되는 3개 이하의 환 구성원 (ring member) 중에서 선택되는 환 구성원을 포함하고,  $-Z^2Q$  중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 2개의 치환기로 치환되며,  $R^5$  중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환되는 5원, 6원 또는 7원 환, 8원 내지 11원 이환계 또는 7원 내지 11원 스피로환계 (spirocyclic ring system)이고;

[0029] 각  $R^5$ 는 독립적으로 H, 할로젠, 시아노, 하이드록시, 아미노, 니트로,  $-CHO$ ,  $-C(=O)OH$ ,  $-C(=O)NH_2$ ,  $-NR^{25}R^{26}$ ,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_2-C_6$  알케닐,  $C_2-C_6$  알키닐,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_2-C_6$  할로알케닐,  $C_2-C_6$  할로알키닐,  $C_3-C_8$  사이클로알킬,  $C_3-C_8$  할로사이클로알킬,  $C_4-C_{10}$  알킬사이클로알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알킬알킬,  $C_6-C_{14}$  사이클로알킬사이클로알킬,  $C_4-C_{10}$  할로사이클로알킬알킬,  $C_5-C_{10}$  알킬사이클로알킬알킬;  $C_3-C_8$  사이클로알케닐,  $C_3-C_8$  할로사이클로알케닐,  $C_2-C_6$  알콕시알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알콕시알킬,  $C_3-C_8$  알콕시알콕시알킬,  $C_2-C_6$  알킬티오알킬,  $C_2-C_6$  알킬설피닐알킬,  $C_2-C_6$  알킬설포닐알킬,  $C_2-C_6$  알킬아미노알킬,  $C_3-C_8$  다이알킬아미노알킬,  $C_2-C_6$  할로알킬아미노알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알킬아미노알킬,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐,  $C_2-C_6$  할로알킬카르보닐,  $C_4-C_8$  사이클로알킬카르보닐,  $C_2-C_6$  알콕시카르보닐,  $C_4-C_8$  사이클로알콕시카르보닐,  $C_5-C_{10}$  사이클로알킬알콕시카르보닐,  $C_2-C_6$  알킬아미노카르보닐,  $C_3-C_8$  다이알킬아미노카르보닐,  $C_4-C_8$  사이클로알킬아미노카르보닐,  $C_2-C_6$  할로알콕시알킬,  $C_1-C_6$  하이드록시알킬,  $C_1-C_6$  알콕시,  $C_1-C_6$  할로알콕시,  $C_3-C_8$  사이클로알콕시,  $C_3-C_8$  할로사이클로알콕시,  $C_4-C_{10}$  사이클로알킬알콕시,  $C_2-C_6$  알케닐옥시,  $C_2-C_6$  할로알케닐옥시,  $C_2-C_6$  알키닐옥시,  $C_2-C_6$  할로알키닐옥시,  $C_2-C_6$  알콕시알콕시,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐옥시,  $C_2-C_6$  할로알킬카르보닐옥시,  $C_4-C_8$  사이클로알킬카르보닐옥시,  $C_3-C_6$  알킬카르보닐알콕시,  $C_1-C_6$  알킬티

오, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬티오, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬설포닐, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬설포닐, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 트라이알킬설킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬설포닐아미노 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬설포닐아미노이며;

[0030] R<sup>25</sup>는 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알콕시카르보닐이고;

[0031] R<sup>26</sup>는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알콕시카르보닐 또는 -Z<sup>4</sup>Q이며;

[0032] 각 R<sup>17</sup> 및 R<sup>18</sup>은 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> 알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 알키닐, C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 할로사이클로알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub> 알킬사이클로알킬, C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub> 알킬사이클로알킬알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> 할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> 알콕시 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> 할로알콕시이고;

[0033] 각 Q는 독립적으로, 각각 탄소 또는 질소 원자 환 구성원 상에서 R<sup>7</sup> 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 2개의 치환기로 치환되며, 탄소 원자 환 구성원 상에서 R<sup>7a</sup>, 질소 원자 환 구성원 상에서 R<sup>12</sup> 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐, 벤질, 나프탈레닐, 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환 또는 8원 내지 11원 헤테로 방향족 (heteroaromatic) 이환계이거나;

[0034] 각각, C(=O), C(=S), S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 환 구성원을 임의로 포함하고, 탄소 또는 질소 원자 환 구성원 상에서 R<sup>7</sup> 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 2개의 치환기로 치환되며, 탄소 원자 환 구성원 상에서 R<sup>7a</sup>, 질소 원자 환 구성원 상에서 R<sup>12</sup> 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환되는 3원 내지 7원 비방향족 탄소환, 5원, 6원 또는 7원 비방향족 복소환 또는 8원 내지 11원 비방향족 이환계이고;

[0035] 각 R<sup>7</sup>은 독립적으로 -Z<sup>3</sup>G<sup>A</sup>, -Z<sup>3</sup>G<sup>N</sup> 또는 -Z<sup>3</sup>G<sup>P</sup>이며;

[0036] 각 G<sup>A</sup>는 독립적으로, 각각 탄소 원자 환 구성원 상에서 R<sup>v</sup>, 질소 원자 환 구성원 상에서 R<sup>22</sup> 중에서 독립적으로 선택되는 5개 이하의 치환기로 치환되는 페닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환이고;

[0037] 각 G<sup>N</sup>은 독립적으로, (CR<sup>v</sup>)<sub>2</sub>, O, S, NR<sup>22</sup>, -C(R<sup>v</sup>)=C(R<sup>v</sup>)-, -C(R<sup>v</sup>)=N-, -N=N-, C(=O), C(=S), C(=NR<sup>23</sup>), S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 환 구성원을 포함하는 3원 내지 7원 비방향족 환이며;

[0038] 각 G<sup>P</sup>는 독립적으로, (CR<sup>v</sup>)<sub>2</sub>, O, S, NR<sup>22</sup>, -C(R<sup>v</sup>)=C(R<sup>v</sup>)-, -C(R<sup>v</sup>)=N-, -N=N-, C(=O), C(=S), C(=NR<sup>23</sup>), S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 환 구성원을 포함하는 8원 내지 10원 방향족 또는 7원 내지 11원 비방향족 이환계이고;

[0039] 각 R<sup>v</sup>는 독립적으로 H, 할로젠, 시아노, 하이드록시, 아미노, 니트로, -CHO, -C(=O)OH, -C(=O)NH<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -C(=S)NH<sub>2</sub>, -C(=O)NHCN, -C(=O)NHOH, -SH, -SO<sub>2</sub>NHCN, -SO<sub>2</sub>NHOH, -OCN, -SCN, -SF<sub>5</sub>, -NHCHO, -NHNH<sub>2</sub>, -N<sub>3</sub>, -NHOH, -NHCN, -NHC(=O)NH<sub>2</sub>, -N=C=O, -N=C=S, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알키닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시카르보닐, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알콕시카르보닐, C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub> 사이클로알킬알콕시카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬아미노카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알킬아미노카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알키닐, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 할로사이클로알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 알킬사이클로알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬알킬, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> 사이클로알킬사이클로알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 할로사이클로알킬알킬, C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub> 알킬사이클로알킬알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알케닐, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 할로사이클로알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알콕시알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시알콕시알



킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬티오알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬설퍼닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬설포닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬아미노알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알킬아미노알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알킬아미노알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬아미노알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬카르보닐, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬아미노카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> 시아노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 하이드록시알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알케닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알콕시알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시할로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알콕시할로알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 할로사이클로알콕시알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알케닐옥시알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 할로사이클로알케닐옥시알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알콕시알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>12</sub> 트라이알콕시알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시알케닐, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 할로다이알킬아미노알킬, C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub> 사이클로알킬(알킬)아미노알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬(티오카르보닐), C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시알킬카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시카르보닐알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알콕시카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시알콕시카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> (알킬티오)카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시(티오카르보닐), C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬티오(티오카르보닐), C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬아미노(티오카르보닐), C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알킬아미노(티오카르보닐), C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시(알킬)아미노카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬설포닐아미노카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알킬설포닐아미노카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬아미디노, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알킬아미디노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬카르보닐옥시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬아미노설포닐, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노설포닐, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 트라이알킬설퍼닐, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알콕시, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 할로사이클로알콕시, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알케닐옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알케닐옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬닐옥시, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬닐옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알킬카르보닐옥시, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬카르보닐옥시, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알킬카르보닐알콕시, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬티오, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬설포닐, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알케닐옥시, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 할로사이클로알케닐옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알콕시알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시할로알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알콕시할로알콕시, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시카르보닐알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬(티오카르보닐)옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬카르보닐티오, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬(티오카르보닐)티오, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬설퍼닐, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 할로트라이알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬카르보닐아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬설포닐아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로다이알킬아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 사이클로알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알킬카르보닐아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬설포닐아미노, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬알킬아미노, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬(알킬)아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알콕시카르보닐알킬아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알콕시아미노, C<sub>4</sub>-C<sub>12</sub> 다이알킬이미도, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알콕시카르보닐아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 할로알콕시카르보닐아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬아미노카르보닐아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알킬아미노카르보닐아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알킬아미노카르보닐알킬아미노, C<sub>4</sub>-C<sub>12</sub> 다이알킬아미노카르보닐알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 알킬아미노(티오카르보닐)아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 다이알킬아미노(티오카르보닐)아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 알킬아미노(티오카르보닐)알킬아미노 또는 C<sub>4</sub>-C<sub>12</sub> 다이알킬아미노(티오카르보닐)알킬아미노이며;

[0040] 각 R<sup>7a</sup>는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬닐, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 사이클로알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 알킬사이클로알킬, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 알킬사이클로알킬알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬닐, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 할로사이클로알킬, 할로젠, 하이드록시, 아미노, 시아노, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 사이클로알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 하이드록시알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬카르보닐옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬카르보닐티오, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬아미노카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노카르보닐 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 트라이알킬설퍼닐이거나;

[0041] R<sup>5</sup> 및 R<sup>7a</sup>는 R<sup>5</sup> 및 R<sup>7a</sup>를 연결하는 원자와 함께, 탄소, 1개 이하의 O, 1개 이하의 S 및 1개 이하의 N 중에서 선택되는 3개 이하의 헤테로 원자, 및 C(=O), C(=S), S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 3개 이하의 환 구성원 중에서 선택되는 환 구성원을 포함하는 임의로 치환된 5원 내지 7원 환을 형성하고;

[0042] R<sup>12</sup>는 H, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 알킬카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 알콕시 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 알콕시카르보닐이며;

[0043] 각 Z<sup>1</sup> 및 Z<sup>2</sup>는 독립적으로 직접 결합, O, C(=O), S(O)<sub>m</sub>, CHR<sup>20</sup> 또는 NR<sup>21</sup>이고;

- [0044] 각  $Z^3$ 는 독립적으로 직접 결합, O,  $NR^{22}$ ,  $C(=O)$ ,  $C(=S)$ ,  $S(O)_m$ ,  $CHR^{20}$ ,  $CHR^{20}-CHR^{20}$ ,  $CR^{24}=CR^{27}$ ,  $C\equiv C$ ,  $OCHR^{20}$  또는  $CHR^{20}O$ 이며;
- [0045] 각  $Z^4$ 는 독립적으로 O,  $C(=O)$ ,  $S(O)_m$  또는  $CHR^{20}$ 이고;
- [0046] 각  $R^{20}$ 는 독립적으로 H,  $C_1-C_4$  알킬 또는  $C_1-C_4$  할로알킬이며;
- [0047] 각  $R^{21}$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_3-C_8$  사이클로알킬,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐,  $C_2-C_6$  할로알킬카르보닐,  $C_2-C_6$  알콕시카르보닐 또는  $C_2-C_6$  할로알콕시카르보닐이고;
- [0048] 각  $R^{22}$ 는 독립적으로 H,  $C_1-C_4$  알킬 또는  $C_1-C_4$  할로알킬이며;
- [0049] 각  $R^{23}$ 는 독립적으로 H, 시아노,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_3-C_8$  사이클로알킬,  $C_3-C_8$  할로사이클로알킬,  $C_1-C_6$  알콕시,  $C_1-C_6$  할로알콕시,  $C_1-C_6$  알킬아미노,  $C_2-C_8$  다이알킬아미노,  $C_1-C_6$  할로알킬아미노 또는 페닐이고;
- [0050] 각  $R^{24}$  및  $R^{27}$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_4$  알킬 또는  $C_1-C_4$  할로알킬이며;
- [0051] 각 m은 독립적으로 0, 1 또는 2이고;
- [0052] n은 0, 1 또는 2이며;
- [0053] a 및 b는  $S(=O)_a(=NR^{23})_b$ 의 각 경우에, 독립적으로 0, 1 또는 2이되, 단 a와 b의 합계는 1 또는 2이다.
- [0054] 특히, 본 발명은 화학식 1의 화합물 (모든 기하 이성질체 및 입체 이성질체 포함), 및 이의 N-옥사이드 및 이의 염 중에서 선택되는 화합물에 관한 것이다. 본 발명은 또한 화학식 1A의 화합물, 및 이의 N-옥사이드 및 이의 염 중에서 선택되는 화합물에 관한 것이다.
- [0055] [화학식 1A]
- $$\begin{array}{c} \text{M} \quad \text{J}^1 \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{C} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$$
- [0056]
- [0057] 상기 식에서,
- [0058] M은  $C_1-C_3$  알킬,  $C_1-C_3$  할로알킬, 하이드록시,  $C_1-C_4$  알콕시,  $C_1-C_2$  할로알콕시,  $C_1-C_4$  알킬아미노,  $C_2-C_8$  다이알킬아미노, 1-피페리디닐, 1-피롤리디닐 또는 4-모르폴리닐이고;
- [0059]  $J^1$ 은 후술하는 증거 A에 나타난 J-29-1 내지 J-29-60 (여기서, 좌측으로 돌출되게 나타난 결합은 화학식 1A의  $-C(=O)M$ 에 결합된다) 중 어느 하나이다.
- [0060] 특히, 본 발명은 화학식 1A의 화합물 (모든 기하 이성질체 및 입체 이성질체 포함), 이의 N-옥사이드 또는 이의 염 (본 발명의 화학식 1A의 화합물이 하기 증거 A에 나타난 바와 같은 발명의 요약에서  $J^1$ 에 관해 정의된 입체 이성질체의 실시 형태로 제한되는 것을 제외함)에 관한 것이다.
- [0061] 본 발명은 또한 화학식 1의 화합물 (이의 모든 기하 이성질체 및 입체 이성질체, 이의 N-옥사이드, 및 이의 염 포함) (즉, 살균적 유효량으로) 및 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 살균제 조성물에 관한 것이다.
- [0062] 본 발명은 또한 화학식 1의 화합물 (이의 모든 기하 이성질체 및 입체 이성질체, 이의 N-옥사이드, 및 이의 염)과 적어도 하나의 다른 살균제 (예를 들어, 작용 부위가 상이한 적어도 하나의 다른 살균제)의 혼합물을 포함하는 살균제 조성물에 관한 것이다.
- [0063] 본 발명은 또한 살균적 유효량의 화학식 1의 화합물 (이의 모든 기하 이성질체 및 입체 이성질체, 이의 N-옥사이드, 및 이의 염 포함) (즉, 본 명세서에 기재된 조성물로서)을 식물 또는 이의 부분, 또는 식물 종자에 적용

하는 것을 포함하는, 균류 식물 병원체에 의한 식물병을 방제하는 방법을 제공한다.

[0064] 본 발명은 추가로 살균제 조성물 및 상술한 식물병을 방제하는 방법에 관한 것이다.

[0065] (발명의 상세한 설명)

[0066] 본 명세서에서 사용되는 용어 "구성하다," "구성하는," "포함하다," "포함하는," "가지다," "갖는" 또는 임의의 이들의 기타 변형체는 비배타적인 포함 사항을 망라하는 것으로 의도된다. 예를 들어, 요소들의 목록을 포함하는 조성물, 공정, 방법, 용품, 또는 장치는 반드시 그러한 요소만으로 제한되지는 않고, 명확하게 열거되지 않거나 그러한 조성물, 공정, 방법, 용품, 또는 장치에 내재적인 다른 요소를 포함할 수도 있다. 더욱이, 명백히 반대로 기술되지 않는다면, "또는"은 포괄적인 '또는'을 말하며, 배타적인 '또는'을 말하는 것은 아니다. 예를 들어, 조건 A 또는 B는 하기 중 어느 하나에 의해 만족된다: A는 참 (또는 존재함)이고 B는 거짓 (또는 존재하지 않음), A는 거짓 (또는 존재하지 않음)이고 B는 참 (또는 존재함), A 및 B가 모두가 참 (또는 존재함)이다.

[0067] 또한, "a" 또는 "an"는 본 발명의 요소 및 성분을 기재하는데 사용된다. 이는 단순히 편의상 본 발명의 일반적인 의미를 제공하도록 사용된다. 이러한 표현은 하나 또는 적어도 하나를 포함하는 것으로 파악되어야 하며, 단수형은 그 수가 명백하게 단수임을 의미하는 것이 아니라면 복수형을 또한 포함한다.

[0068] "식물"은 본 명세서 및 특허청구범위에서 지칭될 때 어린 식물 (예를 들어, 모종 (seedling)으로 발달하는 발아 종자) 및 성숙, 생식 단계 (예를 들어, 꽃 및 종자를 생성하는 식물)를 포함하는 모든 생명 단계 (life stage)의 식물계 (Kingdom Plantae), 특히 종자 식물 (종자 식물상문 (Spermatopsida))의 구성원을 포함한다. 식물 부위는 전형적으로 생육 배지 (예를 들어, 토양) 표면 아래에서 성장하는 굴지성 구성원, 예컨대 뿌리, 덩이 줄기, 구근 및 구경을 포함하며, 또한 생육 배지 위에서 성장하는 구성원, 예컨대 경엽 (줄기 및 잎 포함), 꽃, 열매 및 종자도 포함한다. 단어 단독으로 사용되거나 단어의 조합으로 사용되는 용어 "모종"은 종자 배아로부터 발육되는 어린 식물을 의미한다.

[0069] 상기 설명에서, 단독으로 또는 "알킬티오" 또는 "할로알킬"과 같은 복합어에 사용되는 용어 "알킬"은 직쇄상 또는 분지상 알킬, 예컨대, 메틸, 에틸, n-프로필, i-프로필, 또는 다른 부틸, 펜틸 또는 헥실 이성질체를 포함한다. "알케닐"은 직쇄상 또는 분지상 알켄, 예컨대 에테닐, 1-프로페닐, 2-프로페닐, 및 다른 부테닐, 펜테닐 및 헥세닐 이성질체를 포함한다. "알케닐"은 또한 폴리엔, 예컨대 1,2-프로파디에닐 및 2,4-헥사디에닐을 포함한다. "알키닐"은 직쇄상 또는 분지상 알킨, 예컨대 에티닐, 1-프로피닐, 2-프로피닐 및 다른 부티닐, 펜티닐 및 헥시닐 이성질체를 포함한다. "알키닐"은 또한 다수의 삼중 결합으로 구성되는 부분, 예컨대 2,5-헥사디에닐을 포함할 수 있다. "알킬렌"은 직쇄상 또는 분지상 알칸디일을 나타낸다. "알킬렌"의 예로는  $\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}(\text{CH}_3)$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$  및 다른 부틸렌 이성질체를 들 수 있다. "알케닐렌"은 1개의 올레핀 결합을 포함하는 직쇄상 또는 분지상 알켄디일을 나타낸다. "알케닐렌"의 예로는  $\text{CH}=\text{CH}$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$ ,  $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$  및  $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$ 를 들 수 있다.

[0070] "사이클로알킬"은 예를 들어, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸, 및 사이클로헥실을 포함한다. "사이클로알케닐"은 기, 예컨대 사이클로펜테닐 및 사이클로헥세닐, 및 2개 이상의 이중 결합을 갖는 기, 예컨대 1,3- 및 1,4-사이클로헥사디에닐을 포함한다. 용어 "알킬사이클로알킬"은 사이클로알킬 부분이 알킬 치환된 것을 나타내며, 예를 들어, 에틸사이클로프로필, i-프로필사이클로부틸, 3-메틸사이클로펜틸 및 4-메틸사이클로헥실을 포함한다. 용어 "사이클로알킬알킬"은 알킬 부분이 사이클로알킬 치환된 것을 나타낸다. "사이클로알킬알킬"의 예로는 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸에틸, 및 직쇄상 또는 분지상 알킬기에 결합된 다른 사이클로알킬 부분을 포함한다. "사이클로알킬사이클로알킬"은 다른 사이클로알킬기로 치환된 사이클로알킬기를 나타낸다. "사이클로알킬사이클로알킬"의 예로는 2-사이클로프로필사이클로프로필 및 3-사이클로프로필사이클로펜틸을 들 수 있다. "할로사이클로알킬알킬"은 사이클로알킬 부분, 알킬 부분, 또는 사이클로알킬 및 알킬 부분의 둘다가 할로젠 치환된 것을 나타낸다. "할로사이클로알킬알킬"의 예로는 (2-클로로사이클로프로필)메틸, 2-사이클로펜틸-1-클로로에틸, 및 2-(3-클로로사이클로펜틸)-1-클로로에틸을 들 수 있다.

[0071] "알콕시"는 예를 들어, 메톡시, 에톡시, n-프로필옥시, 아이소프로필옥시 및 다른 부톡시, 펜톡시 및 헥실옥시 이성질체를 포함한다. "알콕시알콕시"는 직쇄상 또는 분지상 알콕시가 적어도 하나의 직쇄상 또는 분지상 알콕시 치환된 것을 나타낸다. "알콕시알콕시"의 예로는  $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{O}-$ ,  $\text{CH}_3\text{OCH}_2(\text{CH}_3\text{O})\text{CHCH}_2\text{O}-$  및  $(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 를 들 수 있다. 용어 "할로알콕시알콕시"는 할로알콕시 부분으로 치환된 알콕시알콕시기를 나타낸다. "할로알콕시알콕시"의 예로는  $\text{CF}_3\text{OCH}_2\text{O}-$ ,  $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$  및  $\text{Cl}_3\text{CCH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ , 및 분지상 알킬 유도체를 들 수 있다. 용어 "알

콕시할로알콕시"는 알콕시 부분으로 추가로 치환된 할로알콕시기를 나타낸다. "알콕시할로알콕시"의 예로는  $\text{CH}_3\text{OCHClO}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CHClO}-$  및  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCCl}_2\text{O}-$ , 및 분지상 알킬 유도체를 들 수 있다. 용어 "할로알콕시할로알콕시"는 할로알콕시 부분으로 추가로 치환된 할로알콕시기를 나타낸다. "할로알콕시할로알콕시"의 예로는  $\text{CF}_3\text{OCHClO}-$ ,  $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{OCHClCH}_2\text{O}-$  및  $\text{Cl}_3\text{CCH}_2\text{OCHClO}-$ , 및 분지상 알킬 유도체를 들 수 있다. "알콕시알킬"은 알킬이 알콕시 치환된 것을 나타낸다. "알콕시알킬"의 예로는  $\text{CH}_3\text{OCH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$  및  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 를 들 수 있다. 용어 "사이클로알콕시알킬"은 알킬 부분이 사이클로알콕시 치환된 것을 나타낸다. "사이클로알콕시알킬"의 예로는 사이클로프로폭시메틸, 사이클로펜톡시에틸, 및 직쇄상 또는 분지상 알킬기에 결합된 다른 사이클로알콕시 부분을 들 수 있다. "알콕시알콕시알킬"은 알킬 부분에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알콕시 부분에 결합된 적어도 하나의 직쇄상 또는 분지상 알콕시 부분을 나타낸다. "알콕시알콕시알킬"의 예로는  $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{OCH}_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3)\text{CHOCH}_2-$  및  $(\text{CH}_3\text{O})_2\text{CHOCH}_2-$ 를 들 수 있다. "알케닐옥시"는 직쇄상 또는 분지상 알케닐옥시 부분을 포함한다. "알케닐옥시"의 예로는  $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ ,  $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$ ,  $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$  및  $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 를 들 수 있다. "알키닐옥시"는 직쇄상 또는 분지상 알키닐옥시 부분을 포함한다. "알키닐옥시"의 예로는  $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ ,  $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$  및  $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 를 들 수 있다.

[0072]

"알킬티오"는 분지상 또는 직쇄상 알킬티오 부분, 예컨대 메틸티오, 에틸티오, 및 다른 프로필티오, 부틸티오, 펜틸티오 및 헥실티오 이성질체를 포함한다. "알킬티오알킬"은 알킬이 알킬티오 치환된 것을 나타낸다. "알킬티오알킬"의 예로는  $\text{CH}_3\text{SCH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$  및  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 를 들 수 있다. "알킬설피닐"은 알킬설피닐기의 두 에난티오머를 포함한다. "알킬설피닐"의 예로는  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})$  및 다른 부틸설피닐, 펜틸설피닐 및 헥실설피닐 이성질체를 들 수 있다. "알킬설피닐알킬"은 알킬이 알킬설피닐 치환된 것을 나타낸다. "알킬설피닐알킬"의 예로는  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})\text{CH}_2$  및  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2$ 를 들 수 있다. "알킬설피닐"의 예로는  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2$  및 다른 부틸설피닐, 펜틸설피닐 및 헥실설피닐 이성질체를 들 수 있다. "알킬설피닐알킬"은 알킬이 알킬설피닐 치환된 것을 나타낸다. "알킬설피닐알킬"의 예로는  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2$  및  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 를 들 수 있다.

[0073]

"알킬카르보닐"의 예로는  $\text{CH}_3\text{C}(\text{O})$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})$  및  $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(\text{O})$ 를 들 수 있다. "알콕시카르보닐"의 예로는  $\text{CH}_3\text{OC}(\text{O})$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(\text{O})$  및 다른 부톡시- 또는 펜톡시카르보닐 이성질체를 들 수 있다. "알킬아미노카르보닐"의 예로는  $\text{CH}_3\text{NHC}(\text{O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(\text{O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(\text{O})-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(\text{O})-$  및 다른 부틸아미노- 또는 펜틸아미노카르보닐 이성질체를 들 수 있다. "다이알킬아미노카르보닐"의 예로는  $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(\text{O})-$ ,  $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(\text{O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(\text{O})-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{O})-$  및  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(\text{O})-$ 를 들 수 있다. "사이클로알킬알콕시카르보닐"은 알콕시카르보닐기의 알콕시 부분에 치환된 사이클로알킬을 나타낸다. "사이클로알킬알콕시카르보닐"의 예로는 사이클로프로필- $\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})-$ , 사이클로프로필- $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OC}(\text{O})-$  및 사이클로펜틸- $\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})-$ 를 들 수 있다. "알콕시(알킬)아미노카르보닐"은 아미노카르보닐기의 질소 원자에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬 및 알콕시 부분을 나타낸다. "알콕시(알킬)아미노카르보닐"의 예로는  $\text{CH}_3\text{O}(\text{CH}_3)\text{NC}(\text{O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3)\text{NC}(\text{O})-$  및  $(\text{CH}_3)_2\text{CHO}(\text{CH}_3)\text{NC}(\text{O})-$ 를 들 수 있다. 용어 "할로알킬설피닐아미노카르보닐"은 알킬 부분 또는 아미노카르보닐기의 질소 원자, 또는 알킬 부분 및 질소 원자 둘다가 할로젠 치환된 것을 나타낸다. "할로알킬설피닐아미노카르보닐"의 예로는  $\text{CF}_3\text{SO}_2\text{NH}(\text{C}=\text{O})-$  및  $\text{CF}_3\text{SO}_2\text{NCl}(\text{C}=\text{O})-$ 를 들 수 있다. 용어 "알킬카르보닐옥시"는  $\text{C}(\text{O})\text{O}$  부분에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬을 나타낸다. "알킬카르보닐옥시"의 예로는  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{O}$  및  $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(\text{O})\text{O}$ 를 들 수 있다. "알콕시카르보닐알킬"은 직쇄상 또는 분지상 알킬이 알콕시카르보닐 치환된 것을 나타낸다. "알콕시카르보닐알킬"의 예로는  $\text{CH}_3\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2$  및  $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(\text{O})\text{CH}_2$ 를 들 수 있다. 용어 "알킬카르보닐알콕시"는 알콕시 부분에 결합된 알킬카르보닐을 나타낸다. "알킬카르보닐알콕시"의 예로는  $\text{CH}_3\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$  및  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{O}$ 를 들 수 있다. "알콕시카르보닐옥시"의 예로는  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{O}$  및  $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(\text{O})\text{O}$ 를 들 수 있다.

[0074] "알킬(티오카르보닐)"은  $C(=S)$  부분에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬 부분을 나타낸다. "알킬(티오카르보닐)"의 예로는  $CH_3C(=S)-$ ,  $CH_3CH_2CH_2C(=S)-$  및  $(CH_3)_2CHC(=S)-$ 를 들 수 있다. "알콕시(티오카르보닐)"은  $C(=S)$  부분에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알콕시 부분을 나타낸다. "알콕시(티오카르보닐)"의 예로는  $CH_3OC(=S)-$ ,  $CH_3CH_2CH_2OC(=S)-$  및  $(CH_3)_2CHOC(=S)-$ 를 들 수 있다. "알킬티오(티오카르보닐)"은  $C(=S)$  부분에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬티오 부분을 나타낸다. "알킬티오(티오카르보닐)"의 예로는  $CH_3SC(=S)-$ ,  $CH_3CH_2CH_2SC(=S)-$  및  $(CH_3)_2CHSC(=S)-$ 를 들 수 있다. "알킬아미노(티오카르보닐)"은  $C(=S)$  부분에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬아미노 부분을 나타낸다. "알킬아미노(티오카르보닐)"의 예로는  $CH_3NHC(=S)-$ ,  $CH_3CH_2CH_2NHC(=S)-$  및  $(CH_3)_2CHNHC(=S)-$ 를 들 수 있다. "다이알킬아미노(티오카르보닐)"은  $C(=S)$  부분에 결합된 직쇄상 또는 분지상 다이알킬아미노 부분을 나타낸다. "다이알킬아미노(티오카르보닐)"의 예로는  $(CH_3)_2NC(=S)-$ ,  $CH_3CH_2CH_2(CH_3)NC(=S)-$  및  $(CH_3)_2C(CH_3)NC(=S)-$ 를 들 수 있다.

[0075] "알킬아미디노"는  $C(=N)$  부분의 탄소 원자에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬아미노 부분, 또는  $C(=N)$  부분의 탄소 원자에 결합된 비치환된 아미노 부분 및  $C(=N)$  부분의 질소 원자에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬 부분을 나타낸다. "알킬아미디노"의 예로는  $CH_3NHC(=NH)-$ ,  $CH_3CH_2NHC(=NH)-$  및  $H_2NC(=NCH_3)-$ 를 들 수 있다. "다이알킬아미디노"는  $C(=N)$  부분의 탄소 원자에 결합된 직쇄상 또는 분지상 다이알킬아미노 부분, 또는  $C(=N)$  부분의 탄소 원자에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬아미노 부분 및  $C(=N)$  부분의 질소 원자에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬 부분을 나타낸다. "다이알킬아미디노"의 예로는  $(CH_3)_2NC(=NH)-$ ,  $CH_3CH_2(CH_3)NC(=NH)-$  및  $CH_3NHC(=NCH_3)-$ 를 들 수 있다.

[0076] "알킬아미노", "다이알킬아미노" 등은 상기 예와 유사하게 정의된다. 용어 "할로다이알킬아미노"는 적어도 하나의 알킬 부분 상에서 동일하거나 상이할 수 있는 하나 이상의 할로젠 원자로 치환된 다이알킬아미노기를 나타낸다. "할로다이알킬아미노"의 예로는  $CF_3(CH_3)N-$ ,  $(CF_3)_2N-$  및  $CH_2Cl(CH_3)N-$ 을 들 수 있다. "사이클로알킬아미노"는 아미노 질소 원자가 사이클로알킬 라디칼 및 수소 원자에 결합되어 있는 것을 의미하며, 기, 예컨대 사이클로프로필아미노, 사이클로부틸아미노, 사이클로펜틸아미노 및 사이클로헥실아미노를 포함한다. "사이클로알킬(알킬)아미노"는 아미노 수소 원자가 알킬 라디칼로 치환되어 있는 사이클로알킬아미노기를 의미한다. "사이클로알킬(알킬)아미노"의 예로는 기, 예컨대 사이클로프로필(메틸)아미노, 사이클로부틸(부틸)아미노, 사이클로펜틸(프로필)아미노, 사이클로헥실(메틸)아미노 등을 들 수 있다. "할로알킬아미노알킬"은 아미노 질소, 또는 알킬 부분 또는 이의 조합 상에서 동일하거나 상이할 수 있는 하나 이상의 할로젠 원자로 치환된 알킬아미노알킬기를 나타낸다. "할로알킬아미노알킬"은 임의의 알킬기 및 질소에 결합된 할로젠기를 포함한다. "할로알킬아미노알킬"의 예로는  $CH_3NHCHCl-$ ,  $(CH_3)_2CClNHCH_2-$  및  $CH_3NC1CH(CH_3)-$ 를 들 수 있다.

[0077] 용어 "다이알킬이미도"는 아미노기의 질소 원자에 결합된 2개의 독립적인 직쇄상 또는 분지상 알킬카르보닐 부분을 나타낸다. "다이알킬이미도"의 예로는  $(CH_3C(=O))_2N-$  및  $CH_3CH_2C(=O)(CH_3C(=O))N-$ 을 들 수 있다. 용어 "알콕시카르보닐아미노"는 카르보닐아미노기의  $C(=O)$  부분에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알콕시 부분을 나타낸다. "알콕시카르보닐아미노"의 예로는  $CH_3OC(=O)NH-$  및  $CH_3CH_2OC(=O)NH-$ 를 들 수 있다. 용어 "알킬아미노카르보닐아미노"는 카르보닐아미노기의  $C(=O)$  부분에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬아미노 부분을 나타낸다. "알킬아미노카르보닐아미노"의 예로는  $CH_3NHC(=O)NH-$  및  $CH_3CH_2NHC(=O)NH-$ 를 들 수 있다. 용어 "다이알킬아미노카르보닐아미노"는 카르보닐아미노기의  $C(=O)$  부분에 결합된 직쇄상 또는 분지상 다이알킬아미노 부분을 나타낸다. "다이알킬아미노카르보닐아미노"의 예로는  $(CH_3)_2NC(=O)NH-$  및  $CH_3CH_2(CH_3)NC(=O)NH-$ 를 들 수 있다. 용어 "알킬아미노카르보닐알킬아미노"는 카르보닐아미노기의  $C(=O)$  부분에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬아미노 부분 및 카르보닐아미노기의 아미노 질소에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬 부분을 나타낸다. "알킬아미노카르보닐알킬아미노"의 예로는  $CH_3NHC(=O)N(CH_3)-$  및  $CH_3CH_2NHC(=O)N(CH_3)-$ 를 들 수 있다. 용어 "다이알킬아미노카르보닐알킬아미노"는 카르보닐아미노기의  $C(=O)$  부분에 결합된 직쇄상 또는 분지상 다이알킬아미노 부분 및 카르보닐아미노기의 아미노 질소에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬 부분을 나타낸다. "다이알킬아미노카르보닐알킬아미노"의 예로는  $(CH_3)_2NC(=O)N(CH_3)-$  및  $CH_3CH_2(CH_3)NC(=O)N(CH_3)-$ 를 들 수 있다. 용어 "알킬아미노(티오카르보닐)아미노"는 카르보닐아미노기의  $C(=S)$  부분에 결합된 직쇄상 또는 분지상 알킬아미노 부분을



나타낸다. "알킬아미노(티오카르보닐)아미노"의 예로는  $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{S})\text{NH}-$  및  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{S})\text{NH}-$ 를 들 수 있다.

[0078] "트라이알킬실릴"은 규소 원자에 부착되어, 규소 원자를 통해 결합되는 3개의 분지상 및/또는 직쇄상 알킬 라디칼, 예컨대 트라이메틸실릴, 트라이에틸실릴 및 tert-부틸다이메틸실릴을 포함한다. 용어 "할로트라이알킬실릴"은 트라이알킬실릴기의 적어도 하나의 알킬 부분 상에서 치환된 하나 이상의 할로겐 원자를 나타낸다. "할로트라이알킬실릴"의 예로는  $\text{CF}_3(\text{CH}_3)_2\text{Si}-$ ,  $(\text{CF}_3)_3\text{Si}-$ , 및  $\text{CH}_2\text{Cl}(\text{CH}_3)_2\text{Si}-$ 를 들 수 있다.

[0079] "하이드록시알킬"은 1개의 하이드록시기로 치환된 알킬기를 나타낸다. "하이드록시알킬"의 예로는  $\text{HOCH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{OH})\text{CH}$  및  $\text{HOCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 를 들 수 있다.

[0080] 단독의 또는 "할로알킬"과 같은 복합어에서의 용어 "할로겐"은 불소, 염소, 브롬 또는 요오드를 포함한다. 또한, "할로알킬"과 같은 복합어에서 사용될 때, 상기 알킬은 동일하거나 상이할 수 있는 할로겐 원자로 부분적으로 또는 완전히 치환될 수 있다. "할로알킬"의 예로는  $\text{F}_3\text{C}$ ,  $\text{ClCH}_2$ ,  $\text{CF}_3\text{CH}_2$  및  $\text{CF}_3\text{CCl}_2$ 를 들 수 있다. 용어 "할로알케닐", "할로알키닐", "할로사이클로알킬", "할로알콕시", "할로알킬티오" 등은 용어 "할로알킬"과 유사하게 정의된다. "할로알케닐"의 예로는  $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$  및  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$ 를 들 수 있다. "할로알키닐"의 예로는  $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$ ,  $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$ ,  $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$  및  $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ 를 들 수 있다. "할로알콕시"의 예로는  $\text{CF}_3\text{O}$ ,  $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ ,  $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$  및  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ 를 들 수 있다. "할로알킬티오"의 예로는  $\text{CCl}_3\text{S}$ ,  $\text{CF}_3\text{S}$ ,  $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$  및  $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ 를 들 수 있다. "할로알킬설폰"의 예로는  $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})$ ,  $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})$ ,  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$  및  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})$ 를 들 수 있다. "할로알킬설폰"의 예로는  $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2$ ,  $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2$ ,  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$  및  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2$ 를 들 수 있다.

[0081] 달리 명시되지 않는 한, 화학식 1의 성분 (예를 들어, 치환기 J 및 Q)으로서의 "환" 또는 "환계"는 탄소환 또는 복소환이다. 용어 "환계"는 2개 이상의 연결된 환을 나타낸다. 용어 "스피로환계"는 단일 원자에서 연결된 2개의 환으로 구성되는 환계를 나타낸다 (그리하여, 환은 공통하는 단일 원자를 갖는다). 용어 "이환계"는 2개 이상의 공통 원자를 공유하는 2개의 환으로 구성되는 환계를 나타낸다. "융합 이환계"에서, 공통 원자가 인접하므로, 환은 2개의 인접한 원자 및 이들을 연결시키는 결합을 공유한다. "가교 이환계"에서, 공통 원자는 인접하지 않는다 (즉, 다리목 (bridgehead) 원자 사이에 결합이 존재하지 않음). "가교 이환계"는 개념적으로 하나 이상의 원자 세그먼트를 환의 인접하지 않은 환 구성원에 결합시킴으로써 형성된다.

[0082] 환, 이환계 또는 스피로환계는 2개 이상의 환을 포함하는 확대 환계의 일부일 수 있으며, 여기서 환, 이환계 또는 스피로환계 상의 치환기는 함께 추가의 환을 형성하고, 확대 환계의 다른 환과 이환식 및/또는 스피로환식 관계에 있을 수 있다. 예를 들어, 증거 A에 나타난 특정한 J 또는  $J^1$  부분 J-29-59은 페닐기 ( $Z^3G^A$ 로서)로 치환된 페닐 환인  $Z^2Q$ 로서 1개의  $R^5$  치환기 및 또한, 다이하이드로 아이속사줄린 환 상의 다른  $R^5$  치환기와 함께  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 로서 취해 환계의 추가의 6원 환 성분을 형성하는 1개의  $R^{7a}$ 를 갖는 다이하이드로 아이속사줄린 환으로 구성된다.

[0083] 용어 "환 구성원"은 환 또는 환계의 골격을 형성하는 원자 (예를 들어, C, O, N 또는 S) 또는 다른 부분 (예를 들어,  $\text{C}(=\text{O})$ ,  $\text{C}(=\text{S})$  또는  $\text{S}(=\text{O})_a(\text{NR}^{23})_b$ )를 말한다. 용어 "탄소환"은 환 골격을 형성하는 원자가 다만 탄소로부터 선택되는 환을 나타낸다. 용어 "탄소환계"는 환 골격을 형성하는 원자가 다만 탄소로부터 선택되는 2개 이상의 융합환을 나타낸다. 용어 "복소환"은 환 골격을 형성하는 원자 중 적어도 하나가 탄소 이외의 것인 환을 나타낸다. 용어 "복소환계"는 환 골격을 형성하는 원자 중 적어도 하나가 탄소 이외의 것인 2개 이상의 융합환을 나타낸다. "방향족"은 각각의 환 원자가 실질적으로 동일 평면에 있고, 환 평면에 수직인 p-오비탈을 가지며,  $(4n + 2) \pi$  전자 (여기서, n은 양의 정수이다)가 회절 규칙 (Hückel's rule)에 따르도록 환에 결합되어 있는 것을 나타낸다. 용어 "헤테로 방향족 환"은 방향족인 복소환을 말한다. 용어 "포화 복소환"은 환 구성원 사이에 다만 단일 결합을 포함하는 복소환을 나타낸다. 용어 "부분 포화 복소환"은 적어도 하나의 이중 결합을 포함하나, 방향족이 아닌 복소환을 나타낸다.

[0084] 화학식 1 및 본 명세서에 나타난 다른 환의 점선 (예를 들어, 증거 3의 J-44, J-45, J-48 및 J-49)은 표시된 결합이 단일 결합 또는 이중 결합일 수 있음을 나타낸다. 달리 표시되지 않는 한, 복소환 및 복소환계는 탄소 또는 질소 상에서의 수소 치환에 의해 임의의 이용가능한 탄소 또는 질소를 통해 화학식 1의 나머지 부분에 결합되며, 모든 복소환 및 복소환계의 치환기는 상기 탄소 또는 질소 상에서의 수소 치환에 의해 임의의 이용가능한

탄소 또는 질소를 통해 결합된다.

[0085]

이미 기재된 바와 같이, J는 탄소, 2개 이하의 O, 2개 이하의 S 및 4개 이하의 N 중에서 선택되는 4개 이하의 헤테로 원자, 및 C(=O), C(=S), S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 3개 이하의 환 구성원 중에서 선택되는 환 구성원을 포함하고, -Z<sup>2</sup>Q 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 2개의 치환기로 치환되며, R<sup>5</sup> 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환되는 5원, 6원 또는 7원 환, 8원 내지 11원 이환계 또는 7원 내지 11원 스피로환계이다. 헤테로 원자가 임의적이므로, 0개 내지 4개의 헤테로 원자가 존재할 수 있다. 본 명세서에서, 2개 이하의 S 중에서 선택되는 헤테로 원자는 원자이고, 부분 S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub>가 아니다. 본 발명이 또한 화학식 1의 화합물의 N-옥사이드 유도체에 관한 것이므로, 4개 이하의 N 중에서 선택되는 헤테로 원자는 N-옥사이드로서 산화될 수 있다. 따라서, 2개 이하의 O, 2개 이하의 S 및 4개 이하의 N 중에서 선택되는 임의의 1개 내지 4개의 헤테로 원자 이외에도, C(=O), C(=S), S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 임의의 1개 내지 3개의 환 구성원이 있다. 미산화 황 원자 (즉, S) 및 산화 황 부분 (즉, S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub>)의 총수가 2를 초과하지 않으면, S 및 S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 중에서 선택되는 환 구성원이 기껏해야 2개가 환 또는 환계에 존재한다는 것에 주목된다. 임의의 헤테로 원자, 및 S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 임의의 환 구성원이 모두 존재하지 않는 경우에는, 환 또는 환계는 탄소환식이다. R<sup>5</sup> 치환기는 이용가능한 결합점을 갖는 질소 원자 환 구성원 및 탄소 원자 환 구성원에 결합될 수 있다. 탄소계 환 구성원 C(=O) 및 C(=S)는 이용가능한 결합점을 갖고 있지 않다. 또한 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 환 구성원에서, 치환기 R<sup>17</sup> 및 R<sup>18</sup>은 달리 별도로 정의되어 있으며, 이러한 환 구성원은 추가로 R<sup>5</sup>로 치환될 수 없다. R<sup>5</sup> 치환기가 임의적이기 때문에, 0개 내지 5개의 치환기가 존재할 수 있는데, 이는 이용가능한 결합점의 수에 의해 제한된다.

[0086]

유사하게는, R<sup>5</sup> 및 R<sup>7a</sup>는 R<sup>5</sup> 및 R<sup>7a</sup>를 연결하는 원자와 함께, 탄소, 1개 이하의 O, 1개 이하의 S 및 1개 이하의 N 중에서 선택되는 3개 이하의 헤테로 원자, 및 C(=O), C(=S), S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 3개 이하의 환 구성원 중에서 선택되는 환 구성원을 포함하는 임의로 치환된 5원 내지 7원 환을 형성할 수 있다. 헤테로 원자가 임의적이므로, 0개 내지 3개의 헤테로 원자가 존재할 수 있다. 본 명세서에서, 1개 이하의 S 중에서 선택되는 헤테로 원자는 원자이며, 부분 S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub>이 아니다. 본 발명이 또한 화학식 1의 화합물의 N-옥사이드 유도체에 관한 것이므로, 1개 이하의 N 중에서 선택되는 헤테로 원자는 N-옥사이드로서 산화될 수 있다. 따라서, 1개 이하의 O, 1개 이하의 S 및 1개 이하의 N 중에서 선택되는 임의의 1개 내지 3개의 헤테로 원자 이외에도, C(=O), C(=S), S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 임의의 1개 내지 3개의 환 구성원이 있다. 미산화 황 원자 (즉, S) 및 산화 황 부분 (즉, S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub>)의 총수가 1을 초과하지 않으면, S 및 S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 중에서 선택되는 환 구성원이 기껏해야 1개가 환에 존재한다는 것에 주목된다. 임의의 헤테로 원자, 및 S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 및 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 중에서 선택되는 임의의 환 구성원이 모두 존재하지 않는 경우에는, 환은 탄소환이다. 5원 내지 7원 환은 임의로 치환된다. R<sup>5</sup> 및 R<sup>7a</sup>를 연결하는 원자 상의 치환기는 R<sup>5</sup> 및 R<sup>7a</sup>를 연결하는 성분의 정의에 기재되어 있다. 예를 들어, 연결 성분 Z<sup>2</sup>가 CHR<sup>20</sup>인 경우에는, 치환기 R<sup>20</sup>는 H, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬인 것으로 정의된다. 함께 취해진 R<sup>5</sup> 및 R<sup>7a</sup>로 구성되는 환 부분에 결합되는 임의의 치환기에 관해서는, 임의의 치환기는 살균 활성을 소멸시키지 않는 비수소 치환기이다. 임의의 치환기는 이용가능한 결합점을 갖는 질소 원자 환 구성원 및 탄소 원자 환 구성원에 결합될 수 있다. 탄소계 환 구성원 C(=O) 및 C(=S)는 이용가능한 결합점을 갖고 있지 않다. 또한 SiR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 환 구성원에서, 치환기 R<sup>17</sup> 및 R<sup>18</sup>은 달리 별도로 정의되어 있으며, 이러한 환 구성원은 추가로 치환될 수 없다. 마찬가지로, S(=O)<sub>a</sub>(=NR<sup>23</sup>)<sub>b</sub> 환 구성원에서, 치환기 R<sup>23</sup>은 달리 별도로 정의되어 있으며, 이러한 환 구성원은 추가로 치환될 수 없다.

[0087] 치환기 내의 탄소 원자의 총수는 " $C_i-C_j$ " 접두어로 나타내며, 여기서  $i$ 와  $j$ 는 1 내지 10의 수이다. 예를 들어,  $C_1-C_4$  알킬설폰일은 메틸설폰일 내지 부틸설폰일을 나타내며;  $C_2$  알콕시알킬은  $CH_3OCH_2$ 를 나타내며;  $C_3$  알콕시알킬은 예를 들어,  $CH_3CH(OCH_3)$ ,  $CH_3OCH_2CH_2$  또는  $CH_3CH_2OCH_2$ 를 나타내며;  $C_4$  알콕시알킬은 총 4개의 탄소 원자를 포함하는 알콕시기로 치환된 알킬기의 다양한 이성질체를 나타내며, 그 예로는  $CH_3CH_2CH_2OCH_2$  및  $CH_3CH_2OCH_2CH_2$ 를 들 수 있다.

[0088] 화합물이 치환기의 수가 변화할 수 있음을 나타내는 아래 첨자를 갖는 치환기로 치환되어, 상기 치환기의 수가 1을 초과하는 경우에는, 상기 치환기는 정의된 치환기 그룹 중에서 독립적으로 선택된다. 또한 범위가 표시되어 있으면 (예를 들어,  $i-j$  치환기), 치환기의 수는  $i$  내지  $j$ 의 정수 중에서 선택될 수 있다. 기 (예를 들어,  $J$ )가 수소일 수 있는 치환기 (예를 들어,  $R^5$ )를 포함하면, 이러한 치환기가 수소로서 간주되는 경우, 이는 비치환된 상기 기와 동등한 것으로 인지된다. 가변 기 (variable group)가 어느 한 위치, 예를 들어  $(R^2)_n$  (여기서,  $n$ 은 0일 수 있다), 또는 추가의 예로서 증거 1의 U-17의  $(R^4)_k$  (여기서,  $k$ 는 0일 수 있다)에 임의로 결합되는 것으로 보여지면, 수소는 가변 기 (예를 들어,  $R^2$  및  $R^4$ )의 정의에서 인용되지 않더라도 그 위치에 있을 수 있다. 기의 위치가 "치환되지 않은" 또는 "비치환된"이라고 하면, 수소 원자는 임의의 자유 원자가를 차지하도록 결합된다.  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$ ,  $R^{7a}$ ,  $G$ ,  $J$  및  $Q$ 에 열거된 기와 관련하여, 용어 "임의로 치환된"은 비치환되거나 적어도 1개의 비수소 치환기를 갖는 기를 말한다. 달리 표시되지 않는 한, 이들 기는 임의의 이용가능한 탄소 또는 질소 원자 상에서 수소 원자를 비수소 치환기로 치환함으로써 수용될 수 있는 것과 같은 수 만큼의 임의의 치환기로 치환될 수 있다. 통상, 임의의 치환기 (존재하는 경우)의 수는 1 내지 3의 범위이다. 치환기의 수에 지정된 범위 (예를 들어,  $x$ 는 증거 3에서 0 내지 5의 정수임)가 환 상의 치환기에 이용가능한 위치의 수를 초과하면 (예를 들어, 증거 3의 J-1의  $(R^5)_x$ 에 관해서는  $s$ 가 1 ( $s$ 는 0과 같을 수 없음)이면 단 1개의 위치가 이용하거나,  $s$ 가 2 이면 이용가능한 위치가 존재하지 않는다), 실질적인 범위 상한치가 이용가능한 위치의 수인 것으로 인지된다. 용어 "임의로 치환된"은 치환기의 수가 0일 수 있음을 의미한다. 예를 들어, 어구 "탄소 환 구성원 상에서  $R^3$  중에서 선택되고, 질소 환 구성원 상에서  $R^{11}$  중에서 선택되는 2개 이하의 치환기로 임의로 치환된"은 0개, 1개 또는 2개의 치환기가 존재할 수 있으므로 (잠재적인 연결점의 수가 허용되는 경우),  $R^3$  및  $R^{11}$  치환기의 수가 0일 수 있음을 의미한다. 유사하게는, 어구 "1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환되는"은 이용가능한 연결점의 수가 허용되는 경우에 0개, 1개, 2개, 3개, 4개 또는 5개의 치환기가 존재할 수 있음을 의미한다. 기, 예컨대 환 또는 환계와 관련하여, 용어 "비치환된"은 기가 화학식 1의 나머지 부분에 대한 이의 하나 이상의 결합부 이외의 임의의 치환기를 갖지 않는 것을 의미한다. 용어 "메타-치환된 페닐"은 화학식 1의 나머지 부분에 대한 페닐 환의 결합부에 대하여 메타 위치에서 비수소 치환기로 치환된 페닐 환을 의미한다.

[0089] 상술한 바와 같이,  $R^1$ 은 임의로 치환된 페닐, 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환 또는 임의로 치환된 나프탈레닐이고;  $G$ 는 임의로 치환된 5원 복소환이며;  $R^5$  및  $R^{7a}$ 는  $R^5$  및  $R^{7a}$ 를 연결하는 원자와 함께, 탄소, 1개 이하의 O, 1개 이하의 S 및 1개 이하의 N 중에서 선택되는 3개 이하의 헤테로 원자, 및  $C(=O)$ ,  $C(=S)$ ,  $S(=O)_a(=NR^{23})_b$  및  $SiR^{17,18}$  중에서 선택되는 1개 내지 3개 이하의 환 구성원 중에서 선택되는 환 구성원을 포함하는 임의로 치환된 5원 내지 7원 환을 형성할 수 있다.  $R^1$ ,  $G$ ,  $R^5$  및  $R^{7a}$ 의 정의와 관련하여, 용어 "치환된"은 살균 활성을 소멸시키지 않는 적어도 하나의 비수소 치환기를 갖는 기를 말한다. 이들 기가 임의로 치환되기 때문에, 이들은 임의의 비수소 치환기를 가질 필요가 없다. 이들 기가 치환기의 수가 명시되지 않고서 "임의로 치환되기" 때문에, 이들 기는 임의의 이용가능한 탄소 또는 질소 원자 상에서 수소 원자를 비수소 치환기로 치환함으로써 수용될 수 있는 것과 같은 수 만큼의 임의의 치환기로 치환될 수 있다.

[0090]  $Z^3$ 가  $CR^{24}=CR^{27}$ ,  $OCHR^{20}$  또는  $CHR^{20}$ 인 경우에는, 라디칼의 좌측 말단은  $Q$ 에 연결되며, 라디칼의 우측 말단은  $G^A$ ,  $G^N$  또는  $G^P$ 에 연결된다.

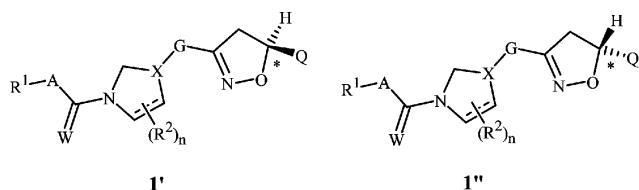
[0091] 본 명세서에서의 치환기의 명명은 화학 구조를 당업자에게 정확히 전달하는데 있어서 간결성을 제공하는 용인된 용어를 사용한다. 간결성을 위해, 로칸트 디스크립터 (locant descriptor)는 생략될 수 있으며; "피라졸-1-



일"은 명명법의 케미칼 앱스트랙트 시스템 (Chemical Abstracts system)에 따르면, "1H-피라졸-1-일"을 의미한다. 용어 "피리딜"은 "피리디닐"과 동의어이다. 치환기의 리스트 순서는 그 차이가 의미에 영향을 미치지 않는 경우에는 케미칼 앱스트랙트 시스템과 상이할 수 있다.

[0092]

본 발명의 화합물은 하나 이상의 입체 이성질체로서 존재할 수 있다. 다양한 입체 이성질체는 에난티오머, 다이어스테레오머, 아트로프 이성질체 (atropisomer) 및 기타 이성질체를 포함한다. 당업자는 하나의 입체 이성질체가 다른 이성질체(들)에 비하여 풍부할 때 또는 다른 입체 이성질체(들)로부터 분리될 때 활성이 더 클 수 있고/있거나 유의한 효과를 나타낼 수 있음을 이해할 것이다. 부가적으로, 당업자는 상기 입체 이성질체를 분리, 농축, 및/또는 선택적으로 제조하는 방법을 안다. 본 발명의 화합물은 입체 이성질체들의 혼합물, 개별 입체 이성질체 또는 광학 활성 형태로서 존재할 수 있다. 예를 들어, J가 3 위치에서 화학식 1의 나머지 부분에 결합된 J-29 (증거 3 참조)이고, J-29이 5 위치에서 H 이외의 1개의 Q 치환기를 가지면 ( $Z^2$ 는 직접 결합이고, s는 1이며, x는 0이다), 화학식 1은 Q가 결합되는 탄소 원자에 키랄 중심을 갖는다. 2개의 에난티오머는 별표 (\*)로 특정된 키랄 중심을 갖는 화학식 1' 및 화학식 1"로서 나타낸다.



[0093]

[0094]

본 발명은 라세미 혼합물, 예를 들어 동일량의 화학식 1' 및 1"의 에난티오머를 포함한다. 게다가, 본 발명은 라세미 혼합물과 비교하여, 화학식 1의 에난티오머가 풍부한 화합물을 포함한다. 실질적으로 순수한 화학식 1, 예를 들어, 화학식 1' 및 화학식 1"의 화합물의 에난티오머도 포함한다.

[0095]

에난티오머적으로 풍부한 (enantiomerically enriched) 경우에는, 하나의 에난티오머가 다른 것보다 더 많은 양으로 존재하며, 풍부도 (extent of enrichment)는 에난티오머 과잉률 (enantiomeric excess; "ee")의 표현으로 정의될 수 있고, 이는  $(2x-1) \times 100\%$  (여기서, x는 혼합물 중의 주된 에난티오머의 몰 분율 (예를 들어, 20 %의 ee는 에난티오머들의 60:40 비에 해당한다)로서 정의된다.

[0096]

바람직하게는 본 발명의 조성물은 보다 활성을 나타내는 이성질체의 에난티오머 과잉률이 적어도 50 %; 더욱 바람직하게는 에난티오머 과잉률이 적어도 75 %; 보다 더 바람직하게는 에난티오머 과잉률이 적어도 90 %; 가장 바람직하게는 에난티오머 과잉률이 적어도 94 %이다. 에난티오머적으로 순수한 보다 활성을 나타내는 이성질체의 실시 형태가 특히 주목된다.

[0097]

화학식 1의 화합물은 추가의 키랄 중심을 포함할 수 있다. 예를 들어, 치환기 및 다른 분자 성분, 예컨대  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^{7a}$ , G, J, Q 및  $X^1$  내지  $X^9$ 은 그것들 자체가 키랄 중심을 포함할 수 있다. 본 발명은 이러한 추가의 키랄 중심의 라세미 혼합물 및 풍부한 실질적으로 순수한 입체 형태를 포함한다.

[0098]

본 발명의 화합물은 화학식 1의 아마이드 결합 (예를 들어, C(W)-N)에 대한 제한된 회전으로 인해, 하나 이상의 형태 이성질체로서 존재할 수 있다. 본 발명은 형태 이성질체의 혼합물을 포함한다. 또한, 본 발명은 다른 형태 이성질체에 비해 하나의 입체 이성질체가 풍부한 화합물을 포함한다.

[0099]

증거 1, 2, 3, 4 및 5에 나타난 불포화 환 및 환계의 일부는 나타난 것과는 상이한 환 구성원 사이의 단일 및 이중 결합의 배열을 가질 수 있다. 특정한 환 원자 배열에 대한 이러한 상이한 결합 배열은 상이한 토토머에 해당한다. 이러한 불포화 환 및 환계에 관해서는, 도시된 특정한 토토머는 나타내어진 환 원자 배열에 가능한 모든 토토머를 나타내는 것으로 고려된다. 증거에 나타난 환 및 환계를 포함하는 특정 화합물을 열거하는 표는 증거에 나타난 토토머와는 상이한 토토머를 포함할 수 있다.

[0100]

본 발명의 화합물은 N-옥사이드 유도체를 포함한다. 당업자는 질소가 산화물로의 산화를 위해 이용가능한 고립 전자쌍을 필요로 하므로, 모든 질소 함유 복소환이 N-옥사이드를 형성할 수 있는 것은 아님을 인지할 것이며; 당업자는 N-옥사이드를 형성할 수 있는 그러한 질소 함유 복소환을 인식할 것이다. 또한, 당업자라면 삼차 아민이 N-옥사이드를 형성할 수 있음을 인식할 것이다. 복소환 및 삼차 아민의 N-옥사이드의 제조에 관한 합성 방법은 피옥시산, 예컨대 피아세트산 및 m-클로로퍼벤조산 (MCPBA), 과산화수소, 알킬 하이드로퍼옥사이드, 예컨대 tert-부틸 하이드로퍼옥사이드, 과불산나트륨, 및 다이옥시산, 예컨대 다이메틸다

이옥시란을 사용한 복소환 및 삼차 아민의 산화를 비롯하여, 당업자에게 공지되어 있다. 이러한 N-옥사이드의 제조 방법은 문헌에 광범위하게 설명 및 검토되었으며; 예를 들어, 문헌 [T. L. Gilchrist in Comprehensive Organic Synthesis, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press]; 문헌 [M. Tisler and B. Stanovnik in Comprehensive Heterocyclic Chemistry, vol. 3, pp 18-20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press]; 문헌 [M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 43, pp 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press]; 문헌 [M. Tisler and B. Stanovnik in Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press]; 및 문헌 [G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press]을 참조한다.

[0101] 본 발명의 화학식 1의 화합물은 농업용으로 적합한 염의 형태일 수 있다. 당업자라면, 당해 환경에서 그리고 생리학적 조건 하에서 화학적 화합물의 염은 그의 대응하는 비염 형태 (nonsalt form)와 평형 상태에 있기 때문에, 염은 비염 형태의 생물학적 유용성을 공유한다는 것을 인식한다. 따라서, 다양한 화학식 1의 화합물의 염은 균류 식물 병원체에 의한 식물병의 방제에 유용하다 (즉, 농업용으로 적합함). 화학식 1의 화합물의 염은 무기 또는 유기 산, 예를 들어 브롬화수소산, 염산, 질산, 인산, 황산, 아세트산, 부티르산, 푸마르산, 락트산, 말레산, 말론산, 옥살산, 프로피온산, 살리실산, 타르타르산, 4-톨루엔설폰산 또는 발레르산과의 산 부가염을 포함한다. 화학식 1의 화합물이 산 부분, 예컨대 카르복실산 또는 페놀을 함유하는 경우에는, 염은 또한 유기 또는 무기 염기, 예컨대 피리딘, 트라이에틸아민 또는 암모니아와 함께 형성된 염, 또는 나트륨, 칼륨, 리튬, 칼슘, 마그네슘 또는 바륨의 아미드, 수소화물, 수산화물 또는 탄산염을 포함한다.

[0102] 화학식 1 및 1A로부터 선택된 화합물 (기하 이성질체 및 입체 이성질체 포함), 이들의 N-옥사이드, 및 이들의 염은 전형적으로 2개 이상의 형태로 존재하므로, 화학식 1 또는 1A는 화학식 1 또는 1A가 나타내는 화합물의 모든 결정질 형태 및 비결정질 형태를 포함한다. 비결정질 형태는 왁스 및 겜과 같은 고체인 실시 형태뿐만 아니라, 용액 및 용융물과 같은 액체인 실시 형태도 포함한다. 결정질 형태는 기본적으로 단결정 타입을 나타내는 실시 형태 및 다형체 (즉, 상이한 결정질 타입)의 혼합물을 나타내는 실시 형태를 포함한다. 용어 "다형체"는 상이한 결정질 형태 - 이들 형태는 결정 격자 내에 분자의 상이한 배열 및/또는 배좌를 가짐 - 로 결정화될 수 있는 화학적 화합물의 특정 결정질 형태를 말한다. 다형체는 동일한 화학 조성을 가질 수 있지만, 이는 또한 격자 내에서 약하게 또는 강하게 결합될 수 있는 공결정화된 (co-crystallized) 물 또는 기타 분자의 존재 또는 부재로 인하여 조성이 다를 수 있다. 다형체는 결정의 형상, 밀도, 경도, 색상, 화학적 안정성, 용점, 흡습성, 현탁성, 용해 속도 및 생물학적 이용성과 같은 화학적, 물리적 및 생물학적 특성이 상이할 수 있다. 당업자는 화학식 1 또는 1A로 나타내는 화합물의 다형체가 다른 다형체 또는 화학식 1 또는 화학식 1A로 나타내는 동일한 화합물의 다형체의 혼합물에 비해, 유익한 효과 (예를 들어, 유용한 제형의 제조에 대한 적합성, 생물학적 성능 개선)를 나타낼 수 있음을 인지할 것이다. 화학식 1 또는 1A로 나타내는 화합물의 특정 다형체의 제조 및 분리는 예를 들어, 선택된 용매 및 온도를 이용한 결정화를 비롯하여, 당업자에게 공지된 방법에 의해 달성될 수 있다.

[0103] 발명의 요약에 기재된 본 발명의 실시 형태는 하기에 기재된 것을 포함한다. 하기 실시 형태에서, 화학식 1 및 1A는 이들의 N-옥사이드 및 이들의 염을 포함하며, "화학식 1의 화합물" 또는 "화학식 1A의 화합물"에 대한 언급은 실시 형태에서 추가로 정의되지 않는 한, 발명의 요약에 규정된 치환기의 정의를 포함한다.

[0104] 본 발명의 실시 형태는 하기를 포함한다:

[0105] 실시 형태 1. A가  $\text{CHR}^{15}$ 인 화학식 1의 화합물.

[0106] 실시 형태 1a.  $\text{R}^{15}$ 이 H, 할로젠, 시아노, 하이드록시,  $-\text{CHO}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알킬 또는  $\text{C}_2\text{-C}_5$  알콕시카르보닐인 화학식 1 또는 실시 형태 1의 화합물.

[0107] 실시 형태 1b.  $\text{R}^{15}$ 이 H, 시아노, 하이드록시, 메틸 또는 메톡시카르보닐인 실시 형태 1a의 화합물. 실시 형태 1c.  $\text{R}^{15}$ 이 H인 실시 형태 1b의 화합물.

[0108] 실시 형태 2. A가  $\text{NR}^{16}$ 인 화학식 1의 화합물.

[0109] 실시 형태 2a.  $\text{R}^{16}$ 이 H,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알킬,  $\text{C}_2\text{-C}_4$  알킬카르보닐,  $\text{C}_2\text{-C}_4$  할로알킬카르보닐 또는  $\text{C}_2\text{-C}_4$  알

콕시카르보닐인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 2 중 어느 하나의 화합물.

[0110] 실시 형태 2b.  $R^{16}$ 이 H, 메틸, 메틸카르보닐 또는 메톡시카르보닐인 실시 형태 2a의 화합물.

[0111] 실시 형태 2c.  $R^{16}$ 이 H인 실시 형태 2b의 화합물.

[0112] 실시 형태 3. W가 O인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 2c 중 어느 하나의 화합물.

[0113] 실시 형태 4. W가 S인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 2c 중 어느 하나의 화합물.

[0114] 실시 형태 5. 각  $R^2$ 가 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알케닐,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로젠, 시아노 또는 하이드록시이거나;

[0115] 2개의  $R^2$ 가 함께  $C_1-C_3$  알킬렌 또는  $C_2-C_3$  알케닐렌으로서 취해 가교 이환계를 형성하거나;

[0116] 이중 결합으로 결합된 인접한 환 탄소 원자에 부착되는 2개의  $R^2$ 가 함께,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $C_1-C_4$  할로알콕시, 할로젠, 하이드록시, 아미노, 시아노 및 니트로 중에서 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는  $-CH=CH-CH=CH-$ 로서 취해지는 화학식 1의 화합물.

[0117] 실시 형태 5a. 각  $R^2$ 가 독립적으로  $C_1-C_2$  알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬,  $C_1-C_2$  알콕시, 할로젠, 시아노 또는 하이드록시인 실시 형태 5의 화합물.

[0118] 실시 형태 5b.  $R^2$ 가 독립적으로 메틸, 메톡시, 시아노 또는 하이드록시인 실시 형태 5a의 화합물.

[0119] 실시 형태 5c. 각  $R^2$ 가 메틸인 실시 형태 5b의 화합물.

[0120] 실시 형태 6. n이 0 또는 1인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 5c 중 어느 하나의 화합물.

[0121] 실시 형태 7. n이 0인 실시 형태 6의 화합물.

[0122] 실시 형태 7a. n이 1인 실시 형태 6의 화합물.

[0123] 실시 형태 8. X가  $X^1$ ,  $X^2$  또는  $X^3$ 인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 7a 중 어느 하나의 화합물.

[0124] 실시 형태 9. X가  $X^1$  또는  $X^2$ 인 실시 형태 8의 화합물.

[0125] 실시 형태 10. X가  $X^1$ 인 실시 형태 9의 화합물.

[0126] 실시 형태 11. X를 포함하는 환이 포화되는 (즉, 단일 결합 만을 포함함) 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 10 중 어느 하나의 화합물.

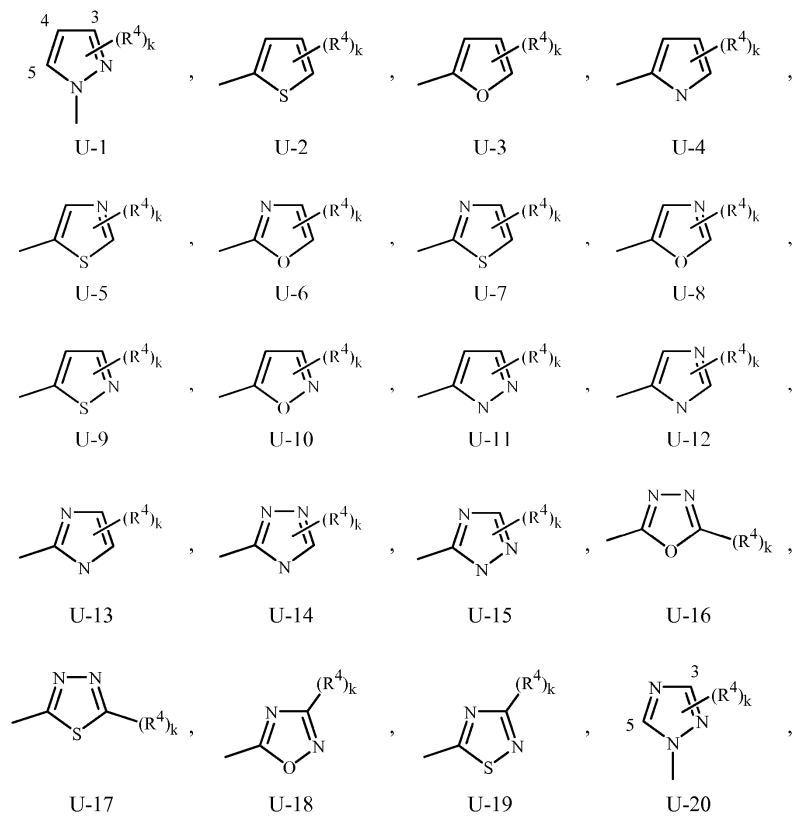
[0127] 실시 형태 12.  $R^1$ 이  $R^1$ 이 융합 환계를 형성하도록 함께 연결되지 않는 치환기로 임의로 치환되는 페닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 11 중 어느 하나의 화합물.

[0128] 실시 형태 12a.  $R^1$ 이 탄소 환 구성원 상에서  $R^{4a}$ , 질소 환 구성원 상에서  $R^{4b}$  중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환된 페닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환이고;

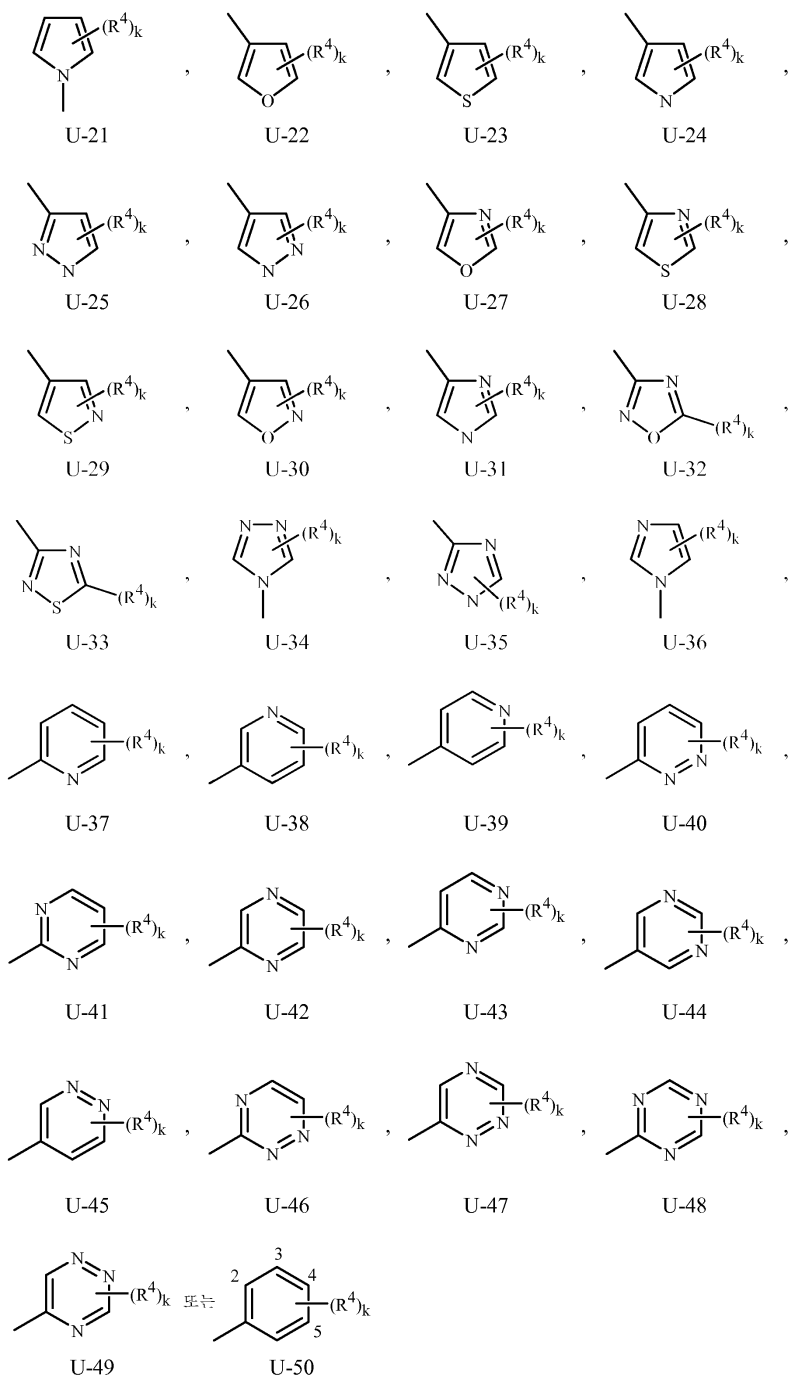
[0129] 각  $R^{4a}$ 가 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_2-C_6$  알케닐,  $C_2-C_6$  알키닐,  $C_3-C_6$  사이클로알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알킬알킬,  $C_4-C_{10}$  알킬사이클로알킬,  $C_5-C_{10}$  알킬사이클로알킬알킬,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_2-C_6$  할로알케닐,  $C_2-C_6$  할로알키닐,  $C_3-C_6$  할로사이클로알킬, 할로젠, 하이드록시, 아미노, 시아노, 니트로,  $C_1-C_4$  알콕시,  $C_1-C_4$  할로알콕시,  $C_1-C_4$  알킬티오,  $C_1-C_4$  알킬설퍼닐,  $C_1-C_4$  알킬설폰닐,  $C_1-C_4$  할로알킬티오,  $C_1-C_4$  할로알킬설퍼닐,  $C_1-C_4$  할로알킬설폰닐,  $C_1-C_4$  알킬아미노,  $C_2-C_8$  다이알킬아미노,  $C_3-C_6$  사이클로알킬아미노,  $C_2-C_4$  알콕시알킬,  $C_1-C_4$  하이드록시알킬,  $C_2-C_4$  알킬카르보닐,  $C_2-C_6$  알콕시카르보닐,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐옥시,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐티오,  $C_2-C_6$  알킬아미노카르보닐,  $C_3-C_8$  다이알킬아미노카르보닐 또는  $C_3-C_6$  트라이알킬실릴이며;

- [0130] 각  $R^{4b}$ 가 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_3-C_6$  알케닐,  $C_3-C_6$  알키닐,  $C_3-C_6$  사이클로알킬,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_3-C_6$  할로알케닐,  $C_3-C_6$  할로알키닐,  $C_3-C_6$  할로사이클로알킬 또는  $C_2-C_4$  알콕시알킬인 실시 형태 12의 화합물.
- [0131] 실시 형태 12b.  $R^1$ 이 탄소 환 구성원 상에서  $R^{4a}$  중에서, 질소 환 구성원 상에서  $R^{4b}$  중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 2개의 치환기로 임의로 치환된 페닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환인 실시 형태 12a의 화합물.
- [0132] 실시 형태 13. 각  $R^{4a}$ 가 독립적으로  $C_1-C_3$  알킬,  $C_2-C_3$  알케닐,  $C_2-C_3$  알키닐, 사이클로프로필,  $C_1-C_3$  할로알킬,  $C_2-C_3$  할로알케닐,  $C_2-C_3$  할로알키닐, 할로사이클로프로필, 할로젠, 시아노, 니트로,  $C_1-C_2$  알콕시,  $C_1-C_2$  할로알콕시,  $C_1-C_2$  알킬티오,  $C_1-C_2$  할로알킬티오,  $C_2-C_3$  알콕시알킬,  $C_2-C_3$  알킬카르보닐,  $C_2-C_3$  알콕시카르보닐,  $C_2-C_3$  알킬아미노카르보닐 또는  $C_3-C_4$  다이알킬아미노카르보닐인 실시 형태 12a 내지 12b 중 어느 하나의 화합물.
- [0133] 실시 형태 14. 각  $R^{4a}$ 가 독립적으로  $C_1-C_3$  알킬,  $C_2-C_3$  알케닐,  $C_2-C_3$  알키닐, 사이클로프로필,  $C_1-C_3$  할로알킬,  $C_2-C_3$  할로알케닐,  $C_2-C_3$  할로알키닐, 할로사이클로프로필, 할로젠, 시아노, 니트로,  $C_1-C_2$  알콕시 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 실시 형태 13의 화합물.
- [0134] 실시 형태 15. 각  $R^{4a}$ 가 독립적으로 할로젠,  $C_1-C_3$  알킬,  $C_1-C_3$  할로알킬,  $C_1-C_2$  알콕시 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 실시 형태 14의 화합물.
- [0135] 실시 형태 15a. 각  $R^{4a}$ 가 독립적으로  $C_1-C_2$  알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬, 할로젠,  $C_1-C_2$  알콕시 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 실시 형태 15의 화합물.
- [0136] 실시 형태 16. 각  $R^{4a}$ 가 독립적으로 할로젠,  $C_1-C_2$  알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬 또는  $C_1-C_2$  알콕시인 실시 형태 15a의 화합물.
- [0137] 실시 형태 17. 각  $R^{4a}$ 가 독립적으로  $C_1-C_2$  알킬, 트라이플루오로메틸, Cl, Br, I 또는 메톡시인 실시 형태 16의 화합물.
- [0138] 실시 형태 18. 각  $R^{4a}$ 가 독립적으로  $C_1-C_2$  알킬, 트라이플루오로메틸, Cl 또는 Br인 실시 형태 17의 화합물.
- [0139] 실시 형태 19. 각  $R^{4b}$ 가 독립적으로  $C_1-C_3$  알킬,  $C_3$  알케닐 (예를 들어, 알틸),  $C_3$  알키닐 (예를 들어, 프로파길), 사이클로프로필,  $C_1-C_3$  할로알킬,  $C_3$  할로알케닐,  $C_3$  할로알키닐, 할로사이클로프로필 또는  $C_2-C_3$  알콕시알킬인 실시 형태 12a 내지 18 중 어느 하나의 화합물.
- [0140] 실시 형태 20. 각  $R^{4b}$ 가 독립적으로  $C_1-C_3$  알킬,  $C_3$  알케닐,  $C_3$  알키닐, 사이클로프로필,  $C_1-C_3$  할로알킬,  $C_3$  할로알케닐 또는 할로사이클로프로필인 실시 형태 19의 화합물.
- [0141] 실시 형태 21. 각  $R^{4b}$ 가 독립적으로  $C_1-C_2$  알킬 또는  $C_1-C_2$  할로알킬인 실시 형태 20의 화합물.
- [0142] 실시 형태 22. 각  $R^{4b}$ 가 독립적으로  $C_1-C_2$  알킬 또는 트라이플루오로메틸인 실시 형태 21의 화합물.
- [0143] 실시 형태 23. 각  $R^{4b}$ 가 독립적으로  $C_1-C_2$  알킬인 실시 형태 22의 화합물.
- [0144] 실시 형태 24.  $R^1$ 이 증거 1에 나타난 U-1 내지 U-50 중 하나인 실시 형태 12a 내지 23 중 어느 하나의 화합물:

[0145] 증거 1



[0146]



[0147]

[0148] (여기서,  $R^4$ 가 탄소 환 구성원에 결합되면, 상기  $R^4$ 는  $R^{4a}$  중에서 선택되고,  $R^4$ 가 질소 환 구성원에 결합되면 (예를 들어, U-4, U-11 내지 U-15, U-24 내지 U-26, U-31 또는 U-35), 상기  $R^4$ 는  $R^{4b}$  중에서 선택되며;

[0149]  $k$ 는 0, 1 또는 2이다).

[0150] 실시 형태 24a.  $k$ 가 1 또는 2인 실시 형태 24의 화합물.

[0151] 실시 형태 25.  $k$ 가 1 또는 2이고, 적어도 하나의  $R^4$ 가 Cl인 실시 형태 24의 화합물.

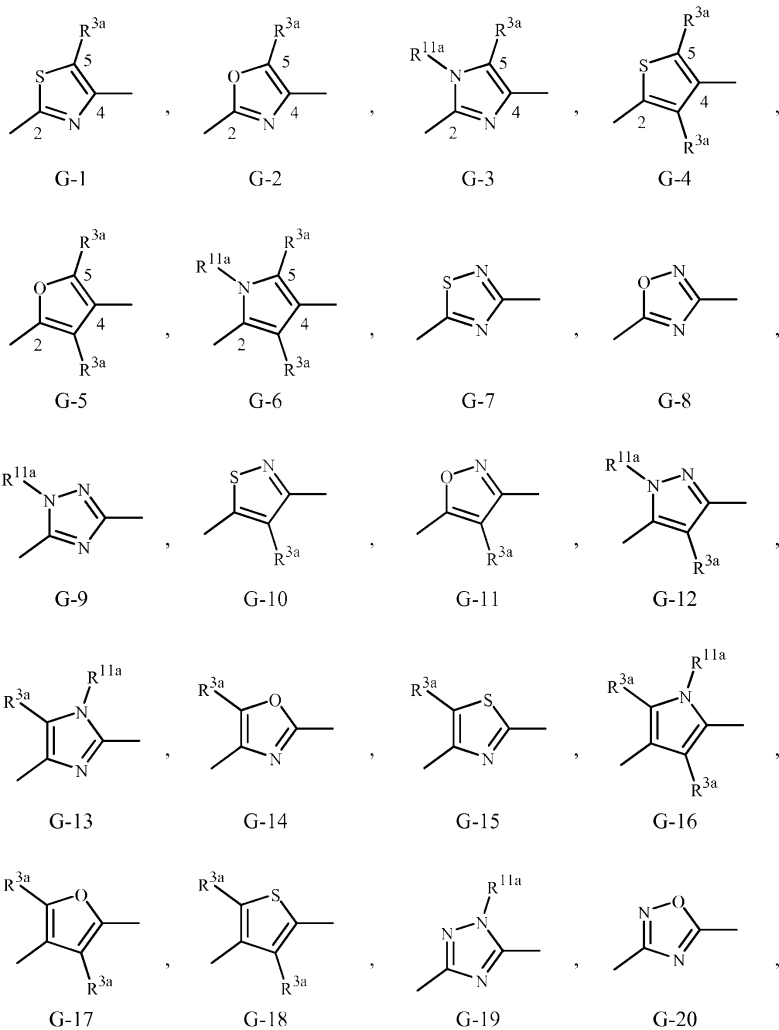
[0152] 실시 형태 26.  $k$ 가 1 또는 2이고, 적어도 하나의  $R^4$ 가 Br인 실시 형태 24의 화합물.

[0153] 실시 형태 27.  $k$ 가 1 또는 2이고, 적어도 하나의  $R^4$ 가 메틸인 실시 형태 24의 화합물.

- [0154] 실시 형태 28.  $k$ 가 1 또는 2이고, 적어도 하나의  $R^4$ 가 에틸인 실시 형태 24의 화합물.
- [0155] 실시 형태 29.  $k$ 가 1 또는 2이고, 적어도 하나의  $R^4$ 가 트라이플루오로메틸인 실시 형태 24의 화합물.
- [0156] 실시 형태 30.  $k$ 가 1 또는 2이고, 적어도 하나의  $R^4$ 가 메톡시인 실시 형태 24의 화합물.
- [0157] 실시 형태 31.  $R^1$ 이 U-1 내지 U-5, U-8, U-11, U-13, U-15, U-20 내지 U-28, U-31, U-36 내지 U-39 및 U-50 중에서 선택되는 실시 형태 24 내지 30 중 어느 하나의 화합물.
- [0158] 실시 형태 32.  $R^1$ 이 U-1 내지 U-3, U-5, U-8, U-11, U-13, U-20, U-22, U-23, U-25 내지 U-28, U-36 내지 U-39 및 U-50 중에서 선택되는 실시 형태 31의 화합물.
- [0159] 실시 형태 33.  $R^1$ 이 U-1 내지 U-3, U-11, U-13, U-20, U-22, U-23, U-36 내지 U-39 및 U-50 중에서 선택되는 실시 형태 32의 화합물.
- [0160] 실시 형태 34.  $R^1$ 이 U-1, U-20 또는 U-50인 실시 형태 33의 화합물.
- [0161] 실시 형태 35.  $R^1$ 이 U-1인 실시 형태 34의 화합물.
- [0162] 실시 형태 35a.  $R^1$ 이 U-20인 실시 형태 34의 화합물.
- [0163] 실시 형태 36.  $R^1$ 이 U-50인 실시 형태 34의 화합물.
- [0164] 실시 형태 37.  $k$ 가 1이고,  $R^4$ 가 U-1의 3 위치 또는 5 위치에 연결되는 실시 형태 35의 화합물.
- [0165] 실시 형태 37a.  $k$ 가 2이고, 하나의  $R^4$ 가 U-1의 3 위치에 연결되고, 다른  $R^4$ 가 5 위치에 연결되는 실시 형태 35의 화합물.
- [0166] 실시 형태 38.  $k$ 가 1이고,  $R^4$ 가 U-20의 3 위치 또는 5 위치에 연결되는 실시 형태 35a의 화합물.
- [0167] 실시 형태 38a.  $k$ 가 2이고, 하나의  $R^4$ 가 U-20의 3 위치에 연결되며, 다른  $R^4$ 가 5 위치에 연결되는 실시 형태 35a의 화합물.
- [0168] 실시 형태 39.  $k$ 가 1이고,  $R^4$ 가 U-50의 2 위치 또는 5 위치에 연결되는 실시 형태 36의 화합물.
- [0169] 실시 형태 40.  $k$ 가 2이고, 하나의  $R^4$ 가 U-50의 2 위치에 연결되며, 다른  $R^4$ 가 5 위치에 연결되는 실시 형태 36의 화합물.
- [0170] 실시 형태 41.  $G$ 가 탄소 환 구성원 상에서  $R^3$ , 질소 환 구성원 상에서  $R^{11}$  중에서 선택되는 2개 이하의 치환기로 임의로 치환된 5원 복소환이고;
- [0171] 각  $R^3$ 가 독립적으로  $C_1-C_3$  알킬,  $C_1-C_3$  할로알킬 또는 할로젠이며;
- [0172] 각  $R^{11}$ 이 독립적으로  $C_1-C_3$  알킬인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 40 중 어느 하나의 화합물.
- [0173] 실시 형태 41a. 각  $R^3$ 가 독립적으로  $C_1-C_3$  알킬 또는 할로젠인 실시 형태 41의 화합물.
- [0174] 실시 형태 41b. 각  $R^3$ 가 독립적으로 메틸 또는 할로젠인 실시 형태 41a의 화합물.
- [0175] 실시 형태 41c. 각  $R^3$ 가 메틸인 실시 형태 41b의 화합물.
- [0176] 실시 형태 42.  $G$ 가 증거 2에 나타낸 G-1 내지 G-59 중 하나인 실시 형태 41 내지 41c 중 어느 하나의 화합물:

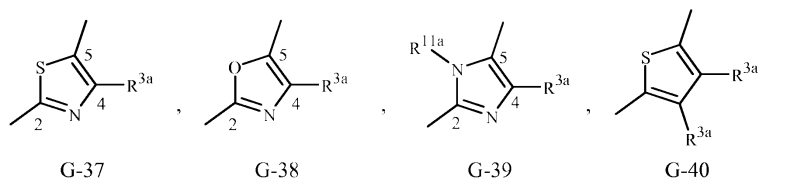
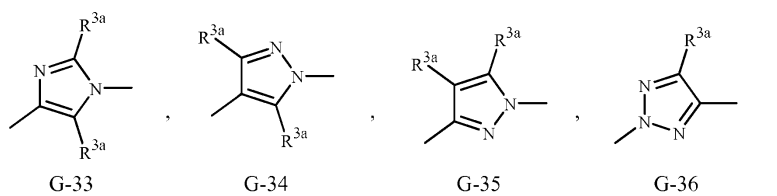
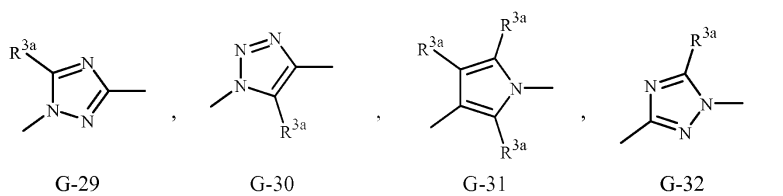
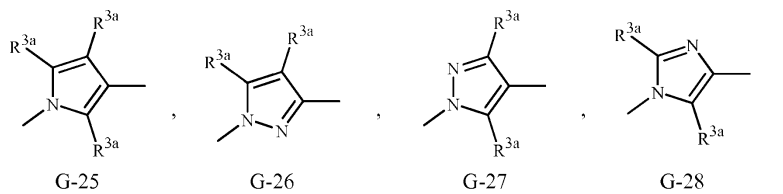
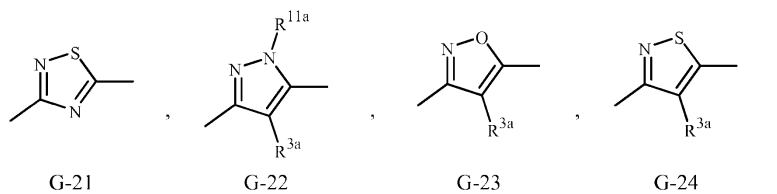
[0177]

증거 2

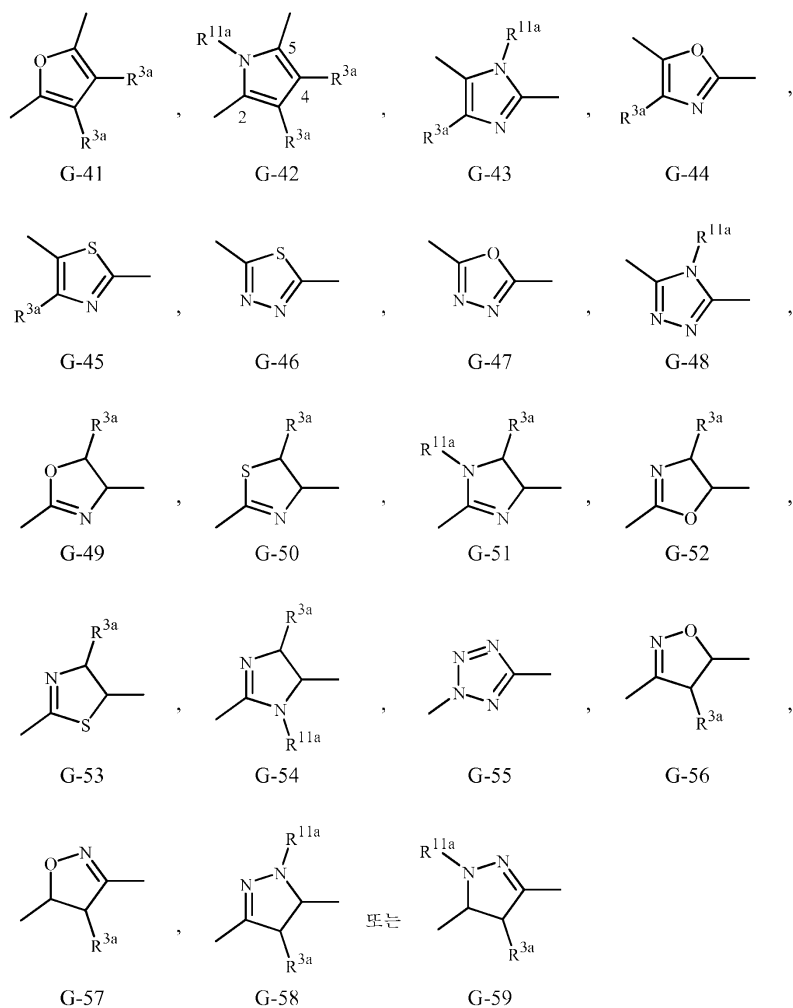


[0178]





[0179]



[0180]

[0181] (여기서, 좌측으로 돌출하는 결합은 X에 결합되고, 우측으로 돌출하는 결합은 Z<sup>1</sup>에 결합되며; 각 R<sup>3a</sup>는 독립적으로 H 또는 R<sup>3</sup> 중에서 선택되고; R<sup>11a</sup>는 H 및 R<sup>11</sup> 중에서 선택된다).

[0182] 실시 형태 43. G가 G-1 내지 G-3, G-7, G-8, G-10, G-11, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26 내지 G-28, G-30, G-36 내지 G-38 및 G-49 내지 G-55 중에서 선택되는 실시 형태 42의 화합물.

[0183] 실시 형태 44. G가 G-1, G-2, G-7, G-8, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26, G-27, G-36, G-37, G-38, G-49, G-50 및 G-55 중에서 선택되는 실시 형태 43의 화합물.

[0184] 실시 형태 45. G가 G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 및 G-38 중에서 선택되는 실시 형태 44의 화합물.

[0185] 실시 형태 46. G가 G-1, G-2, G-15, G-26 및 G-36 중에서 선택되는 실시 형태 45의 화합물.

[0186] 실시 형태 47. G가 G-1인 실시 형태 46의 화합물. 실시 형태 1 내지 40, 실시 형태 52 내지 83, 및 실시 형태 A1 내지 A5 내의 이들 화합물의 실시 형태에 주목된다.

[0187] 실시 형태 48. G가 G-2인 실시 형태 46의 화합물. 실시 형태 1 내지 40, 실시 형태 52 내지 83, 및 실시 형태 A1 내지 A5 내의 이들 화합물의 실시 형태에 주목된다.

[0188] 실시 형태 49. G가 G-15인 실시 형태 46의 화합물. 실시 형태 1 내지 40, 실시 형태 52 내지 83, 및 실시 형태 A1 내지 A5 내의 이들 화합물의 실시 형태에 주목된다.

[0189] 실시 형태 50. G가 G-26인 실시 형태 46의 화합물. 실시 형태 1 내지 40, 실시 형태 52 내지 83, 및 실시 형태 A1 내지 A5 내의 이들 화합물의 실시 형태에 주목된다.

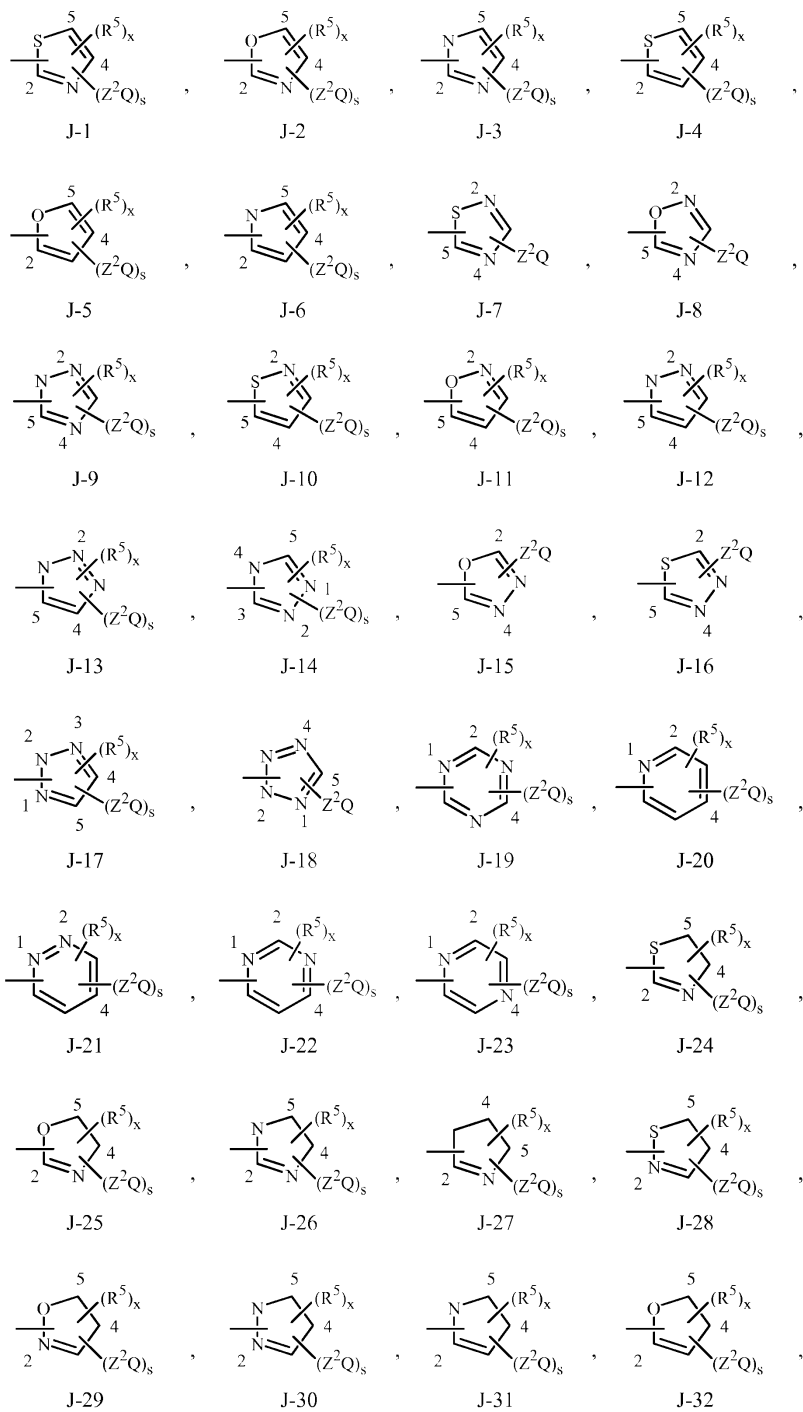
[0190] 실시 형태 51. G가 G-36인 실시 형태 46의 화합물. 실시 형태 1 내지 40, 실시 형태 52 내지 83, 및 실시 형태

A1 내지 A5 내의 이들 화합물의 실시 형태에 주목된다.

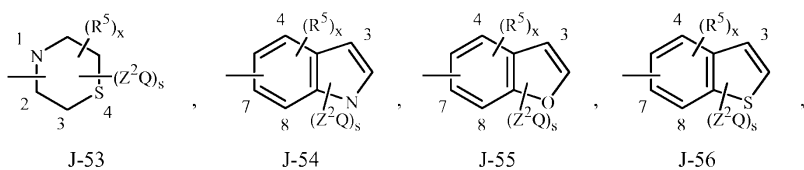
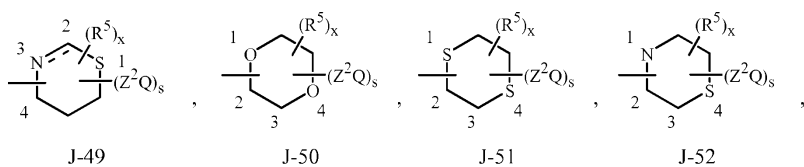
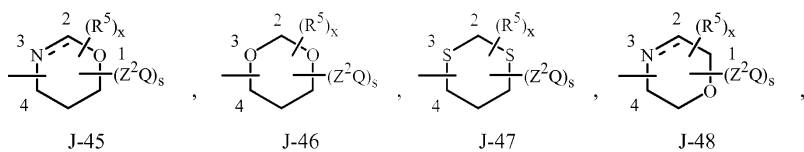
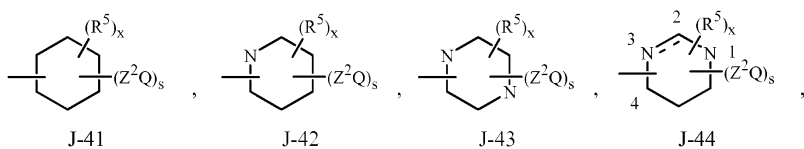
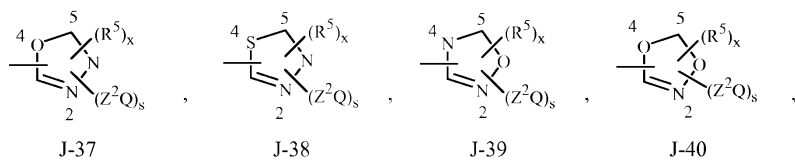
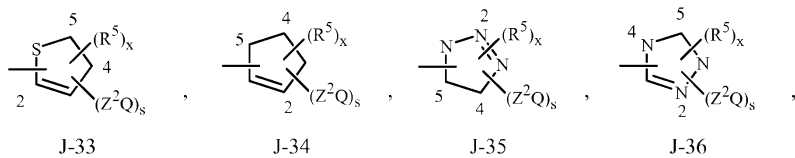
- [0191] 실시 형태 52. 각  $R^{3a}$ 가 독립적으로 H,  $C_1-C_3$  알킬 또는 할로젠인 실시 형태 42 내지 51 중 어느 하나의 화합물.
- [0192] 실시 형태 53. 각  $R^{3a}$ 가 독립적으로 H 또는 메틸인 실시 형태 52의 화합물.
- [0193] 실시 형태 54. 각  $R$ 가 H이고, 각  $R^{11a}$ 가 독립적으로 H 또는 메틸인 실시 형태 42 내지 51 중 어느 하나의 화합물.
- [0194] 실시 형태 55. G가 비치환된 화학식 1 또는 실시 형태 41 내지 51 중 어느 하나의 화합물.
- [0195] 실시 형태 56. 각  $R^5$ 가 독립적으로 H, 시아노,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_3-C_8$  사이클로알킬,  $C_3-C_8$  할로사이클로알킬,  $C_2-C_6$  알콕시알킬,  $C_1-C_6$  알콕시,  $C_1-C_6$  할로알콕시,  $C_3-C_8$  사이클로알콕시,  $C_2-C_6$  알케닐옥시,  $C_2-C_6$  할로알케닐옥시,  $C_2-C_6$  알키닐옥시,  $C_2-C_6$  알콕시알콕시,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐옥시,  $C_2-C_6$  할로알킬카르보닐옥시,  $C_1-C_6$  알킬티오,  $C_1-C_6$  할로알킬티오,  $C_3-C_{10}$  트라이알킬실릴,  $-NR^{25}R^{26}$  또는 할로젠인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 55 중 어느 하나의 화합물.
- [0196] 실시 형태 57. 각  $R^5$ 가 독립적으로 H, 시아노,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_1-C_6$  알콕시,  $C_1-C_6$  할로알콕시,  $-NR^{25}R^{26}$  또는 할로젠인 실시 형태 56의 화합물.
- [0197] 실시 형태 57a.  $R^5$ 가 할로젠 이외의 것인 실시 형태 56 또는 57의 화합물.
- [0198] 실시 형태 58. 각  $R^5$ 가 독립적으로 H, 시아노,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  알킬카르보닐 또는 할로젠인 실시 형태 57의 화합물.
- [0199] 실시 형태 59. 각  $R^5$ 가 독립적으로 H 및  $C_1-C_3$  알킬인 실시 형태 58의 화합물.
- [0200] 실시 형태 60. J가 증거 3에 나타난 J-1 내지 J-82 중 하나인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 59 중 어느 하나의 화합물:

[0201]

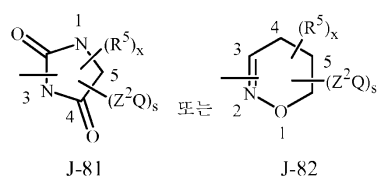
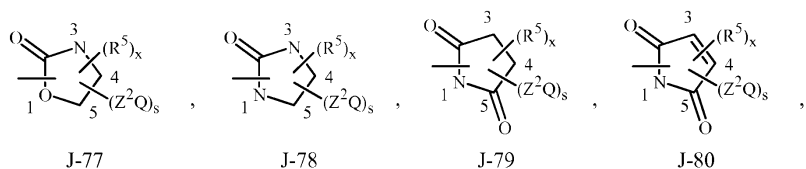
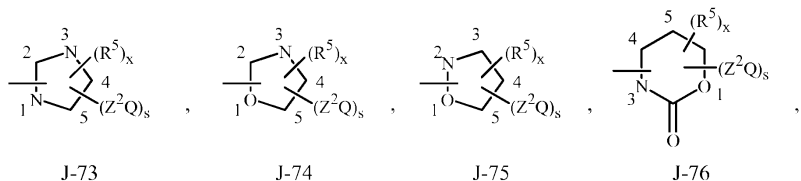
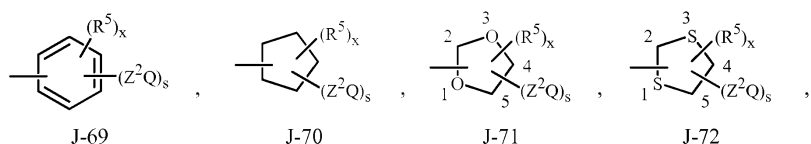
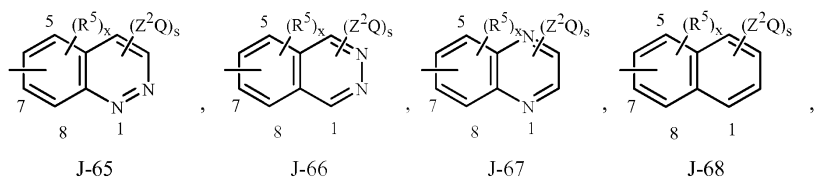
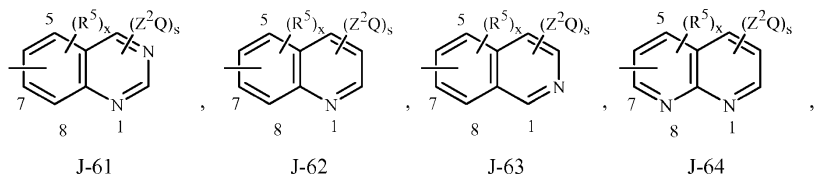
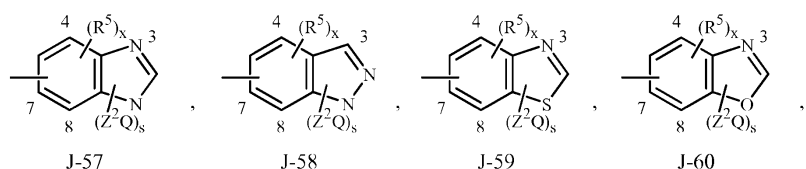
증거 3



[0202]



[0203]



[0204]

[0205] (여기서, 좌측으로 돌출되게 나타낸 결합은  $Z^1$ 에 결합되고;  $x$ 는 0 내지 5의 정수이며;  $s$ 는 1 내지 2의 정수이다).

[0206] 실시 형태 61.  $x$ 가 0 또는 1인 실시 형태 60의 화합물.

[0207] 실시 형태 61a.  $x$ 가 0인 실시 형태 61의 화합물.

[0208] 실시 형태 62.  $s$ 가 1 또는 2인 실시 형태 61a의 화합물.

[0209] 실시 형태 63.  $s$ 가 1인 실시 형태 62의 화합물.

[0210] 실시 형태 64.  $J$ 가 J-1, J-2, J-3, J-4, J-5, J-7, J-8, J-9, J-10, J-11, J-12, J-14, J-15, J-16, J-20, J-24, J-25, J-26, J-29, J-30, J-37, J-38, J-45 및 J-69 중에서 선택되는 실시 형태 60 내지 63 중 어느 하나의 화합물.

[0211] 실시 형태 65.  $J$ 가 J-4, J-5, J-8, J-11, J-15, J-16, J-20, J-29, J-30, J-37, J-38, 및 J-69 중에서 선택되

는 실시 형태 64의 화합물.

[0212] 실시 형태 66. J가 J-4, J-5, J-11, J-20, J-29, J-37, J-38, 및 J-69 중에서 선택되는 실시 형태 65의 화합물.

[0213] 실시 형태 67. J가 J-11인 실시 형태 66의 화합물.

[0214] 실시 형태 68. J가 J-29인 실시 형태 66의 화합물.

[0215] 실시 형태 69. J가 J-69인 실시 형태 59의 화합물.

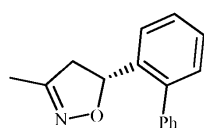
[0216] 실시 형태 70. J-11의 3 위치가  $Z^1$ 에 연결되고, J-11의 5 위치가  $Z^2Q$ 에 연결되는 실시 형태 67의 화합물.

[0217] 실시 형태 71. J-29의 3 위치가  $Z^1$ 에 연결되고, J-29의 5 위치가  $Z^2Q$ 에 연결되는 실시 형태 68의 화합물.

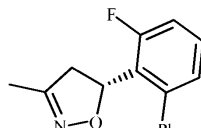
[0218] 실시 형태 72.  $Z^1$ 에 직접 연결되는 J의 환 또는 환계가 하나의  $-Z^2Q$ 로 치환되는 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 71 중 어느 하나의 화합물.

[0219] 실시 형태 72a. J가 증거 A에 나타낸 J-29-1 내지 J-29-60 중 하나인 실시 형태 68의 화합물:

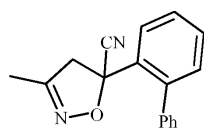
[0220] 증거 A



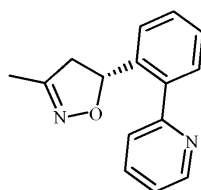
J-29-1



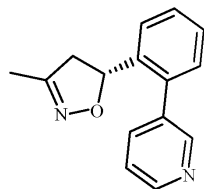
J-29-2



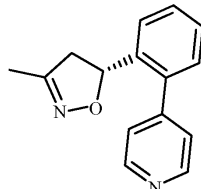
J-29-3



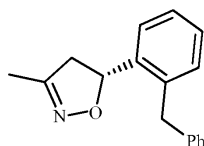
J-29-4



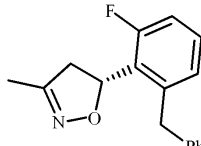
J-29-5



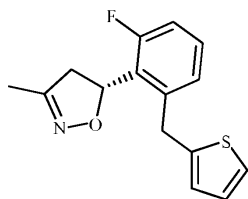
J-29-6



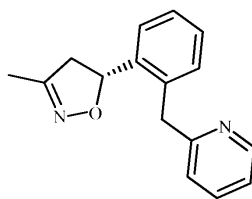
J-29-7



J-29-8

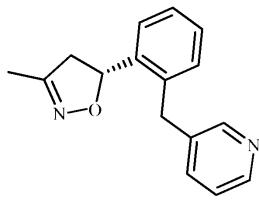


J-29-9

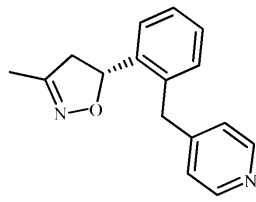


J-29-10

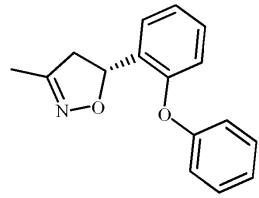
[0221]



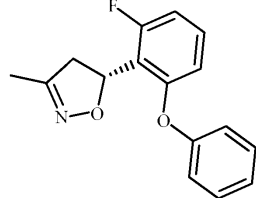
J-29-11



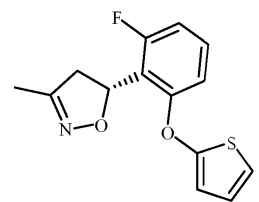
J-29-12



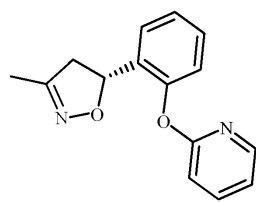
J-29-13



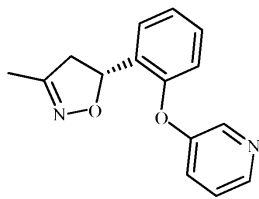
J-29-14



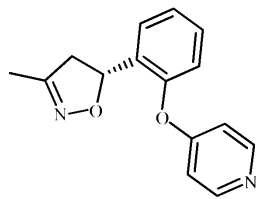
J-29-15



J-29-16



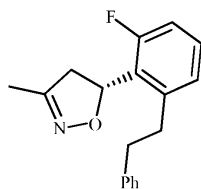
J-29-17



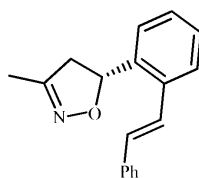
J-29-18

[0222]

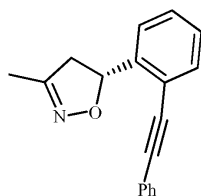




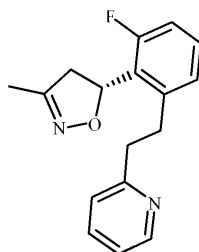
J-29-19



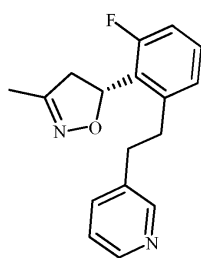
J-29-20



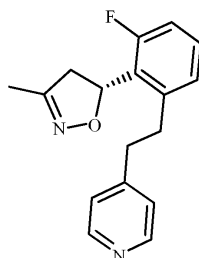
J-29-21



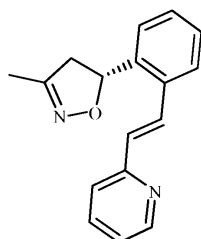
J-29-22



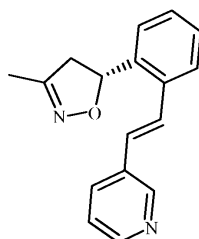
J-29-23



J-29-24

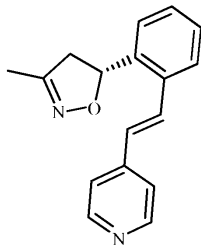


J-29-25

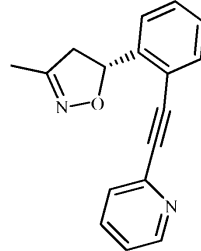


J-29-26

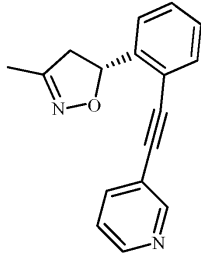
[0223]



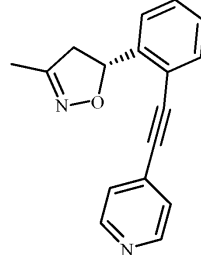
J-29-27



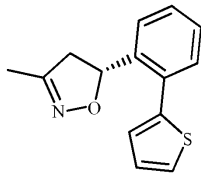
J-29-28



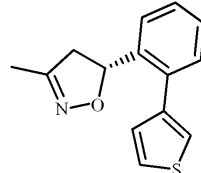
J-29-29



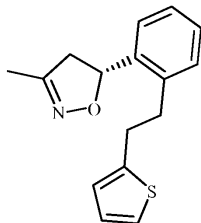
J-29-30



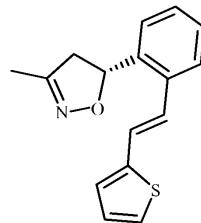
J-29-31



J-29-32

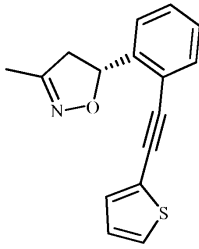


J-29-33

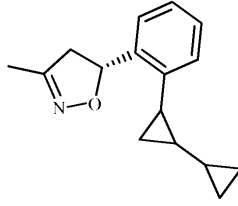


J-29-34

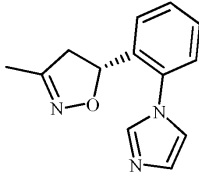
[0224]



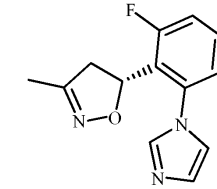
J-29-35



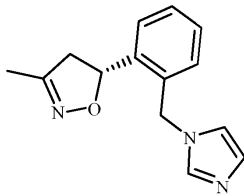
J-29-36



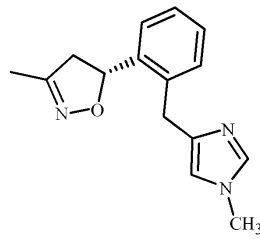
J-29-37



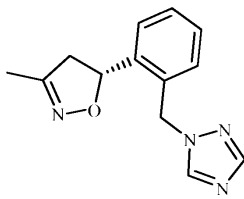
J-29-38



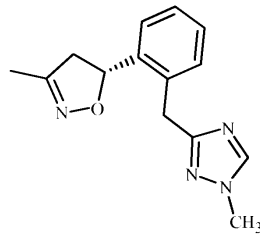
J-29-39



J-29-40

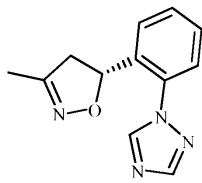


J-29-41

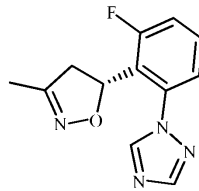


J-29-42

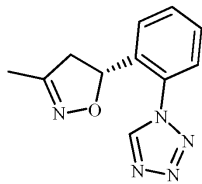
[0225]



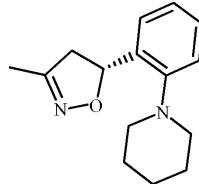
J-29-43



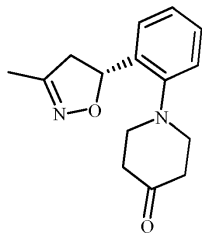
J-29-44



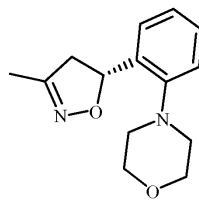
J-29-45



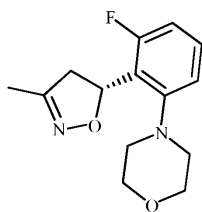
J-29-46



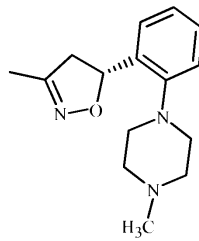
J-29-47



J-29-48

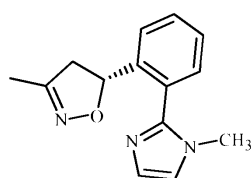


J-29-49

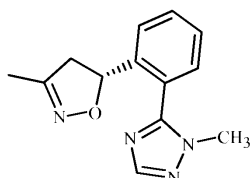


J-29-50

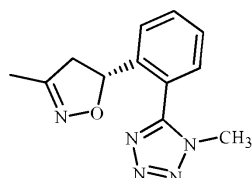
[0226]



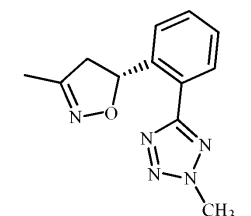
J-29-51



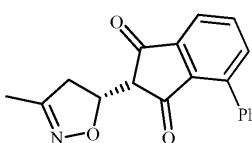
J-29-52



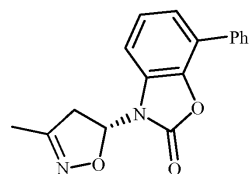
J-29-53



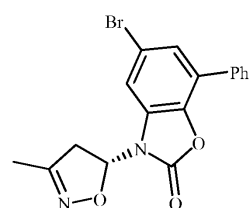
J-29-54



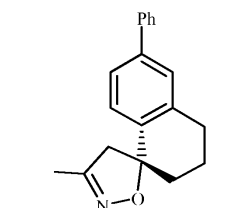
J-29-55



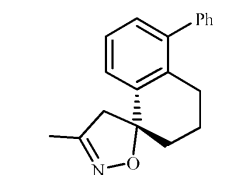
J-29-56



J-29-57

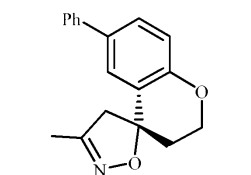


J-29-58



J-29-59

또는



J-29-60

[0227]

[0228] (여기서, Ph는 페닐이고, 좌측으로 돌출되게 나타낸 결합은 화학식 1의  $Z^1$ 에 결합된다).

[0229] 실시 형태 72b. J가 J-29-1 내지 J-29-57 중 하나인 실시 형태 72a의 화합물.

[0230] 실시 형태 73.  $Z^1$ 이 직접 결합, O, C(=O), S(O)<sub>m</sub>, CHR<sup>20</sup> 또는 NR<sup>21</sup>인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 72b 중 어느 하나의 의 화합물.

[0231] 실시 형태 73a.  $Z^1$ 이 직접 결합인 실시 형태 73의 화합물.

[0232] 실시 형태 74.  $Z^2$ 가 직접 결합, O, C(=O), S(O)<sub>m</sub>, CHR<sup>20</sup> 또는 NR<sup>21</sup>인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 73a 중 어느 하나의 화합물.

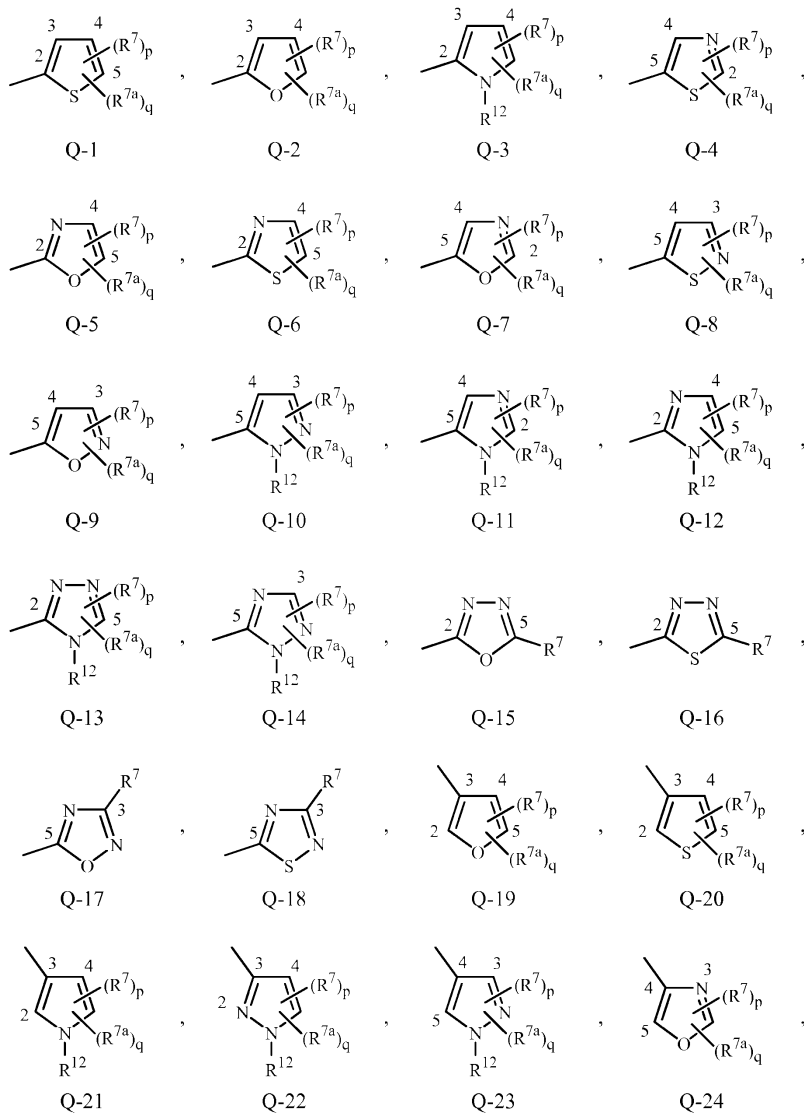
[0233] 실시 형태 74a.  $Z^2$ 가 직접 결합 또는 NR<sup>21</sup>인 실시 형태 74의 화합물.

[0234] 실시 형태 74b.  $Z^2$ 가 직접 결합인 실시 형태 74a의 화합물.

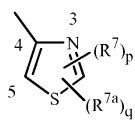
[0235] 실시 형태 75. Q가 증거 4에 나타낸 Q-1 내지 Q-106 중 하나인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 74b 중 어느 하나의 화합물:

[0236]

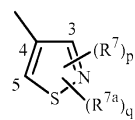
증거 4



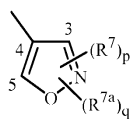
[0237]



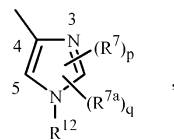
Q-25



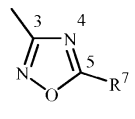
Q-26



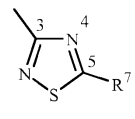
Q-27



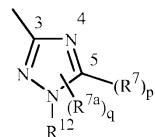
Q-28



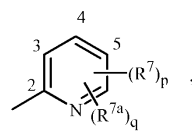
Q-29



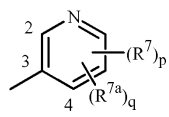
Q-30



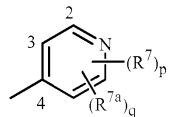
Q-31



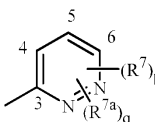
Q-32



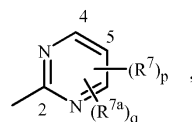
Q-33



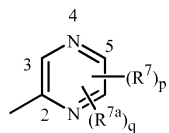
Q-34



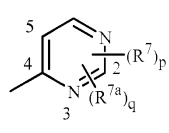
Q-35



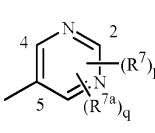
Q-36



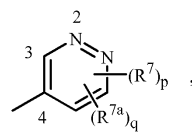
Q-37



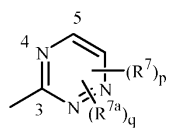
Q-38



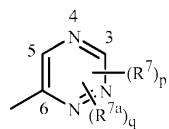
Q-39



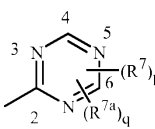
Q-40



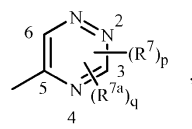
Q-41



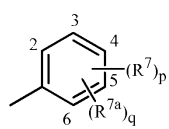
Q-42



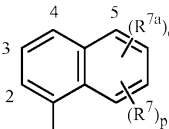
Q-43



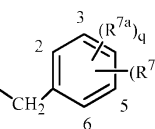
Q-44



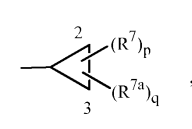
Q-45



Q-46

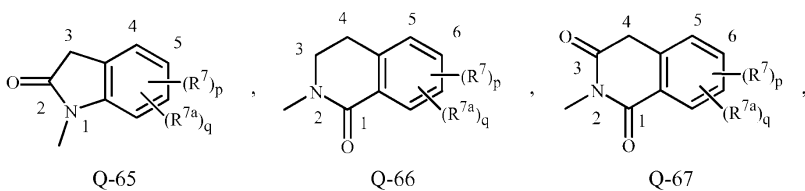
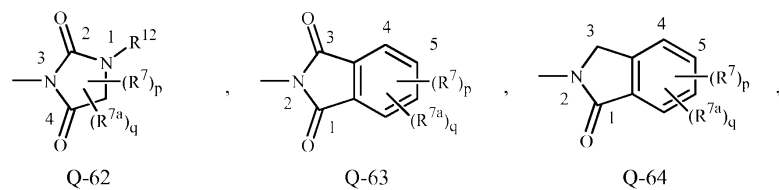
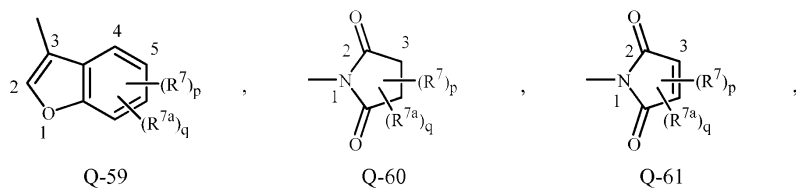
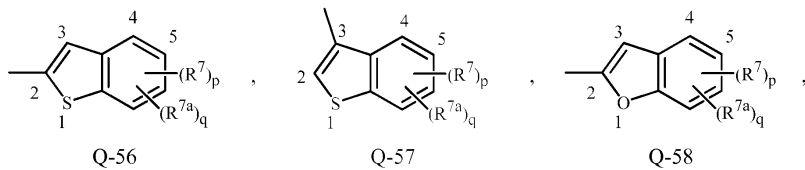
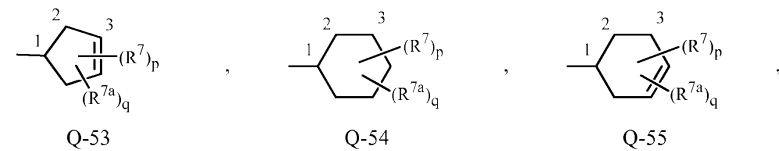
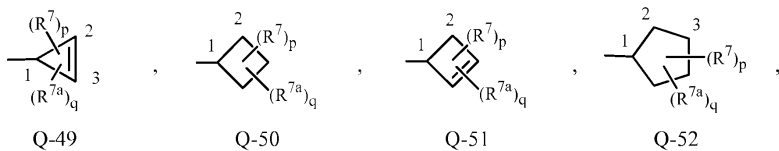


Q-47



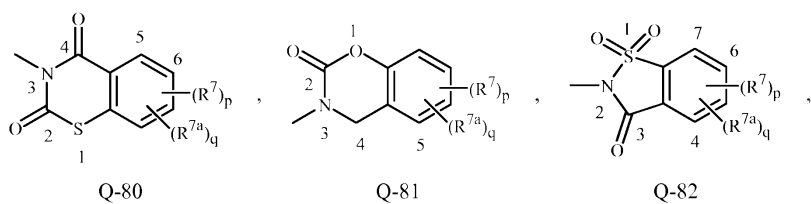
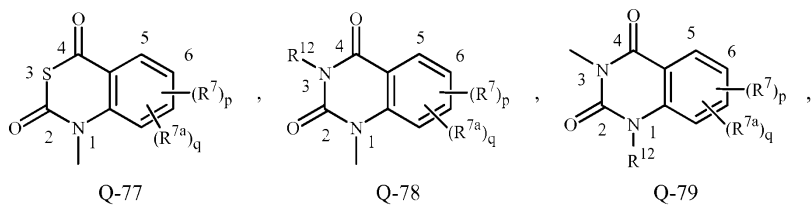
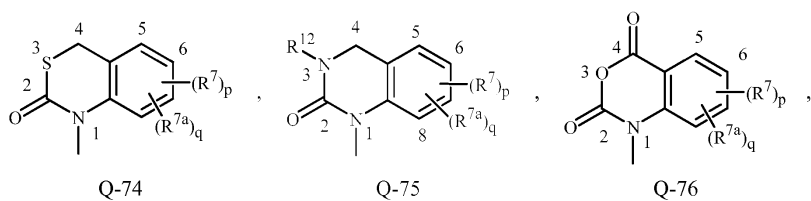
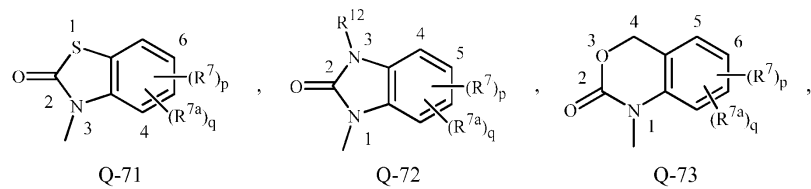
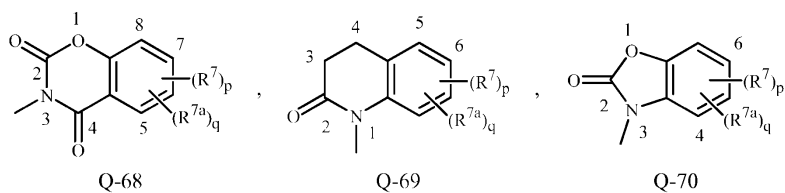
Q-48

[0238]

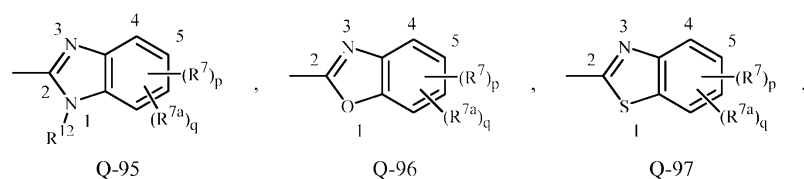
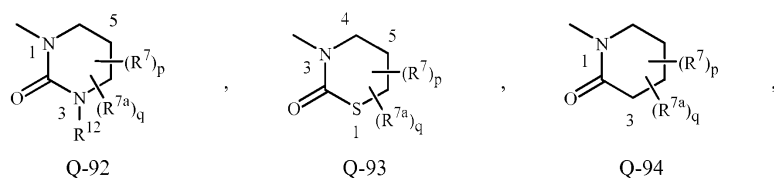
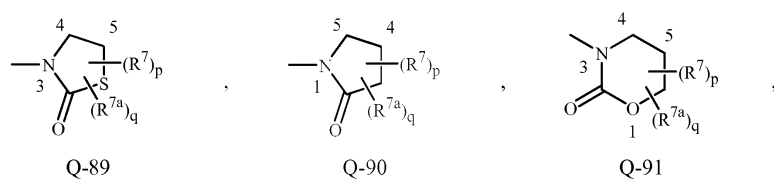
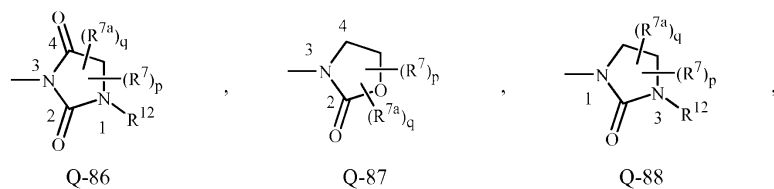
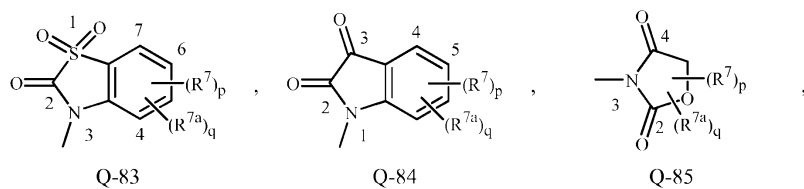


[0239]

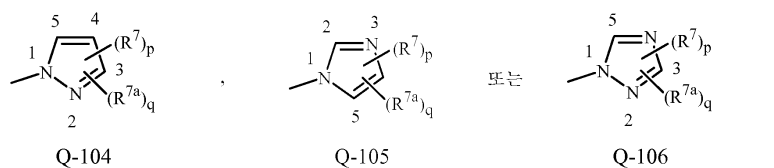
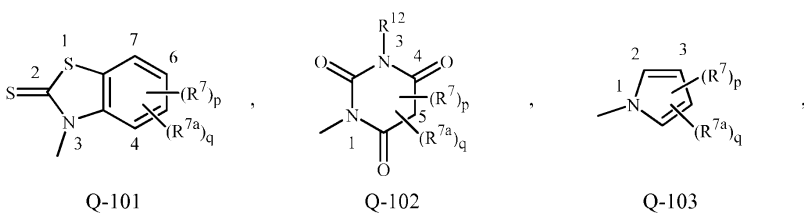
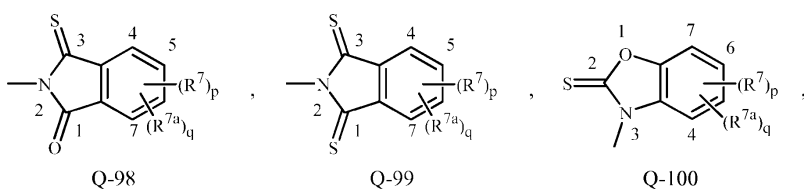




[0240]



[0241]



[0242]

[0243]

(여기서, 좌측으로 돌출되게 나타난 결합은 Z<sup>2</sup>에 결합되고; 질소 환 구성원에 결합된 R<sup>12</sup>는 R<sup>7</sup>으로 임의로 치환되며 (예를 들어, Q-3, Q-10 내지 Q-14, Q-21 내지 Q-23, Q-28, Q-31, Q-62, Q-75, Q-78, Q-79, Q-86, Q-88, Q-

92 또는 Q-95); p는 1 또는 2이고; q는 0, 1, 2, 3, 4 또는 5이다).

- [0244] 실시 형태 76. Q가 Q-1, Q-20, Q-32 내지 Q-34, Q-45 내지 Q-47, Q-60 내지 Q-73, Q-76 내지 Q-79, Q-84 내지 Q-94 및 Q-98 내지 Q-106 중에서 선택되는 실시 형태 75의 화합물.
- [0245] 실시 형태 77. Q가 Q-1, Q-45, Q-62, Q-63, Q-64, Q-65, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72, Q-73, Q-76, Q-78, Q-79, Q-84, Q-85, Q-98, Q-99, Q-100, Q-101 내지 Q-106인 실시 형태 76의 화합물.
- [0246] 실시 형태 78. Q가 Q-45, Q-62, Q-63, Q-64, Q-65, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72, Q-85 또는 Q-104인 실시 형태 77의 화합물.
- [0247] 실시 형태 79. Q가 Q-45, Q-62, Q-63, Q-65, Q-70, Q-71, Q-72, Q-85 또는 Q-104인 실시 형태 78의 화합물.
- [0248] 실시 형태 80. Q가 Q-45, Q-62, Q-63, Q-65, Q-70 또는 Q-104인 실시 형태 79의 화합물.
- [0249] 실시 형태 80a. Q가 Q-62 또는 Q-104 이외의 것인 실시 형태 77 내지 80 중 어느 하나의 화합물.
- [0250] 실시 형태 80b. Q가 Q-45인 실시 형태 80의 화합물.
- [0251] 실시 형태 80c. Q가 Q-62인 실시 형태 80의 화합물.
- [0252] 실시 형태 80d. Q가 Q-104인 실시 형태 80의 화합물.
- [0253] 실시 형태 81. 각 Q가 독립적으로, 탄소 또는 질소 원자 환 구성원 상에서  $R^7$  중에서 선택되는 1개의 치환기로 치환된 페닐, 벤질, 나프탈레닐, 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환 또는 8원 내지 11원 헤테로 방향족 이환계인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 74b 중 어느 하나의 화합물.
- [0254] 실시 형태 82. Q가 하나의  $R^7$ 으로 치환된 페닐인 실시 형태 81의 화합물.
- [0255] 실시 형태 83. Q가 하나의  $R^7$ 으로 치환된 벤질인 실시 형태 81의 화합물.
- [0256] 실시 형태 84. Q가 하나의  $R^7$ 으로 치환된 8원 내지 11원 헤테로 방향족 이환계인 실시 형태 81의 화합물.
- [0257] 실시 형태 85. 각  $Z^3$ 가 독립적으로 직접 결합, O,  $NR^{22}$ , C(=O), C(=S), S(O)<sub>m</sub>,  $CHR^{20}$ ,  $CHR^{20}-CHR^{20}$ ,  $CR^{24}=CR^{27}$ , C≡C 또는  $OCHR^{20}$ 인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 84 중 어느 하나의 화합물.
- [0258] 실시 형태 85a. 각  $Z^3$ 가 C(=O)인 실시 형태 85의 화합물.
- [0259] 실시 형태 86. 각  $Z^3$ 가 독립적으로 직접 결합, O,  $NR^{22}$ , S(O)<sub>m</sub>,  $CHR^{20}$ ,  $CHR^{20}-CHR^{20}$ ,  $CR^{24}=CR^{27}$ , C≡C 또는  $OCHR^{20}$ 인 실시 형태 85의 화합물.
- [0260] 실시 형태 87. 각  $Z^3$ 가 독립적으로 직접 결합, O,  $NR^{22}$ , S(O)<sub>m</sub>,  $CHR^{20}$ ,  $CHR^{20}-CHR^{20}$ ,  $CR^{24}=CR^{27}$  또는 C≡C인 실시 형태 86의 화합물.
- [0261] 실시 형태 88. 각  $Z^3$ 가 독립적으로 직접 결합, O,  $NR^{22}$ ,  $CHR^{20}$  또는  $CHR^{20}-CHR^{20}$ 인 실시 형태 87의 화합물.
- [0262] 실시 형태 88a. 각  $Z^3$ 가 CH<sub>2</sub>인 실시 형태 88의 화합물.
- [0263] 실시 형태 89. 각  $Z^3$ 가 독립적으로 직접 결합, O 또는  $NR^{22}$ 인 실시 형태 88의 화합물.
- [0264] 실시 형태 90. 각  $Z^3$ 가 직접 결합인 실시 형태 89의 화합물.
- [0265] 실시 형태 91. 각  $Z^3$ 가 O인 실시 형태 89의 화합물.
- [0266] 실시 형태 92.  $R^7$ 이  $-Z^3G^A$ 인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 91 중 어느 하나의 화합물.
- [0267] 실시 형태 93.  $G^A$ 가 페닐인 실시 형태 92의 화합물.

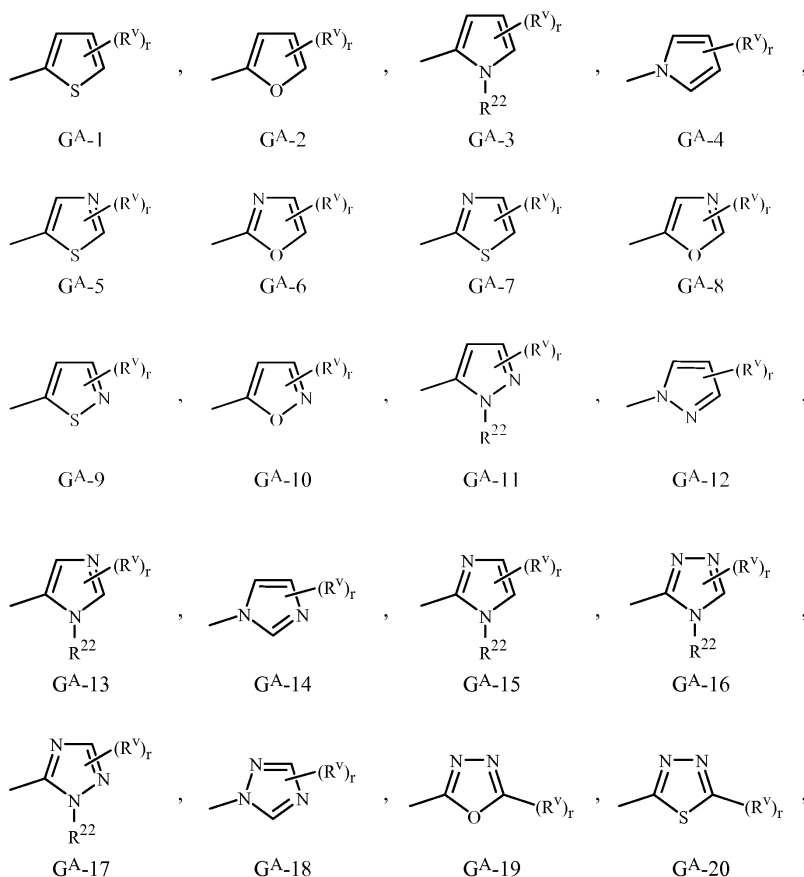
[0268] 실시 형태 94.  $G^A$ 가 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환인 실시 형태 92의 화합물.

[0269] 실시 형태 95.  $R^7$ 이  $-Z^3G^N$ 인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 91 중 어느 하나의 화합물.

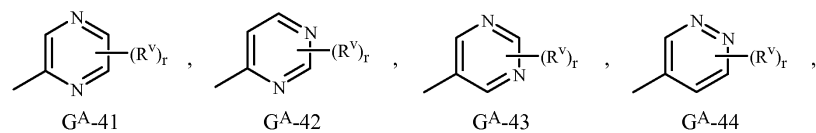
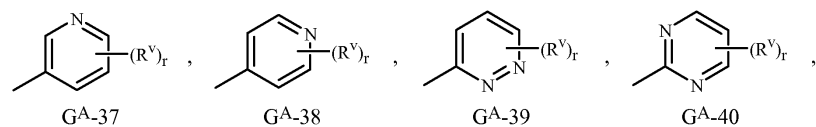
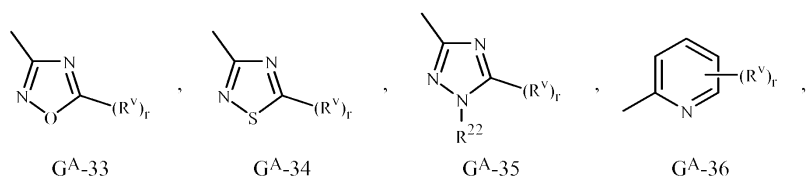
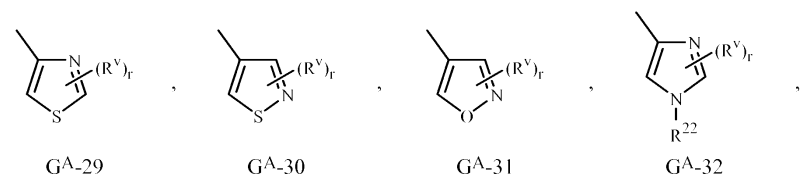
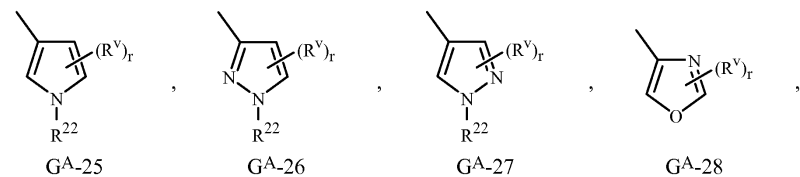
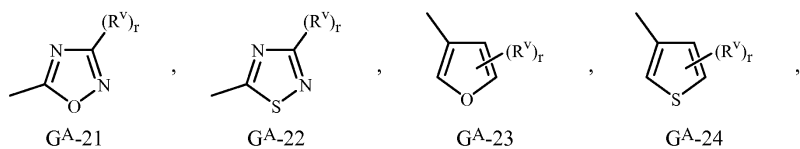
[0270] 실시 형태 96.  $R^7$ 이  $-Z^3G^P$ 인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 91 중 어느 하나의 화합물.

[0271] 실시 형태 97. 증거 5에 나타난 바와 같이, 각각, 각  $G^A$ 가 독립적으로  $G^A-1$  내지  $G^A-49$  중 하나이고, 각  $G^N$ 이 독립적으로  $G^N-1$  내지  $G^N-32$  중 하나이며, 각  $G^P$ 가 독립적으로  $G^P-1$  내지  $G^P-35$  중 하나인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 96 중 어느 하나의 화합물.

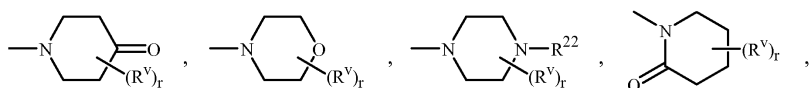
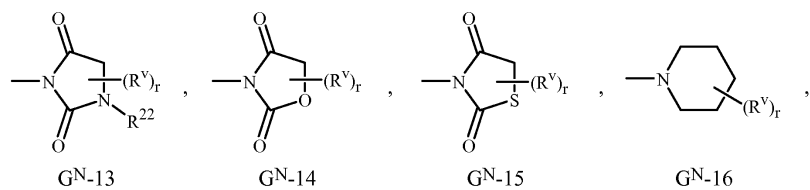
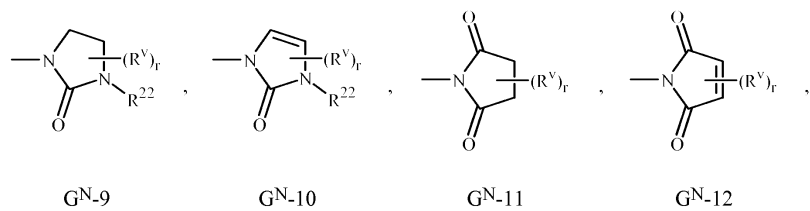
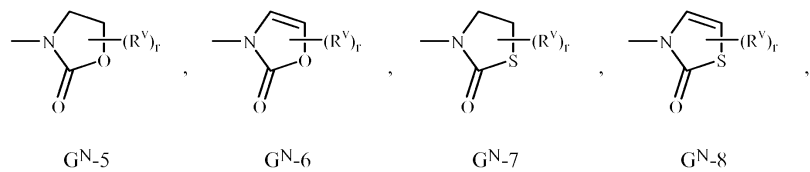
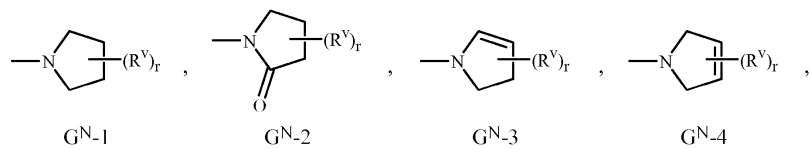
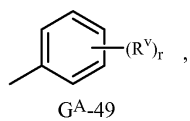
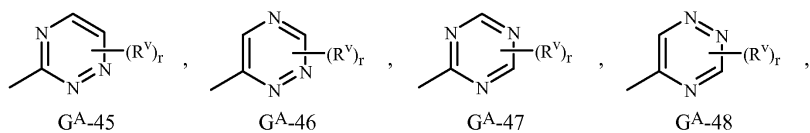
[0272] 증거 5



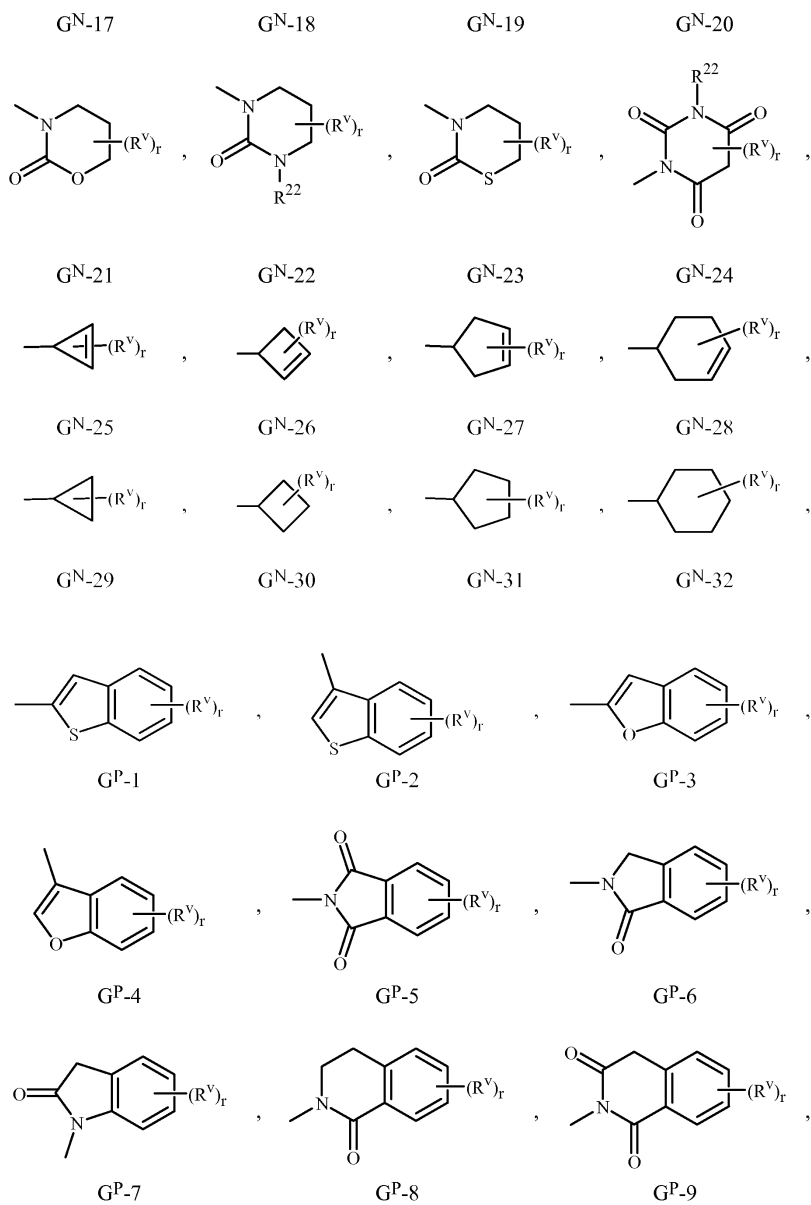
[0273]



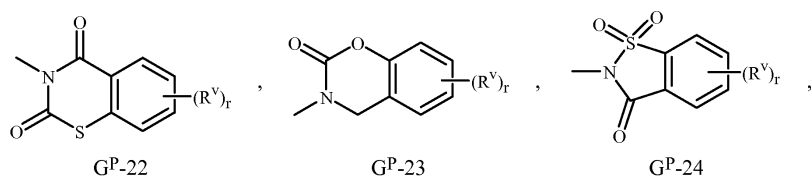
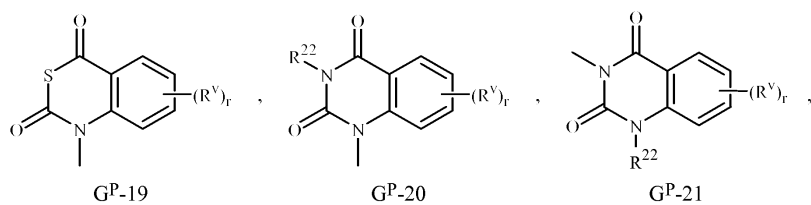
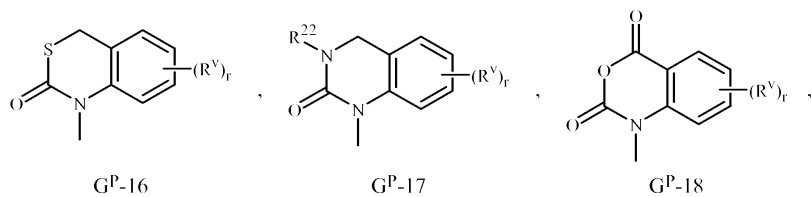
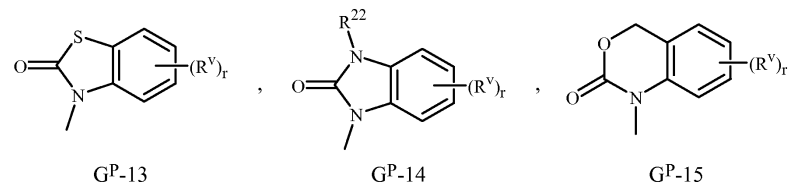
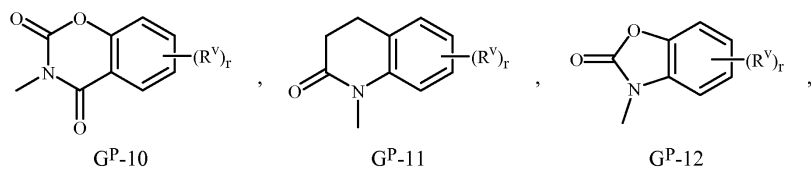
[0274]



[0275]

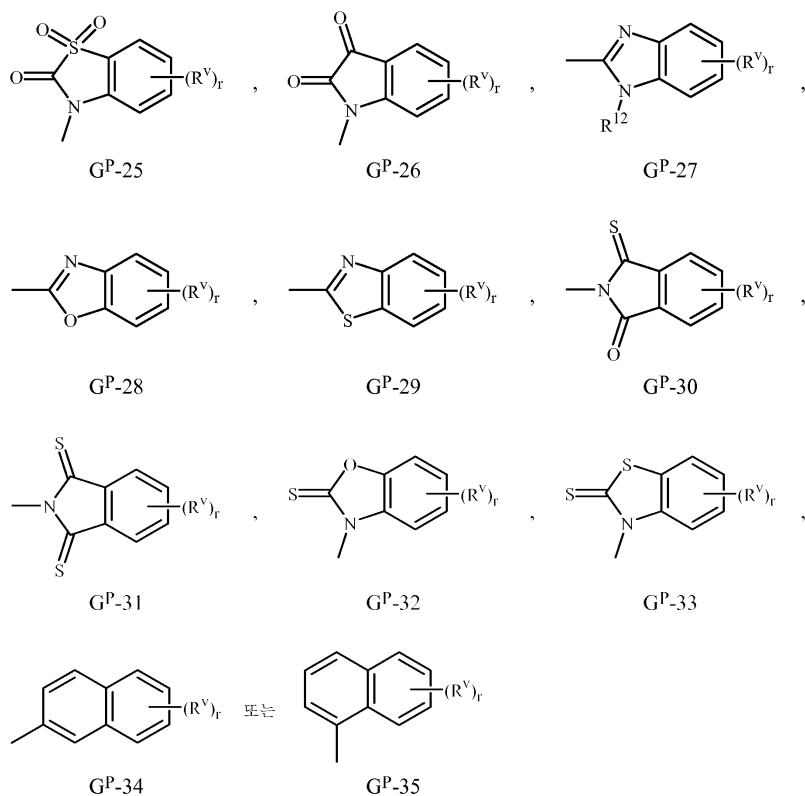


[0276]



[0277]





[0278]

[0279] (여기서, 좌측으로 돌출되게 나타낸 결합은  $Z^3$ 에 결합되고; r은 0, 1, 2, 3, 4 또는 5이다).

[0280] 실시 형태 97a. r이 0, 1, 2 또는 3인 실시 형태 97의 화합물.

[0281] 실시 형태 97b.  $G^A$ 가  $G^A-1$  내지  $G^A-18$ ,  $G^A-23$  내지  $G^A-38$  및  $G^A-49$  중에서 선택되고,  $G^N$ 이  $G^N-1$ ,  $G^N-2$ ,  $G^N-5$ ,  $G^N-6$ ,  $G^N-9$  내지  $G^N-16$  및  $G^N-29$  중에서 선택되며,  $G^P$ 가  $G^P-1$  내지  $G^P-6$ ,  $G^P-34$  및  $G^P-38$  중에서 선택되는 실시 형태 97 또는 97a의 화합물.

[0282] 실시 형태 98.  $G^A$ 가  $G^A-1$  내지  $G^A-18$ ,  $G^A-23$  내지  $G^A-38$  및  $G^A-49$  중에서 선택되고,  $G^N$ 이  $G^N-1$ ,  $G^N-2$ ,  $G^N-5$ ,  $G^N-6$ ,  $G^N-9$  내지  $G^N-16$  및  $G^N-29$  중에서 선택되는 실시 형태 97b의 화합물.

[0283] 실시 형태 99.  $G^A$ 가  $G^A-18$  및  $G^A-49$  중에서 선택되는 실시 형태 98의 화합물.

[0284] 실시 형태 100.  $G^A$ 가  $G^A-18$ 인 실시 형태 99의 화합물.

[0285] 실시 형태 101.  $G^A$ 가  $G^A-49$ 인 실시 형태 99의 화합물.

[0286] 실시 형태 102. 각  $R^V$ 가 독립적으로 H, 할로젠, 시아노, 하이드록시,  $-C(=O)OH$ ,  $-C(=O)NH_2$ ,  $-SO_2NH_2$ ,  $-SH$ ,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_2-C_6$  알케닐,  $C_2-C_6$  알키닐,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_2-C_8$  알킬카르보닐,  $C_2-C_8$  알콕시카르보닐,  $C_4-C_{10}$  사이클로알콕시카르보닐,  $C_5-C_{12}$  사이클로알킬알콕시카르보닐,  $C_2-C_8$  알킬아미노카르보닐,  $C_3-C_{10}$  다이알킬아미노카르보닐,  $C_2-C_6$  할로알케닐,  $C_2-C_6$  할로알키닐,  $C_3-C_8$  사이클로알킬,  $C_3-C_8$  할로사이클로알킬,  $C_4-C_{10}$  알킬사이클로알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알킬알킬,  $C_6-C_{14}$  사이클로알킬사이클로알킬,  $C_4-C_{10}$  할로사이클로알킬알킬,  $C_5-C_{12}$  알킬사이클로알킬알킬,  $C_2-C_8$  알콕시알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알콕시알킬,  $C_3-C_{10}$  알콕시알콕시알킬,  $C_2-C_8$  알킬티오알킬,  $C_2-C_8$  알킬설퍼닐알킬,  $C_2-C_8$  알킬아미노알킬,  $C_3-C_{10}$  다이알킬아미노알킬,  $C_2-C_8$  할로알킬아미노알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알킬아미노알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알킬카르보닐,  $C_4-C_{10}$  사이클로알킬아미노카르보닐,  $C_2-C_7$  시아노알킬,  $C_1-C_6$  하이드록시알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알케닐알킬,  $C_2-C_8$  할로알콕시알킬,  $C_2-C_8$  알콕시할로알킬,  $C_3-C_{10}$  알

콕시알킬카르보닐,  $C_3-C_{10}$  알콕시카르보닐알킬,  $C_3-C_{10}$  알콕시(알킬)아미노카르보닐,  $C_2-C_8$  알킬아미디노,  $C_3-C_{10}$  다이알킬아미디노,  $C_1-C_6$  알콕시,  $C_1-C_6$  할로알콕시,  $C_2-C_8$  알킬카르보닐옥시,  $C_1-C_6$  알킬티오,  $C_1-C_6$  할로알킬티오,  $C_1-C_6$  알킬설퍼닐,  $C_1-C_6$  알킬설퍼닐,  $C_1-C_6$  알킬아미노설퍼닐,  $C_2-C_8$  다이알킬아미노설퍼닐,  $C_3-C_{10}$  트라이알킬설퍼닐,  $C_2-C_8$  알콕시알콕시,  $C_1-C_6$  알킬아미노,  $C_2-C_8$  다이알킬아미노,  $C_2-C_8$  알킬카르보닐아미노,  $C_1-C_6$  알킬설퍼닐아미노 또는  $C_1-C_6$  할로알킬아미노인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 101 중 어느 하나의 화합물.

[0287] 실시 형태 103. 각  $R^v$ 가 독립적으로 H, 할로젠, 시아노, 하이드록시,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_2-C_6$  알케닐,  $C_2-C_6$  알키닐,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_2-C_8$  알킬카르보닐,  $C_2-C_8$  알콕시카르보닐,  $C_3-C_8$  사이클로알킬,  $C_4-C_{10}$  알킬사이클로알킬,  $C_4-C_{10}$  사이클로알킬알킬,  $C_6-C_{14}$  사이클로알킬사이클로알킬,  $C_2-C_8$  알콕시알킬,  $C_3-C_{10}$  다이알킬아미노알킬,  $C_2-C_7$  시아노알킬,  $C_1-C_6$  하이드록시알킬,  $C_2-C_8$  할로알콕시알킬,  $C_3-C_{10}$  알콕시알킬카르보닐,  $C_3-C_{10}$  알콕시카르보닐알킬,  $C_1-C_6$  알콕시,  $C_1-C_6$  할로알콕시,  $C_2-C_8$  알킬카르보닐옥시,  $C_1-C_6$  알킬티오,  $C_1-C_6$  할로알킬티오,  $C_1-C_6$  알킬설퍼닐,  $C_1-C_6$  알킬설퍼닐,  $C_1-C_6$  알킬아미노 또는  $C_2-C_8$  다이알킬아미노인 실시 형태 102의 화합물.

[0288] 실시 형태 104. 각  $R^v$ 가 독립적으로 H, 할로젠, 시아노, 하이드록시,  $C_1-C_2$  알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬,  $C_1-C_2$  알콕시 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 실시 형태 103의 화합물.

[0289] 실시 형태 104a. 각  $R^v$ 가 독립적으로 H, 할로젠, 하이드록시, 또는 메틸인 실시 형태 104의 화합물.

[0290] 실시 형태 105. 각  $R^{7a}$ 가 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_3-C_6$  사이클로알킬,  $C_1-C_6$  할로알킬, 할로젠, 시아노,  $C_1-C_4$  알콕시,  $C_1-C_4$  할로알콕시 또는  $C_2-C_6$  알콕시카르보닐인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 104 중 어느 하나의 화합물.

[0291] 실시 형태 106. 각  $R^{7a}$ 가 독립적으로 메틸,  $CF_3$ , 할로젠 또는 메톡시인 실시 형태 105의 화합물.

[0292] 실시 형태 107.  $R^{21}$ 이 H,  $C_1-C_3$  알킬,  $C_1-C_3$  알킬카르보닐 또는  $C_2-C_3$  알콕시카르보닐인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 106 중 어느 하나의 화합물.

[0293] 실시 형태 108. 각  $Z^4$ 가 독립적으로  $C(=O)$  또는  $S(O)_2$ 인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 107 중 어느 하나의 화합물.

[0294] 실시 형태 109. 각  $Z^4$ 가  $C(=O)$ 인 실시 형태 108의 화합물.

[0295] 실시 형태 110. G가 2 위치에서 화학식 1의 X에 연결되고, 4 위치에서  $Z^1$ 에 연결되는 임의로 치환된 티아졸 환이고, A가  $CHR^{15}$ 이며, J가 4 위치에서  $Z^1$ 에 연결되는 치환된 아이속사졸 환이면,  $Z^1$ 이 0,  $C(=O)$ ,  $S(O)_m$ ,  $CHR^{20}$  또는  $NR^{21}$ 인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 109 중 어느 하나의 화합물.

[0296] 실시 형태 111. G가 2 위치에서 화학식 1의 X에 연결되고, 4 위치에서  $Z^1$ 에 연결되는 임의로 치환된 티아졸 환이고, J가 4 위치에서  $Z^1$ 에 연결되는 치환된 아이속사졸 환이면,  $Z^1$ 이 0,  $C(=O)$ ,  $S(O)_m$ ,  $CHR^{20}$  또는  $NR^{21}$ 인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 110 중 어느 하나의 화합물.

[0297] 실시 형태 112. G가 2 위치에서 화학식 1의 X에 연결되고, 4 위치에서  $Z^1$ 에 연결되는 임의로 치환된 티아졸 환이고, A가  $CHR^{15}$ 이며,  $Z^1$ 이 직접 결합하며, J가 치환된 아이속사졸 환이면, J가 아이속사졸 환의 3 위치 또는 5 위치에서 화학식 1의 나머지 부분에 연결되는 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 111 중 어느 하나의 화합물.

[0298] 실시 형태 113. G가 2 위치에서 화학식 1의 X에 연결되고, 4 위치에서  $Z^1$ 에 연결되는 임의로 치환된 티아졸 환이고, A가  $CHR^{15}$ 이며,  $Z^1$ 이 직접 결합하고, J가 치환된 아이속사졸 환이면, J가 아이속사졸 환의 3 위치에서 화

학식 1의 나머지 부분에 연결되는 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 112 중 어느 하나의 화합물.

[0299] 실시 형태 114. G가 2 위치에서 화학식 1의 X에 연결되고, 4 위치에서  $Z^1$ 에 연결되는 임의로 치환된 티아졸 환이고,  $Z^1$ 이 직접 결합이며, J가 치환된 아이속사졸 환이면, J가 아이속사졸 환의 3 위치에서 화학식 1의 나머지 부분에 연결되는 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 113 중 어느 하나의 화합물.

[0300] 실시 형태 115. X가  $X^1$ 이고, X를 포함하는 환이 포화되며, A가 NH이고, G가 2 위치에서 화학식 1의 X에 연결되고, 4 위치에서  $Z^1$ 에 연결되는 임의로 치환된 티아졸 환이며, J가 2 위치에서 화학식 1의 나머지 부분에 연결되는 치환된 이미다졸 환이면,  $Z^1$ 이 O, C(=O), S(O)<sub>m</sub>, CHR<sup>20</sup> 또는 NR<sup>21</sup>인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 114 중 어느 하나의 화합물.

[0301] 실시 형태 116. X가  $X^1$ 이고, X를 포함하는 환이 포화되며, A가 NR<sup>16</sup>이고, G가 2 위치에서 화학식 1의 X에 연결되고, 4 위치에서  $Z^1$ 에 연결되는 임의로 치환된 티아졸 환이며, J가 2 위치에서 화학식 1의 나머지 부분에 연결되는 치환된 이미다졸 환이면,  $Z^1$ 이 O, C(=O), S(O)<sub>m</sub>, CHR<sup>20</sup> 또는 NR<sup>21</sup>인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 115 중 어느 하나의 화합물.

[0302] 실시 형태 117. G가 2 위치에서 화학식 1의 X에 연결되고, 4 위치에서  $Z^1$ 에 연결되는 임의로 치환된 티아졸 환이면, J가 치환된 이미다졸릴 이외의 것인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 116 중 어느 하나의 화합물.

[0303] 실시 형태 1 내지 117의 조합들이 하기로 예시된다:

[0304] 실시 형태 A1.

[0305] R<sup>1</sup>이 탄소 환 구성원 상에서 R<sup>4a</sup>, 질소 환 구성원 상에서 R<sup>4b</sup> 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환된 페닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환이고;

[0306] G가 탄소 환 구성원 상에서 R<sup>3</sup>, 질소 환 구성원 상에서 R<sup>11</sup> 중에서 선택되는 2개 이하의 치환기로 임의로 치환된 5원 복소환이며;

[0307] J가 J-1 내지 J-82 (증거 3에 나타냄) (여기서, 좌측으로 돌출되게 나타낸 결합은  $Z^1$ 에 결합된다) 중의 하나이고;

[0308] 각 R<sup>2</sup>가 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 알콕시, 할로젠, 시아노 또는 하이드록시이며;

[0309] 각 R<sup>3</sup>가 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 할로알킬 또는 할로젠이고;

[0310] 각 R<sup>4a</sup>가 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알키닐, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 사이클로알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 사이클로알킬알킬, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> 알킬사이클로알킬, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> 알킬사이클로알킬알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 할로알키닐, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 할로사이클로알킬, 할로젠, 하이드록시, 아미노, 시아노, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 사이클로알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 하이드록시알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알킬카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬카르보닐옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬카르보닐티오, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알킬아미노카르보닐, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노카르보닐 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 트라이알킬실릴이며;

[0311] 각 R<sup>4b</sup>가 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 알케닐, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 알키닐, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 사이클로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 할로알케닐, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 할로알키닐, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 할로사이클로알킬 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시알킬이고;

[0312] 각 R<sup>11</sup>이 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 알킬이며;

- [0313]  $R^{15}$ 이 H, 할로젠, 시아노, 하이드록시,  $-CHO$ ,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬 또는  $C_2-C_5$  알콕시카르보닐이고;
- [0314]  $R^{16}$ 이 H,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_2-C_4$  알킬카르보닐,  $C_2-C_4$  할로알킬카르보닐 또는  $C_2-C_4$  알콕시카르보닐이며;
- [0315] x가 0 내지 5의 정수이고;
- [0316] s가 1 내지 2의 정수인 화학식 1의 화합물.
- [0317] 실시 형태 A2.
- [0318] G가 G-1 내지 G-59 (증거 2에 나타냄) (여기서, 좌측으로 돌출하는 결합은 X에 결합되고, 우측으로 돌출하는 결합은  $Z^1$ 에 결합된다) 중의 하나이고;
- [0319] J가 J-1, J-2, J-3, J-4, J-5, J-7, J-8, J-9, J-10, J-11, J-12, J-14, J-15, J-16, J-20, J-24, J-25, J-26, J-29, J-30, J-37, J-38, J-45 및 J-69 중에서 선택되며;
- [0320] Q가 Q-1 내지 Q-106 (증거 4에 나타냄) 중의 하나이고;
- [0321]  $R^1$ 이 U-1 내지 U-50 (증거 1에 나타냄) (여기서,  $R^4$ 가 탄소 환 구성원에 결합되면, 상기  $R^4$ 는  $R^{4a}$  중에서 선택되고,  $R^4$ 가 질소 환 구성원에 결합되면 (예를 들어, U-4, U-11 내지 U-15, U-24 내지 U-26, U-31 또는 U-35에서), 상기  $R^4$ 는  $R^{4b}$  중에서 선택된다) 중의 하나이며;
- [0322] 각  $R^2$ 가 독립적으로 메틸, 메톡시, 시아노 또는 하이드록시이고;
- [0323] 각  $R^{3a}$ 가 독립적으로 H 및  $R^3$  중에서 선택되며;
- [0324] 각  $R^5$ 가 독립적으로 H, 시아노,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  할로알킬,  $C_3-C_8$  사이클로알킬,  $C_3-C_8$  할로사이클로알킬,  $C_2-C_6$  알콕시알킬,  $C_1-C_6$  알콕시,  $C_1-C_6$  할로알콕시,  $C_3-C_8$  사이클로알콕시,  $C_2-C_6$  알케닐옥시,  $C_2-C_6$  할로알케닐옥시,  $C_2-C_6$  알키닐옥시,  $C_2-C_6$  알콕시알콕시,  $C_2-C_6$  알킬카르보닐옥시,  $C_2-C_6$  할로알킬카르보닐옥시,  $C_1-C_6$  알킬티오,  $C_1-C_6$  할로알킬티오,  $C_3-C_{10}$  트라이알킬실릴 또는  $-NR^{25}R^{26}$ 이고;
- [0325]  $R^{11a}$ 가 H 및  $R^{11}$  중에서 선택되며;
- [0326]  $R^{15}$ 이 H, 시아노, 하이드록시, 메틸 또는 메톡시카르보닐이고;
- [0327]  $R^{16}$ 이 H, 메틸, 메틸카르보닐 또는 메톡시카르보닐이며;
- [0328] 각  $Z^4$ 가  $C(=O)$ 이고;
- [0329] k가 0, 1 또는 2이며;
- [0330] p가 1 또는 2이고;
- [0331] q가 0, 1, 2, 3, 4 또는 5이며;
- [0332] s가 1인 실시 형태 A1의 화합물.
- [0333] 실시 형태 A3.
- [0334] G가 G-1, G-2, G-7, G-8, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26, G-27, G-36, G-37, G-38, G-49, G-50 및 G-55 중에서 선택되고;
- [0335] J가 J-4, J-5, J-8, J-11, J-15, J-16, J-20, J-29, J-30, J-37, J-38 및 J-69 중에서 선택되며;
- [0336] 각 Q가 독립적으로 Q-1, Q-20, Q-32 내지 Q-34, Q-45 내지 Q-47, Q-60 내지 Q-73, Q-76 내지 Q-79, Q-84 내지 Q-94 및 Q-98 내지 Q-106이고;

- [0337] A가 CH<sub>2</sub> 또는 NH이며;
- [0338] W가 O이고;
- [0339] X가 X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup> 또는 X<sup>3</sup>이며; Z<sup>1</sup>이 직접 결합이고;
- [0340] Z<sup>2</sup>가 직접 결합 또는 NR<sup>21</sup>이며;
- [0341] R<sup>1</sup>이 U-1 내지 U-3, U-11, U-13, U-20, U-22, U-23, U-36 내지 U-39 및 U-50 중에서 선택되고;
- [0342] 각 R<sup>3</sup>가 독립적으로 메틸 또는 할로겐이며;
- [0343] 각 R<sup>4a</sup>가 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알킬, 할로젠, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 알콕시 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알콕시이고;
- [0344] 각 R<sup>4b</sup>가 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알킬이며;
- [0345] 각 R<sup>7a</sup>가 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 사이클로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬, 할로젠, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알콕시 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐이고;
- [0346] k가 1 또는 2이며;
- [0347] n이 0인 실시 형태 A2의 화합물.
- [0348] 실시 형태 A4.
- [0349] A가 CH<sub>2</sub>이고;
- [0350] G가 G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 및 G-38 중에서 선택되며; G가 비치환되고;
- [0351] J가 J-29이며;
- [0352] Q가 Q-1, Q-45, Q-63, Q-64, Q-65, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72, Q-73, Q-76, Q-78, Q-79, Q-84, Q-85, Q-98, Q-99, Q-100 및 Q-101 내지 Q-106 중에서 선택되고;
- [0353] X가 X<sup>1</sup> 또는 X<sup>2</sup>이며; X를 포함하는 환이 포화되고;
- [0354] R<sup>1</sup>이 U-1, U-20 또는 U-50이며;
- [0355] 각 R<sup>4a</sup>가 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 알킬, 트라이플루오로메틸, Cl, Br, I 또는 메톡시이고;
- [0356] 각 R<sup>4b</sup>가 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 알킬 또는 트라이플루오로메틸이며;
- [0357] 각 R<sup>5</sup>가 독립적으로 H, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알콕시 또는 -NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>인 실시 형태 A3의 화합물.
- [0358] 실시 형태 A5.
- [0359] G가 G-1, G-2, G-15, G-26 및 G-36 중에서 선택되고;
- [0360] J가 J-29-1 내지 J-29-60 (증거 A에 나타냄) 중 어느 하나이며;
- [0361] Q가 Q-45, Q-63, Q-64, Q-65, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72 및 Q-85 중에서 선택되고;
- [0362] X가 X<sup>1</sup>인 실시 형태 A4의 화합물.
- [0363] 본 발명의 실시 형태는 또한 하기를 포함한다:
- [0364] 실시 형태 B1. M이 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알킬, 하이드록시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>

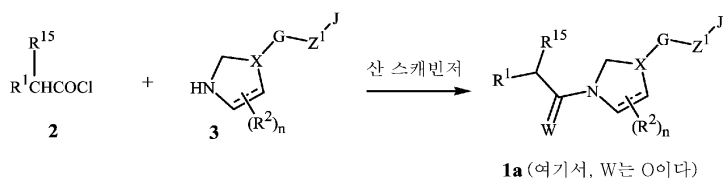
알킬아미노, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 다이알킬아미노, 1-피페리디닐, 1-피롤리디닐 또는 4-모르폴리닐인 화학식 1A의 화합물.

- [0365] 실시 형태 B2. M이 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 할로알킬, 하이드록시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노, 1-피페리디닐, 1-피롤리디닐 또는 4-모르폴리닐인 화학식 1A의 화합물.
- [0366] 실시 형태 B3. M이 메틸, 할로메틸, 하이드록시, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노, 1-피페리디닐, 1-피롤리디닐 또는 4-모르폴리닐인 실시 형태 B2의 화합물.
- [0367] 실시 형태 B4. M이 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노, 1-피페리디닐, 1-피롤리디닐 또는 4-모르폴리닐인 실시 형태 B3의 화합물.
- [0368] 실시 형태 B5. J<sup>1</sup>이 J-29-1 내지 J-29-57 (증거 A에 나타냄) 중 어느 하나인 화학식 1A 또는 실시 형태 B1 내지 B4 중 어느 하나의 화합물.
- [0369] 본 발명의 화학식 1A의 화합물에 관해서는, 다양한 J-29의 실시 형태가 2개 이상의 에난티오머로 존재할 수 있음에 주목된다. 본 발명의 화학식 1A의 화합물에 관한 J-29 실시 형태의 에난티오머는 상기 증거 A에 나타난 것이다. 모든 J-29 에난티오머는 특정한 J-29 에난티오머가 나타나있지 않은 실시 형태에 관한 본 발명의 화학식 1A의 화합물에 포함된다.
- [0370] 구체적인 실시 형태는 하기로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 화학식 1의 화합물을 포함한다:
- [0371] 1-[4-[4-[4,5-다이하이드로-5-[3-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)페닐]-3-아이속사졸릴]-2-티아졸릴]-1-피페리디닐]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에탄온,
- [0372] 1-[4-[4-(5-[1,1'-바이페닐]-4-일-4,5-다이하이드로-3-아이속사졸릴)-2-티아졸릴]-1-피페리디닐]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에탄온,
- [0373] 4-[4-(5-[1,1'-바이페닐]-2-일-4,5-다이하이드로-3-아이속사졸릴)-2-티아졸릴]-N-(2,5-다이메틸페닐)-1-피페리딘카르복스아미드,
- [0374] 4-[4-(4,5-다이하이드로-5-[2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)페닐]-3-아이속사졸릴)-2-티아졸릴]-N-(2,5-다이메틸페닐)-1-피페리딘카르복스아미드,
- [0375] 1-[4-[4-[4,5-다이하이드로-5-[2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)페닐]-3-아이속사졸릴]-2-티아졸릴]-1-피페리디닐]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에탄온,
- [0376] 1-[4-[4-[5-[2-플루오로-6-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)페닐]-4,5-다이하이드로-3-아이속사졸릴]-2-티아졸릴]-1-피페리디닐]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에탄온, 및
- [0377] 1-[4-[4-(5-[1,1'-바이페닐]-2-일-4,5-다이하이드로-3-아이속사졸릴)-2-티아졸릴]-1-피페리디닐]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에탄온.
- [0378] 본 발명은 화학식 1의 화합물 (모든 기하 이성질체 및 입체 이성질체 포함), 이의 N-옥사이드 및 이의 염 중에서 선택되는 화합물, 및 적어도 하나의 다른 살균제를 포함하는 살균제 조성물을 제공한다. 이러한 조성물의 실시 형태로서 주목해야 할 것은 상술한 임의의 화합물 실시 형태에 대응하는 화합물을 포함하는 조성물이다.
- [0379] 본 발명은 화학식 1의 화합물 (모든 기하 이성질체 및 입체 이성질체 포함), 이의 N-옥사이드 및 이의 염 중에서 선택되는 화합물의 살균적 유효량, 및 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 살균제 조성물을 제공한다. 이러한 조성물의 실시 형태로서 주목해야 할 것은 상술한 임의의 화합물 실시 형태에 대응하는 화합물을 포함하는 조성물이다.
- [0380] 본 발명은 화학식 1의 화합물 (모든 기하 이성질체 및 입체 이성질체 포함), 이의 N-옥사이드 및 이의 염 중에서 선택되는 화합물의 살균적 유효량을 식물 또는 이의 부분, 또는 식물 종자에 적용하는 것을 포함하는 균류 식물 병원체에 의한 식물병을 방제하는 방법을 제공한다. 이러한 방법의 실시형태로서 주목해야 할 것은 상술한 임의의 화합물 실시 형태에 대응하는 화합물의 살균적 유효량을 적용하는 것을 포함하는 방법이다. 특히 주목해야 할 것은 화합물이 본 발명의 조성물로서 적용되는 실시 형태이다.
- [0381] 화학식 1 및 1A가 이들의 N-옥사이드, 이들의 염, 또는 이들의 N-옥사이드 및 이들의 염을 포함하지 않는 실시 형태 1 내지 117, A1 내지 A5, 및 B1 내지 B5를 비롯한 상기 실시 형태도 주목된다.

[0382] 화학식 1 및 1A의 화합물은 반응 도식 1 내지 29에 기재된 하나 이상의 하기 방법 및 변형법에 의해 제조될 수 있다. 하기 화학식 1 내지 48 및 화학식 1Ba 및 1Bb의 화합물의 A, G, J, W, X, Q, Z<sup>1</sup>, Z<sup>2</sup>, Z<sup>3</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup> 및 n의 정의는 달리 언급하지 않는 한, 발명의 요약에 상기에서 정의한 바와 같다. 화학식 1a 내지 1i는 다양한 화학식 1의 서브세트이고; 화학식 37a는 화학식 37의 다른 표현이다.

[0383] 반응 도식 1에 나타난 바와 같이, W가 0인 화학식 1A (A가 CHR<sup>15</sup>인 화학식 1)의 화합물은 화학식 2의 산 염화물을 산 스캐빈저의 존재하에 화학식 3의 아민과 커플링하여 제조될 수 있다. 전형적인 산 스캐빈저로는 아민 염기, 예컨대 트라이에틸아민, N,N-다이아이소프로필에틸아민 및 피리딘을 들 수 있다. 다른 스캐빈저로는 수산화물, 예컨대 수산화나트륨 및 수산화칼륨 및 탄산염, 예컨대 탄산나트륨 및 탄산칼륨을 들 수 있다. 경우에 따라서는, 폴리머에 지지된 산 스캐빈저, 예컨대 폴리머에 결합된 N,N-다이아이소프로필에틸아민 및 폴리머에 결합된 4-(다이메틸아미노)피리딘을 사용하는 것이 유용하다. 적어도 2 당량의 산 스캐빈저가 존재한다면, 화학식 3의 아민의 산성염도 이러한 반응에 사용될 수 있다. 아민과 염을 형성하는데 사용되는 전형적인 산으로는 염산, 옥살산 및 트라이플루오로아세트산을 들 수 있다. 후속 단계에서, W가 0인 화학식 1a의 아미드는 다양한 표준 티아팅 시약 (standard thiating reagent), 예컨대 오황화인 또는 2,4-비스(4-메톡시페닐)-1,3-다이티아-2,4-다이포스페테인-2,4-다이설파이드 (로손 시약 (Lawesson's reagent))를 사용하여, W가 S인 화학식 1a의 티오아미드로 전환될 수 있다.

[0384] 반응 도식 1

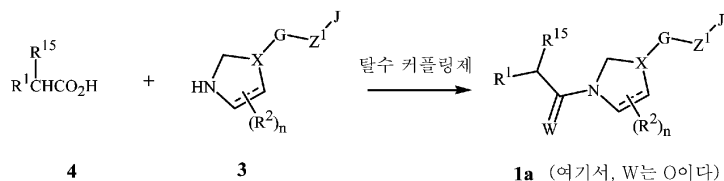


[0385]

[0386] W가 0인 화학식 1a의 화합물을 제조하기 위한 대체 절차는 반응 도식 2에 나타나있으며, 탈수 커플링 시약, 예컨대 다이사이클로헥실카르보다이이미드 (DCC), 1-(3-다이메틸아미노프로필)-3-에틸카르보다이이미드 하이드로클로라이드 (EDC) 또는 0-벤조트라이아졸-1-일-N,N,N',N'-테트라메틸우로늄 헥사플루오로포스페이트 (HBTU)의 존재하에서의 화학식 4의 산과 화학식 3의 아민 (또는 이의 산성염)의 커플링을 포함한다. 반복해서 말하지만, 폴리머에 지지된 시약, 예컨대 폴리머에 결합된 사이클로헥실카르보다이이미드가 유용하다. 이들 반응은 전형적으로 0 내지 40°C에서 용매, 예컨대 디클로로메탄 또는 아세토니트릴 중에서 염기, 예컨대 트라이에틸아민 또는 N,N-다이아이소프로필에틸아민의 존재하에 행해진다. 화학식 4의 산은 공지되어 있거나, 당업자에게 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다. 예를 들어, R<sup>1</sup>CH<sub>2</sub>COOH (여기서, R<sup>1</sup>은 질소를 통해 연결된 헤테로 방향족 환이다)는 대응하는 R<sup>1</sup>H 화합물을 염기의 존재하에 할로아세트산 또는 에스테르와 반응시켜 제조될 수 있다 (예를 들어, 미국 특허 제4,084,955호를 참조함). R<sup>1</sup>CH<sub>2</sub>COOH (여기서, R<sup>1</sup>은 탄소를 통해 연결된 페닐 또는 헤테로 방향족 환이다)는 대응하는 R<sup>1</sup>CH<sub>2</sub>-할로젠 화합물로부터 할로젠을 시안화물로 치환한 후에 가수분해하여, 제조될 수 있거나 (예를 들어, 문헌 [K. Adachi, Yuki Gosei Kagaku Kyokaishi 1969, 27, 875-876]을 참조함); R<sup>1</sup>C(=O)CH<sub>3</sub>로부터 빌게로트-킨들러 (Willgerodt-Kindler) 반응에 의해 제조될 수 있거나 (예를 들어, [문헌: H. R. Darabi et al., Tetrahedron Letters 1999, 40, 7549-7552 및 M. M. Alam and S. R. Adapa, Synthetic Communications 2003, 33, 59-63] 및 본 명세서에 인용된 참조문헌을 참조함); R<sup>1</sup>Br 또는 R<sup>1</sup>I로부터 tert-부틸 아세테이트 또는 말론산다이에틸과의 팔라듐 촉매 커플링 후에, 에스테르 가수분해하여 제조될 수 있다 (예를 들어, 문헌 [W. A. Moradi and S. L. Buchwald, J. Am. Chem. Soc. 2001, 123, 7996-8002 및 J. F. Hartwig et al., J. Am. Chem. Soc. 2002, 124, 12557-12565]을 참조함).



[0387] 반응 도식 2

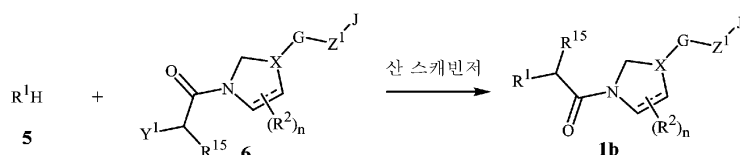


[0388] 1a (여기서, W는 O이다)

[0389] 합성 문헌이 다수의 아미드 생성 방법을 포함하고 있기 때문에, 반응 도식 1 및 2의 합성 절차는 화학식 1 화합물의 제조에 유용한 다양한 방법 중 간단한 대표적인 예이다. 당업자는 또한 화학식 2의 산 염화물이 다수의 공지된 방법에 의해 화학식 4의 산으로부터 제조될 수 있다.

[0390]  $R^1$ 이 질소 원자를 통해 연결된 5원 질소 함유 헤테로 방향족 환인 특정한 화학식 1b (A가  $CHR^{15}$ 이고, W가 O인 화학식 1)의 화합물은 반응 도식 3에 나타난 바와 같이, 화학식 5의 모 복소환과 화학식 6의 할로아세트아미드의 반응에 의해 제조될 수 있다. 상기 반응은 용매, 예컨대 테트라하이드로푸란, N,N-다이메틸포름아미드 또는 아세토니트릴 중에서 0 내지 80°C에서 염기, 예컨대 수소화나트륨 또는 탄산칼륨의 존재하에 행해진다. 화학식 6의 할로아세트아미드는 각각, 반응 도식 1 및 2에 기재된 아미드 생성 반응과 유사하게, 화학식 3의 아민과  $\alpha$ -할로 카르복실산 할라이드 또는  $\alpha$ -할로 카르복실산 또는 이의 무수물의 반응에 의해 제조될 수 있다.

[0391] 반응 도식 3

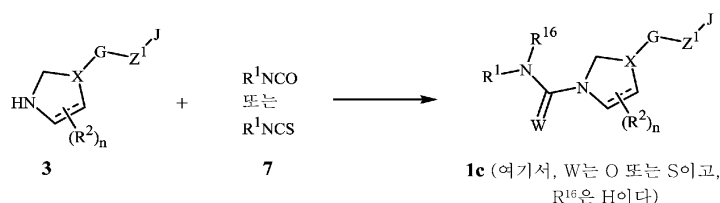


[0392]

[0393] (여기서,  $R^1$ 은 N 상에서 비치환된 5원 질소 함유 헤테로 방향족 환이고;  $Y^1$ 은 Cl, Br 또는 I이다).

[0394]  $R^1$ 이 페닐, 나프탈레닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환이고, W가 O 또는 S인 화학식 1c (A가 NH인 화학식 1)의 화합물은 반응 도식 4에 나타난 바와 같이, 각각 화학식 3의 아민과 화학식 7의 아이소시아네이트 또는 아이소티오시아네이트의 반응에 의해 제조될 수 있다. 이러한 반응은 전형적으로 주위 온도에서 비양성자성 용매, 예컨대 다이클로로메탄 또는 아세토니트릴 중에서 행해진다.

[0395] 반응 도식 4

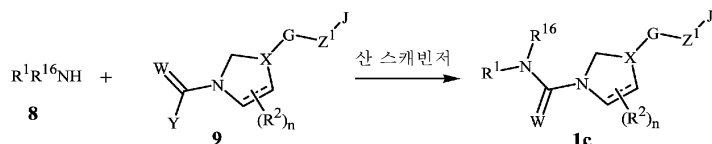


[0396]

[0397] 화학식 1c의 화합물은 또한 반응 도식 5에 나타난 바와 같이, 화학식 8의 아민과 화학식 9의 카르바모일 또는 티오카르바모일 클로라이드 또는 이미다졸의 반응에 의해 제조될 수 있다. Y가 염소인 경우, 반응은 전형적으로 산 스캐빈저의 존재하에 행해진다. 전형적인 산 스캐빈저로는 아민 염기, 예컨대 트라이에틸아민, N,N-다이아이소프로필에틸아민 및 피리딘을 들 수 있다. 다른 스캐빈저로는 수산화물, 예컨대 수산화나트륨 및 수산화칼륨 및 탄산염, 예컨대 탄산나트륨 및 탄산칼륨을 들 수 있다. 당업자에게 공지된 일반적인 방법에 따라, 화학식 9 (여기서, Y는 Cl이다)의 카르바모일 또는 티오카르바모일 클로라이드는 각각, 화학식 3의 아민으로부터 포스젠 또는 티오포스젠, 또는 이들의 등가물로 처리하여 제조될 수 있는 반면에, 화학식 9 (여기서, Y는 이미다졸-1-일이다)의 카르바모일 또는 티오카르바모일 이미다졸은 각각, 화학식 3의 아민으로부터 1,1'-카르보닐다이이미다졸 또는 1,1'-티오카르보닐다이이미다졸로 처리하여 제조될 수 있다.



[0398] 반응 도식 5

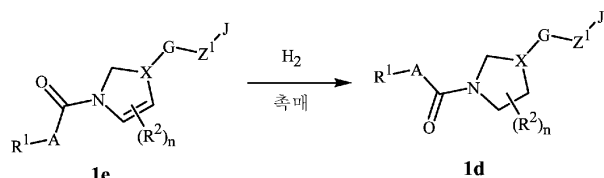


[0399]

[0400] (여기서, W는 O 또는 S이고; Y는 Cl 또는 이미다졸-1-일이다).

[0401] 특정한 화학식 1d (즉, X를 포함하는 환이 포화된 화학식 1)의 화합물은 반응 도식 6에 나타난 바와 같이, X를 포함하는 환이 불포화된 화학식 1e의 화합물로부터 촉매 수소화에 의해 제조될 수 있다. 전형적인 조건은 주위 온도에서 용매, 예컨대 에탄올 중에서 현탁된, 담체에 대한 금속의 중량비가 5 내지 20 %인 금속 촉매, 예컨대 불활성 담체, 예컨대 활성탄에 담지된 팔라듐의 존재하에, 화학식 1e의 화합물을 70 내지 700 kPa, 바람직하게는 270 내지 350 kPa의 압력의 수소 가스에 노출시키는 것을 포함한다. 이러한 타입의 환원은 공지되어 있으며; 예를 들어, 문헌 [Catalytic Hydrogenation, L. Cervený, Ed., Elsevier Science, Amsterdam, 1986]을 참조한다. 당업자는 화학식 1e의 화합물에 존재할 수 있는 다른 특정한 작용기도 촉매 수소화 조건하에 환원될 수 있으므로, 적절한 촉매 및 조건의 선택을 요한다는 것을 인지할 것이다.

[0402] 반응 도식 6

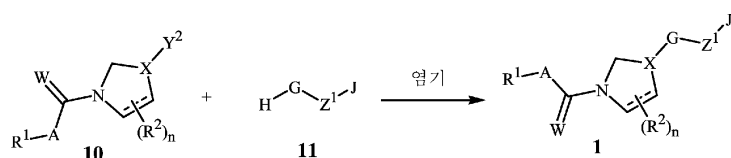


[0403]

[0404] (여기서, X는 X¹, X², X⁵, X⁸ 또는 X⁹이다).

[0405] X가 X¹, X⁵, X⁷ 또는 X⁹이고, G가 질소 원자를 통해 X를 포함하는 환에 연결되는 특정한 화학식 1의 화합물은 반응 도식 7에 나타난 바와 같이, 염기의 존재하에 화학식 10의 X를 포함하는 환 상의 적절한 이탈기 Y²를 화학식 11의 질소 함유 복소환으로 치환함으로써 제조될 수 있다. 적절한 염기로는 수소화나트륨 또는 탄산칼륨을 들 수 있으며, 반응은 용매, 예컨대 N,N-다이메틸포름아미드 또는 아세트니트릴 중에서 0 내지 80℃에서 행해진다. 화학식 10의 화합물의 적절한 이탈기는 브로마이드, 아이오다이드, 메실레이트 (OS(O)₂CH₃), 트라이플레이트 (OS(O)₂CF₃) 등을 포함하며, 화학식 10의 화합물은 당업계에 공지된 일반적인 방법을 이용하여, 대응하는 화합물 (여기서, Y²는 OH이다)로부터 제조될 수 있다.

[0406] 반응 도식 7



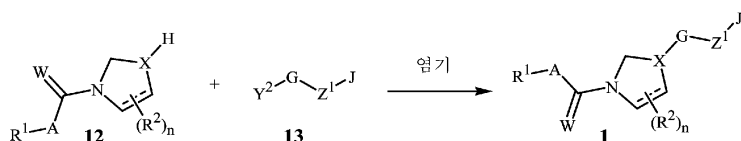
[0407]

[0408] (여기서, W는 O 또는 S이고; X는 X¹, X⁵, X⁷ 또는 X⁹이며; Y²는 이탈기, 예컨대 Br, I, OS(O)₂Me 또는 OS(O)₂CF₃이다).

[0409] X가 X² 또는 X⁸인 화학식 1의 화합물은 반응 도식 8에 나타난 바와 같이, 화학식 12의 화합물과 화학식 13의 헤테로사이클릭 할라이드 또는 트라이플레이트 (OS(O)₂CF₃)의 반응에 의해 제조될 수 있다. 상기 반응은 염기, 예컨대 탄산칼륨의 존재하에 용매, 예컨대 다이메틸설폭사이드, N,N-다이메틸포름아미드 또는 아세트니트릴 중에서 0 내지 80℃에서 행해진다. Y²가 트라이플레이트인 화학식 13의 화합물은 당업자에게 공지된 방법에 의해,

대응하는 화합물 (여기서,  $Y^2$ 는 OH이다)로부터 제조될 수 있다.

[0410] 반응 도식 8

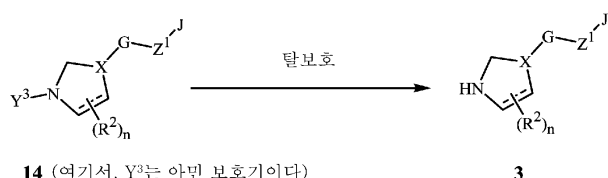


[0411]

[0412] (여기서, W는 O 또는 S이고; X는  $X^2$  또는  $X^8$ 이며;  $Y^2$ 는 이탈기, 예컨대 Br, I, OS(O)<sub>2</sub>Me 또는 OS(O)<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>이다).

[0413] 화학식 3의 아민 화합물은 반응 도식 9에 나타난 바와 같이, 화학식 14 (여기서,  $Y^3$ 는 아민 보호기이다)의 보호 아민 화합물로부터 제조될 수 있다. 다양한 아민 보호기가 이용가능하며 (예를 들어, 문헌 [T. W. Greene and P. G. M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991] 참조), 적절한 보호기의 사용 및 선택은 화학 합성의 숙련가에게 명백할 것이다. 당업계에 공지된 일반적인 방법에 의해, 보호기가 제거될 수 있으며, 아민은 이의 산성염 또는 유리 아민으로서 분리될 수 있다. 당업자는 또한 화학식 14의 보호 아민이, 기 R<sup>1</sup>AC(=W)가 화학식 1의 화합물의 제조를 위한 화학식 14의 유용한 중간체를 얻도록  $Y^3$ 로 치환되는 상기 반응 도식 6, 7, 및 8에 기재된 것과 유사한 방법으로 제조될 수 있음을 인지할 것이다.

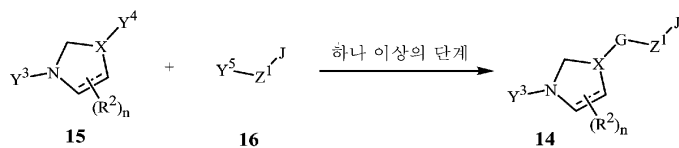
[0414] 반응 도식 9



[0415]

[0416] 화학식 14의 화합물은 또한 반응 도식 10에 나타난 바와 같이, 적절히 작용화된 화학식 15의 화합물과 적절히 작용화된 화학식 16의 화합물의 반응에 의해 제조될 수 있다. 작용기  $Y^4$  및  $Y^5$ 는 적절한 반응 조건하에서 다양한 복소환 G를 구성할 수 있는 부분, 예컨대 알데히드, 케톤, 에스테르, 산, 아마이드, 티오아미드, 니트릴, 아민, 알코올, 티올, 하이드라진, 옥심, 아마딘, 아마이드옥심, 올레핀, 아세틸렌, 할라이드, 알킬 할라이드, 메탄설포네이트, 트라이플루오로메탄설포네이트, 보론산, 보로네이트 등 중에서 선택되나, 이들에 한정되지 않는다. 일례로서, 화학식 15 (여기서,  $Y^4$ 는 티오아미드기이다)의 화합물과, 화학식 16 (여기서,  $Y^5$ 는 브로모아세틸기 또는 클로로아세틸기이다)의 화합물의 반응에 의해, 화학식 14 (여기서, G는 티아졸 환이다)의 화합물이 얻어질 것이다. 합성 문헌은 5원 헤테로 방향족 환 및 5원 부분 포화 복소환 (예를 들어, G-1 내지 G-59)을 형성하는 다수의 일반적인 방법을 기술하고 있다 (예를 들어, 문헌 [Comprehensive Heterocyclic Chemistry, Vol. 4-6, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors, Pergamon Press, New York, 1984]; Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, Vol. 2-4, A. R. Katritzky, C. W. Rees, and E. F. Scriven editors, Pergamon Press, New York, 1996; 및 시리즈, The Chemistry of Heterocyclic Compounds, E. C. Taylor, editor, Wiley, New York]을 참조함). 방향족 환과의 크로스 커플링 반응에 사용되는 유기 아연 시약을 제조하기 위한 화학식 15 (여기서, X는  $X^1$ 이고,  $Y^4$ 는 Br, I, 메탄설포네이트 또는 트라이플루오로메탄설포네이트이다)의 중간체의 용도가 기재되어 있다 (예를 들어, 문헌 [S. Bellotte, Synlett 1998, 379-380, 및 M. Nakamura et al., Synlett 2005, 1794-1798]을 참조함). 원하는 복소환, 예컨대 G를 구성하도록 적절한 작용기를 선택하는 방법은 당업자에 공지되어 있다. 화학식 15 및 16의 화합물은 공지되어 있거나, 당업계에 공지된 일반적인 방법에 의해 제조될 수 있다. 예를 들어, 화학식 15 (여기서,  $Y^4$ 는 티오아미드기이다)의 화합물은 실시예 2, 단계 B에 예증된 방법과 유사하게, 수황화나트륨 (sodium hydrosulfide)으로 처리하여, 대응하는 화합물 (여기서,  $Y^4$ 는 시아노이다)로부터 제조될 수 있다.

[0417] 반응 도식 10



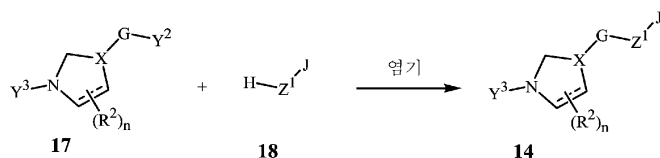
[0418]

[0419] (여기서,  $Y^4$  및  $Y^5$ 는 원하는 복소환 G의 구성에 적합한 작용기이다).

[0420] 당업자는 특히 본 명세서에 기재된 방법이 화학식 1의 화합물을 제조하는데 유용한 합성 유기 화학 분야에 공지된 다양한 방법의 예시가 되는 것을 인지한다. 화학식 1의 분자 성분을 집합하는 순서는 변화될 수 있으며, 유사한 출발 화합물 및 시약은 화학식 1의 범위 내에서 각종 화합물을 제조하는데 선택될 수 있다. 예를 들어, 반응 도식 10의 방법은 반응 도식 9에 나타낸 보호기  $Y^3$ 를 제거하여, 반응 도식 1 내지 5에 나타낸 분자 ( $R^1AC(=W)-$ )의 좌측 부분을 결합시키기 전에 전구체 기 (precursor group)  $Y^4$  및  $Y^5$ 로부터 G 환을 형성하는 것을 포함한다. 그 대안으로는, 반응 도식 1 내지 5와 유사한 방법을 이용하여 분자의 좌측 부분을 결합시킨 후에, 전구체 기  $Y^4$  및  $Y^5$ 로부터 G 환을 형성하는데, 반응 도식 10과 유사한 방법이 사용될 수 있다. 이러한 대체 합성 경로는 단계 A가 반응 도식 4와 유사하고, 단계 B가 반응 도식 10의 출발 화합물을 제조하는 방법과 유사하며, 단계 C가 반응 도식 28에 상응하고, 단계 D가 반응 도식 20과 유사하며, 단계 E가 반응 도식 10과 유사한 실시예 2에 예증된다.

[0421]  $Z^1$ 이 O, S, 또는  $NR^{21}$ 인 특정한 화학식 14의 화합물은 반응 도식 11에 나타낸 바와 같이, 염기의 존재하에 화학식 17의 G 상의 적절한 이탈기  $Y^2$ 를 화학식 18의 화합물로 치환함으로써 제조될 수 있다. 적절한 염기로는 수소화나트륨 또는 탄산칼륨을 들 수 있으며, 반응은 용매, 예컨대 N,N-다이메틸포름아미드 또는 아세토니트릴 중에서 0 내지 80°C에서 행해진다. 화학식 17의 화합물의 적절한 이탈기로는 브로마이드, 아이오다이드, 메실레이트 ( $OS(O)_2CH_3$ ), 트라이플레이트 ( $OS(O)_2CF_3$ ) 등을 들 수 있다. 화학식 17의 화합물은 당업계에 공지된 일반적인 방법에 의해 대응하는 화합물 (여기서,  $Y^2$ 는 OH이다)로부터 제조될 수 있다. 화학식 18의 화합물은 공지되어 있거나, 당업계에 공지된 일반적인 방법에 의해 제조될 수 있다.

[0422] 반응 도식 11

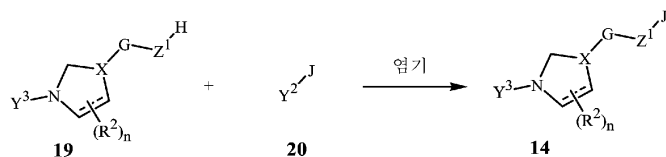


[0423]

[0424] (여기서,  $Y^2$ 는 이탈기, 예컨대 Br, I,  $OS(O)_2Me$  또는  $OS(O)_2CF_3$ 이고;  $Z^1$ 은 O, S 또는  $NR^{21}$ 이다).

[0425]  $Z^1$ 이 O, S, 또는  $NR^{21}$ 인 특정한 화학식 14의 화합물은 반응 도식 12에 나타낸 바와 같이, 염기의 존재하에 화학식 20의 J 상의 적절한 이탈기  $Y^2$ 를 화학식 19의 화합물로 치환함으로써 제조될 수 있다. 적절한 염기로는 수소화나트륨 또는 탄산칼륨을 들 수 있으며, 반응은 용매, 예컨대 N,N-다이메틸포름아미드 또는 아세토니트릴 중에서 0 내지 80°C에서 행해진다. 화학식 20의 화합물의 적절한 이탈기로는 브로마이드, 아이오다이드, 메실레이트 ( $OS(O)_2CH_3$ ), 트라이플레이트 ( $OS(O)_2CF_3$ ) 등을 들 수 있다. 화학식 20의 화합물은 당업계에 공지된 일반적인 방법을 이용하여, 대응하는 화합물 (여기서,  $Y^2$ 는 OH이다)로부터 제조될 수 있다.

[0426] 반응 도식 12



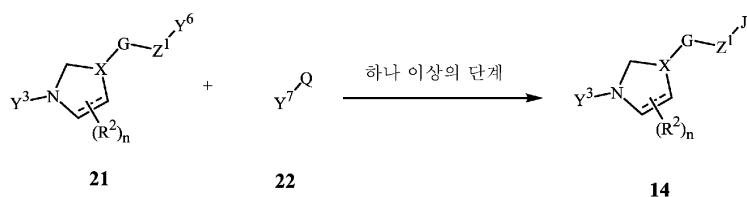
[0427]

[0428] (여기서,  $Y^2$ 는 이탈기, 예컨대 Br, I, OS(O)<sub>2</sub>Me 또는 OS(O)<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>이고;  $Z^1$ 은 O, S 또는 NR<sup>21</sup>이다).

[0429]

화학식 14의 화합물은 또한 반응 도식 13에 나타난 바와 같이, 적절히 작용화된 화학식 21의 화합물과 적절히 작용화된 화학식 22의 화합물의 반응에 의해 제조될 수 있다. 작용기  $Y^6$  및  $Y^7$ 은 적절한 반응 조건하에서 다양한 복소환 J를 구성할 수 있는 부분, 예컨대 알데히드, 케톤, 에스테르, 산, 아마이드, 티오아마이드, 니트릴, 아민, 알코올, 티올, 하이드라진, 옥심, 아마딘, 아마이드옥심, 올레핀, 아세틸렌, 할라이드, 알킬 할라이드, 메탄설폰네이트, 트라이플루오로메탄설폰네이트, 보론산, 보로네이트 등 중에서 선택되나, 이들에 한정되지 않는다. 일례로서, 염기의 존재하에서의 화학식 21 (여기서,  $Y^6$ 는 클로로 옥심 부분이다)의 화합물과 화학식 22 (여기서,  $Y^7$ 은 비닐기 또는 아세틸렌기이다)의 화합물의 반응에 의해, 각각 화학식 14 (여기서, J는 아이속사졸린 또는 아이속사졸이다)의 화합물이 얻어질 것이다. 합성 문헌은 탄소환 및 탄소환계, 및 복소환 및 복소환계 (예를 들어, J-1 내지 J-82)의 생성에 관한 다수의 일반적인 방법을 포함하며; 예를 들어, 문헌 [Comprehensive Heterocyclic Chemistry, Vol. 4-6, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors, Pergamon Press, New York, 1984; Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, Vol. 2-4, A. R. Katritzky, C. W. Rees, and E. F. Scriven editors, Pergamon Press, New York, 1996; 시리즈, The Chemistry of Heterocyclic Compounds, E. C. Taylor, editor, Wiley, New York, 및 Rodd's Chemistry of Carbon Compounds, Vol. 2-4, Elsevier, New York]을 참조한다. 니트릴 옥사이드와 올레핀의 고리화 첨가 반응에 대한 일반적인 절차는 화학 문헌에 기록되어 있다. 관련 문헌에 관해서는 예를 들어, 문헌 [Lee, Synthesis 1982, 6, 508-509 and Kanemasa et al., Tetrahedron 2000, 56, 1057-1064] 및 상기 문헌에 인용된 참조문헌을 참조한다. 당업자는 원하는 복소환 J를 구성하기 위한 적절한 작용기의 선택 방법을 인지하고 있다. 화학식 22의 화합물은 공지되어 있거나, 당업계에 공지된 일반적인 방법에 의해 제조될 수 있다.

[0430] 반응 도식 13



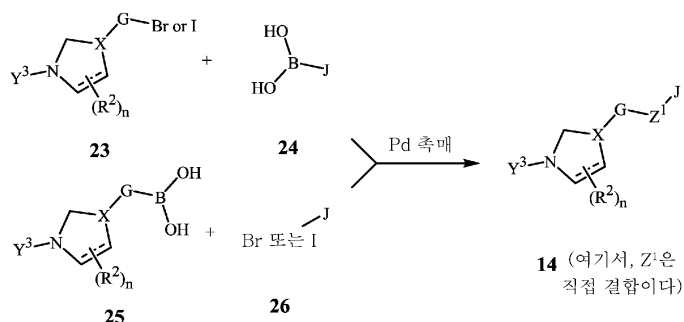
[0431]

[0432] (여기서,  $Y^6$  및  $Y^7$ 은 원하는 복소환 J의 구성에 적합한 작용기이다).

[0433]

화학식 14 (여기서,  $Z^1$ 은 결합수 (bond)이다)의 화합물의 대체 제법은 반응 도식 14에 나타난 바와 같이, 각각 화학식 23 또는 26의 아이오다이드 또는 브로마이드와 화학식 24 또는 25의 보론산의 Pd 촉매 크로스 커플링을 비롯한 공지된 스즈키 (Suzuki) 반응을 포함한다. 이러한 타입의 변환에는 다수의 촉매가 유용한데; 전형적인 촉매는 테트라키스(트라이페닐포스핀)팔라듐이다. 용매, 예컨대 테트라하이드로푸란, 아세토니트릴, 다이에틸 에테르 및 다이옥산이 적합하다. 스즈키 반응 및 관련된 커플링 절차는 G-J 결합 형성을 위한 다수의 대체 수단을 제공한다. 주요 참조 문헌에 관해서는 예를 들어, 문헌 [C. A. Zifacsak and D. J. Hlasta, Tetrahedron 2004, 60, 8991-9016]을 참조한다. G-J 결합의 합성에 적용가능한 팔라듐 화학의 철저한 검토에 관해서는, 예를 들어 문헌 [J. J. Li and G. W. Gribble, editors, Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist, Elsevier: Oxford, UK, 2000]을 참조한다. 이러한 일반적인 방법에 관한 다양한 촉매 종류, 염기 및 반응 조건이 당업계에 공지되어 있다.

[0434] 반응 도식 14

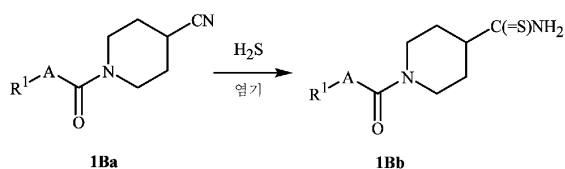


[0435]

[0436] 당업자는 다수의 화학식 1의 화합물이 기 Y<sup>3</sup>가 R<sup>1</sup>AC(=W)로 치환되는 상기 반응 도식 10 내지 14에 기재된 것과 유사한 방법에 의해 직접 제조될 수 있음을 인지할 것이다. 따라서, Y<sup>3</sup>가 R<sup>1</sup>AC(=W)로 치환되는 화학식 15, 17, 19, 21, 23 및 25에 대응하는 화합물은 화학식 1의 화합물의 제조에 유용한 중간체이다.

[0437] 화학식 1Bb의 티오아미드는 반응 도식10의 방법에 기재된 티오아미드-α-할로아릴 환 형성 반응을 이용하여, 화학식 1 (여기서, X는 X<sup>1</sup>이다)의 화합물을 제조하기 위한 특히 유용한 중간체이다. 화학식 1Bb의 티오아미드는 반응 도식 15에 나타낸 바와 같이, 대응하는 화학식 1Ba의 니트릴에 황화수소를 첨가하여 제조될 수 있다.

[0438] 반응 도식 15



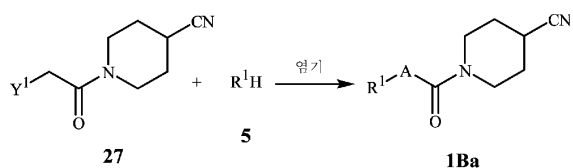
[0439]

[0440] (여기서, R<sup>1</sup> 및 A는 화학식 1에 정의된 바와 같다).

[0441] 반응 도식 15의 방법은 아민, 예컨대 피리딘, 다이에틸아민 또는 다이에탄올아민의 존재하에, 화학식 1Ba의 화합물과 황화수소를 접촉시켜 행해질 수 있다. 대안적으로, 황화수소는 알칼리 금속 또는 암모니아와의 이의 바이설파이드 염 형태로 사용될 수 있다. 이러한 타입의 반응은 문헌에 잘 기록되어 있다 (예를 들어, 문헌 [참조: A. Jackson et al., EP 696,581 (1996)]). 이 방법은 실시예 1, 단계 C 및 실시예 2, 단계 B에 예증되어 있다.

[0442] R<sup>1</sup>이 질소 원자를 통해 연결된 5원 질소 함유 헤테로 방향족 환인 특정한 화학식 1Ba의 화합물은 반응 도식 16에 나타낸 바와 같이, 화학식 5의 모 복소환과 화학식 27의 할로아세트아미드의 반응에 의해 제조될 수 있다. 상기 반응은 용매, 예컨대 테트라하이드로푸란, N,N-다이메틸포름아미드 또는 아세토니트릴 중에서 0 내지 80℃에서 열기, 예컨대 수소화나트륨 또는 탄산칼륨의 존재하에 행해진다. 이 방법은 실시예 1, 단계 B에 예증되어 있다.

[0443] 반응 도식 16

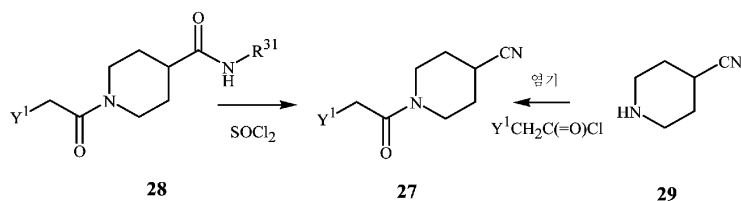


[0444]

[0445] (여기서, R<sup>1</sup>H (화학식 5)에서의 R<sup>1</sup>은 N 상에서 비치환된 5원 질소 함유 헤테로 방향족 환 (즉, 화학식 -(NH)-의 환 구성원을 포함하는 5원 헤테로 방향족 환)이고; A는 CH<sub>2</sub>이며; Y<sup>1</sup>은 Cl, Br 또는 I이다).

[0446] 화학식 27의 할로아세트아미드는 반응 도식 17에 나타난 두가지 방법에 의해 제조될 수 있다.

[0447] 반응 도식 17



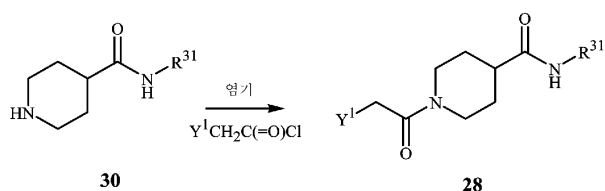
[0448]

[0449] (여기서, Y¹은 Cl, Br, 또는 I이고; R³¹은 삼차 알킬기, 예컨대 -C(Me)₃이다).

[0450] 하나의 방법에서, 화학식 29의 4-시아노피페리딘은 표준 방법에 따라 전형적으로 염기의 존재하에 적절한 할로아세틸 클로라이드와 접촉시켜 할로아세틸화한다. 바람직한 조건은 무기 염기, 예컨대 알칼리 금속 또는 알칼리 토금속 탄산염, 중탄산염 또는 인산염의 수용액, 및 비수혼화성 유기 용매, 예컨대 톨루엔, 아세트산에틸 또는 1,2-다이클로로에탄의 사용을 포함한다. 반응 도식 17에 나타난 두번째 방법에서, 화학식 28의 1-(할로아세틸)-N-치환된 아이소니페코타미드 (isonipecotamide) 유도체 (여기서, R³¹은 삼차 알킬, 예컨대 C(Me)₃이다)는 적절한 용매 중에서 표준 아미드 탈수제, 예컨대 염화티오닐 또는 옥시염화인을 사용하여 탈수된다. 이러한 변환에 특히 바람직한 용매는 N,N-다이알킬아미드, 예컨대 N,N-다이메틸포름아미드이다. 상기 반응은 전형적으로 반응이 첨가 시에 신속하게 진행되는 온도에서 옥시염화인 또는 염화티오닐 0.9 내지 2 당량, 바람직하게는 1.1 당량을 화학식 28의 화합물과 용매 0.5 내지 10 중량부의 혼합물에 첨가함으로써 행해진다. 이 반응에 관한 첨가 시간은 전형적으로 약 35 내지 55°C의 전형적인 온도에서 약 20 내지 90 분간이다.

[0451] 반응 도식 18에 나타난 바와 같이, 화학식 28의 화합물은 반응 도식 17에 기재된 할로아세틸화 반응과 유사하게 화학식 30의 화합물로부터 제조될 수 있다.

[0452] 반응 도식 18



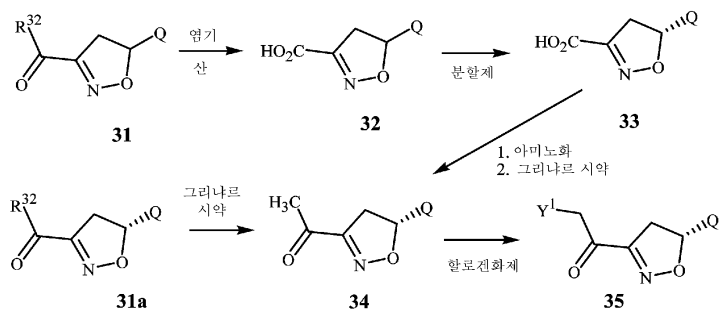
[0453]

[0454] 화학식 30의 화합물은 공지되어 있거나, 당업계에 공지된 방법을 이용하여 4-시아노피리딘 또는 아이소니코틴산으로부터 제조될 수 있으며; 예를 들어, 시아노피리딘 및 t-부탄올로부터 N-t-부틸 피리딘카르복스아미드를 제조하는 것에 관해서는 문헌 [G. Marzolph et al., DE 3,537,762 (1986)]을 참조하고, 팔라듐 촉매를 이용한 N-메틸아이소니코틴아미드의 수소화에 관해서는 문헌 [S. F. Nelsen et al., J. Org. Chem., 1990, 55, 3825]을 참조한다.

[0455] 화학식 35의 할로메틸 아이속사졸 케톤은 J가 예를 들어, 증거 A에 나타난 J-29-1 내지 J-29-57 중에서 선택되는 특정한 화학식 1의 키랄 화합물을 제조하기 위한 특히 유용한 중간체이다. 화학식 35의 할로메틸 아이속사졸 케톤은 반응 도식 19에 나타난 다단계 반응 순서에 의해 제조될 수 있다.



[0456] 반응 도식 19



[0457]

[0458] (여기서, R<sup>32</sup>는 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노, 1-피페리디닐, 1-피롤리디닐 또는 4-모르폴리닐이고, Q는 발명의 요약에 상기에서 정의한 바와 같다).

[0459]

화학식 32의 라세미 카르복실산의 제조는 바람직하게는 약 25 내지 45℃에서 수혼화성 공용매, 예컨대 메탄올 또는 테트라하이드로퓨란 중에서 약간 과량의 수산화나트륨을 사용하여, 화학식 31의 대응하는 화합물의 염기성 또는 산성 가수분해의 공지된 방법에 따라 달성될 수 있다. 생성물은 pH를 약 1 내지 3으로 조절한 다음에, 임의로 증발에 의한 유기 용매의 제거 후에 여과 또는 추출하여 분리될 수 있다. 화학식 32의 라세미 카르복실산은 적절한 키랄 아민 염기, 예컨대 실크닌, 다이하이드로실크닌 또는 이들의 혼합물의 디아스테레오머 염의 전형적인 분별 결정에 의해 분해될 수 있다. 약 85:15 비율의 실크닌-다이하이드로실크닌 혼합물은 예를 들어, 용해도가 낮은 염으로서의 R<sup>5</sup>가 치환된 페닐기인 화학식 33의 (R)-배열 카르복실산을 제공하기 때문에, 특히 유용하다. 또한, 이들 키랄 아민 염기는 상업 규모로 용이하게 이용가능하다. 화학식 35의 (R)-배열 할로메틸 케톤 중간체는 반응 도식 10의 방법에 따라 화학식 1Bb의 티오아미드와 커플링한 후에 더욱더 살균적으로 활성인 화학식 1의 최종 생성물을 제공한다. 화학식 35의 할로메틸 케톤은 우선 순수한 에난티오머 (즉, 화학식 31a)로서 또는 에난티오머적으로 풍부한 혼합물 또는 라세미 혼합물 중에서의 화학식 31의 대응하는 아미드를 1 몰 당량의 메틸마그네슘 할라이드 (그리냐르 시약)와 적절한 용매 또는 용매 혼합물, 예컨대 테트라하이드로퓨란 및 톨루엔 중에서 약 0 내지 20℃에서 반응시켜 제조될 수 있으며, 화학식 34의 조제의 케톤 생성물은 산성 수용액으로 킨칭 (quenching), 추출, 및 농축시켜 분리될 수 있다. 그 다음에, 화학식 34의 조제의 케톤은 시약, 예컨대 염화설푸릴로 할로젠화되어, 화학식 35 (여기서, Y<sup>1</sup>은 Cl이다)의 클로로메틸 케톤을 제공하거나, 분자 브롬으로 할로젠화되어, 화학식 35 (여기서, Y<sup>1</sup>은 Br이다)의 대응하는 브로모메틸 케톤을 제공한다. 화학식 35의 할로메틸 케톤은 용매, 예컨대 헥산 또는 메탄올로 결정화되어 정제될 수 있거나, 티오아미드와의 축합 반응 시에 추가의 정제없이 사용될 수 있다.

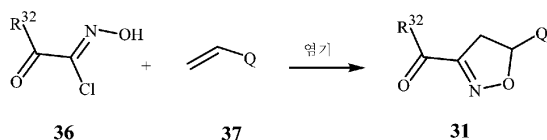
[0460]

반응 도식 19에 예시된 변환 반응은 화학식 1 (여기서, J는 증거 A에 나타난 J-29-1 내지 J-29-57 중 어느 하나이다)의 특정한 화합물을 제조하기 위한 중간체로서 유용한 화학식 31 내지 35에 대응하는 화학식 1A의 화합물을 예시한다. 화학식 31 및 31a의 R<sup>32</sup> 및 화학식 32 내지 35의 대응하는 기는 화학식 1A의 M에 대응한다. 당업자는 화학식 31 내지 35의 화합물의 유사체가 예컨대, 화학식 1 (여기서, J는 증거 A에 나타난 J-29-58 내지 J-29-60 중 어느 하나이다)의 다른 화합물을 제조하는데 유용하다는 것을 인지한다. 게다가, 당업자는 반응 도식 19에 나타난 변환에 관해서는, R<sup>32</sup>가 C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 다이알킬아미노, 1-피페리디닐, 1-피롤리디닐 또는 4-모르폴리닐 이외에도 다른 기일 수 있다. 예를 들어, 화학식 32의 화합물로서의 화학식 31의 화합물의 가수분해 (하이드록시인 화학식 1A의 M에 대응)에 관해서는, R<sup>32</sup>는 또한 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알콕시 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬아미노일 수 있다. 게다가, 화학식 34의 메틸 (CH<sub>3</sub>) 기 및 화학식 35의 할로메틸 (Y<sup>1</sup>CH<sub>2</sub>) 기는 각각, 상응하게 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 알킬 및 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 할로알킬인 화학식 1A의 M을 나타낸다.

[0461]

화학식 31의 아이속사졸 카르복스아미드는 반응 도식 20에 나타난 바와 같이, 화학식 36의 대응하는 하이드록사모일 클로라이드와 화학식 37의 올레핀 유도체의 고리화 첨가 반응에 의해 제조될 수 있다.

[0462] 반응 도식 20

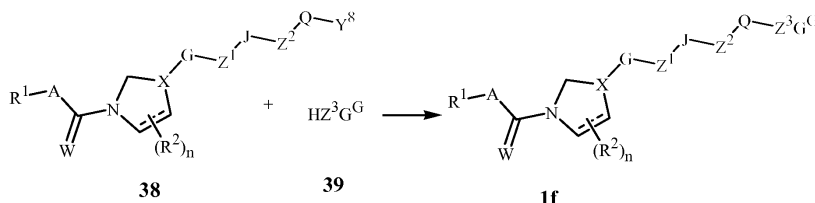


[0463]

[0464] 이 방법에서, 모든 3개의 반응 성분 (화학식 36 및 37의 화합물, 및 염기)은 화학식 36의 하이드록사모일 클로라이드의 가수분해 또는 이량체화를 최소화하도록 접촉된다. 하나의 전형적인 절차에서, 삼차 아민 염기, 예컨대 트라이에틸아민 또는 무기 염기, 예컨대 알칼리 금속 또는 알칼리 토금속 탄산염, 중탄산염 또는 인산염일 수 있는 염기는 화학식 37의 올레핀 유도체와 혼합되며, 화학식 36의 하이드록사모일 클로라이드는 고리화 첨가 반응이 비교적 급속도로 진행되는 온도, 전형적으로 5 내지 25℃의 온도에서 서서히 첨가된다. 대안적으로, 염기는 다른 2개의 성분 (화학식 36 및 37의 화합물)에 서서히 첨가될 수 있다. 화학식 36의 하이드록사모일 클로라이드가 실질적으로 반응 매질에 불용성을 나타내는 경우에 이러한 대체 절차가 바람직하다. 반응 매질 중의 용매는 과량으로 사용되는 물 또는 불활성 유기 용매, 예컨대 톨루엔, 헥산 또는 심지어는 올레핀 유도체일 수 있다. 생성물은 여과 또는 수세 후에, 용매 증발에 의해 염 부산물로부터 분리될 수 있다. 조 생성물은 결정화에 의해 정제될 수 있거나, 조 생성물은 반응 도식 19의 방법에 직접 사용될 수 있다. 반응 도식 20의 방법은 실시예 1, 단계 F에 예증된다. 또한, 반응 도식 20과 유사한 방법은 실시예 2, 단계 D에 예증된다. 화학식 31의 화합물은 화학식 34의 대응하는 메틸 케톤 및 화학식 35의 할로메틸 케톤의 유용한 전구체이며, 또한 반응 도식 19에 나타난 바와 같이, 가수분해, 분해, 메틸 케톤 합성 및 할로겐화에 의해 화학식 34 및 35의 화합물의 분해된 에난티오머를 제조하는데 유용하다.

[0465] 화학식 1f의 화합물은 다수의 방법에 의해 제조될 수 있다. 하나의 방법에서, 화학식 38 (여기서,  $Y^8$ 은 이탈기, 예컨대 할로젠, 예를 들어 요오드이다)의 화합물은 반응 도식 21에 나타난 바와 같이, 화학식 39 (여기서,  $Z^3$ 는 O, S 또는 NH이다)의 화합물과 반응한다.

[0466] 반응 도식 21



[0467]

[0468]  $Y^8$ 은 F, Cl, Br, I이고;  $Z^3$ 는 O, S 또는 NH이며;  $G^A$ ,  $G^N$  또는  $G^P$ 이다.

[0469] 이 반응 ( $Z^3$ 가 O인 경우에, 올만 (Ullmann) 에테르 합성으로서 공지됨)은 당업자에게 공지되어 있다. 상기 반응은 전형적으로 무기 염기, 예컨대 탄산칼륨 또는 탄산세슘의 존재하에 금속 촉매, 예를 들어, 요오드화구리를 사용하여 행해진다. 실온 내지 150℃의 온도 및 용매, 예컨대 다이메틸 설펝사이드 및 N,N-다이메틸포름아미드가 상기 반응에 적합하다. 화학식 1f (여기서,  $Z^3$ 는 O이다)의 다이아릴 에테르는 또한 팔라듐 촉매 부흐발트-하르트비히 (Buchwald-Hartwig) 반응, 친핵성 방향족 치환 또는 아릴보론산 다이아릴에테르 커플링을 이용하여 제조될 수 있다. 올만 다이아릴에테르 합성을 비롯한 이들 방법의 최근 검토에 관해서는 예를 들어, 문헌 [R. Frien and D. Kikeji, Synthesis 2006, 14, 2271-2285]을 참조한다.

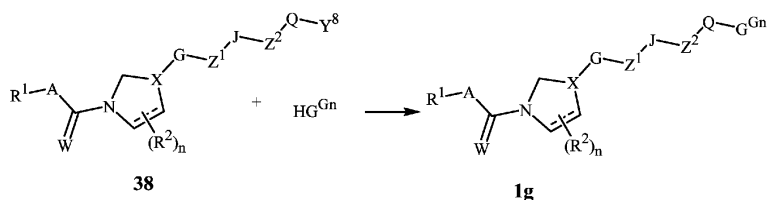
[0470] 다이아릴 에테르에 관해 기재된 것과 유사한 조건은 또한 화학식 1f (여기서, Z는 S 또는 NH이다)의 화합물을 제조하기 위해 사용될 수 있다. 황 및 질소 유사체의 제조의 최근 검토에 관해서는, 예를 들어, 문헌 [S. V. Ley and A. W Thomas, Angew. Chem., Int. Ed. Engl. 2003, 42, 5400]을 참조한다.

[0471] 유사한 구리 촉매 방법은 반응 도식 22에 나타난 바와 같이, H가 질소 환 구성원에 연결되어 있는 복소환  $HG^{Gn}$ , 예를 들어 트리아졸, 또는 이의 염 (예를 들어, 나트륨 트리아졸)으로부터,  $G^{Gn}$ 이  $G^{Gn}$ 의 질소 원자 환 구성원을 통해 Q에 결합된  $G^A$ ,  $G^N$  또는  $G^P$ 인 화학식 1g (즉,  $Z^3$ 가 직접 결합이고,  $G^G$ 가 질소 환 구성원을 통해 결합된



$G^{Gn}$ 인 화학식 1f)의 화합물을 제조하도록 사용될 수 있다.

[0472] 반응 도식 22



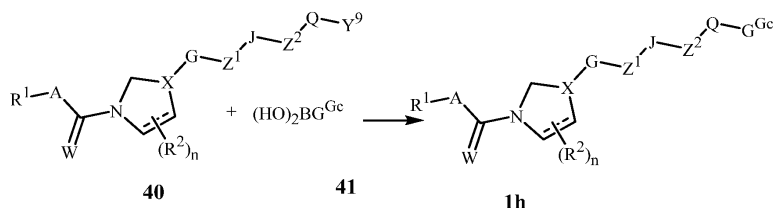
[0473]

[0474]  $Y^8$ 은 F, Cl, Br, I이고;  $G^{Gn}$ 은 환 질소 원자를 통해 Q에 결합된  $G^A$ ,  $G^N$  또는  $G^P$ 이다.

[0475] 리간드, 예컨대 (1R,2R)-N,N-다이메틸-1,2-사이클로헥센다이아민은 구리 촉매의 용해성 및 반응성을 증가시키도록 사용될 수 있다. 반응은 전형적으로 용매, 예컨대 다이메틸설폭사이드 또는 혼합 용매, 예컨대 다이메틸설폭사이드-물 중에서 실온 내지 200℃의 온도에서 행해진다. 주요 참조 문헌에 관해서는 예를 들어, 문헌 [Andersen et al., Synlett 2005, 14, 2209-2213]을 참조한다. 이러한 방법은 실시예 1, 단계 H에 예증된다.

[0476]  $G^{Gc}$ 가  $G^{Gc}$ 의  $sp^2$  탄소 원자 환 구성원을 통해 Q에 결합된  $G^A$ ,  $G^N$  또는  $G^P$ 인 화학식 1h (즉,  $Z^3$ 가 직접 결합이고,  $G^G$ 가  $sp^2$  탄소 원자 환 구성원을 통해 결합된  $G^{Gc}$ 인 화학식 1f)의 화합물은 반응 도식 23에 나타낸 바와 같이, Pd 촉매 크로스 커플링을 비롯한 공지된 스즈키 반응을 비롯하여 다양한 일반적인 방법에 의해 제조될 수 있다.

[0477] 반응 도식 23



[0478]

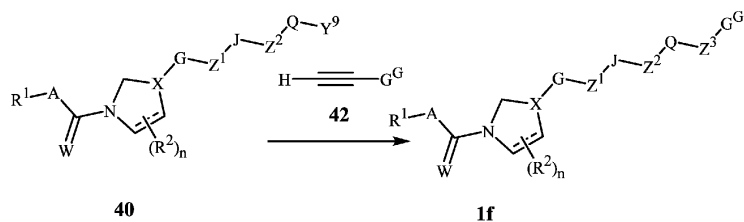
[0479]  $Y^9$ 은 Cl, Br, I, 또는  $OS(O)_2CF_3$ 이고;  $G^{Gc}$ 는  $sp^2$  환 탄소 원자를 통해 Q에 결합된  $G^A$ ,  $G^N$  또는  $G^P$ 이다.

[0480] 화학식 40의 아이오다이드 또는 브로마이드와, 화학식 41 (여기서, 붕소는  $G^{Gc}$ 의  $sp^2$  환 탄소 원자에 결합된다)의 보론산의 커플링 조건은 상기 반응 도식 14에 기재된 것과 유사하다.

[0481] 다수의 촉매가 이러한 형태의 변환에 유용하며; 전형적인 촉매는 테트라키스(트라이페닐포스핀)팔라듐이다. 용매, 예컨대 테트라하이드로푸란, 아세토니트릴, 다이에틸 에테르 및 다이옥산이 적합하다. 스즈키 반응 및 관련된 커플링 절차는 Q와  $G^{Gc}$  환 사이의 직접 결합을 형성하기 위한 다수의 대체 수단을 제공한다. 주요 참조 문헌에 관해서는 예를 들어, 문헌 [C. A. Zifcsak and D. J. Hlasta, Tetrahedron 2004, 60, 8991-9016]을 참조한다.  $QG^{Gc}$  결합의 합성에 적용가능한 팔라듐 화학의 철저한 검토에 관해서는, 예를 들어 문헌 [J. J. Li and G. W. Gribble, editors, Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist, Elsevier: Oxford, UK, 2000]을 참조한다. 이러한 일반적인 방법에 관한 다양한 촉매 종류, 염기 및 반응 조건이 당업계에 공지되어 있다.

[0482] 반응 도식 24에 나타낸 바와 같이, 화학식 1f (여기서,  $Z^3$ 는  $-C\equiv C-$ 이다)의 화합물의 제조 방법으로는 금속 촉매 및 염기의 존재하에서의 화학식 40 (여기서,  $Y^9$ 은 할로젠, 예컨대 요오드 또는 브로마이드이다)의 할라이드와, 화학식 42의 알킨의 Pd 촉매 크로스 커플링을 이용한 공지된 소노가시라 (Sonogashira) 반응을 들 수 있다.

[0483] 반응 도식 24

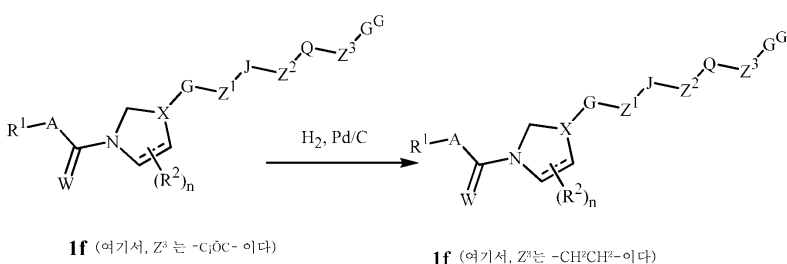


[0484]

[0485]  $Y^9$ 은 Cl, Br, I, 또는  $OS(O)_2CF_3$ 이고;  $Z^3$ 는  $-C\equiv C-$ 이며;  $G^G$ 는  $G^A$ ,  $G^N$  또는  $G^P$ 이다. 다수의 촉매가 이러한 형태의 변환에 유용하며; 전형적인 촉매는 다이클로로비스(트라이-*o*-톨릴포스핀)팔라듐 (II)이다. 적절한 용매로는 테트라하이드로푸란, 아세토니트릴 및 아세트산에틸을 들 수 있다. 적절한 금속 촉매로는 예를 들어, 요오드화구리를 들 수 있다. 전형적인 염기로는 예를 들어, 트리에틸아민 또는 후니그 염기 (Hunig's base)를 들 수 있다. 주요 참조 문헌에 관해서는 예를 들어, 문헌 [I. Campbell, Organocopper Reagents 1994, 217-235]을 참조한다.

[0486] 반응 도식 25에 나타낸 바와 같이, 화학식 1f (여기서,  $Z^3$ 는  $-C\equiv C-$ 이다)의 화합물은 탄소에 담지된 촉매, 예를 들어, 팔라듐의 존재하에 수소로 환원하여, 화학식 1f (여기서,  $Z^3$ 는  $-CH_2CH_2-$ 이다)의 화합물을 제조하기 위한 출발 물질로서 작용할 수 있다.

[0487] 반응 도식 25



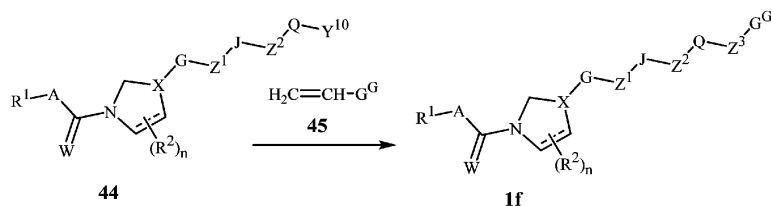
[0488]

[0489]  $G^G$ 는  $G^A$ ,  $G^N$  또는  $G^P$ 이다.

[0490] 환원은 전형적으로 당업자에게 공지된 방법을 이용하여, 대기압 내지 700 kPa, 바람직하게는 약 400 kPa의 압력에서 용매, 예컨대 아세트산에틸 또는 에탄올 중에서 수소 분위기하에 행해진다.

[0491] 반응 도식 26에 나타낸 바와 같이, 화학식 1f (여기서,  $Z^3$ 는  $-C\equiv C-$ 이다)의 화합물의 제법으로는 금속 촉매 및 염기, 예컨대 트리에틸아민 또는 중탄산나트륨의 존재하에서의 화학식 44 (여기서,  $Y^{10}$ 은 할로젠, 예컨대 요오드 또는 브로마이드이다)의 할라이드와, 화학식 45의 알켄의 Pd 촉매 크로스 커플링을 이용한 공지된 Heck 반응을 들 수 있다.

[0492] 반응 도식 26



[0493]

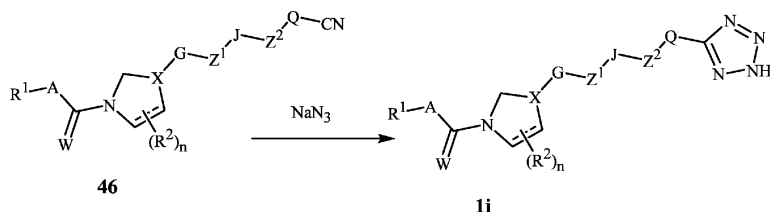
[0494]  $Y^{10}$ 은 Cl, Br, I,  $N_2^+$ ,  $OS(O)_2Ph$  또는  $OS(O)_2CF_3$ 이고;  $Z^3$ 는  $-C\equiv C-$ 이며;  $G^G$ 는  $G^A$ ,  $G^N$  또는  $G^P$ 이다.

[0495] 다수의 촉매가 이러한 형태의 변환에 유용하며; 전형적인 촉매는 트리스(다이벤질리덴아세톤)다이팔라듐이다.

적절한 용매로는 N,N-다이메틸포름아미드 및 아세트니트릴을 들 수 있다. 핵 반응의 검토에 관해서는 예를 들어, 문헌 [W. Cabri and I. Candiani, Acc. Chem Res. 1995, 28, 2-7]을 참조한다.

[0496] 화학식 1i (즉, Z<sup>3</sup>가 직접 결합하고, G<sup>G</sup>가 테트라졸 환 탄소 원자를 통해 Q에 결합된 테트라졸 환인 화학식 1)의 화합물은 반응 도식 27에 나타난 바와 같이, 화학식 46의 니트릴로부터 제조될 수 있다.

[0497] 반응 도식 27

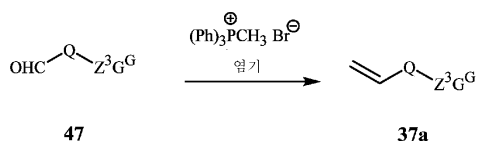


[0498]

[0499] 화학식 46의 니트릴은 용매, 예컨대 N,N-다이메틸포름아미드 또는 톨루엔 중에서 실온 내지 140℃의 온도에서 아자이드, 예컨대 아자이드화나트륨 또는 트라이메틸실릴 아자이드와 반응하여, 화학식 1i의 화합물을 생성한다. 주요 참조 문헌에 관해서는 예를 들어, 문헌 [B. Schmidt, D. Meid and D. Kieser, Tetrahedron 2006, 63, 492-496]을 참조한다.

[0500] 화학식 47의 알데히드는 반응 도식 28에 나타난 바와 같이, 공지된 비티히 (Wittig; 본 방법은 실시예 1, 단계 E에 예증된다) 또는 테베 (Tebbe) 올레핀화 반응을 이용하여, 화학식 37a의 올레핀을 제조하는데 사용될 수 있다.

[0501] 반응 도식 28



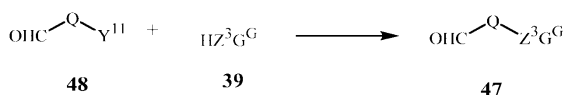
[0502]

[0503] G<sup>G</sup>는 G<sup>A</sup>, G<sup>N</sup> 또는 G<sup>P</sup>이다.

[0504] 비티히 반응에서, 메틸트라이페닐포스포늄 할라이드, 예컨대 메틸트라이페닐포스포늄 브로마이드는 염기, 예컨대 t-BuOK와 반응한다. 테트라하이드로푸란은 이 반응에서 적절한 용매이다. 비티히 반응에 대한 추가의 주요 참조 문헌에 관해서는 예를 들어, 문헌 [A. Maercker Org. React. 1965, 14, 270-490]을 참조하며; 테베 반응에 관해서는 예를 들어, 문헌 [H. Pommer, Angew. Chem. Int. Ed. Engl. 1977, 16, 423-429 및 S. H. Pine, Org. React. 1993, 43 1-91]을 참조한다. 이 반응은 실시예 2, 단계 C에 예증된다. 화학식 37a의 올레핀은 반응 도식 20에 나타난 반응에 대한 출발 물질이다.

[0505] 반응 도식 21에 기재된 것과 유사한 반응은 또한 커플링 전에 중간체에 대하여 행해질 수 있으며, 예를 들어 반응 도식 29의 화학식 48의 알데히드는 화학식 47의 알데히드를 제조하기 위한 유용한 출발 물질이다.

[0506] 반응 도식 29



[0507]

[0508] Y<sup>11</sup>은 F, Cl, Br, I이고; Z<sup>3</sup>는 O, S 또는 NH이며; G<sup>G</sup>는 G<sup>A</sup>, G<sup>N</sup> 또는 G<sup>P</sup>이다.

[0509] 반응 도식 21에 기재된 것과 유사한 시약 및 반응 조건을 이용하는 반응 도식 29의 방법에 의해, 예를 들어 Z<sup>3</sup>가 산소인 경우에 대응하는 다이아릴에테르가 얻어진다 (예를 들어, 2-페녹시벤즈알데히드는 2-요오도벤즈알데히드 및 페놀을 출발 물질로 하여 얻어진다). 다수의 화학식 48의 알데히드 출발 물질은 예를 들어, 플루오로벤즈알데히드, 클로로벤즈알데히드, 브로모벤즈알데히드 및 요오도벤즈알데히드의 오르토, 메타 및 파라 이성질체로 시판 중이다.

- [0510] 유사하게는, 반응 도식 22 내지 27에 기재된 것과 유사한 방법은 또한 화학식 47의 알데히드를 제조하는데 사용될 수 있으며, 예를 들어, 2-(페닐티오)벤즈알데히드에 관해서는 문헌 [W. Mansawat, et. al. Tetrahedron Letters 2007, 48(24), 4235-4238]을; 2-(2-페닐에테닐)벤즈알데히드에 관해서는 문헌 [A. Cwik, Z. Hell, F. Figueras, Advanced Synthesis & Catalysis 2006, 348(4/5), 523-530]을; 2-(페닐에티닐)벤즈알데히드에 관해서는 문헌 [T. Sakamoto, Y. Kondo, N. Miura, K. Hayashi, H. Yamanaka, Heterocycles 1986, 24(8), 2311-14]을; 2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)벤즈알데히드에 관해서는 문헌 [J. Rosevear, J. F. K. Wilshire, John F. K. Australian Journal of Chemistry 1991, 44(8), 1097-114]을 참조한다.
- [0511] 2-페닐벤즈알데히드, 2-페녹시벤즈알데히드 2-(푸란-2-일)벤즈알데히드, 2-(티엔-2-일)벤즈알데히드, 2-(이미다졸-1-일)벤즈알데히드 및 2-(티아졸-2-일)벤즈알데히드를 비롯하여, 다수의 화학식 47의 알데히드가 또한 시판 중이다.
- [0512] 화학식 1 및 1A의 화합물을 제조하기 위해 상술한 일부의 시약 및 반응 조건이 중간체에 존재하는 특정한 작용기에 적합하지 않을 수 있는 것으로 인지되어 있다. 이러한 경우에, 합성에 보호/탈보호 시퀀스 또는 작용기 상호 변환을 포함시키는 것이 원하는 생성물을 얻는데 도움이 될 것이다. 보호기의 사용 및 선택은 화학 합성에서의 당업자에게 자명할 것이다 (예를 들어, 문헌 [T. W. Greene and P. G. M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991]을 참조함). 당업자는 경우에 따라서는, 각각의 반응 도식에 나타난 바와 같이, 화학식 1 및 1A의 화합물의 합성을 완료하기 위해, 소정 시약의 도입 후에, 상세히 기재되어 있지 않은 추가의 통상적인 합성 단계를 행할 필요가 있음을 인지할 것이다. 당업자는 또한 화학식 1 및 1A의 화합물을 제조하기 위해 제시된 특정 시퀀스로 나타난 것과는 다른 순서로 상기 반응 도식에 예시된 단계의 조합을 행할 필요가 있음을 인지할 것이다.
- [0513] 당업자는 또한 치환기를 추가하거나 기존의 치환기를 변경하기 위해, 화학식 1 및 1A의 화합물 및 본 명세서에 기재된 중간체에 대하여 다양한 친전자성, 친핵성, 라디칼, 유기 금속, 산화, 및 환원 반응을 행할 수 있음을 인지할 것이다.
- [0514] 더 이상 상술하지 않고도, 상술한 설명을 이용하는 당업자라면 본 발명을 최대한으로 이용할 수 있을 것으로 여겨진다. 그러므로, 하기 실시예는 단순히 예시적인 것으로 그리고 어떠한 임의의 방식으로든 본 개시 내용을 한정하지 않는 것으로 해석되어야 한다. 하기 실시예에서의 단계들은 전체적인 합성 변환에서 각각의 단계에 있어서의 절차를 예시하며, 각각의 단계에 있어서의 출발 물질은 그 절차가 다른 실시예 또는 단계에 설명된 특정한 예비 실행에 의해 반드시 제조된 것은 아닐 수도 있다. 크로마토그래피 용매 혼합물 또는 달리 나타내는 경우를 제외하고는 백분율은 중량 기준이다. 달리 명시되지 않는 한, 크로마토그래피 용매 혼합물에 대한 부 및 백분율은 체적 기준이다. <sup>1</sup>H NMR 스펙트럼은 테트라메틸실란으로부터의 다운필드 (ppm)로 나타내며; "s"는 싱글렛을 의미하고, "d"는 더블렛을 의미하며, "t"는 트라이플렛을 의미하고, "m"은 멀티플렛을 의미하며, "q"는 콰르텟을 의미하고, "dd"는 더블렛 오브 더블렛 (doublet of doublet)을 의미하며, "br s"는 브로드 싱글렛을 의미하고, "br d"는 브로드 더블렛을 의미하며, "br t"는 브로드 트라이플렛을 의미하고, "br m"은 브로드 멀티플렛을 의미한다.
- [0515] 실시예 1
- [0516] 1-[4-[4-[4,5-다이하이드로-5-[3-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)페닐]-3-아이속사졸릴]-2-티아졸릴]-1-피페리딘]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에탄온 (화합물 1)의 제법
- [0517] 단계 A: 1-(2-클로로아세틸)-4-피페리딘카르보니트릴의 제법
- [0518] 4-피페리딘카르보니트릴 (200 g, 1.80 mol)과, 다이클로로메탄 (1 L) 중의 40 % 탄산칼륨 수용액 (342 g, 0.99 mol)의 혼합물을 -10℃로 냉각시켜, 반응 혼합물을 -10 내지 0℃로 유지하면서 다이클로로메탄 (300 mL) 중의 클로로아세틸 클로라이드 (210 g, 1.86 mol)의 용액을 약 75 분간에 걸쳐서 첨가하였다. 첨가 완료 후에, 반응 혼합물을 분리하여, 상부 수상을 다이클로로메탄 (2 x 300 mL)으로 추출하고, 합한 유기상을 감압하에 농축시켜, 정치 시에 서서히 결정화되는 액체로서의 표제 화합물을 312 g 얻었다. 이 화합물은 후속 반응에서 사용하기에 충분한 순도의 것이었다.
- [0519] <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.8-2.1 (m, 4H), 2.95 (m, 1H), 3.5-3.8 (m, 4H), 4.08 (q, 2H).
- [0520] 단계 A1: 1-(2-클로로아세틸)-4-피페리딘카르보니트릴의 대체 제법

- [0521] 다이클로로메탄 (1 L) 중의 N-(1,1-다이메틸에틸)-4-피페리딘카르복스아미드 (201 g, 1.0 mol)의 용액을 질소하에 -5℃로 냉각시켜, 반응 혼합물을 0 내지 5℃로 유지하면서, 다이클로로메탄 300 mL 중의 클로로아세틸 클로라이드 (124 g, 1.1 mol)를 30 분간에 걸쳐서 적가하였다. 그 다음에, 반응 혼합물을 0 내지 5℃로 유지하면서 20 % 탄산칼륨 수용액 (450 g, 0.65 mol)을 30 분간에 걸쳐서 적가하였다. 반응 혼합물을 0℃에서 추가의 30 분간 교반한 다음에, 실온으로 가온시켰다. 층을 분리하여, 수층을 다이클로로메탄 (200 mL)으로 추출하였다. 합한 다이클로로메탄 층을 감압하에 농축시켜, 고체를 얻어, 헥산 400 mL로 트리튜레이션 (trituration)하였다. 슬러리를 여과하여, 필터 케이크를 헥산 100 mL로 세정하고, 50℃에서 하룻밤 동안 진공 오븐에서 건조시켜, 140.5 내지 141.5℃에서 용융하는 고체로서의 1-(2-클로로아세틸)-N-(1,1-다이메틸에틸)-4-피페리딘카르복스아미드를 185.5 g 얻었다.
- [0522]  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.35 (s, 9H), 1.6-2.0 (m, 4H), 2.25 (m, 1H), 2.8 (t, 1H), 3.2 (t, 1H), 3.9 (d, 1H), 4.07 (s, 2H), 4.5 (d, 1H), 5.3 (br s, 1H).
- [0523] N,N-다이메틸포름아미드 (35 mL) 중의 1-(2-클로로아세틸)-N-(1,1-다이메틸에틸)-4-피페리딘카르복스아미드 (26.1 g, 0.10 mol)의 용액에, 반응 혼합물의 온도를 37℃로 증가시키면서 옥시염화인 (18.8 g, 0.123 mol)을 30 분간에 걸쳐서 적가하였다. 반응 혼합물을 55℃로 1 시간 동안 가열한 다음에, 약 10℃의 온도를 유지하도록 얼음으로 냉각된 물 (약 150 g)에 서서히 첨가하였다. 반응 혼합물의 pH를 50 % NaOH 수용액으로 5.5로 조절하였다. 혼합물을 다이클로로메탄 (4 x 100 mL)으로 추출하여, 합한 추출물을 감압하에 농축시켜, 고체로서의 표제 화합물을 18.1 g 얻었다. 이 화합물은 후속 반응에서 사용하기에 충분한 순도의 것이었다.
- [0524] 단계 B: 1-[2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸]-4-피페리딘카르보니트릴의 제법
- [0525] N,N-다이메틸포름아미드 (25 mL) 중의 3-메틸-5-트라이플루오로메틸피라졸 (9.3 g, 62 mmol) 및 45 % 수산화칼륨 수용액 (7.79 g, 62 mmol)의 용액을 5℃로 냉각시켜, 1-(2-클로로아세틸)-4-피페리딘카르보니트릴 (즉, 실시예 1, 단계 A 또는 A1의 생성물) (11.2 g, 60 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 5 내지 10℃에서 8 시간 동안 교반한 다음에, 물 (100 mL)로 희석시켜, 여과시켰다. 필터 케이크를 수세하여, 50℃에서 진공 오븐에서 건조시켜, 이의 위치 이성질체, 즉, 1-[2-[3-메틸-5-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸]-4-피페리딘카르보니트릴을 3 % 함유하는 고체로서의 표제 화합물을 15 g 얻었다.
- [0526]  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.88 (m, 4H), 2.32 (s, 3H), 2.95 (m, 1H), 3.7 (m, 4H), 5.0 (q, 2H), 6.34 (s, 1H).
- [0527] 단계 C: 1-[2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸]-4-피페리딘카르보티오아미드의 제법
- [0528] 50℃에서 드라이 아이스 냉각기를 갖춘 플라스크의 N,N-다이메틸포름아미드 (15 mL) 중의 1-[2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸]-4-피페리딘카르보니트릴 (즉, 실시예 1, 단계 B의 생성물) (9.0 g, 30 mmol) 및 다이에탄올아민 (3.15 g, 30 mmol)의 용액에 황화수소 가스를 주입하였다. 콜드 핑거 (cold-finger) 상의 응축으로 나타난 바와 같이, 반응 혼합물이 황화수소로 포화되면 황화수소 공급을 중지하였다. 반응 혼합물을 50℃에서 추가로 30 분간 교반하였다. 그 다음에, 과량의 황화수소 가스를 표면하 질소 유동에 의해 스크리버에 살포하며, 물 (70 mL)을 서서히 첨가하였다. 반응 혼합물을 5℃로 냉각시키고, 여과하여, 물 (2 x 30 mL)로 세정하였다. 필터 케이크를 50℃에서 진공 오븐에서 건조시켜, 185 내지 186℃에서 용융하는 고체로서의 표제 화합물을 8.0 g 얻었다.
- [0529]  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.7 (m, 2H), 2.0 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.65 (t, 1H), 3.0 (m, 1H), 3.2 (t, 1H), 4.0 (d, 1H), 4.6 (d, 1H), 4.96 (d, 1H), 5.4 (d, 1H), 6.35 (s, 1H), 7.4 (br s, 1H), 7.5 (br s, 1H).
- [0530] 단계 D: 3-클로로-N-하이드록시-2-옥소-프로판이미도일 클로라이드의 제법
- [0531] 15℃에서 다이에틸 에테르 (400 mL) 중의 염화수소 2 M 용액 중의 1,3-다이클로로아세톤 (100 g, 0.79 mol)의 용액에, t-부틸 나이트라이트 (55 g, 0.534 mol)를 10 분간에 걸쳐서 첨가하였다. 반응 진행을  $^1\text{H}$  NMR로 모니터링하여, 비스-니트로소화 부산물 3 % 이하를 갖는 ~85 % 전환율을 얻었다. 반응 혼합물을 감압하에 농축시켜, 반고체를 얻은 다음에, 클로로부탄으로 철저히 린스하였다. 얻어진 고체를 여과하에 수집하여, 백색 고체로서의 표제 화합물을 77 g 얻었다. 여과액을 추가로 감압하에 농축시켜 반고체 잔류물을 얻어, 추가의 클로로부탄으로 린스하였다. 얻어진 고체를 여과하에 수집하여, 백색 고체로서의 표제 화합물을 추가로 15 g 얻었다.



- [0532]  $^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  4.96 (s, 2H), 13.76 (s, 1H).
- [0533] 단계 E: 1-에테닐-3-요오도벤젠의 제법
- [0534] 테트라하이드로푸란 (50 mL) 중의 3-요오도벤즈알데히드 (2.0 g, 8.6 mmol) 및 메틸트라이페닐포스포늄 브로마이드 (4.62 g, 12.9 mmol)의 혼합물을 0°C로 냉각시켜, 테트라하이드로푸란 (20 mL) 중의 칼륨 *tert*-부톡사이드 (1.45 g, 12.9 mmol)의 용액을 0°C에서 1 시간에 걸쳐서 적가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 헥산을 사용하여 셀라이트 (Celite)<sup>®</sup> 규조토 여과 조제를 통해 여과시키고, 다르코 (DARCO)<sup>®</sup> 활성탄으로 처리하여, 다시 여과시켰다. 얻어진 오일을 용리제로서 100 % 헥산 내지 헥산 중의 10 % 아세트산에틸을 사용하여 실리카 겔 상에서 칼럼 크로마토그래피로 정제하여, 황색 오일로서의 표제 화합물을 1.82 g 얻었다.
- [0535]  $^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  5.28 (d, 1H), 5.74 (d, 1H), 6.60 (dd, 1H), 7.05 (t, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.56-7.59 (m, 1H), 7.74-7.77 (m, 1H).
- [0536] 단계 F: 2-클로로-1-[4,5-다이하이드로-5-(3-요오도페닐)-3-아이속사졸릴]에탄온의 제법
- [0537] 아세트니트릴 (32 mL) 중의 1-에테닐-3-요오도벤젠 (즉, 실시예 1, 단계 E의 생성물) (1.82 g, 7.9 mmol) 및 3-클로로-N-하이드록시-2-옥소-프로판이미도일 클로라이드 (즉, 실시예 1, 단계 D의 생성물) (1.23 g, 7.9 mmol)의 용액에, 중탄산나트륨 (1.99 g, 23.7 mmol)을 첨가하여, 반응 혼합물을 실온에서 12 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 농축시켜, 물에 용해시키고, 다이클로로메탄으로 추출하여, 켐일루트 (ChemElute)<sup>®</sup> 규조토계 액체-액체 교환 카트리지를 통해 여과시키고, 농축시켜, 황색 오일로서의 표제 화합물을 2.38 g 얻었다.
- [0538]  $^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  3.17 (dd, 1H), 3.62 (dd, 1H), 4.72 (s, 2H), 5.74 (dd, 1H), 7.13 (t, 1H), 7.24-7.28 (m, 1H), 7.63-7.72 (m, 2H).
- [0539] 단계 G: 1-[4-[4-[4,5-다이하이드로-5-(3-요오도페닐)-3-아이속사졸릴]-2-티아졸릴]-1-피페리딘릴]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에탄온의 제법
- [0540] 아세톤 (50 mL) 중의 2-클로로-1-[4,5-다이하이드로-5-(3-요오도페닐)-3-아이속사졸릴]에탄온 (즉, 실시예 1, 단계 F의 생성물) (2.38 g, 7.8 mmol) 및 테트라부틸암모늄 브로마이드 (238 mg, 0.74 mmol)의 혼합물에, 1-[2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸]-4-피페리딘카르보티오아미드 (즉, 실시예 1, 단계 C의 생성물) (2.56 g, 7.7 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 12 시간 동안 환류시켰다. 냉각 후에, 반응 혼합물을 농축시킨 다음에, 물에 용해시켰다. pH를 포화 중탄산나트륨으로 8로 조절하고, 1.5 mL 클로록스 (Clorox)<sup>®</sup> 차아염소산나트륨 표백제를 첨가하여, 혼합물을 아세트산에틸로 2회 추출하였다. 합한 유기 추출물을 염수로 세정하고, 황산마그네슘으로 건조시켜, 다르코<sup>®</sup>로 처리하고, 셀라이트<sup>®</sup> 규조토 여과 조제를 통해 여과시켜, 농축시켰다. 얻어진 오일을 용리제로서 헥산 중의 20 % 아세트산에틸 내지 헥산 중의 50 % 아세톤을 사용하여 실리카 겔 상에서 칼럼 크로마토그래피로 정제하여, 담황색 고체 폼 (foam)으로서의 표제 화합물을 2.76 g 얻었다.
- [0541]  $^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.70-1.85 (m, 2H), 2.20 (br t, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.90 (t, 1H), 3.25-3.45 (m, 4H), 3.85 (dd, 1H), 4.05 (d, 1H), 4.58 (d, 1H), 4.95-5.05 (m, 2H), 5.70 (dd, 1H), 7.11 (t, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.60-7.70 (m, 2H) 7.75 (s, 1H).
- [0542] 단계 H: 1-[4-[4-[4,5-다이하이드로-5-[3-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)페닐]-3-아이속사졸릴]-2-티아졸릴]-1-피페리딘릴]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에탄온의 제법
- [0543] 나트륨 1,2,4-트리아졸 (63.0 mg, 0.69 mmol)을, 다이메틸설폭사이드 및 물의 80:20 용액 2 mL 중의 1-[4-[4-[4,5-다이하이드로-5-(3-요오도페닐)-3-아이속사졸릴]-2-티아졸릴]-1-피페리딘릴]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에탄온 (즉, 실시예 1, 단계 G의 생성물) (217 mg, 0.34 mmol), (+)-나트륨 L-아스코르베이트 (3.4 mg, 0.017 mmol), 요오드화구리 (6.6 mg, 0.034 mmol) 및 (1R,2R)-N,N-다이메틸-1,2-사이클로헥센다이아민 (7.3 mg, 0.051 mmol)의 혼합물에 첨가하였다. 반응 혼합물을 60°C로 20 시간 동안 가열한 다음에, 100°C에서 24 시간 동안 가열하였다. 냉각 후에, 반응 혼합물을 물로 희석하여, 아세트산에틸로 2회 추출

하였다. 합한 유기 추출물을 5회 수세한 다음에, 염수로 세정하여, 황산마그네슘으로 건조시키고, 여과시켜, 농축시켰다. 얻어진 오일을 용리제로서 헥산 중의 75 % 아세트산에틸을 사용하여 실리카 겔 상에서 칼럼 크로마토그래피로 정제하여, 83 내지 85℃에서 용융하는 담황색 고체 품으로서의 표제 화합물, 본 발명의 화합물을 49 mg 얻었다.

[0544]  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.68–1.89 (m, 2H), 2.19 (br t, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.83–2.94 (m, 1H), 3.25–3.36 (m, 2H), 3.46 (dd, 1H), 3.94 (dd, 1H), 4.05 (d 1H), 4.57 (d, 1H), 4.91–5.05 (m, 2H), 5.84 (dd, 1H), 6.33 (s, 1H), 7.42–7.46 (m, 1H), 7.53 (t, 1H), 7.62–7.67 (m, 2H), 7.73–7.76 (m, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.59 (s, 1H).

[0545] 실시예 2

[0546] 4-[4-(5-[1,1'-바이페닐]-2-일-4,5-다이하이드로-3-아이속사졸릴)-2-티아졸릴]-N-(2,5-다이메틸페닐)-1-피페리딘카르복스아미드 (화합물 17)의 제법

[0547] 단계 A: 4-시아노-N-(2,5-다이메틸페닐)-1-피페리딘카르복스아미드의 제법

[0548] 다이에틸 에테르 (350 mL) 중의 4-시아노피페리딘 (11.0 g, 100 mmol)의 용액을 빙수욕으로 0℃로 냉각시켰다. 다이에틸 에테르 (50 mL) 중의 2-아이소시아나토-1,4-다이메틸벤젠 (14.7 g, 100 mmol)의 용액을 30 분간에 걸쳐서 반응 혼합물에 첨가하여, 조직이 치밀한 (thick) 침전물을 얻었다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시키고, 얻어진 고체를 여과시켜, 다이에틸 에테르로 세정하고, 공기 건조시켜, 187 내지 190℃에서 용융하는 백색 분말로서의 표제 화합물을 25.3 g 얻었다.

[0549]  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  1.95 (m, 4H), 2.19 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.90 (m, 1H), 3.45 (m, 2H), 3.70 (m, 2H), 6.10 (br s, 1H), 6.85 (m, 1H), 7.04 (m, 1H), 7.37 (m, 1H).

[0550] 단계 B: 4-(아미노티옥소메틸)-N-(2,5-다이메틸페닐)-1-피페리딘-카르복스아미드의 제법

[0551] N,N-다이메틸포름아미드 (50 mL) 중의 4-시아노-N-(2,5-다이메틸페닐)-1-피페리딘카르복스아미드 (즉, 실시예 2, 단계 A의 생성물) (12.75 g, 49.6 mmol), 수황화나트륨 수화물 (11.1 g, 150 mmol) 및 다이에틸아민 하이드로클로라이드 (10.9 g, 100 mmol)의 혼합물을 실온에서 3 일간 교반하였다. 얻어진 걸쭉한 녹색 현탁액을 빙수 (600 mL)에 적가하였다. 얻어진 고체를 여과하여, 수세하고, 공기 건조시켜, 155 내지 156℃에서 분해하는 황갈색 고체로서의 표제 화합물을 12.5 g 얻었다.

[0552]  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ ):  $\delta$  1.67 (m, 4H), 2.10 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 2.75 (m, 3H), 4.15 (m, 2H), 6.85 (m, 1H), 7.0 (m, 1H), 7.05 (m, 1H), 7.95 (br s, 1H), 9.15 (br s, 1H), 9.22 (br s, 1H).

[0553] 단계 C: 2-에테닐-1,1'-바이페닐의 제법

[0554] 테트라하이드로푸란 (40 mL) 중의 [1,1'-바이페닐]-2-카르복스알데히드 (2.00 g, 11.0 mmol) 및 메틸트라이페닐포스포늄 브로마이드 (5.88 g, 16.5 mmol)의 혼합물을 0℃로 냉각시켜, 테트라하이드로푸란 (20 mL) 중의 칼륨 tert-부톡사이드 (1.85 g, 16.5 mmol)의 용액을 0℃에서 1 시간에 걸쳐서 적가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12 시간 동안 교반한 다음에, 헥산으로 셀라이트® 규조토 여과 조제를 통해 여과하여, 감압하에 농축시켰다. 얻어진 오일을 헥산으로 처리하여, 다시 여과시키고, 감압하에 농축시켜, 용리제로서 100% 헥산 내지 헥산 중의 10% 아세트산에틸을 사용하여 실리카 겔 상에서 칼럼 크로마토그래피로 정제하여, 무색 오일로서의 표제 화합물을 1.69 g 얻었다.

[0555]  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  5.18 (dd, 1H), 5.70 (dd, 1H), 6.71 (dd, 1H), 7.27–7.44 (m, 8H), 7.62–7.66 (m, 1H).

[0556] 단계 D: 1-(5-[1,1'-바이페닐]-2-일-4,5-다이하이드로-3-아이속사졸릴)-2-클로로에탄올의 제법

[0557] 아세트니트릴 (13 mL) 중의 2-에테닐-1,1'-바이페닐 (즉, 실시예 2, 단계 C의 생성물) (750 mg, 4.17 mmol) 및 3-클로로-N-하이드록시-2-옥소-프로판이미도일 클로라이드 (즉, 실시예 1, 단계 D의 생성물) (646 mg, 4.17 mmol)의 용액에, 중탄산나트륨 (1.05 g, 12.5 mmol)을 첨가하여, 반응 혼합물을 실온에서 2 일간 교반하였다. 반응 혼합물을 감압하에 농축시켰다. 얻어진 잔류물을 아세트산에틸에 용해시키고, 물 2 mL를 첨가하여, 캠일 루트® 규조토계 액체-액체 교환 카트리지를 통해 아세트산에틸로 용리하여, 농축시켜, 무색 오일로서의 표제

화합물을 630 mg 얻었다.

[0558]  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.14 (dd, 1H), 3.37 (dd, 1H), 4.63-4.73 (m, 2H), 5.79 (dd, 1H), 7.26-7.46 (m, 9H).

[0559] 단계 E: 4-[4-(5-[1,1'-바이페닐]-2-일-4,5-다이하이드로-3-아이속사졸릴)-2-티아졸릴]-N-(2,5-다이메틸페닐)-1-피페리딘카르복스아미드의 제법

[0560] 아세트니트릴 (5 mL) 중의 1-(5-[1,1'-바이페닐]-2-일-4,5-다이하이드로-3-아이속사졸릴)-2-클로로에탄온 (즉, 실시예 2, 단계 D의 생성물) (200 mg, 0.67 mmol) 및 4-(아미노티옥소메틸)-N-(2,5-다이메틸페닐)-1-피페리딘카르복스아미드 (즉, 실시예 2, 단계 B의 생성물) (195 mg, 0.67 mmol)의 혼합물에, 브롬화나트륨 (103 mg, 1.00 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 하룻밤 동안 환류시킨 다음에, 감압하에 농축시켰다. 조제의 잔류물을 물 및 중탄산나트륨 (56 mg, 0.67 mmol)에 첨가한 다음에, 아세트산에틸로 3회 추출하였다. 합한 유기 추출물을 염수로 세정하여, 황산마그네슘으로 건조시켜, 감압하에 농축시켰다. 얻어진 오일을 용리제로서 헥산 중의 20 % 아세트산에틸 내지 100% 아세트산에틸을 사용하여 실리카 겔 상에서 칼럼 크로마토그래피로 정제하여, 77 내지 79°C에서 용융하는 고체 백색 품으로서의 표제 화합물, 본 발명의 화합물을 139 mg 얻었다.

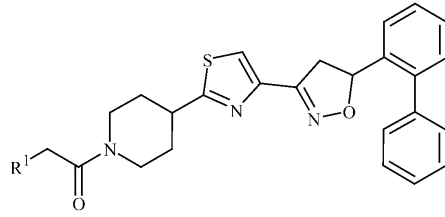
[0561]  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.77-1.89 (m, 2H), 2.12-2.21 (m, 5H), 2.29 (s, 3H), 3.00-3.09 (m, 2H), 3.20-3.29 (m, 1H), 3.36 (dd, 1H), 3.60 (dd 1H), 4.11-4.18 (m, 2H), 5.74 (dd, 1H), 6.24 (br s, 1H), 6.82 (d 1H), 7.03 (d, 1H), 7.24-7.47 (m, 9H), 7.57 (s, 1H), 7.60 (dd, 1H).

[0562] 당업계에 공지된 방법과 함께 본 명세서에 기재된 절차에 의해, 표 1 내지 15의 하기 화합물이 제조될 수 있다. 하기 약어가 하기 표에 사용된다: t는 삼차를 의미하고, s는 이차를 의미하며, n은 노르말을 의미하고, i 는 아이소를 의미하며, c는 사이클로를 의미하고, Ac는 아세틸을 의미하며, Me는 메틸을 의미하고, Et는 에틸을 의미하고, Pr은 프로필 (즉, n-프로필)을 의미하고, i-Pr은 아이소프로필을 의미하며, c-Pr은 사이클로프로필을 의미하고, Bu는 부틸을 의미하며, Pen은 펜틸을 의미하고, Hex는 헥실을 의미하며, Am은 아밀을 의미하고, CN은 시아노를 의미하며,  $\text{SO}_2$ 는 설폰일 ( $\text{S}(=\text{O})_2$ )을 의미한다. 대시 (-)는 치환기가 없음을 의미한다.

[0563] 본 발명은 하기 예시적인 종류를 포함하나, 이들에 한정되지 않는다.



[0564] [표 1]



R <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>
페닐	3-에틸페닐
2-메틸페닐	3-프로필페닐
2-메톡시페닐	3-아이소프로필페닐
2-클로로페닐	3-(트라이플루오로메틸)페닐
2-브로모페닐	3-(2,2,2-트라이플루오로에틸)페닐
2-에틸페닐	3-(펜타플루오로에틸)페닐
2-에톡시페닐	3-시아노페닐
2-(메틸티오)페닐	3-니트로페닐
2-(에틸티오)페닐	2,5-다이클로로페닐
2-(트라이플루오로메톡시)페닐	5-브로모-2-클로로페닐
3-클로로페닐	2-클로로-5-요오도페닐
3-브로모페닐	2-클로로-5-메틸페닐
3-요오도페닐	2-클로로-5-에틸페닐
3-메틸페닐	2-클로로-5-프로필페닐
2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페닐	2-클로로-5-아이소프로필페닐
2-클로로-5-(2,2,2-트라이플루오로에틸)페닐	5-에틸-2-메톡시페닐
2-클로로-5-(펜타플루오로에틸)페닐	2-메톡시-5-프로필페닐
2-클로로-5-시아노페닐	5-아이소프로필-2-메톡시페닐
2-클로로-5-니트로페닐	2-메톡시-5-(트라이플루오로메틸)페닐
2-브로모-5-클로로페닐	2-메톡시-5-(2,2,2-트라이플루오로에틸)페닐
2,5-다이브로모페닐	2-메톡시-5-(펜타플루오로에틸)페닐
2-브로모-5-요오도페닐	5-시아노-2-메톡시페닐
2-브로모-5-메틸페닐	2-메톡시-5-니트로페닐
2-브로모-5-에틸페닐	5-클로로-2-에틸페닐
2-브로모-5-프로필페닐	5-브로모-2-에틸페닐
2-브로모-5-아이소프로필페닐	2-에틸-5-요오도페닐
2-브로모-5-(트라이플루오로메틸)페닐	2-에틸-5-메틸페닐

[0565]

R <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>
2-브로모-5-(2,2,2-트라이플루오로에틸)페닐	2,5-다이에틸페닐
2-브로모-5-(펜타플루오로에틸)페닐	2-에틸-5-프로필페닐
2-브로모-5-시아노페닐	2-에틸-5-아이소프로필페닐
2-브로모-5-니트로페닐	2-에틸-5-(트라이플루오로메틸)페닐
5-클로로-2-메틸페닐	2-에틸-5-(2,2,2-트라이플루오로에틸)페닐
5-브로모-2-메틸페닐	2-에틸-5-(펜타플루오로에틸)페닐
5-요오도-2-메틸페닐	5-시아노-2-에틸페닐
2,5-다이메틸페닐	2-에틸-5-니트로페닐
5-에틸-2-메틸페닐	3-메틸피라졸-1-일
2-메틸-5-프로필페닐	3-클로로피라졸-1-일
5-아이소프로필-2-메틸페닐	3-브로모피라졸-1-일
2-메틸-5-(트라이플루오로메틸)페닐	3-요오도피라졸-1-일
2-메틸-5-(2,2,2-트라이플루오로에틸)페닐	3-에틸피라졸-1-일
2-메틸-5-(펜타플루오로에틸)페닐	3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
5-시아노-2-메틸페닐	3-(2,2,2-트라이플루오로에틸)피라졸-1-일
2-메틸-5-니트로페닐	3-(펜타플루오로에틸)피라졸-1-일
5-클로로-2-메톡시페닐	3-시아노피라졸-1-일
5-브로모-2-메톡시페닐	3-니트로피라졸-1-일
5-요오도-2-메톡시페닐	3,5-다이메틸피라졸-1-일
2-메톡시-5-메틸페닐	3-클로로-5-메틸피라졸-1-일
3-요오도-5-메틸피라졸-1-일	3-브로모-5-메틸피라졸-1-일
3-에틸-5-메틸피라졸-1-일	5-메톡시-3-메틸피라졸-1-일
5-메틸-3-프로필피라졸-1-일	3-클로로-5-메톡시피라졸-1-일
3-아이소프로필-5-메틸피라졸-1-일	5-에틸-3-메틸피라졸-1-일
5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일	3-클로로-5-에틸피라졸-1-일
5-메틸-3-(2,2,2-트라이플루오로에틸)피라졸-1-일	3-브로모-5-에틸피라졸-1-일
5-메틸-3-(펜타플루오로에틸)피라졸-1-일	5-에틸-3-요오도피라졸-1-일
3-시아노-5-메틸피라졸-1-일	3,5-다이에틸피라졸-1-일
5-메틸-3-니트로피라졸-1-일	5-에틸-3-프로필피라졸-1-일
5-클로로-3-메틸피라졸-1-일	5-에틸-3-아이소프로필피라졸-1-일
3,5-다이클로로피라졸-1-일	5-에틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
5-클로로-3-브로모피라졸-1-일	5-에틸-3-(2,2,2-트라이플루오로에틸)피라졸-1-일
5-클로로-3-요오도피라졸-1-일	5-에틸-3-(펜타플루오로에틸)피라졸-1-일
5-클로로-3-에틸피라졸-1-일	3-시아노-5-에틸피라졸-1-일
5-클로로-3-프로필피라졸-1-일	5-에틸-3-니트로피라졸-1-일
5-클로로-3-아이소프로필피라졸-1-일	5-부틸-2-메틸페닐

[0566]

R <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>
5-클로로-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일	5-헥실-1,2-메틸페닐
5-클로로-3-(2,2,2-트라이플루오로에틸)피라졸-1-일	5-알릴-2-메틸페닐
5-클로로-3-(펜타플루오로에틸)피라졸-1-일	2-메틸-5-(4-메틸-3-펜테닐)페닐
5-클로로-3-시아노피라졸-1-일	2-메틸-5-프로파길페닐
5-클로로-3-니트로피라졸-1-일	2-메틸-5-(3-메틸프로파길)페닐
5-브로모-3-메틸피라졸-1-일	5-사이클로프로필-2-메틸페닐
5-브로모-3-클로로피라졸-1-일	5-사이클로헥실-1,2-메틸페닐
3,5-다이브로모피라졸-1-일	2-메틸-5-(펜타플루오로아이소프로필)페닐
5-브로모-3-요오도피라졸-1-일	5-(3,3-다이클로로-2-프로펜-1-일)-2-메틸페닐
5-브로모-3-에틸피라졸-1-일	2-메틸-5-(4,4,4-트라이플루오로-2-부틴-1-일)페닐
5-브로모-3-프로필피라졸-1-일	5-(2,2-다이클로로사이클로프로판-1-일)-2-메틸페닐
5-브로모-3-아이소프로필피라졸-1-일	2-메틸-5-(트라이플루오로메톡시)페닐
5-브로모-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일	2-클로로-5-(아이소부틸티오)페닐
5-브로모-3-(2,2,2-트라이플루오로에틸)피라졸-1-일	2-클로로-5-(에틸설포닐)페닐
5-브로모-3-(펜타플루오로에틸)피라졸-1-일	2-클로로-5-(트라이플루오로메틸티오)페닐
5-브로모-3-시아노피라졸-1-일	2-클로로-5-(트라이플루오로메틸설포닐)페닐
5-브로모-3-니트로피라졸-1-일	2-클로로-5-(메틸아미노)페닐
2-클로로-5-(다이메틸아미노)페닐	2-클로로-5-( <i>tert</i> -부틸아미노)페닐
2-클로로-5-(다이에틸아미노)페닐	2,5-다이메틸-3-푸릴
2-클로로-5-(사이클로프로필아미노)페닐	2,5-다이메틸-3-티에닐
3-(메톡시메틸)페닐	2,5-다이클로로-3-티에닐
2-클로로-5-(에톡시메틸)페닐	1,4-다이메틸-3-피롤릴
2-클로로-5-(하이드록시메틸)페닐	1,4-다이메틸-3-피라졸릴
2-클로로-5-(메톡시카르보닐)페닐	1,3-다이메틸-4-피라졸릴
2-클로로-5-(에틸카르보닐)페닐	2,5-다이메틸-4-옥사졸릴
2-클로로-5-(메틸카르보닐 oxy)페닐	2,5-다이메틸-4-티아졸릴
2-클로로-5-(메틸아미노카르보닐)페닐	3-브로모-4-아이소티아졸릴
2-클로로-5-(다이메틸아미노카르보닐)페닐	3-브로모-4-아이소옥사졸릴
2-메틸-5-(트라이메틸실릴)페닐	1-메틸-4-이미다졸릴
3,5-다이메틸-2-티에닐	5-(트라이플루오로메틸)-3-(1,2,4-옥사다리아졸릴)
3,5-다이클로로-2-티에닐	5-(트라이플루오로메틸)-3-(1,2,4-티아다리아졸릴)
3,5-다이메틸-2-푸릴	2-브로모-1-(1,3,4-트리아아졸릴)
1-메틸-2-피롤릴	5-(트라이플루오로메틸)-3-(1,2,4-트리아아졸릴)
4-메틸-2-(트라이플루오로메틸)-5-티아졸릴	2-브로모-1-이미다졸릴
4-(트라이플루오로메틸)-2-티아졸릴	3,6-다이메틸-2-피리딜
4-(트라이플루오로메틸)-2-옥사졸릴	2,5-다이메틸-3-피리딜

[0567]

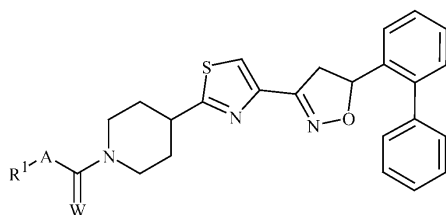
R <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>
4-메틸-2-(트라이플루오로메틸)-5-옥사졸릴	2,5-다이메틸-4-페리딜
4-브로모-5-아이소티아졸릴	3,6-다이클로로-2-페리딜
4-브로모-5-아이속사졸릴	2,5-다이클로로-3-페리딜
1-메틸-5-피라졸릴	2,5-다이클로로-4-페리딜
1-메틸-5-이미다졸릴	4-브로모-3-페리다지닐
1-메틸-4-(트라이플루오로메틸)-2-이미다졸릴	4-(트라이플루오로메틸)-2-페리미디닐
4-메틸-3-(1,3,4-트리아아졸릴)	3,6-다이메틸-2-피라지닐
2-메틸-3-(1,2,4-트리아아졸릴)	2,5-다이메틸-4-페리미디닐
5-(트라이플루오로메틸)-2-(1,3,4-티아다리아졸릴)	4-메톡시-5-페리미디닐
5-(트라이플루오로메틸)-2-(1,3,4-옥사다리아졸릴)	3,6-다이메틸-4-페리다지닐
3-(트라이플루오로메틸)-5-(1,2,4-티아다리아졸릴)	5-(트라이플루오로메틸)-3-(1,2,4-트리아아지닐)
3-(트라이플루오로메틸)-5-(1,2,4-옥사다리아졸릴)	5-메톡시-6-(1,2,4-트리아아지닐)
3-(트라이플루오로메틸)-1-(1,2,4-트리아아졸릴)	4-(트라이플루오로메틸)-2-(1,3,5-트리아아지닐)
2,5-다이메틸-1-피롤릴	3,6-다이메틸-5-(1,2,4-트리아아지닐)
1-메틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-5-일	1-메틸-4-(트라이플루오로메틸)이미다졸-2-일
3-브로모-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일	3,5-비스-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
3-요오도-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일	3-(2,2,2-트라이플루오로에틸)-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
3-에틸-5-(트라이플루오로메틸)-피라졸-1-일	3-(펜타플루오로에틸)-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
3-프로필-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일	3-시아노-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
3-아이소프로필-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일	3-니트로-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
3-메틸-5-(트라이플루오로메틸)-피라졸-1-일	3-클로로-5-(트라이플루오로메틸)-피라졸-1-일
3-메톡시-5-(트라이플루오로메틸)-피라졸-1-일	3,5-비스-(트라이클로로메틸)피라졸-1-일
5-다이플루오로메톡시-3-메틸피라졸-1-일	3-다이플루오로메톡시-5-메틸피라졸-1-일
5-다이플루오로메톡시-3-클로로피라졸-1-일	3-다이플루오로메톡시-5-클로로피라졸-1-일
3,5-다이브로모피라졸-1-일	3-다이플루오로메톡시-5-브로모피라졸-1-일
5-다이플루오로메톡시-3-요오도피라졸-1-일	3-다이플루오로메톡시-5-요오도피라졸-1-일
5-다이플루오로메톡시-3-에틸피라졸-1-일	3-다이플루오로메톡시-5-에틸피라졸-1-일
5-다이플루오로메톡시-3-프로필피라졸-1-일	3-다이플루오로메톡시-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
5-다이플루오로메톡시-3-아이소프로필피라졸-1-일	3-다이플루오로메톡시-5-(2,2,2-트라이플루오로에틸)피라졸-1-일
5-다이플루오로메톡시-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일	3-다이플루오로메톡시-5-(펜타플루오로에틸)피라졸-1-일
5-다이플루오로메톡시-3-(2,2,2-트라이플루오로에틸)피라졸-1-일	3-다이플루오로메톡시-5-시아노피라졸-1-일

[0568]

R <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>
트라이플루오로에틸)피라졸-1-일	3-다이플루오로메톡시-5-니트로피라졸-1-일
5-다이플루오로메톡시-3-(펜타플루오로에틸)피라졸-1-일	3,5-비스-(다이플루오로메톡시)피라졸-1-일
5-다이플루오로메톡시-3-시아노피라졸-1-일	5-카르보메톡시-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
5-다이플루오로메톡시-3-니트로피라졸-1-일	3,5-다이에톡시피라졸-1-일
3-카르보메톡시-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일	5-에톡시-3-메틸피라졸-1-일
5-메톡시-3-메틸피라졸-1-일	5-에톡시-3-브로모피라졸-1-일
5-메톡시-3-브로모피라졸-1-일	5-에톡시-3-요오도피라졸-1-일
5-메톡시-3-요오도피라졸-1-일	5-에톡시-3-에틸피라졸-1-일
5-메톡시-3-에틸피라졸-1-일	5-에톡시-3-프로필피라졸-1-일
5-메톡시-3-프로필피라졸-1-일	5-에톡시-3-아이소프로필피라졸-1-일
5-메톡시-3-아이소프로필피라졸-1-일	5-에톡시-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
5-메톡시-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일	5-에톡시-3-(2,2,2-트라이플루오로에틸)피라졸-1-일
5-메톡시-3-(2,2,2-트라이플루오로에틸)피라졸-1-일	5-에톡시-3-(펜타플루오로에틸)피라졸-1-일
5-메톡시-3-(펜타플루오로에틸)피라졸-1-일	5-에톡시-3-시아노피라졸-1-일
5-메톡시-3-시아노피라졸-1-일	5-에톡시-3-니트로피라졸-1-일
5-메톡시-3-니트로피라졸-1-일	

[0569]

[0570] [표 2]



A 는 NH 이고; W 는 O 이다.

R <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>
2-메톡시페닐	3,5-다이메틸피라졸-1-일
2,5-다이클로로페닐	3,5-다이클로로피라졸-1-일
5-브로모-2-클로로페닐	3,5-다이브로모피라졸-1-일
2-클로로-5-메틸페닐	5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페닐	5-클로로-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
2,5-다이브로모페닐	5-브로모-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
2-브로모-5-메틸페닐	5-에틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
2-브로모-5-(트라이플루오로메틸)페닐	3,5-비스-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
5-클로로-2-메틸페닐	3-메틸-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
5-브로모-2-메틸페닐	3-클로로-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
2,5-다이메틸페닐	3-브로모-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
5-에틸-2-메틸페닐	5-메톡시-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
2-메틸-5-(트라이플루오로메틸)페닐	5-다이플루오로메톡시-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
5-브로모-2-메톡시페닐	3,5-다이클로로트라이아졸-1-일
2-메톡시-5-메틸페닐	3,5-다이브로모트라이아졸-1-일
2-메톡시-5-(트라이플루오로메틸)페닐	

A 는 CH<sub>2</sub> 이고; W 는 S 이다.

R <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>
3-에틸-5-메틸피라졸-1-일	5-브로모-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일	3,5-다이메틸피라졸-1-일
3,5-다이클로로피라졸-1-일	5-에틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
5-클로로-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일	3,5-다이클로로트라이아졸-1-일
3,5-비스-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일	3,5-다이브로모트라이아졸-1-일
3,5-다이메틸피라졸-1-일	3-메틸-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
3,5-다이브로모피라졸-1-일	

[0571]

A 는 NH 이고; W 는 S 이다.

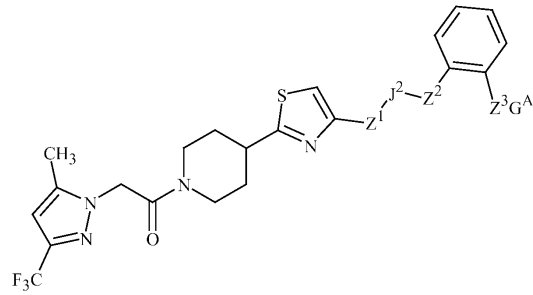
R <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>
2-메톡시페닐	5-브로모-2-메틸페닐
2,5-다이클로로페닐	2,5-다이메틸페닐
5-브로모-2-클로로페닐	5-에틸-2-메틸페닐
2-클로로-5-메틸페닐	2-메틸-5-(트라이플루오로메틸)페닐
2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페닐	5-브로모-2-메톡시페닐
2,5-다이브로모페닐	2-메톡시-5-메틸페닐
2-브로모-5-메틸페닐	2-메톡시-5-(트라이플루오로메틸)페닐
2-브로모-5-(트라이플루오로메틸)페닐	5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일
5-클로로-2-메틸페닐	

R<sup>1</sup> 은 5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; W 는 O 이다.

A	A	A	A
NCH <sub>3</sub>	NCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHCH <sub>3</sub>	CHCl
NCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NAc	CHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHOCH <sub>3</sub>

[0572]

[0573] [표 3\*]



\* 상기 마쿠쉬 구조 (Markush structure)의  $J^2$ 는 치환기 ( $Z^2Q$ )를 제외한 J-1 내지 J-82에 관한 실시 형태의 증거 3에 정의된 J기의 부분을 나타낸다. 게다가,  $J^2$ 는 J-1 내지 J-82를 기준으로 하여 하기 표에 특정되며, 이로써  $J^2$ 는 증거 3에 나타난 치환기 ( $Z^2Q$ )를 포함하지 않는 J-1 내지 J-82의 부분인 것으로 여겨진다.  $G^A$ 는 증거 5에 특정된다.

$Z^1$ 은 직접 결합이고;  $Z^2$ 는 직접 결합이며;  $Z^3$ 는 직접 결합이고; x는 0이며;  $G^A$ 는  $G^A$ -49이고; r은 0이다.

$J^2$	J-배향**	$J^2$	J-배향**	$J^2$	J-배향**
J-1	2/4	J-24	2/5	J-44	2/4
J-1	2/5	J-24	4/2	J-44	2/5
J-1	4/2	J-24	5/2	J-44	2/6
J-1	5/2	J-25	2/4	J-45	2/4
J-2	2/4	J-25	2/5	J-45	2/5
J-2	2/5	J-25	4/2	J-45	2/6
J-2	4/2	J-25	5/2	J-46	2/4
J-2	5/2	J-26	2/4	J-46	2/5
J-3	2/4	J-26	2/5	J-46	4/2
J-3	2/5	J-26	4/2	J-46	5/2
J-3	4/2	J-26	5/2	J-47	2/4
J-3	5/2	J-26	1/4	J-47	2/5
J-3	1/4	J-26	4/1	J-47	4/2
J-3	4/1	J-27	2/4	J-47	5/2
J-4	2/4	J-27	2/5	J-48	3/5
J-4	2/5	J-27	3/5	J-49	2/4
J-4	4/2	J-27	4/2	J-49	2/5
J-4	5/2	J-27	5/2	J-49	4/2
J-4	3/5	J-27	5/3	J-49	5/2

[0574]

J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**
J-4	5/3	J-28	3/5	J-50	2/6
J-5	2/4	J-28	5/3	J-51	2/6
J-5	2/5	J-29	3/5	J-52	2/6
J-5	4/2	J-29	5/3	J-53	2/3
J-5	5/2	J-30	3/5	J-54	2/3
J-5	3/5	J-30	5/3	J-55	2/3
J-5	5/3	J-30	1/3	J-56	2/3
J-6	2/4	J-30	3/1	J-57	2/4
J-6	2/5	J-30	1/4	J-58	3/4
J-6	4/2	J-30	4/1	J-59	2/4
J-6	5/2	J-31	1/3	J-60	2/4
J-6	3/5	J-31	1/4	J-61	2/4
J-6	5/3	J-31	2/4	J-62	2/4
J-6	1/3	J-31	2/5	J-63	3/4
J-6	3/1	J-31	3/5	J-64	2/3
J-7	5/3	J-31	3/1	J-65	3/4
J-7	3/5	J-31	4/1	J-66	6/7
J-8	5/3	J-31	4/2	J-67	2/3
J-8	3/5	J-31	5/2	J-68	2/3
J-9	5/3	J-32	2/4	J-69	1/3
J-9	3/5	J-32	2/5	J-69	1/4
J-9	1/4	J-32	3/5	J-70	1/3
J-9	4/1	J-32	5/3	J-71	2/4
J-10	3/5	J-32	5/2	J-71	4/2
J-10	5/3	J-32	4/2	J-72	2/4
J-11	3/5	J-33	2/4	J-72	4/2
J-11	5/3	J-33	2/5	J-73	2/4
J-12	3/5	J-33	3/5	J-73	4/2
J-12	5/3	J-33	5/3	J-73	1/3
J-12	1/3	J-33	5/2	J-73	1/4
J-12	3/1	J-33	4/2	J-73	4/1
J-13	1/4	J-34	1/3	J-74	2/4
J-13	4/1	J-34	1/4	J-74	2/5
J-14	3/5	J-34	3/5	J-74	4/2
J-14	5/3	J-34	3/1	J-74	5/2
J-15	2/5	J-34	4/1	J-74	3/5

[0575]

J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**
J-16	2/5	J-35	1/4	J-74	5/3
J-17	2/4	J-35	4/1	J-75	3/5
J-17	4/2	J-36	1/3	J-75	5/3
J-18	2/5	J-36	3/1	J-75	2/4
J-18	5/2	J-36	3/5	J-75	2/5
J-19	2/4	J-36	5/3	J-75	3/5
J-19	4/2	J-37	2/5	J-75	5/3
J-20	2/4	J-37	5/2	J-76	3/6
J-20	2/5	J-37	2/4	J-76	6/3
J-20	2/6	J-37	4/2	J-77	3/5
J-20	3/5	J-38	2/5	J-77	5/3
J-20	4/2	J-38	5/2	J-78	1/3
J-20	5/2	J-38	2/4	J-79	1/3
J-21	3/5	J-38	4/2	J-79	3/1
J-21	3/6	J-39	3/5	J-80	1/3
J-21	5/3	J-39	5/3	J-80	3/1
J-22	2/4	J-40	3/5	J-81	3/5
J-22	2/5	J-40	5/3	J-81	5/3
J-22	4/6	J-41	1/3	J-82	3/5
J-22	4/2	J-41	1/4	J-82	3/6
J-22	5/2	J-42	1/3	J-82	5/3
J-23	2/5	J-42	1/4	J-82	6/3
J-23	2/6	J-43	1/4		
J-24	2/4	J-44	1/3		

$Z^1$ 은 직접 결함이고;  $Z^2$ 는 직접 결함이며;  $Z^3$ 는 O이고; x는 0이며;  $G^A$ 는  $G^{A-49}$ 이고; r은 0이다.

J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**
J-1	2/4	J-24	2/5	J-44	2/4
J-1	2/5	J-24	4/2	J-44	2/5
J-1	4/2	J-24	5/2	J-44	2/6
J-1	5/2	J-25	2/4	J-45	2/4
J-2	2/4	J-25	2/5	J-45	2/5
J-2	2/5	J-25	4/2	J-45	2/6
J-2	4/2	J-25	5/2	J-46	2/4
J-2	5/2	J-26	2/4	J-46	2/5
J-3	2/4	J-26	2/5	J-46	4/2

[0576]



J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**
J-3	2/5	J-26	4/2	J-46	5/2
J-3	4/2	J-26	5/2	J-47	2/4
J-3	5/2	J-26	1/4	J-47	2/5
J-3	1/4	J-26	4/1	J-47	4/2
J-3	4/1	J-27	2/4	J-47	5/2
J-4	2/4	J-27	2/5	J-48	3/5
J-4	2/5	J-27	3/5	J-49	2/4
J-4	4/2	J-27	4/2	J-49	2/5
J-4	5/2	J-27	5/2	J-49	4/2
J-4	3/5	J-27	5/3	J-49	5/2
J-4	5/3	J-28	3/5	J-50	2/6
J-5	2/4	J-28	5/3	J-51	2/6
J-5	2/5	J-29	3/5	J-52	2/6
J-5	4/2	J-29	5/3	J-53	2/3
J-5	5/2	J-30	3/5	J-54	2/3
J-5	3/5	J-30	5/3	J-55	2/3
J-5	5/3	J-30	1/3	J-56	2/3
J-6	2/4	J-30	3/1	J-57	2/4
J-6	2/5	J-30	1/4	J-58	3/4
J-6	4/2	J-30	4/1	J-59	2/4
J-6	5/2	J-31	1/3	J-60	2/4
J-6	3/5	J-31	1/4	J-61	2/4
J-6	5/3	J-31	2/4	J-62	2/4
J-6	1/3	J-31	2/5	J-63	3/4
J-6	3/1	J-31	3/5	J-64	2/3
J-7	5/3	J-31	3/1	J-65	3/4
J-7	3/5	J-31	4/1	J-66	6/7
J-8	5/3	J-31	4/2	J-67	2/3
J-8	3/5	J-31	5/2	J-68	2/3
J-9	5/3	J-32	2/4	J-69	1/3
J-9	3/5	J-32	2/5	J-69	1/4
J-9	1/4	J-32	3/5	J-70	1/3
J-9	4/1	J-32	5/3	J-71	2/4
J-10	3/5	J-32	5/2	J-71	4/2
J-10	5/3	J-32	4/2	J-72	2/4
J-11	3/5	J-33	2/4	J-72	4/2

[0577]

J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**
J-11	5/3	J-33	2/5	J-73	2/4
J-12	3/5	J-33	3/5	J-73	4/2
J-12	5/3	J-33	5/3	J-73	1/3
J-12	1/3	J-33	5/2	J-73	1/4
J-12	3/1	J-33	4/2	J-73	4/1
J-13	1/4	J-34	1/3	J-74	2/4
J-13	4/1	J-34	1/4	J-74	2/5
J-14	3/5	J-34	3/5	J-74	4/2
J-14	5/3	J-34	3/1	J-74	5/2
J-15	2/5	J-34	4/1	J-74	3/5
J-16	2/5	J-35	1/4	J-74	5/3
J-17	2/4	J-35	4/1	J-75	3/5
J-17	4/2	J-36	1/3	J-75	5/3
J-18	2/5	J-36	3/1	J-75	2/4
J-18	5/2	J-36	3/5	J-75	2/5
J-19	2/4	J-36	5/3	J-75	3/5
J-19	4/2	J-37	2/5	J-75	5/3
J-20	2/4	J-37	5/2	J-76	3/6
J-20	2/5	J-37	2/4	J-76	6/3
J-20	2/6	J-37	4/2	J-77	3/5
J-20	3/5	J-38	2/5	J-77	5/3
J-20	4/2	J-38	5/2	J-78	1/3
J-20	5/2	J-38	2/4	J-79	1/3
J-21	3/5	J-38	4/2	J-79	3/1
J-21	3/6	J-39	3/5	J-80	1/3
J-21	5/3	J-39	5/3	J-80	3/1
J-22	2/4	J-40	3/5	J-81	3/5
J-22	2/5	J-40	5/3	J-81	5/3
J-22	4/6	J-41	1/3	J-82	3/5
J-22	4/2	J-41	1/4	J-82	3/6
J-22	5/2	J-42	1/3	J-82	5/3
J-23	2/5	J-42	1/4	J-82	6/3
J-23	2/6	J-43	1/4		
J-24	2/4	J-44	1/3		

Z<sup>1</sup>은 직접 결합이고; Z<sup>2</sup>는 직접 결합이며; Z<sup>3</sup>는 CH<sub>2</sub>이고; x는 0이며; G<sup>A</sup>는 G<sup>A</sup>-49이고; r은 0이다.

[0578]

J <sup>2</sup>	J-비향**	J <sup>2</sup>	J-비향**	J <sup>2</sup>	J-비향**
J-1	2/4	J-24	2/5	J-44	2/4
J-1	2/5	J-24	4/2	J-44	2/5
J-1	4/2	J-24	5/2	J-44	2/6
J-1	5/2	J-25	2/4	J-45	2/4
J-2	2/4	J-25	2/5	J-45	2/5
J-2	2/5	J-25	4/2	J-45	2/6
J-2	4/2	J-25	5/2	J-46	2/4
J-2	5/2	J-26	2/4	J-46	2/5
J-3	2/4	J-26	2/5	J-46	4/2
J-3	2/5	J-26	4/2	J-46	5/2
J-3	4/2	J-26	5/2	J-47	2/4
J-3	5/2	J-26	1/4	J-47	2/5
J-3	1/4	J-26	4/1	J-47	4/2
J-3	4/1	J-27	2/4	J-47	5/2
J-4	2/4	J-27	2/5	J-48	3/5
J-4	2/5	J-27	3/5	J-49	2/4
J-4	4/2	J-27	4/2	J-49	2/5
J-4	5/2	J-27	5/2	J-49	4/2
J-4	3/5	J-27	5/3	J-49	5/2
J-4	5/3	J-28	3/5	J-50	2/6
J-5	2/4	J-28	5/3	J-51	2/6
J-5	2/5	J-29	3/5	J-52	2/6
J-5	4/2	J-29	5/3	J-53	2/3
J-5	5/2	J-30	3/5	J-54	2/3
J-5	3/5	J-30	5/3	J-55	2/3
J-5	5/3	J-30	1/3	J-56	2/3
J-6	2/4	J-30	3/1	J-57	2/4
J-6	2/5	J-30	1/4	J-58	3/4
J-6	4/2	J-30	4/1	J-59	2/4
J-6	5/2	J-31	1/3	J-60	2/4
J-6	3/5	J-31	1/4	J-61	2/4
J-6	5/3	J-31	2/4	J-62	2/4
J-6	1/3	J-31	2/5	J-63	3/4
J-6	3/1	J-31	3/5	J-64	2/3
J-7	5/3	J-31	3/1	J-65	3/4
J-7	3/5	J-31	4/1	J-66	6/7

[0579]

J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**
J-8	5/3	J-31	4/2	J-67	2/3
J-8	3/5	J-31	5/2	J-68	2/3
J-9	5/3	J-32	2/4	J-69	1/3
J-9	3/5	J-32	2/5	J-69	1/4
J-9	1/4	J-32	3/5	J-70	1/3
J-9	4/1	J-32	5/3	J-71	2/4
J-10	3/5	J-32	5/2	J-71	4/2
J-10	5/3	J-32	4/2	J-72	2/4
J-11	3/5	J-33	2/4	J-72	4/2
J-11	5/3	J-33	2/5	J-73	2/4
J-12	3/5	J-33	3/5	J-73	4/2
J-12	5/3	J-33	5/3	J-73	1/3
J-12	1/3	J-33	5/2	J-73	1/4
J-12	3/1	J-33	4/2	J-73	4/1
J-13	1/4	J-34	1/3	J-74	2/4
J-13	4/1	J-34	1/4	J-74	2/5
J-14	3/5	J-34	3/5	J-74	4/2
J-14	5/3	J-34	3/1	J-74	5/2
J-15	2/5	J-34	4/1	J-74	3/5
J-16	2/5	J-35	1/4	J-74	5/3
J-17	2/4	J-35	4/1	J-75	3/5
J-17	4/2	J-36	1/3	J-75	5/3
J-18	2/5	J-36	3/1	J-75	2/4
J-18	5/2	J-36	3/5	J-75	2/5
J-19	2/4	J-36	5/3	J-75	3/5
J-19	4/2	J-37	2/5	J-75	5/3
J-20	2/4	J-37	5/2	J-76	3/6
J-20	2/5	J-37	2/4	J-76	6/3
J-20	2/6	J-37	4/2	J-77	3/5
J-20	3/5	J-38	2/5	J-77	5/3
J-20	4/2	J-38	5/2	J-78	1/3
J-20	5/2	J-38	2/4	J-79	1/3
J-21	3/5	J-38	4/2	J-79	3/1
J-21	3/6	J-39	3/5	J-80	1/3
J-21	5/3	J-39	5/3	J-80	3/1
J-22	2/4	J-40	3/5	J-81	3/5

[0580]

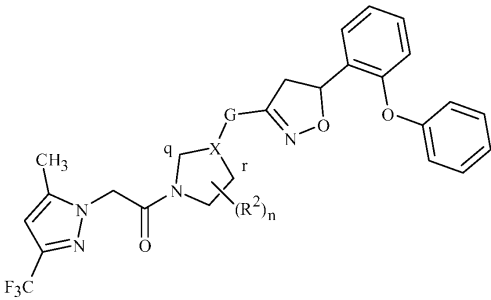
J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**	J <sup>2</sup>	J-배향**
J-22	2/5	J-40	5/3	J-81	5/3
J-22	4/6	J-41	1/3	J-82	3/5
J-22	4/2	J-41	1/4	J-82	3/6
J-22	5/2	J-42	1/3	J-82	5/3
J-23	2/5	J-42	1/4	J-82	6/3
J-23	2/6	J-43	1/4		
J-24	2/4	J-44	1/3		

\*\* J-배향은 J<sup>2</sup> (증거 3의 J 기를 기준으로 하여 특정됨) 환 상의 Z<sup>1</sup> 및 Z<sup>2</sup>에 대한 결합점을 말한다.

첫번째 번호는 Z<sup>1</sup>이 결합되는 J<sup>2</sup> (증거 3의 J 기를 기준으로 하여) 환 상의 위치를 말하며, 두번째 번호는 Z<sup>2</sup>가 결합되는 J<sup>2</sup> 환 상의 위치를 말한다.

[0581]

[0582] [표 4\*]



X는 X<sup>1</sup>이고; R<sup>3a</sup>는 H이며; R<sup>11a</sup>는 Me이고; n은 0이다.

G	G	G	G	G	G
G-1	G-11	G-21	G-31	G-41	G-51
G-2	G-12	G-22	G-32	G-42	G-52
G-3	G-13	G-23	G-33	G-43	G-53
G-4	G-14	G-24	G-34	G-44	G-54
G-5	G-15	G-25	G-35	G-45	G-55
G-6	G-16	G-26	G-36	G-46	G-56
G-7	G-17	G-27	G-37	G-47	G-57
G-8	G-18	G-28	G-38	G-48	G-58
G-9	G-19	G-29	G-39	G-49	G-59
G-10	G-20	G-30	G-40	G-50	

X는 X<sup>2</sup>이고; R<sup>3a</sup>는 H이며; R<sup>11a</sup>는 Me이고; n은 0이다.

G	G	G	G	G	G
G-1	G-11	G-21	G-31	G-41	G-51
G-2	G-12	G-22	G-32	G-42	G-52
G-3	G-13	G-23	G-33	G-43	G-53
G-4	G-14	G-24	G-34	G-44	G-54
G-5	G-15	G-25	G-35	G-45	G-55
G-6	G-16	G-26	G-36	G-46	G-56
G-7	G-17	G-27	G-37	G-47	G-57
G-8	G-18	G-28	G-38	G-48	G-58
G-9	G-19	G-29	G-39	G-49	G-59
G-10	G-20	G-30	G-40	G-50	

[0583]

X는  $X^3$  이고;  $R^{3a}$ 는 H이며;  $R^{11a}$ 는 Me 이고; n은 0이다.

G	G	G	G	G	G
G-1	G-11	G-21	G-31	G-41	G-51
G-2	G-12	G-22	G-32	G-42	G-52
G-3	G-13	G-23	G-33	G-43	G-53
G-4	G-14	G-24	G-34	G-44	G-54
G-5	G-15	G-25	G-35	G-45	G-55
G-6	G-16	G-26	G-36	G-46	G-56
G-7	G-17	G-27	G-37	G-47	G-57
G-8	G-18	G-28	G-38	G-48	G-58
G-9	G-19	G-29	G-39	G-49	G-59
G-10	G-20	G-30	G-40	G-50	

n은 0이다.

X	G	$R^{3a}$	X	G	$R^{3a}$	X	G	$R^{3a}$
$X^1$	G-2	Me	$X^2$	G-2	Me	$X^3$	G-2	Me
$X^1$	G-2	Cl	$X^2$	G-2	Cl	$X^3$	G-2	Cl
$X^1$	G-2	F	$X^2$	G-2	F	$X^3$	G-2	F
$X^1$	G-2	$CF_3$	$X^2$	G-2	$CF_3$	$X^3$	G-2	$CF_3$
$X^1$	G-14	<i>n</i> -Pr	$X^2$	G-14	<i>n</i> -Pr	$X^3$	G-14	<i>n</i> -Pr
$X^1$	G-26	5-Me						

$R^{3a}$ 는 H 이고; n은 0이다.

X	G	$R^{11a}$
$X^1$	G-3	Me
$X^1$	G-3	<i>n</i> -Pr
$X^2$	G-3	Me
$X^2$	G-3	<i>n</i> -Pr
$X^3$	G-3	Me
$X^3$	G-3	<i>n</i> -Pr

G는 G-1 이고;  $R^{3a}$ 는 H이며; n은 0이다.

X	X
$X^4$	$X^7$
$X^5$	$X^8$
$X^6$	$X^9$

[0584]

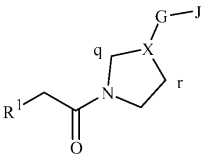
G는 G-1 이고;  $R^{3a}$ 는 H이며; n은 1이다.

X	$R^2$	X	$R^2$	X	$R^2$
$X^1$	2-Me	$X^1$	4-Br	$X^3$	3-Me
$X^1$	3-Me	$X^1$	4-CN	$X^3$	2,6-다이-Me
$X^1$	2,6-다이-Me	$X^2$	2-Me	$X^3$	3,5-다이-Me
$X^1$	3,5-다이-Me	$X^2$	3-Me	$X^3$	3- <i>n</i> -Bu
$X^1$	3- <i>n</i> -Bu	$X^2$	2,6-다이-Me	$X^3$	5-Me
$X^1$	4-MeO	$X^2$	3,5-다이-Me	$X^3$	6-Me
$X^1$	4-OH	$X^2$	3- <i>n</i> -Bu		
$X^1$	4-Cl	$X^3$	2-Me		

\* 이 표의 화합물에서의 X, G,  $R^{3a}$  및  $R^{11a}$ 의 정의는 발명의 요약 및 상기 실시 형태의 증거 2에 정의한 바와 같다.

[0585]

[0586] [표 5\*]



\* 이 표의 화합물에서의 G 및 J-29-1 내지 J-29-57 은 상기 실시 형태의 증거 2 및 A 에 정의한 바와 같다.  
R<sup>1</sup> 은 2,5-다이클로로페닐이고; X 는 X<sup>1</sup> 이며; G 는 G-1 이고; R<sup>3a</sup> 는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup> 은 2,5-다이클로로페닐이고; X 는 X<sup>2</sup> 이며; G 는 G-1 이고; R<sup>3a</sup> 는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup> 은 2,5-다이클로로페닐이고; X 는 X<sup>1</sup> 이며; G 는 G-2 이고; R<sup>3a</sup> 는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52

[0587]

J	J	J	J	J	J
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 2,5-다이클로로페닐이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페닐이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페닐이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51

[0588]



J	J	J	J	J	J
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페닐이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페닐이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 2,5-다이메틸페닐이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

[0589]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 2,5-다이페틸페닐이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 2,5-다이페틸페닐이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 2,5-다이페틸페닐이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

[0590]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 2-메틸-5-(트라이플루오로메틸)페닐이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 2-메틸-5-(트라이플루오로메틸)페닐이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 2-메틸-5-(트라이플루오로메틸)페닐이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

[0591]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 2-메틸-5-(트라이플루오로메틸)페닐이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이메틸피라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이메틸피라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

[0592]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

$R^1$  은 3,5-다이메틸피라졸-1-일이고; X 는  $X^1$  이며; G 는 G-2 이고;  $R^{3a}$  는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

$R^1$  은 3,5-다이메틸피라졸-1-일이고; X 는  $X^2$  이며; G 는 G-2 이고;  $R^{3a}$  는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

$R^1$  은 3,5-다이클로로피라졸-1-일이고; X 는  $X^1$  이며; G 는 G-1 이고;  $R^{3a}$  는 H 이다.

[0593]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이클로로피라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이클로로피라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이클로로피라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

[0594]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이브로모페라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이브로모페라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이브로모페라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

[0595]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이브로모피라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

[0596]



J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0597]

R<sup>1</sup>은 5-클로로-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-클로로-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-클로로-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0598]

R<sup>1</sup>은 5-클로로-3-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-브로모-3-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-브로모-3-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0599]

R<sup>1</sup>은 5-에틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-에틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-에틸-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0600]

R<sup>1</sup>은 3,5-비스-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-비스-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-비스-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0601]

R<sup>1</sup>은 3,5-비스-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3-메틸-5-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3-메틸-5-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0602]

R<sup>1</sup>은 3-메틸-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3-메틸-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3-클로로-5-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0603]

R<sup>1</sup>은 3-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58

[0604]



J	J	J	J	J	J
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup> 은 3-브로모-5-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X 는 X<sup>1</sup> 이며; G 는 G-1 이고; R<sup>3a</sup> 는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup> 은 3-브로모-5-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X 는 X<sup>2</sup> 이며; G 는 G-1 이고; R<sup>3a</sup> 는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup> 은 3-브로모-5-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X 는 X<sup>1</sup> 이며; G 는 G-2 이고; R<sup>3a</sup> 는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57

[0605]

J	J	J	J	J	J
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup> 은 3-브로모-5-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X 는 X<sup>2</sup> 이며; G 는 G-2 이고; R<sup>3a</sup> 는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup> 은 5-메톡시-3-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X 는 X<sup>1</sup> 이며; G 는 G-1 이고; R<sup>3a</sup> 는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup> 은 5-메톡시-3-(트라이플루오로메틸)페라졸-1-일이고; X 는 X<sup>2</sup> 이며; G 는 G-1 이고; R<sup>3a</sup> 는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56

[0606]

J	J	J	J	J	J
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-메톡시-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-메톡시-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-다이플루오로메톡시-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54

[0607]

J	J	J	J	J	J
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

$R^1$  은 5-다이플루오로메톡시-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X 는  $X^2$  이며; G 는 G-1 이고;  
 $R^{3a}$  는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

$R^1$  은 5-다이플루오로메톡시-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X 는  $X^1$  이며; G 는 G-2 이고;  
 $R^{3a}$  는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

$R^1$  은 5-다이플루오로메톡시-3-(트라이플루오로메틸)피라졸-1-일이고; X 는  $X^2$  이며; G 는 G-2 이고;  
 $R^{3a}$  는 H 이다.

[0608]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이클로로트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이클로로트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이클로로트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

[0609]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이클로로트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이브로모트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이브로모트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

[0610]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이브로모트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이브로모트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이메틸트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

[0611]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이메틸트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이메틸트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이메틸트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

[0612]



J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이클로로피라졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이클로로피라졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-다이클로로피라졸-1-일이고; X는 X<sup>3</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

[0613]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3-메틸-5-(트라이플루오로메틸)트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3-메틸-5-(트라이플루오로메틸)트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H 이다.

[0614]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup> 은 3-메틸-5-(트라이플루오로메틸)트라이아졸-1-일이고; X 는 X<sup>1</sup> 이며; G 는 G-2 이고; R<sup>3a</sup> 는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup> 은 3-메틸-5-(트라이플루오로메틸)트라이아졸-1-일이고; X 는 X<sup>2</sup> 이며; G 는 G-2 이고; R<sup>3a</sup> 는 H 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup> 은 3,5-비스-(트라이플루오로메틸)트라이아졸-1-일이고; X 는 X<sup>1</sup> 이며; G 는 G-1 이고; R<sup>3a</sup> 는 H 이다.

[0615]

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-비스-(트라이플루오로메틸)트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-1 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-비스-(트라이플루오로메틸)트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>1</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

R<sup>1</sup>은 3,5-비스-(트라이플루오로메틸)트라이아졸-1-일이고; X는 X<sup>2</sup>이며; G는 G-2 이고; R<sup>3a</sup>는 H이다.

[0616]

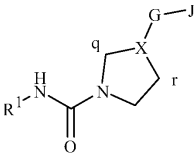
J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0617]

[0618]

표 5는 J-29-1 내지 J-29-60 (즉, J-29의 특정예) 중에서 선택되는 J 기를 포함하는 특정 화합물을 특정한다. 다수의 J-29-1 내지 J-29-60는 키랄 중심을 포함하기 때문에, 이들 J 기는 특정 에난티오머 형태로 예시되며, 경우에 따라서는 가장 큰 살균 활성을 제공할 수 있다. 당업자는 열거된 각 화합물에 대한 거울상체 (antipode; 즉, 반대 에난티오머)를 바로 인지하며, 게다가 에난티오머가 순수한 에난티오머로서 또는 하나의 에난티오머가 풍부한 혼합물 또는 라세미 혼합물 중에 존재할 수 있음을 인지한다.

[0619] [표 6\*]

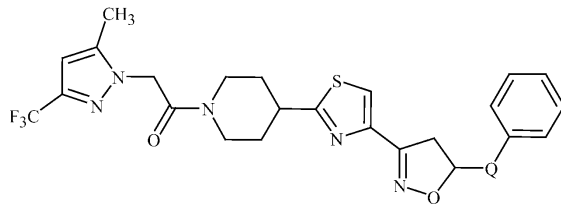


\* 이 표의 화합물에서의 G 및 J-29-1 내지 J-29-60의 정의는 상기 실시 형태의 증거 2 및 A에 정의된 바와 같다.  
R¹은 2,5-다이메틸페닐이고; X는 X¹이며; G는 G-1 이다.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0620]

[0621] [표 7\*]



\* 이 표에서의 Q 기 (Q-1 내지 Q-106)의 정의는 상기 실시 형태의 증거 4에 정의한 바와 같으며; p는 1이고, q는 0이며, R<sup>7</sup>은 상기 분자 구조에 나타낸 페닐이다.

\*\* Q-배향은 분자의 나머지 부분 및 Q 환 상의 R<sup>7</sup> (페닐) 치환기에 대한 결합점을 말한다. 첫번째 번호는 Q 를 분자의 나머지 부분에 결합시키는 Q 환 상의 위치를 말한다. 두번째 번호는 R<sup>7</sup> (페닐) 치환기가 결합되는 Q 환 상의 위치를 말한다.

Q	Q-배향**	Q	Q-배향**	Q	Q-배향**
Q-1	2/3	Q-39	5/6	Q-71	3/6
Q-1	2/4	Q-40	4/3	Q-72	1/4
Q-1	2/5	Q-40	4/5	Q-72	1/6
Q-2	2/3	Q-40	4/6	Q-73	1/4
Q-2	2/4	Q-41	3/5	Q-73	1/5
Q-2	2/5	Q-41	3/6	Q-73	1/6
Q-3	2/3	Q-42	6/3	Q-73	1/7
Q-3	2/4	Q-42	6/5	Q-73	1/8
Q-3	2/5	Q-43	2/4	Q-74	1/4
Q-4	5/4	Q-44	5/3	Q-74	1/6
Q-4	5/2	Q-44	5/6	Q-74	1/8
Q-5	2/4	Q-45	1/2	Q-75	1/4
Q-5	2/5	Q-45	1/3	Q-75	1/6
Q-6	2/4	Q-45	1/4	Q-75	1/7
Q-6	2/5	Q-46	1/2	Q-75	1/8
Q-7	5/2	Q-46	1/3	Q-76	1/6
Q-7	5/4	Q-46	1/4	Q-76	1/7
Q-8	5/3	Q-46	1/5	Q-77	1/6
Q-8	5/4	Q-47	1/2	Q-77	1/7
Q-9	5/3	Q-47	1/3	Q-78	1/5
Q-9	5/4	Q-47	1/4	Q-78	1/6
Q-10	5/3	Q-48	1/1	Q-79	3/6
Q-10	5/4	Q-48	1/2	Q-79	3/7

[0622]

Q	Q-배항**	Q	Q-배항**	Q	Q-배항**
Q-11	5/2	Q-49	1/1	Q-80	3/6
Q-11	5/4	Q-49	1/2	Q-80	3/7
Q-12	2/4	Q-50	1/1	Q-81	3/4
Q-12	2/5	Q-50	1/2	Q-81	3/5
Q-13	2/5	Q-50	1/3	Q-82	2/5
Q-14	5/3	Q-51	1/1	Q-82	2/6
Q-15	2/5	Q-51	1/2	Q-82	2/7
Q-16	2/5	Q-51	1/3	Q-83	3/5
Q-17	3/5	Q-52	1/1	Q-84	1/5
Q-18	5/3	Q-52	1/2	Q-85	3/5
Q-19	3/2	Q-52	1/3	Q-86	3/5
Q-19	3/4	Q-53	1/1	Q-87	3/4
Q-19	3/5	Q-53	1/2	Q-87	3/5
Q-20	3/2	Q-53	1/3	Q-88	1/4
Q-20	3/4	Q-54	1/1	Q-88	1/5
Q-20	3/5	Q-54	1/2	Q-89	3/4
Q-21	3/2	Q-54	1/3	Q-89	3/5
Q-21	3/4	Q-54	1/4	Q-90	1/3
Q-21	3/5	Q-55	1/1	Q-90	1/4
Q-22	3/4	Q-55	1/2	Q-90	1/5
Q-22	3/5	Q-55	1/3	Q-91	3/4
Q-23	4/3	Q-55	1/4	Q-91	3/5
Q-23	4/5	Q-56	2/3	Q-91	3/6
Q-24	4/2	Q-56	2/5	Q-92	1/4
Q-24	4/5	Q-56	2/6	Q-92	1/5
Q-25	4/2	Q-57	3/2	Q-92	1/6
Q-25	4/5	Q-57	3/5	Q-93	3/4
Q-26	4/3	Q-57	3/6	Q-93	3/5
Q-26	4/5	Q-58	2/3	Q-93	3/6
Q-27	4/3	Q-58	2/5	Q-94	1/3
Q-27	4/5	Q-58	2/6	Q-94	1/4
Q-28	4/2	Q-59	3/2	Q-94	1/5
Q-28	4/5	Q-59	3/5	Q-94	1/6
Q-29	3/5	Q-59	3/6	Q-95	2/5
Q-30	3/4	Q-60	1/3	Q-95	2/6
Q-31	3/5	Q-61	1/3	Q-96	2/4

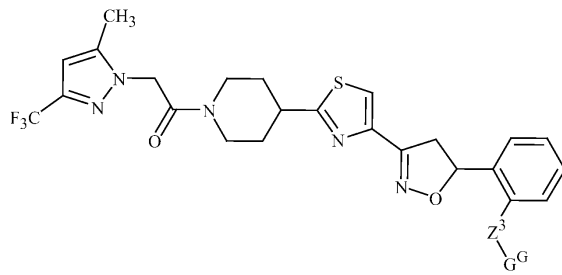
[0623]

Q	Q-배향**	Q	Q-배향**	Q	Q-배향**
Q-32	2/3	Q-62	3/5	Q-96	2/6
Q-32	2/4	Q-63	2/4	Q-97	2/5
Q-32	2/5	Q-63	2/5	Q-97	2/6
Q-32	2/6	Q-64	2/3	Q-98	2/4
Q-33	3/2	Q-64	2/4	Q-98	2/7
Q-33	3/4	Q-64	2/5	Q-99	2/5
Q-33	3/5	Q-65	1/3	Q-99	2/6
Q-33	3/6	Q-65	1/4	Q-100	3/5
Q-34	4/2	Q-65	1/5	Q-100	3/6
Q-34	4/3	Q-66	2/3	Q-101	3/4
Q-35	3/4	Q-66	2/4	Q-101	3/7
Q-35	3/5	Q-66	2/6	Q-102	1/5
Q-35	3/6	Q-67	2/4	Q-103	1/2
Q-36	2/4	Q-67	2/5	Q-103	1/3
Q-36	2/5	Q-67	2/6	Q-104	1/3
Q-37	2/3	Q-68	3/6	Q-104	1/4
Q-37	2/5	Q-68	3/8	Q-104	1/5
Q-37	2/6	Q-69	1/3	Q-105	1/2
Q-38	4/2	Q-69	1/4	Q-105	1/4
Q-38	4/5	Q-69	1/6	Q-105	1/5
Q-38	4/6	Q-70	3/4	Q-106	1/3
Q-39	5/2	Q-70	3/6	Q-106	1/5
Q-39	5/4	Q-71	3/4		

[0624]



[0625] [표 8\*]



(여기서,  $G^G$ 는 하기에 나타낸 바와 같이,  $G^A$ ,  $G^N$  또는  $G^P$ 이다).

\* 이 표의 화합물에서의  $G^A$ ,  $G^N$  및  $G^P$ 의 정의는 상기 실시 형태의 증거 5에 정의한 바와 같다.

$Z^3$ 는 직접 결합이고; r은 0이며;  $R^{22}$ 는 Me이다.

$G^G$	$G^G$	$G^G$	$G^G$	$G^G$	$G^G$
$G^A$ -1	$G^A$ -21	$G^A$ -41	$G^N$ -12	$G^N$ -32	$G^P$ -20
$G^A$ -2	$G^A$ -22	$G^A$ -42	$G^N$ -13	$G^P$ -1	$G^P$ -21
$G^A$ -3	$G^A$ -23	$G^A$ -43	$G^N$ -14	$G^P$ -2	$G^P$ -22
$G^A$ -4	$G^A$ -24	$G^A$ -44	$G^N$ -15	$G^P$ -3	$G^P$ -23
$G^A$ -5	$G^A$ -25	$G^A$ -45	$G^N$ -16	$G^P$ -4	$G^P$ -24
$G^A$ -6	$G^A$ -26	$G^A$ -46	$G^N$ -17	$G^P$ -5	$G^P$ -25
$G^A$ -7	$G^A$ -27	$G^A$ -47	$G^N$ -18	$G^P$ -6	$G^P$ -26
$G^A$ -8	$G^A$ -28	$G^A$ -48	$G^N$ -19	$G^P$ -7	$G^P$ -27
$G^A$ -9	$G^A$ -29	$G^A$ -49	$G^N$ -20	$G^P$ -8	$G^P$ -28
$G^A$ -10	$G^A$ -30	$G^N$ -1	$G^N$ -21	$G^P$ -9	$G^P$ -29
$G^A$ -11	$G^A$ -31	$G^N$ -2	$G^N$ -22	$G^P$ -10	$G^P$ -30
$G^A$ -12	$G^A$ -32	$G^N$ -3	$G^N$ -23	$G^P$ -11	$G^P$ -31
$G^A$ -13	$G^A$ -33	$G^N$ -4	$G^N$ -24	$G^P$ -12	$G^P$ -32
$G^A$ -14	$G^A$ -34	$G^N$ -5	$G^N$ -25	$G^P$ -13	$G^P$ -33
$G^A$ -15	$G^A$ -35	$G^N$ -6	$G^N$ -26	$G^P$ -14	$G^P$ -34
$G^A$ -16	$G^A$ -36	$G^N$ -7	$G^N$ -27	$G^P$ -15	$G^P$ -35
$G^A$ -17	$G^A$ -37	$G^N$ -8	$G^N$ -28	$G^P$ -16	
$G^A$ -18	$G^A$ -38	$G^N$ -9	$G^N$ -29	$G^P$ -17	
$G^A$ -19	$G^A$ -39	$G^N$ -10	$G^N$ -30	$G^P$ -18	
$G^A$ -20	$G^A$ -40	$G^N$ -11	$G^N$ -31	$G^P$ -19	

$Z^3$ 는 O이고; r은 0이며;  $R^{22}$ 는 Me이다.

[0626]

G <sup>G</sup>	G <sup>G</sup>	G <sup>G</sup>	G <sup>G</sup>	G <sup>G</sup>	G <sup>G</sup>
G <sup>A</sup> -1	G <sup>A</sup> -21	G <sup>A</sup> -41	G <sup>N</sup> -12	G <sup>N</sup> -32	G <sup>P</sup> -20
G <sup>A</sup> -2	G <sup>A</sup> -22	G <sup>A</sup> -42	G <sup>N</sup> -13	G <sup>P</sup> -1	G <sup>P</sup> -21
G <sup>A</sup> -3	G <sup>A</sup> -23	G <sup>A</sup> -43	G <sup>N</sup> -14	G <sup>P</sup> -2	G <sup>P</sup> -22
G <sup>A</sup> -4	G <sup>A</sup> -24	G <sup>A</sup> -44	G <sup>N</sup> -15	G <sup>P</sup> -3	G <sup>P</sup> -23
G <sup>A</sup> -5	G <sup>A</sup> -25	G <sup>A</sup> -45	G <sup>N</sup> -16	G <sup>P</sup> -4	G <sup>P</sup> -24
G <sup>A</sup> -6	G <sup>A</sup> -26	G <sup>A</sup> -46	G <sup>N</sup> -17	G <sup>P</sup> -5	G <sup>P</sup> -25
G <sup>A</sup> -7	G <sup>A</sup> -27	G <sup>A</sup> -47	G <sup>N</sup> -18	G <sup>P</sup> -6	G <sup>P</sup> -26
G <sup>A</sup> -8	G <sup>A</sup> -28	G <sup>A</sup> -48	G <sup>N</sup> -19	G <sup>P</sup> -7	G <sup>P</sup> -27
G <sup>A</sup> -9	G <sup>A</sup> -29	G <sup>A</sup> -49	G <sup>N</sup> -20	G <sup>P</sup> -8	G <sup>P</sup> -28
G <sup>A</sup> -10	G <sup>A</sup> -30	G <sup>N</sup> -1	G <sup>N</sup> -21	G <sup>P</sup> -9	G <sup>P</sup> -29
G <sup>A</sup> -11	G <sup>A</sup> -31	G <sup>N</sup> -2	G <sup>N</sup> -22	G <sup>P</sup> -10	G <sup>P</sup> -30
G <sup>A</sup> -12	G <sup>A</sup> -32	G <sup>N</sup> -3	G <sup>N</sup> -23	G <sup>P</sup> -11	G <sup>P</sup> -31
G <sup>A</sup> -13	G <sup>A</sup> -33	G <sup>N</sup> -4	G <sup>N</sup> -24	G <sup>P</sup> -12	G <sup>P</sup> -32
G <sup>A</sup> -14	G <sup>A</sup> -34	G <sup>N</sup> -5	G <sup>N</sup> -25	G <sup>P</sup> -13	G <sup>P</sup> -33
G <sup>A</sup> -15	G <sup>A</sup> -35	G <sup>N</sup> -6	G <sup>N</sup> -26	G <sup>P</sup> -14	G <sup>P</sup> -34
G <sup>A</sup> -16	G <sup>A</sup> -36	G <sup>N</sup> -7	G <sup>N</sup> -27	G <sup>P</sup> -15	G <sup>P</sup> -35
G <sup>A</sup> -17	G <sup>A</sup> -37	G <sup>N</sup> -8	G <sup>N</sup> -28	G <sup>P</sup> -16	
G <sup>A</sup> -18	G <sup>A</sup> -38	G <sup>N</sup> -9	G <sup>N</sup> -29	G <sup>P</sup> -17	
G <sup>A</sup> -19	G <sup>A</sup> -39	G <sup>N</sup> -10	G <sup>N</sup> -30	G <sup>P</sup> -18	
G <sup>A</sup> -20	G <sup>A</sup> -40	G <sup>N</sup> -11	G <sup>N</sup> -31	G <sup>P</sup> -19	

Z<sup>3</sup>는 CH<sub>2</sub> 이고; r 은 0 이며; R<sup>22</sup>는 Me 이다.

G <sup>G</sup>	G <sup>G</sup>	G <sup>G</sup>	G <sup>G</sup>	G <sup>G</sup>	G <sup>G</sup>
G <sup>A</sup> -1	G <sup>A</sup> -21	G <sup>A</sup> -41	G <sup>N</sup> -12	G <sup>N</sup> -32	G <sup>P</sup> -20
G <sup>A</sup> -2	G <sup>A</sup> -22	G <sup>A</sup> -42	G <sup>N</sup> -13	G <sup>P</sup> -1	G <sup>P</sup> -21
G <sup>A</sup> -3	G <sup>A</sup> -23	G <sup>A</sup> -43	G <sup>N</sup> -14	G <sup>P</sup> -2	G <sup>P</sup> -22
G <sup>A</sup> -4	G <sup>A</sup> -24	G <sup>A</sup> -44	G <sup>N</sup> -15	G <sup>P</sup> -3	G <sup>P</sup> -23
G <sup>A</sup> -5	G <sup>A</sup> -25	G <sup>A</sup> -45	G <sup>N</sup> -16	G <sup>P</sup> -4	G <sup>P</sup> -24
G <sup>A</sup> -6	G <sup>A</sup> -26	G <sup>A</sup> -46	G <sup>N</sup> -17	G <sup>P</sup> -5	G <sup>P</sup> -25
G <sup>A</sup> -7	G <sup>A</sup> -27	G <sup>A</sup> -47	G <sup>N</sup> -18	G <sup>P</sup> -6	G <sup>P</sup> -26
G <sup>A</sup> -8	G <sup>A</sup> -28	G <sup>A</sup> -48	G <sup>N</sup> -19	G <sup>P</sup> -7	G <sup>P</sup> -27
G <sup>A</sup> -9	G <sup>A</sup> -29	G <sup>A</sup> -49	G <sup>N</sup> -20	G <sup>P</sup> -8	G <sup>P</sup> -28
G <sup>A</sup> -10	G <sup>A</sup> -30	G <sup>N</sup> -1	G <sup>N</sup> -21	G <sup>P</sup> -9	G <sup>P</sup> -29
G <sup>A</sup> -11	G <sup>A</sup> -31	G <sup>N</sup> -2	G <sup>N</sup> -22	G <sup>P</sup> -10	G <sup>P</sup> -30
G <sup>A</sup> -12	G <sup>A</sup> -32	G <sup>N</sup> -3	G <sup>N</sup> -23	G <sup>P</sup> -11	G <sup>P</sup> -31
G <sup>A</sup> -13	G <sup>A</sup> -33	G <sup>N</sup> -4	G <sup>N</sup> -24	G <sup>P</sup> -12	G <sup>P</sup> -32

[0627]

GG	GG	GG	GG	GG	GG
GA-14	GA-34	GN-5	GN-25	GP-13	GP-33
GA-15	GA-35	GN-6	GN-26	GP-14	GP-34
GA-16	GA-36	GN-7	GN-27	GP-15	GP-35
GA-17	GA-37	GN-8	GN-28	GP-16	
GA-18	GA-38	GN-9	GN-29	GP-17	
GA-19	GA-39	GN-10	GN-30	GP-18	
GA-20	GA-40	GN-11	GN-31	GP-19	

Z<sup>3</sup>는 -C≡C-이고; r 은 0 이며; R<sup>22</sup>는 Me 이다.

GG	GG	GG	GG	GG	GG
GA-1	GA-21	GA-41	GN-12	GN-32	GP-20
GA-2	GA-22	GA-42	GN-13	GP-1	GP-21
GA-3	GA-23	GA-43	GN-14	GP-2	GP-22
GA-4	GA-24	GA-44	GN-15	GP-3	GP-23
GA-5	GA-25	GA-45	GN-16	GP-4	GP-24
GA-6	GA-26	GA-46	GN-17	GP-5	GP-25
GA-7	GA-27	GA-47	GN-18	GP-6	GP-26
GA-8	GA-28	GA-48	GN-19	GP-7	GP-27
GA-9	GA-29	GA-49	GN-20	GP-8	GP-28
GA-10	GA-30	GN-1	GN-21	GP-9	GP-29
GA-11	GA-31	GN-2	GN-22	GP-10	GP-30
GA-12	GA-32	GN-3	GN-23	GP-11	GP-31
GA-13	GA-33	GN-4	GN-24	GP-12	GP-32
GA-14	GA-34	GN-5	GN-25	GP-13	GP-33
GA-15	GA-35	GN-6	GN-26	GP-14	GP-34
GA-16	GA-36	GN-7	GN-27	GP-15	GP-35
GA-17	GA-37	GN-8	GN-28	GP-16	
GA-18	GA-38	GN-9	GN-29	GP-17	
GA-19	GA-39	GN-10	GN-30	GP-18	
GA-20	GA-40	GN-11	GN-31	GP-19	

Z<sup>3</sup>는 -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-이고; r 은 0 이며; R<sup>22</sup>는 Me 이다.

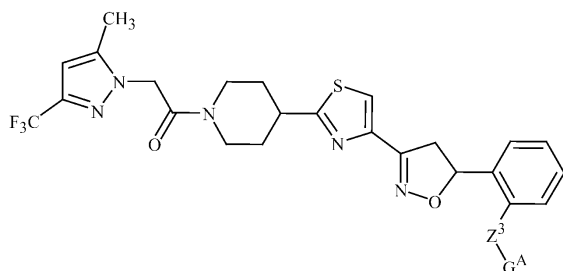
GG	GG	GG	GG	GG	GG
GA-1	GA-21	GA-41	GN-12	GN-32	GP-20
GA-2	GA-22	GA-42	GN-13	GP-1	GP-21
GA-3	GA-23	GA-43	GN-14	GP-2	GP-22
GA-4	GA-24	GA-44	GN-15	GP-3	GP-23

[0628]

GG	GG	GG	GG	GG	GG
GA-5	GA-25	GA-45	GN-16	GP-4	GP-24
GA-6	GA-26	GA-46	GN-17	GP-5	GP-25
GA-7	GA-27	GA-47	GN-18	GP-6	GP-26
GA-8	GA-28	GA-48	GN-19	GP-7	GP-27
GA-9	GA-29	GA-49	GN-20	GP-8	GP-28
GA-10	GA-30	GN-1	GN-21	GP-9	GP-29
GA-11	GA-31	GN-2	GN-22	GP-10	GP-30
GA-12	GA-32	GN-3	GN-23	GP-11	GP-31
GA-13	GA-33	GN-4	GN-24	GP-12	GP-32
GA-14	GA-34	GN-5	GN-25	GP-13	GP-33
GA-15	GA-35	GN-6	GN-26	GP-14	GP-34
GA-16	GA-36	GN-7	GN-27	GP-15	GP-35
GA-17	GA-37	GN-8	GN-28	GP-16	
GA-18	GA-38	GN-9	GN-29	GP-17	
GA-19	GA-39	GN-10	GN-30	GP-18	
GA-20	GA-40	GN-11	GN-31	GP-19	

[0629]

[0630] [표 9\*]



\* 이 표의 화합물에서의  $G^A$ 의 정의는 상기 실시 형태의 증거 5에 정의한 바와 같다.

$G^A$ 는  $G^A$ -18이고; r은 0이다.

$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$
NH	C(=O)	S	CHCH <sub>3</sub> **	CH=C(CH <sub>3</sub> )**	CH <sub>2</sub> O**
NCH <sub>3</sub>	C(=S)	SO <sub>2</sub>	CHCF <sub>3</sub> **	OCH <sub>2</sub> **	

$G^A$ 는  $G^A$ -36이고; r은 0이다.

$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$
NH	C(=O)	S	CHCH <sub>3</sub> **	CH=C(CH <sub>3</sub> )**	CH <sub>2</sub> O**
NCH <sub>3</sub>	C(=S)	SO <sub>2</sub>	CHCF <sub>3</sub> **	OCH <sub>2</sub> **	

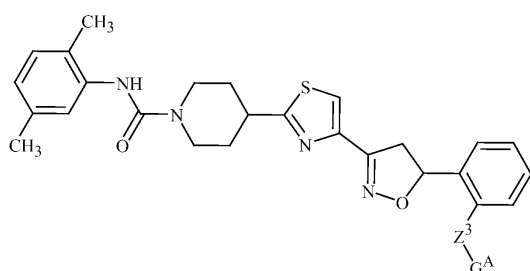
$G^A$ 는  $G^A$ -49이고; r은 0이다.

$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$
NH	C(=O)	S	CHCH <sub>3</sub> **	CH=C(CH <sub>3</sub> )**	CH <sub>2</sub> O**
NCH <sub>3</sub>	C(=S)	SO <sub>2</sub>	CHCF <sub>3</sub> **	OCH <sub>2</sub> **	

\*\* 이들 치환기의 좌측 말단은 페닐기에 연결되고, 이들 치환기의 우측 말단은  $G^A$ 에 연결된다.

[0631]

[0632] [표 10\*]



\* 이 표의 화합물에서의  $G^A$ 의 정의는 상기 실시 형태의 증거 5에 정의한 바와 같다.

$G^A$ 는  $G^A$ -18이고; r은 0이다.

$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$
NH	C(=O)	S	CHCH <sub>3</sub> **	CH=C(CH <sub>3</sub> )**	CH <sub>2</sub> O**
NCH <sub>3</sub>	C(=S)	SO <sub>2</sub>	CHCF <sub>3</sub> **	OCH <sub>2</sub> **	

$G^A$ 는  $G^A$ -36이고; r은 0이다.

$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$
NH	C(=O)	S	CHCH <sub>3</sub> **	CH=C(CH <sub>3</sub> )**	CH <sub>2</sub> O**
NCH <sub>3</sub>	C(=S)	SO <sub>2</sub>	CHCF <sub>3</sub> **	OCH <sub>2</sub> **	

$G^A$ 는  $G^A$ -49이고; r은 0이다.

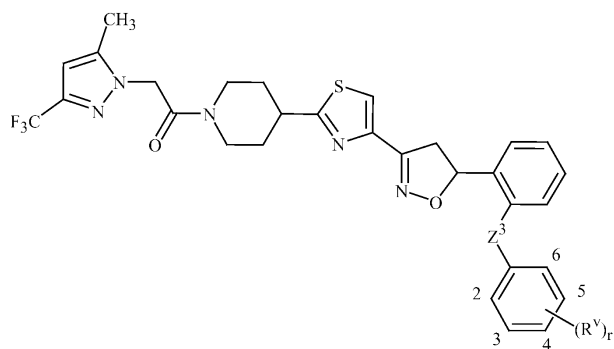
$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$	$Z^3$
NH	C(=O)	S	CHCH <sub>3</sub> **	CH=C(CH <sub>3</sub> )**	CH <sub>2</sub> O**
NCH <sub>3</sub>	C(=S)	SO <sub>2</sub>	CHCF <sub>3</sub> **	OCH <sub>2</sub> **	

\*\* 이들 치환기의 좌측 말단은 페닐기에 연결되고, 이들 치환기의 우측 말단은  $G^A$ 에 연결된다.

[0633]



[0636] [표 12]



$Z^3$ 는 직접 결합이다.

$(R^v)_r$	$(R^v)_r$	$(R^v)_r$	$(R^v)_r$
2-Cl	4-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-F	2,6-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-C(=S)OCH <sub>3</sub>
2,6-다이-F	2,3-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-CS <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-CN	2,4,6-트라이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-OCH <sub>3</sub>
2-OH	3-CH=CH <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CN	2-OCF <sub>3</sub>
2-NH <sub>2</sub>	3-C≡CH	4-CH <sub>2</sub> OH	2-OC(=O)CH <sub>3</sub>
2-CO <sub>2</sub> H	2-CF <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	2-SCH <sub>3</sub>
2-CONH <sub>2</sub>	3-C(=O)CH <sub>3</sub>	3-CHC(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-SCF <sub>3</sub>
3-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	2-C(=O)CF <sub>3</sub>	3-C(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-SH	2-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-C(=O)CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-SF <sub>5</sub>	3-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-NHCN	2-CH=CHCl	2-CO <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	3-NHCH <sub>3</sub>
2-CH <sub>3</sub>	2-사이클로프로필	3-NHC(=O)CH <sub>3</sub>	2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-( <i>c</i> -pr-(2- <i>c</i> -Pr))	2-(테트라하이드로푸란-2-일)	2-NH- <i>c</i> -Pr	

$Z^3$ 는 O이다.

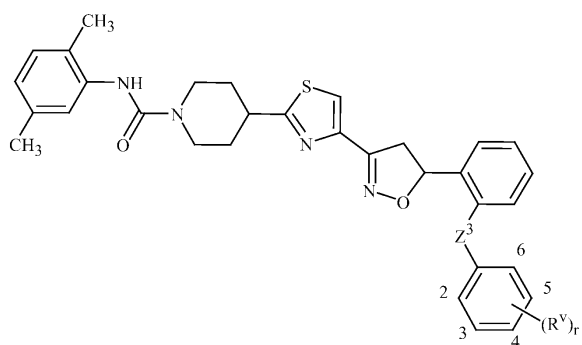
$(R^v)_r$	$(R^v)_r$	$(R^v)_r$	$(R^v)_r$
2-Cl	4-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-F	2,6-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-C(=S)OCH <sub>3</sub>
2,6-다이-F	2,3-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-CS <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-CN	2,4,6-트라이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-OCH <sub>3</sub>
2-OH	3-CH=CH <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CN	2-OCF <sub>3</sub>

[0637]

(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>	(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>	(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>	(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>
2-NH <sub>2</sub>	3-C≡CH	4-CH <sub>2</sub> OH	2-OC(=O)CH <sub>3</sub>
2-CO <sub>2</sub> H	2-CF <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	2-SCH <sub>3</sub>
2-CONH <sub>2</sub>	3-C(=O)CH <sub>3</sub>	3-CHC(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-SCF <sub>3</sub>
3-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	2-C(=O)CF <sub>3</sub>	3-C(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-SH	2-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-C(=O)CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-SF <sub>5</sub>	3-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-NHCN	2-CH=CHCl	2-CO <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	3-NHCH <sub>3</sub>
2-CH <sub>3</sub>	2-사이클로프로필	3-NHC(=O)CH <sub>3</sub>	2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-( <i>c</i> -pr-(2- <i>c</i> -Pr))	2-(테트라하이드로푸란-2-일)	2-NH- <i>c</i> -Pr	
Z <sup>1</sup> 는 CH <sub>2</sub> 이다.			
(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>	(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>	(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>	(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>
2-Cl	4-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-F	2,6-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-C(=S)OCH <sub>3</sub>
2,6-다이-F	2,3-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-CS <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-CN	2,4,6-트라이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-OCH <sub>3</sub>
2-OH	3-CH=CH <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CN	2-OCF <sub>3</sub>
2-NH <sub>2</sub>	3-C≡CH	4-CH <sub>2</sub> OH	2-OC(=O)CH <sub>3</sub>
2-CO <sub>2</sub> H	2-CF <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	2-SCH <sub>3</sub>
2-CONH <sub>2</sub>	3-C(=O)CH <sub>3</sub>	3-CHC(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-SCF <sub>3</sub>
3-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	2-C(=O)CF <sub>3</sub>	3-C(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-SH	2-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-C(=O)CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-SF <sub>5</sub>	3-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-NHCN	2-CH=CHCl	2-CO <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	3-NHCH <sub>3</sub>
2-CH <sub>3</sub>	2-사이클로프로필	3-NHC(=O)CH <sub>3</sub>	2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-( <i>c</i> -pr-(2- <i>c</i> -Pr))	2-(테트라하이드로푸란-2-일)	2-NH- <i>c</i> -Pr	

[0638]

[0639] [표 13]



$Z^3$ 는 직접 결합이다.

$(R^V)_r$	$(R^V)_r$	$(R^V)_r$	$(R^V)_r$
2-Cl	4-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-F	2,6-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-C(=S)OCH <sub>3</sub>
2,6-다이-F	2,3-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-CS <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-CN	2,4,6-트라이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-OCH <sub>3</sub>
2-OH	3-CH=CH <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CN	2-OCF <sub>3</sub>
2-NH <sub>2</sub>	3-C≡CH	4-CH <sub>2</sub> OH	2-OC(=O)CH <sub>3</sub>
2-CO <sub>2</sub> H	2-CF <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	2-SCH <sub>3</sub>
2-CONH <sub>2</sub>	3-C(=O)CH <sub>3</sub>	3-CHC(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-SCF <sub>3</sub>
3-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	2-C(=O)CF <sub>3</sub>	3-C(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-SH	2-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-C(=O)CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-SF <sub>5</sub>	3-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-NHCN	2-CH=CHCl	2-CO <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	3-NHCH <sub>3</sub>
2-CH <sub>3</sub>	2-사이클로프로필	3-NHC(=O)CH <sub>3</sub>	2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-( <i>c</i> -pr-(2- <i>c</i> -Pr))	2-(테트라하이드로푸란-2-일)	2-NH- <i>c</i> -Pr	

$Z^3$ 는 O이다.

$(R^V)_r$	$(R^V)_r$	$(R^V)_r$	$(R^V)_r$
2-Cl	4-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-F	2,6-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-C(=S)OCH <sub>3</sub>
2,6-다이-F	2,3-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-CS <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-CN	2,4,6-트라이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-OCH <sub>3</sub>
2-OH	3-CH=CH <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CN	2-OCF <sub>3</sub>

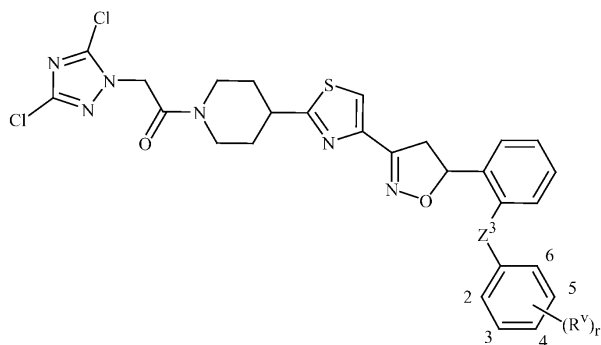
[0640]



$(R^V)_F$	$(R^V)_F$	$(R^V)_F$	$(R^V)_F$
2-NH <sub>2</sub>	3-C≡CH	4-CH <sub>2</sub> OH	2-OC(=O)CH <sub>3</sub>
2-CO <sub>2</sub> H	2-CF <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	2-SCH <sub>3</sub>
2-CONH <sub>2</sub>	3-C(=O)CH <sub>3</sub>	3-CHC(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-SCF <sub>3</sub>
3-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	2-C(=O)CF <sub>3</sub>	3-C(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-SH	2-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-C(=O)CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-SF <sub>5</sub>	3-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-NHCN	2-CH=CHCl	2-CO <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	3-NHCH <sub>3</sub>
2-CH <sub>3</sub>	2-사이클로프로필	3-NHC(=O)CH <sub>3</sub>	2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-( <i>c</i> -pr-(2- <i>c</i> -Pr))	2-(테트라하이드로푸란-2-일)	2-NH- <i>c</i> -Pr	
$Z^3$ 는 CH <sub>2</sub> 이다.			
$(R^V)_F$	$(R^V)_F$	$(R^V)_F$	$(R^V)_F$
2-Cl	4-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-F	2,6-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-C(=S)OCH <sub>3</sub>
2,6-다이-F	2,3-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-CS <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-CN	2,4,6-트라이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-OCH <sub>3</sub>
2-OH	3-CH=CH <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CN	2-OCF <sub>3</sub>
2-NH <sub>2</sub>	3-C≡CH	4-CH <sub>2</sub> OH	2-OC(=O)CH <sub>3</sub>
2-CO <sub>2</sub> H	2-CF <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	2-SCH <sub>3</sub>
2-CONH <sub>2</sub>	3-C(=O)CH <sub>3</sub>	3-CHC(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-SCF <sub>3</sub>
3-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	2-C(=O)CF <sub>3</sub>	3-C(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-SH	2-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-C(=O)CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-SF <sub>5</sub>	3-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-NHCN	2-CH=CHCl	2-CO <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	3-NHCH <sub>3</sub>
2-CH <sub>3</sub>	2-사이클로프로필	3-NHC(=O)CH <sub>3</sub>	2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-( <i>c</i> -pr-(2- <i>c</i> -Pr))	2-(테트라하이드로푸란-2-일)	2-NH- <i>c</i> -Pr	

[0641]

[0642] [표 14]



Z<sup>3</sup>는 직접 결합이다.

(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>	(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>	(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>	(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>
2-Cl	4-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-F	2,6-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-C(=S)OCH <sub>3</sub>
2,6-다이-F	2,3-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-CS <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-CN	2,4,6-트라이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-OCH <sub>3</sub>
2-OH	3-CH=CH <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CN	2-OCF <sub>3</sub>
2-NH <sub>2</sub>	3-C≡CH	4-CH <sub>2</sub> OH	2-OC(=O)CH <sub>3</sub>
2-CO <sub>2</sub> H	2-CF <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	2-SCH <sub>3</sub>
2-CONH <sub>2</sub>	3-C(=O)CH <sub>3</sub>	3-CHC(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-SCF <sub>3</sub>
3-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	2-C(=O)CF <sub>3</sub>	3-C(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-SH	2-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-C(=O)CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-SF <sub>5</sub>	3-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-NHCN	2-CH=CHCl	2-CO <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	3-NHCH <sub>3</sub>
2-CH <sub>3</sub>	2-사이클로프로필	3-NHC(=O)CH <sub>3</sub>	2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-( <i>c</i> -pr-(2- <i>c</i> -Pr))	2-(테트라하이드로푸란-2-일)	2-NH- <i>c</i> -Pr	

Z<sup>3</sup>는 O 이다.

(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>	(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>	(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>	(R <sup>V</sup> ) <sub>r</sub>
2-Cl	4-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-F	2,6-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-C(=S)OCH <sub>3</sub>
2,6-다이-F	2,3-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-CS <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-CN	2,4,6-트라이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-OCH <sub>3</sub>
2-OH	3-CH=CH <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CN	2-OCF <sub>3</sub>

[0643]

$(R^V)_F$	$(R^V)_F$	$(R^V)_F$	$(R^V)_F$
2-NH <sub>2</sub>	3-C≡CH	4-CH <sub>2</sub> OH	2-OC(=O)CH <sub>3</sub>
2-CO <sub>2</sub> H	2-CF <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	2-SCH <sub>3</sub>
2-CONH <sub>2</sub>	3-C(=O)CH <sub>3</sub>	3-CHC(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-SCF <sub>3</sub>
3-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	2-C(=O)CF <sub>3</sub>	3-C(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-SH	2-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-C(=O)CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-SF <sub>5</sub>	3-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-NHCN	2-CH=CHCl	2-CO <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	3-NHCH <sub>3</sub>
2-CH <sub>3</sub>	2-사이클로프로필	3-NHC(=O)CH <sub>3</sub>	2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-(c-pr-(2-c-Pr))	2-(테트라하이드로푸란-2-일)	2-NH-c-Pr	
$Z^3$ 는 CH <sub>3</sub> 이다.			
$(R^V)_F$	$(R^V)_F$	$(R^V)_F$	$(R^V)_F$
2-Cl	4-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-F	2,6-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-C(=S)OCH <sub>3</sub>
2,6-다이-F	2,3-다이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-CS <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-CN	2,4,6-트라이-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-OCH <sub>3</sub>
2-OH	3-CH=CH <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CN	2-OCF <sub>3</sub>
2-NH <sub>2</sub>	3-C≡CH	4-CH <sub>2</sub> OH	2-OC(=O)CH <sub>3</sub>
2-CO <sub>2</sub> H	2-CF <sub>3</sub>	3-CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	2-SCH <sub>3</sub>
2-CONH <sub>2</sub>	3-C(=O)CH <sub>3</sub>	3-CHC(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-SCF <sub>3</sub>
3-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	2-C(=O)CF <sub>3</sub>	3-C(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2-SH	2-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-C(=O)CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-SF <sub>5</sub>	3-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-NHCN	2-CH=CHCl	2-CO <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	3-NHCH <sub>3</sub>
2-CH <sub>3</sub>	2-사이클로프로필	3-NHC(=O)CH <sub>3</sub>	2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2-(c-pr-(2-c-Pr))	2-(테트라하이드로푸란-2-일)	2-NH-c-Pr	

[0644]

[0645] [표 15]



\* 이 표의 화합물에서의 J<sup>I</sup>에 특정된 J-29-1 내지 J-29-60 는 상기 실시 형태의 증거 A 에 정의한 바와 같다.

M 은 CH<sub>3</sub> 이다.

J <sup>I</sup>	J <sup>I</sup>	J <sup>I</sup>	J <sup>I</sup>	J <sup>I</sup>	J <sup>I</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

M 은 CH<sub>2</sub>Cl 이다.

J <sup>I</sup>	J <sup>I</sup>	J <sup>I</sup>	J <sup>I</sup>	J <sup>I</sup>	J <sup>I</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0646]

M 은  $\text{CH}_2\text{Br}$  이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

M 은  $\text{CH}_2\text{I}$  이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

M 은 OH 이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0647]

M 은 OMe 이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

M 은 OEt 이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

M 은 OPr 이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0648]

M 은 O-i-Pr 이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

M 은 O-n-Bu 이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

M 은 O-t-Bu 이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0649]

M 은  $\text{NMe}_2$  이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

M 은  $\text{NEt}_2$  이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

M 은  $\text{N}(\text{n-Pr})_2$  이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0650]



M은 1-피페리딘일이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

M은 1-피롤리딘일이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

M은 4-모르폴리딘일이다.

J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>	J <sup>1</sup>
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-58
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-29-59
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-29-60

[0651]

[0652]

상기 표 15은 J-29-1 내지 J-29-60 중에서 선택되는 J<sup>1</sup> 기를 포함하는 특정한 화합물을 열거한다. 다수의 J-29-1 내지 J-29-60는 키랄 중심을 포함하기 때문에, 이들 J<sup>1</sup> 기는 특정 에난티오머 형태로 예시되며, 경우에 따라서는 화학식 1의 화합물이 가장 큰 살균 활성을 제공할 수 있다. 당업자는 열거된 각 화합물에 대한 거울상체 (즉, 반대 에난티오머)를 바로 인지하며, 게다가 에난티오머가 순수한 에난티오머로서 또는 하나의 에난티오머가 풍부한 혼합물 또는 라세미 혼합물 중에 존재할 수 있음을 인지한다.

[0653]

제형/유효성

[0654]

본 발명의 화학식 1의 화합물 (또는 이의 N-옥사이드 또는 염)은 일반적으로 담체로서 작용하는 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가 성분과 함께, 조성물, 즉, 제형 중의 살균제 활성 성분으로서 사용될 것이다. 제형 또는 조성물 성분은 활성 성분의 물리적 특성, 적용 방식 및 환경 인자, 예를 들어, 토양형, 수분 및 온도와 상응하도록 선택된다.

[0655]

유용한 제형은 액체 조성물 및 고체 조성물을 포함한다. 액체 조성물은 용액 (유제 (emulsifiable concentrate) 포함), 현탁제, 에멀전 (마이크로에멀전 및/또는 유현탁제 (suspoemulsion) 포함) 등을 포함하며, 이들은 임의로 젤로 증점될 수 있다. 수성 액체 조성물의 일반적인 유형은 액제 (soluble concentrate), 액상수화제 (suspension concentrate), 캡슐 현탁제, 농축 에멀전, 마이크로에멀전 및 유현탁제이다. 비수성 액체 조성물의 일반적인 유형은 유제, 마이크로유제 (microemulsifiable concentrate), 분산성 액제 (dispersible

concentrate) 및 오일 분산액이다.

[0656] 고체 조성물의 일반적인 유형은 분체 (dust), 분말, 과립, 펠릿, 환약, 향정 (pastille), 정제, 충전 필름 (종자 코팅 포함) 등이 있으며, 이들은 수분산성 ("습윤성") 또는 수용성일 수 있다. 필름 형성 용액 또는 유동성 현탁제로 형성되는 필름 및 코팅이 종자 처리에 특히 유용하다. 활성 성분은 (마이크로)캡슐화될 수 있으며, 추가로 현탁 제형 또는 고체 제형으로 형성될 수 있거나; 또는 활성 성분의 전체 제형은 캡슐화 (또는 "오버코팅")될 수 있다. 캡슐화는 활성 성분의 방출을 제어하거나 지연시킬 수 있다. 유화성 (emulsifiable) 과립은 유제 제형과 건조 과립 제형의 이점을 모두 갖추고 있다. 고강도 조성물은 주로 추가 제형화를 위한 중간체로서 사용된다.

[0657] 분무형 제형은 전형적으로 분무 전에 적절한 매질에서 증량된다. 그러한 액체 및 고체 제형은 보통 물인 분무 매질에서 용이하게 희석되도록 제형화된다. 분무량 (Spray volume)은 헥타르 당 약 1 내지 수천 리터 범위일 수 있으나, 보다 전형적으로는 헥타르 당 약 10 내지 수백 리터 범위이다. 분무형 제형은 공중 또는 지상 적용에 의한 경엽 처리를 위해, 또는 식물의 생육 매지에로의 적용을 위해 물 또는 다른 적절한 매질과 탱크 혼합될 수 있다. 액체 및 건조 제형은 식재 동안에 점적 관개 시스템 내로 직접 계량되거나 도랑 내로 계량될 수 있다. 액체 및 고체 제형은 전신 흡수 (systemic uptake)를 통해 발육 중인 뿌리 및 다른 지하 식물 부분 및/또는 경엽을 보호하기 위해 식재 이전에 종자 처리로서 식물 종자 상에 적용될 수 있다.

[0658] 제형은 전형적으로 총 100 중량%가 되는 하기의 근사적인 범위 내에서 유효량의 활성 성분, 희석제 및 계면활성제를 함유할 것이다.

	중량%		
	활성 성분	희석제	계면활성제
수분산성 및 수용성 과립, 정제 및 분말	0.001-90	0-99.999	0-15
오일 분산액, 현탁제, 에멀전, 용액 (유제 포함)	1-50	40-99	0-50
분체	1-25	70-99	0-5
과립 및 펠릿	0.001-95	5-99.999	0-15
고강도 조성물	90-99	0-10	0-2

[0659]

[0660] 고체 희석제는 예를 들어, 클레이, 예컨대 벤토나이트, 몬트모릴로나이트, 애터필사이트 및 카올린, 석고, 셀룰로오스, 이산화티탄, 산화아연, 전분, 텍스트린, 당 (예를 들어, 락토스, 수크로스), 실리카, 톨크, 운모, 규조토, 우레아, 탄산칼슘, 탄산나트륨 및 중탄산나트륨, 및 황산나트륨을 포함한다. 전형적인 고체 희석제는 문헌 [참조: Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey]에 기재되어 있다.

[0661] 액체 희석제는 예를 들어, 물, N,N-다이메틸알칸아미드 (예를 들어, N,N-다이메틸포름아미드), 리모넨, 다이메틸 설폭사이드, N-알킬피롤리돈 (예를 들어, N-메틸피롤리디논), 에틸렌 글리콜, 트라이에틸렌 글리콜, 프로필렌 글리콜, 다이프로필렌 글리콜, 폴리프로필렌 글리콜, 프로필렌 카르보네이트, 부틸렌 카르보네이트, 파라핀 (예를 들어, 백색 광유, 노르말 파라핀, 아이소파라핀), 알킬벤젠, 알킬나프탈렌, 글리세린, 글리세롤 트리아세테이트, 소르비톨, 트리아세틴, 방향족 탄화수소, 탈방향족 (dearomatized) 지방족 화합물, 알킬벤젠, 알킬나프탈렌, 케톤, 예컨대 사이클로헥사논, 2-헵타논, 아이소포론 및 4-하이드록시-4-메틸-2-펜타논, 아세테이트, 예컨대 아이소아밀 아세테이트, 헥실 아세테이트, 헵틸 아세테이트, 옥틸 아세테이트, 노닐 아세테이트, 트라이데실 아세테이트 및 아이소보르닐 아세테이트, 기타 에스테르, 예컨대 알킬화 락테이트 에스테르, 이염기성 에스테르 및  $\gamma$ -부티로락톤, 및 직쇄상, 분지상, 포화 또는 불포화될 수 있는 알코올, 예컨대 메탄올, 에탄올, n-프로판올, 아이소프로필 알코올, n-부탄올, 아이소부틸 알코올, n-헥산올, 2-에틸헥산올, n-옥탄올, 데칸올, 아이소데실 알코올, 아이소옥타데칸올, 세틸 알코올, 라우릴 알코올, 트라이데실 알코올, 올레일 알코올, 사이클로헥산올, 테트라하이드로푸르푸릴 알코올, 다이아세톤 알코올 및 벤질 알코올을 포함한다. 액체 희석제는 또한 포화 및 불포화 지방산의 글리세롤 에스테르 (전형적으로 C<sub>6</sub>-C<sub>22</sub>), 예컨대 식물 종자 및 과일유 (예를 들어, 올리브유, 피마자유, 아마인유, 참기름, 콘유 (옥수수 기름), 낙화생유, 해바라기씨유, 포도씨유, 홍화유, 면실유, 대두유, 채종유, 코코넛유 및 팜핵유), 동물성 지방 (예를 들어, 우지, 돈지, 라드, 간유, 어유), 및 이들의 혼합물을 포함한다. 액체 희석제는 또한 알킬화 지방산 (예를 들어, 메틸화, 에틸화, 부틸화)을 포함하며, 여기서 지방산은 식물원 및 동물원으로부터의 글리세롤 에스테르의 가수분해에 의해 얻어질 수 있으며, 증류에

의해 정제될 수 있다. 전형적인 액체 희석제는 문헌 [참조: Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950]에 기재되어 있다.

[0662] 본 발명의 고체 및 액체 조성물은 종종 하나 이상의 계면활성제를 포함한다. 계면활성제는 비이온성, 음이온성 또는 양이온성으로 분류될 수 있다. 본 발명의 조성물에 유용한 비이온성 계면활성제로는 알코올 알콕실레이트, 예컨대 천연 및 합성 알코올 (분지상 또는 직쇄상일 수 있음) 계이며, 알코올 및 에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드, 부틸렌 옥사이드 또는 이들의 혼합물로부터 제조된 알코올 알콕실레이트; 아민 에톡실레이트, 알칸올아미드 및 에톡실화 알칸올아미드; 알콕실화 트라이글리세리드, 예컨대 에톡실화 대두유, 피마자유 및 채종유; 알킬페놀 알콕실레이트, 예컨대 옥틸페놀 에톡실레이트, 노닐페놀 에톡실레이트, 다이노닐 페놀 에톡실레이트 및 도데실 페놀 에톡실레이트 (페놀과 에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드, 부틸렌 옥사이드 또는 이들의 혼합물로부터 제조됨); 에틸렌 옥사이드 또는 프로필렌 옥사이드로부터 제조된 블록 중합체 및 역 블록 중합체 (말단 블록이 프로필렌 옥사이드로부터 제조됨); 에톡실화 지방산; 에톡실화 지방 에스테르 및 오일; 에톡실화 메틸 에스테르; 에톡실화 트라이스티릴페놀 (에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드, 부틸렌 옥사이드 또는 이들의 혼합물로부터 제조된 것들을 포함); 지방산 에스테르, 글리세롤 에스테르, 라놀린계 유도체, 폴리 에톡실레이트 에스테르, 예컨대 폴리에톡실화 소르비탄 지방산 에스테르, 폴리에톡실화 소르비톨 지방산 에스테르 및 폴리에톡실화 글리세롤 지방산 에스테르; 기타 소르비탄 유도체, 예컨대 소르비탄 에스테르; 폴리머 계면활성제, 예컨대 랜덤 공중합체, 블록 공중합체, 알키드 peg (폴리에틸렌 글리콜) 수지, 그라프트 또는 콤 (comb) 중합체 및 스타 중합체; 폴리에틸렌 글리콜 (peg); 폴리에틸렌 글리콜 지방산 에스테르; 실리콘계 계면활성제; 및 당 유도체, 예컨대 수크로스 에스테르, 알킬 폴리글리코사이드 및 알킬 폴리사카라이드를 들 수 있으나, 이들에 한정되지 않는다.

[0663] 유용한 음이온성 계면활성제로는 알킬아릴 설포산 및 이의 염; 카르복실화 알코올 또는 알킬페놀 에톡실레이트; 다이페닐 설포네이트 유도체; 리그닌 및 리그닌 유도체, 예컨대 리그노설포네이트; 말레산 또는 석신산 또는 이들의 무수물; 올레핀 설포네이트; 포스페이트 에스테르, 예컨대 알코올 알콕실레이트의 포스페이트 에스테르, 알킬페놀 알콕실레이트의 포스페이트 에스테르 및 스티릴 페놀 에톡실레이트의 포스페이트 에스테르; 단백질을 계면활성제; 사르코신 유도체; 스티릴 페놀 에테르 설페이트; 오일 및 지방산의 설페이트 및 설포네이트; 에톡실화 알킬페놀의 설페이트 및 설포네이트; 알코올의 설페이트; 에톡실화 알코올의 설페이트; 아민 및 아미드의 설포네이트, 예컨대 N,N-알킬타우레이트; 벤젠, 쿠멘, 톨루엔, 자일렌, 및 도데실벤젠 및 트라이데실벤젠의 설포네이트; 축합 나프탈렌의 설포네이트; 나프탈렌 및 알킬나프탈렌의 설포네이트; 분별 증류된 (fractionated) 석유의 설포네이트; 설포석시나메이트; 및 설포석시네이트 및 그 유도체, 예컨대 다이알킬 설포석시네이트 염을 들 수 있으나, 이들에 한정되지 않는다.

[0664] 유용한 양이온성 계면활성제로는 아미드 및 에톡실화 아미드; 아민, 예컨대 N-알킬 프로판다이아민, 트라이프로필렌트라이아민 및 다이프로필렌테트라민, 및 에톡실화 아민, 에톡실화 다이아민 및 프로콕실화 아민 (아민과 에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드, 부틸렌 옥사이드 또는 이들의 혼합물로부터 제조됨); 아민 염, 예컨대 아민 아세테이트 및 다이아민 염; 사차 암모늄 염, 예컨대 사차 염, 에톡실화 사차 염 및 이중사차 (diquaternary) 염; 및 아민 옥사이드, 예컨대 알킬다이메틸아민 옥사이드 및 비스-(2-하이드록시에틸)-알킬아민 옥사이드를 들 수 있으나, 이들에 한정되지 않는다.

[0665] 비이온성 계면활성제와 음이온성 계면활성제의 혼합물, 또는 비이온성 계면활성제와 양이온성 계면활성제의 혼합물도 본 발명의 조성물에 유용하다. 비이온성, 음이온성 및 양이온성 계면활성제 및 이들의 추천 용도는 문헌 [참조: McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.]; 문헌 [참조: Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964]; 및 문헌 [참조: A. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987]을 비롯한 다양한 간행된 참조문헌에 개시되어 있다.

[0666] 본 발명의 조성물은 또한 제형 조제로서 당업자에게 알려진 제형 보조제 및 첨가제를 함유할 수 있다. 그러한 제형 보조제 및 첨가제는 pH (완충제), 가공 중의 발포 (소포제, 예를 들어, 폴리오르가노실록산 (예를 들어, 로도실 (Rhodorsil)® 416)), 활성 성분의 침강 (현탁제), 점도 (요변성 증점제), 용기내 (in-container) 미생물 성장 (항균제), 제품 동결 (부동제), 색상 (염료/안료 분산액 (예를 들어, 프로-이제드 (Pro-Ized)® 컬러 런트 레드 (Colorant Red)), 워시-오프 (필름 형성제 또는 스티커), 증발 (증발 지연제), 및 다른 제형 속성을 제어할 수 있다. 필름 형성제는 예를 들어, 폴리비닐 아세테이트, 폴리비닐 아세테이트 공중합체, 폴리비닐피

폴리돈-비닐 아세테이트 공중합체, 폴리비닐 알코올, 폴리비닐 알코올 공중합체 및 왁스를 포함한다. 제형 보조제 및 첨가제의 예로는 문헌 [참조: McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.]; 및 국제 특허 공개 WO 03/024222호에 열거된 것들을 들 수 있다.

[0667] 유제를 비롯한 용액은 성분들을 단순히 혼합함으로써 제조될 수 있다. 유제로서 사용하려는 액체 조성물의 용매가 수불혼화성인 경우에는, 물로 희석시에 활성제 함유 용매를 유화시키기 위하여 유화제가 전형적으로 첨가된다. 2,000  $\mu\text{m}$  이하의 입경을 가진 활성 성분 슬러리는 매체 밀을 이용하여 습식 밀링하여, 평균 직경이 3  $\mu\text{m}$  미만인 입자를 얻을 수 있다. 수성 슬러리는 완성된 액상 수화제로 제조되거나 (예를 들어, 미국 특허 제 3,060,084호 참조) 또는 분무 건조에 의해 추가로 가공되어 수분산성 과립을 형성할 수 있다. 건조 제형은 통상 건조 밀링 공정을 필요로 하며, 이것에 의해 2 내지 10  $\mu\text{m}$  범위의 평균 입경이 형성된다. 분제 및 분말은 블렌딩 및 통상, 해머 밀 또는 유체 에너지 밀에서와 같은 분쇄에 의해 제조될 수 있다. 과립 및 펠릿은 활성 물질을 미리 형성된 과립 담체 상에 분무함으로써 또는 응집 기술에 의해 제조될 수 있다. 문헌 [Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-48], 문헌 [Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 및 그 이하] 및 국제 특허 공개 WO 91/13546호를 참조한다. 펠릿은 미국 특허 제4,172,714호에 개시된 바와 같이 제조될 수 있다. 수분산성 및 수용성 과립은 미국 특허 제4,144,050호, 제3,920,442호 및 독일 특허 제3,246,493호에 교시된 바와 같이 제조될 수 있다. 정제는 미국 특허 제5,180,587호, 제5,232,701호 및 제5,208,030호에 교시된 바와 같이 제조될 수 있다. 필름은 영국 특허 제2,095,558호 및 미국 특허 제3,299,566호에 교시된 바와 같이 제조될 수 있다.

[0668] 제형화 분야에 관한 추가의 정보에 대해서는, 문헌 [T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133]을 참조한다. 또한 미국 특허 제3,235,361호, 컬럼 6, 16행 내지 컬럼 7, 19행 및 실시예 10 내지 41; 미국 특허 제3,309,192호, 컬럼 5, 43행 내지 컬럼 7, 62행 및 실시예 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138 내지 140, 162 내지 164, 166, 167 및 169 내지 182; 미국 특허 제2,891,855호, 컬럼 3, 66행 내지 컬럼 5, 17행 및 실시예 1 내지 4; 문헌 [Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96]; 문헌 [Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989]; 및 문헌 [Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000]을 참조한다.

[0669] 하기 실시예에서, 모든 백분율은 중량 기준이며, 모든 제형은 통상적인 방식으로 제조된다. 화합물 번호는 인덱스 표 A의 화합물을 말한다.

#### [0670] 실시예 A

##### 고강도 농축물

화합물 1	98.5%
실리카 에어로젤	0.5 %
합성 비결정질 미세 실리카	1.0 %.

[0671]

#### [0672] 실시예 B

##### 습윤성 분말

화합물 2	65.0 %
도데실케놀 폴리에틸렌 글리콜 에테르	2.0 %
소듐 리그닌설포네이트	4.0 %
소듐 실리코알루미네이트	6.0 %
몬트모릴로나이트 (소성됨)	23.0 %.

[0673]

[0674]

실시예 C

과립

화합물 1	10.0 %
에터컬자이트 과립 (저 휘발성 물질, 0.71/0.30 mm; U.S.S. No. 25-50 시브 (sieve))	90.0 %.

[0675]

[0676]

실시예 D

수성 현탁액

화합물 2	25.0 %
수화 에터컬자이트	3.0 %
조제의 칼슘 리그닌설포네이트	10.0%
인산이수소나트륨	0.5 %
물	61.5 %.

[0677]

[0678]

실시예 E

압출 펠릿

화합물 1	25.0 %
무수 황산나트륨	10.0 %
조제의 칼슘 리그닌설포네이트	5.0 %
소듐 알킬나프탈렌설포네이트	1.0 %
칼슘/마그네슘 벤토나이트	59.0 %.

[0679]

[0680]

실시예 F

마이크로에멀전

화합물 2	1.0%
트라이아세틴	30.0 %
C <sub>8</sub> -C <sub>10</sub> 알킬폴리글리코사이드	30.0 %
글리세릴 모노올레레이트	19.0 %
물	20.0 %.

[0681]

[0682]

실시예 G

유제

화합물 1	10.0%
C <sub>8</sub> -C <sub>10</sub> 지방산 메틸에스테르	70.0 %
폴리옥시에틸렌 소르비톨 헥솔레이트	20.0 %.

[0683]

[0684]

본 발명의 화합물 (즉, 화학식 1의 화합물, 이의 N-옥사이드, 및 이의 염)은 식물병 방제제로서 유용하다. 따라서, 본 발명은 또한 유효량의 본 발명의 화합물 또는 상기 화합물을 함유하는 살균제 조성물을 보호할 식물 또는 이의 부분, 또는 보호할 식물 종자에 적용하는 것을 포함하는, 균류 식물 병원체에 의한 식물병을 방제하는 방법을 포함한다. 본 발명의 화합물 및/또는 조성물은 담자균류 (Basidiomycete), 자낭균류 (Ascomycete), 난균류 (Oomycete) 및 불완전 균류 (Deuteromycete)의 광범위한 균류 식물 병원체에 의한 병해 방제를 제공한다. 이들은 광범위한 식물병, 특히 관상용 작물, 잔디, 야채, 농작물, 곡물, 및 과실 작물의 경엽 병원체를 방제하는데 유효하다. 이러한 병원체는 파이토프토라 (Phytophthora) 병, 예컨대 파이토프토라 인페스탄스 (Phytophthora infestans), 파이토프토라 메가스페르마 (Phytophthora megasperma), 파이토프토라 파라시티카 (Phytophthora parasitica), 파이토프토라 신나모미 (Phytophthora cinnamomi) 및 파이토프토라 캡사이시 (Phytophthora capsici), 피티움 (Pythium) 병, 예컨대 피티움 아파니데르마툼 (Pythium aphanidermatum), 및 페로노스포라세아에 패밀리 (Peronosporaceae family)의 병, 예컨대 플라스모파라 비티콜라 (Plasmopara viticola), 페로노스포라 스피시스 (Peronospora spp. ) (페로노스포라 타바시나 (Peronospora tabacina) 및 페로노스포라 파라시티카 (Peronospora parasitica) 포함), 슈도페로노스포라 스피시스 (Pseudoperonospora spp.) (슈도페로노스포라 쿠벤시스 (Pseudoperonospora cubensis) 포함) 및 브레미아 락투카에 (Bremia



lactucae)를 포함하는 난균류; 알테르나리아 (*Alternaria*) 병, 예컨대 알테르나리아 솔라니 (*Alternaria solani*) 및 알테르나리아 브라시카에 (*Alternaria brassicae*), 귀그나르디아 (*Guignardia*) 병, 예컨대 귀그나르디아 비드웰 (*Guignardia bidwell*), 벤투리아 (*Venturia*) 병, 예컨대 벤투리아 이나에퀼리스 (*Venturia inaequalis*), 셉토리아 (*Septoria*) 병, 예컨대 셉토리아 노도룸 (*Septoria nodorum*) 및 셉토리아 트리티시 (*Septoria tritici*), 흰가루병, 예컨대 에리시페 스피시스 (*Erysiphe spp.*) (에리시페 그라미니스 (*Erysiphe graminis*) 및 에리시페 폴리고니 (*Erysiphe polygoni*) 포함), 운시눌라 네카투르 (*Uncinula necatur*), 스파에로테카 폴리게나 (*Sphaerotheca fuliginea*) 및 포도스파에라 류코트리카 (*Podosphaera leucotricha*), 슈도세르코스포렐라 헤르포트리코이데스 (*Pseudocercospora herpotrichoides*), 보트리티스 (*Botrytis*) 병, 예컨대 보트리티스 시네레아 (*Botrytis cinerea*), 몬닐리니아 프룩티콜라 (*Monilinia fructicola*), 스크레로티니아 (*Sclerotinia*) 병, 예컨대 스크레로티니아 스크레로티움 (*Sclerotinia sclerotiorum*), 마그나포르테 그리세아 (*Magnaporthe grisea*), 포몹시스 비티콜라 (*Phomopsis viticola*), 헬민토스포리움 (*Helminthosporium*) 병, 예컨대 헬민토스포리움 트리티시 레펜티스 (*Helminthosporium tritici repentis*), 피레노포라 테레스 (*Pyrenophora teres*), 안트라크노세 (*anthracnose*) 병, 예컨대 글로메렐라 (*Glomerella*) 또는 콜레토티리움 스피시스 (*Colletotrichum spp.*) (예컨대, 콜레토티리움 그라미니콜라 (*Colletotrichum graminicola*) 및 콜레토티리움 오르비쿨라레 (*Colletotrichum orbiculare*)), 및 가에우만노마이세스 그라미니스 (*Gaeumannomyces graminis*)를 포함하는 자낭균류 (*Ascomycetes*); 푸시니아 스피시스 (*Puccinia spp.*) (예컨대 푸시니아 레콘디타 (*Puccinia recondita*), 푸시니아 스트리이포르미스 (*Puccinia striiformis*), 푸시니아 호르데이 (*Puccinia hordei*), 푸시니아 그라미니스 (*Puccinia graminis*) 및 푸시니아 아라키디스 (*Puccinia arachidis*)), 헤밀레이아 바스타트릭스 (*Hemileia vastatrix*) 및 파콥소라 파키리지 (*Phakopsora pachyrhizi*)에 의한 녹병 (rust disease)을 포함하는 담자균류 (*Basidiomycetes*); 리조크토니아 스피시스 (*Rhizoctonia spp.*) (예컨대, 리조크토니아 솔라니 (*Rhizoctonia solani*))를 포함하는 다른 병원체; 푸사리움 (*Fusarium*) 병, 예컨대 푸사리움 로세움 (*Fusarium roseum*), 푸사리움 그라미네아룸 (*Fusarium graminearum*) 및 푸사리움 옥시스포룸 (*Fusarium oxysporum*); 베르티실리움 달리아에 (*Verticillium dahliae*); 스크레로티움 롤프시이 (*Sclerotium rolfsii*); 린코스포리움 세칼리스 (*Rhynchosporium secalis*); 세르코스포리디움 페르소나툼 (*Cercosporidium personatum*), 세르코스포라 아라키디콜라 (*Cercospora arachidicola*) 및 세르코스포라 베티콜라 (*Cercospora beticola*); 및 이들 병원체와 근연 관계에 있는 기타 속 (*genus*) 및 종을 포함한다. 조성물 또는 배합물은 이들의 살균 활성 이외에도, 박테리아, 예컨대 에르위니아 아밀로보라 (*Erwinia amylovora*), 크산토모나스 캄페스트리스 (*Xanthomonas campestris*), 슈도모나스 시링가에 (*Pseudomonas syringae*), 및 다른 근연 종에 대한 활성도 갖는다. 주목해야 할 것은 자낭균류 및 난균류에 의한 병해 방제를 제공한다는 것이다. 특히 주목해야 할 것은 난균류에 의한 병해 방제를 제공한다는 것이다.

- [0685] 식물병 방제는 통상 유효량의 본 발명의 화합물을 감염-전이나 감염-후에 보호할 식물의 부분, 예컨대 뿌리, 줄기, 경엽, 열매, 종자, 덩이 줄기 또는 구근, 또는 보호할 식물이 생육하고 있는 배지 (토양 또는 샌드)에 적용함으로써 달성된다. 화합물은 또한 종자 및 종자에서 발생하는 모종을 보호하도록 종자에 적용될 수 있다. 화합물은 또한 식물을 처리하도록 관개 용수를 통해 적용될 수 있다.
- [0686] 이들 화합물의 적용량 (rate of application)은 다수의 환경 인자에 의해 영향을 받을 수 있으며, 실제 사용 조건하에 결정되어야 한다. 경엽은 통상 활성 성분 약 1 g/ha 미만 내지 약 5,000 g/ha의 비율로 처리되는 경우에 보호될 수 있다. 종자 및 모종은 통상 종자가 종자 1 킬로그램 당 약 0.1 내지 약 10 g의 비율로 처리되는 경우에 보호될 수 있다.
- [0687] 본 발명의 화합물은 또한 살균제, 살충제, 살선충제, 살세균제 (bactericide), 진드기 구충제, 제초제, 제초제 완화제, 생장 조절제, 예컨대 곤충 탈피 억제제 (insect molting inhibitor) 및 발근 촉진제 (rooting stimulant), 불임화제, 신호 화학물질 (semiochemicals), 방충제, 유인 물질, 페로몬, 섭식 촉진 물질, 식물 영양소, 다른 생물 활성 화합물 또는 곤충병원성 세균, 곤충병원 바이러스 또는 곤충병원균을 비롯한 하나 이상의 다른 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제와 혼합되어, 훨씬 더 광범위한 농업 보호를 부여하는 다성분 농약을 생성할 수 있다. 따라서, 본 발명은 또한 살균적 유효량의 화학식 1의 화합물 및 생물학적 유효량의 적어도 하나의 추가의 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제를 포함하는 조성물에 관한 것으로, 추가로 계면활성제, 고체 희석제 또는 액체 희석제 중 적어도 하나를 포함할 수 있다. 다른 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제는 계면활성제, 고체 또는 액체 희석제 중 적어도 하나를 포함하는 조성물 중에서 제형화될 수 있다. 본 발명의 혼합물에 관해서는, 하나 이상의 다른 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제는 프리믹스 (premix)를 형성하도록 화학식 1의 화합물과 함께 제형화될 수 있거나, 하나 이상의 다른 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제는 화학식 1의 화합물과는 별도로 제형화될 수 있으며, 제형은 적용 전에 배합되거나 (예를 들어, 스프레이 탱크 중에서), 연

속하여 적용된다.

- [0688] 화학식 1의 화합물 이외에도, 부류 (1) 메틸 벤즈이미다졸 카르바메이트 (MBC) 살균제; (2) 다이카르복스이미드 살균제; (3) 탈메틸화 저해제 (DMI) 살균제; (4) 페닐아미드 살균제; (5) 아민/모르폴린 살균제; (6) 인지질 생합성 저해제 살균제; (7) 카르복스아미드 살균제; (8) 하이드록시(2-아미노-)피리미딘 살균제; (9) 아닐리노피리미딘 살균제; (10) N-페닐 카르바메이트 살균제; (11) 퀴논 아웃사이드 (outside) 저해제 (QoI) 살균제; (12) 페닐피롤 살균제; (13) 퀴놀린 살균제; (14) 지질 과산화 저해제 살균제; (15) 멜라닌 생합성 저해제-환원 효소 (MBI-R) 살균제; (16) 멜라닌 생합성 저해제-탈수 효소 (MBI-D) 살균제; (17) 하이드록시아닐리드 살균제; (18) 스쿠알렌-에폭시다아제 저해제 살균제; (19) 폴리옥신 살균제; (20) 페닐우레아 살균제; (21) 퀴논 인사이드 (inside) 저해제 (QiI) 살균제; (22) 벤즈아미드 살균제; (23) 에노피라누론산 (enopyranuronic acid) 항생제 살균제; (24) 헥소피라노실 항생제 살균제; (25) 글루코피라노실 항생제: 단백질 합성 살균제; (26) 글루코피라노실 항생제: 트레할라아제 및 이노시톨 생합성 살균제; (27) 시아노아세트아미드옥심 살균제; (28) 카르바메이트 살균제; (29) 산화적 인산화 언커플링 (uncoupling) 살균제; (30) 유기 주석 살균제; (31) 카르복실산 살균제; (32) 헤테로 방향족 살균제; (33) 포스포네이트 살균제; (34) 프탈람산 (phthalamic acid) 살균제; (35) 벤조트라이아진 살균제; (36) 벤젠-설폰아미드 살균제; (37) 피리다지논 살균제; (38) 티오오펜-카르복스아미드 살균제; (39) 피리미딘아미드 살균제; (40) 카르복실산 아미드 (CAA) 살균제; (41) 테트라사이클린 항생제 살균제; (42) 티오카르바메이트 살균제; (43) 벤즈아미드 살균제; (44) 숙주 식물 방어 유도 살균제; (45) 멀티사이트 접촉 활성 살균제; (46) 부류 (1) 내지 (45) 이외의 살균제; 및 부류 (1) 내지 (46)의 화합물의 염으로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 살균제 화합물을 포함하는 조성물에 주목해야 한다.
- [0689] 이들 살균제 화합물 부류에 대한 추가의 설명이 하기에 주어진다.
- [0690] (1) "메틸 벤즈이미다졸 카르바메이트 (MBC) 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 1)는 미소관 중합 (microtubule assembly) 시에  $\beta$ -튜불린에 결합함으로써, 유사 분열을 저해한다. 미소관 중합 저해는 세포 분열, 세포 내의 수송 및 세포 구조를 방해할 수 있다. 메틸 벤즈이미다졸 카르바메이트 살균제로는 벤즈이미다졸 및 티오파네이트 살균제를 들 수 있다. 벤즈이미다졸로는 베노밀, 카르벤다짐, 푸베리다졸 및 티아벤다졸을 들 수 있다. 티오파네이트로는 티오파네이트 및 티오파네이트-메틸을 들 수 있다.
- [0691] (2) "다이카르복스이미드 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 2)는 NADH 사이토크롬 c 환원 효소 저해를 통해 균류에서의 지질 과산화를 저해하는데 제시된다. 이의 예로는 클로졸리네이트, 이프로디온, 프로사이미돈 및 빈클로졸린을 들 수 있다.
- [0692] (3) "탈메틸화 저해제 (DMI) 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 3)는 스테롤 생성에 중요한 역할을 하는 C14-탈메틸화 효소를 저해한다. 스테롤, 예컨대 에르고스테롤은 기능 세포벽의 발육에 필수적인 막 구조 및 막 기능에 필요하다. 따라서, 이들 살균제에 노출되면, 감수성 균류의 비정상 성장을 초래하여, 결국은 감수성 균류의 사멸을 가져온다. DMI 살균제는 몇 가지의 화학적 분류로 나뉘어진다: 아졸 (트라이아졸 및 이미다졸 포함), 피리미딘, 피페라진 및 피리딘. 트라이아졸로는 아자코나졸, 비터타놀, 브로무코나졸, 사이프로코나졸, 디페노코나졸, 디니코나졸 (디니코나졸-M 포함), 에폭시코나졸, 펜부코나졸, 플루코코나졸, 플루실라졸, 플루트리아폴, 헥사코나졸, 이미벤코나졸, 이프로코나졸, 메트코나졸, 마이클로부타닐, 웬코나졸, 프로피코나졸, 프로티오코나졸, 퀴코나졸, 시메코나졸, 테부코나졸, 테트라코나졸, 트라이아디메논, 트라이아디메놀, 트라이티코나졸 및 유니코나졸을 들 수 있다. 이미다졸로는 클로트리마졸, 이마잘릴, 옥스포코나졸, 프로클로라즈, 페푸라조에이트 및 트라이플루미졸을 들 수 있다. 피리미딘으로는 페나리몰 및 누아리몰을 들 수 있다. 피페라진으로는 트리포린을 들 수 있다. 피리딘으로는 피리페녹스를 들 수 있다. 생화학적 연구에 의하면, 상기에 언급된 살균제 전부가 문헌 [참조: K. H. Kuck et al. in Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 205-258]에 기재된 DMI 살균제임을 알 수 있다.
- [0693] (4) "페닐아미드 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 4)는 난균류에 있어서의 RNA 폴리메라아제의 특이적 저해제이다. 이들 살균제에 노출된 감수성 균류는 우리딘을 rRNA에 혼입하는 능력이 감소된다. 감수성 균류의 성장 및 발육은 이러한 부류의 살균제에 노출시킴으로써 저지된다. 페닐아미드 살균제로는 아실알라닌, 옥사졸리디논 및 부티로락톤 살균제를 들 수 있다. 아실알라닌으로는 베날락실, 베날락실-M, 푸랄락실, 메탈락실 및 메탈락실-M/메페녹삼을 들 수 있다. 옥사졸리디논으로는 옥사디실을 들 수 있다. 부티로락톤으로는 오프레이스를 들 수 있다.
- [0694] (5) "아민/모르폴린 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 5)는 스테롤 생합성 경로

내의 2개의 표적 부위,  $\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$  아이소메라아제 및  $\Delta^{14}$  환원 효소를 저해한다. 스테롤, 예컨대 에르고스테롤은 기능 세포벽의 발육에 필수적인 막 구조 및 막 기능에 필요하다. 따라서, 이들 살균제에 노출되면, 감수성 균류의 비정상 성장을 초래하여, 결국은 감수성 균류의 사멸을 가져온다. 아민/모르폴린 살균제 (비 DMI (non-DMI) 스테롤 생합성 저해제로도 공지됨)로는 모르폴린, 피페리딘 및 스피로케탈-아민 살균제를 들 수 있다. 모르폴린으로는 알디모르프, 도데모르프, 펜프로피모르프, 트라이데모르프 및 트라이모르파미드를 들 수 있다. 피페리딘으로는 펜프로피딘 및 피페랄린을 들 수 있다. 스피로케탈-아민으로는 스피록사민을 들 수 있다.

[0695] (6) "인지질 생합성 저해제 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 6)는 인지질 생합성에 영향을 미침으로써 균류 성장을 저해한다. 인지질 생합성 살균제로는 포스포티올레이트 및 다이티올란 살균제를 들 수 있다. 포스포티올레이트로는 에디펜포스, 이프로벤포스 및 피라조포스를 들 수 있다. 다이티올란으로는 아이소프로티올란을 들 수 있다.

[0696] (7) "카르복사미드 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 7)는 석신산 탈수소효소로 명명되는 크레브스 회로 (TCA 회로)의 중요한 효소를 방해함으로써 복합체 II (석신산 탈수소효소) 균류 호흡을 저해한다. 호흡 저해에 의해, 균류가 ATP 생성하는 것을 저지하므로, 균류의 성장 및 번식을 저해한다. 카르복사미드 살균제로는 벤즈아미드, 푸란 카르복사미드, 옥사티인 (oxathiin) 카르복사미드, 티아졸 카르복사미드, 피라졸 카르복사미드 및 피리딘 카르복사미드를 들 수 있다. 벤즈아미드로는 베노다닐, 플루톨라닐 및 메프로닐을 들 수 있다. 푸란 카르복사미드로는 펜푸람을 들 수 있다. 옥사티인 카르복사미드로는 카르복신 및 옥시카르복신을 들 수 있다. 티아졸 카르복사미드로는 티플루자미드를 들 수 있다. 피라졸 카르복사미드로는 푸라메트피르, 펜티오피라드, 빅사펜, N-[2-(1S,2R)-[1,1'-바이사이클로프로필]-2-일페닐]-3-(다이플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드 및 N-[2-(1,3-다이메틸부틸)페닐]-5-플루오로-1,3-다이메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드를 들 수 있다. 피리딘 카르복사미드로는 보스칼리드를 들 수 있다.

[0697] (8) "하이드록시(2-아미노-)피리미딘 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 8)는 아데노신 데아미나아제 저해에 의해 핵산 합성을 저해한다. 이의 예로는 부피리메이트, 디메티리몰 및 에티리몰을 들 수 있다.

[0698] (9) "아닐리노피리미딘 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 9)는 아미노산 메티오닌의 생합성을 저해하고, 감염 중에 식물 세포를 용해시키는 가수분해 효소의 분비를 방해하는 것으로 제시된다. 이의 예로는 사이프로디닐, 메파니피림 및 피리메타닐을 들 수 있다.

[0699] (10) "페닐 카르바메이트 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 10)는  $\beta$ -튜불린에 결합하여, 미소관 중합을 방해함으로써, 유사 분열을 저해한다. 미소관 중합 저해는 세포 분열, 세포 내의 수송 및 세포 구조를 방해할 수 있다. 이의 예로는 디에토펜카브를 들 수 있다.

[0700] (11) "퀴논 아웃사이드 저해제 (QoI) 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 11)는 유비퀴놀 산화 효소에 영향을 미침으로써 균류의 복합체 III 미토콘드리아 호흡을 저해한다. 유비퀴놀 산화는 균류의 미토콘드리아 내막에 위치하는 사이토크롬  $bc_1$  복합체의 "퀴논 아웃사이드" ( $Q_o$ ) 부위에서 저지된다. 미토콘드리아 호흡 저해는 정상적인 균류 성장 및 발육을 저지시킨다. 퀴논 아웃사이드 저해제 살균제 (스트로빌루린 살균제로도 공지됨)로는 메톡시아크릴레이트, 메톡시카르바메이트, 옥시미노아세테이트, 옥시미노아세트아미드, 옥사졸리딘디온, 다이하이드로다이옥사진, 이미다졸리논 및 벤질카르바메이트 살균제를 들 수 있다. 메톡시아크릴레이트로는 아족시스트로빈, 에네스트로부린 (SYP-Z071) 및 피콕시스트로빈을 들 수 있다. 메톡시카르바메이트로는 피라클로스트로빈을 들 수 있다. 옥시미노아세테이트로는 크레속심-메틸 및 트라이플록시스트로빈을 들 수 있다. 옥시미노아세트아미드로는 디목시스트로빈, 메토미노스트로빈, 오리사스트로빈,  $\alpha$ -[메톡시이미노]-N-메틸-2-[[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]에톡시]이미노]메틸]벤젠아세트아미드 및 2-[[[3-(2,6-다이클로로페닐)-1-메틸-2-프로펜-1-일리덴]아미노]옥시]메틸]- $\alpha$ -(메톡시이미노)-N-메틸벤젠아세트아미드를 들 수 있다. 옥사졸리딘디온으로는 파목사돈을 들 수 있다. 다이하이드로다이옥사진으로는 플루옥사스트로빈을 들 수 있다. 이미다졸리논으로는 페나미돈을 들 수 있다. 벤질카르바메이트로는 피리벤카브를 들 수 있다.

[0701] (12) "페닐피롤 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 12)는 균류의 삼투압 시그널 전달과 관련된 MAP 단백질 키나아제를 저해한다. 펜피클로닐 및 플루디옥소닐은 이러한 살균제 부류의 예이다.

[0702] (13) "퀴놀린 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 13)는 초기 세포 시그널링에서 G-단백질에 영향을 미침으로써 시그널 전달을 저해하는 것으로 제시된다. 이들은 흰가루병을 일으키는 균류의 발아 및/또는 부착기 형성을 저해하는 것으로 밝혀졌다. 퀴녹시펜은 이러한 살균제 부류의 일례이다.



- [0703] (14) "지질 과산화 저해제 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 14)는 균류의 막 합성에 영향을 미치는 지질 과산화를 저해하는 것으로 제시된다. 이러한 부류의 구성원, 예컨대 에트리다리아졸은 또한 기타 생물학적 과정, 예컨대 호흡 및 멜라닌 생합성에 영향을 미칠 수 있다. 지질 과산화 살균제로는 방향족 탄소 및 1,2,4-티아다리아졸 살균제를 들 수 있다. 방향족 탄소 살균제로는 바이페닐, 클로로넵, 디클로란, 퀴토젠, 텍나젠 및 톨클로포스-메틸을 들 수 있다. 1,2,4-티아다리아졸 살균제로는 에트리다리아졸을 들 수 있다.
- [0704] (15) "멜라닌 생합성 저해제-환원 효소 (MBI-R) 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 16.1)는 멜라닌 생합성에서의 나프탈 환원 (naphthal reduction) 단계를 저해한다. 멜라닌은 일부의 균류에 의한 숙주 식물 감염에 필요하다. 멜라닌 생합성 저해제-환원 효소 살균제로는 아이소벤조푸라논, 피롤로퀴놀리논 및 트리아아졸로벤조티아졸 살균제를 들 수 있다. 아이소벤조푸라논으로는 프탈라이드를 들 수 있다. 피롤로퀴놀리논으로는 피로퀼론을 들 수 있다. 트리아아졸로벤조티아졸로는 트라이사이클라졸을 들 수 있다.
- [0705] (16) "멜라닌 생합성 저해제-탈수 효소 (MBI-D) 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 16.2)는 멜라닌 생합성에서의 시탈론 탈수 효소를 저해한다. 멜라닌은 일부의 균류에 의한 숙주 식물 감염에 필요하다. 멜라닌 생합성 저해제-탈수 효소 살균제로는 사이클로프로판카르복스아미드, 카르복스아미드 및 프로피온아미드 살균제를 들 수 있다. 사이클로프로판카르복스아미드로는 카르프로파미드를 들 수 있다. 카르복스아미드로는 디클로사이메트를 들 수 있다. 프로피온아미드로는 페녹사닐을 들 수 있다.
- [0706] (17) "하이드록시아닐리드 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 17)는 스테롤 생성에 중요한 역할을 하는 C4-탈메틸화 효소를 저해한다. 이의 예로는 펜헥사미드를 들 수 있다.
- [0707] (18) "스쿠알렌-에폭시다아제 저해제 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 18)는 에르고스테롤 생합성 경로에서의 스쿠알렌-에폭시다아제를 저해한다. 스테롤, 예컨대 에르고스테롤은 기능 세포벽의 발육에 필수적인 막 구조 및 막 기능에 필요하다. 따라서, 이들 살균제에 노출되면, 감수성 균류의 비정상 성장을 초래하여, 결국은 감수성 균류의 사멸을 가져온다. 스쿠알렌-에폭시다아제 저해제 살균제로는 티오카르바메이트 및 알릴아민 살균제를 들 수 있다. 티오카르바메이트로는 피리부티카브를 들 수 있다. 알릴아민으로는 나프티핀 및 테르비나핀을 들 수 있다.
- [0708] (19) "폴리옥신 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 19)는 키틴 신타아제를 저해한다. 이의 예로는 폴리옥신을 들 수 있다.
- [0709] (20) "페닐우레아 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 20)는 세포 분열에 영향을 미치는 것으로 제시된다. 이의 예로는 펜사이쿠론을 들 수 있다.
- [0710] (21) "퀴논 인사이드 저해제 (QiI) 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 21)는 유비퀴놀 환원 효소에 영향을 미침으로써 균류의 복합체 III 미토콘드리아 호흡을 저해한다. 유비퀴놀 환원은 균류의 미토콘드리아 내막에 위치하는 사이토크롬  $bc_1$  복합체의 "퀴논 인사이드" ( $Q_i$ ) 부위에서 저지된다. 미토콘드리아 호흡 저해는 정상적인 균류 성장 및 발육을 저지시킨다. 퀴논 인사이드 저해제 살균제로는 시아노이미다졸 및 설파모일트리아아졸 살균제를 들 수 있다. 시아노이미다졸로는 시아조파미드를 들 수 있다. 설파모일트리아아졸로는 아미설브롬을 들 수 있다.
- [0711] (22) "벤즈아미드 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 22)는  $\beta$ -튜블린에 결합하여, 미소관 중합을 방해함으로써, 유사 분열을 저해한다. 미소관 중합 저해는 세포 분열, 세포 내의 수송 및 세포 구조를 방해할 수 있다. 이의 예로는 족사미드를 들 수 있다.
- [0712] (23) "에노피라누론산 항생제 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 23)는 단백질 생합성에 영향을 미침으로써 균류 성장을 저해한다. 이의 예로는 블라스티시딘-S를 들 수 있다.
- [0713] (24) "헥소피라노실 항생제 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 24)는 단백질 생합성에 영향을 미침으로써 균류 성장을 저해한다. 이의 예로는 카수가마이신을 들 수 있다.
- [0714] (25) "글루코피라노실 항생제: 단백질 합성 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 25)는 단백질 생합성에 영향을 미침으로써 균류 성장을 저해한다. 이의 예로는 스트렙토마이신을 들 수 있다.
- [0715] (26) "글루코피라노실 항생제: 트레할라아제 및 이노시톨 생합성 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 26)는 이노시톨 생합성 경로에서의 트레할라아제를 저해한다. 이의 예로는 발리다마이

신을 들 수 있다.

- [0716] (27) "시아노아세트아미드옥심 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 27)로는 사이목사닐을 들 수 있다.
- [0717] (28) "카르바메이트 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 28)는 균류 성장의 멀티사이트 저해제인 것으로 고려된다. 이들은 세포막의 지방산 합성을 저해한 다음에, 세포막 투과성을 방해하는 것으로 제시된다. 프로파마카브, 프로파마카브-하이드로클로라이드, 요오도카브, 및 프로티오카브는 이러한 살균제 부류의 예이다.
- [0718] (29) "산화적 인산화 언커플링 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 29)는 언커플링 산화적 인산화에 의해 균류 호흡을 저해한다. 호흡 저해는 정상적인 균류 성장 및 발육을 저지시킨다. 이러한 부류로는 2,6-다이니트로아닐린, 예컨대 플루아지남, 피리미돈하이드라존, 예컨대 페림존 및 다이니트로페닐 크로토네이트, 예컨대 디노캡, 엠틸디노캡 및 비나프크릴을 들 수 있다.
- [0719] (30) "유기 주석 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 30)는 산화적 인산화 경로에서의 아데노신 트라이포스페이트 (ATP) 신타아제를 저해한다. 이의 예로는 펜틴 아세테이트, 펜틴 클로라이드 및 펜틴 하이드록사이드를 들 수 있다.
- [0720] (31) "카르복실산 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 31)는 데옥시리보핵산 (DNA) 토포아이소메라아제형 II (자이라아제)에 영향을 미침으로써 균류 성장을 저해한다. 이의 예로는 옥솔린산을 들 수 있다.
- [0721] (32) "헤테로 방향족 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 32)는 DNA/리보핵산 (RNA) 합성에 영향을 미치는 것으로 제시된다. 헤테로 방향족 살균제로는 아이속사졸 및 아이소티아졸론 살균제를 들 수 있다. 아이속사졸로는 하이멕사졸을 들 수 있으며, 아이소티아졸론으로는 옥틸리논을 들 수 있다.
- [0722] (33) "포스포네이트 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 33)로는 포세틸-알루미늄을 비롯한 아인산 및 이의 각종 염을 들 수 있다.
- [0723] (34) "프탈람산 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 34)로는 테클로프탈람을 들 수 있다.
- [0724] (35) "벤조트라이아진 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 35)로는 트라이아족사이드를 들 수 있다.
- [0725] (36) "벤젠-설펜아미드 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 36)로는 플루설파미드를 들 수 있다.
- [0726] (37) "피리다지논 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 37)로는 디클로메진을 들 수 있다.
- [0727] (38) "티오펜-카르복사미드 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 38)는 ATP 생성에 영향을 미치는 것으로 제시된다. 이의 예로는 실티오팜을 들 수 있다.
- [0728] (39) "피리미딘아미드 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 39)는 인지질 생합성에 영향을 미침으로써 균류 성장을 저해하며, 이의 예로는 디플루메토림을 들 수 있다.
- [0729] (40) "카르복실산 아미드 (CAA) 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 40)는 인지질 생합성 및 세포벽 침착을 저해하는 것으로 제시된다. 이러한 과정의 저해는 표적 균류의 성장을 저지하여, 표적 균류의 사멸을 가져온다. 카르복실산 아미드 살균제로는 신남산 아미드, 발린아미드 카르바메이트 및 만텔산 아미드 살균제를 들 수 있다. 신남산 아미드로는 디메토모르프 및 플루모르프를 들 수 있다. 발린아미드 카르바메이트로는 벤티아발리카브, 벤티아발리카브-아이소프로필, 이프로발리카브 및 발리페날을 들 수 있다. 만텔산 아미드로는 만디프로파미드, N-[2-[4-[[3-(4-클로로페닐)-2-프로핀-1-일]옥시]-3-메톡시페닐]에틸]-3-메틸-2-[(메틸설포닐)아미노]부탄아미드 및 N-[2-[4-[[3-(4-클로로페닐)-2-프로핀-1-일]옥시]-3-메톡시페닐]에틸]-3-메틸-2-[(메틸설포닐)아미노]부탄아미드를 들 수 있다.
- [0730] (41) "테트라사이클린 항생제 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 41)는 복합체 1 니코틴아미드 아데닌 디뉴클레오티드 (NADH) 산화 환원 효소에 영향을 미침으로써 균류 성장을 저해한다. 이의

예로는 옥시테트라사이클린을 들 수 있다.

- [0731] (42) "티오키아르바메이트 살균제 (b42)" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 42)로는 메타실 포카브를 들 수 있다.
- [0732] (43) "벤즈아미드 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 43)는 스펙트린양 단백질의 비편재화에 의해 균류 성장을 저해한다. 이의 예로는 아실피콜라이드 살균제, 예컨대 플루오피콜라이드 및 플루오피람을 들 수 있다.
- [0733] (44) "숙주 식물 방어 유도 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 P)로는 숙주 식물 방어 메카니즘을 유도한다. 숙주 식물 방어 유도 살균제로는 벤조-티아다리아졸, 벤즈아이소티아졸 및 티아다리아졸-카르복스아미드 살균제를 들 수 있다. 벤조-티아다리아졸로는 아시벤졸라-S-메틸을 들 수 있다. 벤즈아이소티아졸로는 프로베나졸을 들 수 있다. 티아다리아졸-카르복스아미드로는 티아디닐 및 아이소티아닐을 들 수 있다.
- [0734] (45) "멀티사이트 접촉 살균제"는 다수의 작용 부위를 통해 균류 성장을 저해하며, 접촉/예방 활성을 갖는다. 이러한 부류의 살균제로는 (45.1) "구리 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 M1)", (45.2) "황 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 M2), (45.3) "다이트이오카르바메이트 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 M3), (45.4) "프탈이미드 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 M4), (45.5) "클로로니트릴 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 M5), (45.6) "설파미드 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 M6), (45.7) "구아니딘 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 M7), (45.8) "트라이아진 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 M8) 및 (45.9) "퀴논 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 M9)를 들 수 있다. "구리 살균제"는 전형적으로 구리(II) 산화 상태의 구리를 함유하는 무기 화합물이며; 이의 예로는 조성물, 예컨대 보르도액 (Bordeaux mixture; 삼염기성 황산구리)을 비롯한 옥시염화구리, 황산구리 및 수산화구리를 들 수 있다. "황 살균제"는 황 원자 환 또는 쇠를 포함하는 무기 화합물이며; 이의 예로는 황 원소를 들 수 있다. "다이트이오카르바메이트 살균제"는 다이트이오카르바메이트 분자 부분을 포함하며; 이의 예로는 만코젯, 메티람, 프로피넬, 퍼밤, 마넬, 티람, 지넬 및 지람을 들 수 있다. "프탈이미드 살균제"는 프탈이미드 분자 부분을 포함하며; 이의 예로는 폴페트, 캅탄 및 캅타폴을 들 수 있다. "클로로니트릴 살균제"는 클로로 및 시아노로 치환된 방향족 환을 포함하며; 이의 예로는 클로로탈로닐을 들 수 있다. "설파미드 살균제"로는 디클로플루아니드 및 톨리플루아니드를 들 수 있다. "구아니딘 살균제"로는 도딘, 구아자틴, 이미녹타딘 알베실레이트 및 이미녹타딘 트라이아세테이트를 들 수 있다. "트라이아진 살균제"로는 아닐라진을 들 수 있다. "퀴논 살균제"로는 디티아논을 들 수 있다.
- [0735] (46) "부류 (1) 내지 (45) 이외의 살균제"로는 작용 모드가 미지일 수 있는 특정 살균제를 들 수 있다. 이들은 (46.1) "티아졸 카르복스아미드 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 U5), (46.2) "페닐-아세트아미드 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 U6), (46.3) "퀴나졸리논 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 U7) 및 (46.4) "벤조페논 살균제" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) 코드 U8)를 포함한다. 티아졸 카르복스아미드로는 에타복삼을 들 수 있다. 페닐-아세트아미드로는 사이플루페나미드 및 N-[[[사이클로프로필메톡시]아미노][6-(다이플루오로메톡시)-2,3-다이플루오로페닐]-메틸렌]벤젠아세트아미드를 들 수 있다. 퀴나졸리논으로는 프로퀴나지드 및 2-부톡시-6-요오도-3-프로필-4H-1-벤조피란-4-온을 들 수 있다. 벤조페논으로는 메트라페논을 들 수 있다. (b46) 부류로는 또한 베크사진, 네오-아소진 (메탄아르손산제이철 (ferric methanearsonate), 피롤니트린, 퀴노메티오네이트, N-[2-[4-[[3-(4-클로로페닐)-2-프로판-1-일]옥시]-3-메톡시페닐]에틸]-3-메틸-2-[(메틸설포닐)아미노]부탄아미드, N-[2-[4-[[3-(4-클로로페닐)-2-프로판-1-일]옥시]-3-메톡시페닐]에틸]-3-메틸-2-[(메틸설포닐)아미노]부탄아미드, 2-[[2-플루오로-5-(트라이플루오로메틸)페닐]티오]-2-[3-(2-메톡시페닐)-2-티아졸리디닐리덴]아세트니트릴, 3-[5-(4-클로로페닐)-2,3-다이메틸-3-이속사졸리디닐]피리딘, 4-플루오로페닐 N-[1-[[[1-(4-시아노페닐)에틸]설포닐]메틸]프로필]카르바메이트, 5-클로로-6-(2,4,6-트라이플루오로페닐)-7-(4-메틸피페리딘-1-일)[1,2,4]트리아자졸로[1,5-a]피리미딘, N-(4-클로로-2-니트로페닐)-N-에틸-4-메틸벤셀술포아미드, N-[[[사이클로프로필메톡시]아미노][6-(다이플루오로메톡시)-2,3-다이플루오로페닐]메틸렌]벤젠아세트아미드, N'-[4-[4-클로로-3-(트라이플루오로메틸)페톡시]-2,5-다이메틸페닐]-N-에틸-N-메틸메탄아미드아미드 및 1-[(2-프로페닐티오)카르보닐]-2-(1-메틸에틸)-4-(2-메틸페닐)-5-아미노-1H-피라졸-3-온을 들 수 있다.
- [0736] 따라서, 화학식 1의 화합물 및 상술한 부류 (1) 내지 (46)으로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의

살균제 화합물을 포함하는 혼합물 (즉, 조성물)에 주목해야 한다. 또한, 상기 혼합물 (살균적 유효량으로)과, 추가로 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물에 주목해야 한다. 화학식 1의 화합물과, 부류 (1) 내지 (46)와 관련하여 상기에 열거된 특정 화합물의 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 살균제 화합물을 포함하는 혼합물 (즉, 조성물)에 특히 주목해야 한다. 또한 상기 혼합물 (살균적 유효량으로)과, 추가로 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가의 계면활성제를 포함하는 조성물에 특히 주목해야 한다.

[0737] 본 발명의 화합물과 함께 제형화될 수 있는 다른 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제의 예로는 살충제, 예컨대 아바멕틴, 아세페이트, 아세타미프리드, 아세토프롤, 알디카브, 아미도플루메트, 아미트라즈, 아바멕틴, 아자디라크틴, 아진포스-메틸, 비펜트린, 비페나제이트, 비스트리플루론, 부프로페진, 카르보푸란, 칼타, 키노메티오나트, 클로르페나피르, 클로르플루아주론, 클로란트라닐리프롤, 3-브로모-1-(3-클로로-2-피리디닐)-N-[4-시아노-2-메틸-6-[(1-메틸에틸)아미노]카르보닐]페닐]-1H-피라졸-5-카르복스아미드, 3-브로모-1-(3-클로로-2-피리디닐)-N-[4-시아노-2-메틸-6-[(메틸아미노)카르보닐]페닐]-1H-피라졸-5-카르복스아미드, 3-클로로-1-(3-클로로-2-피리디닐)-N-[4-시아노-2-메틸-6-[(메틸아미노)카르보닐]페닐]-1H-피라졸-5-카르복스아미드, 3-클로로-1-(3-클로로-2-피리디닐)-N-[4-시아노-2-메틸-6-[(1-메틸에틸)아미노]카르보닐]페닐]-1H-피라졸-5-카르복스아미드, 클로르피리포스, 클로르피리포스-메틸, 클로로벤질레이트, 크로마페노자이드, 클로티아니딘, 사이플루메토펜, 사이플루트린, 베타-사이플루트린, 사이할로트린, 감마-사이할로트린, 람다-사이할로트린, 사이헥사틴, 사이퍼메트린, 사이로마진, 델타메트린, 디아펜티우론, 디아지논, 디코폴, 디엘드린, 디에노클로르, 디플루벤주론, 디메플루트린, 디메토에이트, 디노테푸란, 디오페놀란, 에마멕틴, 엔도설판, 에스펜발레레이트, 에티프롤, 에톡사졸, 페나미포스, 페나자린, 펜부타틴 옥사이드, 페노티오카브, 페녹시카브, 펜프로파트린, 펜피록시메이트, 펜발레레이트, 피프로닐, 플로니카미드, 플루벤디아미드, 플루사이트리네이트, 타우-플루발리네이트, 플루페네림, 플루페녹수론, 포노포스, 할로페노자이드, 헥사플루무론, 헥시티아족스, 하이드라메틸논, 이미시아포스, 이미다클로프리드, 인독사카브, 아이소펜포스, 루페누론, 말라티온, 메타플루미존, 메트알데히드, 메타미도포스, 메티다티온, 메토밀, 메토프렌, 메톡시클로르, 메톡시페노자이드, 메토플루트린, 모노크로토포스, 니텐피람, 니티아진, 노발루론, 노비플루무론, 옥사밀, 파라티온, 파라티온-메틸, 퍼메트린, 포레이트, 포살론, 포스메트, 포스파미돈, 피리미카브, 프로페노포스, 프로플루트린, 프로파자이트, 프로트리헨부트, 피메트로진, 피라플루프롤, 피레트린, 피리다벤, 피리달릴, 피리플루퀴나존, 피리프롤, 피리프록시펜, 로테논, 라노딘, 스피네토람, 스피노사드, 스피로디클로펜, 스피로메시펜, 스피로테트라마트, 설프로포스, 테부페노자이드, 테부펜피라드, 테플루벤주론, 테플루트린, 터부포스, 테트라클로르빈포스, 티아클로프리드, 티아메톡삼, 티오디카브, 티오설판-소듐, 톨펜피라드, 트랄로메트린, 트라이아자메이트, 트라이클로르폰 및 트라이플루무론; 및 곤충병원성 세균, 예컨대 바실러스 투링지엔시스 (*Bacillus thuringiensis*) 서브스피시스 (subsp.) 아이자와이 (aizawai), 바실러스 투링지엔시스 (*Bacillus thuringiensis*) 서브스피시스 (subsp.) 쿠르스타키 (kurstaki), 및 바실러스 투링지엔시스 (*Bacillus thuringiensis*)의 캡슐화 델타-엔도톡신 (예를 들어, 셀캡 (Cellcap), MPV, MPVII); 곤충병원균, 예컨대 풍뎡이 녹강균 (green muscardine fungus); 및 바콜로바이러스, 헥다각체형 바이러스 (NPV), 예컨대 HzNPV, AfNPV를 비롯한 곤충병원성 바이러스; 및 과립병 바이러스 (GV), 예컨대 CpGV를 비롯한 생물 작용제 (biological agent)가 있다.

[0738] 본 발명의 화합물 및 이의 조성물은 무척추 해충에 유독한 단백질 (예를 들어, 바실러스 투링지엔시스 델타-내독소 (*Bacillus thuringiensis* delta-endotoxin))을 발현하도록 유전적으로 형질전환된 식물에 적용될 수 있다. 외부로부터 적용된 본 발명의 살균제 화합물의 효과는 발현된 독소 단백질로 상승 작용이 일어날 수 있다.

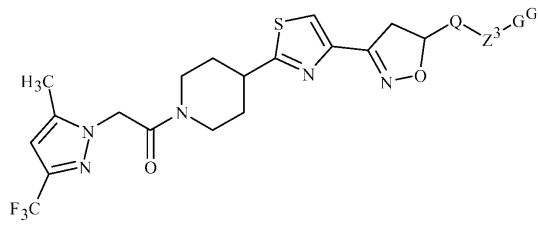
[0739] 농업용 보호제 (즉, 살충제, 살균제, 살선충제, 진드기 구충제, 제초제 및 생물 작용제)에 관한 일반적인 참조 문헌으로는 문헌 [참조: The Pesticide Manual, 13th Edition, C. D. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003] 및 문헌 [참조: The BioPesticide Manual, 2nd Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001]을 들 수 있다.

[0740] 이들 다양한 혼합 파트너 중 하나 이상을 사용하는 실시 형태의 경우, 화학식 1의 화합물 (또는 이의 N-옥사이드 또는 이의 염)에 대한 이들 다양한 혼합 파트너 (전체)의 중량비는 전형적으로 약 1:3000 내지 약 3000:1이다. 약 1:300 내지 약 300:1 (예를 들어, 약 1:30 내지 약 30:1의 비)의 중량비에 주목해야 한다. 당업자는 원하는 생물학적 활성 범위에 필요한 활성 성분의 생물학적 유효량을 간단한 실험을 통하여 용이하게 결정할 수 있다. 이들 추가의 성분을 포함시키면, 화학식 1의 화합물 단독에 의해 방제되는 범위를 초과하여, 방제되는 질환의 범위를 확대할 수 있음이 명백할 것이다.



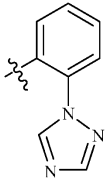
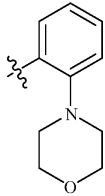
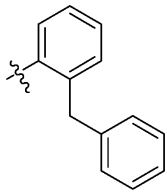
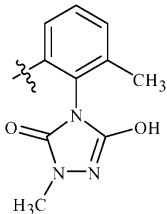
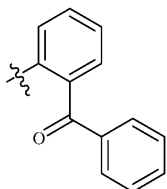
- [0741] 경우에 따라서는, 본 발명의 화합물과 다른 생물 활성 (특히 살균성) 화합물 또는 생물 활성제 (즉, 활성 성분)의 배합물은 첨가제를 상회하는 (즉, 상승) 효과를 가져올 수 있다. 효과적인 해충 방제를 보장하면서 환경에 방출되는 활성 성분의 양을 감소시키는 것이 항상 바람직하다. 살균제 활성 성분의 상승 작용이 농학적으로 만족스러운 레벨의 균류 방제를 부여하는 적용량으로 일어나는 경우에는, 이러한 배합물은 작물 생산비를 감소시키고 환경 부하를 저감시키는데 유리할 수 있다.
- [0742] 화학식 1의 화합물 (또는 이의 N-옥사이드 또는 염)과 적어도 하나의 다른 살균제 활성 성분의 배합물에 주목해야 한다. 다른 살균제 활성 성분이 화학식 1의 화합물과 상이한 작용 부위를 갖는 그러한 배합물에 특히 주목해야 한다. 경우에 따라서는, 유사한 방제 범위를 갖지만, 상이한 작용 부위를 갖는 적어도 하나의 다른 살균제 활성 성분과의 배합물은 저항성 관리에 특히 유리할 것이다. 따라서, 본 발명의 조성물은 추가로 유사한 방제 범위를 갖지만, 상이한 작용 부위를 갖는 생물학적 유효량의 적어도 하나의 추가의 살균제 활성 성분을 포함할 수 있다.
- [0743] 난균류 식물 병원체에 의한 식물병이 방제되는 이들 방법에 주목해야 한다.
- [0744] 하기 시험은 특정 병원체에 대한 본 발명의 화합물의 방제 효과를 예증한다. 그러나, 화합물에 의해 주어진 병해 방제 보호는 이들 종류에 한정되지 않는다. 화합물 설명에 관해서는 인덱스 표 A 및 B를 참조한다. 약어 "Ex."는 "실시예"를 나타내며, 화합물이 제조되는 실시예를 나타내는 번호가 이어진다. 인덱스 표 A 및 B는 대기압 화학 이온화 ( $AP^+$ )를 이용하여 질량 분석에 의해 관찰된, 분자에 대하여  $H^+$  (분자량 1)를 첨가하여 형성된 최고 동위원소 존재비 어미 이온 ( $M+1$ )의 분자량을 나타낸다. 인덱스 표 A 및 B의 기  $G^6$ 는 발명의 요약에 정의한  $G^A$ ,  $G^N$  또는  $G^P$ 일 수 있다. 파선은 J 환 (아이속사졸린)에 대한 각  $QZ^3G^6$  기의 결합점을 나타낸다.  $Z^2$ 는 직접 결합이므로, Q와 아이속사졸린 환 사이의 라인으로서 나타낸다.

[0745] 인덱스 표 A

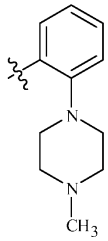
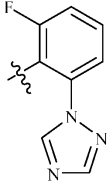
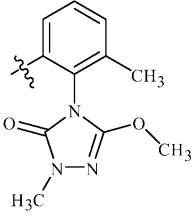
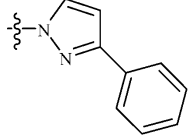
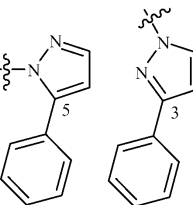


화합물	QZ³Gᵀ	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
1 (Ex. 1)		*	
2		**	
3			596
4			587

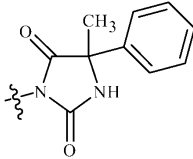
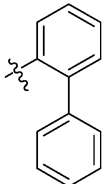
[0746]

화합물	QZ <sup>3</sup> G <sup>G</sup>	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
5			571
6			589
7			594
8			631
9			608

[0747]

화합물	QZ <sup>3</sup> G <sup>G</sup>	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
10			602
11			589
12			645
13			570
14 <sup>#</sup>			570

[0748]

화합물	QZ <sup>3</sup> G <sup>G</sup>	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
15			616
16			580

\* <sup>1</sup>H NMR 데이터에 관해서는 합성예를 참조한다.

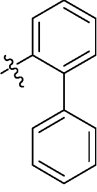
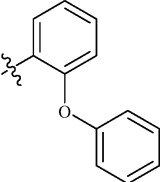
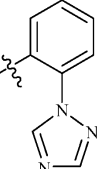
\*\* <sup>1</sup>H NMR 데이터에 관해서는 인덱스 표 B를 참조한다.

# 이 화합물은 3-페닐 위치 이성질체와 5-페닐 위치 이성질체의 3 : 1 혼합물이다.

[0749]



[0750] 인덱스 표 B

화합물	QZ <sup>3</sup> G <sup>G</sup>	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
17 (Ex. 2)		*	
18			553
19			528

\* <sup>1</sup>H NMR 데이터에 관해서는 합성예를 참조한다.

[0751]

[0752] 인덱스 표 C

화합물	<sup>1</sup> H NMR 데이터 (달리 나타내지 않으면 CDCl <sub>3</sub> 용액) <sup>a</sup>
2	δ 1.70-1.90 (m, 2H), 2.20 (t, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.89 (t, 1H), 3.25-3.40 (m, 2H), 3.45 (dd, 1H), 3.88 (dd, 1H), 4.04 (d, 1H), 4.57 (br d, 1H), 4.92-5.05 (m, 2H), 5.80 (dd, 1H), 6.33 (s, 1H), 7.35 (t, 1H), 7.40-7.50 (m, 4H), 7.55-7.68 (m, 5H).

<sup>a</sup> <sup>1</sup>H NMR 데이터는 테트라메틸실란으로부터의 다운필드 (ppm)로 나타낸다. 커플링은 (s)-싱글렛, (d)-더블렛, (t)-트라이플렛, (m)-멀티플렛, (dd)-더블렛 오브 더블렛 (doublet of doublets), (br d)-브로드 더블렛으로 나타낸다.

[0753]

[0754] 본 발명의 생물학적 실시예

[0755] 시험 A 내지 시험 C에 관한 시험 현탁액을 제조하기 위한 일반적인 프로토콜: 시험 화합물을 먼저 최종 체적의 3%에 상당하는 양으로 아세톤에 용해시킨 다음에, 계면활성제 트렘 (Trem)<sup>®</sup> 014 (다가 알코올 에스테르) 250 ppm을 함유하는 아세톤 및 정제수 (50/50 체적 믹스)에 원하는 농도 (ppm)로 현탁시켰다. 그 다음에, 얻어진 시험 현탁액을 시험 A 내지 시험 C에 사용하였다. 시험 식물에 대하여 유출할 수 있을 정도의 40 ppm 시험 현탁액을 분무하는 것은 100 g/ha의 비율에 상당하였다.

[0756] 시험 A

[0757] 포도 모종을 플라스모과라 비티콜라 (Plasmopara viticola) (포도 흰가루병의 병원균)의 포자 현탁액으로 접종시켜, 20°C에서 24 시간 동안 포화 분위기에서 인큐베이션하였다. 짧은 건조 기간 후에, 시험 현탁액을 포도 모종에 유출할 수 있을 정도로 분무한 다음에, 20°C에서 5 일간 생장상 (growth chamber)에 옮겨 둔 후에, 포도 모종을 다시 20°C에서 24 시간 동안 포화 분위기에 두었다. 제거 후에, 육안 병해 평가 척도 (visual disease rating)를 작성하였다.

[0758]

시험 B

[0759]

시험 현탁액을 토마토 모종에 유출할 수 있을 정도로 분무하였다. 그 다음날에, 모종을 파이토프토라 인페스탄스 (*Phytophthora infestans*) (토마토 역병의 병원균)의 포자 현탁액으로 접종시켜, 20℃에서 24 시간 동안 포화 분위기에서 인큐베이션한 다음에, 20℃에서 5 일간 성장상에 옮겨 둔 후에, 육안 병해 평가 척도를 작성하였다.

[0760]

시험 C

[0761]

토마토 모종을 파이토프토라 인페스탄스 (*Phytophthora infestans*) (토마토 역병의 병원균)의 포자 현탁액으로 접종시켜, 20℃에서 17 시간 동안 포화 분위기에서 인큐베이션하였다. 짧은 건조 기간 후에, 시험 현탁액을 토마토 모종에 유출할 수 있을 정도로 분무한 다음에, 20℃에서 4 일간 성장상에 옮겨 둔 후에, 육안 병해 평가 척도를 작성하였다.

[0762]

시험 A 내지 시험 C 이외에도, 화합물을 토마토 묘목에 분무하여, 처리 후 24 시간 후에 알테르나리아 솔라니 (*Alternaria solani*)로 접종시키고, 밀 식물을 처리 후 24 시간 후에 에리시페 그라미니스 (*Erysiphe graminis*) f. sp. 트리티시 (*tritici*)로 접종시켰다. 시험 화합물은 시험된 살포량으로 시험 조건하에 이들 추가의 병원균에 대하여 현저한 활성을 나타내지 않았다.

[0763]

시험 A 내지 시험 C에 대한 결과는 표 A에 나타낸다. 표에서, 100의 평가 척도는 100 % 병해 방제를 나타내고, 0의 평가 척도는 병해 방제를 전혀 나타내지 않음을 나타낸다 (대조군과 비교).

[0764]

표 A

화합물	병해 방제율		
	시험 A	시험 B	시험 C
1	91	100	99
2	76	90	32
3	97	100	93
4	58	99	83
5	98	100	99
6	87	100	99
7	73	99	86
8	0	100	53
9	0	100	17
10	10	100	93
11	99	100	99
12	31	100	99
13	56	100	93
14	82	100	99
15	92	100	97
16	99	100	99
17	98	100	99
18	67	93	58
19	99	100	99

[0765]