



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2017년06월05일
 (11) 등록번호 10-1743791
 (24) 등록일자 2017년05월30일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
C07D 239/46 (2006.01) *A01N 43/54* (2006.01)
A01N 47/10 (2006.01) *C07D 239/47* (2006.01)
 (21) 출원번호 10-2012-7005933
 (22) 출원일자(국제) 2010년08월05일
 심사청구일자 2015년07월24일
 (85) 번역문제출일자 2012년03월06일
 (65) 공개번호 10-2012-0043070
 (43) 공개일자 2012년05월03일
 (86) 국제출원번호 PCT/US2010/044592
 (87) 국제공개번호 WO 2011/017547
 국제공개일자 2011년02월10일
 (30) 우선권주장
 61/232,204 2009년08월07일 미국(US)
 (56) 선행기술조사문헌
 EP00877022 A1*
 US03368938 A1*
 *는 심사관에 의하여 인용된 문헌

(73) 특허권자
다우 아그로사이언시즈 엘엘씨
 미국 인디애나주 46268-1054 인디애나폴리스 자이언스빌 로드 9330
 (72) 발명자
뵈벨 티모시
 미국 46220 인디애나주 인디애나폴리스 노스 옥스포드 스트리트 5747
브라이언 크리스티
 미국 46033 인디애나주 카멜 쿨 크릭 드라이브 1502
 (뒷면에 계속)
 (74) 대리인
양영준, 김영

전체 청구항 수 : 총 20 항

심사관 : 금보라

(54) 발명의 명칭 **N1-술포닐-5-플루오로피리미디논 유도체**

(57) 요약

본 발명의 개시내용은 N1-술포닐-5-플루오로피리미디논 및 그의 유도체 분야, 및 이 화합물의 살진균제로서의 용도에 관한 것이다.

(72) 발명자

로스바흐 베스

미국 46220 인디애나주 인디애나폴리스 하버포드
애비뉴 6034

마틴 티모시

미국 46062 인디애나주 노블스빌 램지 드라이브
6095

오웬 더블유

미국 46033 인디애나주 카멜 페블포인트 패스
12421

포반즈 마크

미국 46077 인디애나주 자이언스빌 세즈 코트 4293

쏘버그 스콧

미국 46032 인디애나주 카멜 스프링필드 폰즈 서클
13820

웹스터 제프리

미국 46163 인디애나주 뉴 팔레스타인 더블유 오크
우드 코트 7581

야오 쉐린

미국 46074 인디애나주 웨스트필드 에스프리 드라
이브 14178

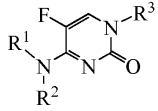
명세서

청구범위

청구항 1

하기 화학식 I의 화합물, 또는 이들의 광학 이성질체, 염 또는 수화물인 화합물.

[화학식 I]



식 중, R¹은

H;

선택적으로 1-3 개의 R⁴로 치환된 C₁-C₆ 알킬;

선택적으로 1-3 개의 R⁴로 치환된 C₁-C₆ 알케닐;

선택적으로 1-3 개의 R⁴로 치환된 C₃-C₆ 알키닐;

페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R⁵; 또는 각각이 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리계, 5-6 융합 고리계, 또는 6-6 융합 고리계로 치환될 수 있으며, 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R⁵ 또는 선택적으로 1-3 개의 R⁵로 치환된 비페닐 또는 나프틸로 치환될 수 있음 -;

-(CHR⁶)_mOR⁷;

-C(=O)R⁸;

-C(=S)R⁸;

-C(=O)OR⁸;

-C(=S)OR⁸;

-(CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;

-C(=O)N(R⁹)R¹⁰; 또는

-C(=S)N(R⁹)R¹⁰

- 여기서, m은 1-3의 정수임 - 이고;

R²는

H; 또는

선택적으로 R⁴로 치환된 C₁-C₆ 알킬이고;

별법으로, R¹ 및 R²는 함께 =CR¹¹N(R¹²)R¹³을 형성할 수 있고;

R^3 은 $-S(O)_2R^{14}$ 이고;

R^4 는 독립적으로 할로젠, C_1-C_6 알킬, C_1-C_4 할로알킬, C_1-C_4 알콕시, C_1-C_4 할로알콕시, C_1-C_4 알킬티오, C_1-C_4 할로알킬티오, 아미노, 할로티오, C_1-C_3 알킬아미노, C_2-C_6 알콕시카르보닐, C_2-C_6 알킬카르보닐, C_2-C_6 알킬아미노카르보닐, 히드록실, 또는 C_3-C_6 트리알킬실릴이고;

R^5 는 독립적으로 할로젠, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_1-C_6 알콕시, C_1-C_6 할로알콕시, C_1-C_6 알킬티오, C_1-C_6 할로알킬티오, 할로티오, 아미노, C_1-C_6 알킬아미노, C_2-C_6 디알킬아미노, C_2-C_6 알콕시카르보닐, C_1-C_6 알킬술포닐 또는 C_2-C_6 알킬카르보닐, 니트로, 히드록실, 또는 시아노이고;

R^6 은 H, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 알콕시, 페닐 또는 벤질 - 각각의 벤질 또는 페닐은 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 이고;

R^7 은 H, C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_3-C_6 알키닐, C_1-C_6 할로알킬, C_1-C_6 알콕시알킬, C_2-C_6 알킬카르보닐, 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 ; 또는 각각이 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리계, 5-6 융합 고리계, 또는 6-6 융합 고리계로 치환될 수 있으며, 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 또는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환된 비페닐 또는 나프틸로 치환될 수 있음 - 이고;

R^8 은 H, C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_3-C_6 알키닐, C_1-C_6 할로알킬, C_1-C_6 알콕시알킬, 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 ; 또는 각각이 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리계, 5-6 융합 고리계, 또는 6-6 융합 고리계로 치환될 수 있으며, 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 또는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환된 비페닐 또는 나프틸로 치환될 수 있음 - 이고;

R^9 는 H, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_1-C_6 알콕시알킬, C_2-C_6 알킬카르보닐, 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 ; 또는 각각이 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리계, 5-6 융합 고리계, 또는 6-6 융합 고리계로 치환될 수 있으며, 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 또는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환된 비페닐 또는 나프틸로 치환될 수 있음 - 이고;

R^{10} 은 H, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_1-C_6 알콕시알킬, C_2-C_6 알킬카르보닐, 또는 벤질 - 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 이고;

별법으로, R^9 및 R^{10} 은 함께 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리 - 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 를 형성할 수 있고;

R^{11} 은 H 또는 C_1-C_4 알킬이고;

R^{12} 는 H, 시아노, 히드록실, C_1-C_4 알킬, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_6 알킬카르보닐, 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 이고;

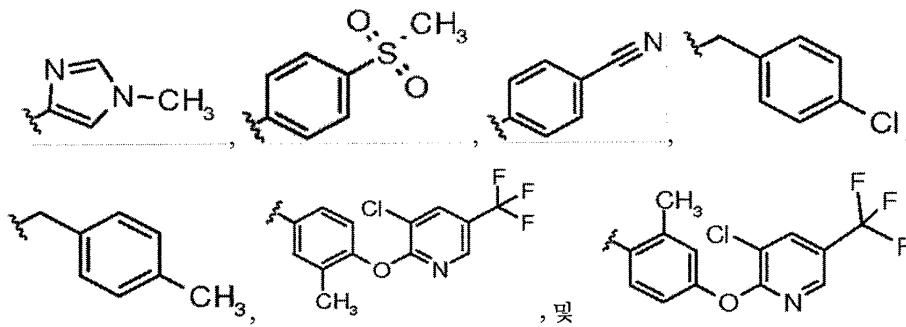
별법으로, R^{11} 및 R^{12} 는 함께 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리 - 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 를 형성할 수 있고;

R^{13} 은 H, C_1-C_4 알킬, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_6 알킬카르보닐, 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 이고;

별법으로, R^{12} 및 R^{13} 은 함께 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리 - 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 를 형성할 수 있고;

R^{14} 는 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, 아미노, C_1-C_6 알킬아미노, C_2-C_6 디알킬아미노, 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 ; 또는 각각이 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 4-(3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일옥시)-3-메틸페닐, 4-(3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일옥시)-2-메틸페닐, 또는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리로 치환될 수 있으며, 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 이며;

이때 R^1 이 H이고 R^2 가 H이면, R^{14} 는 하기로 이루어진 군으로부터 선택된다.



청구항 2

제1항에 있어서, R^1 은 H, $-C(=O)R^8$, $-C(=S)R^8$, $-C(=O)OR^8$, $-C(=S)N(R^9)R^{10}$, 또는 $-C(=O)N(R^9)R^{10}$ 이고; R^2 는 H인 화합물.

청구항 3

제2항에 있어서, R^1 은 $-C(=O)R^8$ 또는 $-C(=S)R^8$ 이고, R^8 은 C_1-C_6 알킬인 화합물.

청구항 4

제3항에 있어서, R^8 은 메틸, 에틸, 또는 tert-부틸인 화합물.

청구항 5

제2항에 있어서, R^1 은 $-C(=O)R^8$, $-C(=S)R^8$, 또는 $-C(=O)OR^8$ 이고, R^8 은 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 인 화합물.

청구항 6

제2항에 있어서, R^1 은 $-C(=S)N(R^9)R^{10}$ 또는 $-C(=O)N(R^9)R^{10}$ 이고; R^9 는 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 이며; R^{10} 은 H인 화합물.

청구항 7

제1항에 있어서, R^1 및 R^2 는 함께 $=CR^{11}N(R^{12})R^{13}$ 을 형성하는 것인 화합물.

청구항 8

제7항에 있어서, R^{11} 은 H이고, R^{12} 및 R^{13} 는 각각 독립적으로 C_1-C_4 알킬인 화합물.

청구항 9

제4항에 있어서, R¹² 및 R¹³ 중 적어도 하나는 메틸인 화합물.

청구항 10

제1항에 있어서, R¹⁴는 C₁-C₆ 알킬인 화합물.

청구항 11

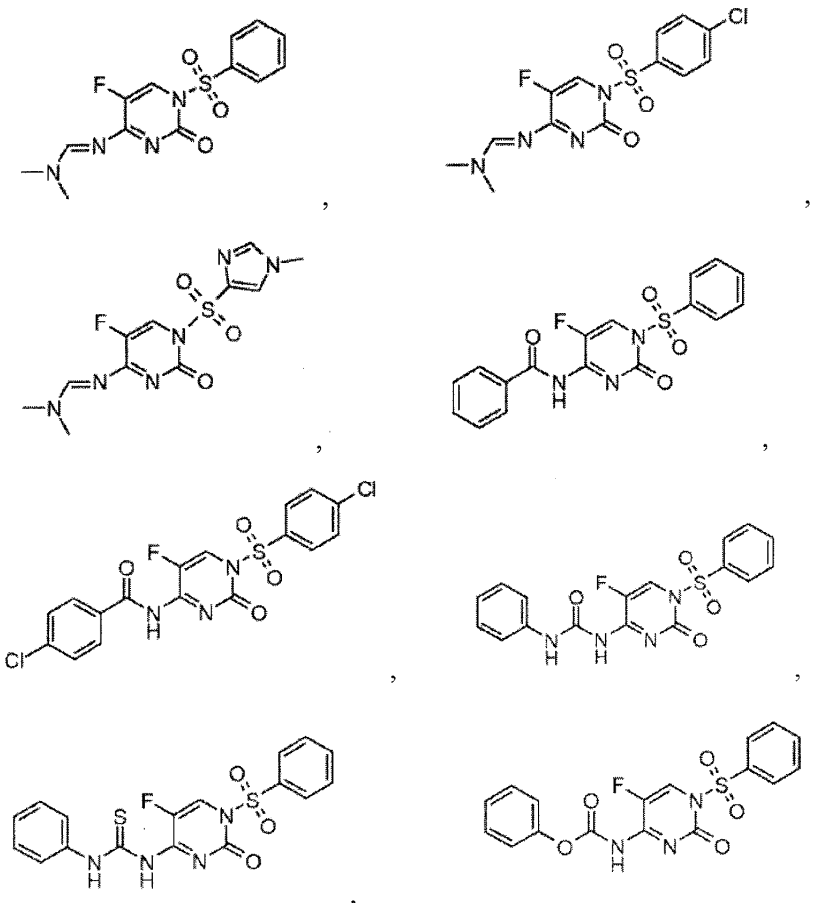
제1항에 있어서, R¹⁴는 (a) 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R⁵로 치환될 수 있음 - 또는 (b) 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리계 - 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R⁵로 치환될 수 있음 - 인 화합물.

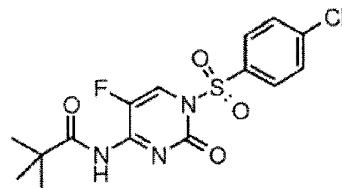
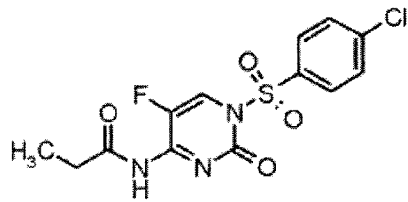
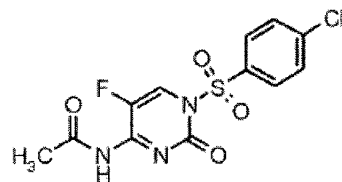
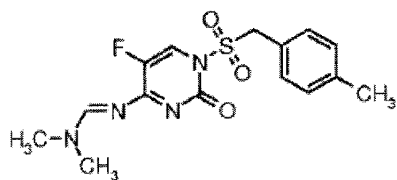
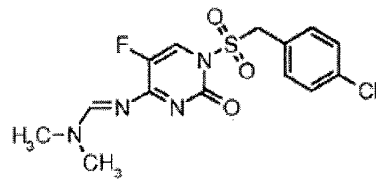
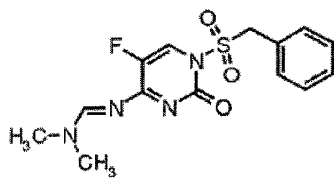
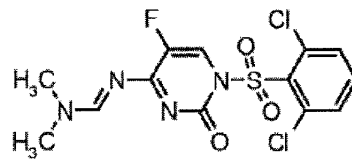
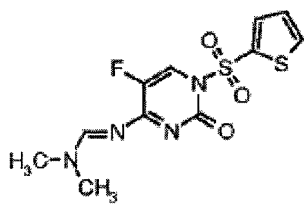
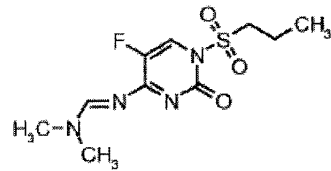
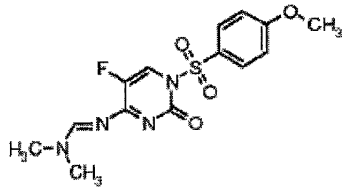
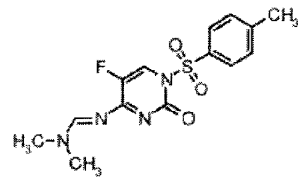
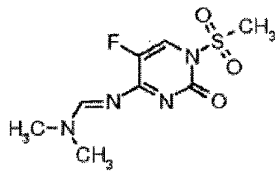
청구항 12

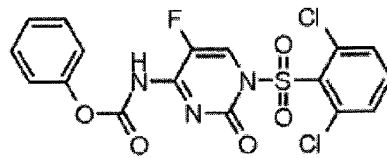
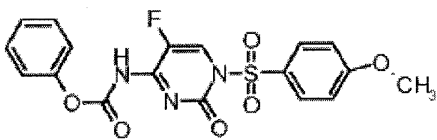
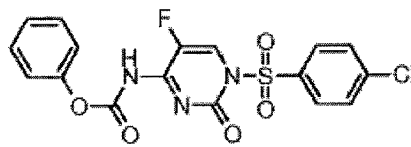
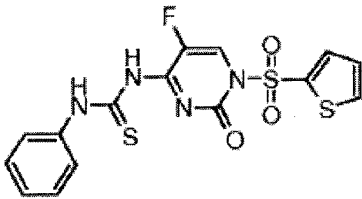
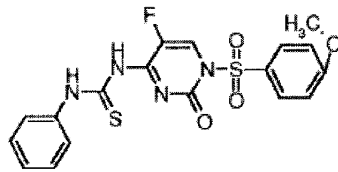
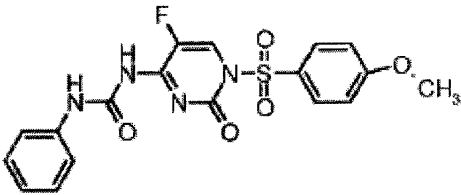
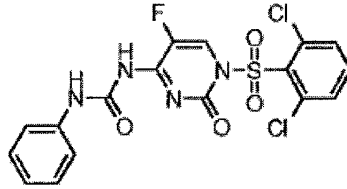
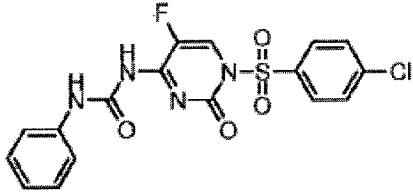
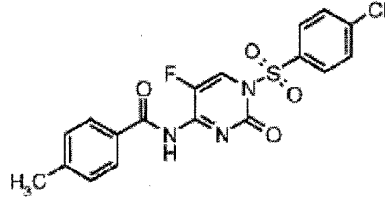
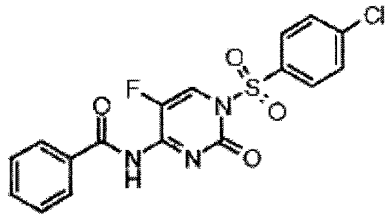
제11항에 있어서, R⁵는 할로젠, C₁-C₆ 알킬 또는 C₁-C₆ 알콕시인 화합물.

청구항 13

제1항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물, 또는 이들의 염 또는 수화물인 화합물.



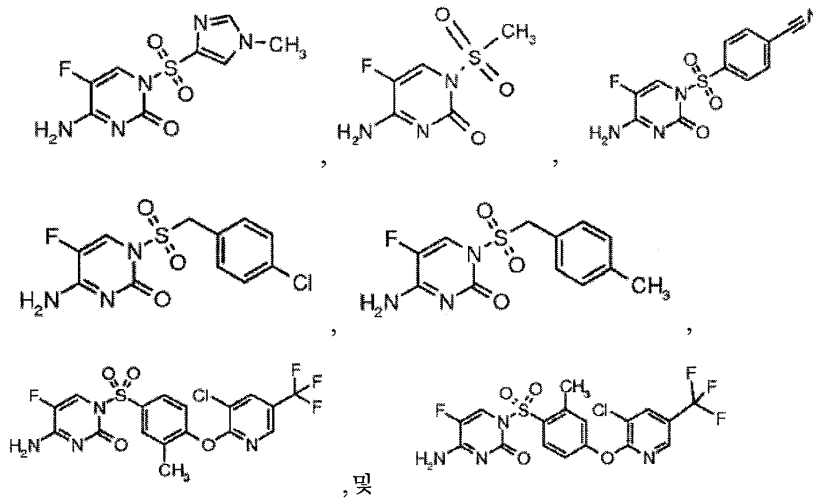




, 및

청구항 14

제1항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물, 또는 이들의 염 또는 수화물인 화합물.



청구항 15

제1항 내지 제14항 중 어느 한 항에 있어서, 염의 형태인 화합물.

청구항 16

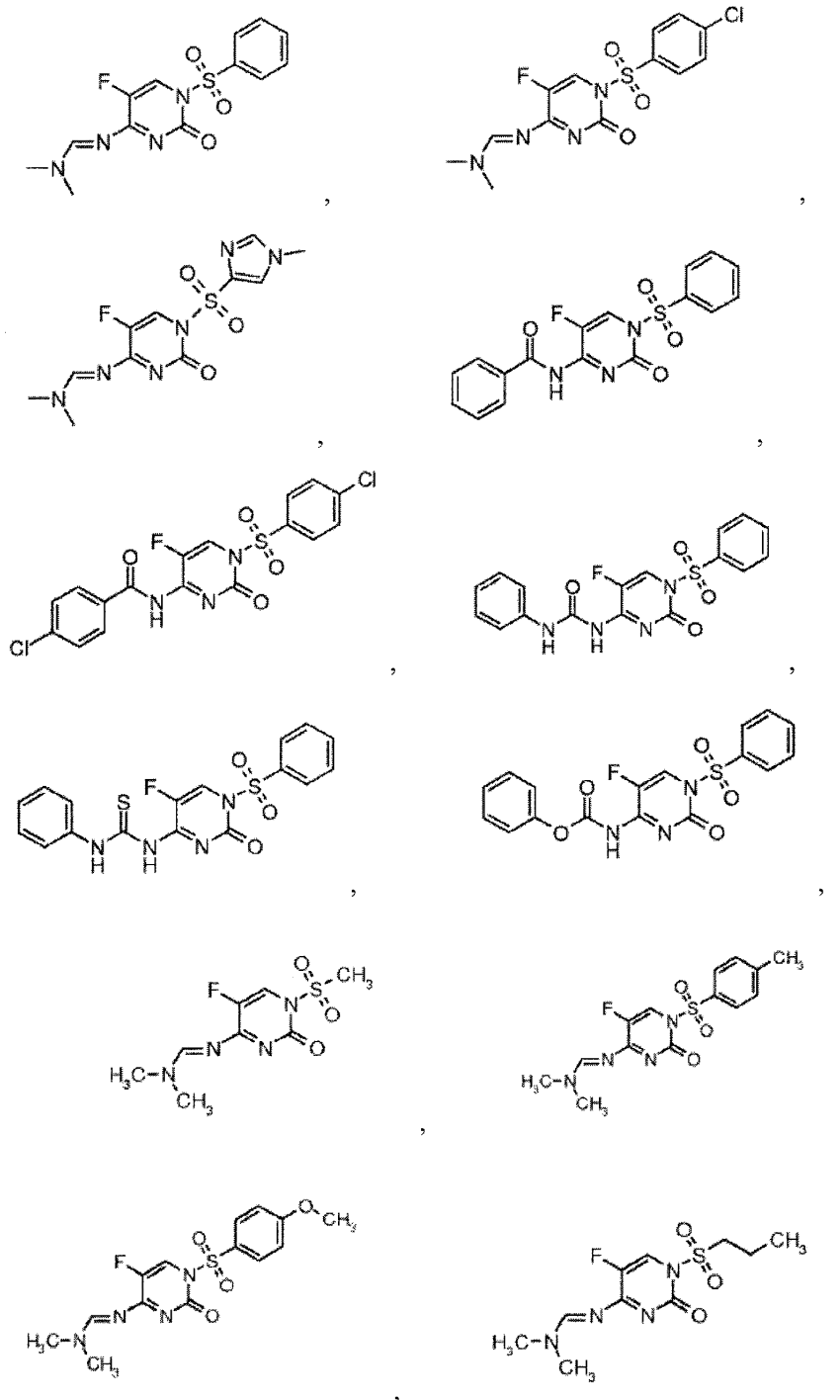
제15항에 있어서, 염은 히드로클로라이드, 히드로브로마이드 또는 히드로요오다이드인 화합물.

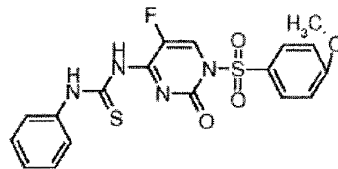
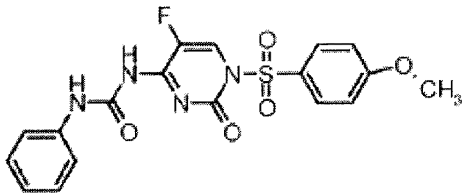
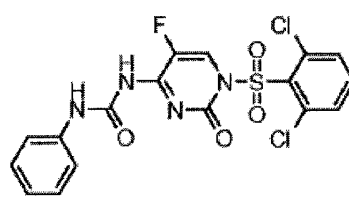
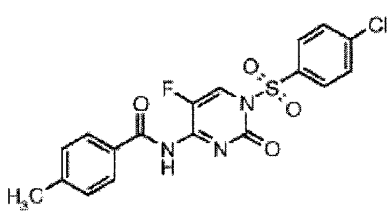
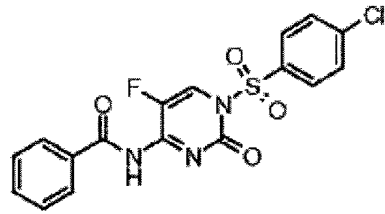
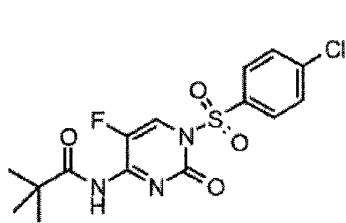
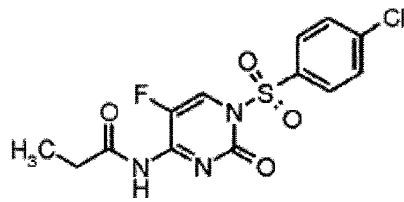
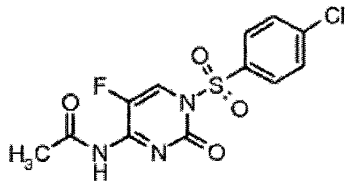
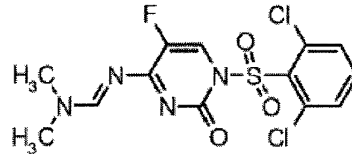
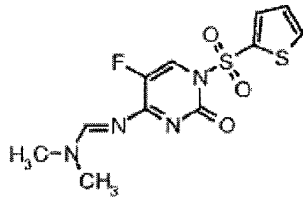
청구항 17

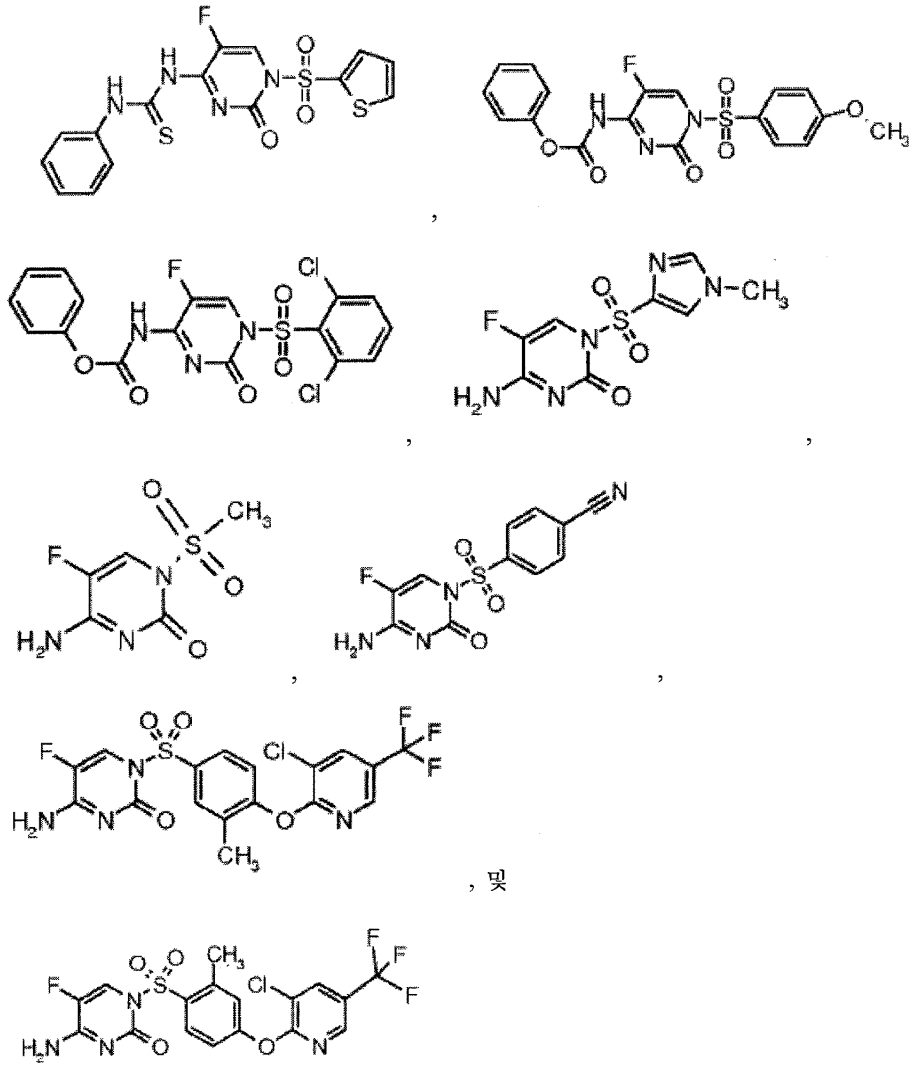
제1항 내지 제14항 중 어느 한 항의 화합물 및 식물학적으로 허용가능한 담체 물질을 포함하는 살진균성 조성물.

청구항 18

제17항에 있어서, 화합물이 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 살진균성 조성물.







청구항 19

제17항에 있어서, 밀의 잎 얼룩균(Leaf Blotch)(셉토리아 트리티시: *Septoria tritici*)에 의한 식물에 대한 진균 공격의 방제 및 예방에 유효한 살진균성 조성물.

청구항 20

살진균적 유효량의 1종 이상의 제1항 내지 제14항 중 어느 한 항의 화합물을 식물, 식물에 인접한 영역, 식물의 성장을 보조하는 토양, 식물의 뿌리, 식물의 잎, 및 식물을 생성하도록 된 씨앗 중 하나 이상에 사용하는 단계를 포함하는, 식물에 대한 진균 공격의 방제 및 예방 방법.

발명의 설명

기술분야

[0001] 관련 출원에 대한 상호 참조

[0002] 본 출원은 2009년 8월 7일에 출원된 미국 특허 가출원 제61/232,204호의 이익을 청구한다.

배경기술

[0003] 살진균제는 농업적으로 관련된 진균에 의해 유발되는 피해에 대하여 식물을 보호 및/또는 치유하는 작용을 하는 천연 또는 합성 기원의 화합물이다. 일반적으로, 단일 살진균제가 모든 상황에서 유용하지는 않다. 결론적

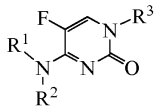
으로, 더 나은 성능을 가질 수 있고, 사용하기 쉬우며, 비용이 적게 드는 살진균제를 생산하기 위한 연구가 계속 진행 중이다. 미국 특허 제3,368,938호(1968년 2월 13일)는 진균 방제에 있어서의 5-플루오로시토신의 용도를 개시하고 있다. 미국 특허 출원 공보 제2003/0039667호(2003년 2월 27일)는 진균 질환의 치료 및 방지에 유용한 경구 조성물, 경구 투여 가능한 항진균 백신의 제조 방법, 및 사용 방법을 개시하고 있다. 국제 공보 WO 2008/083465(2008년 7월 17일)는 암 치료를 위한 특정 6-치환된 피리미딘 유도체를 사용하는 방법을 개시하고 있다. 국제 공보 WO 2002/030922(2002년 4월 18일)은 암 치료를 위한 디옥솔란 뉴클레오시드 유사체를 개시하고 있다. 유럽 특허 제0877022(2003년 4월 16일)는 항암 특성을 가지는 피리미딘 핵 염기의 N-1 술폰닐 유도체, 그 제조 방법, 및 이러한 화합물의 항암 활성을 개시하고 있다. 국제 공보 WO 2009/094442(2009년 7월 30일)는 5-플루오로 피리미딘, 그 유도체, 및 이러한 화합물의 살진균제로서의 용도를 개시하고 있다.

발명의 내용

[0004] 본 개시내용은 N1-술폰닐-5-플루오로피리미딘은 화합물 및 그의 살진균제로서의 용도에 관한 것이다. 본 개시내용의 화합물은 자낭균, 담자균, 불완전 균강 및 난균에 대한 보호를 제공할 수 있다.

[0005] 본 개시내용의 일 실시양태는 화학식 I의 화합물을 포함할 수 있다.

[0006] [화학식 I]



[0007]

[0008] 식 중, R¹은

[0009] H;

[0010] 선택적으로 1-3 개의 R⁴로 치환된 C₁-C₆ 알킬;

[0011] 선택적으로 1-3 개의 R⁴로 치환된 C₁-C₆ 알케닐;

[0012] 선택적으로 1-3 개의 R⁴로 치환된 C₃-C₆ 알키닐;

[0013] 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R⁵; 또는 각각이 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리계, 5-6 융합 고리계, 또는 6-6 융합 고리계로 치환될 수 있으며, 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R⁵ 또는 선택적으로 1-3 개의 R⁵로 치환된 비페닐 또는 나프틸로 치환될 수 있음 -;

[0014] -(CHR⁶)_mOR⁷;

[0015] -C(=O)R⁸;

[0016] -C(=S)R⁸;

[0017] -C(=O)OR⁸;

[0018] -C(=S)OR⁸;

[0019] -S(O)₂R⁸;

[0020] -(CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;

[0021] -C(=O)N(R⁹)R¹⁰; 또는

- [0022] $-C(=S)N(R^9)R^{10}$
- [0023] - 여기서, m은 1-3의 정수임 - 이고;
- [0024] R^2 는
- [0025] H; 또는
- [0026] 선택적으로 R^4 로 치환된 C_1-C_6 알킬이고;
- [0027] 별법으로, R^1 및 R^2 는 함께 $=CR^{11}N(R^{12})R^{13}$ 을 형성할 수 있고;
- [0028] R^3 은 $-S(O)_2R^{14}$ 이고;
- [0029] R^4 는 독립적으로 할로젠, C_1-C_6 알킬, C_1-C_4 할로알킬, C_1-C_4 알콕시, C_1-C_4 할로알콕시, C_1-C_4 알킬티오, C_1-C_4 할로알킬티오, 아미노, 할로티오, C_1-C_3 알킬아미노, C_2-C_6 알콕시카르보닐, C_2-C_6 알킬카르보닐, C_2-C_6 알킬아미노카르보닐, 히드록실, 또는 C_3-C_6 트리알킬실릴이고;
- [0030] R^5 는 독립적으로 할로젠, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_1-C_6 알콕시, C_1-C_6 할로알콕시, C_1-C_6 알킬티오, C_1-C_6 할로알킬티오, 할로티오, 아미노, C_1-C_6 알킬아미노, C_2-C_6 디알킬아미노, C_2-C_6 알콕시카르보닐, C_1-C_6 알킬술포닐 또는 C_2-C_6 알킬카르보닐, 니트로, 히드록실, 또는 시아노이고;
- [0031] R^6 은 H, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 알콕시, 페닐 또는 벤질 - 각각의 벤질 또는 페닐은 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 이고;
- [0032] R^7 은 H, C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_3-C_6 알키닐, C_1-C_6 할로알킬, C_1-C_6 알콕시알킬, C_2-C_6 알킬카르보닐, 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 ; 또는 각각이 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리계, 5-6 융합 고리계, 또는 6-6 융합 고리계로 치환될 수 있으며, 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 또는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환된 비페닐 또는 나프틸로 치환될 수 있음 - 이고;
- [0033] R^8 은 H, C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_3-C_6 알키닐, C_1-C_6 할로알킬, C_1-C_6 알콕시알킬, 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 ; 또는 각각이 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리계, 5-6 융합 고리계, 또는 6-6 융합 고리계로 치환될 수 있으며, 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 또는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환된 비페닐 또는 나프틸로 치환될 수 있음 - 이고;
- [0034] R^9 는 H, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_1-C_6 알콕시알킬, C_2-C_6 알킬카르보닐, 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 ; 또는 각각이 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리계, 5-6 융합 고리계, 또는 6-6 융합 고리계로 치환될 수 있으며, 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 또는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환된 비페닐 또는 나프틸로 치환될 수 있음 - 이고;
- [0035] R^{10} 은 H, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_1-C_6 알콕시알킬, C_2-C_6 알킬카르보닐, 또는 벤질 - 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 이고;
- [0036] 별법으로, R^9 및 R^{10} 은 함께 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리 - 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 를 형성할 수 있고;

- [0037] R^{11} 은 H 또는 C_1-C_4 알킬이고;
- [0038] R^{12} 는 H, 시아노, 히드록실, C_1-C_4 알킬, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_6 알킬카르보닐, 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 이고;
- [0039] 별법으로, R^{11} 및 R^{12} 는 함께 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리 - 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 를 형성할 수 있고;
- [0040] R^{13} 은 H, C_1-C_4 알킬, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_6 알킬카르보닐, 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 이고;
- [0041] 별법으로, R^{12} 및 R^{13} 은 함께 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리 - 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 를 형성할 수 있고;
- [0042] R^{14} 는 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, 아미노, C_1-C_6 알킬아미노, C_2-C_6 디알킬아미노, 페닐 또는 벤질 - 각각의 페닐 또는 벤질은 선택적으로 1-3 개의 R^5 ; 또는 각각이 1-3 개의 헤테로원자를 함유하는 4-(3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일옥시)-3-메틸페닐, 4-(3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일옥시)-2-메틸페닐, 또는 5- 또는 6-원 포화 또는 불포화 고리로 치환될 수 있으며, 각각의 고리는 선택적으로 1-3 개의 R^5 로 치환될 수 있음 - 이다.
- [0043] 본 개시내용의 다른 실시양태는 이하에 기술되는 화합물 및 식물학적으로 허용가능한 담체 물질을 포함하는 진균 공격의 방제 또는 예방을 위한 살진균성 조성물을 포함할 수 있다.
- [0044] 본 개시내용의 또 다른 실시양태는 이하에 기술되는 화합물 중 1종 이상의 살진균적 유효량을 진균, 식물, 식물에 인접한 영역 및 식물을 생성하도록 된 씨앗 중 하나 이상에 사용하는 단계를 포함하는, 식물에 대한 진균 공격을 방제 또는 예방하는 방법을 포함할 수 있다.
- [0045] 용어 "알킬"은 메틸, 에틸, 프로필, 부틸, 이소프로필, 이소부틸, 3차 부틸, 펜틸, 헥실, 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실 등을 포함하는 분지형, 비분지형 또는 환형 탄소쇄를 지칭한다.
- [0046] 용어 "알케닐"은 에테닐, 프로페닐, 부테닐, 이소프로페닐, 이소부테닐, 시클로헥세닐 등을 포함하는 하나 이상의 이중 결합을 함유하는 분지형, 비분지형 또는 환형 탄소쇄를 지칭한다.
- [0047] 용어 "알키닐"은 프로피닐, 부티닐 등을 포함하는 하나 이상의 삼중 결합을 함유하는 분지형 또는 비분지형 탄소쇄를 지칭한다.
- [0048] 본 명세서 전반에서 사용되는, 용어 'R'은 달리 기술되지 않는 한, C_{2-8} 알킬, C_{3-8} 알케닐 또는 C_{3-8} 알키닐로 구성된 군을 지칭한다.
- [0049] 용어 "알콕시"는 -OR 치환기를 지칭한다.
- [0050] 용어 "알콕시카르보닐"은 -C(O)-OR 치환기를 지칭한다.
- [0051] 용어 "알킬카르보닐"은 -C(O)-R 치환기를 지칭한다.
- [0052] 용어 "알킬술포닐"은 -SO₂-R 치환기를 지칭한다.
- [0053] 용어 "할로알킬술포닐"은 R이 완전히 또는 부분적으로 Cl, F, I 또는 Br, 또는 이들의 임의의 조합으로 치환된 -SO₂-R 치환기를 지칭한다.
- [0054] 용어 "알킬티오"는 -S-R 치환기를 지칭한다.
- [0055] 용어 "할로티오"는 3 개 또는 5 개의 F 치환기로 치환된 황을 지칭한다.
- [0056] 용어 "할로알킬티오"는 Cl, F, I 또는 Br, 또는 이들의 임의의 조합으로 치환된 알킬티오를 지칭한다.

- [0057] 용어 "알킬아미노카르보닐"은 $-C(O)-N(H)-R$ 치환기를 지칭한다.
- [0058] 용어 "디알킬아미노카르보닐"은 $-C(O)-NR_2$ 치환기를 지칭한다.
- [0059] 용어 "알킬시클로알킬아미노"는 알킬기로 치환된 시클로알킬아미노 치환기를 지칭한다.
- [0060] 용어 "트리알킬실릴"은 $-SiR_3$ 을 지칭한다.
- [0061] 용어 "시아노"는 $-C\equiv N$ 치환기를 지칭한다.
- [0062] 용어 "히드록실"은 $-OH$ 치환기를 지칭한다.
- [0063] 용어 "아미노"는 $-NH_2$ 치환기를 지칭한다.
- [0064] 용어 "알킬아미노"는 $-N(H)-R$ 치환기를 지칭한다.
- [0065] 용어 "디알킬아미노"는 $-NR_2$ 치환기를 지칭한다.
- [0066] 용어 "알콕시알콕시"는 $-O(CH_2)_nO(CH_2)_mCH_3$ (식 중, n 은 1-3이고 m 은 0-2임)을 지칭한다.
- [0067] 용어 "알콕시알킬"은 알킬 상의 알콕시 치환을 지칭한다.
- [0068] 용어 "할로알콕시알킬"은 완전히 또는 부분적으로 Cl, F, Br 또는 I, 또는 이들의 임의의 조합으로 치환된 알킬 상의 알콕시 치환을 지칭한다.
- [0069] 용어 "히드록시알킬"은 히드록실기로 치환된 알킬을 지칭한다.
- [0070] 용어 "할로알콕시"는 $-OR-X$ 치환기 (식 중, X 는 Cl, F, Br 또는 I, 또는 이들의 임의의 조합임)를 지칭한다.
- [0071] 용어 "할로알킬"은 Cl, F, I 또는 Br, 또는 이들의 임의의 조합으로 치환된 알킬을 지칭한다.
- [0072] 용어 "할로알케닐"은 Cl, F, I 또는 Br, 또는 이들의 임의의 조합으로 치환된 알케닐을 지칭한다.
- [0073] 용어 "할로알키닐"은 Cl, F, I 또는 Br, 또는 이들의 임의의 조합으로 치환된 알키닐을 지칭한다.
- [0074] 용어 "할로겐" 또는 "할로"는 F, Cl, Br 및 I로 규정되는 하나 이상의 할로겐 원자를 지칭한다.
- [0075] 용어 "히드록시카르보닐"은 $-C(O)-OH$ 치환기를 지칭한다.
- [0076] 용어 "니트로"는 $-NO_2$ 치환기를 지칭한다.
- [0077] 용어 "아릴"은 수소 및 탄소로 이루어진 환형 방향족 치환기를 지칭한다.
- [0078] 본 개시내용 전반에서, 화학식 I의 화합물에 대한 참조는 또한 화학식 I의 광학 이성질체 및 염, 및 이들의 수 화물을 포함하는 것으로 이해된다. 구체적으로, 화학식 I이 분지쇄 알킬기를 함유하는 경우, 이러한 화합물이 그의 광학 이성질체 및 라세미체를 포함하는 것으로 이해된다. 예시적인 염들은 다음을 포함한다: 히드로클로라이드, 히드로브로마이드, 히드로요오다이드 등. 추가적으로, 화학식 I의 화합물은 호변이성질체 형태를 포함할 수 있다.
- [0079] 본 문헌에 개시된 특정한 화합물은 하나 이상의 이성질체로 존재할 수 있다. 당업자는 하나의 이성질체가 다른 것에 비해 보다 활성일 수 있음을 이해할 것이다. 본 개시내용에 개시된 구조는 명료함을 위해 단지 하나의 기하학적 형태만을 도시하였지만, 분자의 모든 기하학적 및 호변이성질체 형태를 나타내는 것으로 의도된다.
- [0080] 달리 제시되지 않는 한, 화학 결합 및 변형 에너지의 규칙들이 만족되고, 생성물이 여전히 살진균적 활성을 나타내는 한 추가적인 치환이 허용가능하다는 것이 당업자에게 또한 이해된다.
- [0081] 본 개시내용의 또 다른 실시양태는 화학식 I의 화합물 또는 화합물을 포함하는 조성물의 토양, 식물, 식물의 일부, 잎 및/또는 씨앗에의 사용을 포함하는, 식물 병원체 생물에 의한 공격에 대항하는 식물의 보호 또는 식물 병원체 생물들이 만연하는 식물의 치료를 위한 화학식 I의 화합물의 용도이다.
- [0082] 추가적으로, 본 개시내용의 다른 실시양태는 화학식 I의 화합물 및 식물학적으로 허용가능한 담체 물질을 포함하는, 식물 병원체 생물에 의한 공격에 대항하는 식물의 보호 및/또는 식물 병원체 생물이 만연하는 식물의 치료에 유용한 조성물이다.

[0083] 본 발명의 추가적인 특징 및 장점은, 현재 최적 모드로 인식되는 본 발명의 수행을 예시하는 예시적인 실시양태의 하기 상세한 설명을 고려하면 당업자에게 명백해질 것이다.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

[0084] 본 개시내용의 화합물은 임의의 공지된 각종 기술에 의해 화합물로서 또는 화합물을 포함하는 제형으로서 사용될 수 있다. 예컨대, 화합물은 각종 진균의 방제를 위해서, 식물의 상업적 가치를 손상시키지 않고 식물의 뿌리, 씨앗 또는 잎에 사용될 수 있다. 물질은 일반적으로 사용되는 임의의 제형 타입의 형태로, 예컨대 용액, 분진, 습윤성 파우더, 유동성 농축액 또는 유화성(emulsifiable) 농축액으로 사용될 수 있다.

[0085] 바람직하게는, 본 개시내용의 화합물은 식물학적으로 허용가능한 담체와 함께 화학식 I의 화합물 중 하나 이상을 포함하는 제형의 형태로 사용된다. 농축된 제형은 사용을 위해서 물 또는 기타 액체에 분산될 수 있고, 또는 제형은 후에 추가적인 처리 없이 사용될 수 있는 분진형(dust-like) 또는 과립형일 수 있다. 제형은 농업 화학 분야에서 통상적인 절차에 따라 제조될 수 있다.

[0086] 본 개시내용은 화합물 중 하나 이상이 그에 의해 전달되고 살진균제로 사용되기 위해 제형화될 수 있는 모든 비히클(vehicle)을 고려한다. 통상적으로, 제형은 수성 현탁액 또는 에멀전으로 사용된다. 이러한 현탁액 또는 에멀전은 일반적으로 습윤성 파우더로 공지된 고체; 또는 일반적으로 유화성 농축액, 수성 현탁액 또는 현탁 농축액으로 공지된 액체인 수용성, 수현탁성 또는 유화성 제형으로부터 생성될 수 있다. 쉽게 이해될 바와 같이, 이러한 화합물들이 첨가될 수 있는 임의의 물질이 사용될 수 있으며, 단 항진균성 제제로서의 이들 화합물의 활성에 유의한 간섭 없이 목적하는 유용성을 산출해야 한다.

[0087] 수 분산성 과립자를 형성하도록 압축될 수 있는 습윤성 파우더는 화학식 I의 화합물 중 하나 이상, 불활성 담체 및 계면활성제의 긴밀한 혼합물(intimate mixture)을 포함한다. 습윤성 파우더 중 화합물의 농도는 습윤성 파우더 총 중량을 기준으로, 약 10 중량% 내지 약 90 중량%, 더 바람직하게는 약 25 중량% 내지 약 75 중량%일 수 있다. 습윤성 파우더 제형의 제조시, 화합물은 임의의 미분된 고체, 예컨대 프로필라이트, 활석, 백악, 석고, 백토, 벤토나이트, 아타풀자이트(attapulgit), 전분, 카세인, 글루텐, 몬모릴로나이트 점토, 규조토, 정제된 실리카이트 등과 함께 배합될 수 있다. 이러한 작업에서, 미분된 담체 및 계면활성제는 통상적으로 화합물(들)과 블렌딩되고 분쇄된다.

[0088] 화학식 I의 화합물의 유화성 농축액은 적절한 액체 중에 편리한 농도, 예컨대 농축액의 총 중량을 기준으로 화합물 약 10 중량% 내지 약 50 중량%를 포함할 수 있다. 화합물은 수혼화성 용매 또는 수-불혼화성 유기 용매 및 유화제의 혼합물인 불활성 담체에 용해될 수 있다. 농축액은 물 및 오일로 희석되어, 수중유(oil-in-water) 에멀전의 형태로 분산성 혼합물을 형성할 수 있다. 유용한 유기 용매로는 방향족, 특히 석유의 고비점 나프탈렌계 및 올레핀계 부분, 예컨대 중질 방향족 나프타를 포함한다. 기타 유기 용매, 예컨대 로신 유도체를 포함하는 테르펜계 용매, 지방족 케톤, 예컨대 시클로헥산 및 복합 알콜, 예컨대 2-에톡시에탄올이 또한 사용될 수 있다.

[0089] 본원에서 유익하게 사용될 수 있는 유화제는 당업자에 의해 쉽게 결정될 수 있으며, 각종 비이온성, 음이온성, 양이온성 및 양성 유화제, 또는 둘 이상의 유화제의 블렌드를 포함한다. 유화성 농축액을 제조하는데 있어서 유용한 비이온성 유화제의 예는 폴리알킬렌 글리콜 에테르 및 알킬 및 아릴 페놀, 지방족 알콜, 지방족 아민 또는 지방산과 에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드의 축합 생성물, 예컨대 에톡실화 알킬 페놀 및 폴리올 또는 폴리옥시알킬렌으로 가용화된 카르복실산 에스테르를 포함한다. 양이온성 유화제로는 4차 암모늄 화합물 및 지방 아민 염을 포함한다. 음이온성 유화제로는 알킬아릴 술폰산의 지용성 염(예컨대, 칼슘), 황산화된 폴리글리콜 에테르의 지용성 염 및 인산화 폴리글리콜 에테르의 적절한 염을 포함한다.

[0090] 본 발명의 화합물의 유화성 농축액을 제조하는데 사용될 수 있는 대표적인 유기 액체는 방향족 액체, 예컨대 크실렌, 프로필 벤젠 분획물; 또는 혼합된 나프탈렌 분획물, 미네랄 오일, 치환된 방향족 유기 액체, 예컨대 디옥틸 프탈레이트; 케로센; 각종 지방산의 디알킬 아미드, 특히 지방 글리콜의 디메틸 아미드 및 글리콜 유도체, 예컨대 n-부틸 에테르, 디에틸렌 글리콜의 에틸 에테르 또는 메틸 에테르, 및 트리에틸렌 글리콜의 메틸 에테르 등이다. 둘 이상의 유기 액체의 혼합물 또한 유화성 농축액의 제조에 사용될 수 있다. 유기 액체로는 크실렌 및 프로필 벤젠 분획물을 포함하며, 크실렌이 일부 경우에서 가장 바람직하다. 표면-활성 분산제는 통상적으로 액체 제형 중에 화합물 중 하나 이상과 분산제의 조합 중량을 기준으로 0.1 내지 20 중량%의 양으로 사용된다. 제형은 또한 기타의 상용성 첨가제, 예컨대 식물 성장 조절제 및 농업에서 사용되는 다른 생물학적 활성 화합물을 함유할 수 있다.

- [0091] 수성 현탁액은 수성 현탁액의 총 중량을 기준으로 약 5 내지 약 50 중량% 범위의 농도로 수성 비히클에 분산되는 화학식 I의 하나 이상의 수-불용성 화합물의 현탁액을 포함한다. 현탁액은 화합물 중 하나 이상을 미세하게 연마하고 연마된 물질을 물 및 상술한 것과 동일한 타입으로부터 선택된 계면활성제를 포함하는 비히클 안으로 격렬하게 혼합시킴으로써 제조된다. 다른 성분들, 예컨대 무기염 및 합성 또는 천연 검이 또한 수성 비히클의 밀도 및 점도를 증가시키기 위해 첨가될 수 있다. 수성 혼합물을 제조하고 이를 기구, 예컨대 샌드 밀, 볼 밀 또는 피스톤형 호모지나이저(homogenizer)에서 균질화함으로써 연마와 혼합을 동시에 하는 것이 종종 가장 효과적이다.
- [0092] 수성 에멀전은 통상적으로 수성 에멀전의 총 중량을 기준으로 약 5 내지 약 50 중량% 범위의 농도로 수성 비히클 중에 유화된 하나 이상의 수-불용성 살충성 활성 성분의 에멀전을 포함한다. 살충성 활성 성분이 고체인 경우에는 수성 에멀전의 제조 전에 적절한 수-불용화성 용액에 용해되어야 한다. 에멀전은, 통상적으로 상기 기술된 에멀전의 형성 및 안정화를 돕는 계면활성제를 포함하는 수성 매질에 액체 살충성 활성 성분 또는 그의 수-불용화성 용액을 유화시킴으로써 제조된다. 이는 흔히 고전단 혼합기 또는 호모지나이저에 의해 제공되는 격렬한 혼합의 도움으로 달성된다.
- [0093] 화학식 I의 화합물은 또한 토양에의 시용에 특히 유용한 과립형 제형으로 시용될 수 있다. 과립형 제형은 대부분 또는 전체적으로 조대하게 나누어진 불활성 물질, 예컨대 아타풀자이트, 벤토나이트, 규조토, 점토 또는 비싸지 않은 유사 물질로 구성되는 불활성 담체에 분산된 화합물(들)을 과립형 제형의 총 중량을 기준으로 일반적으로 약 0.5 내지 약 10 중량% 함유한다. 이러한 제형은 일반적으로 화합물을 적절한 용매에 용해하고, 이를 적절한 입자 크기, 약 0.5 내지 약 3 mm의 범위로 예비형성된 과립형 담체에 적용함으로써 제조된다. 적절한 용매는 화합물이 실질적으로 또는 완전히 용해성인 용매이다. 이러한 제형은 담체 및 화합물 및 용매의 도우 또는 페이스트를 만들고, 부수고 건조시켜 목적하는 과립형 입자를 획득함으로써 또한 제조될 수 있다.
- [0094] 화학식 I의 화합물을 함유하는 분진은 파우더 형태의 화합물 중 하나 이상, 예컨대 카울린 점토, 연마된 화산암 등과 같은 적절한 분진형(dusty) 농업적 담체와 긴밀하게 혼합함으로써 제조될 수 있다. 분진은 분진의 총 중량을 기준으로 약 1 내지 약 10 중량%의 화합물을 적절하게 함유할 수 있다.
- [0095] 제형들은 보조 계면활성제를 추가적으로 함유하여 표적 농작물 및 생물체의 화합물의 침착, 습윤 및 침투를 증강시킬 수 있다. 이러한 보조 계면활성제는 제형의 성분으로 또는 탱크 믹스(tank mix)로 선택적으로 사용될 수 있다. 보조 계면활성제의 양은 통상적으로 물의 분사-부피를 기준으로 0.01 내지 1.0 부피%, 바람직하게는 0.05 내지 0.5 부피%로 변할 것이다. 적절한 보조 계면활성제로는 에톡실화 노닐 페놀, 에톡실화 합성 또는 천연 알콜, 에스테르 또는 술포숙신산의 염, 에톡실화 유기실리콘, 에톡실화 지방 아민 및 계면활성제와 미네랄 오일 또는 식물성 오일과의 블렌드를 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 제형은 또한 수중유 에멀전, 예컨대 본원에 그 개시내용이 분명하게 참고로 도입된 미국특허 출원번호 제11/495,228호에 개시된 것들을 포함할 수 있다.
- [0096] 제형들은 기타 살충제 화합물들을 함유하는 배합물들을 선택적으로 포함할 수 있다. 이러한 추가적인 살충제 화합물들은 적용을 위해 선택된 매질에서 본 발명의 화합물과 상용성이며 본 발명의 화합물의 활성에 길항적이지 않은 살진균제, 살균제, 제초제, 살선충제, 살비제, 살절지동물제(arthropodicide), 살균제 또는 이들의 조합일 수 있다. 따라서, 이러한 실시양태에서, 다른 살충제 화합물들이 동일하거나 상이한 살충적 용도를 위해 보충적 독물로서 사용된다. 배합물 중 화학식 I의 화합물 및 살충제 화합물은 일반적으로 1:100 내지 100:1의 중량비로 존재할 수 있다.
- [0097] 본 개시내용의 화합물들은 또한 다른 살진균제와 조합되어 살진균적 혼합물 및 그의 상승작용성 혼합물을 형성할 수 있다. 본 개시내용의 살진균적 화합물은 종종 하나 이상의 다른 살진균제와 함께 사용되어서 더 광범위한 각종의 원하지 않는 질병들을 방제한다. 다른 살진균제(들)과 함께 사용되는 경우, 현재 청구하는 화합물들은 다른 살진균제(들)과 함께 제형화되거나, 다른 살진균제(들)과 함께 탱크 혼합될 수 있거나, 다른 살진균제(들)과 순차적으로 사용될 수 있다. 이러한 다른 살진균제로는 2-(티오시아네이트메틸티오)-벤조티아졸, 2-페닐페놀, 8-히드록시퀴놀린 술페이트, 아메톡트라딘, 아미솔브롬, 향마이신, 암펠로마이세스 퀴즈칼리스(*Ampelomyces quisqualis*), 아자콘아졸, 아족시스트로빈, 바실러스 서브틸리스, 바실러스 서브틸리스 변형 QST713, 벤알라실, 베노밀, 벤티아발리카르브-이소프로필, 벤질아미노벤젠-술포네이트 (BABS) 염, 중탄산염, 비페닐, 비스머티아졸, 비터르탄올, 빅사펜, 블라스티시딘-S, 보락스, 보르도(Bordeaux) 혼합물, 보스칼리드, 브로무콘아졸, 부피리메이트, 칼슘 폴리술퍼드, 캅타폴, 캅탄, 카르벤다짐, 카르복신, 카르프로파미드, 카르본, 클라자페논, 클로로넵, 클로로탈로닐, 클로졸리네이트, 코니오티륨 미니탄(*Coniothyrium minitans*), 구리 수산

화물, 구리 옥타노에이트, 구리 옥시클로라이드, 황산구리, 황산구리 (삼염기성), 산화 제1구리, 시아조파미드, 시플루엔아미드, 시모잔닐(cymoxanil), 시프로코나졸, 시프로딘일, 다조메트, 데바카르브, 디암모늄 에틸렌비스-(디티오카르바메이트), 디클로플루아니드, 디클로로펜, 디클로시메트, 디클로메진, 디클로란, 디에토펜카르브, 디페노코나졸, 디펜조콕트 이온, 디플루메토림, 디메토모르프, 디목시스트로빈, 디니코나졸, 디니코나졸-M, 디노부톤, 디노캡, 디페닐아민, 디티아논, 도데모르프, 도데모르프 아세테이트, 도딘, 도딘 자유 염기, 에디펜포스, 에네스트로빈, 에폭시코나졸, 에타복삼, 에복시퀸, 에트리디아졸, 파목사돈, 페나미돈, 페나리몰, 펜부코나졸, 펜푸람, 펜헥사미드, 페녹사닐, 펜피클로닐, 펜프로피딘, 펜프로피모르프, 펜피라자민, 펜틴, 펜틴 아세테이트, 펜틴 수산화물, 펄밤, 퍼림존, 플루아지남, 플루디옥소닐, 플루모르프, 플루오피콜리드, 플루오피람, 플루오로이미드, 플루옥사스트로빈, 플루퀸코나졸, 플루실아졸, 플루솔파미드, 플루티아닐, 플루톨라닐, 플루트리아폴, 플루크사피록사드, 폴렛, 포름알데히드, 포세틸, 포세틸-알루미늄, 푸베리다졸, 푸랄락실, 푸라메트피르, 구아자틴, 구아자틴 아세테이트, GY-81, 핵사클로로벤젠, 핵사코나졸, 히백사졸, 이마잘릴, 이마잘릴 술페이트, 이미벤코나졸, 이미녹타딘, 이미녹타딘 트리아세테이트, 이미녹타딘 트리스(알베실레이트), 요오도카르브, 입콘아졸, 입펜피라졸론, 이프로벤포스, 이프로디온, 이프로발리카르브, 이소프로티올란, 이소피라잠, 이소티아닐, 라미나린, 카수가마이신(kasugamycin), 카수가마이신 히드로클로라이드 수화물, 크레소심-메틸, 만코퍼, 만코젯, 만디프로파미드, 마넵, 메파니피림, 메프로닐, 염화 수은, 산화 수은, 머큐러스(mercurous) 클로라이드, 메탈락실, 메페녹삼, 멧틸-디노캡, 메탈락실-M, 메담, 메담-암모늄, 메담-갈륨, 메담-나트륨, 메트코나졸, 메타술포카르브, 메틸 요오드화물, 메틸 이소티오시아네이트, 메티람, 메토민오스트로빈, 메트라페논, 밀디오마이신, 미클로부탄일, 나밤, 니트로탈-이소프로필, 누아리몰, 옥틸리논, 오후라스(ofurace), 올레산 (지방산), 오리사스트로빈, 옥사디실, 옥신-구리, 옥스포코나졸 푸마레이트, 옥시카르복신, 페푸라조에이트, 펜코나졸, 펜시쿠론, 펜플루펜, 펜타클로로페놀, 펜타클로로페닐 라우레이트, 펜티오피라드, 페닐수은 아세테이트, 포스폰산, 프탈리드, 피콕시스트로빈, 폴리옥신 B, 폴리옥신S, 폴리옥소림, 칼륨 이탄산염, 칼륨 히드록시퀴놀린 술페이트, 프로벤아졸, 프로클로라즈, 프로시미돈, 프로파모카르브, 프로파모카르브 히드로클로라이드, 프로피코나졸, 프로피넵, 프로퀸아지드, 프로티오코나졸, 피라클로스트로빈(pyraclostrobin), 피라메토스트로빈, 피라옥시스트로빈, 피라조포스, 피리벤카르브, 피리부티카르브, 피리페녹스, 피리메탄일, 피리오페논, 피로퀸론, 퀴노클라민, 퀴녹시펜, 퀴토젠, 호장근(*Reynoutria*) 사카리넨시스(*sachalinensis*) 추출물, 세탁산, 실티오팜, 시메코나졸, 나트륨 2-페닐페녹시드, 중탄산나트륨, 나트륨 펜타클로로페녹시드, 스피록사민, 황, SYP-Z071, SYP-Z048, 타르 오일, 테부코나졸, 테부플로퀸, 텍나젠, 테트라코나졸, 티아벤다졸, 티플루자미드, 티오파네이트-메틸, 티람, 티아딘일, 툴클로포스-메틸, 툴릴플루아니드, 트리아디메폰, 트리아디메올, 트리아족시드, 트리시클라졸, 트리데모르프, 트리플록시스트로빈, 트리플루미줄, 트리포린, 트리티코나졸, 발리다마이신, 발리페날레이트, 발리페날, 빈클로졸린, 지넵, 지람, 족사미드, 칸디다 올레오필라(*Candida oleophila*), 푸사리움 옥시스포럼(*Fusarium oxysporum*), 글리오클라디움 에스피퍼(*Gliocladium* spp.), 플레비옵시스 기간티아(*Phlebiopsis gigantea*), 스트렙토마이세스 그리세오비리디스(*Streptomyces griseoviridis*), 트리코덜마 에스피퍼(*Trichoderma* spp.), (RS)-N-(3,5-디클로로페닐)-2-(메톡시메틸)-숙신이미드, 1,2-디클로로프로판, 1,3-디클로로-1,1,3,3-테트라플루오로아세톤 수화물, 1-클로로-2,4-디니트로나프탈렌, 1-클로로-2-니트로프로판, 2-(2-헵타데실-2-이미다졸린-1-일)에탄올, 2,3-디히드로-5-페닐-1,4-디티-인 1,1,4,4-테트라옥시드, 2-메톡시에틸수은 아세테이트, 2-메톡시에틸수은 클로라이드, 2-메톡시에틸수은 실리케이트, 3-(4-클로로페닐)-5-메틸로다닌, 4-(2-니트로프로프-1-에닐)페닐 티오시아네이텀(thiocyanateme), 암프로필포스, 아닐라진, 아지티람, 바륨 폴리술포이드, 베이어(Bayer) 32394, 베노단일, 벤퀴녹스, 벤탈루론, 벤즈아마크릴; 벤즈아마크릴-이소부틸, 벤즈아몰프, 비나파크릴, 비스(메틸수은) 술페이트, 비스(트리부틸린) 옥시드, 부티오베이트, 카드뮴 칼슘 구리 아연 크로메이트 술페이트, 카르바모르프, CECA, 클로벤티아존, 클로라니포르메탄, 클로르펜아졸, 클로르퀴녹스, 클림바졸, 시클라푸라미드, 시펜다졸, 시프로푸람, 데카펜틴, 디클론, 디클로졸린, 디클로부트라졸, 디메티리몰, 디녹톤, 디노술포, 디노테르본, 디피리티온, 디탈림포스, 도디신, 드라족솔론, EBP, ESBP, 에타코나졸, 에템, 에티림, 펜아미노술포, 페나과닐, 페니트로판, 5-플루오로시토신 및 그의 프로살진균제(profungicide), 플루오트리마졸, 푸르카르바닐, 푸르코나졸, 푸르코나졸-시스, 푸르메시클록스, 푸로파네이트, 글리오딘, 그리세오폴빈, 할라크리네이트, 허큘레스(Hercules) 3944, 핵실티오포스, ICIA0858, 이소팜포스, 이소발레디온, 메베닐, 메카르비지드, 메타즈옥솔론, 메트푸록삼, 메틸수은 디시안디아미드, 메트술포박스, 밀넵, 무코클로릭 무수물, 미클로졸린, N-3,5-디클로로페닐-숙신이미드, N-3-니트로페닐이타콘이미드, 나타마이신, N-에틸머큐리오-4-톨루엔술포아닐리드, 니켈 비스(디메틸디티오카르바메이트), OCH, 페닐수은 디메틸디티오카르바메이트, 페닐수은 질산염, 포스디펜, 피콜린아미드 UK-2A 및 그의 유도체, 프로티오카르브; 프로티오카르브 히드로클로라이드, 피라카르볼리드, 피리디니트릴, 피록시클로르, 피록시푸르, 퀴아세톨; 퀴아세톨 술페이트, 퀴아자미드, 퀴코나졸, 라벤자졸, 살리실라닐리드, SSF-109, 술포로펜, 테코람, 티아

디플루오르, 티시오펜, 티오클로르펜핌, 티오파네이트, 티오킨옥스, 티옥시미드, 트리아미포스, 트리아리몰, 트리아즈부틸, 트리클라미드, 엘바시드 및 자릴라미드, 및 이들의 임의의 조합을 포함할 수 있다.

[0098]

추가적으로, 본 발명의 화합물은 적용을 위해 선택된 매질에서 본 발명의 화합물들과 상용성이며, 본 발명의 화합물의 활성에 길항적이지 않아서 살충적 혼합물 및 그의 상승작용적 혼합물을 형성하는 살곤충제, 살선충제, 살비제, 살절지동물제, 살균제 또는 이들의 조합물을 포함하는 다른 살충제와 혼합될 수 있다. 본 개시내용의 살진균적 화합물은 하나 이상의 다른 살충제와 함께 사용되어서 더 광범위한 각종의 원하지 않는 해충들을 방제할 수 있다. 다른 살충제와 함께 사용되는 경우, 현재 청구하는 화합물은 다른 살충제(들)과 함께 제형화되거나, 다른 살충제(들)과 탱크 혼합될 수 있거나, 다른 살충제(들)과 순차적으로 사용될 수 있다. 통상적인 살곤충제로는 항생성 살곤충제, 예컨대 알로사미딘 및 투링지엔신(thuringiensin); 마크로시클릭 락톤 살곤충제, 예컨대 스피노사드 및 스피네토람; 에버멕틴 살곤충제, 예컨대 에버멕틴, 도라멕틴, 에마멕틴, 에프리노멕틴, 이베르멕틴 및 셀라멕틴; 밀베마이신 살곤충제, 예컨대 레피멕틴, 밀베멕틴, 밀베마이신 옥심 및 목시텍틴; 비소성 살곤충제, 예컨대 비산 칼슘, 구리 아세토알세니트, 비산 구리, 비산 납, 칼륨 알세니트 및 나트륨 알세니트; 식물성 살곤충제, 예컨대 아나바신, 아자디라크틴, d-리모넨, 니코틴, 피레트린, 시네린, 시네린 I, 시네린 II, 자스몰린 I, 자스몰린 II, 피레트린 I, 피레트린 II, 콰싸아, 로데논, 리아니아 및 사바딜라; 카르바메이트 살곤충제, 예컨대 벤디오키아르브 및 카르브아릴; 벤조푸라닐 메틸카르바메이트 살곤충제, 예컨대 벤푸라카르브, 카르보푸란, 카르보술판, 데카르보푸란 및 푸라티오키아르브; 디메틸카르바메이트 살곤충제 디미탄, 디메틸란, 히퀸카르브 및 피리미카르브; 옥심 카르바메이트 살곤충제, 예컨대 알라니카르브, 알디카르브, 알독시카르브, 부토카르복심, 부톡시카르복심, 메토밀, 니트릴라카르브, 옥사밀, 타짐카르브, 티오키아르복심, 티오디카르브 및 티오파노옥스; 페닐 메틸카르바메이트 살곤충제, 예컨대 알리시카르브, 아미노카르브, 부벤카르브, 부타카르브, 카르바놀레이트, 클로에토카르브, 디크레실, 디옥사카르브, EMPC, 에티오펜카르브, 페네타카르브, 페노부카르브, 이소프로카르브, 메티오키아르브, 메톨카르브, 맥사카르베이트, 프로막실, 프로메카르브, 프로폭실, 트리메타카르브, XMC 및 크실틸카르브; 흡습 살곤충제, 예컨대 붕산, 규조토 및 실리카 겔; 디아미드 살곤충제, 예컨대 클로란트라닐리프롤, 시안트라닐리프롤 및 플루벤디아미드; 디니트로페놀 살곤충제, 예컨대 디넥스, 디노프로프, 디노삼 및 DNOC; 불소 살곤충제, 예컨대 바륨 헥사플루오로실리케이트, 방정석, 나트륨 플루오라이드, 나트륨 헥사플루오로실리케이트 및 숄플루라미드; 포름아미딘 살곤충제, 예컨대 아미트라즈, 클로르디메포름, 포르메타네이트 및 포름파라네이트; 훈증 살곤충제, 예컨대 아크릴로니트릴, 탄소 이황화물, 탄소 사염화물, 클로로포름, 클로로피크린, 파라-디클로로벤젠, 1,2-디클로로프로판, 에틸 포르메이트, 에틸렌 이브롬화물, 에틸렌 디클로라이드, 에틸렌 옥사이드, 수소 시안화물, 요오도메탄, 메틸 브롬화물, 메틸클로로포름, 염화메틸렌, 나프탈렌, 포스핀, 숄푸릴 플루오라이드 및 테트라클로로에탄; 무기 살곤충제, 예컨대 보락스, 칼슘 폴리술포이드, 구리 올레이트, 멀큐러스 클로라이드, 칼륨 티오시아네이트 및 나트륨 티오시아네이트; 키틴 합성 억제제, 예컨대 비스트리플루론, 부프로페진, 클로르플루아주론, 시로마진, 디플루벤주론, 플루시클록수론, 플루페녹수론, 헥사플루무론, 루페누론, 노발루론, 노비플루무론, 펜플루론, 테플루벤주론 및 트리플루무론; 유충(juvenile) 호르몬 모방제(mimics), 예컨대 에포페노난, 페녹시카르브, 히드로프렌, 키노프렌, 메토프렌, 피리프록시펜 및 트리프렌; 유충 호르몬, 예컨대 유충 호르몬 I, 유충 호르몬 II 및 유충 호르몬 III; 탈피(moulting) 호르몬 효능제, 예컨대 크로마페노지드, 할로페노지드, 메톡시페노지드 및 테부페노지드; 탈피 호르몬, 예컨대 α-엑디손 및 엑디스테론; 탈피 억제제, 예컨대 디오펜올란; 프레코신, 예컨대 프레코신 I, 프레코신 II 및 프레코신 III; 미분류 곤충 성장 조절제, 예컨대 디시클라닐; 네레이스톡신 아날로그 살곤충제, 예컨대 벤술탑, 칼탑, 티오시클람 및 티오술탑; 니코티노이드 살곤충제, 예컨대 플로니카미드; 니트로구아니딘 살곤충제, 예컨대 클로티아니딘, 디노트푸란, 이미다클로프리드 및 티아메톡삼; 니트로메틸렌 살곤충제, 예컨대 니텐피람 및 니티아진; 피리디메틸-아민 살곤충제, 예컨대 아세트아미프리드, 이미다클로프리드, 니텐피람 및 티아클로프리드; 유기염소 살곤충제, 예컨대 브로모-DDT, 캄페클로르, DDT, pp'-DDT, 에틸-DDD, HCH, 감마-HCH, 린단, 메톡시클로르, 펜타클로로페놀 및 TDE; 시클로디엔 살곤충제, 예컨대 알드린, 브로모시클렌, 클로르비시클렌, 클로르단, 클로르데콘, 디엘드린, 딜로르, 엔도술판, 알파-엔도술판, 엔드린, HEOD, 헵타클로르, HHDN, 이소벤잔, 이소드린, 켈레반 및 미렉스; 유기포스페이트 살곤충제, 예컨대 브롬벤리포스, 클로르벤리포스, 크로톡시포스, 디클로르보스, 디크로토포스, 디메틸리포스, 포스피레이트, 헵타노포스, 메토키로토포스, 메빈포스, 모노키로토포스, 날레드, 나프탈로포스, 포스파미돈, 프로파포스, TEPP 및 테트라클로르빈포스; 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 디옥사벤조포스, 포스메틸란 및 펜토에이트; 지방족 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 아세티온, 아미톤, 카두사포스, 클로레톡시포스, 클로르메포스, 데메피온, 데메피온-O, 데메피온-S, 데메톤, 데메톤-O, 데메톤-S, 데메톤-메틸, 데메톤-O-메틸, 데메톤-S-메틸, 데메톤-S-메틸숄폰, 디숄포톤, 에티온, 에토프로포스, IPSP, 이소티오에이트, 말라티온, 메타크리포스, 옥시테메톤-메틸, 옥시테프

로포스, 옥시디술포톤, 포레이트, 술포텡, 테르부포스 및 티오메톤; 지방족 아미드 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 아미디티온, 시안토에이트, 디메토에이트, 에토에이트-메틸, 포르모티온, 메카르밤, 오메토에이트, 프로토에이트, 소파미드 및 바미도티온; 옥심 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 클로르복심, 폭심 및 폭심-메틸; 헤테로시클릭 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 아자메티포스, 쿠마포스, 쿠미토에이트, 디옥사티온, 엔도티온, 맨아존, 모르포티온, 포살론, 피라클로포스, 피리다텐티온 및 퀴노티온; 벤조티오피란 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 디티크로포스 및 티크로포스; 벤조트리아진 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 아진포스-에틸 및 아진포스-메틸; 이소인돌 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 디알리포스 및 포스메트; 이속사졸 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 이속사티온 및 줄라프로포스; 피라졸로피리미딘 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 클로르프라조포스 및 피라조포스; 피리딘 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 클로르피리포스 및 클로르피리포스-메틸; 피리미딘 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 부타티오포스, 디아지논, 에트림포스, 리림포스, 피리미포스-에틸, 피리미포스-메틸, 프리미도포스, 피리미테이트 및 테부피림포스; 퀴녹살린 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 퀴날포스 및 퀴날포스-메틸; 티아디아졸 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 아티다티온, 리티다티온, 메티다티온 및 프로티다티온; 트리아졸 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 이사조포스 및 트리아조포스; 페닐 유기티오포스페이트 살곤충제, 예컨대 아조토에이트, 브로모포스, 브로모포스-에틸, 카르보페노티온, 클로르티오포스, 시아노포스, 시티오에이트, 디캅톤, 디클로펜티온, 에타포스, 팜퍼르, 펜클로르포스, 페니트로티온, 펜술포티온, 펜티온, 펜티온-에틸, 헤테로포스, 조드펜포스, 메술펜포스, 파라티온, 파라티온-메틸, 펜캅톤(phenkapton), 포스니클로르, 프로페노포스, 프로티오포스, 술프로포스, 테메포스, 트리클로르메타포스-3 및 트리페노포스; 포스폰산염 살곤충제, 예컨대 부토네이트 및 트리클로르폰; 포스포노티오에이트 살곤충제, 예컨대 메카르폰; 페닐 에틸포스포노티오에이트 살곤충제, 예컨대 포노포스 및 트리클로로나트; 페닐 페닐포스포노티오에이트 살곤충제, 예컨대 시아노펜포스, EPN 및 랩토포스; 포스포르아미데이트 살곤충제, 예컨대 크루포메이트, 펜아미포스, 포스티에탄, 메포스폴란, 포스폴란 및 피리메타포스; 포스포르아미도티오에이트 살곤충제, 예컨대 아세페이트, 이소카르보포스, 이소펜포스, 이소펜포스-메틸, 메트아미도포스 및 프로페탐포스; 포스포로디아미드 살곤충제, 예컨대 디메폭스, 마지독스, 미파폭스 및 시라단(schradan); 옥사디아진 살곤충제, 예컨대 인독사카르브; 옥사디아졸린 살곤충제, 예컨대 메톡사디아존; 프탈이미드 살곤충제, 예컨대 디알리포스, 포스메트 및 테트라메트린; 피라졸 살곤충제, 예컨대 테부펜피라드, 톨레펜피라드; 페닐피라졸 살곤충제, 예컨대 아세토프롤, 에티프롤, 피프론일, 피라플루프롤, 피리프롤 및 바닐리프롤; 피레트로이드 에스테르 살곤충제, 예컨대 아크리나트린, 알레트린, 비오알레트린, 바르트린, 비펜트린, 비오에타노메트린, 시클레트린, 시클로프로트린, 시플루트린, 베타-시플루트린, 시할로트린, 감마-시할로트린, 람다-시할로트린, 시페르메트린, 알파-시페르메트린, 베타-시페르메트린, 쉐타-시페르메트린, 제타-시페르메트린, 시페노트린, 델타메트린, 디메플루트린, 디메트린, 엠펜트린, 펜플루트린, 펜피리트린, 펜프로파트린, 펜발레레이트, 에스펜발레레이트, 플루시트리네이트, 플루발리네이트, 타우-플루발리네이트, 푸레트린, 이미프로트린, 메퍼플루트린, 메토플루트린, 펠메트린, 바이오펠메트린, 트랜스펠메트린, 페노트린, 프랄레트린, 프로플루트린, 피레스메트린, 레스메트린, 바이오레스메트린, 시스메트린, 테플루트린, 테랄레트린, 테트라메트린, 테트라메틸플루트린, 트랄로메트린 및 트랜스플루트린; 피레트로이드 에테르 살곤충제, 예컨대 에토펜프록스, 플루펜프록스, 할펜프록스, 프로트리펜부트 및 실라플루오펜; 피리미딘아민 살곤충제, 예컨대 플루페네림 및 피리미디펜; 피롤 살곤충제, 예컨대 클로르펜아피르; 테트라 산 살곤충제, 예컨대 스피로테트라마트; 테트론산 살곤충제, 예컨대 스피로메시펜; 티오우레아 살곤충제, 예컨대 디아펜티우론; 우레아 살곤충제, 예컨대 플루코푸론 및 솔코푸론; 및 미분류 살곤충제, 예컨대 클로산텔, 구리 나프테네이트, 크로타미돈, EXD, 펜아자플로르, 페녹사크림, 히드라메틸논, 이소프로티올란, 말로노벤, 메타플루미존, 니플루리디드, 폴리페네이트, 피리다벤, 피리달릴, 피리플루퀴나존, 라폭스아니드, 술포사플로르, 트리아라텐 및 트리아자메이트 및 그의 임의의 조합물을 포함하나 이에 제한되지 않는다.

[0099] 추가적으로, 본 발명의 화합물은 적용을 위해 선택된 매질에서 본 발명의 화합물들과 상용성이며, 본 발명의 화합물의 활성에 길항적이지 않아서 살충적 혼합물 및 그의 상승작용적 혼합물을 형성하는 제조제와 혼합될 수 있다. 본 개시내용의 살진균적 화합물은 하나 이상의 다른 제조제와 함께 사용되어서 광범위한 각종의 원하지 않는 식물들을 조절할 수 있다. 제조제와 함께 사용되는 경우, 현재 청구하는 화합물은 제조제(들)과 함께 제형화되거나, 제조제(들)과 탱크 혼합될 수 있거나, 제조제(들)과 순차적으로 사용될 수 있다. 통상적인 제조제로는 아미드 제조제, 예컨대 알리도클로르, 베플루부타미드, 벤자독스, 벤지프람, 브로모부티드, 카펜스트롤, CDEA, 시프라졸, 디메텐아미드, 디메텐아미드-P, 디펜아미드, 에프로나즈, 에트니프로미드, 펜트라자미드, 플루폭삼, 포메사펜, 할로사펜, 이소카르바미드, 이속사벤, 나프로파미드, 나프탈람, 페톡사미드, 프로피자미드, 퀴노나미드 및 테부담; 아닐리드 제조제, 예컨대 클로라노크릴, 시스아닐리드, 클로메프로프, 시프로미드, 디플루

페니칸, 에토벤자니드, 페나솔람, 플루펜아세트, 플루페니칸, 메펜아세트, 메플루이디드, 메탐이폼, 모날리드, 나프로알리드, 펜타노클로르, 피콜린아펜 및 프로판닐; 아릴알라닌 제조제, 예컨대 벤조일프로프, 플람프로프 및 플람프로프-M; 클로로아세트아닐리드 제조제, 예컨대 아세토클로르, 알라클로르, 부타클로르, 부테나클로르, 텔라클로르, 디에타틸, 디메타클로르, 메타자클로르, 메톨라클로르, S-메톨라클로르, 프레틸라클로르, 프로파클로르, 프로피소클로르, 프리나클로르, 테르부클로르, 테닐클로르 및 크실라클로르; 술폰아닐리드 제조제, 예컨대 벤조플루오르, 피플루이돈, 피리미솔판 및 프로플루아졸; 술폰아미드 제조제, 예컨대 아솔람, 카르바솔람, 페나솔람 및 오리잘린; 티오아미드 제조제, 예컨대 클로르티아미드; 항생제 제조제, 예컨대 빌라나포스; 벤조산 제조제, 예컨대 클로람벤, 디캄바, 2,3,6-TBA 및 트리캄바; 피리미디닐옥시벤조산 제조제, 예컨대 비스피리박 및 피리미노박; 피리미디닐티오벤조산 제조제, 예컨대 피리티오박; 프탈산 제조제, 예컨대 클로르탈; 피콜린산 제조제, 예컨대 아미노피랄리드, 클로피랄리드 및 피클로람; 퀴놀린카르복실산 제조제, 예컨대 퀴놀로라 및 퀴네락; 비소성 제조제 예컨대 카코딜레 산, CMA, DSMA, 핵사플루레이트, MAA, MAMA, MSMA, 칼륨 아세니트 및 나트륨 아세니트; 벤조일시클로헥산디온 제조제, 예컨대 메소트리온, 솔코트리온, 테푸릴트리온 및 탬보트리온; 벤조푸랄린 알킬술포네이트 제조제, 예컨대 벤푸레사이트 및 에토프메사이트; 벤조티아졸 제조제, 예컨대 벤즈아졸린; 카르바메이트 제조제, 예컨대 아솔람, 카르복사졸 클로르프로카르브, 디클로르메이트, 페나솔람, 카르부틸레이트 및 테르부카르브; 카르바닐레이트 제조제, 예컨대 바르반, BCPC, 카르바솔람, 카르베타미드, CEPC, 클로르부팜, 클로르프로팜, CPPC, 데스메디팜, 페니소팜, 펜메디팜, 펜메디팜-에틸, 프로팜 및 스웱(swept); 시클로헥센 옥심 제조제, 예컨대 알록시딤, 부트록시딤, 클레토딤, 클로프록시딤, 시클록시딤, 프로폭시딤, 세록시딤, 테프랄록시딤 및 트랄록시딤; 시클로프로필이속사졸 제조제, 예컨대 이속사클로르톨 및 이속사플루톨; 디카르복시미드 제조제, 예컨대 시니돈-에틸, 플루메진, 플루미클로라, 플루미옥사진 및 플루미프로핀; 디니트로아닐린 제조제, 예컨대 벤플루랄린, 부트랄린, 디니트라민, 에탈플루랄린, 플루클로랄린, 이소프로팔린, 메탈프로팔린, 니트랄린, 오리잘린, 펜디메탈린, 프로디아민, 프로플루랄린 및 트리플루랄린; 디니트로페놀 제조제, 예컨대 디노페네이트, 디노프로프, 디노삼, 디노셉, 디노테르브, DNOC, 에티노펜 및 메디노테르브; 디페닐 에테르 제조제, 예컨대 에톡시펜; 니트로페닐 에테르 제조제, 예컨대 엑시플루오르펜, 아클로니펜, 비페녹스, 클로메톡시펜, 클로르니트로펜, 에트니프로미드, 플루오로디펜, 플루오로글리코펜, 플루오로니트로펜, 포메사펜, 푸릴옥시펜, 할로사펜, 락토펴, 니트로펜, 니트로플루오르펜 및 옥시플루오르펜; 디티오카르바메이트 제조제, 예컨대 다조메트 및 메탐; 할로겐화된 지방족 제조제, 예컨대 알로라, 클로로폰, 달라폰, 플루프로파네이트, 핵사클로로아세톤, 요오도메탄, 메틸 브롬화물, 모노클로로아세트산, SMA 및 TCA; 이미다졸리논 제조제, 예컨대 이마자메타벤즈, 이마자목스, 이마자픽, 이마자피르, 이마자퀸 및 이마제타피르; 무기 제조제, 예컨대 암모늄 술포메이트, 붕사, 갈슘 클로레이트, 황산구리, 황산 제1철, 칼륨 아지드, 칼륨 시아네이트, 나트륨 아지드, 나트륨 클로르에이트 및 황산; 니트릴 제조제, 예컨대 브로모보닐, 브로목시닐, 클로록시닐, 디클로베닐, 요오도보닐, 이옥시닐 및 피라클로닐; 유기인 제조제, 예컨대 아미프로포스-메틸, 아닐로포스, 벤솔리드, 빌라나포스, 부타미포스, 2,4-DEP, DMPA, EBEP, 포사민, 글루포시네이트, 글루포시네이트-P, 글리포세이트 및 피페로포스; 페녹시 제조제, 예컨대 브로모페녹심, 클로메프로프, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 디페노헨텐, 디술, 에르본, 에트니프로미드, 펜테라콜 및 트리포프심; 옥사디아졸린 제조제, 예컨대 메타졸, 옥사디아르길, 옥사디아존; 옥사졸 제조제, 예컨대 페녹사솔폰; 페녹시아세트산 제조제, 예컨대 4-CPA, 2,4-D, 3,4-DA, MCPA, MCPA-티오에틸 및 2,4,5-T; 페녹시부티릭 제조제, 예컨대 4-CPB, 2,4-DB, 3,4-DB, MCPB 및 2,4,5-TB; 페녹시프로피온산 제조제, 예컨대 클로프로프, 4-CPP, 디클로르프로프, 디클로르프로프-P, 3,4-DP, 페노프로프, 메코프로프 및 메코프로프-P; 아릴옥시페녹시프로피온산 제조제, 예컨대 클로라지포프, 클로디나포프, 클로포프, 시할로포프, 디클로포프, 페녹사프로프, 페녹사프로프-P, 펜티아프로프, 플루아지포프, 플루아지포프-P, 할록시포프, 할록시포프-P, 이속사피리포프, 메타미포프, 프로파퀴자포프, 퀴잘로포프, 퀴잘로포프-P 및 트리포프; 페닐렌디아민 제조제, 예컨대 디니트라민 및 프로디아민; 피라졸 제조제, 예컨대 피록사솔폰; 벤조일피라졸 제조제, 예컨대 벤조페나프, 피라솔포톨, 피라졸리네이트 및 토프라메존; 페닐피라졸 제조제, 예컨대 플루아졸레이트, 니피라클로펜, 피옥사덴 및 피라플루펜; 피리다진 제조제, 예컨대 크레다진, 피리다폴 및 피리테이트; 피리다진은 제조제, 예컨대 브롬피라존, 클로리다존, 디미다존, 플루펜피르, 메트플루라존, 노르플루라존, 옥사피라존 및 피다논; 피리딘 제조제, 예컨대 아미노피랄리드, 클리오디네이트, 클로피랄리드, 디티오피르, 플루록시피르, 할록시딘, 피클로람, 피콜리나펜, 피리클로르, 티아조피르 및 트리클로피르; 피리미딘디아민 제조제, 예컨대 이프리미담 및 티오클로람; 4차 암모늄 제조제, 예컨대 시페르퀴트, 디에탐퀴트, 디펜조퀴트, 디퀴트, 모르팜퀴트 및 파라퀴트; 티오카르바메이트 제조제, 예컨대 부틸레이트, 시클로에이트, 디-알레이트, EPTC, 에스프로카르브, 에티올레이트, 이소폴리네이트, 메티오벤카르브, 몰리네이트, 올벤카르브, 페볼레이트, 프로술포카르브, 피리부티카르브, 술폰레이트, 티오벤카르브, 티오카르바질, 트리-알레이트 및 베르놀레이트; 티오탄산염 제조제, 예컨대 디백사노, EXD 및 프록산; 티오우레아 제조제, 예컨대 메티우론; 트리아진 제조제, 예컨대 디프로페트린, 인다

지플람, 트리아지플람 및 트리히드록시트리아진; 클로로트리아진 제초제, 예컨대 아트라진, 클로라진, 시아나진, 시프라진, 에글리나진, 이파진, 메소프라진, 프로시아진, 프로글리나진, 프로파진, 세부틸라진, 시마진, 테르부틸라진 및 트리에타진; 메톡시트리아진 제초제, 예컨대 아트라톤, 메토메톤, 프로메톤, 섹부메톤, 시메톤 및 테르부메톤; 메틸티오텐트리아진 제초제, 예컨대 아메트린, 아지프로트린, 시아나트린, 데스메트린, 디메타메트린, 메토프로트린, 프로메트린, 시메트린 및 테르부트린; 트리아진은 제초제, 예컨대 아메트리디온, 아미부진, 핵사지논, 이소메티오진, 메타미트론 및 메트리부진; 트리아졸 제초제, 예컨대 아미트롤, 카펜스트롤, 에프로나즈 및 플루폭삼; 트리아졸론 제초제, 예컨대 아미카르바존, 벤카르바존, 카르펜트라존, 플루카르바존, 이프펜카르바존, 프로폭시카르바존, 솔펜트라존 및 티엔카르바존-메틸; 트리아졸로피리미딘 제초제, 예컨대 클로란술람, 디클로술람, 플로라술람, 플루메트술람, 메토술람, 페녹술람 및 피록술람; 우라실 제초제, 예컨대 벤즈펜디존, 브로마실, 부타페나실, 플루프로파실, 이소실, 레나실, 사플루페나실 및 테르바실; 우레아 제초제, 예컨대 벤즈티아주론, 쿠밀루론, 시클루론, 디클로랄우레아, 디플루벤조피르, 이소노루론, 이소우론, 메타벤즈티아주론, 모니소우론 및 노루론; 페닐우레아 제초제, 예컨대 아니수론, 부투론, 클로르브로무론, 클로르에투론, 클로로톨루론, 클로록수론, 다이무론, 디페녹수론, 디메푸론, 디우론, 페누론, 플루오메투론, 플루오티우론, 이소프로투론, 리누론, 메티우론, 메틸딤론, 메토벤주론, 메토브로무론, 메톡수론, 모노리누론, 모누론, 네부론, 파라플루론, 페노벤주론, 시두론, 테트라플루론 및 티디아주론; 피리미디닐술포닐우레아 제초제, 예컨대 아미도술푸론, 아짐술푸론, 벤술푸론, 클로리무론, 시클로술파무론, 예톡시술푸론, 플라자술푸론, 플루세토술푸론, 플루피르술푸론, 포람술푸론, 할로술푸론, 이마조술푸론, 메소술푸론, 메타조술푸론, 니코술푸론, 오르토술파무론, 옥사술푸론, 프리미술푸론, 프로피리술푸론, 피라조술푸론, 림술푸론, 술포메투론, 술포술푸론 및 트리플록시술푸론; 트리아지닐술포닐우레아 제초제, 예컨대 클로르술푸론, 시노술푸론, 에타메트술푸론, 요오도술푸론, 메트술푸론, 프로술푸론, 티펜술푸론, 트리아술푸론, 트리베누론, 트리플루술푸론 및 트리토술푸론; 티아디아졸릴우레아 제초제, 예컨대 부티우론, 에티디무론, 테부티우론, 티아자플루론 및 티디아주론; 및 미분류 제초제, 예컨대 아크롤레인, 알릴 알코올, 아미노시클로피라클로르, 아자페니딘, 벤타존, 벤조비시클론, 비시클로피론, 부티다졸, 갈슘 시안아미드, 캄벤디클로르, 클로르페낙, 클로르펜프로프, 클로르플루라졸, 클로르플루레놀, 신메틸린, 클로마존, CPMF, 크레졸, 시아나미드, 오르토-디클로로벤젠, 디메피퍼레이트, 엔도탈, 플루오로미딘, 플루리돈, 플루로클로리돈, 플루르타몬, 플루티아세트, 인다노판, 메틸 이소티오시아네이트, OCH, 옥사지클로메폰, 펜타클로로페놀, 펜톡사존, 페닐수은 아세테이트, 프로솔파린, 피리벤족심, 피리프탈리드, 퀴노클라민, 로데탄일, 술글리카핀, 티디아지민, 트리디판, 트리메투론, 트리프로핀단 및 트리텍을 포함하나, 이에 제한되지 않는다.

[0100] 본 개시내용의 또다른 실시양태는 진균 공격의 방제 또는 예방을 위한 방법이다. 이 방법은 토양, 식물, 뿌리, 잎, 씨앗 또는 균류의 위치에 또는, 체내 침입이 예방되어야 하는 위치에 화학식 I의 화합물 중 하나 이상을 살진균적 유효량으로 사용(예컨대, 곡류 식물에 사용)하는 것을 포함한다. 화합물은 살진균적 수준으로 각종 식물을 처리하는데 적합하며, 낮은 식물독성을 나타낸다. 이 화합물은 예방보호제(protectant) 및/또는 근절제 방식 모두에서 유용할 수 있다.

[0101] 이 화합물은 특히 농업적 용도로 유의한 살진균적 효과를 가지는 것으로 밝혀졌다. 다수의 화합물들이 농업적 농작물 및 원예 식물에 사용하기에 특히 효과적이다. 추가적인 이익은 식물의 건강 향상; 식물의 수확량 향상(예컨대, 바이오매스 증가 및/또는 가치있는 성분 함량의 증가); 식물의 생장력 향상(예컨대, 식물 성장 향상 및/또는 더 푸른 잎); 식물의 품질 향상(예컨대, 특정 성분의 조성 또는 함량 향상); 및 식물의 비생물적 및/또는 생물적 스트레스에 대한 내성 향상을 포함할 수 있지만, 이에 제한되지 않는다.

[0102] 상기의 균류에 대한 화합물의 효능이 살진균제로서의 화합물의 일반적인 이용성을 확립한다는 것이 당업자에게 이해될 것이다.

[0103] 이 화합물들은 진균성 병원체에 대항하는 넓은 범위의 활성을 가진다. 예시적인 병원체들은 밀 잎 얼룩균(wheat leaf blotch)(미코스파에텔라 그라미니콜라(*Mycosphaerella graminicola*))로도 또한 공지된, 썬토타아 트리티시), 사과나무 검은별무늬균(벤투리아 인아에쿠알리스), 및 사탕무의 세르코스포라 잎 점무늬균(세르코스포라 베티콜라), 땅콩(세르코스포라 아라키디콜라(*Cercospora arachidicola*)) 및 세르코스포리디움 페르소나툼(*Cercosporidium personatum*)) 및 기타 농작물의 잎 점무늬균, 및 바나나의 점무늬균(black sigatoka)(미코스파에텔라 푸지엔시스(*Mycosphaerella fijiensis*))을 포함할 수 있으나 이에 제한되지 않는다. 사용되는 활성 물질의 정확한 양은 사용될 특정 활성 물질 뿐만 아니라, 요망되는 특정 작용, 방제될 진균 종 및 그의 성장 단계와 화합물과 접촉될 식물의 부분 또는 다른 생물에 또한 좌우된다. 따라서, 모든 화합물, 및 이를 함유하는 제제는 유사한 농도 또는 동일한 진균 종에 대해서 동등하게 효과적이지는 않을 수 있다.

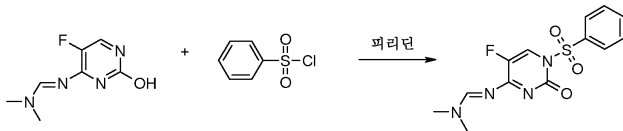
[0104] 이 화합물은 질병-억제 및 식물학적으로 허용가능한 양으로 식물에 사용하기에 효과적이다. 용어 "질병-억제 및 식물학적으로 허용가능한 양"은 방제가 요망되는 식물 질병을 억제하거나 죽이지만 식물에는 유의하게 독성이 없는 화합물의 양을 지칭한다. 이러한 양은 일반적으로 약 0.1 내지 약 1000 ppm (백만 당 부), 바람직하게는 1 내지 500 ppm일 것이다. 요구되는 화합물의 정확한 양은 방제될 진균성 질병, 사용되는 제제의 타입, 시용의 방법, 특정 식물 종, 기후 조건 등에 따라 달라진다. 적절한 시용 속도는 통상적으로 약 0.10 내지 약 4 파운드/에이커(약 0.01 내지 0.45 그램/제곱미터, g/m^2)의 범위이다.

[0105] 본원에 제공된 모든 범위 또는 바람직한 값은, 본원의 교시의 이해를 위해 당업자에게 명백한 바와 같이, 추구하는 효과의 손실 없이 확장되거나 변경될 수 있다.

[0106] 화학식 I의 화합물은 주지된 화학적 절차를 사용하여 제조될 수 있다. 본 개시내용에 특정하게 언급되지 않은 중간체들은 상업적으로 입수가가능하거나, 화학 문헌에 개시된 경로로 제조될 수 있거나, 표준 절차를 이용하여 상업적인 시작 물질로부터 용이하게 합성될 수 있다.

[0107] 하기의 실시예들은 본 개시내용의 화합물의 각종 태양들을 설명하기 위해 제시되며, 특허청구범위에 대한 제한으로 이해되어서는 안된다.

[0108] 실시예 1: N'-(1-벤젠술포닐-5-플루오로-2-옥소-1,2-디히드로-피리미딘-4-일)-N,N-디메틸포름아미딘(1)의 제조



[0109]

[0110] 8 mL의 스크류-캡(screw-cap) 유리병에 피리딘(2 mL), N'-(5-플루오로-2-히드록시-피리미딘-4-일)-N,N-디메틸포름아미딘(100 mg, 0.54 mmol), 및 벤젠술포닐 클로라이드(106 mg, 0.60 mmol)를 첨가하고, 이 혼합물을 24 시간(h) 동안 실온에서 진탕시켰다. 조 혼합물을 에틸 아세테이트(EtOAc)와 포화된 수성 나트륨 비카르보네이트(satd aq NaHCO₃) 사이에서 분배하고, 유기상을 마그네슘 술페이트(MgSO₄) 상에서 건조시키고, 여과시키고, 증발시켜, 153 mg의 조 물질을 제공하였다. 역상 크로마토그래피가 표제의 생성물을 백색 고체(33 mg, 19 %)로서 제공하였다:

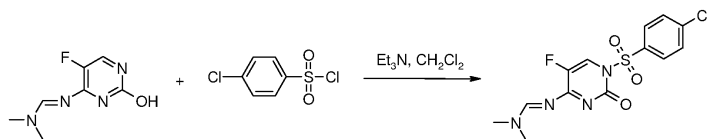
mp 203–204 °C;

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 8.77 (s, 1H), 8.16-8.11 (m, 3H), 7.72-7.65 (m, 1H) 7.60-7.53

(m, 2H), 3.24 (s, 3H), 3.23 (s, 3H); ESIMS *m/z* 325 ([M+H]⁺).

[0111]

[0112] 실시예 2: N'-[1-(4-클로로-벤젠술포닐)-5-플루오로-2-옥소-1,2-디히드로-피리미딘-4-일]-N,N-디메틸포름아미딘 (2)의 제조



[0113]

[0114] 25 mL의 스크류-캡 유리병에 디클로로메탄(CH₂Cl₂; 10 mL), N'-(5-플루오로-2-히드록시-피리미딘-4-일)-N,N-디메틸포름아미딘(250 mg, 1.36 mmol), 및 트리에틸아민(Et₃N, 300 mg, 3 mmol)을 첨가하였다. 이 혼합물에 4-클로로벤젠술포닐 클로라이드(315 mg, 1.5 mmol)를 첨가하고, 생성된 혼합물을 3 시간 동안 실온에서 진탕시켰다. 조 반응 혼합물을 CH₂Cl₂와 염수 사이에서 분배하고, MgSO₄ 상에서 건조시키고, 여과 및 증발시켰다. 잔류물을 역상 크로마토그래피로 정제하여, 표제의 화합물을 백색 고체(321 mg, 66 %)로서 제공하였다:

mp 207–210 °C; ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ

8.75 (s, 1H), 8.08-8.02 (m, 3H), 7.53-7.47 (m, 2H), 3.23 (s, 3H), 3.21 (s, 3H); ESIMS *m/z*

360 ([M+H]⁺).

[0115]

[0116] 표 I의 화합물 3-7을 실시예 2에서와 같이 합성하였다.

[0117] 실시예 3: 4-아미노-1-(4-클로로-벤젠술포닐)-5-플루오로-1H-피리미딘-2-온(8)의 제조(방법 A)

[0118]



[0119] 아세토니트릴(CH₃CN; 40 mL) 중 4-아미노-5-플루오로-피리미딘-2-온^{*}(1.0 g, 7.75 mmol)에 비스-N,O-트리메틸실릴아세트아미드(BSA; 5.7 mL, 23.3 mmol)를 첨가하고, 이 혼합물을 1 시간 동안 70 °C로 가열하여, 투명한 용액을 생성하였다. 실온으로 냉각시킨 후, 4-클로로벤젠 술포닐 클로라이드(1.8 g, 8.5 mmol)를 첨가하고, 이 혼합물을 24 시간 동안 교반하였다. 용매를 증발시키고, 잔류물을 EtOAc와 염수 사이에서 분배하였다. 유기상을 MgSO₄ 상에서 건조시키고, 여과 및 증발시켜, 조 생성물을 백색 고체(1.3 g)로서 제공하였다. EtOAc 및 헵탄으로부터의 재결정화가 표제의 생성물을 백색 고체(0.96 g, 41 %)로서 제공하였다:

[0120]

mp 174–178 °C; ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 8.5 (br s, 1H), 8.08 (d, *J* = 5.9 Hz, 1H), 8.04-7.98 (m, 2H), 7.55-7.49 (m, 2H), 5.9 (br s, 1H); ESIMS *m/z* 304 ([M+H]⁺).

[0121]

* 4-아미노-5-플루오로-피리미딘-2-온은 상업적으로 구입가능하다.

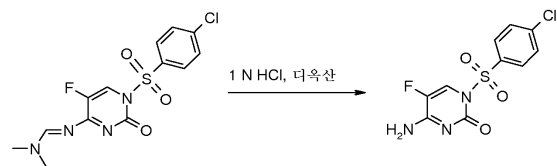
[0122]

표 I의 화합물 9-23을 실시예 3에서와 같이 합성하였다.

[0123]

실시예 4: 4-아미노-1-(4-클로로-벤젠술포닐)-5-플루오로-1H-피리미딘-2-온(8)의 제조(방법 B)

[0124]



[0125]

8 mL의 스크류-캡 유리병에 디옥산(9 mL), 1N 수성 염산(HCl; 1 mL), 및 N'-[1-(4-클로로-벤젠술포닐)-5-플루오로-2-옥소-1,2-디히드로-피리미딘-4-일]-N,N-디메틸포름아미딘(269 mg, 0.75 mmol)을 첨가하였다. 이 혼합물을 16 시간 동안 실온에서 진탕시키고, 질소 스트림 하에 증발시키고, EtOAc와 포화된 수성 NaHCO₃ 사이에서 분배하였다. 유기상을 MgSO₄ 상에서 건조시키고, 여과 및 증발시켜, 표제의 생성물을 백색 고체(196 mg, 86 %)로서 제공하였다:

[0126]

mp 174–178 °C; ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 8.5 (br s, 1H), 8.08 (d, *J* = 5.9 Hz, 1H), 8.04-7.98 (m, 2H), 7.55-7.49 (m, 2H), 5.9 (br s, 1H); ESIMS *m/z* 304 ([M+H]⁺).

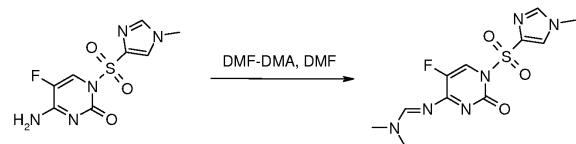
[0127]

표 I의 화합물 24-27을 실시예 4에서와 같이 합성하였다.

[0128]

실시예 5: N'-[5-플루오로-1-(1-메틸-1H-이미다졸-4-술포닐)-2-옥소-1,2-디히드로-피리미딘-4-일]-N,N-디메틸포름아미딘(28)의 제조

[0129]



[0130]

8 mL의 스크류-캡 유리병에 4-아미노-5-플루오로-1-(1-메틸-1H-이미다졸-4-술포닐)-1H-피리미딘-2-온(80 mg, 0.3 mmol), N,N-디메틸포름아미드(DMF; 3 mL), 및 디메틸포름아미드 디메틸아세탈(DMF-DMA; 70 mg, 0.6 mmol)을 첨가하였다. 이 혼합물을 16 시간 동안 실온에서 진탕시키고, Et₂O로 희석시키고, 여과시켜, 표제의 생성물을 밝은 황색 고체(68 mg, 69 %)로서 제공하였다:

mp 228–232 °C dec; ¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ

8.67 (s, 1H), 8.25-8.21 (m, 2H), 7.82 (s, 1H), 3.73 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.13 (s, 3H); ESIMS *m/z* 329 ([M+H]⁺).

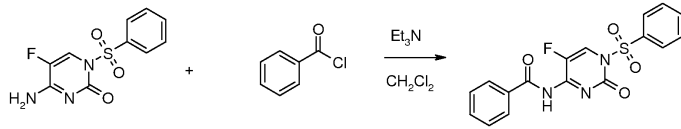
[0131]

[0132]

표 I의 화합물 29-32를 실시예 5에서와 같이 합성하였다.

[0133]

실시예 6: N-(1-벤젠술폰닐-5-플루오로-2-옥소-1,2-디히드로-피리미딘-4-일)-벤즈아미드(33)의 제조



[0134]

[0135]

8 mL의 스크류-캡 유리병에 4-아미노-1-벤젠술폰닐-5-플루오로-1H-피리미딘-2-온(200 mg, 0.74 mmol), CH₂Cl₂(5 mL), Et₃N(200 mg, 1.98 mmol), 및 벤조일 클로라이드(114 mg, 0.82 mmol)를 첨가하였다. 이 혼합물을 2.5 시간 동안 실온에서 진탕시키고, 질소 스트림 하에 증발시키고, EtOAc와 H₂O 사이에서 분배하였다. 유기상을 MgSO₄ 상에서 건조시키고, 여과 및 증발시켰다. 조 물질을 정상 크로마토그래피(구배, 10 내지 50 % EtOAc/석유 에테르)로 부분적으로 정제하고, 주 생성물을 함유한 분획을 증발시키고 EtOAc 및 석유 에테르로부터 재결정화시켜, 표제의 생성물을 백색 고체(112 mg, 41 %)로서 제공하였다:

mp 150–151 °C; ¹H NMR

(300 MHz, CDCl₃) δ 8.31-8.25 (m, 2H), 8.24 (d, *J* = 5.8 Hz, 1H), 8.16-8.11 (m, 2H), 7.82-7.75 (m, 1H), 7.68-7.56 (m, 3H), 7.52-7.44 (m, 2H); ESIMS *m/z* 374 ([M+H]⁺), 372 ([M-H]⁻).

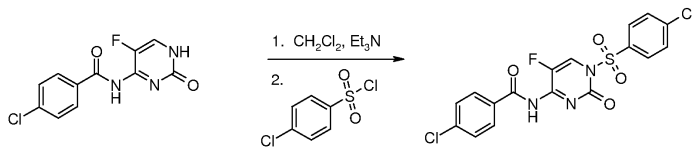
[0136]

[0137]

표 I의 화합물 34-37을 실시예 6에서와 같이 합성하였다.

[0138]

실시예 7: 4-클로로-N-[1-(4-클로로벤젠술폰닐)-5-플루오로-2-옥소-1,2-디히드로피리미딘-4-일]벤즈아미드(38)의 제조



[0139]

[0140]

CH₂Cl₂(4 mL) 중 4-클로로-N-(5-플루오로-2-옥소-1,2-디히드로피리미딘-4-일)벤즈아미드(0.10 g, 0.37 mmol)의 현탁액에 Et₃N(0.08 g, 0.82 mmol) 및 4-클로로벤젠술폰닐 클로라이드(0.087 g, 0.41 mmol)를 0 °C에서 첨가하고, 생성된 혼합물을 실온으로 가온하고 3 시간 동안 교반하였다. 이 반응물을 CH₂Cl₂(10 mL)로 희석시키고 염수로 세척하였다. 상을 분리하고, 유기상을 나트륨 황산염(Na₂SO₄) 상에서 건조시키고, 여과시키고, 호박색(amber) 오일(0.295 g)로 농축시켰다. 정상 크로마토그래피(12 g SiO₂; 구배, 0 내지 35 % EtOAc/헥산)로 정제하여, 4-클로로-N-[1-(4-클로로벤젠술폰닐)-5-플루오로-2-옥소-1,2-디히드로피리미딘-4-일]벤즈아미드(0.025 g, 26 %)를 백색 고체로서 제공하였다:

mp 169–172 °C; ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 12.59 (s,

1H), 8.29-8.15 (m, 3H), 8.05 (d, *J* = 8.8 Hz, 2H), 7.59 (d, *J* = 8.7 Hz, 2H), 7.42 (d, *J* = 8.6 Hz, 2H); ESIMS *m/z* 442 ([M+H]⁺), 440 ([M-H]⁻).

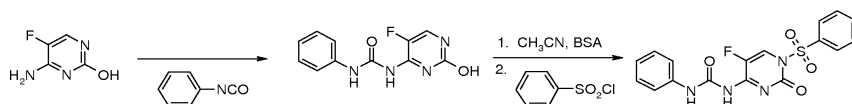
[0141]

[0142]

표 I의 화합물 39를 실시예 7에서와 같이 합성하였다.

[0143]

실시예 8: 1-(1-벤젠술폰닐-5-플루오로-2-옥소-1,2-디히드로피리미딘-4-일)-3-페닐우레아(40)의 제조



[0144]

[0145] A) 무수 DMF(3 mL) 중 4-아미노-5-플루오로피리미딘-2-올(0.200 g, 1.5 mmol)의 현탁액에 페닐이소시아네이트(0.251 g, 2.1 mmol)를 첨가하고, 이 혼합물을 1 시간 동안 23 °C에서 교반한 다음, 16 시간 동안 60 °C에서 교반하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고, 잔류 고체를 여과에 의해 수집하였다. 필터 케이크(cake)를 디에틸 에테르(Et₂O)로 세척하고, 진공 오븐에서 40 °C에서 3 시간 동안 건조시켜, 1-(5-플루오로-2-히드록시피리미딘-4-일)-3-페닐우레아를 백색 고체(0.210 g, 55 %)로서 제공하고, 이를 즉시 다음 단계에 사용하였다.

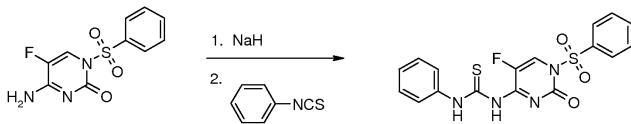
[0146] B) 무수 CH₃CN(4 mL) 중 1-(5-플루오로-2-히드록시피리미딘-4-일)-3-페닐우레아(0.200 g, 0.8 mmol)의 현탁액에 BSA(0.487 g, 2.4 mmol)를 첨가하고, 이 혼합물을 70 °C로 가온하고 1 시간 동안 교반하였다. 생성된 용액을 실온으로 냉각시키고, 벤젠술포닐 클로라이드(0.156 g, 0.9 mmol)로 처리하고, 이 혼합물을 12 시간 동안 교반하였다. 용매를 증발시키고, 잔류물을 EtOAc와 염수 사이에서 분배하였다. 유기상을 MgSO₄ 상에서 건조시키고, 여과 및 농축시켜, 조 생성물을 백색 고체로서 제공하였다. EtOAc 및 헵탄으로부터의 재결정화를 1-(1-벤젠술포닐-5-플루오로-2-옥소-1,2-디히드로피리미딘-4-일)-3-페닐우레아를 백색 고체(0.100 g, 32 %)로서 제공하였다:

mp 210–214 °C; ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 11.26 (dd, *J* = 3.7, 1.1 Hz, 1H), 10.87 (m, 1H), 8.65 (m, 1H), 8.10 (d, *J* = 7.5 Hz, 2H), 7.85 (t, *J* = 7.5 Hz, 1H), 7.71 (m, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.34 (m, 2H), 7.10 (m, 1H); ESIMS *m/z* 389 ([M+H]⁺).

[0147]

[0148] 표 I의 화합물 41-43을 실시예 8에서와 같이 합성하였다.

[0149] 실시예 9: (1-벤젠술포닐-5-플루오로-2-옥소-1,2-디히드로피리미딘-4-일)-3-페닐티오우레아(44)의 제조



[0150]

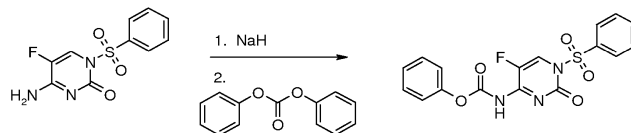
[0151] 무수 테트라히드로푸란(THF; 3 mL) 중 4-아미노-1-벤젠술포닐-5-플루오로-1H-피리미딘-2-온(0.20 g, 0.74 mmol)의 현탁액에 나트륨 히드라이드(NaH; 미네랄 오일 중 60 중량% 현탁액 0.044 g, 1.11 mmol)를 0 °C에서 첨가하였다. 가스 발생이 진정된 후, 이 혼합물을 캐놀러를 통해 무수 THF(5 mL) 중 페닐 이소티오시아네이트(1.0 g, 7.4 mmol)의 얼음-냉각 혼합물로 옮기고, 6 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 EtOAc(25 mL)로 희석시키고, 생성된 용액을 포화된 수성 암모늄 클로라이드(NH₄Cl; 15 mL) 및 염수(15 mL)로 세척하였다. 유기상을 Na₂SO₄상에서 건조시키고, 여과시키고, 용매를 증발시켰다. 잔류물을 메탄올(MeOH) 및 Et₂O로부터의 침전에 의해 정제하여, (1-벤젠술포닐-5-플루오로-2-옥소-1,2-디히드로피리미딘-4-일)-3-페닐티오우레아를 밝은 황색 고체(0.025 g, 8 %)로서 제공하였다:

mp 205–208 °C; ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 11.26 (dd, *J* = 3.7, 1.1 Hz, 1H), 10.87 (m, 1H), 8.65 (m, 1H), 8.10 (d, *J* = 7.5 Hz, 2H), 7.85 (t, *J* = 7.5 Hz, 1H), 7.71 (m, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.34 (m, 2H), 7.10 (m, 1H); ESIMS *m/z* 405 ([M+H]⁺).

[0152]

[0153] 표 I의 화합물 45 및 46을 실시예 9에서와 같이 합성하였다.

[0154] 실시예 10: (1-벤젠술포닐-5-플루오로-2-옥소-1,2-디히드로피리미딘-4-일)카르바산 페닐 에스테르(47)의 제조



[0155]

[0156] 무수 THF(3 mL) 중 4-아미노-1-벤젠술포닐-5-플루오로-1H-피리미딘-2-온(0.20 g, 0.74 mmol)의 현탁액에 NaH(미네랄 오일 중 60 중량% 현탁액 0.044 g, 1.11 mmol)를 0 °C에서 첨가하였다. 가스 발생이 진정된 후, 이 혼합물을 캐놀러를 통해 무수 THF(5 mL) 중 디페닐 카르보네이트(1.5 g, 7.4 mmol)의 얼음-냉각 혼합물로 옮기고, 6 시간 동안 교반하였다. 반응물을 EtOAc(25 mL)로 희석시키고 생성된 용액을 포화된 수성 NH₄Cl(15 mL) 및 염

수(15 mL)로 세척하였다. 유기상을 Na₂SO₄ 상에서 건조시키고, 여과시키고, 용매를 증발시켰다. 잔류물을 MeOH 및 Et₂O로부터의 침전에 의해 정제하여, (1-벤젠술폰닐-5-플루오로-2-옥소-1,2-디히드로피리미딘-4-일)카르바산 페닐 에스테르를 밝은 갈색 고체(0.070 g, 24 %)를 제공하였다:

mp

182–185 °C; ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 7.95 (m, 2H), 7.87 (d, *J* = 7.0 Hz, 1H), 7.71 (d, *J* = 7.5 Hz, 1H), 7.61 (t, *J* = 7.7 Hz, 2H), 7.33 (t, *J* = 7.9 Hz, 2H), 7.15 (d, *J* = 7.3 Hz, 1H), 7.06 (d, *J* = 7.6 Hz, 2H); ESIMS *m/z* 390 ([M+H]⁺), 388 ([M-H]⁻).

[0157]

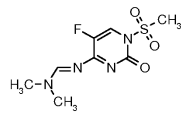
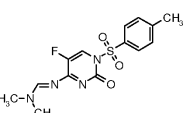
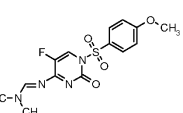
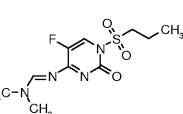
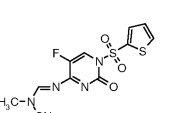
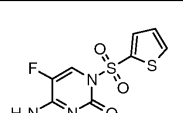
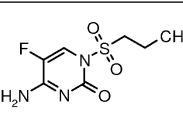
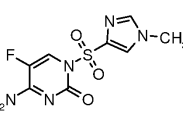
[0158]

표 I의 화합물 48–50을 실시예 10에서와 같이 합성하였다.

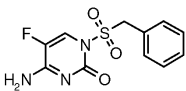
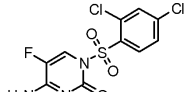
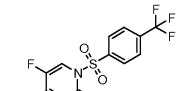
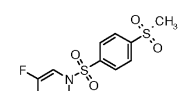
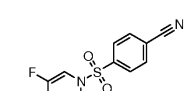
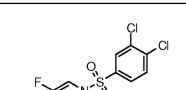
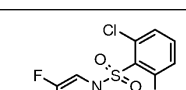
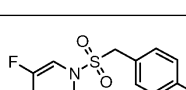
[0159]

[표 I]

화합물 및 관련된 특정 데이터

화합물	구조식	MS	mp (°C)	외관	¹ H NMR* (δ, CDCl ₃)
3		ESIMS <i>m/z</i> 263 ([M+H] ⁺)	133–134	백색 결정질 고체	8.8 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 3.6 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.21 (s, 3H)
4		ESIMS <i>m/z</i> 340 ([M+H] ⁺)	199–203	백색 고체	8.73 (s, 1H), 8.09 (d, <i>J</i> = 5.6 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.32 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 3.21 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 2.42 (s, 3H)
5		ESIMS <i>m/z</i> 356 ([M+H] ⁺)	188–190	백색 고체	8.67 (s, 1H), 8.04 (d, <i>J</i> = 5.6 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 9.2 Hz, 2H), 6.92 (d, <i>J</i> = 9.2 Hz, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.16 (s, 6H)
6		ESIMS <i>m/z</i> 291 ([M+H] ⁺)	144–145	황색-오렌지색 고체	8.83 (s, 1H), 7.84 (d, <i>J</i> = 5.6 Hz, 1H), 3.84–3.77 (m, 2H), 3.25 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 1.91–1.74 (m, 2H), 1.04 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 3H)
7		ESIMS <i>m/z</i> 331 ([M+H] ⁺)	205–207	황갈색 고체	8.79 (s, 1H), 8.09–8.06 (m, 1H), 8.04 (d, <i>J</i> = 5.6 Hz, 1H), 7.77–7.74 (m, 1H), 7.15–7.11 (m, 1H), 3.23 (s, 6H)
9		ESIMS <i>m/z</i> 275 ([M+H] ⁺)	187–189	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.59 (br s, 1H), 8.33–8.24 (br s 및 d, 2H), 8.21–8.18 (m, 1H), 8.00–7.96 (m, 1H), 7.29–7.24 (m, 1H)
10		ESIMS <i>m/z</i> 236 ([M+H] ⁺)	144–146	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.58 (br s, 1H), 8.28 (br s, 1H), 8.01 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 3.88–3.82 (m, 2H), 1.74–1.63 (m, 2H), 0.97 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H)
11		ESIMS <i>m/z</i> 274 ([M+H] ⁺)	235–237	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.48 (br s, 1H), 8.23 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 8.21 (br s, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.84 (s, 1H), 3.74 (s, 3H)

[0160]

화합물	구조식	MS	mp (°C)	외관	¹ H NMR* (δ, CDCl ₃)
12		ESIMS <i>m/z</i> 284 ([M+H] ⁺)	172- 174	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.57 (br s, 1H), 8.25 (br s, 1H), 7.65 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 7.41-7.35 (m, 3H), 7.30-7.26 (m, 2H), 5.20 (s, 2H)
13		ESIMS <i>m/z</i> 339 ([M+H] ⁺)	229- 230	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.56 (br s, 2H), 8.30 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 8.17 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 1H), 7.95 (d, <i>J</i> = 2.0 Hz, 1H), 7.74 (dd, <i>J</i> = 8.6, 2.0 Hz, 1H)
14		ESIMS <i>m/z</i> 338 ([M+H] ⁺)	202- 204	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.66 (br s, 1H), 8.37 (br s, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 8.25 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 2H), 8.06 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 2H)
15		ESIMS <i>m/z</i> 348 ([M+H] ⁺)	220- 223	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆ + CD ₃ CO ₂ D) 8.30 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 8.27-8.23 (m, 2H), 8.19-8.15 (m, 2H), 3.3 (s, 3H)
16		ESIMS <i>m/z</i> 295 ([M+H] ⁺)	210	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.67 (br s, 1H), 8.38 (br s, 1H), 8.30 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 8.22-8.13 (m, 4H)
17		ESIMS <i>m/z</i> 338 ([M+H] ⁺)	206- 207	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.65 (br s, 1H), 8.36 (br s, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 2 Hz, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 8.01 (dd, <i>J</i> = 8.6, 2 Hz, 1H), 7.96 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 1H)
18		ESIMS <i>m/z</i> 338 ([M+H] ⁺)	209- 212	회백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.76 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 7.70 (m, 3H)
19		ESIMS ESIMS <i>m/z</i> 361 ([M+H] ⁺)	156- 159	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.63 (s, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.72 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 7.63 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.26 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 2H), 5.23 (s, 2H)

[0161]

화합물	구조식	MS	mp (°C)	외관	¹ H NMR* (δ, CDCl ₃)
20		ESIMS <i>m/z</i> 318 ([M+H] ⁺)	168– 170	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.63 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.72 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.49 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 2H), 7.33 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 2H), 5.25 (s, 2H)
21		ESIMS <i>m/z</i> 298 ([M+H] ⁺)	164– 166	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.60 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.68 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 7.19 (d, <i>J</i> = 3.0 Hz, 4H), 5.17 (s, 2H), 2.29 (s, 3H)
22		ESIMS <i>m/z</i> 480 ([M+H] ⁺)		백색 고체	9.12 (s, 1H), 8.26-8.20 (m, 1H), 8.07 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 8.05-7.99 (m, 2H), 7.96 (dd, <i>J</i> = 8.6, 2.2 Hz, 1H), 7.31-7.23 (m, 1H), 6.21 (s, 1H), 2.26 (s, 3H)
23		ESIMS <i>m/z</i> 481 ([M+2H] ⁺), 477 ([M-2H] ⁺)	132 dec	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 9.26 (s, 1H), 8.29 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 2H), 8.11 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 8.03 (d, <i>J</i> = 2.0 Hz, 1H), 7.22 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.3 Hz, 1H), 7.12 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H), 6.24 (s, 1H), 2.51 (s, 3H)
24		ESIMS <i>m/z</i> 270 ([M+H] ⁺)	195– 196	백색 고체	(CD ₃ CN) 8.17 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 8.05-8.00 (m, 2H), 7.80-7.73 (m, 1H), 7.66-7.60 (m, 2H), 6.86 (br s, 1H), 6.62 (br s, 1H)
25		ESIMS <i>m/z</i> 284 ([M+H] ⁺)	208– 210	백색 고체	8.18 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 7.96-7.90 (m, 2H), 7.48- 7.43 (m, 2H), 6.95 (br s, 1H), 6.64 (br s, 1H), 2.48 (s, 3H)
26		ESIMS <i>m/z</i> 300 ([M+H] ⁺)	182.5	백색 고체	8.40 (br s, 1H), 8.11 (d, <i>J</i> = 5.9 Hz, 1H), 8.04-7.98 (m, 2H), 7.02-6.96 (m, 2H), 5.77 (br s, 1H), 3.88 (s, 3H)
27		ESIMS <i>m/z</i> 208 ([M+H] ⁺)	181– 184	백색 고체	(CD ₃ CN) 7.91 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 7.2 (br s, 1H), 6.7 (br s, 1H), 3.54 (s, 3H)

[0162]

화합물	구조식	MS	mp (°C)	외관	¹ H NMR* (δ, CDCl ₃)
29		ESIMS <i>m/z</i> 393 ([M+H] ⁺)	207- 211	연황색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.73 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.34 (d, <i>J</i> = 5.9 Hz, 1H), 7.72 (m, 3H), 3.28 (s, 3H), 3.17 (d, <i>J</i> = 0.8 Hz, 3H)
30		ESIMS <i>m/z</i> 339 ([M+H] ⁺)	152- 154	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.82 (s, 1H), 7.68 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 7.39 (m, 3H), 7.31 (dd, <i>J</i> = 6.6, 2.9 Hz, 2H), 5.26 (s, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.15 (s, 3H)
31		ESIMS <i>m/z</i> 373 ([M+H] ⁺)	140- 143	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.71 (s, 1H), 8.45 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.52 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 4H), 5.23 (s, 2H), 3.24 (s, 3H), 3.13 (s, 3H)
32		ESIMS <i>m/z</i> 353 ([M+H] ⁺)	150- 152	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.71 (s, 1H), 8.44 (d, <i>J</i> = 1.9 Hz, 1H), 7.37 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.22 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 5.14 (s, 2H), 3.24 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 2.31 (s, 3H)
34		ESIMS <i>m/z</i> 346 ([M+H] ⁺), 344 ([M-H] ⁻)	159- 162	황갈색 고체	8.27 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 8.07 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 7.80 (s, 1H), 7.57 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 2.62 (s, 3H)
35		ESIMS <i>m/z</i> 360 ([M+H] ⁺), 358 ([M-H] ⁻)	148- 154 dec	황색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 10.83 (s, 1H), 8.61 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 8.10 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 2H), 7.79 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 2H), 2.63 (q, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 1.01 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H)
36		ESIMS <i>m/z</i> 388 ([M+H] ⁺), 386 ([M-H] ⁻)	129- 132	밝은 황색 고체	8.16 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 8.04 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 2H), 7.56 (d, <i>J</i> = 8.9 Hz, 2H), 1.24 (s, 9H)

[0163]

화합물	구조식	MS	mp (°C)	외관	¹ H NMR* (δ, CDCl ₃)
37		ESIMS <i>m/z</i> 408 ([M+H] ⁺), 406 ([M-H] ⁻)	156- 159	백색 고체	12.64 (s, 1H), 8.25 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 8.18 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 8.05 (m, 2H), 7.58 (m, 3H), 7.46 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H)
39		ESIMS <i>m/z</i> 422 ([M+H] ⁺), 420 ([M-H] ⁻)	156- 158	황갈색 고체	12.50 (s, 1H), 8.15 (m, 3H), 8.05 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 7.59 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 7.25 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 2.42 (s, 3H)
41		ESIMS <i>m/z</i> 423 ([M+H] ⁺)	211- 214	연황색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 11.26 (s, 1H), 10.90 (s, 1H), 8.64 (d, <i>J</i> = 5.6 Hz, 1H), 8.11 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 2H), 7.81 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 7.45 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 7.35 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 7.11 (s, 1H)
42		ESIMS <i>m/z</i> 457 ([M+H] ⁺)	205- 210	백색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 11.19 (s, 1H), 11.02 (s, 1H), 8.72 (s, 1H), 7.76 (m, 3H), 7.47 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.34 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.10 (m, 1H)
43		ESIMS <i>m/z</i> 419 ([M+H] ⁺)	185- 191	백색 고체	
45		ESIMS <i>m/z</i> 435 ([M+H] ⁺)	190- 195	밝은 갈색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 11.31 (s, 1H), 10.84 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.03 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 2H), 7.44 (s, 2H), 7.35 (s, 2H), 7.21 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 7.10 (s, 1H), 3.89 (s, 3H)
46		ESIMS <i>m/z</i> 411 ([M+H] ⁺)	182- 185	연황색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 11.28 (s, 1H), 10.87 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.29 (dd, <i>J</i> = 5.0, 1.4 Hz, 1H), 8.08 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 7.46 (m, 2H), 7.34 (m, 4H)
48		ESIMS <i>m/z</i> 424 ([M+H] ⁺)	192- 195	연황색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 7.97 (m, 2H), 7.85 (m, 1H), 7.69 (m, 2H), 7.34 (dd, <i>J</i> = 10.9, 5.0 Hz, 2H), 7.15 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 7.06 (m, 2H)

[0164]

화합물	구조식	MS	mp (°C)	외관	¹ H NMR* (δ, CDCl ₃)
49		ESIMS <i>m/z</i> 420 ([M+H] ⁺), 418 ([M-H] ⁻)	138- 142	연황색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7.89 (m, 2H), 7.84 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.33 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 7.13 (m, 3H), 7.06 (dd, <i>J</i> = 7.6, 0.9 Hz, 2H), 3.85 (s, 3H)
50		ESIMS <i>m/z</i> 458 ([M+H] ⁺)	199- 203	연황색 고체	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.10 (m, 1H), 7.89 (m, 1H), 7.80 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.35 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 3H), 7.21 (dd, <i>J</i> = 4.9, 3.9 Hz, 1H), 7.15 (dd, <i>J</i> = 11.5, 4.2 Hz, 1H), 7.07 (m, 2H)

[0165]

[0166]

실시에 11: 살진균적 활성의 평가: 밀의 잎 얼룩(미코스포에렐라 그라미니콜라; 아나모르프: 셉토리아 트리티시; 베이어 코드 SEPTTR)

[0167]

밀 식물(각종 유마(Yuma))을 온실 속의 50 % 미네랄 토양/50 % 토양-없는 메트로 믹스(Metro mix) 내의 씨앗으로부터 첫번째 잎이 완전히 발생할 때까지, 화분 당 7-10 묘(苗)목에서 성장시켰다. 이러한 식물들에 살진균제 처리 전 또는 후에 셉토리아 트리티시의 수성 포자 현탁액을 접종하였다. 접종 후에 식물을 100 % 상대 습도에

(1 일은 어두운 이슬(dew) 챔버, 2 및 3 일에는 밝힌 이슬 챔버) 두고 포자들로 하여금 싹트고 있을 감염시키게 하였다. 이후, 질병이 발달하도록 식물을 온실로 옮겼다.

[0168] 하기의 표는 이들 실험들에서 평가된 경우의 본 개시내용의 통상적인 화합물의 활성을 나타낸다. 질병 방제에서의 시험 화합물의 효능은 치료된 식물의 질병의 중증도를 평가하고, 이후 중증도를 처리되지 않고 접종되지 않은 식물의 질병 수준을 기준으로 % 방제로 변환함으로써 결정하였다.

표 II의 각각의 경우에서의 등급 척도는 다음과 같다:

% 질병 방제	등급
76-100	A
51-75	B
26-50	C
0-25	D
시험하지 않음	E

[0169]

[0170] [표 II]

100ppm에서의 SEPTTR 상에서의 화합물의 1-일 예방보호제(1DP) 및 3-일 치료적(3DC) 활성

화합물	SEPTTR 100 PPM 1DP	SEPTTR 100 PPM 3DC
1	A	A
2	A	A
3	A	A
4	A	A
5	A	A
6	A	A
7	A	A
8	A	A
9	A	A
10	A	A
11	C	C
12	A	A
13	A	A
14	A	A
15	B	A
16	B	A
17	A	A
18	A	A
19	A	A
20	E	E
21	E	E
22	A	A
23	A	A
24	A	A
25	A	A
26	A	A
27	A	A
28	C	B
29	A	A
30	E	E
31	E	E
32	E	E
33	A	C
34	A	A
35	A	A
36	A	A
37	A	C
38	A	D
39	D	A
40	D	C
41	E	E
42	D	C
43	D	C
44	D	C

[0171]

화합물	SEPTTR 100 PPM 1DP	SEPTTR 100 PPM 3DC
45	C	B
46	D	C
47	B	A
48	E	E
49	D	A
50	A	A

[0172]