



(19)대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(51) 。 Int. Cl.
C07D 279/06 (2006.01)

(45) 공고일자 2007년04월10일
(11) 등록번호 10-0704719
(24) 등록일자 2007년04월02일

(21) 출원번호	10-2002-7012218	(65) 공개번호	10-2002-0081585
(22) 출원일자	2002년09월17일	(43) 공개일자	2002년10월28일
심사청구일자	2005년12월02일		
번역문 제출일자	2002년09월17일		
(86) 국제출원번호	PCT/EP2001/003215	(87) 국제공개번호	WO 2001/74770
국제출원일자	2001년03월21일	국제공개일자	2001년10월11일

(81) 지정국

국내특허 : 아랍에미리트, 안티구와바부다, 알바니아, 아르메니아, 오스트리아, 오스트레일리아, 아제르바이잔, 보스니아 헤르체고비나, 바베이도스, 불가리아, 브라질, 벨라루스, 벨리제, 캐나다, 스위스, 중국, 콜롬비아, 코스타리카, 쿠바, 체코, 독일, 덴마크, 도미니카, 알제리, 에스토니아, 스페인, 핀란드, 영국, 그라나다, 그루지야, 가나, 감비아, 크로아티아, 헝가리, 인도네시아, 이스라엘, 인도, 아이슬랜드, 일본, 케냐, 키르기즈스탄, 북한, 대한민국, 카자흐스탄, 세인트루시아, 스리랑카, 리베이라, 레소토, 리투아니아, 룩셈부르크, 라트비아, 모로코, 몰도바, 마다가스카르, 마케도니아공화국, 몽고, 말라위, 멕시코, 모잠비크, 노르웨이, 뉴질랜드, 폴란드, 포르투갈, 루마니아, 러시아, 수단, 스웨덴, 싱가포르, 슬로베니아, 슬로바키아, 시에라리온, 타지키스탄, 투르크멘, 터키, 트리니다드토바고, 탄자니아, 우크라이나, 우간다, 미국, 우즈베키스탄, 베트남, 세르비아 앤 몬테네그로, 남아프리카, 짐바브웨,

AP ARIPO특허 : 가나, 감비아, 케냐, 레소토, 말라위, 모잠비크, 수단, 시에라리온, 스와질랜드, 탄자니아, 우간다, 짐바브웨,

EA 유라시아특허 : 아르메니아, 아제르바이잔, 벨라루스, 키르기즈스탄, 카자흐스탄, 몰도바, 러시아, 타지키스탄, 투르크멘,

EP 유럽특허 : 오스트리아, 벨기에, 스위스, 사이프러스, 독일, 덴마크, 스페인, 핀란드, 프랑스, 영국, 그리스, 아일랜드, 이탈리아, 룩셈부르크, 모나코, 네덜란드, 포르투갈, 스웨덴, 터키,

OA OAPI특허 : 부르키나파소, 베닌, 중앙아프리카, 콩고, 코트디부아르, 카메룬, 가봉, 기니, 기니 비사우, 말리, 모리타니, 니제르, 세네갈, 차드, 토고,

(30) 우선권주장 10016544.3 2000년04월03일 독일(DE)

(73) 특허권자 바이엘 악티엔게젤샤프트
독일 데-51368 레버쿠젠

(72) 발명자 루터미카엘
독일연방공화국40764랑엔펠트휘스겐8아

하계만헤르만
독일연방공화국51375레버쿠젠칸딘스키스트라세52

쉬나이더우도

독일연방공화국51373레버쿠젠헤이만스트라세38

돌링거마르크스

미합중국켄사스주66213켄사스오버랜드파크노스13210

다멘페터

독일연방공화국41470노이스알테브뤼커스트라세61

바헨도르프-노이만울리케

독일연방공화국56566노이비트오베러마르켄벡85

피셔라이너

독일연방공화국40789몬하임넬리-작스-스트라세23

그라프알란

독일연방공화국51375레버쿠젠로르칭스트라세35

브레트쉬나이더토마스

독일연방공화국53797로마르탈스트라세29베

에르텔렌크리스트opf

독일연방공화국42799라이홀링겐운터뷔셔호프15

드레베스마르크빌헬름

독일연방공화국40764랑엔펠트괴테스트라세38

호이흐트디터

독일연방공화국40789몬하임악커벡9

리브폴커

독일연방공화국51375레버쿠젠알프레드-쿠빈-스트라세1

(74) 대리인

최규팔

이은선

(56) 선행기술조사문헌

WO 96/25395 A *

US 4613617 A *

US 4256659 A *

US 4409153 A *

* 심사관에 의하여 인용된 문헌

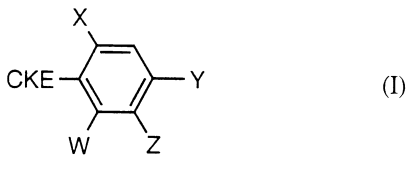
심사관 : 성선영

전체 청구항 수 : 총 15 항

(54) 페스티사이드 및 제조제로서 사용되는 C₂-페닐-치환된사이클릭 케토-에놀

(57) 요약

본 발명은 일반식 (I)의 신규한 C₂-페닐-치환된 사이클릭 케토-에놀, 그의 제조 방법, 및 페스티사이드 및 제조제로서의 그의 용도에 관한 것이다:



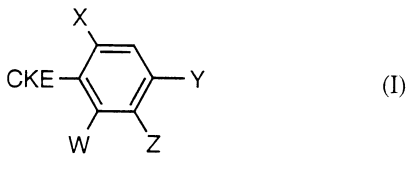
상기 식에서,

W, X, Y, Z 및 CKE 는 각각 명세서에 정의된 바와 같다.

특허청구의 범위

청구항 1.

일반식 (I)의 화합물:



상기 식에서,

W 는 수소, 메틸, 에틸 또는 i-프로필을 나타내고,

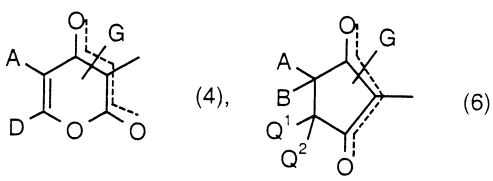
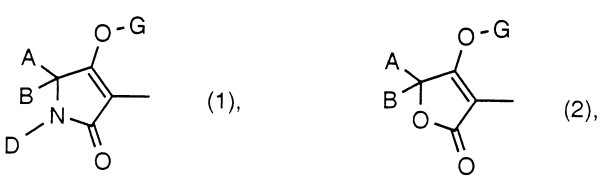
X 는 메틸, 에틸, i-프로필 또는 비닐을 나타내며,

Y 는 수소, 메틸, 에틸, i-프로필, 비닐 또는 에틸닐을 나타내고,

Z 는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필 또는 i-부틸을 나타내며,

단, 래디칼 W, X, Y 및 Z 중 적어도 하나는 적어도 두 개의 탄소원자를 가진 사슬을 나타내고, 래디칼 W, X, Y 또는 Z 중 많아야 하나만 비닐 또는 에틸닐을 나타내고,

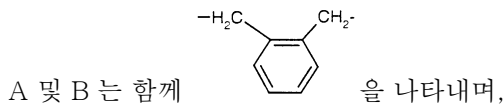
CKE 는 하기 그룹 중 하나를 나타내며;



A 는 메틸을 나타내고,

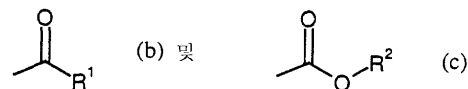
B 는 메틸을 나타내며,

A, B 및 이들이 결합된 탄소 원자는 임의로 하나의 환 멤버가 산소에 의해 대체되고, 메틸, 에틸, 메톡시 또는 에톡시에 의해 임의로 일치환된 포화 C₅-C₆-사이클로알킬을 나타내고,



D 는 수소를 나타내거나, (일반식 (I-1)의 화합물의 경우는 제외) 불소-치환된 페닐을 나타내고,

G 는 수소(a)를 나타내거나, 하기 그룹 중 하나를 나타내며;



R¹ 은 C₁-C₆-알킬 또는 C₁-C₂-알콕시메틸을 나타내고,

R² 는 C₁-C₄-알킬을 나타내며,

CKE=(6)인 경우,


A 및 Q¹ 은 함께 C₃-C₄-알칸디일을 나타내고,

B 및 Q² 는 각각 수소를 나타낸다.

청구항 2.

(A) 일반식 (II)의 N-아실아미노산 에스테르를 희석제의 존재하 및 염기의 존재하에서 분자내 축합시켜 일반식 (I-1-a)의 3-페닐피롤리딘-2,4-디온 또는 그의 에놀을 수득하거나,

(H) 일반식 (I-1')의 화합물을, 용매의 존재하 및 경우에 따라 염기 및 촉매의 존재하에서 일반식 (X-a)의 실릴아세틸렌 또는 일반식 (X-b)의 비닐주석과 반응시켜 일반식 (I-1)의 화합물[여기에서, A, B, D, G, W, X, Y 및 Z 는 각각 하기 정의된

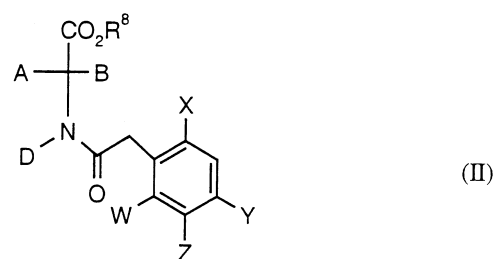
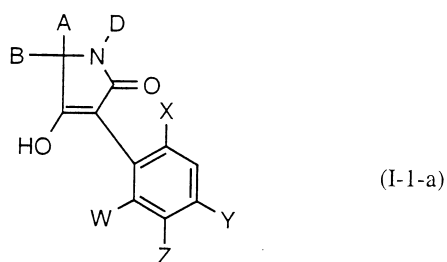
바와 같으며, 하나, 많아야 두 개의 래디칼 W, X, Y 또는 Z 가 R²²-C≡C- 또는  을 나타내고, R²²는 수소 또는 C₁-C₄-알킬을 나타낸다]을 수득하거나,

(I) 일반식 (I-1-a)의 화합물(여기에서, A, B, D, W, X, Y 및 Z 는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서

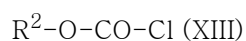
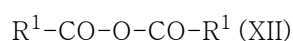
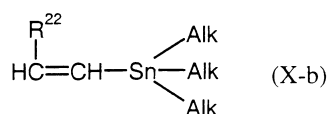
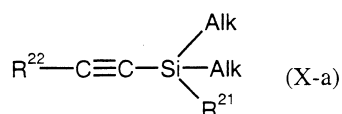
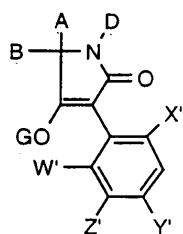
(a) 일반식 (XI)의 산 할라이드와 반응시키거나,

(β) 일반식 (XII)의 카복실산 무수물과 반응시켜 일반식 (I-1-b)의 화합물(여기에서, A, B, D, R¹, W, X, Y 및 Z는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 수득하거나,

(J) 일반식 (I-1-a)의 화합물(여기에서, A, B, D, W, X, Y 및 Z 는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XIII)의 클로로포름산 에스테르와 반응시켜 일반식 (I-1-c)의 화합물(여기에서, A, B, D, R², W, X, Y 및 Z 는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 수득함을 특징으로 하여 제 1 항에 따른 일반식 (I)의 화합물을 제조하는 방법:



(I-1'):



상기 식에서,

A, B, D, G, W, X, Y, Z, W', X', Y', Z', R^1 및 R^2 은 각각 제 1 항에 정의된 바와 같으며, 아포스트로피(')는 이 방법에서 하나, 많아야 두 개의 래디칼 W, X, Y 또는 Z가 염소, 브롬 또는 요오드를 나타내며, 단 나머지 래디칼 W, X, Y 또는 Z가 알케닐 또는 알킬을 나타내지 않는다는 것을 의미하고,

R^8 은 C_1-C_6 -알킬을 나타내며,

Hal 은 할로젠을 나타내며,

Alk 는 C_1-C_4 -알킬을 나타내고,

R^{21} 은 C_1-C_4 -알킬 또는 페닐을 나타내며,

R^{22} 는 수소 또는 C_1-C_4 -알킬을 나타낸다.

청구항 3.

삭제

청구항 4.

삭제

청구항 5.

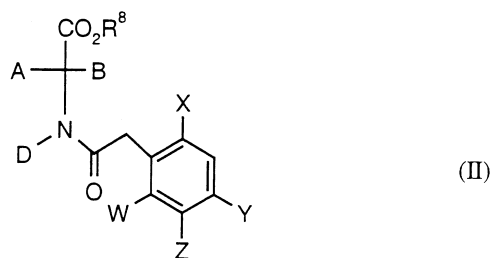
삭제

청구항 6.

삭제

청구항 7.

일반식 (II)의 화합물:



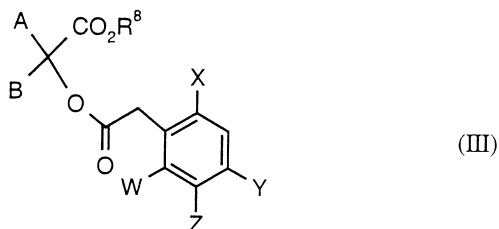
상기 식에서,

A, B, D, W, X, Y 및 Z는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같고,

R^8 은 C_1-C_6 -알킬을 나타낸다.

청구항 8.

일반식 (III)의 화합물:



상기 식에서,

A, B, W, X, Y 및 Z는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같고,

R^8 은 C_1 - C_6 -알킬을 나타낸다.

청구항 9.

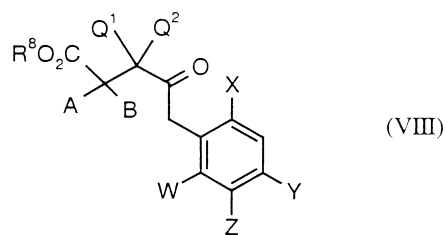
삭제

청구항 10.

삭제

청구항 11.

일반식 (VIII)의 화합물:



상기 식에서,

A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y 및 Z 는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같고,

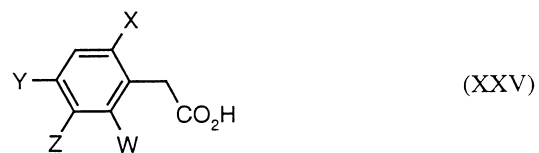
R^8 은 C_1 - C_8 -알킬을 나타낸다.

청구항 12.

삭제

청구항 13.

일반식 (XXV)의 화합물:



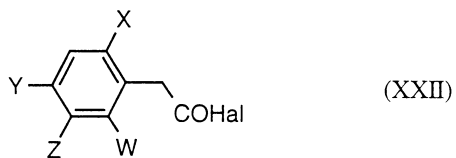
상기 식에서,

W, X, Y 및 Z 는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같고,

Y는 또한 $-C\equiv C-Si(CH_3)_3$ 를 나타낼 수 있다.

청구항 14.

일반식 (XXII)의 화합물:



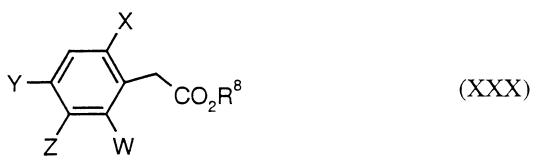
상기 식에서,

W, X, Y 및 Z 는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같으며,

Hal은 염소 또는 브롬을 나타낸다.

청구항 15.

일반식 (XXX)의 화합물:



상기 식에서,

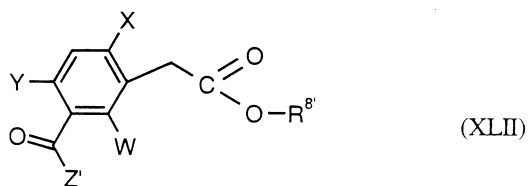
W, X, Y 및 Z 는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같고,

R⁸ 은 C₁-C₆-알킬을 나타내며,

Y는 또한 -C≡C-Si(CH₃)₃일 수 있다.

청구항 16.

일반식 (XLII)의 화합물:



상기 식에서,

W, X 및 Y 는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같으며,

R^{8'} 는 C₁-C₈-알킬을 나타내고,

Z' 는 C₁-C₅-알킬을 나타낸다.

청구항 17.

제 1 항에 따른 일반식 (I)의 화합물을 적어도 하나 함유함을 특징으로 하는 페스티사이드(pesticide) 및 제초제.

청구항 18.

제 1 항에 따른 일반식 (I)의 화합물을 해충 및/또는 그의 서식지에 작용시킴을 특징으로 하여 동물 해충 및 원치않는 식물을 구제하는 방법.

청구항 19.

삭제

청구항 20.

제 1 항에 따른 일반식 (I)의 화합물을 증량제 및/또는 계면활성제와 혼합시킴을 특징으로 하여 페스티사이드 및 제초제를 제조하는 방법.

청구항 21.

삭제

청구항 22.

(B) 일반식 (III)의 카복실산 에스테르를 희석제의 존재하 및 염기의 존재하에서 분자내 축합시켜 일반식 (I-2-a)의 3-페닐-4-하이드록시- Δ^3 -디하이드로푸라는 유도체를 수득하거나,

(H) 일반식 (I-2')의 화합물을, 용매의 존재하 및 경우에 따라 염기 및 촉매의 존재하에서 일반식 (X-a)의 실릴아세틸렌 또는 일반식 (X-b)의 비닐주석과 반응시켜 일반식 (I-2)의 화합물[여기에서, A, B, G, W, X, Y 및 Z 는 각각 하기 정의된 바

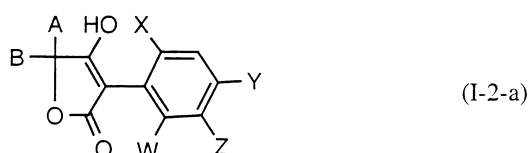
와 같으며, 하나, 많아야 두 개의 래디칼 W, X, Y 또는 Z 가 $R^{22}-C\equiv C-$ 또는 $HC\equiv CH$ 을 나타내고, R^{22} 는 수소 또는 C_1-C_4 -알킬을 나타낸다]을 수득하거나,

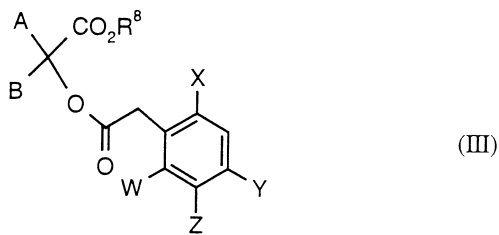
(I) 일반식 (I-2-a)의 화합물(여기에서, A, B, W, X, Y 및 Z 는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서

(a) 일반식 (XI)의 산 할라이드와 반응시키거나,

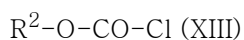
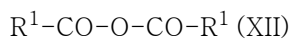
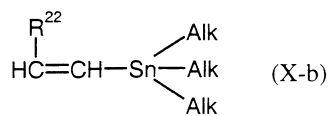
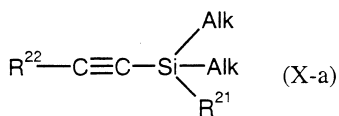
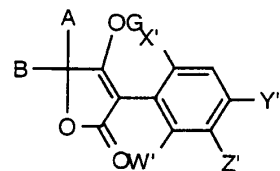
(β) 일반식 (XII)의 카복실산 무수물과 반응시켜 일반식 (I-2-b)의 화합물(여기에서, A, B, R^1 , W, X, Y 및 Z는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 수득하거나,

(J) 일반식 (I-2-a)의 화합물(여기에서, A, B, W, X, Y 및 Z 는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XIII)의 클로로포름산 에스테르와 반응시켜 일반식 (I-2-c)의 화합물(여기에서, A, B, R^2 , W, X, Y 및 Z 는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 수득함을 특징으로 하여 제 1 항에 따른 일반식 (I)의 화합물을 제조하는 방법:





(I-2'):



상기 식에서,

A, B, G, W, X, Y, Z, W', X', Y', Z', R^1 및 R^2 은 각각 제 1 항에 정의된 바와 같으며, 아포스트로피(')는 이 방법에서 하나, 많아야 두 개의 래디칼 W, X, Y 또는 Z 가 염소, 브롬 또는 요오드를 나타내며, 단 나머지 래디칼 W, X, Y 또는 Z가 알케닐 또는 알키닐을 나타내지 않는다는 것을 의미하고,

R^8 은 C_1-C_6 -알킬을 나타내며,

Hal 은 할로젠을 나타내며,

Alk 는 C_1-C_4 -알킬을 나타내고,

R^{21} 은 C_1-C_4 -알킬 또는 페닐을 나타내며,

R^{22} 는 수소 또는 C_1-C_4 -알킬을 나타낸다.

청구항 23.

(D) 일반식 (V)의 카보닐 화합물 또는 일반식 (Va)인 그의 실릴 에놀 에테르를 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 수용체의 존재하에서 일반식 (VI)의 케텐산 할라이드와 반응시켜 일반식 (I-4-a)의 3-페닐피론 유도체를 수득하거나,

(H) 일반식 (I-4')의 화합물을, 용매의 존재하 및 경우에 따라 염기 및 촉매의 존재하에서 일반식 (X-a)의 실릴아세틸렌 또는 일반식 (X-b)의 비닐주석과 반응시켜 일반식 (I-4)의 화합물[여기에서, A, D, G, W, X, Y 및 Z는 각각 하기 정의된 바

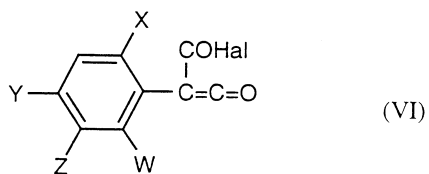
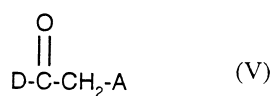
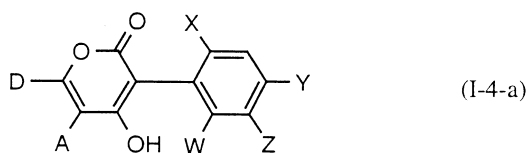
와 같으며, 하나, 많아야 두 개의 래디칼 W, X, Y 또는 Z가 $R^{22}-C\equiv C-$ 또는 $\begin{matrix} R^{22} \\ | \\ HC=CH \end{matrix}$ 을 나타내고, R^{22} 는 수소 또는 C_1-C_4 -알킬을 나타낸다]을 수득하거나,

(I) 일반식 (I-4-a)의 화합물(여기에서, A, D, W, X, Y 및 Z는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서

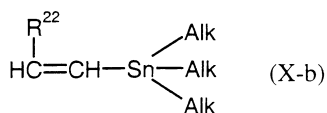
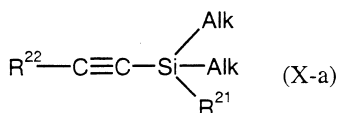
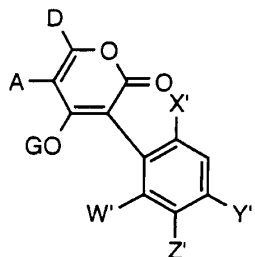
(α) 일반식 (XI)의 산 할라이드와 반응시키거나,

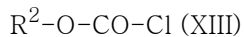
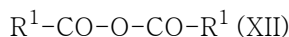
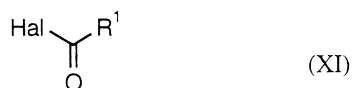
(β) 일반식 (XII)의 카복실산 무수물과 반응시켜 일반식 (I-4-b)의 화합물(여기에서, A, D, R^1 , W, X, Y 및 Z는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 수득하거나,

(J) 일반식 (I-4-a)의 화합물(여기에서, A, D, W, X, Y 및 Z는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XIII)의 클로로포름산 에스테르와 반응시켜 일반식 (I-4-c)의 화합물(여기에서, A, D, R^2 , W, X, Y 및 Z는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 수득함을 특징으로 하여 제 1 항에 따른 일반식 (I)의 화합물을 제조하는 방법:



(I-4'):





상기 식에서,

A, D, G, W, X, Y, Z, W', X', Y', Z', R¹ 및 R²은 각각 제 1 항에 정의된 바와 같으며, 아포스트로피(')는 이 방법에서 하나, 많아야 두 개의 래디칼 W, X, Y 또는 Z가 염소, 브롬 또는 요오드를 나타내며, 단 나머지 래디칼 W, X, Y 또는 Z가 알케닐 또는 알킬닐을 나타내지 않는다는 것을 의미하고,

R⁸은 C₁-C₆-알킬을 나타내며,

Hal은 할로젠을 나타내며,

Alk는 C₁-C₄-알킬을 나타내고,

R²¹은 C₁-C₄-알킬 또는 페닐을 나타내며,

R²²은 수소 또는 C₁-C₄-알킬을 나타낸다.

청구항 24.

(F) 일반식 (VIII)의 케토카복실산 에스테르를 경우에 따라 희석제의 존재하 및 염기의 존재하에서 분자내 폐환시켜 일반식 (I-6-a)의 화합물을 수득하거나,

(H) 일반식 (I-6')의 화합물을, 용매의 존재하 및 경우에 따라 염기 및 촉매의 존재하에서 일반식 (X-a)의 실릴아세틸렌 또는 일반식 (X-b)의 비닐주석과 반응시켜 일반식 (I-6)의 화합물[여기에서, A, B, G, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z는 각각 하기 정

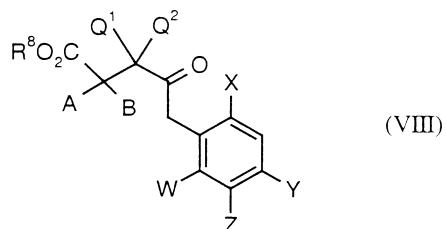
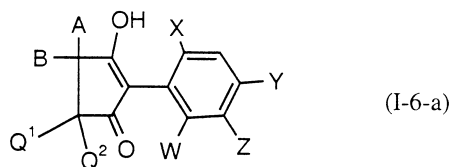
의된 바와 같으며, 하나, 많아야 두 개의 래디칼 W, X, Y 또는 Z가 R²²-C≡C- 또는 $\text{HC}=\text{CH}-\text{R}^{22}$ 을 나타내고, R²²은 수소 또는 C₁-C₄-알킬을 나타낸다]을 수득하거나,

(I) 일반식 (I-6-a)의 화합물(여기에서, A, B, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서

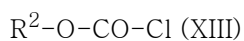
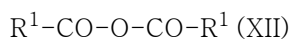
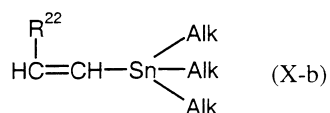
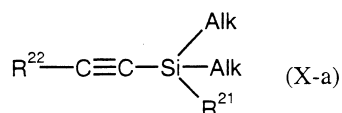
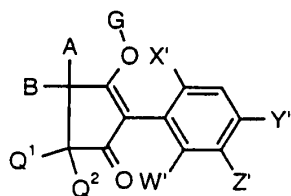
(a) 일반식 (XI)의 산 할라이드와 반응시키거나,

(β) 일반식 (XII)의 카복실산 무수물과 반응시켜 일반식 (I-6-b)의 화합물(여기에서, A, B, Q¹, Q², R¹, W, X, Y 및 Z는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 수득하거나,

(J) 일반식 (I-6-a)의 화합물(여기에서, A, B, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XIII)의 클로로포름산 에스테르와 반응시켜 일반식 (I-6-c)의 화합물(여기에서, A, B, Q¹, Q², R², W, X, Y 및 Z는 각각 하기 정의된 바와 같다)을 수득함을 특징으로 하여 제 1 항에 따른 일반식 (I)의 화합물을 제조하는 방법:



(I-6'):



상기 식에서,

A, B, G, W, X, Y, Z, W', X', Y', Z', R^1 , R^2 , Q^1 및 Q^2 는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같으며, 아포스트로피(')는 이 방법에서 하나, 많아야 두 개의 래디칼 W, X, Y 또는 Z 가 염소, 브롬 또는 요오드를 나타내며, 단 나머지 래디칼 W, X, Y 또는 Z 가 알케닐 또는 알킬닐을 나타내지 않는다는 것을 의미하고,

R^8 은 C_1 - C_8 -알킬을 나타내며,

Hal 은 할로겐을 나타내며,

Alk 는 C_1 - C_4 -알킬을 나타내고,

R^{21} 은 C_1 - C_4 -알킬 또는 페닐을 나타내며,

R^{22} 는 수소 또는 C_1 - C_4 -알킬을 나타낸다.

명세서

기술분야

본 발명은 신규한 C₂-페닐-치환된 사이클릭 케토에놀, 다수의 그의 제조방법, 및 페스티사이드(pesticide) 및 제초제로서의 그의 용도에 관한 것이다.

배경기술

3-아릴-피롤리딘-2,4-디온의 약제학적 성질은 이미 알려져 있다(참조: S. Suzuki 등에 의한 Chem. Pharm. Bull. 15 1120 (1967)). 또한, N-페닐피롤리딘-2,4-디온이 알. 슈미러(R. Schmierer) 및 에이치. 밀덴버거(H. Mildenberger)에 의해 합성되었다(참조: Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095). 이들 화합물의 생물학적 활성은 알려지지 않았다.

EP-A-0 262 399 및 GB-A-2 266 888 은 유사한 구조의 (3-아릴-피롤리딘-2,4-디온) 화합물을 개시하고 있지만, 제초, 살충 또는 살비 활성은 공지되어 있지 않다. 제초, 살충 또는 살비 활성을 갖는 비치환된 비사이클릭 3-아릴-피롤리딘-2,4-디온 유도체(EP-A-355 599 및 EP-A-415 211) 및 치환된 모노사이클릭 3-아릴-피롤리딘-2,4-디온 유도체(EP-A-377 893 및 EP-A-442 077)가 공지되었다.

폴리사이클릭 3-아릴피롤리딘-2,4-디온 유도체(EP-A-442 073) 및 1H-아릴피롤리딘-디온 유도체(EP-A-456 063, EP-A-521 334, EP-A-596 298, EP-A-613 884, EP-A-613 885, WO 94/01 997, WO 95/26 954, WO 95/20 572, EP-A-0 668 267, WO 96/25 395, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/36 868, WO 97/43275, WO 98/05638, WO 98/06721, WO 98/25928, WO 99/16748, WO 99/24437, WO 99/43649, WO 99/48869 및 WO 99/55673)가 또한 공지되었다.

특정의 치환된 Δ^3 -디하이드로푸란-2-온 유도체가 제초적 성질을 갖는 것으로 알려져 있다(참조: DE-A-4 014 420). 출발 물질로서 사용된 테트론산 유도체(예를 들어, 3-(2-메틸-페닐)-4-하이드록시-5-(4-플루오로페닐)- Δ^3 -디하이드로푸란-2-온)의 합성이 또한 DE-A-4 014 420 에 기술되어 있다. 유사한 구조의 화합물이 살충 및/또는 살비 활성의 아무런 언급없이 캠프벨(Campbell) 등에 의한 문헌[J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 1985, (8) 1567-76]에 공지되어 있다. 또한, 제초, 살비 및 살충적 성질을 갖는 3-아릴- Δ^3 -디하이드로푸란은 유도체가 EP-A-528 156, EP-A 0 647 637, WO 95/26 345, WO 96/20 196, WO 96/25 395, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/36 868, WO 98/05638, WO 98/25928, WO 99/16748, WO 99/43649, WO 99/48869 및 WO 99/55673에 기술되어 있다. 3-아릴- Δ^3 -디하이드로티오펜-온 유도체가 마찬가지로 공지되었다(WO 95/26 345, WO 96/25 395, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/36 868, WO 98/05638, WO 98/25928, WO 99/16748, WO 99/43649, WO 99/48869 및 WO 99/55673).

페닐 환이 비치환된 특정의 페닐-피론 유도체가 이미 알려져 있으나(참조: A.M. Chirazi, T. Kappe 및 E. Ziegler, Arch. Pharm. 309, 558 (1976) 및 K.-H. Boltz 및 K. Heidenbluth, Chem. Ber. 91, 2849), 이들 화합물이 페스티사이드로서 사용될 수 있는 지에 대해서는 언급되어 있지 않다. 페닐 환이 치환되어 있으며 제초, 살비 및 살충적 성질을 갖는 페닐-피론 유도체가 EP-A-588 137, WO 96/25 395, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/16 436, WO 97/19 941, WO 97/36 868, WO 98/05638, WO 99/43649, WO 99/48869 및 WO 99/55673에 기술되어 있다.

페닐 환이 비치환된 특정의 5-페닐-1,3-티아진 유도체가 이미 알려져 있으나(참조: E. Ziegler 및 E. Steiner, Monatsh. 95, 147 (1964), R. Ketcham, T. Kappe 및 E. Ziegler, J. Heterocycl. Chem. 10, 223 (1973), 이들 화합물이 페스티사이드로서 사용될 수 있는 지에 대해서는 언급되어 있지 않다. 페닐 환이 치환되어 있으며 제초, 살비 및 살충 활성을 갖는 5-페닐-1,3-티아진 유도체가 WO 94/14 785, WO 96/02 539, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/36 868, WO 98/05638, WO 99/43649, WO 99/48869 및 WO 99/55673에 기술되어 있다.

특정의 치환된 2-아릴사이클로펜탄디온이 제초 및 살비적 성질을 가지고 있음은 공지되었다(참조예: US-4 283 348; 4 338 122; 4 436 666; 4 526 723; 4 551 547; 4 632 698; WO 96/01 798; WO 96/03 366, WO 97/14 667 및 또한 WO 98/39281, WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673). 또한 유사한 구조의 화합물이 공지되었다: 문헌 [Micklefield et al., Tetrahedron, (1992), 7519-26] 으로부터 3-하이드록시-5,5-디메틸-2-페닐사이클로펜텐-2-엔-1-온 및 문헌 [Edwards, et al., J. Chem. Soc. S, (1967), 405-9] 으로부터의 천연 생성물인 인볼류틴 (-)-시스-5-(3,4-디하이드록

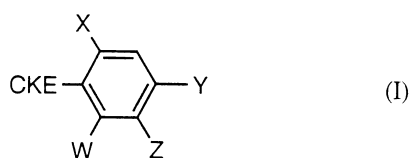
시페닐)-3,4-디하이드록시-2-(4-하이드록시페닐)-사이클로펜트-2-엔-2-온. 살충 또는 살비 활성에 대해서는 개시되어 있지 않다. 또한, 2-(2,4,6-트리메틸페닐)-1,3-인단디온이 문헌 [J. Economic Entomology, 66, (1973), 584] 및 공개된 DE-A 2 361 084에 기술되어 있으며, 제초 및 살비 활성에 대해서도 언급되어 있다.

특정의 치환된 2-아릴사이클로헥산디온이 제초 및 살비적 성질을 가지고 있음은 공지되었다(US-4 175 135, 4 209 432, 4 256 657, 4 256 658, 4 256 659, 4 257 858, 4 283 348, 4 303 669, 4 351 666, 4 409 153, 4 436 666, 4 526 723, 4 613 617, 4 659 372, DE-A 2 813 341, 및 또한 Wheeler, T.N., J. Org. Chem. 44, 4906 (1979), WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673).

그러나, 이들 화합물의 활성 및 활성 스펙트럼은, 특히 적용 비율 및 농도가 낮은 경우에 항상 만족스럽지만은 않다. 또한, 이들 화합물의 식물과의 상용성이 반드시 흡족스러운 것은 아니다.

발명의 상세한 설명

따라서, 본 발명은 신규한 일반식 (I)의 화합물을 제공한다:



상기 식에서,

W 는 수소, 알킬, 알케닐 또는 알키닐을 나타내고,

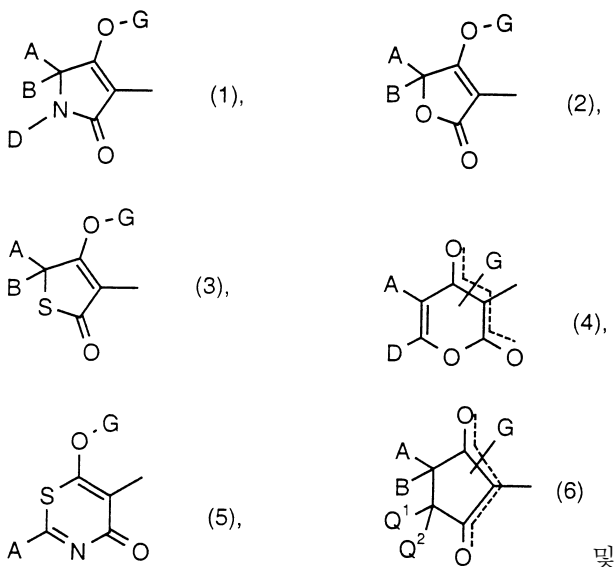
X 는 알킬, 알케닐 또는 알키닐을 나타내며,

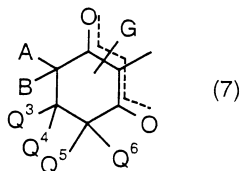
Y 는 수소, 메틸, 에틸, i-프로필, 알케닐 또는 알키닐을 나타내고,

Z 는 수소, 알킬, 알케닐 또는 알키닐을 나타내며,

단, 래디칼 W, X, Y 또는 Z 중 적어도 하나는 적어도 두 개의 탄소원자를 가진 사슬을 나타내고,

CKE 는 하기 그룹 중 하나를 나타내며:





여기에서,

A 는 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 알킬, 알케닐, 알콕시알킬 또는 알킬티오알킬을 나타내거나, 임의로 적어도 하나의 환 원자가 헤테로원자에 의해 대체되고 임의로 치환된 포화 또는 불포화 사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-, 알킬-, 할로게노알킬-, 알콕시-, 할로게노알콕시-, 시아노- 또는 니트로-치환된 아릴, 아릴알킬 또는 헤테아릴을 나타내며,

B 는 수소, 알킬 또는 알콕시알킬을 나타내거나,

A 및 B 는 이들이 결합된 탄소원자와 함께, 임의로 적어도 하나의 헤테로원자를 함유하며 포화되거나 불포화된 비치환 또는 치환 사이클을 나타내고,

D 는 수소를 나타내거나, 알킬, 알케닐, 알키닐, 알콕시알킬, 임의로 하나 이상의 환 멤버가 헤테로원자에 의해 대체되고 포화되거나 불포화된 사이클로알킬, 아릴알킬, 아릴, 헤테아릴알킬 및 헤테아릴로 구성된 그룹으로부터 선택된 임의로 치환된 래디칼을 나타내거나,

A 및 D 는 이들이 결합된 원자와 함께, A, D 부위가 비치환되거나 치환되고 임의로 적어도 하나의 헤테로원자를 함유하는 포화 또는 불포화 사이클을 나타내거나,

A 및 Q¹ 은 함께, 하이드록실에 의해 또는 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 알콕시, 알킬티오, 사이클로알킬, 벤질옥시 또는 아릴에 의해 각각 임의로 치환된 알칸디일 또는 알켄디일을 나타내거나,

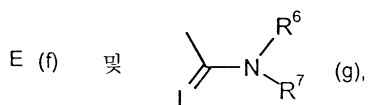
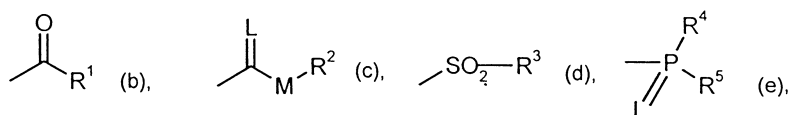
Q¹ 은 수소 또는 알킬을 나타내고,

Q², Q⁴, Q⁵ 및 Q⁶ 은 서로 독립적으로 각각 수소 또는 알킬을 나타내며,

Q³ 은 수소, 알킬, 알콕시알킬, 알킬티오알킬, 임의로 치환된 사이클로알킬(임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소 또는 황에 의해 대체된다) 또는 임의로 치환된 페닐을 나타내거나,

Q³ 및 Q⁴ 는 이들이 결합된 탄소원자와 함께, 임의로 헤테로원자를 함유하며 포화되거나 불포화된 비치환 또는 치환 사이클을 나타내고,

G 는 수소(a)를 나타내거나, 하기 그룹 중 하나를 나타내며:



여기에서,

E 는 금속이온 등가물 또는 암모늄 이온을 나타내고,

L 은 산소 또는 황을 나타내며,

M 은 산소 또는 황을 나타내고,

R¹ 은 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 알킬, 알케닐, 알콕시알킬, 알킬티오알킬 또는 폴리알콕시알킬을 나타내거나, 임의로 할로젠-, 알킬- 또는 알콕시-치환되고 적어도 하나의 헤테로원자에 의해 차단될 수 있는 사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 치환된 페닐, 페닐알킬, 헤트아릴, 페녹시알킬 또는 헤트아릴옥시알킬을 나타내며,

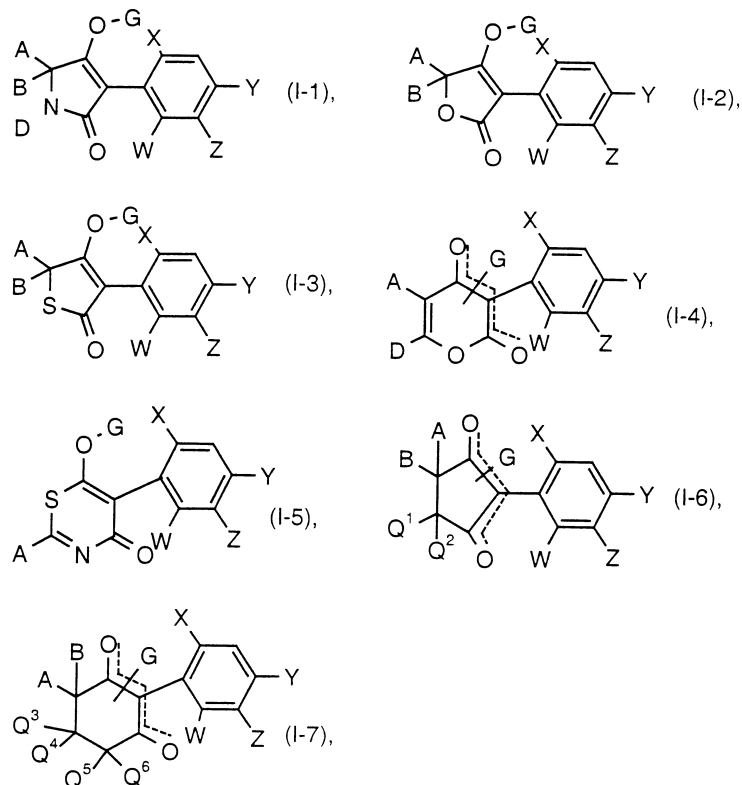
R² 는 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 알킬, 알케닐, 알콕시알킬 또는 폴리알콕시알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 치환된 사이클로알킬, 페닐 또는 벤질을 나타내고,

R³, R⁴ 및 R⁵ 는 서로 독립적으로 각각 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 알킬, 알콕시, 알킬아미노, 디알킬아미노, 알킬티오, 알케닐티오 또는 사이클로알킬티오를 나타내거나, 각 경우에 임의로 치환된 페닐, 벤질, 페녹시 또는 페닐티오를 나타내며,

R⁶ 및 R⁷ 은 서로 독립적으로 각각 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 알킬, 사이클로알킬, 알케닐, 알콕시 또는 알콕시알킬을 나타내거나, 임의로 치환된 페닐을 나타내거나, 임의로 치환된 벤질을 나타내거나, 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 산소 또는 황에 의해 임의로 차단된 사이클을 나타낸다.

특히, 일반식 (I)의 화합물은 치환체의 성질에 따라, 기하 및/또는 광학 이성체 또는, 필요에 따라 통상의 방법으로 분리될 수 있는 다양한 조성의 이성체 혼합물로 존재할 수 있다. 본 발명은 순수한 이성체 및 이성체 혼합물, 이들의 제조방법 및 용도, 및 이들을 함유하는 조성물을 제공한다. 그러나, 편의상, 이하에서는 항상 일반식 (I)의 화합물을 언급할 것이지만, 이는 순수 화합물 및 경우에 따라 상이한 비율의 이성체 화합물의 혼합물도 의미한다.

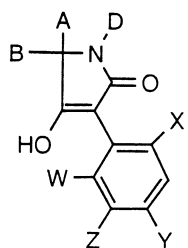
그룹 CKE 의 의미 (1) 내지 (7)을 포함시키는 경우, 하기 주 구조 (I-1) 내지 (I-7)이 얻어진다:



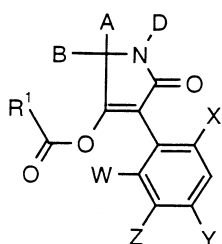
상기 식에서, A, B, D, G, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같다.

CKE가 그룹 (1)을 나타내는 경우, 그룹 G의 다양한 의미 (a), (b), (c), (d), (e), (f) 및 (g)를 포함시킬 때, 하기 주 구조 (I-1-a) 내지 (I-1-g)가 얻어진다:

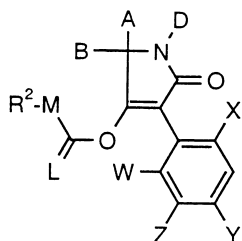
(I-1-a):



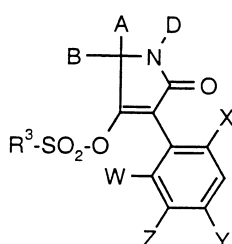
(I-1-b):



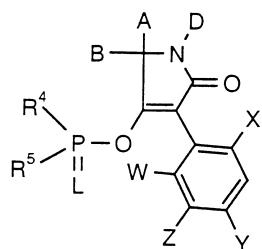
(I-1-c):



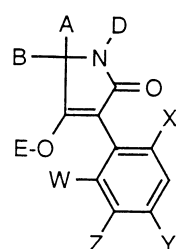
(I-1-d):



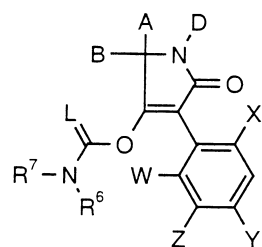
(I-1-e):



(I-1-f):



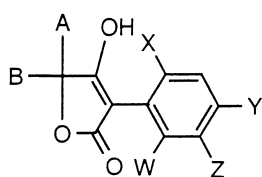
(I-1-g):



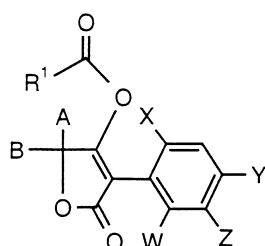
상기 식에서, A, B, D, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ 및 R⁷은 각각 상기 정의된 바와 같다.

CKE가 그룹 (2)를 나타내는 경우, 그룹 G의 다양한 의미 (a), (b), (c), (d), (e), (f) 및 (g)를 포함시킬 때, 하기 주 구조 (I-2-a) 내지 (I-2-g)가 얻어진다:

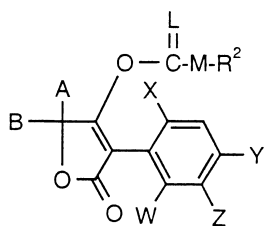
(I-2-a):



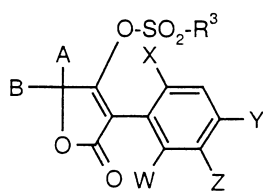
(I-2-b):



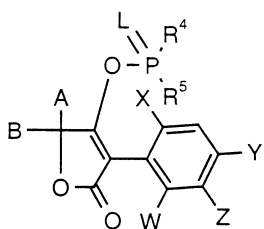
(I-2-c):



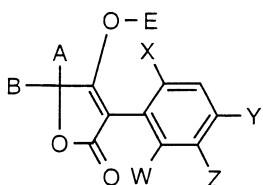
(I-2-d):



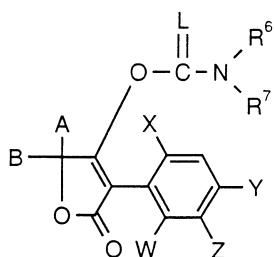
(I-2-e):



(I-2-f):



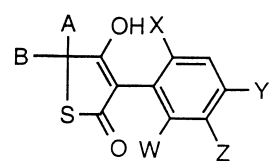
(I-2-g):



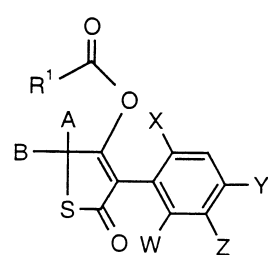
상기 식에서, A, B, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ 및 R⁷ 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

CKE 가 그룹 (3)을 나타내는 경우, 그룹 G 의 다양한 의미 (a), (b), (c), (d), (e), (f) 및 (g)를 포함시킬 때, 하기 주 구조 (I-3-a) 내지 (I-3-g)가 얻어진다:

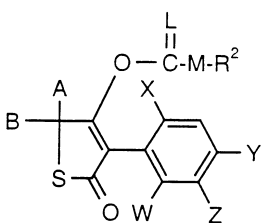
(I-3-a):



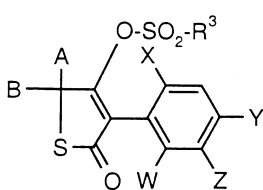
(I-3-b):



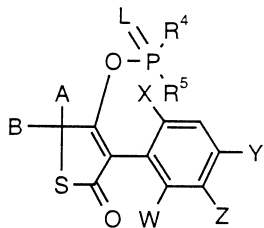
(I-3-c):



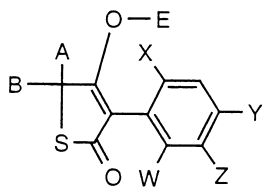
(I-3-d):



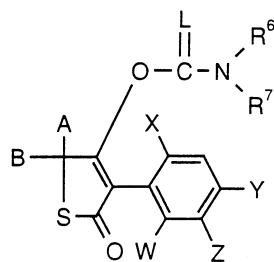
(I-3-e):



(I-3-f):

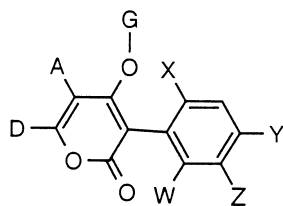


(I-3-g):

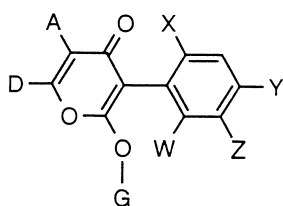


상기 식에서, A, B, E, L, M, W, X, Y, Z, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 및 R^7 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

치환체 G 의 위치에 따라 일반식 (I-4)의 화합물은 일반식 (I-4-A) 및 (I-4-B)의 두 이성체 형태로 존재할 수 있으며, 일반식 (I-4)에서 점선으로 표시하고자 한다:



(I-4-A)



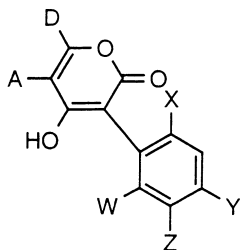
(I-4-B)

일반식 (I-4-A) 및 (I-4-B)의 화합물은 혼합물 및 이들의 순수한 이성체 형태로 존재할 수 있다. 일반식 (I-4-A) 및 (I-4-B)의 화합물의 혼합물은, 경우에 따라 물리적인 방법, 예를 들면 크로마토그래피법에 의해 공지된 방식으로 분리할 수 있다.

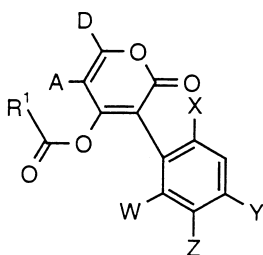
명백하게 하기 위하여, 이후에는 각 경우에 하나의 가능한 이성체만을 나타낸다. 이는 화합물이 경우에 따라 이성체 혼합물 또는 각각의 다른 이성체 형태로 존재할 수 있음을 배제하지 않는다.

CKE 가 그룹 (4)를 나타내는 경우, 그룹 G 의 다양한 의미 (a), (b), (c), (d), (e), (f) 및 (g)를 포함시킬 때, 하기 주 구조 (I-4-a) 내지 (I-4-g)가 얻어진다:

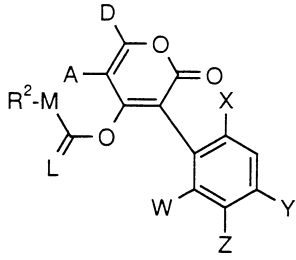
(I-4-a):



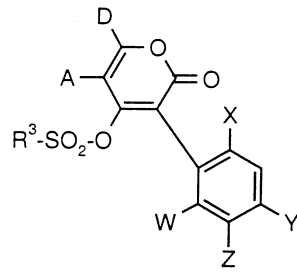
(I-4-b):



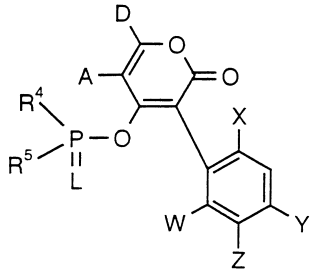
(I-4-c):



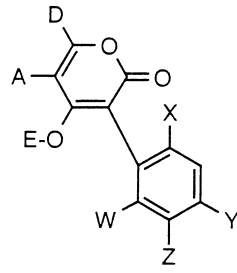
(I-4-d):



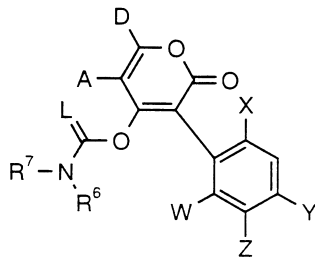
(I-4-e):



(I-4-f):



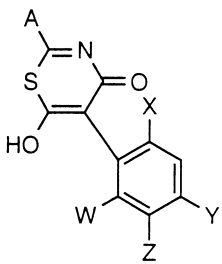
(I-4-g):



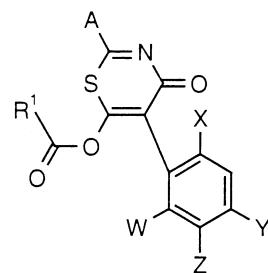
상기 식에서, A, D, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ 및 R⁷ 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

CKE 가 그룹 (5)를 나타내는 경우, 그룹 G 의 다양한 의미 (a), (b), (c), (d), (e), (f) 및 (g)를 포함시킬 때, 하기 주 구조 (I-5-a) 내지 (I-5-g)가 얻어진다:

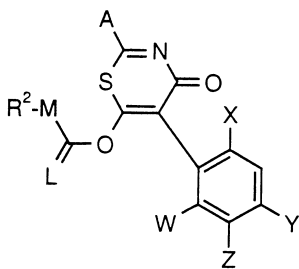
(I-5-a):



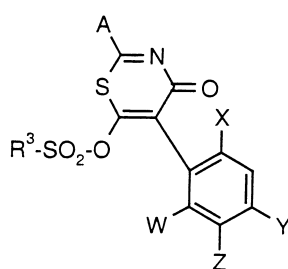
(I-5-b):



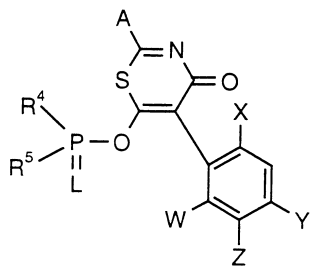
(I-5-c):



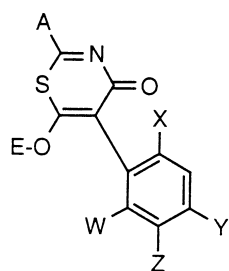
(I-5-d):



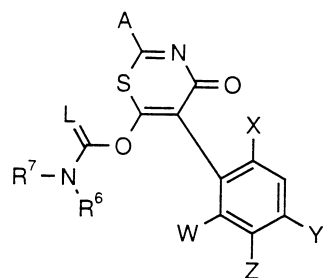
(I-5-e):



(I-5-f):

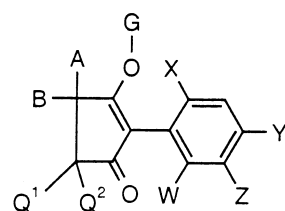


(I-5-g):

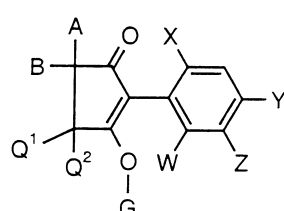


상기 식에서, A, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ 및 R⁷ 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

치환체 G 의 위치에 따라 일반식 (I-6)의 화합물은 일반식 (I-6-A) 및 (I-6-B)의 두 이성체 형태로 존재할 수 있으며, 일반식 (I)에서 점선으로 표시하고자 한다:



(I-6-A)



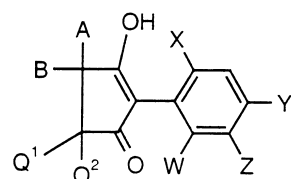
(I-6-B)

일반식 (I-6-A) 및 (I-6-B)의 화합물은 혼합물 및 이들의 순수한 이성체 형태로 존재할 수 있다. 일반식 (I-6-A) 및 (I-6-B)의 화합물의 혼합물은, 경우에 따라 물리적인 방법, 예를 들면 크로마토그래피법에 의해 분리할 수 있다.

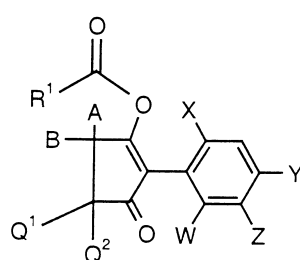
명백하게 하기 위하여, 이후에는 각 경우에 하나의 가능한 이성체만을 나타낸다. 이는 화합물이 경우에 따라 이성체 혼합물 또는 각각의 다른 이성체 형태로 존재할 수 있음을 배제하지 않는다.

CKE 가 그룹 (6)을 나타내는 경우, 그룹 G 의 다양한 의미 (a), (b), (c), (d), (e), (f) 및 (g)를 포함시킬 때, 하기 주 구조 (I-6-a) 내지 (I-6-g)가 얻어진다:

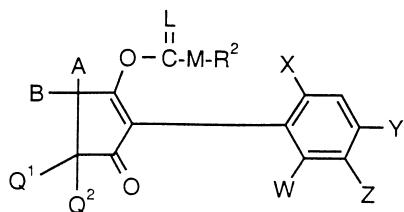
(I-6-a):



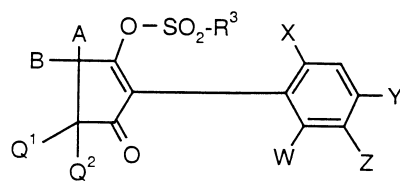
(I-6-b):



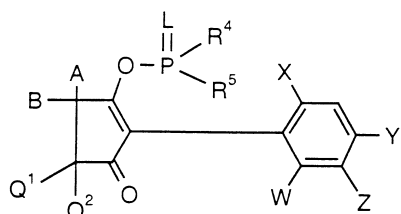
(I-6-c):



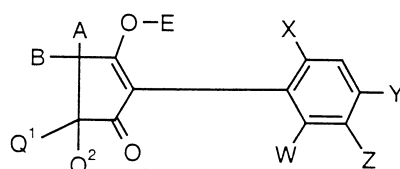
(I-6-d):



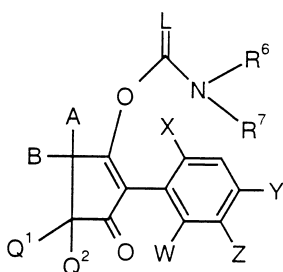
(I-6-e):



(I-6-f):

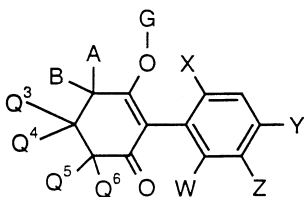


(I-6-g):

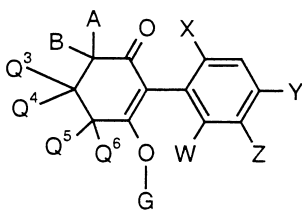


상기 식에서, A, B, Q¹, Q², E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ 및 R⁷ 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

치환체 G 의 위치에 따라 일반식 (I-7)의 화합물은 일반식 (I-7-A) 및 (I-7-B)의 두 이성체 형태로 존재할 수 있으며, 일반식 (I)에서 점선으로 표시하고자 한다:



(I-7-A)



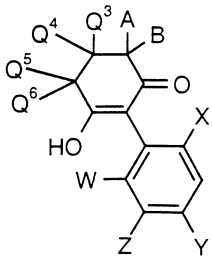
(I-7-B)

일반식 (I-7-A) 및 (I-7-B)의 화합물은 혼합물 및 이들의 순수한 이성체 형태로 존재할 수 있다. 일반식 (I-7-A) 및 (I-7-B)의 화합물의 혼합물은, 경우에 따라 물리적인 방법, 예를 들면 크로마토그래피법에 의해 분리할 수 있다.

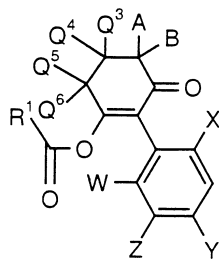
명백하게 하기 위하여, 이후에는 각 경우에 하나의 가능한 이성체만을 나타낸다. 이는 화합물이 경우에 따라 이성체 혼합물 또는 각각의 다른 이성체 형태로 존재할 수 있음을 배제하지 않는다.

그룹 G 의 다양한 의미 (a), (b), (c), (d), (e), (f) 및 (g)를 포함시킬 때, 하기 주 구조 (I-7-a) 내지 (I-7-g)가 얻어진다:

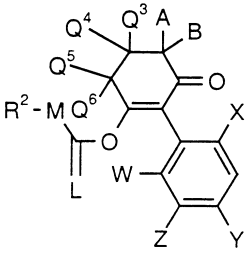
(I-7-a):



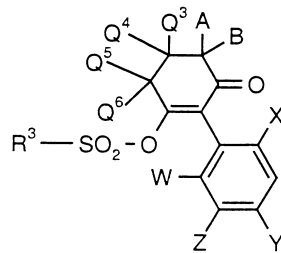
(I-7-b):



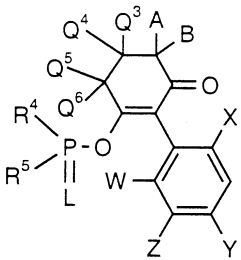
(I-7-c):



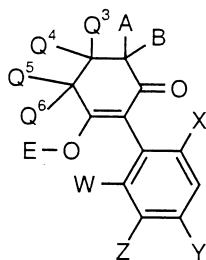
(I-7-d):



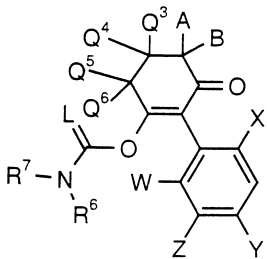
(I-7-e):



(I-7-f):



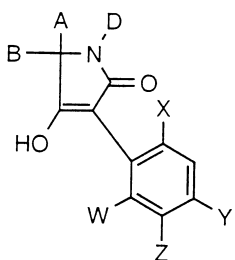
(I-7-g):



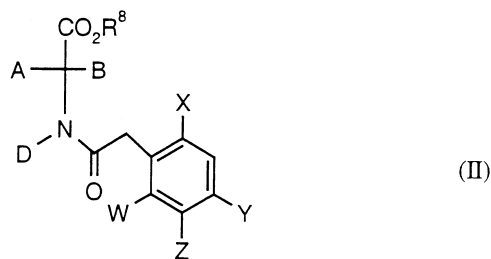
상기 식에서, A, B, E, L, M, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ 및 R⁷ 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

또한, 본 발명에 따라 일반식 (I)의 신규한 화합물은 하기 기술된 방법 중 하나에 의해 수득됨이 밝혀졌다:

(A) 일반식 (I-1-a)의 치환된 3-페닐피롤리딘-2,4-디온 또는 그의 에놀은 일반식 (II)의 N-아실아미노산 에스테르를 희석제의 존재하 및 염기의 존재하에서 분자내 축합시킴으로써 수득된다:



(I-1-a)

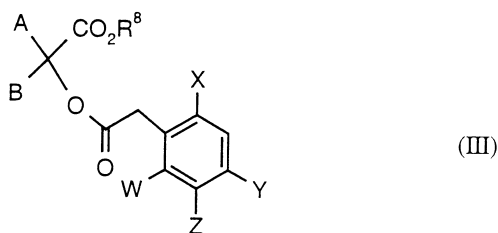
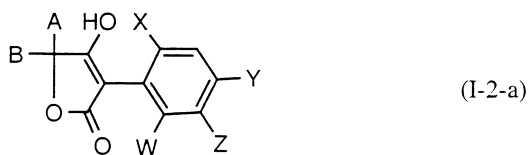


상기 식에서,

A, B, D, W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같고,

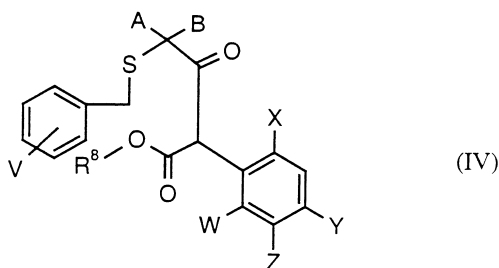
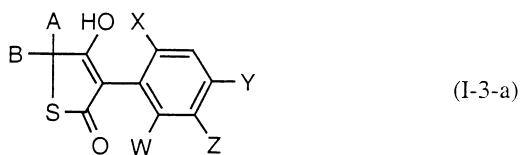
R⁸은 알킬(바람직하게는 C₁-C₆-알킬)을 나타낸다.

(B) 또한, 일반식 (I-2-a)의 치환된 3-페닐-4-하이드록시- Δ^3 -디하이드로푸라논 유도체는 일반식 (III)의 카복실산 에스테르를 회석제의 존재하 및 염기의 존재하에서 분자내 축합시킴으로써 수득됨이 밝혀졌다:



상기 식에서, A, B, W, X, Y, Z 및 R⁸ 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

(C) 또한, 일반식 (I-3-a)의 치환된 3-페닐-4-하이드록시- Δ^3 -디하이드로티오펜 유도체는 일반식 (IV)의 β -케토카복실산 에스테르를, 경우에 따라 회석제의 존재하 및 산의 존재하에서 분자내 폐환시킴으로써 수득됨이 밝혀졌다:

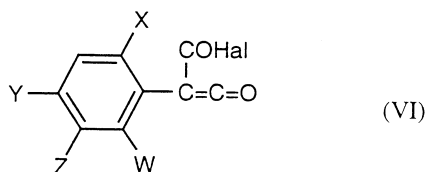
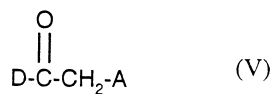
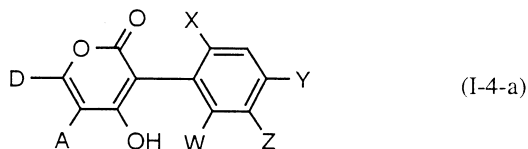


상기 식에서,

A, B, W, X, Y, Z 및 R⁸ 은 각각 상기 정의된 바와 같고,

V 는 수소, 할로젠, 알킬(바람직하게는 C₁-C₆-알킬) 또는 알콕시(바람직하게는 C₁-C₈-알콕시)를 나타낸다.

(D) 또한, 일반식 (I-4-a)의 신규 치환된 3-페닐피론 유도체는 일반식 (V)의 카보닐 화합물 또는 일반식 (Va)인 그의 실릴 에놀 에테르를, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 수용체의 존재하에서 일반식 (VI)의 케텐산 할라이드와 반응시킴으로써 수득됨이 밝혀졌다:

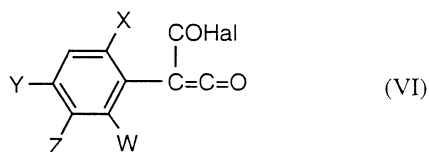
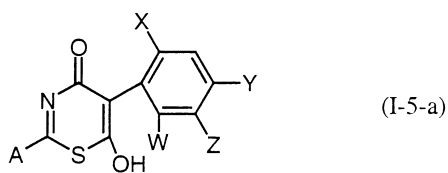


상기 식에서,

A, D, W, X, Y, Z 및 R⁸ 은 각각 상기 정의된 바와 같고,

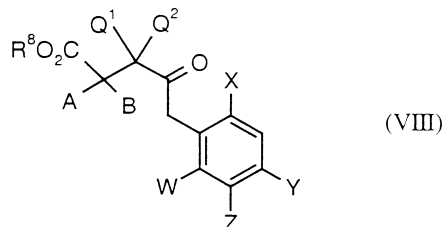
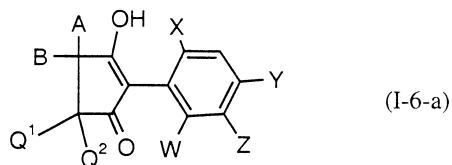
Hal 은 할로젠(바람직하게는 염소 또는 브롬)을 나타낸다.

(E) 또한, 일반식 (I-5-a)의 신규 치환된 페닐-1,3-티아진 유도체는 일반식 (VII)의 티오아미드를, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 수용체의 존재하에서 일반식 (VI)의 케텐산 할라이드와 반응시킴으로써 수득됨이 밝혀졌다:



상기 식에서, A, W, X, Y, Z 및 Hal 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

(F) 또한, 일반식 (I-6-a)의 화합물은 일반식 (VIII)의 케토카복실산 에스테르를, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 염기의 존재하에서 분자내 폐환시킴으로써 수득됨이 밝혀졌다:

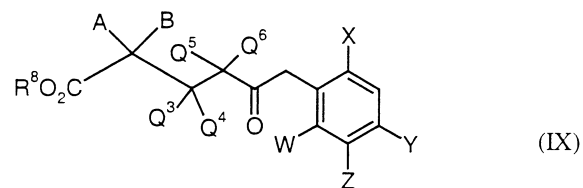
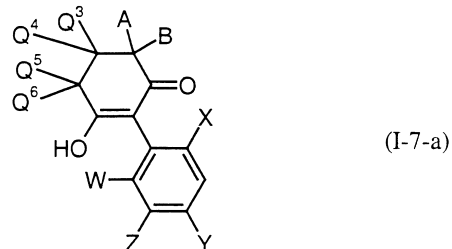


상기 식에서,

A, B, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같고,

R⁸ 은 알킬(특히 C₁-C₈-알킬)을 나타낸다.

(G) 또한, 일반식 (I-7-a)의 화합물은 일반식 (IX)의 6-아릴-5-케토-헥산산 에스테르를 희석제의 존재하 및 염기의 존재하에서 분자내 축합시킴으로써 수득되거나:



(상기 식에서,

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같고,

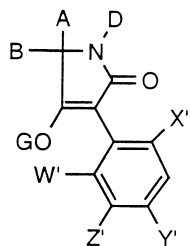
R⁸ 은 알킬(바람직하게 C₁-C₆-알킬)을 나타낸다)

(H) 상기 나타낸 일반식 (I-1-(a-g)) 내지 (I-7-(a-g))의 화합물(여기에서, A, B, D, G, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y

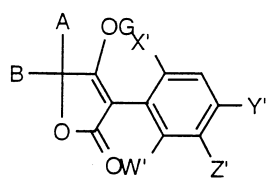
및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같으며, 하나, 많아야 두 개의 래디칼 W, X, Y 또는 Z 가 $R^{22}-C\equiv C-$ 또는 $\begin{matrix} R^{22} \\ | \\ HC=CH \end{matrix}$ 를 나타내고, R²²는 수소 또는 C₁-C₄-알킬, 바람직하게는 수소 또는 C₁-C₂-알킬, 특히 바람직하게는 수소를 나타낸다)은 일반식

(I-1'-(a-g)) 내지 (I-7'-(a-g))의 화합물을, 용매의 존재하 및 경우에 따라 염기 및 촉매(특히 적합한 촉매는 팔라듐 복합체이다)의 존재하에서 일반식 (X-a)의 실릴아세틸렌 또는 일반식 (X-b)의 비닐주석과 반응시킴으로써 수득됨이 밝혀졌다:

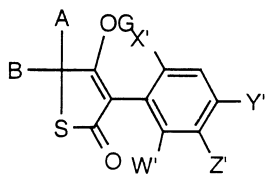
(I-1'):



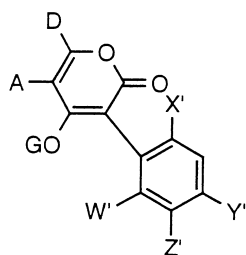
(I-2'):



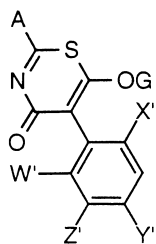
(I-3'):



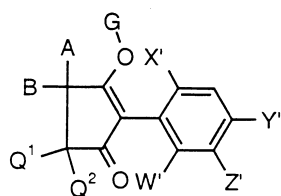
(I-4'):



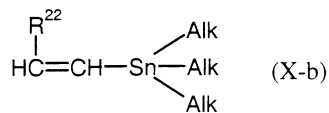
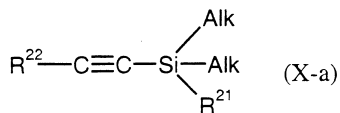
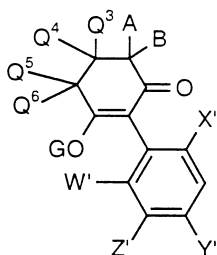
(I-5'):



(I-6'):



(I-7'):



상기 식에서,

A, B, D, G, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W', X', Y' 및 Z' 는 각각 상기 정의된 정의된 바와 같으며, 아포스트로피(')는 이 방법에서 하나, 많아야 두 개의 래디칼 W, X, Y 또는 Z 가 염소, 브롬, 요오드, 바람직하게는 브롬을 나타내고, 단 나머지 래디칼 W, X, Y 또는 Z가 알케닐 또는 알케닐을 나타내지 않는다는 것을 의미하며,

Alk 는 바람직하게는 C₁-C₄-알킬을 나타내고,

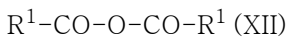
R^{21} 은 C_1 - C_4 -알킬 또는 페닐을 나타내며,

R^{22} 는 바람직하게는 수소 또는 C_1 - C_4 -알킬, 특히 바람직하게는 수소 또는 C_1 - C_2 -알킬, 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타낸다.

또한, (I) 상기 나타낸 일반식 (I-1-b) 내지 (I-7-b)의 화합물(여기에서, A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , R^1 , W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같다)은 상기 나타낸 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물(여기에서, A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같다)을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서

(a) 일반식 (XI)의 산 할라이드와 반응시키거나,

(β) 일반식 (XII)의 카복실산 무수물과 반응시킴으로써 수득되거나;

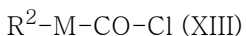


(상기 식에서,

R^1 은 상기 정의된 바와 같고,

Hal 은 할로젠(특히 염소 또는 브롬)을 나타낸다)

(J) 상기 나타낸 일반식 (I-1-c) 내지 (I-7-c)의 화합물(여기에서, A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , R^2 , M, W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같고, L 은 산소를 나타낸다)은 상기 나타낸 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물(여기에서, A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같다)을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XIII)의 클로로포름산 에스테르 또는 클로로포름산 티오에스테르와 반응시킴으로써 수득되거나;



(상기 식에서, R^2 및 M 은 각각 상기 정의된 바와 같다)

(K) 상기 나타낸 일반식 (I-1-c) 내지 (I-7-c)의 화합물(여기에서, A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , R^2 , M, W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같고, L 은 황을 나타낸다)은 상기 나타낸 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물(여기에서, A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같다)을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XIV)의 클로로모노티오포름산 에스테르 또는 클로로디티오포름산 에스테르와 반응시킴으로써 수득되거나;



(상기 식에서, M 및 R^2 는 각각 상기 정의된 바와 같다)

(L) 상기 나타낸 일반식 (I-1-d) 내지 (I-7-d)의 화합물(여기에서, A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R³, W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같다)은 상기 나타낸 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물(여기에서, A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같다)을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XV)의 설폰닐 클로라이드와 반응시킴으로써 수득되거나;



(상기 식에서, R³은 상기 정의된 바와 같다)

(M) 상기 나타낸 일반식 (I-1-e) 내지 (I-7-e)의 화합물(여기에서, A, B, D, L, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R⁴, R⁵, W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같다)은 상기 나타낸 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물(여기에서, A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같다)을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XVI)의 인 화합물과 반응시킴으로써 수득되거나;

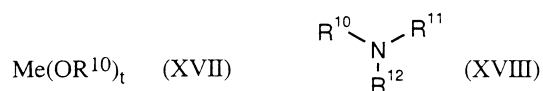


(상기 식에서,

L, R⁴ 및 R⁵는 각각 상기 정의된 바와 같고,

Hal은 할로젠(특히 염소 또는 브롬)을 나타낸다)

(N) 상기 나타낸 일반식 (I-1-f) 내지 (I-7-f)의 화합물(여기에서, A, B, D, E, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같다)은 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물(여기에서, A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같다)을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하에서 일반식 (XVII) 또는 (XVIII)의 금속 화합물 또는 아민과 반응시킴으로써 수득되거나;



(상기 식에서,

Me는 1가 또는 2가 금속(바람직하게는 알칼리 금속 또는 알칼리 토금속, 예를 들어 리튬, 나트륨, 칼륨, 마그네슘 또는 칼슘)을 나타내고,

t는 1 또는 2의 수를 나타내며,

R¹⁰, R¹¹ 및 R¹²는 서로 독립적으로 각각 수소 또는 알킬(바람직하게는 C₁-C₈-알킬)을 나타낸다)

(O) 상기 나타낸 일반식 (I-1-g) 내지 (I-7-g)의 화합물(여기에서, A, B, D, L, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R⁶, R⁷, W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같다)은 상기 나타낸 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물(여기에서, A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같다)을 각 경우에,

(a) 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 촉매의 존재하에서 일반식 (XIX)의 이소시아네이트 또는 이소티오시아네이트와 반응시키거나,

(β) 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XX)의 카바모일 클로라이드 또는 티오 카바모일 클로라이드와 반응시킴으로써 수득됨이 밝혀졌다:



상기 식에서, R^6 , L 및 R^7 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

또한, 일반식 (I)의 신규한 화합물은 페스티사이드, 바람직하게는 살충제, 살비제 및 또한 제초제로서 매우 우수한 활성을 가짐이 밝혀졌다.

일반식 (I)은 본 발명에 따른 화합물의 일반적 정의를 제공한다. 상기 및 이후 언급된 일반식들에 열거된 바람직한 치환체 또는 래디칼의 범위를 하기에 나타낸다:

W 는 바람직하게는 수소, C_1-C_6 -알킬, C_2-C_6 -알케닐 또는 에틸닐을 나타낸다.

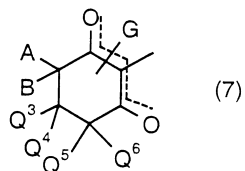
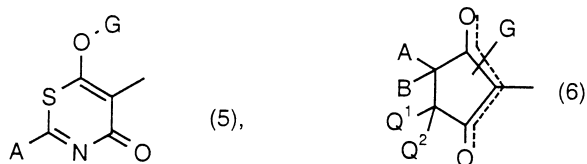
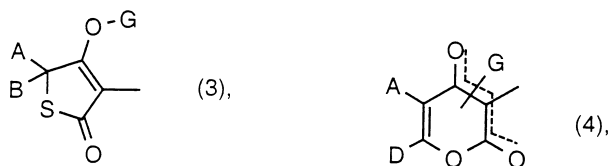
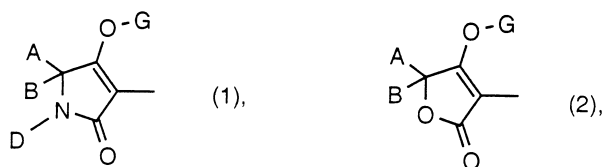
X 는 바람직하게는 C_1-C_6 -알킬, C_2-C_6 -알케닐 또는 에틸닐을 나타낸다.

Y 는 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, i-프로필, C_2-C_6 -알케닐 또는 에틸닐을 나타낸다.

Z 는 바람직하게는 수소, C_1-C_6 -알킬, C_2-C_6 -알케닐 또는 에틸닐을 나타내며,

단, 래디칼 W, X, Y 및 Z 중 적어도 하나는 적어도 두 개의 탄소원자를 가진 사슬을 나타낸다.

CKE 는 바람직하게는 하기 그룹 중 하나를 나타낸다:



A 는 바람직하게는 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C_1-C_{12} -알킬, C_3-C_8 -알케닐, C_1-C_{10} -알콕시- C_1-C_8 -알킬, C_1-C_{10} -알킬티오- C_1-C_6 -알킬, 임의로 직접 인접해 있지 않은 하나 또는 두 개의 환 멤버가 산소 및/또는 황에 의해 대체되고 임의로 할로젠-, C_1-C_6 -알킬- 또는 C_1-C_6 -알콕시-치환된 C_3-C_8 -사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-, C_1-C_6 -알킬-, C_1-C_6 -할로게노알킬-, C_1-C_6 -알콕시-, C_1-C_6 -할로게노알콕시-, 시아노- 또는 니트로-치환된 페닐 또는 나프틸, 5 내지 6 환 원자의 헥사릴(예를 들어 푸라닐, 피리딜, 이미다졸릴, 트리아졸릴, 피라졸릴, 피리미딜, 티아졸릴 또는 티에닐), 페닐- C_1-C_6 -알킬 또는 나프틸- C_1-C_6 -알킬을 나타내며,

B 는 바람직하게는 수소, C_1-C_{12} -알킬 또는 C_1-C_8 -알콕시- C_1-C_6 -알킬을 나타내거나,

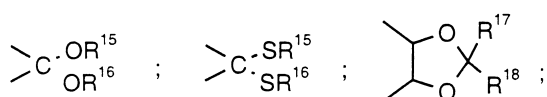
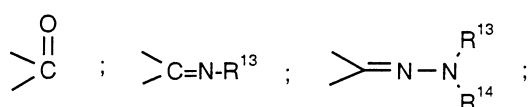
A, B 및 이들이 결합된 탄소원자는 바람직하게는 임의로 하나의 환 멤버가 산소 또는 황에 의해 대체되고 C_1-C_8 -알킬, C_3-C_{10} -사이클로알킬, C_1-C_8 -할로게노알킬, C_1-C_8 -알콕시, C_1-C_8 -알킬티오, 할로젠 또는 페닐에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 포화 C_3-C_{10} -사이클로알킬 또는 불포화 C_5-C_{10} -사이클로알킬을 나타내거나,

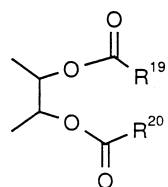
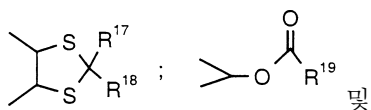
A, B 및 이들이 결합된 탄소원자는 바람직하게는 임의로 직접 인접해 있지 않은 하나 또는 두 개의 산소 및/또는 황 원자를 함유하고 임의로 C_1-C_4 -알킬-치환된 알킬렌디일 그룹에 의해, 또는 결합된 탄소 원자와 함께 추가의 5- 내지 8-원 환을 형성하는 알킬렌디옥실 그룹 또는 알켄디티오일 그룹에 의해 치환된 C_3-C_6 -사이클로알킬을 나타내거나,

A, B 및 이들이 결합된 탄소 원자는 바람직하게는 두 개의 치환체가 이들이 결합된 탄소원자와 함께, 각 경우에 임의로 C_1-C_6 -알킬-, C_1-C_6 -알콕시- 또는 할로젠-치환되고 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소 또는 황에 의해 대체된 C_2-C_6 -알칸디일, C_2-C_6 -알켄디일 또는 C_4-C_6 -알칸디엔디일을 나타내는 C_3-C_8 -사이클로알킬 또는 C_5-C_8 -사이클로알케닐을 나타내며,

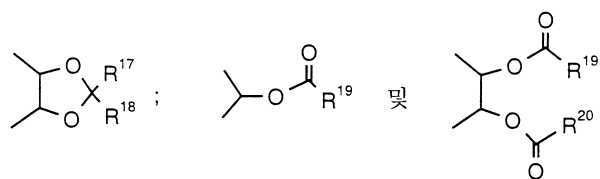
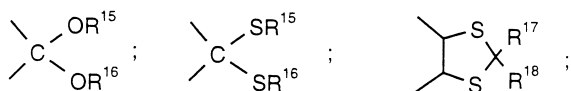
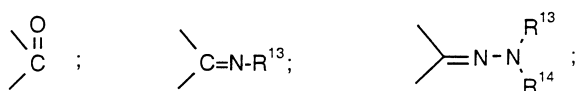
D 는 바람직하게는 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C_1-C_{12} -알킬, C_3-C_8 -알케닐, C_3-C_8 -알키닐, C_1-C_{10} -알콕시- C_2-C_8 -알킬, 임의로 하나의 환 멤버가 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 할로젠-, C_1-C_4 -알킬-, C_1-C_4 -알콕시- 또는 C_1-C_4 -할로게노알킬-치환된 C_3-C_8 -사이클로알킬, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, C_1-C_6 -알킬-, C_1-C_6 -할로게노알킬-, C_1-C_6 -알콕시-, C_1-C_6 -할로게노알콕시-, 시아노- 또는 니트로-치환된 페닐, 5 또는 6 개의 환 원자를 갖는 헥사릴(예를 들어 푸라닐, 이미다졸릴, 피리딜, 티아졸릴, 피라졸릴, 피리미딜, 피롤릴, 티에닐 또는 트리아졸릴), 페닐- C_1-C_6 -알킬 또는 5 또는 6 개의 환 원자를 갖는 헥사릴- C_1-C_6 -알킬(예를 들어 푸라닐- C_1-C_6 -알킬, 이미다졸릴- C_1-C_6 -알킬, 피리딜- C_1-C_6 -알킬, 티아졸릴- C_1-C_6 -알킬, 피라졸릴- C_1-C_6 -알킬, 피리미딜- C_1-C_6 -알킬, 피롤릴- C_1-C_6 -알킬, 티에닐- C_1-C_6 -알킬 또는 트리아졸릴- C_1-C_6 -알킬)을 나타내거나,

A 및 D 는 함께, 바람직하게는 각 경우에 임의로 치환되고 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 카보닐 그룹, 산소 또는 황에 의해 대체된 C_3-C_6 -알칸디일 또는 C_3-C_6 -알켄디일을 나타내고, 여기에서 가능한 치환체는 각 경우에 할로젠, 하이드록실, 머캡토 또는 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C_1-C_{10} -알킬, C_1-C_6 -알콕시, C_1-C_6 -알킬티오, C_3-C_7 -사이클로알킬, 페닐 또는 벤질옥시, 또는 C_1-C_6 -알킬에 의해 임의로 치환되거나 임의로 두 개의 인접한 치환체가 이들이 결합된 탄소원자와 함께, 산소 또는 황을 함유할 수 있거나, 임의로 하기 그룹 중의 하나를 함유할 수 있는 추가의 포화 또는 불포화된 5 또는 6 환 원자의 사이클(일반식 (I-1)의 화합물의 경우, A 및 D 는 이들이 결합된 원자와 함께, 예를 들어 이후 언급하는 그룹 AD-1 내지 AD-10 을 나타낸다)을 형성하는 C_3-C_6 -알칸디일 그룹, C_3-C_6 -알켄디일 그룹 또는 부타디에닐 그룹이거나;





A 및 Q¹ 은 함께, 바람직하게는 각각 할로젠, 하이드록실; 각각 동일하거나 상이한 할로젠에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₆-알콕시, C₁-C₆-알킬티오, C₃-C₇-사이클로알킬; 및 각각 할로젠, C₁-C₆-알킬 및 C₁-C₆-알콕시로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 벤질옥시 및 페닐로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 이치환되고, 추가로 임의로 하기 그룹 중 하나를 함유하거나, C₁-C₂-알칸디일 그룹 또는 산소 원자에 의해 브릿지(bridged)된 C₃-C₆-알칸디일 또는 C₄-C₆-알켄디일을 나타내거나;



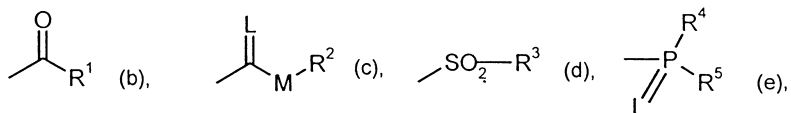
Q¹ 은 바람직하게는 수소 또는 C₁-C₄-알킬을 나타낸다.

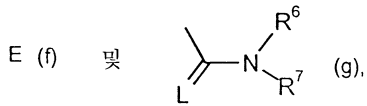
Q², Q⁴, Q⁵ 및 Q⁶ 은 서로 독립적으로 각각 바람직하게는 수소 또는 C₁-C₄-알킬을 나타낸다.

Q³ 은 바람직하게는 수소, C₁-C₆-알킬, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₂-알킬, C₁-C₆-알킬티오-C₁-C₂-알킬, 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 C₁-C₄-알킬- 또는 C₁-C₄-알콕시-치환된 C₃-C₈-사이클로알킬, 또는 임의로 할로젠-, C₁-C₄-알킬-, C₁-C₄-알콕시-, C₁-C₂-할로게노알킬-, C₁-C₂-할로게노알콕시-, 시아노- 또는 니트로-치환된 페닐을 나타내거나,

Q³ 및 Q⁴ 는 이들이 결합된 탄소원자와 함께, 바람직하게는 임의로 하나의 환 멤버가 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 C₁-C₄-알킬-, C₁-C₄-알콕시- 또는 C₁-C₂-할로게노알킬-치환된 C₃-C₇-환을 나타낸다.

G 는 바람직하게는 수소(a)를 나타내거나, 하기 그룹 중 하나(특히 (a), (b), (c) 또는 (g))를 나타낸다:





여기에서,

E 는 금속 이온 등가물 또는 암모늄 이온을 나타내고,

L 은 산소 또는 황을 나타내며,

M 은 산소 또는 황을 나타낸다.

R¹ 은 바람직하게는 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C₁-C₂₀-알킬, C₂-C₂₀-알케닐, C₁-C₈-알콕시-C₁-C₈-알킬, C₁-C₈-알킬티오-C₁-C₈-알킬, 폴리-C₁-C₈-알콕시-C₁-C₈-알킬, 또는 임의로 직접 인접해 있지 않은 하나 이상(바람직하게는 두 개 이하)의 환 멤버가 산소 및/또는 황에 의해 대체되고 임의로 할로젠-, C₁-C₆-알킬- 또는 C₁-C₆-알콕시-치환된 C₃-C₈-사이클로알킬을 나타내거나,

임의로 할로젠-, 시아노-, 니트로-, C₁-C₆-알킬-, C₁-C₆-알콕시-, C₁-C₆-할로게노알킬-, C₁-C₆-할로게노알콕시-, C₁-C₆-알킬티오- 또는 C₁-C₆-알킬설포닐-치환된 페닐을 나타내거나,

임의로 할로젠-, 니트로-, 시아노-, C₁-C₆-알킬-, C₁-C₆-알콕시-, C₁-C₆-할로게노알킬- 또는 C₁-C₆-할로게노알콕시-치환된 페닐-C₁-C₆-알킬을 나타내거나,

임의로 할로젠- 또는 C₁-C₆-알킬-치환된 5- 또는 6-원 헤트아릴(예를 들어 피라졸릴, 티아졸릴, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐 또는 티에닐)을 나타내거나,

임의로 할로젠- 또는 C₁-C₆-알킬-치환된 페녹시-C₁-C₆-알킬을 나타내거나,

임의로 할로젠-, 아미노- 또는 C₁-C₆-알킬-치환된 5- 또는 6-원 헤트아릴옥시-C₁-C₆-알킬(예를 들어 피리딜옥시-C₁-C₆-알킬, 피리미딜옥시-C₁-C₆-알킬 또는 티아졸릴옥시-C₁-C₆-알킬)을 나타낸다.

R² 는 바람직하게는 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C₁-C₂₀-알킬, C₂-C₂₀-알케닐, C₁-C₈-알콕시-C₂-C₈-알킬 또는 폴리-C₁-C₈-알콕시-C₂-C₈-알킬을 나타내거나,

임의로 할로젠-, C₁-C₆-알킬- 또는 C₁-C₆-알콕시-치환된 C₃-C₈-사이클로알킬을 나타내거나,

각 경우에 임의로 할로젠-, 시아노-, 니트로-, C₁-C₆-알킬-, C₁-C₆-알콕시-, C₁-C₆-할로게노알킬- 또는 C₁-C₆-할로게노알콕시-치환된 페닐 또는 벤질을 나타낸다.

R³ 은 바람직하게는 임의로 할로젠-치환된 C₁-C₈-알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-, C₁-C₆-알킬-, C₁-C₆-알콕시-, C₁-C₄-할로게노알킬-, C₁-C₄-할로게노알콕시-, 시아노- 또는 니트로-치환된 페닐 또는 벤질을 나타낸다.

R^4 및 R^5 는 서로 독립적으로 각각 바람직하게는 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C_1-C_8 -알킬, C_1-C_8 -알콕시, C_1-C_8 -알킬아미노, 디- $(C_1-C_8$ -알킬)아미노, C_1-C_8 -알킬티오, C_2-C_8 -알케닐티오 또는 C_3-C_7 -사이클로알킬티오를 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-, 니트로-, 시아노-, C_1-C_4 -알콕시-, C_1-C_4 -할로게노알콕시-, C_1-C_4 -알킬티오-, C_1-C_4 -할로게노알킬티오-, C_1-C_4 -알킬- 또는 C_1-C_4 -할로게노알킬-치환된 페닐, 페녹시 또는 페닐티오를 나타낸다.

R^6 및 R^7 은 서로 독립적으로 각각 바람직하게는 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C_1-C_8 -알킬, C_3-C_8 -사이클로알킬, C_1-C_8 -알콕시, C_3-C_8 -알케닐 또는 C_1-C_8 -알콕시- C_1-C_8 -알킬을 나타내거나, 임의로 할로젠-, C_1-C_8 -할로게노알킬-, C_1-C_8 -알킬- 또는 C_1-C_8 -알콕시-치환된 페닐을 나타내거나, 임의로 할로젠-, C_1-C_8 -알킬-, C_1-C_8 -할로게노알킬- 또는 C_1-C_8 -알콕시-치환된 벤질을 나타내거나, 함께 임의로 하나의 탄소 원자가 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 C_1-C_4 -알킬-치환된 C_3-C_6 -알킬렌 래디칼을 나타낸다.

R^{13} 은 바람직하게는 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C_1-C_8 -알킬 또는 C_1-C_8 -알콕시를 나타내거나, 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 할로젠-, C_1-C_4 -알킬- 또는 C_1-C_4 -알콕시-치환된 C_3-C_8 -사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-, C_1-C_6 -알킬-, C_1-C_6 -알콕시-, C_1-C_4 -할로게노알킬-, C_1-C_4 -할로게노알콕시-, 니트로- 또는 시아노-치환된 페닐, 페닐- C_1-C_4 -알킬 또는 페닐- C_1-C_4 -알콕시를 나타낸다.

R^{14} 는 바람직하게는 수소 또는 C_1-C_8 -알킬을 나타내거나,

R^{13} 및 R^{14} 는 함께 바람직하게는 C_4-C_6 -알칸디일을 나타낸다.

R^{15} 및 R^{16} 은 동일하거나 상이하며 각각 바람직하게는 C_1-C_6 -알킬을 나타내거나,

R^{15} 및 R^{16} 은 함께, 바람직하게는 C_1-C_6 -알킬에 의해, C_1-C_6 -할로게노알킬에 의해 또는 임의로 할로젠-, C_1-C_6 -알킬-, C_1-C_4 -할로게노알킬-, C_1-C_6 -알콕시-, C_1-C_4 -할로게노알콕시-, 니트로- 또는 시아노-치환된 페닐에 의해 임의로 치환된 C_2-C_4 -알칸디일 래디칼을 나타낸다.

R^{17} 및 R^{18} 은 서로 독립적으로 각각 바람직하게는 수소를 나타내거나, 임의로 할로젠-치환된 C_1-C_8 -알킬을 나타내거나, 임의로 할로젠-, C_1-C_6 -알킬-, C_1-C_6 -알콕시-, C_1-C_4 -할로게노알킬-, C_1-C_4 -할로게노알콕시-, 니트로- 또는 시아노-치환된 페닐을 나타내거나,

R^{17} 및 R^{18} 은 이들이 결합된 탄소 원자와 함께, 바람직하게는 카보닐 그룹을 나타내거나, 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 할로젠-, C_1-C_4 -알킬- 또는 C_1-C_4 -알콕시-치환된 C_5-C_7 -사이클로알킬을 나타낸다.

R^{19} 및 R^{20} 은 서로 독립적으로 각각 바람직하게는 C_1-C_{10} -알킬, C_2-C_{10} -알케닐, C_1-C_{10} -알콕시, C_1-C_{10} -알킬아미노, C_3-C_{10} -알케닐아미노, 디- $(C_1-C_{10}$ -알킬)아미노 또는 디- $(C_3-C_{10}$ -알케닐)아미노를 나타낸다.

W 는 특히 바람직하게는 수소, C_1-C_4 -알킬, C_2-C_4 -알케닐 또는 에틸을 나타낸다.

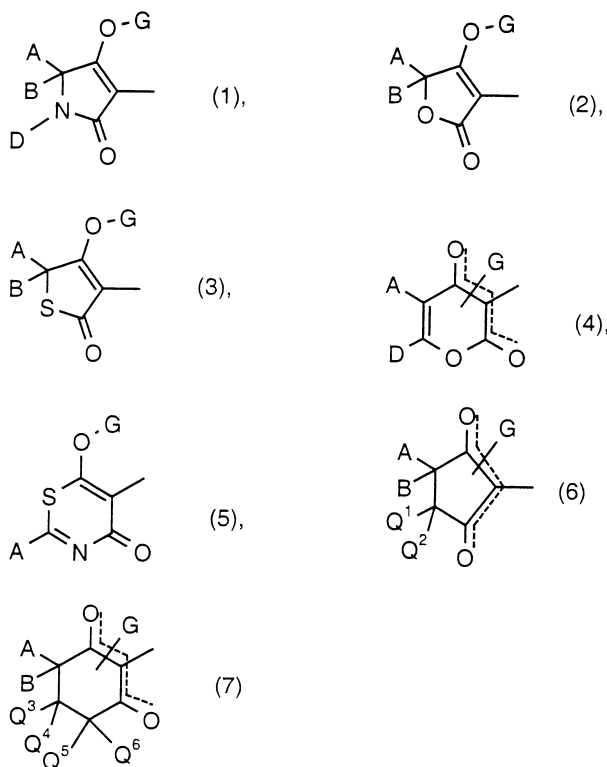
X 는 특히 바람직하게는 C_1-C_4 -알킬, C_2-C_4 -알케닐 또는 에틸을 나타낸다.

Y 는 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, i-프로필, C₂-C₄-알케닐 또는 에티닐을 나타낸다.

Z 는 특히 바람직하게는 수소, C₁-C₄-알킬, C₂-C₄-알케닐 또는 에티닐을 나타내며,

단, 래디칼 W, X, Y 및 Z 중 적어도 하나는 적어도 두 개의 탄소원자를 가진 사슬을 나타내고, 래디칼 W, X, Y 또는 Z 중 많아야 하나만 C₂-C₄-알케닐 또는 에티닐을 나타낸다.

CKE 는 특히 바람직하게는 하기 그룹 중 하나를 나타낸다:



A 는 특히 바람직하게는 각 경우에 임의로 불소- 또는 염소-치환된 C₁-C₆-알킬 또는 C₁-C₄-알콕시-C₁-C₆-알킬, 임의로 C₁-C₂-알킬- 또는 C₁-C₂-알콕시-치환된 C₃-C₆-사이클로알킬, 또는 (일반식 (I-4), (I-6) 및 (I-7)의 화합물의 경우는 제외) 각 경우에 임의로 불소-, 염소-, 브롬-, C₁-C₄-알킬-, C₁-C₂-할로게노알킬-, C₁-C₄-알콕시-, C₁-C₂-할로게노알콕시-, 시아노- 또는 니트로-치환된 페닐 또는 벤질을 나타낸다.

B 는 특히 바람직하게는 수소 또는 C₁-C₄-알킬을 나타내거나,

A, B 및 이들이 결합된 탄소 원자는 특히 바람직하게는 임의로 하나의 환 멤버가 산소 또는 황에 의해 대체되고, C₁-C₆-알킬, 트리플루오로메틸 또는 C₁-C₆-알콕시에 의해 임의로 일치환된 포화 또는 불포화 C₅-C₇-사이클로알킬을 나타내거나,

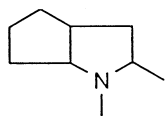
A, B 및 이들이 결합된 탄소 원자는 특히 바람직하게는 임의로 직접 인접해 있지 않은 하나 또는 두 개의 산소 및/또는 황 원자를 함유하고 임의로 메틸- 또는 에틸-치환된 알킬렌디일 그룹에 의해, 또는 결합된 탄소 원자와 함께 추가의 5- 또는 6-원 환을 형성하는 알킬렌디옥실 그룹 또는 알킬렌디티올 그룹에 의해 치환된 C₅-C₆-사이클로알킬을 나타내거나,

A, B 및 이들이 결합된 탄소 원자는 특히 바람직하게는 두 개의 치환체가 이들이 결합된 탄소원자와 함께, 각 경우에 임의로 C₁-C₂-알킬- 또는 C₁-C₂-알콕시-치환된 C₂-C₄-알칸디일, C₂-C₄-알켄디일 또는 부타디엔디일을 나타내는 C₃-C₆-사이클로알킬 또는 C₅-C₆-사이클로알케닐을 나타낸다.

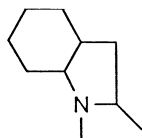
D는 특히 바람직하게는 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 불소-치환된 C_1-C_6 -알킬, C_3-C_6 -알케닐 또는 C_1-C_6 -알콕시- C_2-C_3 -알킬을 나타내거나, 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소에 의해 임의로 대체되고 임의로 C_1-C_4 -알킬-, C_1-C_4 -알콕시- 또는 C_1-C_2 -할로게노알킬-치환된 C_3-C_6 -사이클로알킬을 나타내거나, 또는 (일반식 (I-1)의 화합물의 경우는 제외) 각 경우에 불소, 염소, 브롬, C_1-C_4 -알킬, C_1-C_4 -할로게노알킬, C_1-C_4 -알콕시 및 C_1-C_4 -할로게노알콕시로 구성된 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 페닐 또는 피리딜을 나타내거나,

A 및 D는 함께, 특히 바람직하게는 하나의 메틸렌 그룹이 카보닐 그룹 (일반식 (I-1)의 화합물의 경우는 제외), 산소 또는 황에 의해 대체될 수 있고 임의로 치환된 C_3-C_5 -알칸디일을 나타내며, 여기에서 가능한 치환체는 C_1-C_2 -알킬이거나,

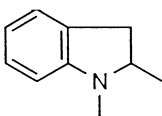
A 및 D (일반식 (I-1)의 화합물의 경우는 제외)는 이들이 결합된 원자와 함께, 하기 그룹 AD-1 내지 AD-10 중 하나를 나타내거나:



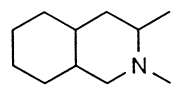
AD-1



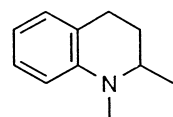
AD-2



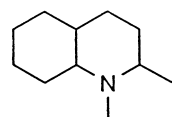
AD-3



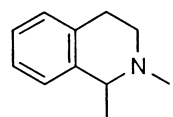
AD-4



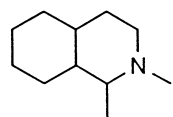
AD-5



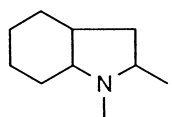
AD-6



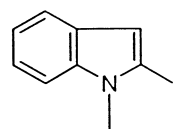
AD-7



AD-8



AD-9



AD-10

A 및 Q^1 은 함께, 특히 바람직하게는 C_1-C_2 -알킬 및 C_1-C_2 -알콕시로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 C_3-C_4 -알칸디일을 나타내거나,

Q^1 은 특히 바람직하게는 수소를 나타낸다.

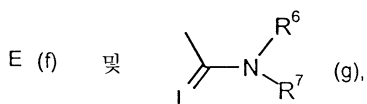
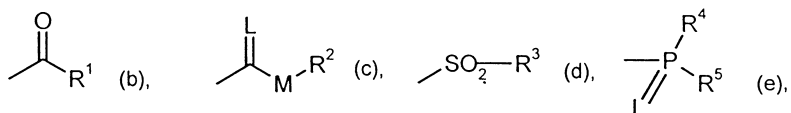
Q^2 은 특히 바람직하게는 수소를 나타낸다.

Q^4 , Q^5 및 Q^6 은 서로 독립적으로 각각 특히 바람직하게는 수소 또는 C_1-C_3 -알킬을 나타낸다.

Q^3 은 특히 바람직하게는 수소 또는 C_1-C_4 -알킬을 나타내거나, 메틸 또는 메톡시에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 C_3-C_6 -사이클로알킬을 나타내거나,

Q^3 및 Q^4 는 이들이 결합된 탄소원자와 함께 특히 바람직하게는 임의로 하나의 환 멤버가 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 C_1 - C_2 -알킬- 또는 C_1 - C_2 -알콕시-치환된 포화 C_5 - C_6 -원 환을 나타낸다.

G 는 특히 바람직하게는 수소(a)를 나타내거나, 하기 그룹 중 하나(특히 (a), (b) 또는 (c))를 나타낸다:



여기에서,

E 는 금속 이온 등가물 또는 암모늄 이온을 나타내며,

L 은 산소 또는 황을 나타내고,

M 은 산소 또는 황을 나타낸다.

R^1 은 특히 바람직하게는 각 경우에 임의로 불소- 또는 염소-치환된 C_1 - C_8 -알킬, C_2 - C_8 -알케닐, C_1 - C_4 -알콕시- C_1 - C_2 -알킬, C_1 - C_4 -알킬티오- C_1 - C_2 -알킬, 또는 임의로 직접 인접해 있지 않은 하나 또는 두 개의 환 멤버가 산소에 의해 대체되고 임의로 불소-, 염소-, C_1 - C_2 -알킬- 또는 C_1 - C_2 -알콕시-치환된 C_3 - C_6 -사이클로알킬을 나타내거나,

불소, 염소, 브롬, 시아노, 니트로, C_1 - C_4 -알킬, C_1 - C_4 -알콕시, C_1 - C_2 -할로게노알킬 또는 C_1 - C_2 -할로게노알콕시에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 페닐을 나타낸다.

R^2 는 특히 바람직하게는 각 경우에 임의로 불소-치환된 C_1 - C_8 -알킬, C_2 - C_8 -알케닐 또는 C_1 - C_4 -알콕시- C_2 - C_4 -알킬을 나타내거나,

임의로 C_1 - C_2 -알킬- 또는 C_1 - C_2 -알콕시-치환된 C_3 - C_6 -사이클로알킬을 나타내거나,

각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, 니트로, C_1 - C_4 -알킬, C_1 - C_3 -알콕시, 트리플루오로메틸 또는 트리플루오로메톡시에 의해 임의로 일치환된 페닐 또는 벤질을 나타낸다.

R^3 은 특히 바람직하게는 임의로 불소-치환된 C_1 - C_6 -알킬을 나타내거나, 임의로 불소, 염소, 브롬, C_1 - C_4 -알킬, C_1 - C_4 -알콕시, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시, 시아노 또는 니트로에 의해 임의로 일치환된 페닐을 나타내거나,

R^4 는 특히 바람직하게는 C_1 - C_6 -알킬, C_1 - C_6 -알콕시, C_1 - C_6 -알킬아미노, 디-(C_1 - C_6 -알킬)아미노, C_1 - C_6 -알킬티오, C_3 - C_4 -알케닐티오 또는 C_3 - C_6 -사이클로알킬티오를 나타내거나, 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 니트로, 시아노, C_1 - C_3 -알콕시, C_1 - C_3 -할로게노알콕시, C_1 - C_3 -알킬티오, C_1 - C_3 -할로게노알킬티오, C_1 - C_3 -알킬 또는 트리플루오로메틸에 의해 임의로 일치환된 페닐, 페녹시 또는 페닐티오를 나타낸다.

R^5 는 특히 바람직하게는 C_1 - C_6 -알콕시 또는 C_1 - C_6 -알킬티오를 나타낸다.

R^6 는 특히 바람직하게는 수소, C_1-C_6 -알킬, C_3-C_6 -사이클로알킬, C_1-C_6 -알콕시, C_3-C_6 -알케닐 또는 C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_4 -알킬을 나타내거나, 불소, 염소, 브롬, 트리플루오로메틸, C_1-C_4 -알킬 또는 C_1-C_4 -알콕시에 의해 임의로 일치환된 페닐을 나타내거나, 불소, 염소, 브롬, C_1-C_4 -알킬, 트리플루오로메틸 또는 C_1-C_4 -알콕시에 의해 임의로 일치환된 벤질을 나타낸다.

R^7 은 특히 바람직하게는 C_1-C_6 -알킬, C_3-C_6 -알케닐 또는 C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_4 -알킬을 나타낸다.

R^6 및 R^7 은 함께, 특히 바람직하게는 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 메틸- 또는 에틸-치환된 C_5 -알킬렌 래디칼을 나타낸다.

특히 바람직한 것으로 언급된 래디칼 정의에서, 할로젠은 불소, 염소, 브롬 및 요오드, 특히 불소, 염소 및 브롬을 나타낸다.

W 는 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, i-프로필, 비닐 또는 에티닐을 나타낸다.

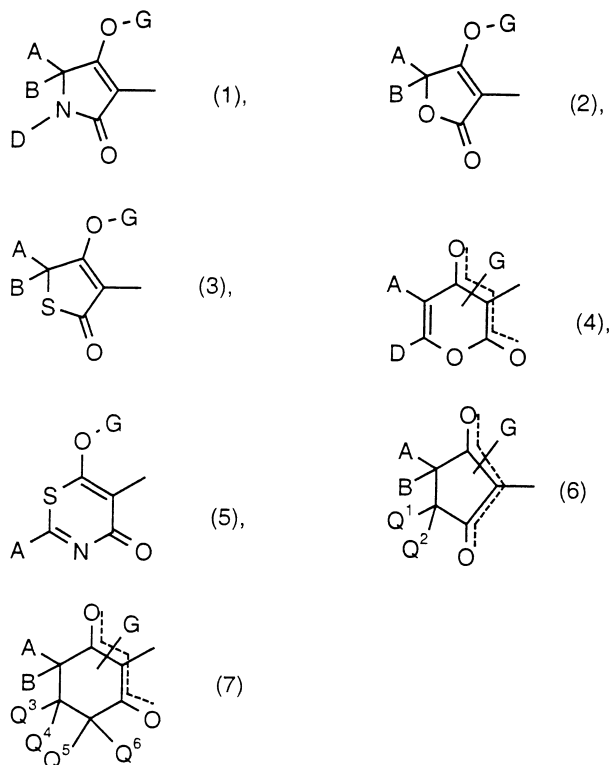
X 는 매우 특히 바람직하게는 메틸, 에틸, n-프로필, i-프로필, 비닐 또는 에티닐을 나타낸다.

Y 는 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, i-프로필, 비닐 또는 에티닐을 나타낸다.

Z 는 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, i-부틸, 비닐 또는 에티닐을 나타내며,

단, 래디칼 W, X, Y 및 Z 중 적어도 하나는 적어도 두 개의 탄소원자를 가진 사슬을 나타내며, 래디칼 W, X, Y 또는 Z 중 많아야 하나만 비닐 또는 에티닐을 나타내고,

CKE 는 매우 특히 바람직하게는 하기 그룹 중 하나를 나타낸다:



A 는 매우 특히 바람직하게는 각 경우에 임의로 불소-치환된 C_1-C_4 -알킬 또는 C_1-C_2 -알콕시- C_1-C_2 -알킬, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실 및, 일반식 (I-5)의 화합물의 경우에만 임의로 불소-, 염소-, 브롬-, 메틸-, 에틸-, n-프로필-, i-프로필-, 메톡시-, 에톡시-, 트리플루오로메틸-, 트리플루오로메톡시-, 시아노- 또는 니트로-치환된 페닐을 나타낸다.

B 는 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸 또는 에틸을 나타내거나,

A, B 및 이들이 결합된 탄소 원자는 매우 특히 바람직하게는 임의로 하나의 환 멤버가 산소 또는 황에 의해 대체되고, 메틸, 에틸, 프로필, i-프로필, 트리플루오로메틸, 메톡시, 에톡시, 프로폭시 또는 부톡시에 의해 임의로 일치환된 포화 C_5-C_6 -사이클로알킬을 나타내거나,

A, B 및 이들이 결합된 탄소 원자는 매우 특히 바람직하게는 직접 인접해 있지 않은 두 개의 산소원자를 함유하는 알킬렌 디옥실 그룹에 의해 치환된 C_6 -사이클로알킬을 나타내거나,

A, B 및 이들이 결합된 탄소 원자는 두 개의 치환체가 이들이 결합된 탄소원자와 함께, 매우 특히 바람직하게는 C_2-C_4 -알칸디일 또는 C_2-C_4 -알켄디일 또는 부타디엔디일을 나타내는 C_5-C_6 -사이클로알킬 또는 C_5-C_6 -사이클로알케닐을 나타낸다.

D 는 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 불소-치환된 C_1-C_4 -알킬, C_3-C_4 -알케닐 또는 C_1-C_4 -알콕시- C_2-C_3 -알킬, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나, 또는 (일반식 (I-1)의 화합물의 경우는 제외) 불소, 염소, 메틸, 에틸, n-프로필, i-프로필, 메톡시, 에톡시 또는 트리플루오로메틸에 의해 임의로 일치환된 피리딜 또는 페닐을 나타내거나,

A 및 D 는 함께, 매우 특히 바람직하게는 임의로 하나의 탄소원자가 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 치환된 C_3-C_4 -알칸디일을 나타내거나,

A 및 Q^1 은 함께, 매우 특히 바람직하게는 메틸 또는 메톡시에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 C_3-C_4 -알칸디일을 나타내거나,

Q^1 은 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타낸다.

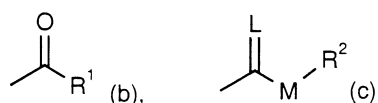
Q^2 는 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타낸다.

Q^4 , Q^5 및 Q^6 은 서로 독립적으로 각각 매우 특히 바람직하게는 수소 또는 메틸을 나타낸다.

Q^3 은 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸 또는 프로필을 나타내거나,

Q^3 및 Q^4 는 이들이 결합된 탄소원자와 함께 매우 특히 바람직하게는 메틸 또는 메톡시에 의해 임의로 일치환된 포화 C_5-C_6 -환을 나타낸다.

G 는 매우 특히 바람직하게는 수소(a)를 나타내거나, 하기 그룹 중 하나를 나타낸다:



여기에서,

L 은 산소 또는 황을 나타내고,

M 은 산소 또는 황을 나타낸다.

R^1 은 매우 특히 바람직하게는 C_1-C_6 -알킬, C_2-C_6 -알케닐, C_1-C_2 -알콕시- C_1 -알킬, C_1-C_2 -알킬티오- C_1 -알킬 또는, 불소, 염소, 메틸 또는 메톡시에 의해 임의로 일치환된 사이클로헥실 또는 사이클로프로필을 나타내거나,

불소, 염소, 브롬, 시아노, 니트로, 메틸, 메톡시, 트리플루오로메틸 또는 트리플루오로메톡시에 의해 임의로 일치환된 페닐을 나타낸다.

R^2 는 매우 특히 바람직하게는 각 경우에 임의로 불소-치환된 C_1-C_8 -알킬, C_2-C_6 -알케닐 또는 C_1-C_4 -알콕시- C_2-C_3 -알킬, 페닐 또는 벤질을 나타낸다.

W 는 가장 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸 또는 i-프로필을 나타내고,

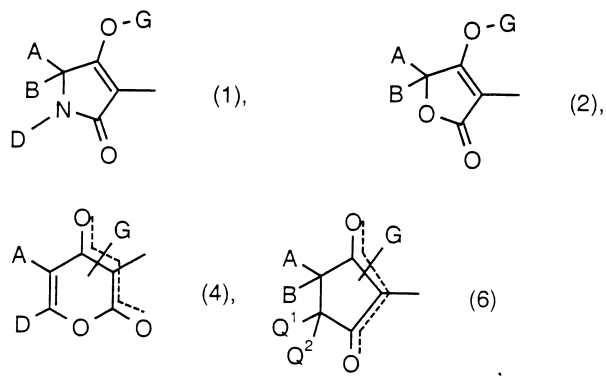
X 는 가장 특히 바람직하게는 메틸, 에틸, i-프로필 또는 비닐을 나타내며,

Y 는 가장 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, i-프로필, 비닐 또는 에틸닐을 나타내고,

Z 는 가장 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필 또는 i-부틸을 나타내며,

단, 래디칼 W, X, Y 및 Z 중 적어도 하나는 적어도 두 개의 탄소원자를 가진 사슬을 나타내며, 래디칼 W, X, Y 또는 Z 중 많아야 하나만 비닐 또는 에틸닐을 나타내고,

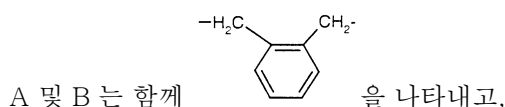
CKE 는 가장 특히 바람직하게는 하기 그룹 중 하나를 나타내며:



A 는 가장 특히 바람직하게는 메틸을 나타내고,

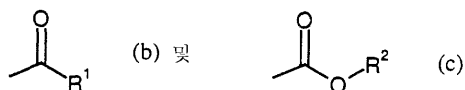
B 는 가장 특히 바람직하게는 메틸을 나타내며,

A, B 및 이들이 결합된 탄소 원자는 가장 특히 바람직하게는 임의로 하나의 환 멤버가 산소에 의해 대체되고, 메틸, 에틸, 메톡시 또는 에톡시에 의해 임의로 일치환된 포화 C_5-C_6 -사이클로알킬을 나타낸다.



D 는 가장 특히 바람직하게는 수소를 나타내거나, (일반식 (I-1)의 화합물의 경우는 제외) 불소-치환된 페닐을 나타내며,

G 는 가장 특히 바람직하게는 수소(a)를 나타내거나, 하기 그룹 중 하나를 나타내고:



R^1 은 가장 특히 바람직하게는 C_1-C_6 -알킬 또는 C_1-C_2 -알콕시메틸을 나타내며,

R^2 는 가장 특히 바람직하게는 C_1-C_4 -알킬을 나타낸다.

CKE=(6)인 경우,

A 및 Q^1 은 함께 가장 특히 바람직하게는 C_3-C_4 -알칸디일을 나타내고,

B 및 Q^2 는 각각 가장 특히 바람직하게는 수소를 나타낸다.

상기 언급된 일반적이거나 바람직한 래디칼의 정의 및 설명은 필요한 경우 서로 조합될 수 있으며, 즉, 각각의 범위와 바람직한 범위사이의 조합이 가능하다. 이것은 최종 생성물 및, 상응하게 전구체 및 중간체에도 적용된다.

본 발명에 따른 바람직한 것으로 상기에서 바람직한(더 바람직한) 것으로 언급된 의미의 조합을 포함하는 일반식 (I)의 화합물이 제시된다.

본 발명에 따른 특히 바람직한 것으로 상기에서 특히 바람직한 것으로 언급된 의미의 조합을 포함하는 일반식 (I)의 화합물이 제시된다.

본 발명에 따른 매우 특히 바람직한 것으로 상기에서 매우 특히 바람직한 것으로 언급된 의미의 조합을 포함하는 일반식 (I)의 화합물이 제시된다.

본 발명에 따른 가장 특히 바람직한 것으로 상기에서 가장 특히 바람직한 것으로 언급된 의미의 조합을 포함하는 일반식 (I)의 화합물이 제시된다.

예를 들어 알콕시에서와 같이 헤테로 원자와 결합된 것을 포함하여 알킬 또는 알케닐과 같은 포화 또는 불포화된 탄화수소 래디칼은 가능한, 각 경우에 직쇄 또는 측쇄이다.

다른 언급이 없는 한, 임의로 치환된 래디칼은 일- 또는 다치환될 수 있으며, 다치환된 경우 치환체는 동일하거나 상이할 수 있다.

제조 실시예에 언급된 화합물 이외에 일반식 (I-1-a)의 화합물이 구체적으로 언급될 수 있다:

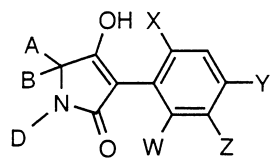


표 1 : $W=CH_3$, $X=CH_3$, $Y=C\equiv CH$, $Z=H$.

A	B	D
CH ₃	H	H
C ₂ H ₅	H	H
C ₃ H ₇	H	H
i-C ₃ H ₇	H	H
C ₄ H ₉	H	H
i-C ₄ H ₉	H	H
s-C ₄ H ₉	H	H
t-C ₄ H ₉	H	H
CH ₃	CH ₃	H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₃ H ₇	CH ₃	H
i-C ₃ H ₇	CH ₃	H
C ₄ H ₉	CH ₃	H
i-C ₄ H ₉	CH ₃	H
s-C ₄ H ₉	CH ₃	H
t-C ₄ H ₉	CH ₃	H

표 1(계속) :



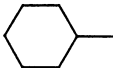
A	B	D
C_2H_5	C_2H_5	H
C_3H_7	C_3H_7	H
	CH_3	H
	CH_3	H
	CH_3	H
$-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_4-$		H
$-(CH_2)_5-$		H
$-(CH_2)_6-$		H
$-(CH_2)_7-$		H
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-O-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$		H

표 1(계속) :

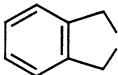
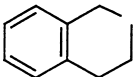
A	B	D
$-\text{CH}_2-(\text{CHCH}_3)_2-(\text{CH}_2)_2-$		H
$ \begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH}-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}- \\ \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \end{array} $		H
$ \begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH} \qquad \qquad \text{CH}-\text{CH}_2- \\ \qquad \qquad \qquad \\ (\text{CH}_2)_4 \end{array} $		H
$ \begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH} \qquad \qquad \text{CH}-(\text{CH}_2)_2- \\ \qquad \qquad \qquad \\ (\text{CH}_2)_3 \end{array} $		H
		H
		H
$-(\text{CH}_2)_3-$		H
$-(\text{CH}_2)_4-$		H
$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-\text{CH}_2-$		H
$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-$		H
$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-\text{CHCH}_3-$		H
$-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$		H
$-\text{CH}_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-\text{CH}_2-$		H
$ \begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH} \qquad \qquad \text{CH}- \\ \qquad \qquad \qquad \\ (\text{CH}_2)_3 \end{array} $		H
H	CH_3	H
H	C_2H_5	H
H	C_3H_7	H

표 1(계속) :


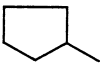
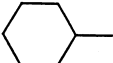

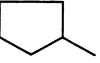
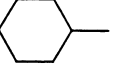
A	B	D
H	i-C ₃ H ₇	H
H		H
H		H
H		H
CH ₃	CH ₃	H
CH ₃	C ₂ H ₅	H
CH ₃	C ₃ H ₇	H
CH ₃	i-C ₃ H ₇	H
CH ₃		H
CH ₃		H
CH ₃		H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

표 2 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

W=CH₃; X=CH₃; Y=CH=CH₂; Z=H.

표 3 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

W=CH₃; X=C₂H₅; Y=CH₃; Z=H.

표 4 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

W=CH₃; X=CH₃; Y=C₂H₅; Z=H.

표 5 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

W=C₂H₅; X=C₂H₅; Y=CH₃; Z=H.

표 6 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

$W=C_2H_5$; $X=C_2H_5$; $Y=C_2H_5$; $Z=H$.

표 7 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

$W=CH_3$; $X=C\equiv CH$; $Y=CH_3$; $Z=H$.

표 8 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

$W=CH_3$; $X=CH=CH_2$; $Y=CH_3$; $Z=H$.

표 9 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

$W=CH_3$; $X=C_2H_5$; $Y=C_2H_5$; $Z=H$.

표 10 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

$W=H$; $X=CH_3$; $Y=C\equiv CH$; $Z=H$.

표 11 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

$W=H$; $X=CH_3$; $Y=CH=CH_2$; $Z=H$.

표 12 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

$W=H$; $X=C_2H_5$; $Y=CH_3$; $Z=H$.

표 13 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

$W=H$; $X=CH_3$; $Y=C_2H_5$; $Z=H$.

표 14 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

W=H; X=CH₃; Y=H; Z=C₂H₅.

표 15 :

A, B 및 D 는 각각 표 1에 정의된 바와 같으며,

W=H; X=CH₃; Y=CH₃; Z=C₂H₅.

제조 실시예에 언급된 화합물 이외에 일반식 (I-2-a)의 하기 화합물이 구체적으로 언급될 수 있다:

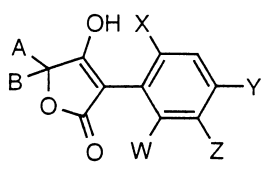


표 16 : W=CH₃; X=CH₃; Y=C≡CH; Z=H.

A	B
CH ₃	H
C ₂ H ₅	H
C ₃ H ₇	H
i-C ₃ H ₇	H
C ₄ H ₉	H
i-C ₄ H ₉	H
s-C ₄ H ₉	H
t-C ₄ H ₉	H
CH ₃	CH ₃
C ₂ H ₅	CH ₃
C ₃ H ₇	CH ₃
i-C ₃ H ₇	CH ₃
C ₄ H ₉	CH ₃
i-C ₄ H ₉	CH ₃
s-C ₄ H ₉	CH ₃
t-C ₄ H ₉	CH ₃

표 16(계속) :



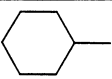
A	B
C_2H_5	C_2H_5
C_3H_7	C_3H_7
	CH_3
	CH_3
	CH_3
$-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_4-$	
$-(CH_2)_5-$	
$-(CH_2)_6-$	
$-(CH_2)_7-$	
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$	
$-CH_2-O-(CH_2)_3-$	
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$	
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$	
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$	
$(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$	
$-CH_2-(CHCH_3)_2-(CH_2)_2-$	

표 16(계속) :

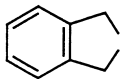
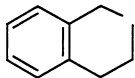
A	B
$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---(CH}_2\text{)}_2\text{---CH---} \\ \qquad \qquad \\ \text{---CH}_2\text{---} \end{array}$	
$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---CH---CH}_2\text{---} \\ \qquad \qquad \\ \text{---(CH}_2\text{)}_4\text{---} \end{array}$	
$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---CH---(CH}_2\text{)}_2\text{---} \\ \qquad \qquad \\ \text{---(CH}_2\text{)}_3\text{---} \end{array}$	
	
	

표 17 :

A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

W=CH₃; X=CH₃; Y=CH=CH₂; Z=H.

표 18 :

A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

W=CH₃; X=C₂H₅; Y=CH₃; Z=H.

표 19 :

A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

W=CH₃; X=CH₃; Y=C₂H₅; Z=H.

표 20 :

A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

W=C₂H₅; X=C₂H₅; Y=CH₃; Z=H.

표 21 :

A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

W=C₂H₅; X=C₂H₅; Y=C₂H₅; Z=H.

표 22 :

A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

$W=CH_3$; $X=C\equiv CH$; $Y=CH_3$; $Z=H$.

표 23 :

A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

$W=CH_3$; $X=CH=CH_2$; $Y=CH_3$; $Z=H$.

표 24 :

A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

$W=CH_3$; $X=C_2H_5$; $Y=C_2H_5$; $Z=H$.

표 25 :

A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

$W=H$; $X=CH_3$; $Y=C\equiv CH$; $Z=H$.

표 26 :

A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

$W=H$; $X=CH_3$; $Y=CH=CH_2$; $Z=H$.

표 27 :

A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

$W=H$; $X=C_2H_5$; $Y=CH_3$; $Z=H$.

표 28 :

A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

$W=H$; $X=CH_3$; $Y=C_2H_5$; $Z=H$.

표 29 :

A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

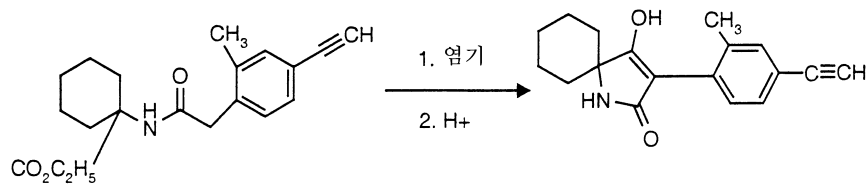
$W=H$; $X=CH_3$; $Y=H$; $Z=C_2H_5$.

표 30 :

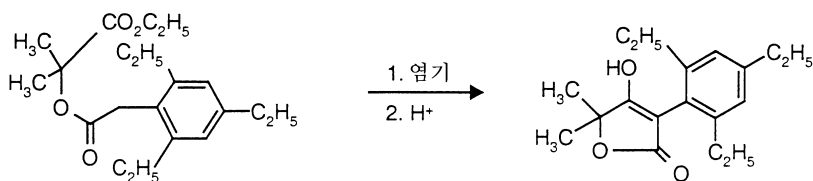
A 및 B 는 각각 표 16에 정의된 바와 같으며,

$W=H$; $X=CH_3$; $Y=CH_3$; $Z=C_2H_5$.

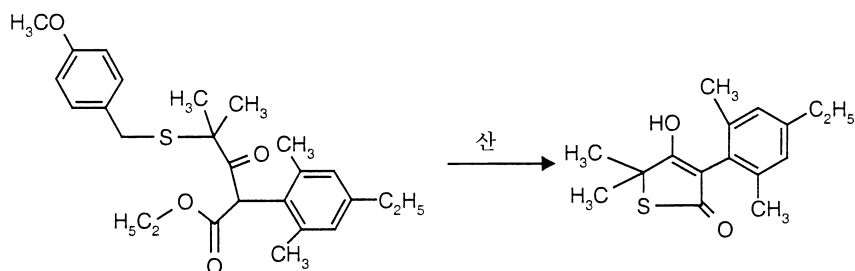
방법 (A)에 따라, 에틸 N-(2-메틸-4-에티닐-페닐아세틸)-1-아미노사이클로헥산-카복실레이트를 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



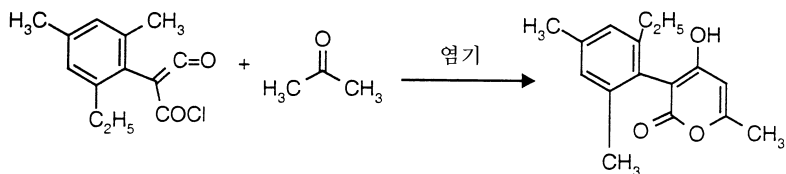
방법 (B)에 따라, 에틸 O-(2,4,6-트리에틸-페닐아세틸)-2-하이드록시이소부티레이트를 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



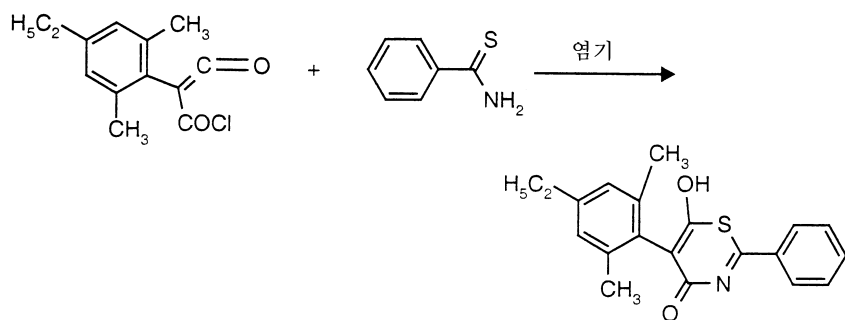
방법 (C)에 따라, 에틸 2-(2,6-디메틸-4-에틸-페닐)-4-(4-메톡시)-벤질머캡토-4-메틸-3-옥소-발레레이트를 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



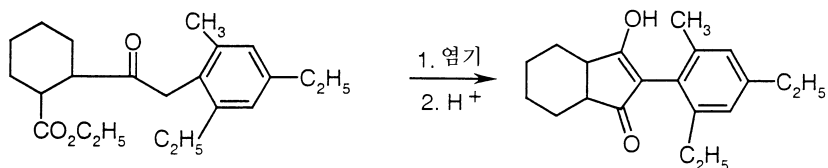
예를 들어 방법 (D)에 따라, (클로로카보닐) 2-(2-에틸-4,6-디메틸)-페닐케텐 및 아세톤을 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



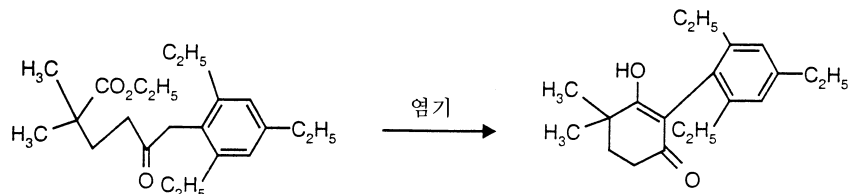
예를 들어 방법 (E)에 따라, (클로로카보닐) 2-(2,6-디메틸-4-에틸)-페닐케텐 및 티오벤즈아미드를 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



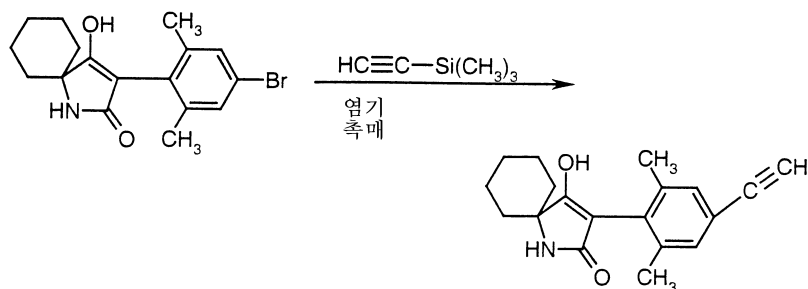
방법 (F)에 따라, 에틸 5-(2,4-디에틸-6-메틸-페닐)-2,3-테트라메틸렌-4-옥소-발레레이트를 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



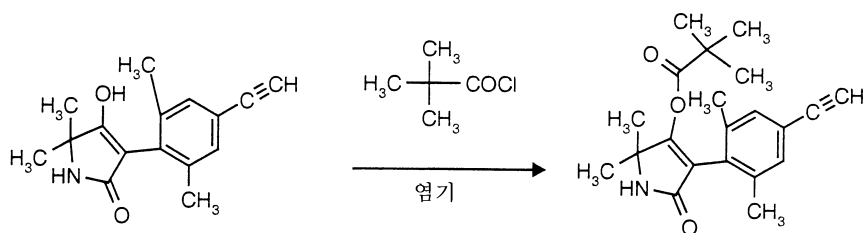
방법 (G)에 따라, 에틸 5-[(2,4,6-트리에틸-페닐)-페닐]-2,2-디메틸-5-옥소-헥사노에이트를 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



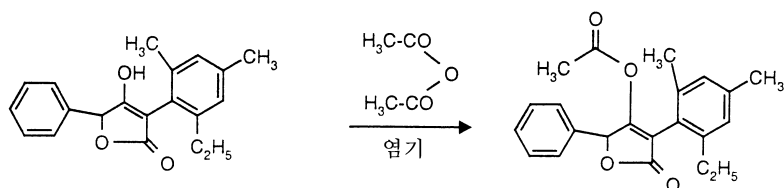
방법 (H)에 따라, 3-[(2,6-디메틸-4-브로모)-페닐]-4,4-(펜타메틸렌)-피롤리딘-2,4-디온을 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



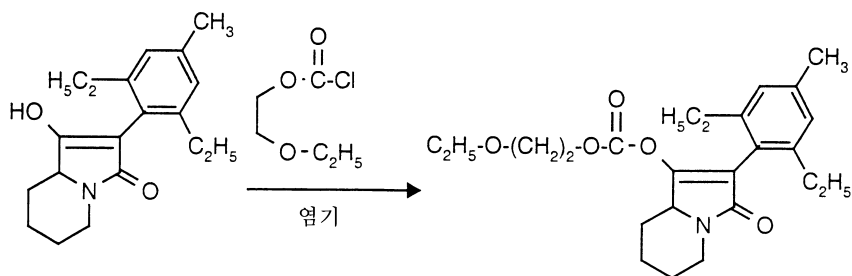
방법 (Ia)에 따라, 3-(2,6-디메틸-4-에티닐-페닐)-5,5-디메틸피롤리딘-2,4-디온 및 피발로일 클로라이드를 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



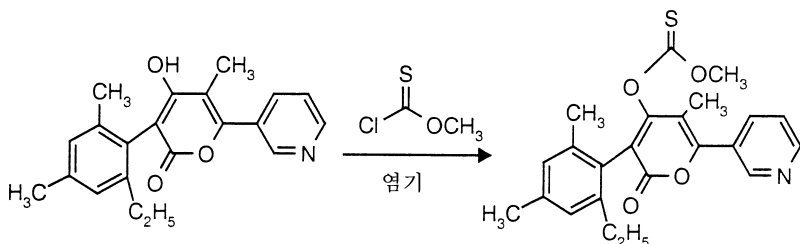
방법 (Ib)에 따라, 3-(2-에틸-4,6-디메틸-페닐)-4-하이드록시-5-페닐-Δ³-디하이드로푸란-2-온 및 아세트산 무수물을 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



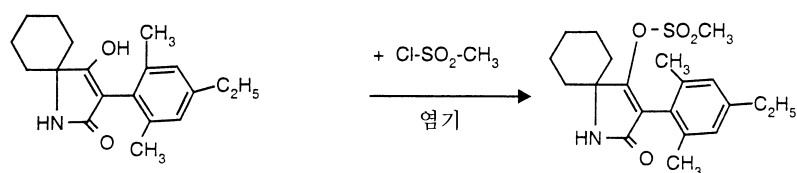
방법 (J)에 따라, 8-[(2,6-디에틸-4-메틸)-페닐]-1-아자비사이클로-(4.3.0^{1,6})-노난-7,9-디온 및 에톡시에틸 클로로포르메이트를 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



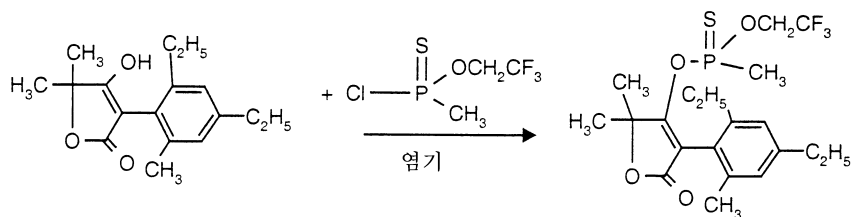
방법 (K)에 따라, 3-(2-에틸-4,6-디메틸-페닐)-4-하이드록시-5-메틸-6-(3-피리딜)-피론 및 메틸 클로로노티오프레이트를 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



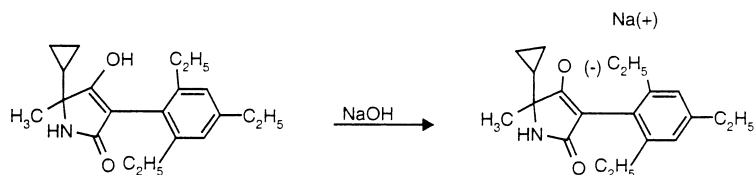
방법 (L)에 따라, 3-(2,6-디메틸-4-에틸-페닐)-5,5-펜타메틸렌-피롤리딘-2,4-디온 및 메탄설폰일 클로라이드를 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



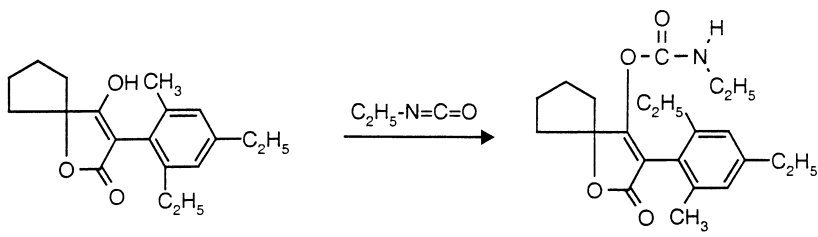
방법 (M)에 따라, 3-(2,4-디에틸-6-메틸-페닐)-4-하이드록시-5,5-디메틸-Δ³-디하이드로푸란-2-온 및 2,2,2-트리플루오로에틸 메탄티오포스포닐 클로라이드를 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



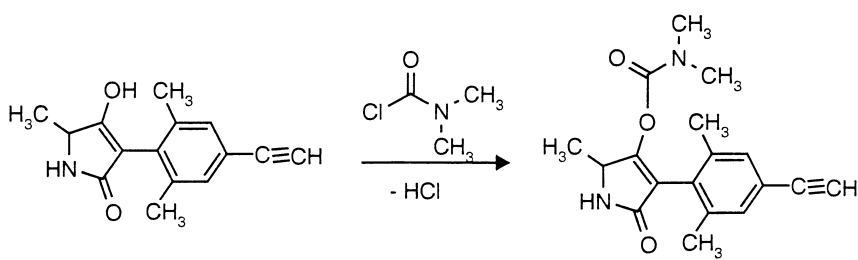
방법 (N)에 따라, 3-(2,4,6-트리에틸-페닐)-5-사이클로프로필-5-메틸-피롤리딘-2,4-디온 및 NaOH를 성분으로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



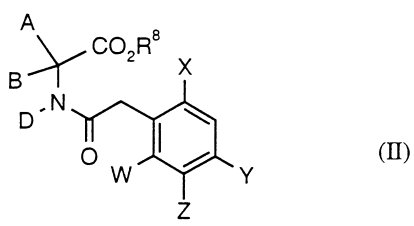
방법 (Oa)에 따라, 3-(2,4-디에틸-6-메틸-페닐)-4-하이드록시-5-테트라메틸렌-Δ³-디하이드로-푸란-2-온 및 에틸이소시아네이트를 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



방법 (Oβ)에 따라, 3-(4-에틸닐-2,6-디메틸-페닐)-5-메틸-피롤리딘-2,4-디온 및 디메틸카바모일 클로라이드를 출발 물질로 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



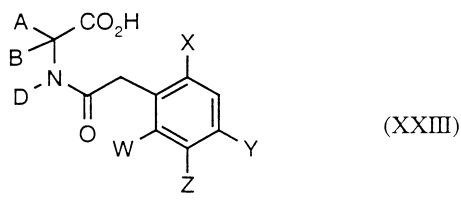
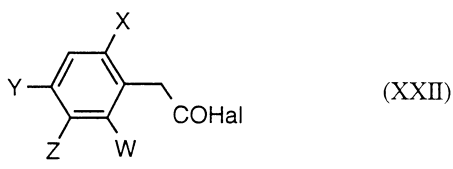
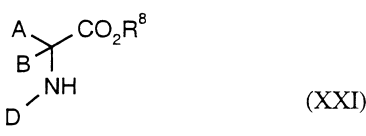
본 발명에 따른 방법 (A)에서 출발 물질로 필요한 일반식 (II)의 화합물은 신규하다:



상기 식에서,

A, B, D, W, X, Y, Z 및 R⁸은 각각 상기 정의된 바와 같다.

일반식 (II)의 아실아미노산 에스테르는 예를 들어 일반식 (XXI)의 아미노산 유도체를 일반식 (XXII)의 치환된 페닐아세틸 할라이드로 아실화시키거나(참조: Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968), 일반식 (XXIII)의 아실아미노산을 에스테르화시킴(참조: Chem. Ind. (London) 1568 (1968))으로서 수득된다:

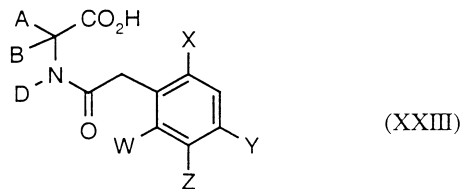


상기 식에서,

A, B, R⁸, D, W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같으며,

Hal은 염소 또는 브롬을 나타낸다.

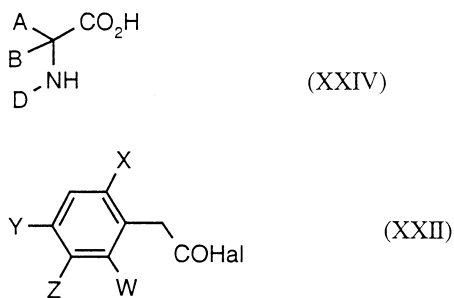
일반식 (XXIII)의 화합물은 신규하다:



상기 식에서,

A, B, D, W, X, Y 및 Z는 각각 상기에 정의된 바와 같다.

일반식 (XXIII)의 화합물은 일반식 (XXIV)의 아미노산을, 예를 들어 쇼텐-바우만(Schotten-Baumann)에 따라 일반식 (XXII)의 치환된 페닐아세틸 할라이드로 아실화시킴으로서 수득된다(참조: Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, p. 505):



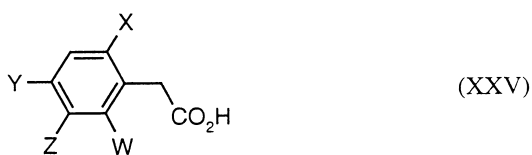
상기 식에서,

A, B, D, W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같으며,

Hal은 염소 또는 브롬을 나타낸다.

일반식 (XXII)의 화합물은 신규하다. 이들은 원칙적으로 공지된 방법에 의해 제조할 수 있다(참조예: H. Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Vol. 8, pp. 467-469 (1952)).

일반식 (XXII)의 화합물은, 예를 들어 일반식 (XXV)의 치환된 페닐아세트산을 -20 내지 150℃, 바람직하게는 -10 내지 100℃의 온도에서, 경우에 따라 희석제(예를 들어, 톨루엔 또는 메틸렌 클로라이드와 같은 임의로 염소화된 지방족 또는 방향족 탄화수소)의 존재하에 할로젠화제(예를 들어, 티오닐 클로라이드, 티오닐 브로마이드, 옥살릴 클로라이드, 포스젠, 삼염화인, 삼브롬화인 또는 오염화인)와 반응시킴으로서 수득된다:

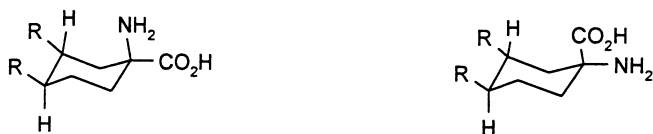


상기 식에서,

W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같다.

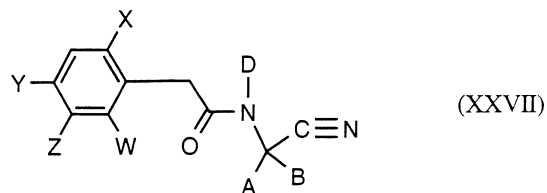
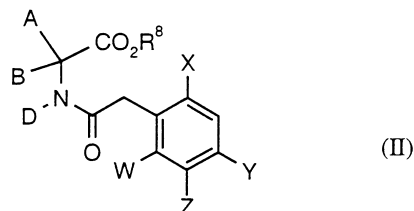
일반식 (XXI) 및 (XXIV)의 화합물의 일부는 공지되어 있고/있거나 공지된 방법(참조예: Compagnon, Miocque Ann. Chim. (Paris) [14] 5, p. 11-22, 23-27 (1970))으로 제조할 수 있다.

A 및 B가 환을 형성하는 일반식 (XXIV)의 치환된 사이클릭 아미노카복실산은 일반적으로 부헤러-베르그스(Bucherer-Bergs) 합성법 또는 스트렉커(Strecker) 합성법으로 수득될 수 있으며, 이들은 각 경우에 이들 합성에서 상이한 이성체 형태로 수득된다. 즉, 부헤러-베르그스 합성법의 조건하에서는 래디칼 R 및 카복실 그룹이 수평(equatorial) 위치에 있는 이성체(이하에서는 간단히 β라고 부른다)가 주로 수득되는 반면, 스트렉커 합성법의 조건하에서는 아미노 그룹 및 래디칼 R이 수평 위치에 있는 이성체(이하에서는 간단히 α라고 부른다)가 주로 수득된다(참조: L. Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961); J. T. Eward, C. Jitrangeri, Can. J. Chem. 53, 3339 (1975)):



부헤러-베르그스 합성법(β이성체) 스트렉커 합성법(α이성체)

또한, 상기 방법 (A)에 사용된 일반식 (II)의 출발 물질은 일반식 (XXVI)의 아미노니트릴을 일반식 (XXII)의 치환된 페닐아세틸 할라이드와 반응시켜 일반식 (XXVII)의 화합물을 수득한 후, 이것을 산 알콜 분해시킴으로서 제조될 수 있다:

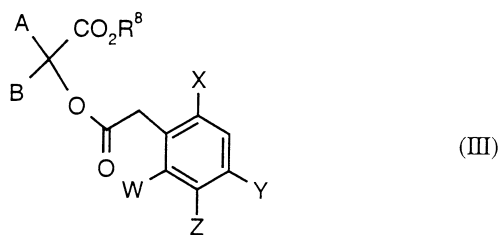


상기 식에서,

A, B, D, W, X, Y, Z, R⁸ 및 Hal은 각각 상기 정의된 바와 같다.

일반식 (XXVII)의 화합물 또한 신규하다.

본 발명에 따른 방법 (B)에 출발 물질로 필요한 일반식 (III)의 화합물은 신규하다:

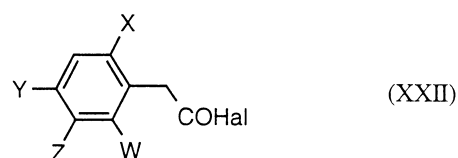


상기 식에서,

A, B, W, X, Y, Z 및 R⁸ 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

이들은 원칙적으로 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다.

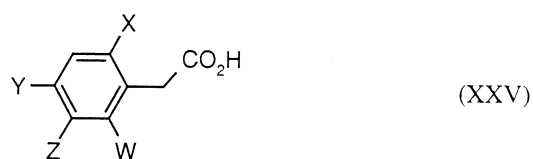
즉, 일반식 (III)의 화합물은, 예를 들어 일반식 (XXVIII)의 2-하이드록시카복실산 에스테르를 일반식 (XXII)의 치환된 페닐아세틸 할라이드로 아실화시킴으로서 취득된다(참조: Chem. Reviews 52, 237-416 (1953)):



상기 식에서,

A, B, W, X, Y, Z, R⁸ 및 Hal은 각각 상기 정의된 바와 같다.

또한, 일반식 (III)의 화합물은 일반식 (XXV)의 치환된 페닐아세트산을 일반식 (XXIX)의 α-할로게노카복실산 에스테르로 알킬화시킴으로서 취득된다:



상기 식에서,

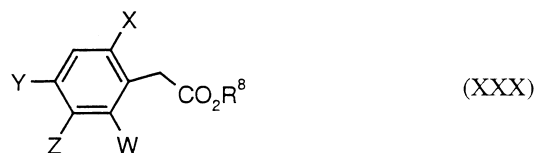
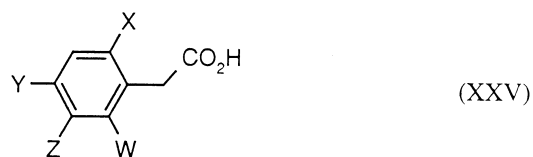
A, B, W, X, Y, Z 및 R⁸ 은 각각 상기 정의된 바와 같으며,

Hal은 염소 또는 브롬을 나타낸다.

일반식 (XXV)의 화합물은 신규하다.

일반식 (XXIX)의 화합물은 상업적으로 입수가능하다.

일반식 (XXV)의 화합물은, 예를 들어 일반식 (XXX)의 페닐아세트산 에스테르를 산 또는 염기의 존재하 및 용매의 존재하에 일반적으로 공지된 표준 조건하에서 가수분해시킴으로써 수득된다:



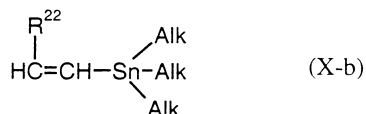
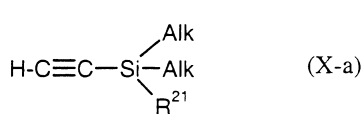
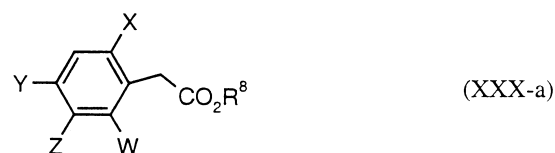
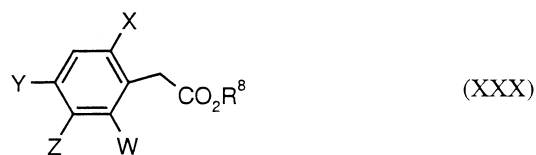
상기 식에서,

W, X, Y, Z 및 R^8 은 각각 상기 정의된 바와 같고,

Y는 또한 $-C\equiv C-Si(CH_3)_3$ 일 수 있다.

일반식 (XXX)의 화합물은 신규하다.

일반식 (XXX)의 화합물은, 예를 들어 일반식 (XXX-a)의 페닐아세트산 에스테르를 용매의 존재하 및 경우에 따라 염기 및 촉매(바람직하게는 상기 언급된 팔라듐 복합체중의 하나)의 존재하에서 일반식 (X-a)의 실릴아세틸렌 또는 일반식 (X-b)의 비닐주석과 반응시킴으로써 수득된다:



상기 식에서,

W, X, Y, Z 및 R^8 은 각각 상기 정의된 바와 같으며,

Y는 또한 $-C\equiv C-Si(CH_3)_3$ 일 수 있고,

하나 또는 두 개의 래디칼, 특히 하나의 래디칼, W, X, Y 또는 Z는 염소, 브롬 또는 요오드, 특히 브롬을 나타내고, 단 나머지 래디칼 W, X, Y 또는 Z는 알케닐 또는 알킬닐을 나타내지 않으며,

Alk는 바람직하게는 C_1-C_4 -알킬을 나타내고,

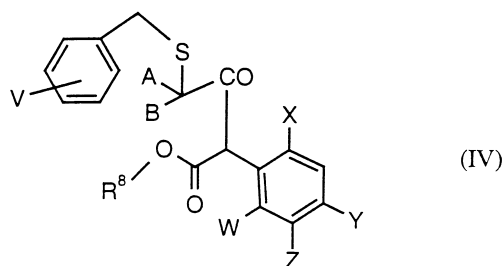
R²¹ 은 바람직하게는 C₁-C₈-알킬 또는 페닐을 나타내며,

R²² 은 상기 정의된 바와 같다.

일반식 (XXX-a)의 페닐아세트산 에스테르의 일부는 WO 96/35 664, WO 97/02 243, WO 97/01535, WO 97/36868 또는 WO 98/05638에 공지되어 있거나, 여기에 기술된 방법으로 제조될 수 있다.

또한, 일반식 (XXX)의 페닐아세트산 에스테르는 추가로 하기에 기술된 방법 (P) 및 (Q)에 의해 수득된다.

본 발명에 따른 방법 (C)에 출발 물질로 필요한 일반식 (IV)의 화합물은 신규하다:

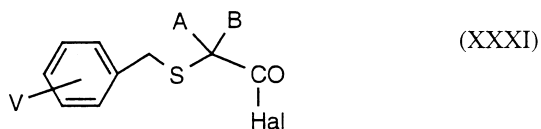
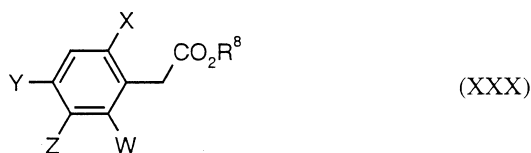


상기 식에서,

A, B, V, W, X, Y, Z 및 R⁸ 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

이들은 원칙적으로 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다.

일반식 (IV)의 화합물은, 예를 들어 일반식 (XXX)의 치환된 페닐아세트산 에스테르를 강염기의 존재하에서 일반식 (XXXI)의 2-벤질티오-카보닐 할라이드로 아실화시킴으로서 수득된다(참조예: M. S. Chambers, E. J. Thomas, D. J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228):



상기 식에서,

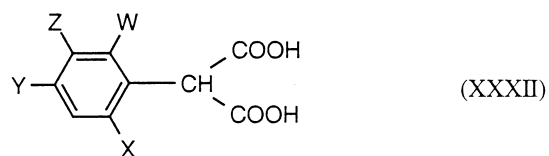
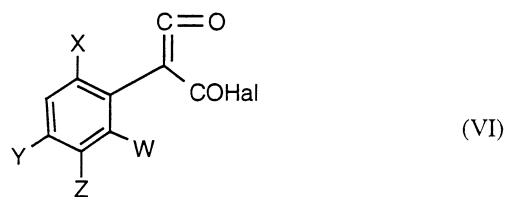
W, X, Y, R⁸, Z, A, B 및 V 는 각각 상기 정의된 바와 같으며,

Hal은 할로겐(특히 염소 또는 브롬)을 나타낸다.

일반식 (XXXI)의 벤질티오-카보닐 할라이드의 일부는 공지되어 있고/있거나 공지된 방법(참조예: J. Antibiotics (1983), 26, 1589)으로 제조할 수 있다.

상기 방법 (D) 및 (E)에 출발 물질로 필요한 일반식 (VI)의 할로게노카보닐 케텐은 신규하다. 이들은 원칙적으로 공지된 방법에 의해 간단한 방식으로 제조될 수 있다(참조예: Org. Prep. Proced. Int. 7, (4), 155-158, 1975 및 DE 1 945 703호). 즉, 예를 들어 일반식 (VI)의 화합물은 일반식 (XXXII)의 치환된 페닐말론산을, 경우에 따라 촉매, 예를 들어 디에틸포름아

미드, 메틸-스테릴-포름아미드 또는 트리페닐포스핀의 존재하 및 경우에 따라 염기, 예를 들어, 피리딘 또는 트리에틸아민의 존재하에서 산 할라이드, 예를 들어, 티오닐 클로라이드, 염화인(V), 염화인(III), 옥살릴 클로라이드, 포스겐 또는 티오닐 브로마이드와 반응시킴으로서 수득된다:



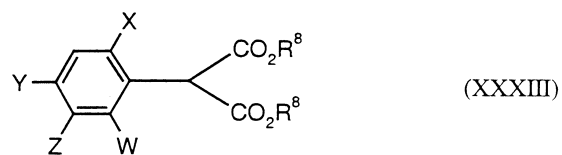
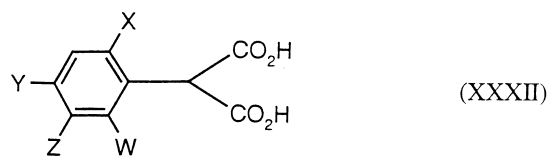
상기 식에서,

W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같으며,

Hal은 염소 또는 브롬을 나타낸다.

일반식 (XXXII)의 치환된 페닐말론산은 신규하다. 이들은 공지된 방법에 의해 간단한 방식으로 제조될 수 있다(참조예: Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, p. 517 이하, EP-A-528 156, WO 96/35 664, WO 97/02 243, WO 97/01535, WO 97/36868 및 WO 98/05638).

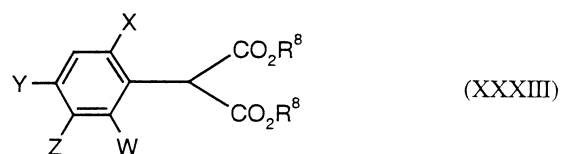
즉, 일반식 (XXXII)의 페닐말론산은 일반식 (XXXIII)의 페닐말론산 에스테르를 우선 염기 및 용매의 존재하에 가수분해시킨후, 조심스럽게 산성화시킴으로써 수득된다(참조: EP-528 156, WO 96/35 664, WO 97/02 243):



상기 식에서,

W, X, Y, Z 및 R⁸은 각각 상기 정의된 바와 같다.

일반식 (XXXIII)의 말론산 에스테르의 일부는 공지되어 있다:

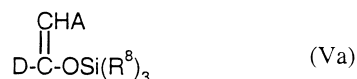
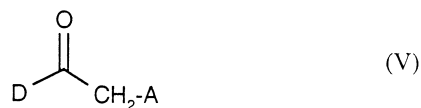


상기 식에서,

W, X, Y, Z 및 R⁸은 각각 상기 정의된 바와 같다.

이들은 유기 화학에서 일반적으로 공지된 방법으로 제조될 수 있다(참조예: Tetrahedron Lett. 27, 2763 (1986) 및 Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, p. 587 이하, WO 96/35664, WO 97/02243, WO 97/01535, WO 97/36868, WO 98/05638 및 WO 99/47525).

본 발명에 따른 방법 (D)를 수행하는데 출발 물질로 필요한 일반식 (V)의 카보닐 화합물 또는 일반식 (Va)의 그의 실릴 에놀 에테르는 상업적으로 입수가능하거나, 일반적으로 공지된 화합물이거나, 공지된 방법으로 수득할 수 있는 화합물이다:



상기 식에서,

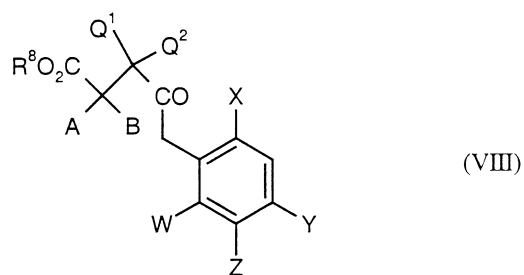
A, D 및 R^8 은 각각 상기에서 정의된 바와 같다.

본 발명에 따른 방법 (E)를 수행하는데 출발 물질로 필요한 일반식 (VI)의 케텐산 클로라이드를 제조하는 것에 대해서는 이미 상기에 기술하였다. 본 발명에 따른 방법 (E)를 수행하는데 출발 물질로 필요한 일반식 (VII)의 티오아미드는 유기 화학에 일반적으로 공지된 화합물이다:



상기 식에서, A 는 상기 정의된 바와 같다.

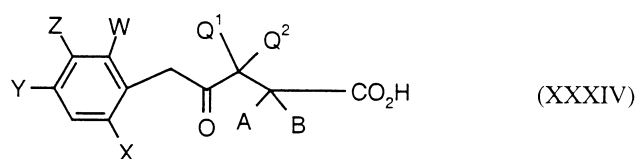
본 발명에 따른 방법 (E)의 출발 물질로 필요한 일반식 (VIII)의 화합물은 신규하다:



상기 식에서, A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y, Z 및 R^8 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

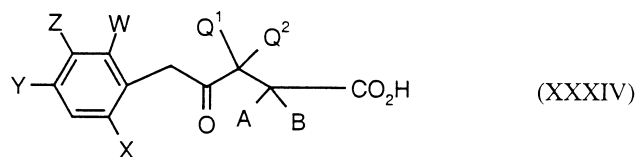
이들은 원칙적으로 공지된 방법으로 제조될 수 있다.

일반식 (VIII)의 5-아릴-4-케토카복실산 에스테르는, 예를 들어 일반식 (XXXIV)의 5-아릴-4-케토카복실산을 에스테르화시키거나(참조예: Organikum, 15th edition, Berlin, 1977, p 499) 알킬화시킴으로써(제조실시에 참조) 수득된다:



상기 식에서, W, X, Y, Z, A, B, Q^1 및 Q^2 는 각각 상기 정의된 바와 같다.

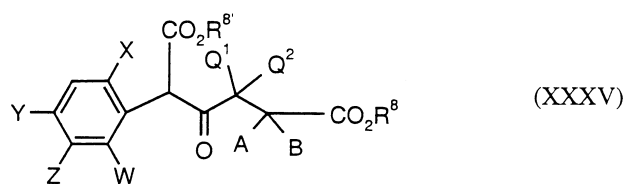
일반식 (XXXIV)의 5-아릴-4-케토카복실산은 신규하지만, 원칙적으로 공지된 방법으로 제조될 수 있다(제조실시에 참조):



상기 식에서, A, B, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같다.

일반식 (XXXIV)의 5-아릴-4-케토카복실산은, 예를 들어 일반식 (XXXV)의 2-페닐-3-옥소-아디프산 에스테르를, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 염기 또는 산의 존재하에서 탈카복실화시킴으로써 수득된다(참조예:

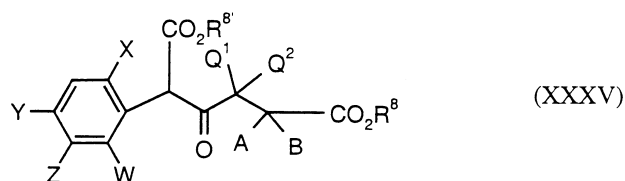
Organikum, 15th edition, Berlin, 1977, p 519-521):



상기 식에서, A, B, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같으며,

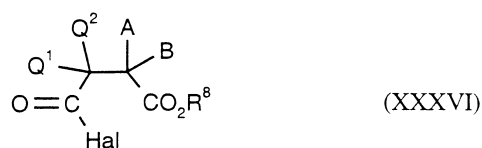
R⁸ 및 R^{8'}는 각각 알킬(특히 C₁-C₈-알킬)을 나타내며, 일반식 (XXXVII)의 화합물이 사용되는 경우 R⁸은 수소를 나타낸다.

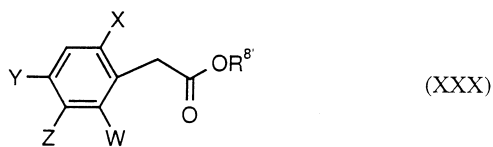
일반식 (XXXV)의 화합물은 신규하다:



상기 식에서, A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z, R⁸ 및 R^{8'}는 각각 상기 정의된 바와 같으며, 일반식 (XXXVII)의 화합물이 사용되는 경우 R⁸은 수소를 나타낸다.

일반식 (XXXV)의 화합물은, 예를 들어 일반식 (XXXVI)의 디카복실산 모노에스테르 클로라이드 또는 일반식 (XXXVII)의 카복실산 무수물을 희석제의 존재하 및 염기의 존재하에서 일반식 (XXX)의 페닐아세트산 에스테르로 아실화시킴으로써 수득된다(참조예: M.S. Chambers, E.J. Thomas, D.J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228, 및 제조실시에):





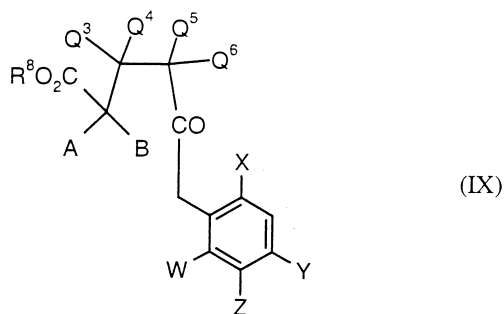
상기 식에서,

A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z, R⁸ 및 R^{8'} 는 각각 상기 정의된 바와 같으며,

Hal 은 염소 또는 브롬을 나타낸다.

일반식 (XXXVI) 및 (XXXVII)의 화합물의 일부는 유기화학의 공지된 화합물이고/이거나, 원칙적으로 공지된 방법에 의해 간단한 방식으로 제조할 수 있다.

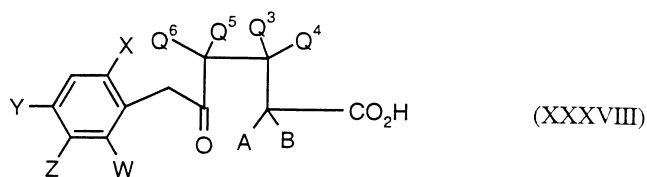
상기 방법 (G)에서 출발 물질로 필요한 일반식 (IX)의 화합물은 신규하다:



상기 식에서, A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z 및 R⁸ 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

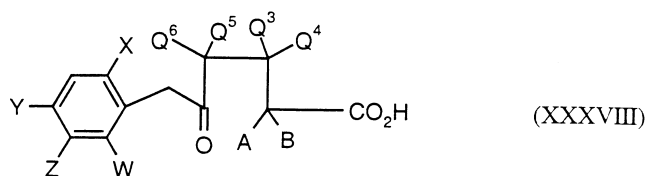
이들은 원칙적으로 공지된 방법으로 제조될 수 있다.

일반식 (IX)의 6-아릴-5-케토카복실산 에스테르는, 예를 들어 일반식 (XXXVIII)의 6-아릴-5-케토카복실산을 에스테르 화시킴으로써 수득된다(참조예: Organikum, 15th edition, Berlin, 1977, p. 499):



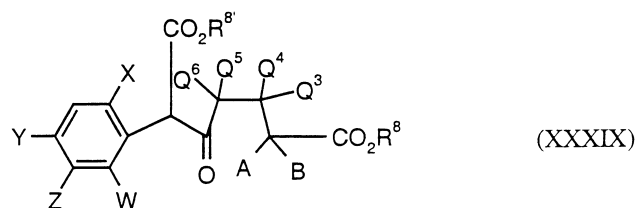
상기 식에서, A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y 및 Z 는 각각 상기에서 언급한 의미를 갖는다.

일반식 (XXXVIII)의 6-아릴-5-케토카복실산은 신규하다:



상기 식에서, A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같다.

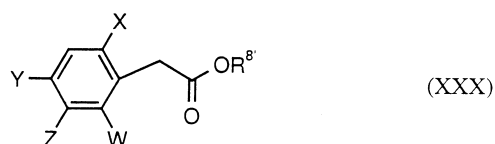
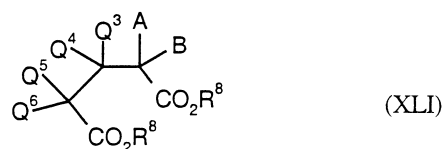
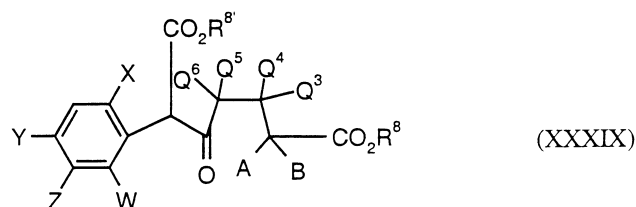
이들은 원칙적으로 공지된 방법에 의해, 예를 들면 일반식 (XXXIX)의 치환된 2-페닐-3-옥소-헵탄디오산 에스테르를, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 염기 또는 산의 존재하에서 가수분해시키고, 탈카복실화시킴으로써 수득된다 (참조예: Organikum, 15th edition, Berlin, 1977, p 519-521):



상기 식에서, A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같으며,

R⁸ 및 R^{8'}는 각각 알킬(바람직하게는 C₁-C₆-알킬)을 나타낸다.

일반식 (XXXIX)의 화합물은 신규하며, 일반식 (XLI)의 디카복실산 무수물을 희석제의 존재하 및 염기의 존재하에서 일반식 (XXX)의 치환된 페닐아세트산 에스테르와 축합시킴으로써 수득된다:

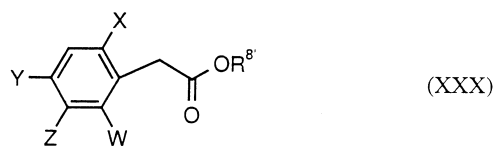


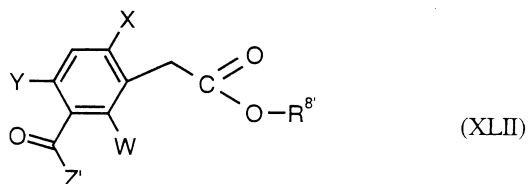
상기 식에서, A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z, R⁸ 및 R^{8'}는 각각 상기 정의된 바와 같다.

일반식 (XLI)의 화합물의 일부는 공지되어 있고/있거나, 공지된 방법으로 제조될 수 있다.

일반식 (XXX)의 화합물은 방법 (B)의 경우에 있어서 전구체로 이미 기술되었거나 하기 방법 (P) 및 (Q)에 예로서 명백히 기술된다.

(P) 즉, 또한 일반식 (XXX)의 화합물은 일반식 (XLII)의 아실페닐아세트산 에스테르를, 경우에 따라 용매의 존재하에 적합한 환원제(예를 들어, Zn/HCl, 수소/촉매, 히드라진/염기)로 환원시킴으로써 수득된다:





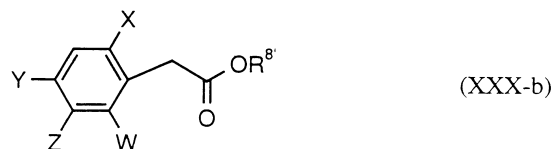
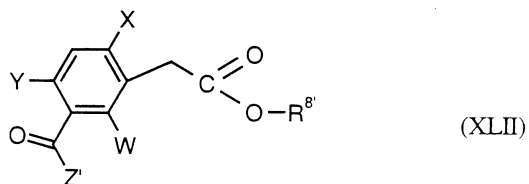
상기 식에서,

W, X, Y, Z 및 R^{8'} 는 각각 상기 정의된 바와 같으며,

Z' 는 알킬을 나타낸다.

일반식 (XLII)의 화합물은 신규하다.

일반식 (XLII)의 화합물은 일반식 (XXX-b)의 페닐아세트산 에스테르를 경우에 따라 용매의 존재하에 카보닐 클로라이드 또는 카복실산 무수물을 사용하여 산 또는 루이스 산(예를 들어 염화알루미늄, 브롬화철(III))의 존재하에서 프리델-크라프트(Friedel-Crafts) 아실화시킴으로서 수득된다:



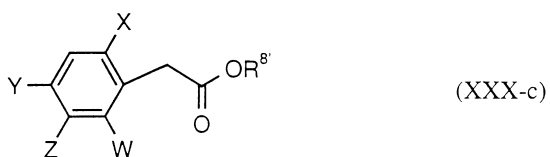
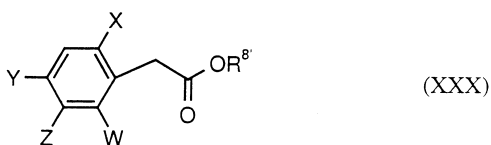
상기 식에서,

W, X, Y, Z' 및 R^{8'} 는 각각 상기 정의된 바와 같으며,

Z 는 수소를 나타낸다.

화합물(XXX-b)은 공지되었거나 서두에 인용된 문헌에 기술된 방법에 의해 제조될 수 있다.

(Q) 또한, 일반식 (XXX)의 페닐아세트산 에스테르는 일반식 (XXX-c)의 페닐아세트산 에스테르를 용매의 존재하 및 환원제(예를 들어 팔라듐 또는 백금과 같은 귀금속 촉매의 존재하에 수소)의 존재하에 탈할로겐화시킴으로써 수득된다:



상기 식에서,

X 는 알킬을 나타내고,

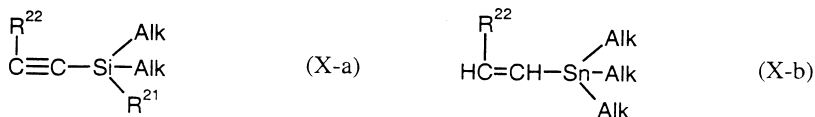
R^{8'}는 알킬을 나타내며,

W, Y 및 Z 는 식 (XXX)에서는 수소 또는 알킬을 나타내고, 식 (XXX-c)에서는 W 및 Z 는 수소 및 알킬 이외에 염소 및 브롬을 나타낼 수 있다.

일반식 (XXX-c)의 화합물은 서두에 인용된 특허 출원으로부터 공지되어 있거나 여기에 기술된 방법에 의해 제조될 수 있다.

A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W', X', Y' 및 Z' 가 각각 상기 정의된 바와 같은, 상기 방법 (H)에 출발 물질로서 필요한 일반식 (I-1'-a) 내지 (I-7'-a)의 화합물의 일부는 공지되어 있거나(WO 96/35 664, WO 97/02 243, WO 97/01535, WO 97/36868, WO 98/05638), 여기에 기술된 방법에 의해 제조될 수 있다.

일반식 (X-a) 및 (X-b)의 커플링제의 일부는 상업적으로 입수가가능하거나 일반적으로 공지된 방법에 의해 간단한 방식으로 제조될 수 있다:



상기 식에서, Alk, R²¹ 및 R²² 는 각각 상기 정의된 바와 같다.

본 발명에 따른 방법 (I), (J), (K), (L), (M), (N) 및 (O)를 수행하는데 출발 물질로 추가로 필요한 일반식 (XI)의 산 할라이드, 일반식 (XII)의 카복실산 무수물, 일반식 (XIII)의 클로로포름산 에스테르 또는 클로로포름산 티오에스테르, 일반식 (XIV)의 클로로모노티오포름산 에스테르 또는 클로로디티오포름산 에스테르, 일반식 (XV)의 설폰릴 클로라이드, 일반식 (XVI)의 인 화합물, 일반식 (XVII) 및 (XVIII)의 금속 수산화물, 금속 알콕사이드 또는 아민, 일반식 (XIX)의 이소시아네이트 및 일반식 (XX)의 카바모일 클로라이드는 유기 또는 무기 화학에 일반적으로 공지된 화합물이다.

또한, 일반식 (V), (VII), (XI) 내지 (XX), (XXI), (XXIV), (XXVI), (XXVIII), (XXIX), (XXXI), (XXXVI), (XXXVII) 및 (XLI)의 화합물은 상기 서두에 인용된 특허 출원들로부터 공지되어 있고/있거나 여기에 제시된 방법에 의해 제조될 수 있다.

방법 (A)는 A, B, D, W, X, Y, Z 및 R⁸ 이 각각 상기 정의된 바와 같은 일반식 (II)의 화합물을 염기의 존재하에서 분자내 축합시킴을 특징으로 한다.

본 발명에 따른 방법 (A)에 적합한 희석제는 모든 불활성 유기 용매이다. 바람직한 것으로 탄화수소, 예를 들어, 톨루엔 및 크실렌, 에테르, 예를 들어, 디부틸 에테르, 테트라하이드로푸란, 디옥산, 글리콜 디메틸 에테르 및 디글리콜 디메틸 에테르, 추가로 극성 용매, 예를 들어, 디메틸 설폭사이드, 설포란, 디메틸포름아미드 및 N-메틸피롤리돈, 및 또한 알콜, 예를 들어, 메탄올, 에탄올, 프로판올, 이소-프로판올, 부탄올, 이소-부탄올 및 t-부탄올을 사용하는 것이 제시된다.

본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는데 적합한 염기(탈양성자화제)는 통상의 모든 양성자 수용체이다. 바람직한 것으로 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 산화물, 수산화물 및 탄산염, 예를 들어, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 산화마그네슘, 산화칼슘, 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산칼슘을 사용하는 것이 제시되며, 또한 이들은 상-전이 촉매, 예를 들어, 트리에틸벤질암모늄 클로라이드, 테트라부틸암모늄 브로마이드, 아도젠 464(=메틸트리알킬(C₈-C₁₀)암모늄 클로라이드) 또는 TDA 1(=트리스(메톡시에톡시에틸)-아민)의 존재하에서 사용될 수 있다. 알칼리 금속, 예를 들어, 나트륨 및 칼륨이 또한 사용될 수 있다. 또한, 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 아마이드 및 수소화물, 예를 들어, 소듐 아마이드, 수소화나트륨 및 수소화칼슘, 및 추가로 또한 알칼리 금속 알콕사이드, 예를 들어, 소듐 메톡사이드, 소듐 에톡사이드 및 포타슘 t-부톡사이드가 사용될 수 있다.

본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는 경우, 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로 반응은 0 내지 250 °C, 바람직하게는 50 내지 150 °C 사이의 온도에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (A)는 일반적으로 대기압하에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는 경우, 일반식 (II)의 반응성분 및 탈양성자화 염기는 일반적으로 대략 동물량의 2 배량으로 사용된다. 그러나, 한 성분 또는 다른 성분을 대과량(3몰 이하)으로 사용하는 것도 가능하다.

방법 (B)는 A, B, W, X, Y, Z 및 R⁸이 각각 상기 정의된 바와 같은 일반식 (III)의 화합물을 희석제의 존재하 및 염기의 존재하에서 분자내 축합시킴을 특징으로 한다.

본 발명에 따른 방법 (B)에 적합한 희석제는 모든 불활성 유기 용매이다. 바람직한 것으로 탄화수소, 예를 들어, 톨루엔 및 크실렌, 또한 에테르, 예를 들어, 디부틸 에테르, 테트라하이드로푸란, 디옥산, 글리콜 디메틸 에테르 및 디글리콜 디메틸 에테르, 추가로 극성 용매, 예를 들어, 디메틸 설펝사이드, 설펝란, 디메틸포름아미드 및 N-메틸피롤리돈 및 또한 알콜, 예를 들어, 메탄올, 에탄올, 프로판올, 이소-프로판올, 부탄올, 이소-부탄올 및 t-부탄올을 사용하는 것이 제시된다.

본 발명에 따른 방법 (B)를 수행하는데 적합한 염기(탈양성자화제)는 통상의 모든 양성자 수용체이다. 바람직한 것으로 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 산화물, 수산화물 및 탄산염, 예를 들어 수산화나트륨, 수산화칼륨, 산화마그네슘, 산화칼슘, 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산칼슘을 사용하는 것이 제시되며, 또한 이들은 각각 상 전이 촉매, 예를 들어, 트리에틸벤질암모늄 클로라이드, 테트라부틸암모늄 브로마이드, 아도젠 464(=메틸트리알킬(C₈-C₁₀)암모늄 클로라이드) 또는 TDA 1(=트리스(메톡시에톡시에틸)-아민)의 존재하에서 사용될 수 있다. 알칼리 금속, 예를 들어, 나트륨 및 칼륨이 또한 사용될 수 있다. 또한, 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 아미드 및 수소화물, 예를 들어, 소듐 아미드, 수소화나트륨 및 수소화칼슘, 및 또한 알칼리 금속 알콕사이드, 예를 들어, 소듐 메톡사이드, 소듐 에톡사이드 및 포타슘 t-부톡사이드가 사용될 수 있다.

본 발명에 따른 방법 (B)를 수행하는 경우 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 반응은 0 내지 250 °C, 바람직하게는 50 내지 150 °C 사이의 온도에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (B)는 일반적으로 대기압하에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (B)를 수행하는 경우, 일반식 (III)의 반응 성분 및 탈양성자화 염기는 일반적으로 대략 동물량으로 사용된다. 그러나, 한 반응 성분 또는 다른 반응 성분을 대과량(3몰 이하)으로 사용하는 것도 가능하다.

방법 (C)는 A, B, V, W, X, Y, Z 및 R⁸이 각각 상기 정의된 바와 같은 일반식 (IV)의 화합물을 산의 존재하, 및 경우에 따라 희석제의 존재하에서 분자내 폐환시킴을 특징으로 한다.

본 발명에 따른 방법 (C)에 적합한 희석제는 모든 불활성 유기 용매이다. 바람직한 것으로 탄화수소, 예를 들어, 톨루엔 및 크실렌, 또한 할로젠화 탄화수소, 예를 들어, 디클로로메탄, 클로로포름, 에틸렌 클로라이드, 클로로벤젠, 디클로로벤젠, 및 추가로 극성 용매, 예를 들어, 디메틸 설펝사이드, 설펝란, 디메틸포름아미드 및 N-메틸피롤리돈을 사용하는 것이 제시된다. 알콜, 예를 들어, 메탄올, 에탄올, 프로판올, 이소-프로판올, 부탄올, 이소-부탄올 및 t-부탄올을 사용하는 것이 또한 가능하다.

경우에 따라 사용된 산이 또한 희석제로 제공될 수도 있다.

본 발명에 따른 방법 (C)에 적합한 산은 통상의 모든 무기 및 유기 산, 예를 들어, 할로젠화수소산, 황산, 알킬-, 아릴- 및 할로알킬설펝산이며, 특히 할로젠화 알킬카복실산, 예를 들어, 트리플루오로아세트산이다.

본 발명에 따른 방법 (C)를 수행하는 경우 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 반응은 0 내지 250 °C, 바람직하게는 50 내지 150 °C 사이의 온도에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (C)는 일반적으로 대기압하에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (C)를 수행하는 경우, 일반식 (IV)의 반응 성분 및 산은 예를 들어 동물량으로 사용된다. 그러나, 경우에 따라 산을 용매 또는 촉매로 사용하는 것이 또한 가능하다.

본 발명에 따른 방법 (D) 는 일반식 (V)의 카보닐 화합물 또는 일반식 (V-a)의 그의 에놀 에테르를 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 수용체의 존재하에서 일반식 (VI)의 케텐산 할라이드와 반응시킴을 특징으로 한다.

본 발명에 따른 방법 (D)에 적합한 희석제는 모든 불활성 유기 용매이다. 바람직한 것으로 탄화수소, 예를 들어, 톨루엔 및 크실렌, 또한 에테르, 예를 들어, 디부틸 에테르, 글리콜 디메틸 에테르 및 디글리콜 디메틸 에테르, 및 추가로 극성 용매, 예를 들어, 디메틸 설펍사이드, 설펴란, 디메틸포름아미드 또는 N-메틸피롤리돈을 사용하는 것이 제시된다.

본 발명에 따른 방법 (D)를 수행하는데 적합한 산 수용체는 통상의 모든 산 수용체이다.

바람직한 것으로 3급 아민, 예를 들어, 트리에틸아민, 피리딘, 디아자비사이클로옥탄(DABCO), 디아자비사이클로운데센(DBU), 디아자비사이클로노넨(DBN), 휘니히(Huenig) 염기 또는 N,N-디메틸-아닐린을 사용하는 것이 제시된다.

본 발명에 따른 방법 (D)를 수행하는 경우, 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변화될 수 있다. 유리하게, 반응은 0 내지 250 °C, 바람직하게는 50 내지 220 °C 사이의 온도에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (D)는 유리하게는 대기압하에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (D)를 수행하는 경우, 일반식 (V) 및 (VI)의 반응 성분(여기에서, A, D, W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같고, Hal 은 할로젠을 나타낸다) 및, 경우에 따라 산 수용체는 일반적으로 대략 동몰량으로 사용된다. 그러나, 한 성분 또는 다른 반응 성분을 대과량(5몰 이하)으로 사용하는 것이 또한 가능하다.

본 발명에 따른 방법 (E) 는 일반식 (VII)의 티오아미드를 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 수용체의 존재하에서 일반식 (VI)의 케텐산 할라이드와 반응시킴을 특징으로 한다.

본 발명에 따른 방법 (E)에 적합한 희석제는 모든 불활성 유기 용매이다. 바람직한 것으로 탄화수소, 예를 들어, 톨루엔 및 크실렌, 또한 에테르, 예를 들어, 디부틸 에테르, 글리콜 디메틸 에테르 및 디글리콜 디메틸 에테르, 및 추가로 극성 용매, 예를 들어, 디메틸 설펍사이드, 설펴란, 디메틸포름아미드 및 N-메틸피롤리돈을 사용하는 것이 제시된다.

본 발명에 따른 방법 (E)를 수행하는데 적합한 산 수용체는 통상의 모든 산 수용체이다.

바람직한 것으로 3급 아민, 예를 들어, 트리에틸아민, 피리딘, 디아자비사이클로옥탄(DABCO), 디아자비사이클로운데센(DBU), 디아자비사이클로노넨(DBN), 휘니히 염기 및 N,N-디메틸-아닐린을 사용하는 것이 제시된다.

본 발명에 따른 방법 (E)를 수행하는 경우, 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변화될 수 있다. 유리하게, 반응은 0 내지 250 °C, 바람직하게는 20 내지 220 °C 사이의 온도에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (E)는 유리하게는 대기압하에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (E)를 수행하는 경우, 일반식 (VII) 및 (VI)의 반응 성분(여기에서, A, W, X, Y 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같고, Hal 은 할로젠을 나타낸다) 및, 경우에 따라 산 수용체는 일반적으로 대략 동몰량으로 사용된다. 그러나, 한 성분 또는 다른 반응 성분을 대과량(5몰 이하)으로 사용하는 것이 또한 가능하다.

방법 (F)는 A, B, Q¹, Q², W, Y, Z 및 R⁸ 이 각각 상기 정의된 바와 같은 일반식 (VIII)의 화합물을 염기의 존재하에서 분자 내 축합시킴을 특징으로 한다.

본 발명에 따른 방법 (F)에 적합한 희석제는 반응 성분에 불활성인 모든 유기 용매이다. 바람직한 것으로 탄화수소, 예를 들어, 톨루엔 및 크실렌, 에테르, 예를 들어, 디부틸 에테르, 테트라하이드로퓨란, 디옥산, 글리콜 디메틸 에테르 및 디글리콜 디메틸 에테르, 추가로 극성 용매, 예를 들어, 디메틸 설펍사이드, 설펴란, 디메틸포름아미드 및 N-메틸피롤리돈을 사용하는 것이 제시된다. 알콜, 예를 들어, 메탄올, 에탄올, 프로판올, 이소-프로판올, 부탄올, 이소-부탄올 및 t-부탄올을 사용하는 것이 또한 가능하다.

본 발명에 따른 방법 (F)를 수행하는데 적합한 염기(탈양성자화제)는 통상의 모든 양성자 수용체이다. 바람직한 것으로 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 산화물, 수산화물 및 탄산염, 예를 들어, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 산화마그네슘, 산화칼슘, 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산칼슘을 사용하는 것이 제시되며, 이들은 상 전이 촉매, 예를 들어, 트리에틸벤질암모늄 클로라이드, 테트라부틸암모늄 브로마이드, 아도겐 464(=메틸트리알킬(C₈-C₁₀)암모늄 클로라이드) 또는 TDA 1(=트리스(메톡시에톡시에틸)-아민)의 존재하에서 사용될 수 있다. 알칼리 금속, 예를 들어, 나트륨 또는 칼륨이 또한 사용될 수 있다. 또한, 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 아미드 및 수소화물, 예를 들어, 소듐 아미드, 수소화나트륨 및 수소화칼슘, 및 추가로 또한 알칼리 금속 알콕사이드, 예를 들어, 소듐 메톡사이드, 소듐 에톡사이드 및 포타슘 t-부톡사이드가 사용될 수 있다.

본 발명에 따른 방법 (F)를 수행하는 경우, 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로 반응은 -75 내지 250 °C, 바람직하게는 -50 내지 150 °C 사이의 온도에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (F)는 일반적으로 대기압하에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (F)를 수행하는 경우, 일반식 (VIII)의 반응성분 및 탈양성자화 염기는 일반적으로 대략 동몰량으로 사용된다. 그러나, 한 성분 또는 다른 성분을 대과량(3몰 이하)으로 사용하는 것이 또한 가능하다.

방법 (G)는 A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z 및 R⁸이 각각 상기 정의된 바와 같은 일반식 (IX)의 화합물을 염기의 존재하에서 분자내 축합시킴을 특징으로 한다.

본 발명에 따른 방법 (G)에 적합한 희석제는 반응 성분에 불활성인 모든 유기 용매이다. 바람직한 것으로 탄화수소, 예를 들어, 톨루엔 및 크실렌, 에테르, 예를 들어, 디부틸 에테르, 테트라하이드로푸란, 디옥산, 글리콜 디메틸 에테르 및 디글리콜 디메틸 에테르, 추가로 극성 용매, 예를 들어, 디메틸 설폭사이드, 설포란, 디메틸포름아미드 및 N-메틸피롤리돈을 사용하는 것이 제시된다. 알콜, 예를 들어, 메탄올, 에탄올, 프로판올, 이소-프로판올, 부탄올, 이소-부탄올 및 t-부탄올을 사용하는 것이 또한 가능하다.

본 발명에 따른 방법 (G)를 수행하는데 적합한 염기(탈양성자화제)는 통상의 모든 양성자 수용체이다.

바람직한 것으로 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 산화물, 수산화물 및 탄산염, 예를 들어, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 산화마그네슘, 산화칼슘, 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산칼슘을 사용하는 것이 제시되며, 이들은 또한 상 전이 촉매, 예를 들어, 트리에틸벤질암모늄 클로라이드, 테트라부틸암모늄 브로마이드, 아도겐 464(=메틸트리알킬(C₈-C₁₀)암모늄 클로라이드) 또는 TDA 1(=트리스(메톡시에톡시에틸)-아민)의 존재하에서 사용될 수 있다. 알칼리 금속, 예를 들어, 나트륨 및 칼륨이 또한 사용될 수 있다. 또한, 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 아미드 및 수소화물, 예를 들어, 소듐 아미드, 수소화나트륨 및 수소화칼슘, 및 추가로 또한 알칼리 금속 알콕사이드, 예를 들어, 소듐 메톡사이드, 소듐 에톡사이드 및 포타슘 t-부톡사이드가 사용될 수 있다.

본 발명에 따른 방법 (G)를 수행하는 경우, 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로 반응은 0 내지 250 °C, 바람직하게는 50 내지 150 °C 사이의 온도에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (G)는 일반적으로 대기압하에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (G)를 수행하는 경우, 일반식 (IX)의 반응성분 및 탈양성자화 염기는 일반적으로 대략 동몰량으로 사용된다. 그러나, 한 성분 또는 다른 성분을 대과량(3몰 이하)으로 사용하는 것이 또한 가능하다.

본 발명에 따른 방법 (H)를 수행하는 경우, 팔라듐(0) 복합체가 촉매로서 적합하다. 바람직한 것으로 예를 들어, 테트라키스(트리페닐포스핀)팔라듐 또는 비스-(트리페닐포스핀)팔라듐 디클로라이드/트리페닐포스핀이 제시된다.

본 발명에 따른 방법 (H)를 수행하는데 적합한 산 수용체는 무기 또는 유기 염기이다. 이들로는 바람직하게는 알칼리 토금속 또는 알칼리 금속 수산화물, 아세테이트, 탄산염 또는 중탄산염, 예를 들어 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화바륨 또는 수산화암모늄, 소듐 아세테이트, 포타슘 아세테이트, 칼슘 아세테이트 또는 암모늄 아세테이트, 탄산나트륨, 탄산칼륨 또는 탄산암모늄, 중탄산나트륨 또는 중탄산칼륨, 알칼리 금속 플루오라이드, 예를 들어 불화세슘, 및 또한 트리메틸아민, 트

리에틸아민, 트리부틸아민, N,N-디메틸아닐린, N,N-디메틸벤질아민, 피리딘, N-메틸피페리딘, N-메틸모르폴린, N,N-디메틸아미노피리딘, 디아자비사이클로옥탄(DABCO), 디아자비사이클로노넨(DBN) 또는 디아자비사이클로운데센(DBU)과 같은 삼급 아민이 포함된다.

본 발명에 따른 방법 (H)를 수행하는데 적합한 희석제는 물, 유기 용매 및 이들의 혼합물이다. 이들로는 지방족, 지환식 또는 방향족 탄화수소, 예를 들어, 석유 에테르, 헥산, 헵탄, 사이클로헥산, 메틸 사이클로헥산, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 데칼린; 할로젠화 탄화수소, 예를 들어 클로로벤젠, 디클로로벤젠, 메틸렌 클로라이드, 클로로포름, 사염화탄소, 디클로로에탄, 트리클로로에탄 또는 테트라클로로에틸렌; 에테르, 예를 들어, 디에틸 에테르, 디이소프로필 에테르, 메틸 t-부틸 에테르, 에틸 t-아밀 에테르, 디옥산, 테트라하이드로푸란, 1,2-디메톡시에탄, 1,2-디에톡시에탄, 디에틸렌 글리콜 디메틸 에테르 또는 아니솔; 알콜, 예를 들어 메탄올, 에탄올, n-또는 i-프로판올, n-, i-, s- 또는 t-부탄올, 에탄디올, 프로판-1,2-디올, 에톡시에탄올, 메톡시에탄올, 디에틸렌 글리콜 모노메틸 에테르, 디에틸렌 글리콜 모노에틸 에테르; 물이 포함된다.

본 발명에 따른 방법 (H)의 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로 반응은 0 내지 +140 °C, 바람직하게는 50 내지 +100 °C 사이의 온도에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (H)를 수행하는 경우, 일반식 (X-aI) 또는 (X-b)의 커플링제 및 일반식 (I-1'-a) 내지 (I-7'-a)의 화합물은 1:1 내지 5:1, 바람직하게는 1:1 내지 2:1의 몰비로 사용된다. 일반적으로, 일반식 (I-1'-a) 내지 (I-7'-a)의 화합물 1 몰당 0.005 내지 0.5 몰, 바람직하게는 0.01 내지 0.1 몰의 촉매가 사용된다. 염기는 통상 과량으로 사용된다.

방법 (I-α)는 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XI)의 카보닐 할라이드와 반응시킴을 특징으로 한다.

본 발명에 따른 방법 (I-α)에 적합한 희석제는 산 할라이드에 대해 불활성인 모든 용매이다. 바람직한 것으로 탄화수소, 예를 들어, 벤진, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 테트라린, 또한 할로젠화 탄화수소, 예를 들어, 메틸렌 클로라이드, 클로로포름, 사염화탄소, 클로로벤젠 및 o-디클로로벤젠, 및 또한 케톤, 예를 들어, 아세톤 및 메틸 이소프로필 케톤, 추가로 에테르, 예를 들어, 디에틸 에테르, 테트라하이드로푸란 및 디옥산, 카복실산 에스테르, 예를 들어, 에틸 아세테이트, 강한 극성 용매, 예를 들어, 디메틸설폭사이드 및 설포란을 사용하는 것이 제시된다. 산 할라이드가 가수분해에 대하여 안정한 경우, 반응은 또한 물의 존재하에서 수행될 수도 있다.

본 발명에 따른 방법 (I-α)의 반응에 적합한 산 결합제는 통상의 모든 산 수용체이다. 바람직한 것으로 3급 아민, 예를 들어, 트리에틸아민, 피리딘, 디아자비사이클로옥탄(DABCO), 디아자비사이클로운데센(DBU), 디아자비사이클로노넨(DBN), 휘니히 염기 및 N,N-디메틸-아닐린, 추가로 알칼리 토금속 산화물, 예를 들어, 산화마그네슘 및 산화칼슘, 또한 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 탄산염, 예를 들어, 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산칼슘, 및 또한 알칼리 금속 수산화물, 예를 들어, 수산화나트륨 및 수산화칼륨을 사용하는 것이 제시된다.

본 발명에 따른 방법 (I-α)에서 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 반응은 -20 내지 +150 °C, 바람직하게는 0 내지 100 °C 사이의 온도에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (I-α)를 수행하는 경우, 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 출발 물질 및 일반식 (XI)의 카보닐 할라이드는 각 경우 일반적으로 대략 동등량으로 사용된다. 그러나, 카보닐 할라이드를 대과량(5몰 이하)으로 사용하는 것이 또한 가능하다. 후처리는 통상의 방법으로 수행된다.

방법 (I-β)는 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물을, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XII)의 카복실산 무수물과 반응시킴을 특징으로 한다.

본 발명에 따른 방법 (I-β)에 바람직한 희석제는 산 할라이드를 사용하는 경우 또한 바람직한 희석제이다. 또한, 과량으로 사용된 카복실산 무수물은 동시에 희석제로서 작용할 수 있다.

방법 (I-β)에서, 경우에 따라 첨가되는 산 결합제는 바람직하게는 산 할라이드를 사용한 경우 또한 바람직한 산 결합제이다.

본 발명에 따른 방법 (I-β)에서 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 반응은 편리하게는 -20 내지 +150 °C, 바람직하게는 0 내지 100 °C 사이의 온도에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (I-β)를 수행하는 경우, 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 출발 물질 및 일반식 (XII)의 카복실산 무수물은 각 경우에 일반적으로 대략 동등량으로 사용된다. 그러나, 카복실산 무수물을 대과량(5몰 이하)으로 사용하는 것이 또한 가능하다. 후처리는 통상의 방법으로 수행된다.

일반적으로, 희석제 및 과량의 카복실산 무수물과 또한 생성된 카복실산을 증류에 의해 또는 유기 용매나 물로 세척하여 제거시키는 단계가 이용된다.

방법 (J)는 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XV)의 클로로포름산 에스테르 또는 클로로포름산 티올 에스테르와 반응시킴을 특징으로 한다.

본 발명에 따른 방법 (J)에 적합한 산 결합제는 통상의 모든 산 수용체이다. 바람직한 것으로 3급 아민, 예를 들어, 트리에틸아민, 피리딘, DABCO, DBU, DBA, 휘니히 염기 및 N,N-디메틸-아닐린, 추가로 알칼리 토금속 산화물, 예를 들어, 산화마그네슘 및 산화칼슘, 알칼리 금속 탄산염 및 알칼리 토금속 탄산염, 예를 들어, 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산칼슘, 및 또한 알칼리 금속 수산화물, 예를 들어, 수산화나트륨 및 수산화칼륨을 사용하는 것이 제시된다.

본 발명에 따른 방법 (J)에 적합한 희석제는 클로로포름산 에스테르 또는 클로로포름산 티올 에스테르에 불활성인 모든 용매이다. 바람직한 것으로 탄화수소, 예를 들어, 벤진, 벤젠, 톨루엔, 크실렌, 및 테트라린, 추가로 할로겐화 탄화수소, 예를 들어, 메틸렌 클로라이드, 클로로포름, 사염화탄소, 클로로벤젠 및 o-디클로로벤젠, 케톤, 예를 들어, 아세톤 및 메틸 이소프로필 케톤, 에테르, 예를 들어, 디에틸 에테르, 테트라하이드로푸란 및 디옥산, 또한 카복실산 에스테르, 예를 들어, 에틸 아세테이트, 및 또한 강한 극성 용매, 예를 들어, 디메틸 설펍사이드 및 설펍란을 사용하는 것이 또한 사용된다.

본 발명에 따른 방법 (J)를 수행하는 경우, 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 반응을 희석제 및 산 결합제의 존재하에서 수행하는 경우, 반응온도는 일반적으로 -20 내지 +100 °C, 바람직하게는 0 내지 50 °C 사이이다.

본 발명에 따른 방법 (J)는 일반적으로 대기압하에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (J)를 수행하는 경우, 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 출발 물질 및 일반식 (XIII)의 적합한 클로로포름산 에스테르 또는 클로로포름산 티올 에스테르는 각 경우에 일반적으로 대략 동등량으로 사용된다. 그러나, 한 성분 또는 다른 성분을 대과량(2몰 이하)으로 사용하는 것도 가능하다. 후처리는 통상의 방법으로 수행된다. 일반적으로, 침전된 염을 제거하고 희석제를 탈거하여 잔류 반응 혼합물을 농축시킨다.

본 발명에 따른 방법 (K)은 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XIV)의 화합물과 반응시킴을 특징으로 한다.

제조 방법 (K)에서, 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 출발 물질 1 몰당 약 1 몰의 일반식 (XIV)의 클로로모노티오포름산 에스테르 또는 클로로디티오포름산 에스테르를 0 내지 120 °C, 바람직하게는 20 내지 60 °C에서 반응시킨다.

경우에 따라 첨가되는 적합한 희석제는 모든 불활성 극성 유기 용매, 예를 들어, 에테르, 아미드, 설펍, 설펍사이드, 및 할로게노알칸이다.

바람직한 것으로 디메틸설펍사이드, 테트라하이드로푸란, 디메틸포름아미드 또는 메틸렌 클로라이드를 사용하는 것이 제시된다.

바람직한 구체예에서, 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물의 에놀레이트 염을 강한 탈양성자화제, 예를 들어, 수소화나트륨 또는 포타슘 t-부톡사이드를 첨가하여 제조하는 경우, 추가의 산 결합제 첨가는 필요치 않다.

산 결합제를 사용하는 경우, 이들은 통상의 무기 또는 유기 염기, 예를 들어 수산화나트륨, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 피리딘 및 트리에틸아민이다.

반응은 대기압 또는 승압하에서 수행될 수 있으며, 바람직하게는 대기압하에서 수행된다. 후처리는 통상의 방법으로 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (L)은 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물을, 각 경우에 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XV)의 설폰닐 클로라이드와 반응시킴을 특징으로 한다.

제조 방법 (L)에서, 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 출발 물질 1 몰당 약 1 몰의 일반식 (XV)의 설폰닐 클로라이드를 -20 내지 150 °C, 바람직하게는 20 내지 70 °C에서 반응시킨다.

경우에 따라 첨가되는 적합한 희석제는 모든 불활성 극성 유기 용매, 예를 들어, 에테르, 아마이드, 니트릴, 설펜, 설폭사이드 또는 할로겐화 탄화수소, 예를 들어 메틸렌 클로라이드이다.

바람직한 것으로 디메틸설폭사이드, 테트라하이드로푸란, 디메틸포름아미드 또는 메틸렌 클로라이드를 사용하는 것이 제시된다.

바람직한 구체예에서, 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물의 에놀레이트 염을 강한 탈양성자화제(예를 들어, 수소화나트륨 또는 포타슘 t-부톡사이드)를 첨가하여 제조하는 경우, 추가의 산 결합제 첨가는 필요치 않다.

산 결합제를 사용하는 경우, 이들은 통상의 무기 또는 유기 염기, 예를 들어, 수산화나트륨, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 피리딘 및 트리에틸아민이다.

반응은 대기압 또는 승압하에서 수행될 수 있으며, 바람직하게는 대기압하에서 수행된다. 후처리는 통상의 방법으로 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (M)은 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물을, 각 경우에 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XVI)의 인 화합물과 반응시킴을 특징으로 한다.

제조 방법 (M)에서, 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물 1 몰당 1 내지 2몰, 바람직하게는 1 내지 1.3 몰의 일반식 (XVI)의 인 화합물을 -40 내지 150 °C, 바람직하게는 -10 내지 110 °C 사이의 온도에서 반응시켜 일반식 (I-1-e) 내지 (I-7-e)의 화합물을 수득한다.

경우에 따라 첨가되는 적합한 용매는 모든 불활성 극성 유기 용매, 예를 들어, 에테르, 아마이드, 니트릴, 알콜, 설파이드, 설펜, 설폭사이드 등이다.

바람직한 것으로 아세토니트릴, 디메틸 설폭사이드, 테트라하이드로푸란, 디메틸포름아미드 또는 메틸렌 클로라이드를 사용하는 것이 제시된다.

경우에 따라 첨가되는 적합한 산 결합제는 수산화물, 탄산염 또는 아민과 같은 통상의 무기 또는 유기 염기이다. 이들로는 예를 들어, 수산화나트륨, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 피리딘 및 트리에틸아민이 포함된다.

반응은 대기압 또는 승압하에서 수행될 수 있으며, 바람직하게는 대기압하에서 수행된다. 후처리는 유기화학의 통상의 방법에 따라 수행된다. 생성된 최종 생성물은 바람직하게는 결정화, 크로마토그래피 정제 또는 소위 "초기 증류법(incipient distillation)", 즉 감압하에서 휘발 성분을 제거하는 방법으로 정제된다.

방법 (N)은 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물을, 각 경우에 경우에 따라 희석제의 존재하에서 일반식 (XVII)의 금속 수산화물 또는 금속 알콕사이드, 또는 일반식 (XVIII)의 아민과 반응시킴을 특징으로 한다.

본 발명에 따른 방법 (N)에 바람직한 희석제는 에테르, 예를 들어, 테트라하이드로푸란, 디옥산 및 디에틸 에테르, 또는 알콜, 예를 들어, 메탄올, 에탄올 및 이소프로판올, 및 또한 물이다.

본 발명에 따른 방법 (N)은 일반적으로 대기압하에서 수행된다.

반응 온도는 일반적으로 -20 내지 100 °C, 바람직하게는 0 내지 50 °C 사이이다.

본 발명에 따른 방법 (O)는 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물을, 각 경우에 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 촉매의 존재하에서 일반식 (XIX)의 화합물과 반응시키거나(O-α), 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XX)의 화합물과 반응시킴을(P-β) 특징으로 한다.

제조 방법 (O-α)에서, 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 출발 물질 1 몰당 약 1 몰의 일반식 (XIX)의 이소시아네이트를 0 내지 100 °C, 바람직하게는 20 내지 50 °C에서 반응시킨다.

경우에 따라 첨가되는 적합한 희석제는 모든 불활성 유기 용매, 예를 들어, 에테르, 아미드, 니트릴, 설펜 또는 설폭사이드이다.

경우에 따라, 반응을 가속화시키기 위하여 촉매를 첨가할 수 있다. 매우 유리하게 사용되는 촉매는 유기 주석 화합물, 예를 들어, 디부틸주석 디라우레이트이다. 반응은 바람직하게는 대기압하에서 수행된다.

제조 방법 (O-β)에서, 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 출발 물질 1 몰당 약 1 몰의 일반식 (XX)의 카바모일 클로라이드를 -20 내지 150 °C, 바람직하게는 20 내지 70 °C에서 반응시킨다.

경우에 따라 첨가되는 적합한 희석제는 모든 불활성 극성 유기 용매, 예를 들어, 에테르, 아미드, 설펜, 설폭사이드 또는 할로젠화 탄화수소이다.

바람직한 것으로 디메틸설폭사이드, 테트라하이드로푸란, 디메틸포름아미드 또는 메틸렌 클로라이드를 사용하는 것이 제시된다.

바람직한 구체예에서, 일반식 (I-1-a) 내지 (I-7-a)의 화합물의 에놀레이트 염을 강한 탈양성자화제(예를 들어, 수소화나트륨 또는 포타슘 t-부톡사이드)를 첨가하여 제조하는 경우, 추가의 산 결합제 첨가는 필요치 않다.

산 결합제를 사용하는 경우, 이들은 통상의 무기 또는 유기 염기, 예를 들어, 수산화나트륨, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 트리에틸아민 또는 피리딘이다.

반응은 대기압 또는 승압하에서 수행될 수 있으며, 바람직하게는 대기압하에서 수행된다. 후처리는 통상의 방법으로 수행된다.

양호한 식물 내성 및 유리한 온혈 독성을 가진 활성 화합물은 농업, 임업, 저장품 및 물질의 보호 및 위생 분야에서 마주치게 되는 동물 해충, 특히 곤충, 거미류 및 선충을 구제하는데 적합하다. 이들은 작물 보호제로서 바람직하게 사용된다. 이들은 보통 정도로 민감하거나 내성인 종 및 모든 또는 일부의 발생 단계에 대하여 활성적이다. 상기에서 언급한 해충에는 다음의 것들이 포함된다:

쥐며느리(*Isopoda*)목, 예를 들어 오니스쿠스 아셀루스(*Oniscus asellus*), 아르마딜리디움 불가레(*Armadillidium vulgare*) 및 포르셀리오 스카베르(*Porcellio scaber*).

노래기(*Diplopoda*)목, 예를 들어 블라니울루스 구툴라투스(*Blaniulus guttulatus*).

지네(*Chilopoda*)목, 예를 들어 게오필루스 카르포파구스(*Geophilus carpophagus*) 및 스쿠티게라 종(*Scutigera spec.*).

심필라(*Symphyla*)목, 예를 들어 스쿠티게렐라 임마쿨라타(*Scutigerella immaculata*).

쫄(*Thysanura*)목, 예를 들어 레피스마 사카리나(*Lepisma saccharina*).

톡토기(*Collembola*)목, 예를 들어 오니키우루스 아르마투스(*Onychiurus armatus*).

메뚜기(*Orthoptera*)목, 예를 들어 아케타 도메스티쿠스(*Acheta domesticus*), 그릴로탈파 종(*Gryllotalpa spp.*), 로쿠스타 미그라토리아 미그라토리오이데스(*Locusta migratoria migratorioides*), 멜라노플루스 종(*Melanoplus spp.*) 및 쉬스토세르카 그레가리아(*Schistocerca gregaria*).

바퀴(*Blattaria*)목, 예를 들어 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 류코파에아 마데라에(*Leucophaea maderae*), 블라텔라 게르마니카(*Blattella germanica*).

집게벌레(*Dermaptera*)목, 예를 들어 포르피쿨라 아우리쿨라리아(*Forficula auricularia*).

흰개미(*Isoptera*)목, 예를 들어 레티쿨리테르메스 종(*Reticulitermes spp.*).

이(*Phthiraptera*)목, 예를 들어 페디쿨루스 후마누스 코르포리스(*Pediculus humanus corporis*), 하에마토피누스 종(*Haematopinus spp.*), 리노그나투스 종(*Linognathus spp.*), 트리코덱테스 종(*Trichodectes spp.*) 및 다말리니아 종(*Damalinia spp.*).

충채벌레(*Thysanoptera*)목, 예를 들어 헤르시노트리프스 페모랄리스(*Hercinothrips femoralis*), 트리프스 타바치(*Thrips tabaci*), 트리프스 팔미(*Thrips palmi*) 및 프랑클리니엘라 옥시덴탈리스(*Frankliniella occidentalis*).

이시아(*Heteroptera*)목, 예를 들어 유리가스테르 종(*Eurygaster spp.*), 디스테르쿠스 인테르메디우스(*Dysdercus intermedius*), 피에스마 쿠아드라타(*Piesma quadrata*), 시멕스 렉툴라리우스(*Cimex lectularius*), 로드니우스 프롤릭수스(*Rhodnius prolixus*) 및 트리야토마 종(*Triatoma spp.*).

매미(*Homoptera*)목, 예를 들어 알레우로데스 브라시카에(*Aleurodes brassicae*), 베미시아 타바치(*Bemisia tabaci*), 트리알레우로데스 바포라리오룸(*Trialeurodes vaporariorum*), 아피스 고시피(*Aphis gossypii*), 브레비코리네 브라시카에(*Brevicoryne brassicae*), 크립토미주스 리비스(*Cryptomyzus ribis*), 아피스 파바에(*Aphis fabae*), 아피스 포미(*Aphis pomi*), 에리오소마 라니게룸(*Eriosoma lanigerum*), 히알로프테루스 아룬디니스(*Hyalopterus arundinis*), 필록세라 바스타트릭스(*Phylloxera vastatrix*), 펌피구스 종(*Pemphigus spp.*), 마크로시폼 아베나에(*Macrosiphum avenae*), 미주스 종(*Myzus spp.*), 포로돈 휴물리(*Phorodon humuli*), 로팔로시폼 파디(*Rhopalosiphum padi*), 엠포아스카 종(*Empoasca spp.*), 유셀리스 빌로바투스(*Euscelis bilobatus*), 네포테틱스 신크티세프스(*Nephotettix cincticeps*), 레카니움 코르니(*Lecanium corni*), 사이세티아 올레아에(*Saissetia oleae*), 라오델팍스 스트리아텔루스(*Laodelphax striatellus*), nilaparvata 루겐스(*Nilaparvata lugens*), 아오니디엘라 아우란티(*Aonidiella aurantii*), 아스피디오투스 헤데라에(*Aspidiotus hederae*), 슈도코쿠스 종(*Pseudococcus spp.*) 및 프실라 종(*Psylla spp.*).

나비(*Lepidoptera*)목, 예를 들어 펙티노포라 고시피엘라(*Pectinophora gossypiella*), 부팔루스 피니아리우스(*Bupalus piniarius*), 케이마토비아 브루마타(*Cheimatobia brumata*), 리토콜레티스 블란카르텔라(*Lithocolletis blancardella*), 히포노메우타 파델라(*Hyponomeuta padella*), 플루텔라 크실로스텔라(*Plutella xylostella*), 말라코소마 네우스트리아(*Malacosoma neustria*), 유프록티스 크리스소레아(*Euproctis chrysorrhoea*), 리만트리아 종(*Lymantria spp.*), 부쿨라트릭스 투르베리엘라(*Bucculatrix thurberiella*), 필로크니스티스 시트렐라(*Phyllocnistis citrella*), 아그로티스 종(*Agrotis spp.*), 욱소아 종(*Euxoa spp.*), 펠티아 종(*Feltia spp.*), 에아리아스 인슐라나(*Earias insulana*), 헬리오티스 종(*Heliothis spp.*), 마메스트라 브라시카에(*Mamestra brassicae*), 파놀리스 플람메아(*Panolis flammea*), 스포도프테라 종(*Spodoptera spp.*), 트리코플루시아 니(*Trichoplusia ni*), 카르포카프사 포모넬라(*Carpocapsa pomonella*), 피에리스 종(*Pieris spp.*), 칠로 종(*Chilo spp.*), 피라우스타 누비랄리스(*Pyrausta nubilalis*), 에페스티아 쿠에니엘라(*Ephestia kuehniella*), 갈레리아 멜로넬라(*Galleria mellonella*), 티네올라 비셀리엘라(*Tineola bisselliella*), 티네아 펠리오넬라(*Tinea pellionella*), 호프만노필라 슈도스프레텔라(*Hofmannophila pseudospretella*), 카코에시아 포다나(*Cacoecia podana*), 카푸아 레티쿨라나(*Capua reticulana*), 코리스토네우라 푸미페라나(*Choristoneura fumiferana*), 클리시아 암비구엘라(*Clysia ambiguella*), 호모나 마그나니마(*Homona magnanima*), 토르트릭스 비리다나(*Tortrix viridana*), 크나팔로세루스 종(*Cnaphalocerus spp.*) 및 오울레마 오리자에(*Oulema oryzae*).

딱정벌레(*Coleoptera*)목, 예를 들어, 아노비움 푼크타툼(*Anobium punctatum*), 리조페르타 도미니카(*Rhizopertha dominica*), 브루키디우스 오브텍투스(*Bruchidius obtectus*), 아칸토스셀리데스 오브텍투스(*Acanthoscelides obtectus*), 힐로트루페스 바줄루스(*Hylotrupes bajulus*), 아겔라스티카 알니(*Agelastica alni*), 렙티노타르사 데셀리네아타(*Leptinotarsa decemlineata*), 파에돈 코클레아리아에(*Phaedon cochleariae*), 디아브로티카 종(*Diabrotica spp.*), 프실리오데스 크리스소세팔라(*Psylliodes chrysocephala*), 에필라크나 바리베스티스(*Epilachna varivestis*), 아토마리아 종(*Atomaria spp.*), 오리자에필루스 수리나멘시스(*Oryzaephilus surinamensis*), 안토노무스 종(*Anthonomus spp.*), 시토피루스 종(*Sitophilus spp.*), 오티오린쿠스 숄카투스(*Otiorrhynchus sulcatus*), 코스모폴리테스 소르디두스(*Cosmopolites sordidus*), 세우토린쿠스 아시밀리스(*Ceuthorrhynchus assimilis*), 히페라 포스티카(*Hypera postica*), 더메스테스 종(*Dermestes spp.*), 트로고더마 종(*Trogoderma spp.*), 안트레누스 종(*Anthrenus spp.*), 아타게누스 종

(*Attagenus spp.*), 릿투스 종(*Lyctus spp.*), 멜리게테스 아에네우스(*Meligethes aeneus*), 프티누스 종(*Ptinus spp.*), 니프투스 홀로레우쿠스(*Niptus hololeucus*), 기비움 프실로이테스(*Gibbium psyllodes*), 트리볼리움 종(*Tribolium spp.*), 테네브리오 몰리토르(*Tenebrio molitor*), 아그리오테스 종(*Agriotes spp.*), 코노테루스 종(*Conoderus spp.*), 멜로론타(*Melolontha melolontha*), 암피말론 솔스티티알리스(*Amphimallon solstitialis*), 코스텔리트라 제알란디카(*Costelytra zealandica*) 및 리소르호프투스 오리조필루스(*Lissorhoptus oryzophilus*).

벌(*Hymenoptera*)목, 예를 들어 디프리콘 종(*Diprion spp.*), 호플로캄파 종(*Hoplocampa spp.*), 라시우스 종(*Lasius spp.*), 모노모리움 파라오니스(*Monomorium pharaonis*) 및 베스파 종(*Vespa spp.*).

파리(*Diptera*)목, 예를 들어 아에테스 종(*Aedes spp.*), 아노펠레스 종(*Anopheles spp.*), 쿨렉스 종(*Culex spp.*), 드로소필라 멜라노가스터(*Drosophila melanogaster*), 무스카 종(*Musca spp.*), 판니아 종(*Fannia spp.*), 칼리포라 에리트로세팔라(*Calliphora erythrocephala*), 루실리아 종(*Lucilia spp.*), 크리소미아 종(*Chrysomyia spp.*), 쿠테레브라 종(*Cuterebra spp.*), 가스트로필루스 종(*Gastrophilus spp.*), 히포보스카 종(*Hyppobosca spp.*), 스토크시스 종(*Stomoxys spp.*), 오에스트루스 종(*Oestrus spp.*), 히포더마 종(*Hypoderma spp.*), 타바누스 종(*Tabanus spp.*), 탄니아 종(*Tannia spp.*), 비비오 호르툴라누스(*Bibio hortulanus*), 오시넬라 프리트(*Oscinella frit*), 포르비아 종(*Phorbia spp.*), 페고미아 히오스키아미(*Pegomyia hyoscyami*), 세라티티스 카피타타(*Ceratitis capitata*), 다쿠스 올레아에(*Dacus oleae*), 티폴라 팔루도사(*Tipula paludosa*), 힐레미아 종(*Hylemyia spp.*) 및 리비오미자 종(*Liriomyza spp.*).

벼룩(*Siphonaptera*)목, 예를 들어 크세노프실라 케오피스(*Xenopsylla cheopis*) 및 세라토피루스 종(*Ceratophyllus spp.*).

거미(*Arachnida*)목, 예를 들어 스코르피오 마우루스(*Scorpio maurus*), 라트로렉투스 막탄스(*Latrodectus mactans*), 아카루스 시로(*Acarus siro*), 아르가스 종(*Argas spp.*), 오르니토도로스 종(*Ornithodoros spp.*), 데르마니수스 갈리나에(*Dermanyssus gallinae*), 에리오피에스 리비스(*Eriophyes ribis*), 필로콥트루타 올레이보라(*Phyllocoptura oleivora*), 부필루스 종(*Boophilus spp.*), 리피세팔루스 종(*Rhipicephalus spp.*), 암블리움마 종(*Amblyomma spp.*), 히알롬마 종(*Hyalomma spp.*), 익소테스 종(*Ixodes spp.*), 프소로프테스 종(*Psoroptes spp.*), 코리오프테스 종(*Chorioptes spp.*), 사코프테스 종(*Sarcoptes spp.*), 타소네무스 종(*Tarsonemus spp.*), 브리오비아 프라에티오사(*Bryobia praetiosa*), 파노니쿠스 종(*Panonychus spp.*), 테트라니쿠스 종(*Tetranychus spp.*), 헤미타소네무스 종(*Hemitarsonemus spp.*) 및 브레비팔푸스 종(*Brevipalpus spp.*).

식물 기생성 선충에는 예를 들어, 프라틸렌쿠스 종(*Pratylenchus spp.*), 라도폴루스 시밀리스(*Radopholus similis*), 디틸렌쿠스 디프사키(*Ditylenchus dipsaci*), 틸렌쿨루스 세미페네트란스(*Tylenchulus semipenetrans*), 헤테로테라 종(*Heterodera spp.*), 글로보테라 종(*Globodera spp.*), 멜로이도기네 종(*Meloidogyne spp.*), 아펠렌코이테스 종(*Aphelenchoides spp.*), 롱기도루스 종(*Longidorus spp.*), 크시피네마 종(*Xiphinema spp.*), 트리코도루스 종(*Trichodorus spp.*) 및 부르사펠렌쿠스 종(*Bursaphelenchus spp.*)이 포함된다.

특정 농도 또는 적용 비율에서, 본 발명에 따른 화합물은 경우에 따라 제초제 및 살미생물제, 예를 들어 살진균제, 항곰팡이제 및 살균제로서 사용될 수 있다. 경우에 따라, 이들은 또한 추가의 활성 화합물을 합성하기 위한 중간체 또는 전구체로서 사용될 수 있다.

활성 화합물은 용액제, 유제, 수화성 산제, 현탁액, 산제, 분제, 페이스트, 가용성 산제, 과립제, 현탁액-유제 농축액, 활성 화합물로 함침된 천연 및 합성물질, 및 중합물질 중의 마이크로캡셀제와 같은 통상의 제제로 전환될 수 있다.

이들 제제는 공지된 방법으로, 예를 들어, 임의로 계면활성제, 즉 유화제 및/또는 분산제 및/또는 포움 형성제를 사용하여 활성 화합물을 증량제, 즉 액체 용매 및/또는 고형 담체와 혼합하여 제조한다.

사용된 증량제가 물인 경우, 예를 들어 유기용매가 또한 보조 용매로 사용될 수 있다. 액체 용매로서, 주로 크실렌, 톨루엔 또는 알킬나프탈렌과 같은 방향족 화합물, 클로로벤젠, 클로로에틸렌 및 메틸렌 클로라이드와 같은 염소화 방향족 및 염소화 지방족 탄화수소, 사이클로헥산 또는 파라핀, 예를 들어, 광유 분획물, 광유 및 식물유와 같은 지방족 탄화수소, 부탄올 또는 글리콜과 같은 알콜 및 이들의 에테르 및 에스테르, 아세톤, 메틸 에틸 케톤, 메틸 이소부틸 케톤 또는 사이클로헥사논과 같은 케톤, 디메틸포름아미드 및 디메틸설폭사이드와 같은 강한 극성 용매, 및 또한 물이 적합하다.

적합한 고형 담체는, 예를 들어 암모늄염, 및 카올린, 점토, 활석, 백악, 석영, 아타펄가이트, 몬모릴로나이트 또는 규조토와 같은 분쇄된 천연 광물, 및 고분산 실리카, 알루미늄 및 실리케이트와 같은 분쇄된 합성 물질이다. 적합한 과립제용 고형

담체는, 예를 들어 방해석, 대리석, 경석, 해포석 및 백운석과 같은 분쇄 및 분류된 천연 암석, 또는 무기 및 유기 가루의 합성 과립, 및 톱밥, 코코넛 껍질, 옥수수 속대 및 담배줄기와 같은 유기물질의 과립이다. 적합한 유화제 및/또는 포움 형성제는 예를 들어 비이온성 및 음이온성 유화제, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 지방산 에스테르, 폴리옥시에틸렌 지방 알콜 에테르, 예를 들어 알킬아릴 폴리글리콜 에테르, 알킬설포네이트, 알킬설페이트, 아릴설포네이트 또는 단백질 가수분해물이다. 적합한 분산제는, 예를 들어 리그닌-설파이트 폐액 및 메틸셀룰로오스이다.

점착제, 예를 들어 카복시메틸셀룰로오스, 및 아라비아고무, 폴리비닐 알콜 및 폴리비닐 아세테이트와 같은 분말, 과립 또는 라텍스 형태의 천연 및 합성 중합체, 및 세팔린 및 레시틴과 같은 천연 인지질, 및 합성 인지질이 제제에 사용될 수 있다. 그 외의 첨가제는 광유 및 식물유일 수 있다.

착색제, 예를 들어 산화철, 산화티탄 및 프루시안 블루 등의 무기안료, 및 알리자린 염료, 아조 염료 및 금속 프탈로시아닌 염료 등의 유기염료 및 철, 망간, 붕소, 구리, 코발트, 몰리브덴 및 아연의 염과 같은 미량 영양소가 사용될 수도 있다.

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

본 발명에 따른 활성 배합물은 살충제, 유인제, 소독제, 살균제, 살비제, 살선충제, 살진균제, 성장-조절 물질 또는 제초제와 같은 다른 활성 화합물과의 혼합물로서, 그의 상업적으로 입수가 가능한 제제 및 이들 제제로부터 제조된 사용형으로 존재할 수 있다. 살충제로는 예를 들어, 인산 에스테르, 카바메이트, 카복실레이트, 염소화 탄화수소, 페닐우레아 및 미생물에 의해 생산된 물질이 포함된다.

혼합물에 특히 유리한 공-성분은 예를 들어 다음과 같다:

살진균제:

알디모르프, 암프로필포스, 암프로필포스 포타슘, 안도프림, 아닐라진, 아자코나졸, 아족사이스트로빈,

벤알락실, 베노다닐, 베노밀, 벤자마크릴, 벤자마크릴-이소부틸, 비알라포스, 비나파크릴, 비페닐, 비테르타놀, 블라스티시딘-S, 브로무코나졸, 부피리메이트, 부티오베이트,

칼슘 폴리설파이드, 캅시마이신, 캅타폴, 캅탄, 카르벤다짐, 카복신, 카르본, 퀴노메티오네이트, 클로벤티아존, 클로르페나졸, 클로로네브, 클로로피크린, 클로로탈로닐, 클로졸리네이트, 클로질라콘, 쿠프라네브, 사이목사닐, 사이프로코나졸, 사이프로디닐, 사이프로푸람,

데바카르브, 디클로로펜, 디클로부트라졸, 디클로플루아니드, 디클로메진, 디클로란, 디에토펜카브, 디페노코나졸, 디메티리몰, 디메토모르프, 디니코나졸, 디니코나졸-M, 디노캡, 디페닐아민, 디피리티온, 디탈립포스, 디티아논, 도데모르프, 도딘, 드라족솔론,

에디펜포스, 에폭시코나졸, 에타코나졸, 에티리몰, 에트리디아졸,

파목사돈, 페나파닐, 페나리몰, 펜부코나졸, 펜푸람, 페니트로판, 펜피클로닐, 펜프로피딘, 펜프로피모르프, 펜틴 아세테이트, 펜틴 하이드록시드, 페르밤, 페림존, 플루아지남, 플루메토버, 플루오로미드, 플루퀸코나졸, 플루르프리미돌, 플루실라졸, 플루설파미드, 플루톨라닐, 플루트리아폴, 폴페트, 포세틸-알루미늄, 포세틸-소듐, 프탈리드, 푸베리다졸, 푸라락실, 푸라메트피르, 푸르카보닐, 푸르코나졸, 푸르코나졸-시스, 푸르메사이클록스,

구아자틴,

헥사클로로벤젠, 헥사코나졸, 하이멕사졸,

이마잘릴, 이미벤코나졸, 이미노옥타딘, 이미노옥타딘 알베실레이트, 이미노옥타딘 트리아세테이트, 요오도카브, 이프로코나졸, 이프로벤포스(IPB), 이프로디온, 이루마마이신, 이소프로티올란, 이소발레디온,

카수가마이신, 크레속심-메틸, 구리 제제, 예를 들어 수산화 구리, 코퍼 나프테네이트, 옥시염화구리, 황산구리, 산화구리, 옥신-구리 및 보르도(Bordeaux) 혼합물,

만코퍼, 만코제브, 마네브, 메페림존, 메파니피림, 메프로닐, 메탈락실, 메트코나졸, 메타설포카브, 메트푸록삼, 메티람, 메
토메클람, 메트설포박스, 밀디오마이신, 마이클로부타닐, 마이클로졸린,

니켈 디메틸디티오카바메이트, 니트로탈-이소프로필, 누아리물,

오푸라스, 옥사딕실, 옥사모카브, 옥솔린산, 옥시카복심, 옥시펜틴,

파클로부트라졸, 페푸라조에이트, 펜코나졸, 펜사이쿠론, 포스디펜, 피마리신, 피페랄린, 폴리옥신, 폴리옥소림, 프로베나
졸, 프로클로라즈, 프로사이미돈, 프로파모카브, 프로파노신-소듐, 프로피코나졸, 프로피네브, 피라조포스, 피리페녹스,
피리메타닐, 피로켈론, 피록시푸르,

퀸코나졸, 퀸토젠 (PCNB),

황 및 황 제제,

테부코나졸, 테클로프탈람, 테크나젠, 테트사이클라시스, 테트라코나졸, 티아벤다졸, 티사이오펜, 티플루자미드, 티오파네
이트-메틸, 티람, 티옥시미드, 톨클로포스-메틸, 톨릴플루아니드, 트리아디메폰, 트리아디메놀, 트리아즈부틸, 트리아족
시드, 트리클라미드, 트리사이클라졸, 트리데모르프, 트리플루미졸, 트리포린, 트리티코나졸,

유니코나졸,

발리다마이신 A, 빈클로졸린, 비니코나졸,

자틸라미드, 지네브, 지람, 및 또한

다거(Dagger) G,

OK-8705,

OK-8801,

α -(1,1-디메틸에틸)- β -(2-페녹시에틸)-1H-1,2,4-트리아졸-1-에탄올,

α -(2,4-디클로로페닐)- β -플루오로- β -프로필-1H-1,2,4-트리아졸-1-에탄올,

α -(2,4-디클로로페닐)- β -메톡시- α -메틸-1H-1,2,4-트리아졸-1-에탄올,

α -(5-메틸-1,3-디옥산-5-일)- β -[[4-(트리플루오로메틸)페닐]메틸렌]-1H-1,2,4-트리아졸-1-에탄올,

(5RS,6RS)-6-하이드록시-2,2,7,7-테트라메틸-5-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)-3-옥탄온,

(E)- α -(메톡시이미노)-N-메틸-2-페녹시-페닐아세트아미드,

1-이소프로필 {2-메틸-1-[[[1-(4-메틸페닐)-에틸]-아미노]-카보닐]-프로필}-카바메이트,

1-(2,4-디클로로페닐)-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)-에탄온-O-(페닐메틸)-옥심,

1-(2-메틸-1-나프탈레닐)-1H-피롤-2,5-디온,

1-(3,5-디클로로페닐)-3-(2-프로페닐)-2,5-피롤리딘디온,

1-[(디요오도메틸)-설포닐]-4-메틸-벤젠,

1-[[2-(2,4-디클로로페닐)-1,3-디옥솔란-2-일]-메틸]-1H-이미다졸,
 1-[[2-(4-클로로페닐)-3-페닐옥시라닐]-메틸]-1H-1,2,4-트리아졸,
 1-[1-[2-[(2,4-디클로로페닐)-메톡시]-페닐]-에테닐]-1H-이미다졸,
 1-메틸-5-노닐-2-(페닐메틸)-3-피롤리디놀,
 2',6'-디브로모-2-메틸-4'-트리플루오로메톡시-4'-트리플루오로-메틸-1,3-티아졸-5-카복시아닐리드,
 2,2-디클로로-N-[1-(4-클로로페닐)-에틸]-1-에틸-3-메틸-사이클로프로판카복스아미드,
 2,6-디클로로-5-(메틸티오)-4-피리미디닐 티오시아네이트,
 2,6-디클로로-N-(4-트리플루오로메틸벤질)-벤즈아미드,
 2,6-디클로로-N-[[4-(트리플루오로메틸)-페닐]-메틸]-벤즈아미드,
 2-(2,3,3-트리아오도-2-프로페닐)-2H-테트라졸,
 2-[(1-메틸에틸)-설폰닐]-5-(트리클로로메틸)-1,3,4-티아디아졸,
 2-[[6-데옥시-4-O-(4-O-메틸-β-D-글리코피라노실)-α-D-글루코피라노실]-아미노]-4-메톡시-1H-피롤로[2,3-d]피리미딘-5-카보니트릴,
 2-아미노부탄,
 2-브로모-2-(브로모메틸)-펜탄디니트릴,
 2-클로로-N-(2,3-디하이드로-1,1,3-트리메틸-1H-인덴-4-일)-3-피리딘카복스아미드,
 2-클로로-N-(2,6-디메틸페닐)-N-(이소티오시아네이트메틸)-아세트아미드,
 2-페닐페놀(OPP),
 3,4-디클로로-1-[4-(디플루오로메톡시)-페닐]-1H-피롤-2,5-디온,
 3,5-디클로로-N-[시아노-[(1-메틸-2-프로피닐)-옥시]-메틸]-벤즈아미드,
 3-(1,1-디메틸프로필)-1-옥소-1H-인덴-2-카보니트릴,
 3-[2-(4-클로로페닐)-5-에톡시-3-이속사졸리디닐]-피리딘,
 4-클로로-2-시아노-N,N-디메틸-5-(4-메틸페닐)-1H-이미다졸-1-설폰아미드,
 4-메틸-테트라졸로[1,5-a]퀴나졸린-5(4H)-온,
 8-(1,1-디메틸에틸)-N-에틸-N-프로필-1,4-디옥사스피로[4.5]데칸-2-메탄아민,
 8-하이드록시퀴놀린 설페이트,
 9H-크산텐-2-[(페닐아미노)-카보닐]-9-카복실릭 하이드라지드,

비스-(1-메틸에틸)-3-메틸-4-[(3-메틸벤조일)-옥시]-2,5-티오펜디카복실레이트,
 시스-1-(4-클로로페닐)-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)-사이클로헥탄올,
 시스-4-[3-[4-(1,1-디메틸프로필)-페닐-2-메틸프로필]-2,6-디메틸몰포린 하이드로클로라이드,
 에틸 [(4-클로로페닐)-아조]-시아노아세테이트,
 탄산수소칼륨,
 메탄테트라티올 소듐염,
 메틸 1-(2,3-디하이드로-2,2-디메틸-1H-인덴-1-일)-1H-이미다졸-5-카복실레이트,
 메틸 N-(2,6-디메틸페닐)-N-(5-이속사졸릴카보닐)-DL-알라니네이트,
 메틸 N-(클로로아세틸)-N-(2,6-디메틸페닐)-DL-알라니네이트,
 N-(2,3-디클로로-4-하이드록시페닐)-1-메틸-사이클로헥산카복스아미드,
 N-(2,6-디메틸페닐)-2-메톡시-N-(테트라하이드로-2-옥소-3-푸라닐)-아세트아미드,
 N-(2,6-디메틸페닐)-2-메톡시-N-(테트라하이드로-2-옥소-3-티에닐)-아세트아미드,
 N-(2-클로로-4-니트로페닐)-4-메틸-3-니트로-벤젠설포나미드,
 N-(4-사이클로헥실페닐)-1,4,5,6-테트라하이드로-2-피리미딘아민,
 N-(4-헥실페닐)-1,4,5,6-테트라하이드로-2-피리미딘아민,
 N-(5-클로로-2-메틸페닐)-2-메톡시-N-(2-옥소-3-옥사졸리디닐)-아세트아미드,
 N-(6-메톡시)-3-피리디닐-사이클로프로판카복스아미드,
 N-[2,2,2-트리클로로-1-[(클로로아세틸)-아미노]-에틸]-벤즈아미드,
 N-[3-클로로-4,5-비스(2-프로피닐옥시)-페닐]-N'-메톡시-메탄이미드아미드,
 N-포르밀-N-하이드록시-DL-알라닌-소듐염,
 O,O-디에틸 [2-(디프로필아미노)-2-옥소에틸]-에틸포스포르아미도티오에이트,
 O-메틸 S-페닐 페닐프로필포스포르아미도티오에이트,
 S-메틸 1,2,3-벤조티아디아졸-7-카보티오에이트,
 스피로[2H]-1-벤조피란-2,1'(3'H)-이소벤조푸란]-3'-온.

살균제:

브로노폴, 디클로로펜, 니트라피린, 니켈 디메틸디티오키바메이트, 카수가마이신, 옥틸리논, 푸란카복실산, 옥시테트라사이클린, 프로베나졸, 스트렙토마이신, 테클로프탈람, 황산구리 및 다른 구리 제제.

살충제 / 살비제 / 살선충제:

아바멕틴, 아세페이트, 아세타미프리트, 아크리나트린, 알라니카브, 알디카브, 알독시카브, 알파사이퍼메트린, 알파메트린, 아미트라즈, 아베르멕틴, AZ 60541, 아자디라크틴, 아자메티포스, 아진포스 A, 아진포스 M, 아조사이클로틴,

바실러스 포필리아에, 바실러스 스파에리쿠스, 바실러스 서브틸리스, 바실러스 투링기엔시스, 바쿨로비루세스, 베아우베리아 바시아나, 베아우베리아 테넬라, 벤디오카브, 벤푸라카브, 벤선탐, 벤족시메이트, 베타사이플루트린, 비페나제이트, 비펜트린, 비오에타노메트린, 비오펜메트린, BPMC, 브로모포스 A, 부펜카브, 부프로페진, 부타티오포스, 부토카복심, 부틸피리다벤,

카두사포스, 카바릴, 카보푸란, 카보페노티온, 카보선탐, 카탐, 클로에토카브, 클로르에톡시포스, 클로르페나피르, 클로르펜빈포스, 클로르플루아주론, 클로르메포스, 클로르피리포스, 클로르피리포스 M, 클로바포르트린, 시스-레스메트린, 시스페르메트린, 클로사이트린, 클로에토카브, 클로펜테진, 시아노포스, 사이클로프렌, 사이클로프로트린, 사이플루트린, 사이할로트린, 사이헥사틴, 사이퍼메트린, 사이로마진,

델타메트린, 데메톤 M, 데메톤 S, 데메톤 S-메틸, 디아펜티우론, 디아지논, 디클로보스, 디플루벤주론, 디메토에이트, 디메틸빈포스, 디오페놀란, 디선포톤, 도쿠사트-소듐, 도펜나파인,

에플루실라네이트, 에마멕틴, 엠펜트린, 엔도선탐, 엔토모프토라 에스에스피., 에스펜발레레이트, 에티오펜카브, 에티온, 에토프로포스, 에토펜프록스, 에톡사줄, 에트림포스,

펜아미포스, 펜아자퀸, 산화 펜부타틴, 페니트로티온, 페노티오키아브, 페녹사크림, 페녹시카브, 펜프로파트린, 펜피라드, 펜피리드린, 펜피록시메이트, 펜발레레이트, 피프로닐, 플루아지남, 플루아주론, 플루브로사이트리네이트, 플루사이클록수론, 플루사이트리네이트, 플루페녹수론, 플루텐진, 플루발리네이트, 포노포스, 포스메틸란, 포스티아제이트, 푸브펜프록스, 푸라티오키아브,

그라눌로시스 비루세스,

할로페노지드, HCH, 햅테노포스, 헥사플루무론, 헥시티아족스, 하이드로프린,

이미다클로프리트, 이사조포스, 이소펜포스, 이속사티온, 이버멕틴,

핵 폴리헤드로시스 바이러스,

람다-사이할로트린, 루페누론,

말라티온, 메카르밤, 메트알데하이드, 메트아미도포스, 메타르히지움 아니소플리아에, 메타르히지움 플라보비리드, 메티다티온, 메티오키아브, 메토밀, 메톡시페노지드, 메톨카브, 메톡사디아존, 메빈포스, 밀베멕틴, 모노크로토프스,

날레드, 니텐피람,니티아진, 노발우론,

오메토에이트, 옥사밀, 옥시데메톤 M,

파에실로마이세스, 푸모소로세우스, 파라티온 A, 파라티온 M, 페르메트린, 펜토아트, 포레이트, 포살론, 포스메트, 포스파미돈, 폭심, 피리미카브, 피리미포스 A, 피리미포스 M, 프로페노포스, 프로메카브, 프로폭수르, 프로티오포스, 프로토에이트, 피메트로진, 피라클로포스, 피레스메트린, 피레트럼, 피리다벤, 피리다티온, 피리미디펜, 피리프록시펜,

퀴날포스,

리바비린,

살리티온, 세부포스, 실라플루오펜, 스피노사드, 선포텨, 선프로포스,

타우-플루발리네이트, 테부페노지드, 테부펜피라드, 테부피리미포스, 테플루벤주론, 테플루트린, 테메포스, 테미빈포스, 테르부포스, 테트라클로르빈포스, 테트라-사이퍼메트린, 티아메톡삼, 티아프로닐, 티아트리포스, 티오시클람 하이드로젠 옥살레이트, 티오디카브, 티오파녹스, 투린기엔신, 트랄로사이트린, 트랄로메트린, 트리아라텐, 트리아자메이트, 트리아조포스, 트리아주론, 트리클로페니딘, 트리클로르폰, 트리플루무론, 트리메타카브,

바미도티온, 바닐리프롤, 버티실리움 레카니,

YI5302,

제타-사이퍼메트린, 졸라프로포스,

(1R-시스)-[5-(페닐메틸)-3-푸라닐]-메틸 3-[(디하이드로-2-옥소-3(2H)-푸라닐리덴)-메틸]-2,2-디메틸사이클로 프로판카복실레이트,

(3-페녹시페닐)-메틸 2,2,3,3-테트라메틸사이클로프로판카복실레이트,

1-[(2-클로로-5-티아졸릴)메틸]테트라하이드로-3,5-디메틸-N-니트로-1,3,5-트리아진-2(1H)-이민,

2-(2-클로로-6-플루오로페닐)-4-[4-(1,1-디메틸에틸)페닐]-4,5-디하이드로-옥사졸,

2-(아세틸옥시)-3-도데실-1,4-나프탈렌디온,

2-클로로-N-[[[4-(1-페닐에톡시)-페닐]-아미노]-카보닐]-벤즈아미드,

2-클로로-N-[[[4-(2,2-디클로로-1,1-디플루오로에톡시)-페닐]-아미노]-카보닐]-벤즈아미드,

3-메틸페닐 프로필카바메이트,

4-[4-(4-에톡시페닐)-4-메틸페닐]-1-플루오로-2-페톡시-벤젠,

4-클로로-2-(1,1-디메틸에틸)-5-[[2-(2,6-디메틸-4-페녹시페녹시)에틸]티오]-3(2H)-피리다지논,

4-클로로-2-(2-클로로-2-메틸프로필)-5-[(6-요오도-3-피리디닐)메톡시]-3(2H)-피리다지논,

4-클로로-5-[(6-클로로-3-피리디닐)메톡시]-2-(3,4-디클로로페닐)-3(2H)-피리다지논,

바실러스 투린기엔시스 균주 EG-2348,

2-벤조일-1-(1,1-디메틸에틸)-하이드라지노벤조산,

2,2-디메틸-3-(2,4-디클로로페닐)-2-옥소-1-옥사스피로[4.5]텍-3-엔-4-일 부타노에이트,

[3-[(6-클로로-3-피리디닐)메틸]-2-티아졸리디닐리덴]-시안아미드,

디하이드로-2-(니트로메틸렌)-2H-1,3-티아진-3(4H)-카복스알데히드,

에틸 [2-[[[1,6-디하이드로-6-옥소-1-(페닐메틸)-4-피리다지닐]옥시]에틸]-카바메이트,

N-(3,4,4-트리플루오로-1-옥소-3-부테닐)-글리신,

N-(4-클로로페닐)-3-[4-(디플루오로메톡시)페닐]-4,5-디하이드로-4-페닐-1H-피라졸-1-카복스아미드,

N-[(2-클로로-5-티아졸릴)메틸]-N'-메틸-N"-니트로-구아니딘,

N-메틸-N'-(1-메틸-2-프로페닐)-1,2-하이드라진디카보티오아미드,

N-메틸-N'-2-프로페닐-1,2-하이드라진디카보티오아미드,

O,O-디에틸 [2-(디프로필아미노)-2-옥소에틸]-에틸포스포르아미도티오에이트.

그 외의 공지된 화합물, 예를 들어 제초제, 또는 비료 및 성장 조절제와의 혼합물이 또한 가능하다.

본 발명에 따른 활성 화합물들은 또한 살충제로서 사용하는 경우에 상승제와의 혼합물로서 그의 상업적으로 이용되는 제제 및 이들 제제로부터 제조된 사용형으로 존재할 수 있다. 상승제는 첨가되는 상승제 그 자체가 활성화될 필요없이 활성 화합물의 작용을 증가시키는 화합물이다.

상업적으로 이용되는 제제로부터 제조된 사용형의 활성 화합물 함량은 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 사용형의 활성 화합물의 농도는 0.0000001 내지 95 중량 %, 바람직하게는 0.0001 내지 1 중량 %이다.

화합물은 사용형에 적합한 통상적인 방식으로 사용된다.

위생 해충 및 저장품 해충에 사용하는 경우에, 본 발명에 따른 활성 화합물은 목재 및 점토에 대해 뛰어난 잔류 활성을 나타내고, 석회 기질상의 알칼리에 대해 우수한 안정성을 나타낸다.

본 발명에 따른 활성 화합물은 식물, 위생 및 저장품 해충뿐만 아니라, 수의학 분야에서 동물 기생충(체외 기생충), 예를 들어, 견체 참진드기, 연체 참진드기, 움 진드기, 잎 진드기, 파리(물고 핏는), 기생성 파리 유충, 이, 털에 사는 이, 가축 이 및 벼룩에 대해 작용한다. 이러한 기생충에는 다음의 것들이 포함된다:

이(*Anoplurida*)목, 예를 들어 하에마토피누스 종(*Haematopinus spp.*), 리노그나투스 종(*Linognathus spp.*), 페디쿨루스 종(*Pediculus spp.*), 프티루스 종(*Phthirus spp.*), 솔레노포테스 종(*Solenopotes spp.*).

털이(*Mallophagida*)목 및 암블리세리나(*Amblycerina*) 및 이스크노세리나(*Ischnocerina*) 아목, 예를 들어 트리메노폰 종(*Trimenopon spp.*), 메노폰 종(*Menopon spp.*), 트리노톤 종(*Trinoton spp.*), 보비콜라 종(*Bovicola spp.*), 웨르넥키엘라 종(*Werneckiella spp.*), 레피켄트론 종(*Lepikentron spp.*), 다말리나 종(*Damalina spp.*), 트리코덱테스 종(*Trichodectes spp.*), 펠리콜라 종(*Felicola spp.*).

파리(*Diptera*)목 및 네마토세리나(*Nematocerina*) 및 브라키세리나(*Brachycerina*) 아목, 예를 들어 아에데스 종(*Aedes spp.*), 아노펠레스 종(*Anopheles spp.*), 쿨렉스 종(*Culex spp.*), 시물리움 종(*Simulium spp.*), 유시물리움 종(*Eusimulium spp.*), 플레보토무스 종(*Phlebotomus spp.*), 루초미아 종(*Lutzomyia spp.*), 쿨리코이데스 종(*Culicoides spp.*), 크리소프스 종(*Crysops spp.*), 히보미트라 종(*Hybomitra spp.*), 아틸로투스 종(*Atylotus spp.*), 타바누스 종(*Tabanus spp.*), 하에마토폠타 종(*Haematopota spp.*), 필리포미아 종(*Philipomyia spp.*), 브라울라 종(*Braula spp.*), 무스카 종(*Musca spp.*), 히드로타아 종(*Hydrotaea spp.*), 스토크시스 종(*Stomoxys spp.*), 하에마토비아 종(*Haematobia spp.*), 모델리아 종(*Morellia spp.*), 파니아 종(*Fannia spp.*), 글로스시나 종(*Glossina spp.*), 칼리포라 종(*Calliphora spp.*), 루실리아 종(*Lucilia spp.*), 크리소미아 종(*Chrysomyia spp.*), 울파르티아 종(*Wohlfartia spp.*), 사르코파가 종(*Sarcophaga spp.*), 오에스트루스 종(*Oestrus spp.*), 히포더마 종(*Hypoderma spp.*), 가스테로필루스 종(*Gasterophilus spp.*), 히포보스카 종(*Hyppobosca spp.*), 리포르테나 종(*Lipoptana spp.*), 멜로파구스 종(*Melophagus spp.*).

벼룩(*Siphonaptera*)목, 예를 들어 풀렉스 종(*Pulex spp.*), 크테노세팔리데스 종(*Ctenocephalides spp.*), 크세노프실라 종(*Xenopsylla spp.*), 세라토피루스 종(*Ceratophyllus spp.*).

이시아(*Heteroptera*) 목, 예를 들어 시멕스 종(*Cimex spp.*), 트리아토마 종(*Triatoma spp.*), 로드니우스 종(*Rhodnius spp.*), 판스트롱길루스 종(*Panstrongylus spp.*).

블라타리다(*Blattarida*) 목, 예를 들어 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 블라타 게르마니카(*Blatta germanica*) 및 수펠라 종(*Supella spp.*).

응애(*Acarina; Acarida*) 아강 및 메타- 및 메소스티그마타(*Meta- and Mesostigmata*)목, 예를 들어 아르가스 종(*Argas spp.*), 오르니토도루스 종(*Ornithodoros spp.*), 오타비우스 종(*Otobius spp.*), 익소테스 종(*Ixodes spp.*), 암블리움마 종(*Amblyomma spp.*), 부필루스 종(*Boophilus spp.*), 데르마센토 종(*Dermacentor spp.*), 하에마피살리스 종(*Haemaphysalis spp.*), 히알롬마 종(*Hyalomma spp.*), 리피세팔루스 종(*Rhipicephalus spp.*), 데르마니수스 종(*Dermanyssus spp.*), 라일리에티아 종(*Raillietia spp.*), 뉴모니수스 종(*Pneumonyssus spp.*), 스테르노스토마 종(*Sternostoma spp.*) 및 바로아 종(*Varroa spp.*).

아크티네디다(*Actinedida*)(프로스티그마타(*Prostigmata*)) 및 아카리디다(*Acaridida*)(아스티그마타(*Astigmata*)) 목, 예를 들어 아카라피스 종(*Acarapis spp.*), 체일레티엘라 종(*Cheyletiella spp.*), 오르니토체일레티아 종(*Ornithocheyletia spp.*), 미오비아 종(*Myobia spp.*), 소레르가테스 종(*Psorergates spp.*), 데모텍스 종(*Demodex spp.*), 트롬비쿨라 종(*Trombicula spp.*), 리스트로포루스 종(*Listrophorus spp.*), 아카루스 종(*Acarus spp.*), 티로파구스 종(*Tyrophagus spp.*), 칼로글리푸스 종(*Caloglyphus spp.*), 히포텍테스 종(*Hypodectes spp.*), 프테롤리쿠스 종(*Pterolichus spp.*), 소로프테스 종(*Psoroptes spp.*), 코리오프테스 종(*Chorioptes spp.*), 오토텍테스 종(*Otodectes spp.*), 사르코프테스 종(*Sarcoptes spp.*), 노토에드레스 종(*Notoedres spp.*), 크네미도코프테스 종(*Knemidocoptes spp.*), 시토디테스 종(*Cytodites spp.*) 및 라미노시오프테스 종(*Laminosioptes spp.*).

본 발명에 따른 활성 화합물은 또한 농업 생산성 가축, 예를 들어 소, 양, 염소, 말, 돼지, 당나귀, 낙타, 물소, 토끼, 닭, 칠면조, 오리, 거위 및 벌, 및 애완 동물, 예를 들어 개, 고양이, 새장에 든 새 및 어항속 어류, 및 또한 소위 실험용 동물, 예를 들어 햄스터, 기니아 피그, 랫트 및 마우스를 침습하는 절지동물을 구제하는데 적합하다. 절지동물을 구제하면, 사망 및 산출량 감소(예를 들어 고기, 우유, 양모, 가죽, 알, 벌꿀 등에 있어서)가 줄어들게 되므로, 본 발명에 따른 활성 화합물을 사용함으로써, 더욱 경제적이고 간편한 동물 관리가 가능하다.

수의학 분야에서, 본 발명에 따른 활성 화합물은, 예를 들어 정제, 캡슐제, 음료, 물약, 과립제, 페이스트제, 거환제, 사료를 통한 방법 및 좌약의 형태로 장내 투여에 의해, 비경구적 투여, 예를 들어 주사(근육내, 피하, 정맥내 및 복막내 등)에 의해, 삽인에 의해, 비강내 투여에 의해, 예를 들어, 침지 또는 담금, 분무, 붓기 및 점적, 세척 및 연무 형태로 및 활성 화합물을 함유하는 성형품 형태, 예를 들어, 목걸이, 귀표식(ear marks), 꼬리 표식, 다리 밴드, 굴레 또는 표시장치 등의 형태로 경피 사용에 의해 공지된 방식으로 사용된다.

가축, 가금류, 애완 동물 등에 사용하는 경우에, 활성 화합물은 활성 화합물을 1 내지 80 중량%의 양으로 함유하는 제제(예를 들어 산제, 유제, 유동이 자유로운 조성물)로서 직접 또는 100 내지 10,000 배 희석하여 사용할 수 있거나, 약품육의 형태로 사용할 수 있다.

또한, 본 발명에 따른 화합물은 산업 재료를 파괴하는 곤충에 대하여 강력한 살충 작용을 나타내는 것으로 밝혀졌다.

다음의 곤충들이 바람직한 예로서 언급될 수 있지만, 이들로만 제한되는 것은 아니다:

딱정벌레(*Beetles*), 예를 들어 힐로트루페스 바줄루스(*Hylotrupes bajulus*), 클로포루스 필로시스(*Chlorophorus pilosis*), 아노비움 폰크타툼(*Anobium punctatum*), 크세스토비움 루포빌로숨(*Xestobium rufovillosum*), 프틸리누스 펙티코르니스(*Ptilinus pecticornis*), 덴드로비움 페르티넥스(*Dendrobium pertinex*), 에르노비우스 몰리스(*Ernobius mollis*), 프리오비움 카르피니(*Priobium carpini*), 릭투스 브룬네우스(*Lyctus brunneus*), 릭투스 아프리카누스(*Lyctus africanus*), 릭투스 플라니콜리스(*Lyctus planicollis*), 릭투스 리네아리스(*Lyctus linearis*), 릭투스 푸베스센스(*Lyctus pubescens*), 트로곡실론 아에쿠알레(*Trogoxylon aequale*), 민테스 루기콜리스(*Minthes rugicollis*), 질레보루스 종(*Zyleborus spp.*), 트립토펜드론 종(*Tryptodendron spp.*), 아파테 모나쿠스(*Apate monachus*), 보스트리쿠스 카푸킨스(*Bostrychus capucins*), 헤테로보스트리쿠스 브룬네우스(*Heterobostrychus brunnes*), 시녹실론 종(*Synoxylon spp.*) 및 디노테루스 미누투스(*Dinoderus minutus*).

히메노프테란스(*Hymenopterans*) 목, 예를 들어, 시렉스 주벤쿠스(*Sirex jubencus*), 우로세루스 기가스(*Urocerus gigas*), 우로세루스 기가스 타이그누스(*Urocerus gigas taignus*), 우로세루스 아우구르(*Urocerus augur*).

흰개미(*Termites*), 예를 들어, 칼로테르메스 플라비콜리스(*Kaloterme flavicollis*), 크립토테르메스 브레비스(*Cryptotermes brevis*), 헤테로테르메스 인디콜라(*Heterotermes indicola*), 레티쿨리테르메스 플라비페스

(*Reticulitermes flavipes*), 레티쿨리테르메스 산토넨시스(*Reticulitermes santonensis*), 레티쿨리테르메스 루시푸구스(*Reticulitermes lucifugus*), 마스토테르메스 다위니엔시스(*Mastotermes darwiniensis*), 주테르모프시스 네바덴시스(*Zootermopsis nevadensis*) 및 코프토테르메스 포르모사누스(*Coptotermes formosanus*).

쥔(*Bristletails*), 예를 들어, 레피스마 사카리나(*Lepisma saccharina*).

본 발명에서 산업 재료는 무생물 물질, 예를 들어, 바람직하게는 플라스틱, 접착제, 호재(sizes), 종이 및 카드(cards), 가죽, 목재 및 가공 목제품, 및 코팅 조성물의 의미로 이해된다.

해충의 침습으로부터 매우 특별히 보호되어야 할 재료는 목재 및 가공 목제품이다.

본 발명에 따른 제제 또는 이를 함유하는 혼합물에 의해 보호될 수 있는 목재 및 가공 목제품은 예를 들어, 건축용 목재, 목재 빔(beam), 철도 침목, 교량 성분, 배다리, 목재 비히클(vehicle), 상자, 파레트, 컨테이너, 전신주, 목재 표지판, 목재로 만들어진 창 및 문, 합판, 칩 보드, 연결구, 또는 일반적으로 가옥 건축 또는 빌딩 연결부분에 매우 일반적으로 사용되는 목제품의 의미로 이해된다.

활성 화합물은 그 자체로, 농축물 또는 일반적인 통상의 제제, 예를 들어, 산제, 과립제, 용액제, 현탁제, 유제 또는 페이스트 형태로 사용될 수 있다.

언급된 제제는 그 자체로 공지된 방법으로, 예를 들어, 활성 화합물을 적어도 하나의 용매 또는 희석제, 유화제, 분산제 및/또는 결합제 또는 고정제, 방수제, 경우에 따라 건조제 및 UV 안정화제 및, 경우에 따라 염료 및 안료 및 또한 다른 가공 보조제들과 혼합함으로써 제조될 수 있다.

목재 및 목재로 만들어진 팀버 제품을 보호하기 위해 사용되는 살충 조성물 또는 농축물은 본 발명에 따른 활성 화합물을 0.0001 내지 95 중량%, 특히 0.001 내지 60 중량%의 농도로 함유한다.

사용되는 조성물 또는 농축물의 양은 해충의 습성 및 빈도와 매질에 따라 달라진다. 최적 사용량은 각 경우에 일련의 시험에 의하여 결정될 수 있다. 그러나, 일반적으로, 보호되어야 할 물질을 기준으로 0.0001 내지 20 중량%, 바람직하게는 0.001 내지 10 중량%를 사용하면 충분하다.

사용된 용매 및/또는 희석제는 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물 및/또는 저휘발성의 오일성 또는 오일형 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물 및/또는 극성 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물 및/또는 물, 및 적합하다면 유화제 및/또는 습윤제이다.

바람직하게 사용되는 유기 화학 용매는 35 이상의 증발 지수(evaporation number) 및 30 °C 이상, 바람직하게는 45 °C 이상의 인화점(flash point)을 갖는 오일성 또는 오일형 용매이다. 저휘발성이며 수-불용성인 오일성 및 오일형 용매로서 사용되는 물질은 적합한 광유 또는 그들의 방향족 분획물, 또는 광유, 바람직하게는 백유(White spirit), 석유 및/또는 알킬벤젠을 함유하는 용매 혼합물이다.

170 내지 220 °C의 비등 범위를 갖는 광유, 170 내지 220 °C의 비등 범위를 갖는 백유, 250 내지 350 °C의 비등 범위를 갖는 스피들 오일, 160 내지 280 °C의 비등 범위를 갖는 석유 및 방향족 화합물, 테레빈(terpentine) 오일 등이 유리하게 사용된다.

바람직한 구체예에서, 180 내지 210 °C의 비등 범위를 갖는 액상 지방족 탄화수소 또는 180 내지 220 °C의 비등 범위를 갖는 방향족 및 지방족 탄화수소의 고-비점 혼합물 및/또는 스피들 오일 및/또는 모노클로로나프탈렌, 바람직하게는 α-모노클로로나프탈렌이 사용된다.

35 이상의 증발 지수 및 30 °C 이상, 바람직하게는 45 °C 이상의 인화점을 갖는 저휘발성의 유기 오일성 또는 오일형 용매는, 용매 혼합물이 또한 35 이상의 증발 지수 및 30 °C 이상, 바람직하게는 45 °C 이상의 인화점을 갖고 살충제/살진균제 혼합물이 이 용매 혼합물에 용해되거나 유화될 수 있는 경우에, 부분적으로 중간 또는 고휘발성 유기 화학 용매로 대체될 수 있다.

바람직한 구체예에 따라, 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물의 일부가 지방족 극성 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물로 대체된다. 예를 들어, 글리콜 에테르, 에스테르 등과 같은 하이드록실 및/또는 에스테르 및/또는 에테르 그룹을 갖는 지방족 유기 화학 용매가 바람직하게 사용된다.

본 발명의 범위에내서 사용되는 유기 화학 결합제는 그 자체로서 공지되어 있고, 물로 희석될 수 있고/있거나 사용되는 유기 화학 용매에 용해, 분산 또는 유화될 수 있는 합성 수지 및/또는 결합 건성유, 특히 아크릴레이트 수지, 비닐 수지, 예를 들어, 폴리비닐 아세테이트, 폴리에스테르 수지, 중축합 또는 중부가 수지, 폴리우레탄 수지, 알키드 수지 또는 개질된 알키드 수지, 페놀 수지, 탄화수소 수지, 예를 들어, 인텐/쿠마론(coumarone) 수지, 실리콘 수지, 건성 식물유 및/또는 건성 유 및/또는 천연 및/또는 합성 수지를 기본으로 하고 물리적 수단으로 건조된 결합제로 구성되거나 이들을 포함하는 결합제이다.

결합제로서 사용되는 합성 수지는 유제, 분산액 또는 용액의 형태로 사용될 수 있다. 10 중량% 이하의 역청(bitumen) 또는 역청질 물질이 또한 결합제로서 사용될 수 있다. 또한, 그 자체로 공지된 염료, 안료, 방수제, 냄새 차폐 물질 및 억제제 또는 부식 방지제 등이 추가로 사용될 수 있다.

바람직하게는, 본 발명에 따른 조성물 또는 농축물은 유기 화학 결합제로서 적어도 하나의 알키드 수지 또는 개질된 알키드 수지 및/또는 건성 식물유를 함유한다. 본 발명에 따라 45 중량% 이상, 바람직하게는 50 내지 68 중량%의 오일 함량을 갖는 알키드 수지가 바람직하게 사용된다.

상기 언급된 결합제의 전부 또는 일부는 고정제(혼합물) 또는 가소제(혼합물)로 대체될 수 있다. 이 첨가제들은 활성 화합물의 증발 및 결정화 또는 침전을 방지하기 위해 사용된다. 이들은 바람직하게는 0.01 내지 30%(사용된 결합제 100%를 기준으로)의 결합제를 대체한다.

가소제는 프탈산 에스테르, 예를 들어, 디부틸, 디옥틸 또는 벤질 부틸 프탈레이트, 인산 에스테르, 예를 들어, 트리부틸 포스페이트, 아디프산 에스테르, 예를 들어, 디-(2-에틸헥실)아디페이트, 스테아레이트, 예를 들어, 부틸 스테아레이트 또는 아밀 스테아레이트, 올레에이트, 예를 들어, 부틸 올레에이트, 글리세롤 에테르 또는 더 고분자량의 글리콜 에테르, 글리세롤 에스테르 및 p-톨루엔설폰산 에스테르의 화학 그룹중에서 유래된다.

고정제는 화학적으로 폴리비닐 알킬 에테르, 예를 들어, 폴리비닐 메틸 에테르, 또는 케톤 예를 들어, 벤조페논 또는 에틸렌벤조페논을 기본으로 한다.

특히, 경우에 따라, 하나 이상의 상기 언급된 유기화학 용매 또는 희석제, 유화제 및 분산제와 혼합물된 물이 또한 용매 또는 희석제로 가능하다.

목재는 대규모의 공업적 스케일, 예를 들어, 진공, 이중 진공 또는 압축 처리에 의해 특히 효과적으로 보존된다.

경우에 따라, 즉시 사용형(ready-to-use) 조성물은 또한 다른 살충제 및, 적합하다면 또한 하나 이상의 살진균제를 함유할 수 있다.

가능한 추가의 혼합 파트너는 바람직하게는 WO 94/29 268에 언급되어 있는 살충제 및 살진균제이다. 이 문헌에 언급된 화합물은 명백한 본 출원의 구성성분이다.

특히 바람직한 혼합 파트너로는 살충제, 예를 들어, 클로르피리포스, 폭심, 실라플루오핀, 알파메트린, 사이플루트린, 사이페메트린, 델타메트린, 페메트린, 이미다클로프리트, NI-25, 플루페녹수론, 헥사플루무론, 트랜스플루트린, 티아클로프리트, 메톡시페녹시드 및 트리플루무론, 및 살진균제, 예를 들어, 에폭시코나졸, 헥사코나졸, 아자코나졸, 프로피코나졸, 테부코나졸, 사이프로코나졸, 메트코나졸, 이마잘릴, 디클로플루아니드, 톨릴플루아니드, 3-요오도-2-프로피닐부틸 카바메이트, N-옥틸-이소티아졸린-3-온 및 4,5-디클로로-N-옥틸이소티아졸린-3-온이 언급될 수 있다.

본 발명에 따른 화합물은 동시에 염수 또는 해수와 접촉하고 있는 물체, 예를 들어 선박 선체, 스크린, 그물, 구조물, 정박장 및 신호송신 시스템을 오염으로부터 보호하기 위해 사용될 수 있다.

고착성 빈모장(*Oligochaetae*), 예를 들어 세르풀리다에(*Serpulidae*), 및 갑각류 및 레다모르파(*Ledamorph*) 군(거위 조개삿갓굴(*goose barnacle*))의 종, 예를 들어 각종 레파스(*Lepas*) 및 스칼렐룸(*Scalpellum*) 종, 또는 굴등형아목(*Balanomorpha*) 군(도토리 조개삿갓굴(*acorn barnacle*))의 종, 예를 들어 발라누스(*Balanus*) 또는 폴리시페스(*Pollicipes*) 종에 의한 오염은 선박의 마찰 저항을 증가시키고, 그 결과 에너지 소비량이 높아지고 또한 건식 독(dock)에 빈번히 정박함으로써 운전비용을 현격히 증가시키게 된다.

조류, 예를 들어 엑토카르푸스 종(*Ectocarpus sp.*) 및 세라미움 종(*Ceramium sp.*)에 의한 오염 이외에도, 만각아강(*Cirripedia*) 속명(시리페드 크루스타세아 (*cirriped crustacea*))에 해당하는 고착성 절갑류(*Entomostraca*) 군에 의한 오염이 특히 중요하다.

놀랍게도, 본 발명에 따른 화합물은 단독 또는 다른 활성 화합물과 조합하여 뛰어난 방오 작용을 갖는 것으로 밝혀졌다.

본 발명에 따른 화합물을 사용함으로써, 예를 들어 비스(트리알킬주석)설퍼이드, 트리-n-부틸주석 라우레이트, 트리-n-부틸주석 클로라이드, 산화구리 (I), 트리에틸주석 클로라이드, 트리-n-부틸(2-페닐-4-클로로페녹시)주석, 트리부틸주석 옥사이드, 폴리브덴 디설퍼이드, 산화안티몬, 중합 부틸 티타네이트, 페닐-(비스피리딘)-비스무스 클로라이드, 트리-n-부틸주석 플루오라이드, 망간 에틸렌비스티오카바메이트, 아연 디메틸디티오카바메이트, 아연 에틸렌비스티오카바메이트, 2-피리딘티올 1-옥사이드의 아연 염 및 구리 염, 비스디메틸디티오카바모일아연에틸렌-비스티오카바메이트, 산화아연, 구리(I) 에틸렌-비스디티오카바메이트, 구리 티오시아네이트, 구리 나프테네이트 및 트리부틸주석 할라이드에서의 중금속을 사용하지 않을 수 있거나, 이들 화합물의 농도를 상당히 감소시키는 것이 가능하다.

필요에 따라, 즉석-사용 방오 페인트는 추가로 다른 활성 화합물, 바람직하게는 살조제, 살진균제, 제초제, 살연체동물제 또는 다른 방오 활성 화합물을 포함할 수 있다.

바람직하게, 본 발명에 따른 방오 조성물과 배합하기에 적합한 성분은 다음과 같다:

살조제, 예를 들어 2-t-부틸아미노-4-사이클로프로필아미노-6-메틸티오-1,3,5-트리아진, 디클로로펜, 디우론, 엔도탈, 펜틴 아세테이트, 이소프로투론, 메타벤즈티아주론, 옥시플루오르펜, 퀴노클라민 및 테르부트린;

살진균제, 예를 들어 벤조[b]티오펜카복실산 사이클로헥실아미드 S,S-디옥사이드, 디클로플루아니드, 플루오르-폴렛, 3-요오도-2-프로피닐 부틸카바메이트, 톨릴플루아니드 및 아줄, 예를 들어 아자코나줄, 사이프로코나줄, 에폭시코나줄, 헥사코나줄, 메트코나줄, 프로피코나줄 및 테부코나줄;

살연체동물제, 예를 들어 펜틴 아세테이트, 메탈데하이드, 메티오카브, 니클로사미드, 티오디카브 및 트리메타카브; 또는

통상적인 방오 활성 화합물, 예를 들어 4,5-디클로로-2-옥틸-4-이소티아졸린 -3-온, 디요오도메틸파라트릴 설펜, 2-(N,N-디메틸티오카바모일티오)-5-니트로티아질, 2-피리딘티올 1-옥사이드의 포타슘, 구리, 소듐 및 아연 염, 피리딘-트리페닐보란, 테트라부틸디스탄옥산, 2,3,5,6-테트라클로로-4-(메틸설포닐)-피리딘, 2,4,5,6-테트라클로로이소프탈로니트릴, 테트라메틸티우람 디설퍼이드 및 2,4,6-트리클로로페닐말레이미드.

사용된 방오 조성물은 본 발명에 따른 활성 화합물을 0.001 내지 50 중량%, 특히 0.01 내지 20 중량%의 농도로 함유한다.

추가로, 본 발명에 따른 방오 조성물은 예를 들어 문헌 [Ungerer, Chem. Ind. 1985, 37, 730-732] 및 [Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973]에 기술된 것과 같은 통상의 성분들을 함유한다.

본 발명에 따른 살조, 살진균, 살연체동물 활성 화합물 및 살충 활성 화합물 이외에, 방오 페인트는 특히 결합제를 함유한다.

승인된 결합제의 예로 용매 시스템중의 폴리비닐 클로라이드, 용매 시스템중의 염소화 러버, 용매 시스템, 특히 수성 시스템중의 아크릴 수지, 수성 분산물 또는 유기 용매 시스템 형태의 비닐 클로라이드/비닐 아세테이트 공중합체 시스템, 부타디엔/스티렌/아크릴로니트릴 러버, 건성유, 예를 들어 아마인유, 타르 또는 비투멘과 배합된 개질된 경화 수지 또는 수지 에스테르, 아스팔트 및 에폭시 화합물, 소량의 염소 러버, 염소화 폴리프로필렌 및 비닐 수지가 있다.

필요에 따라, 페인트는 또한 염수중에 불용성인 것이 바람직한 무기 안료, 유기 안료 또는 염료를 포함한다. 페인트는 또한 활성 화합물이 서서히 방출되도록 콜로포늄과 같은 물질을 포함할 수 있다. 페인트는 또한 가소제, 유동성에 영향을 미치는 개질제 및 기타 통상적인 성분들을 포함할 수 있다. 본 발명에 따른 화합물 또는 상기 언급된 혼합물은 또한 자동-광택 방오 시스템에 도입될 수도 있다.

활성 화합물은 또한 폐쇄 공간, 예를 들어 주택, 공장 홀, 사무실, 차량 캐빈 등에 출현하는 동물 해충, 특히 곤충, 거미류 및 응애를 구제하는데 적합하다. 이들은 단독 또는 다른 활성 화합물 및 보조제와 조합하여 상기 해충을 구제하기 위한 가정용 살충 제품에 사용될 수 있다. 이들은 민감성 및 내성 종 및 모든 발육 단계에 대하여 활성적이다. 이러한 해충에는 다음의 것들이 포함된다:

전갈(*Scorpionidea*)목, 예를 들어 부투스 옥키타누스(*Buthus occitanus*).

응애(*Acarina*)목, 예를 들어 아르가스 페르시쿠스(*Argas persicus*), 아르가스 레플렉수스(*Argas reflexus*), 브리오비아 에스에스피(*Bryobia ssp.*), 데르마니수스 갈리나에(*Dermanyssus gallinae*), 글리시파구스 도메스티구스(*Glyciphagus domestigus*), 오르니토도루스 모우바트(*Ornithodoros moubat*), 리피세팔루스 산귀네우스(*Rhipicephalus sanguineus*), 트롬비쿨라 알프레드두게시(*Trombicula alfreddugesi*), 네우트롬비쿨라 아우툼날리스(*Neutrombicula autumnalis*), 데르마토파고이데스 프테로니시무스(*Dermatophagoides pteronissimus*), 데르마토파고이데스 포리나에(*Dermatophagoides forinae*).

진정거미(*Araneae*)목, 예를 들어 아비쿨라리다에(*Aviculariidae*), 아라네이다(*Araneidae*)

장님거미목(*Opiliones*)목, 예를 들어 슈도스코르피오네스 첼리퍼(*Pseudoscorpiones chelifer*), 슈도스코르피오네스 체이리디움(*Pseudoscorpiones cheiridium*), 오피리오네스 팔랑기움(*Opiliones phalangium*).

쥐며느리(*Isopoda*)목, 예를 들어 오니스쿠스 아셀루스(*Oniscus asellus*), 포르셀리오 스카베르(*Porcellio scaber*).

노래기(*Diplopoda*)목, 예를 들어 블라니울루스 구툴라투스(*Blaniulus guttulatus*), 폴리데스무스 종(*Polydesmus spp.*).

지네(*Chilopoda*)목, 예를 들어 게오필루스 종(*Geophilus spp.*).

좀(*Zygentoma*)목, 예를 들어 크테노레피스마 종(*Ctenolepisma spp.*), 레피스마 사카리나(*Lepisma saccharina*), 레피스모데스 인퀼리누스(*Lepismodes inquilinus*).

바퀴(*Blattaria*)목, 예를 들어 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*), 블라텔라 게르마니카(*Blattella germanica*), 블라텔라 아사히나이(*Blattella asahinae*), 류코파에아 마데라에(*Leucophaea maderae*), 판클로라 종(*Panchlora spp.*), 파르코블라타 종(*Parcoblatta spp.*), 페리플라네타 아우스트랄라시아(*Periplaneta australasiae*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 페리플라네타 브룬네아(*Periplaneta brunnea*), 페리플라네타 플리기노사(*Periplaneta fuliginosa*), 수펠라 롱기팔파(*Supella longipalpa*).

메뚜기(*Saltatoria*)목, 예를 들어 아케타 도메스티쿠스(*Acheta domesticus*).

집게벌레(*Dermaptera*)목, 예를 들어 포르피쿨라 아우리쿨라리아(*Forficula auricularia*).

흰개미(*Isoptera*)목, 예를 들어 칼로테르메스 종(*Kaloterme spp.*), 레티쿨리테르메스 종(*Reticuliterme spp.*).

다듬이벌레(*Psocoptera*)목, 예를 들어 레피나투스 종(*Lepinatus spp.*), 리포셀리스 종(*Liposcelis spp.*).

딱정벌레(*Coleoptera*)목, 예를 들어, 안트레누스 종(*Anthrenus spp.*), 아타게누스 종(*Attagenus spp.*), 더메스테스 종(*Dermestes spp.*), 라테티쿠스 오리자에(*Latheticus oryzae*), 네크로비아 종(*Necrobia spp.*), 프티누스 종(*Ptinus spp.*), 리조페르타 도미니카(*Rhizopertha dominica*), 시토피루스 그라나리우스(*Sitophilus granarius*), 시토피루스 오리자에(*Sitophilus oryzae*), 시토피루스 제아마이스(*Sitophilus zeamais*), 스테고비움 파니세움(*Stegobium paniceum*).

파리(*Diptera*)목, 예를 들어 아에테스 아에집티(*Aedes aegypti*), 아에테스 알보픽투스(*Aedes albopictus*), 아에테스 타에니오린쿠스(*Aedes taeniorhynchus*), 아노펠레스 종(*Anopheles spp.*), 칼리포라 에리트로세팔라(*Calliphora erythrocephala*), 크리스조나 플루비알리스(*Chrysosona pluvialis*), 쿨렉스 퀸퀘파시아투스(*Culex quinquefasciatus*), 쿨렉스 피피엔스(*Culex pipiens*), 쿨렉스 타르살리스(*Culex tarsalis*), 드로소필라 종(*Drosophila spp.*), 판니아 카니쿨

라리스 (*Fannia canicularis*), 무스카 도메스티카(*Musca domestica*), 플레보토무스 종(*Phlebotomus spp.*), 사르코파카 카르나리아(*Sarcophaga carnaria*), 시물리움 종(*Simulium spp.*), 스토크시스 칼시트란스(*Stomoxys calcitrans*), 티풀라 팔루도사(*Tipula paludosa*).

나비(*Lepidoptera*)목, 예를 들어 아크로이아 그리셀라(*Achroia grisella*), 갈레리아 멜로넬라(*Galleria mellonella*), 플로디아 인터퐁크텔라(*Plodia interpunctella*), 티네아 클로아셀라(*Tinea cloacella*), 티네아 펠리오넬라(*Tinea pellionella*), 티네올라 비셀리엘라(*Tineola bisselliella*).

벼룩(*Siphonaptera*)목, 예를 들어 크테노세팔리데스 카니스(*Ctenocephalides canis*), 크테노세팔리데스 펠리스(*Ctenocephalides felis*), 풀렉스 이리탄스(*Pulex irritans*), 툽가 페네트란스(*Tunga penetrans*), 크세노프실라 케오피스(*Xenopsylla cheopis*).

벌(*Hymenoptera*)목, 예를 들어 캄포노투스 헤르쿨레아누스(*Camponotus herculeanus*), 라시우스 풀리기노수스(*Lasius fuliginosus*), 라시우스 니거(*Lasius niger*), 라시우스 움브라투스(*Lasius umbratus*), 모노모리움 파라오니스(*Monomorium pharaonis*), 파라베스풀라 종(*Paravespula spp.*), 테트라모리움 카에스피툼(*Tetramorium caespitum*).

이(*Anoplura*)목, 예를 들어 페디쿨루스 푸마누스 카피티스(*Pediculus humanus capitis*), 페디쿨루스 푸마누스 코르포리스(*Pediculus humanus corporis*), 프티루스 푸비스(*Pthirus pubis*).

이시아(*Heteroptera*)목, 예를 들어 시멕스 헤미프테루스(*Cimex hemipterus*), 시멕스 렉투라리우스(*Cimex lectularius*), 로드니우스 프로릭수스(*Rhodnius prolixus*), 트리아토마 인페스탄스(*Triatoma infestans*).

이들은 가정용 살충 제품에 단독으로 또는 다른 적합한 활성 화합물, 예를 들어 인산에스테르, 카바메이트, 피레트로이드, 성장 조절제 또는 그 밖에 다른 공지된 살충제류로부터의 활성 화합물과 조합하여 사용된다.

이들은 에어졸, 무압력 스프레이 제품, 예를 들어 펌프 및 아토마이저(atomizer) 스프레이, 자동 분사 시스템, 분사기(fogger), 포움, 젤, 셀룰로오스 또는 중합체로 제조된 증발 정제, 액체 증발기, 젤 및 막 증발기를 구비한 증발 제품, 추진제-작동 증발기, 무에너지 또는 수동 증발 시스템, 모스 페이퍼(moth paper), 모스 백(bag) 및 모스 겔로서, 살포용 미끼 또는 유인 장소에서 과립 또는 분체로서 사용된다.

본 발명에 따른 활성 화합물은 고엽제, 건조제, 줄기 킬러(haulm killer) 및 특히 제초제로서 사용될 수 있다. 잡초란, 가장 넓은 의미로 원치않는 장소에서 자라는 모든 식물을 의미한다. 본 발명에 따른 물질이 총체적 또는 선택적인 제초제로 작용하는지의 여부는 본질적으로 사용되는 양에 따라 좌우된다.

본 발명에 따른 활성 화합물은 예를 들어 하기 식물과 관련하여 사용될 수 있다:

하기 속의 쌍떡잎 잡초: 아부틸론(*Abutilon*), 아마란투스(*Amaranthus*), 암브로시아(*Ambrosia*), 아노다(*Anoda*), 안테미스(*Anthemis*), 아파네스(*Aphanes*), 아트리플렉스(*Atriplex*), 벨리스(*Bellis*), 비덴스(*Bidens*), 캡셀라(*Capsella*), 카르투스(*Carduus*), 카시아(*Cassia*), 센타우레아(*Centaurea*), 케노포듐(*Chenopodium*), 시르썃(*Cirsium*), 콘볼볼루스(*Convolvulus*), 다투라(*Datura*), 데스모듐(*Desmodium*), 에멕스(*Emex*), 에리시뮴(*Erysimum*), 유포르비아(*Euphorbia*), 갈레옵시스(*Galeopsis*), 갈린소가(*Galinsoga*), 갈륨(*Galium*), 히비스쿠스(*Hibiscus*), 이포모에아(*Ipomoea*), 코키아(*Kochia*), 라미움(*Lamium*), 레피듐(*Lepidium*), 린데르니아(*Lindernia*), 마트리카리아(*Matricaria*), 멘타(*Mentha*), 메르쿠리알리스(*Mercurialis*), 물루고(*Mullugo*), 미오소티스(*Myosotis*), 파파베르(*Papaver*), 파르비티스(*Pharbitis*), 플란타고(*Plantago*), 폴리고눔(*Polygonum*), 포르툴라카(*Portulaca*), 라누쿨루스(*Ranunculus*), 라파누스(*Raphanus*), 로리파(*Rorippa*), 로탈라(*Rotala*), 루멕스(*Rumex*), 살솔라(*Salsola*), 세네시오(*Senecio*), 세스바니아(*Sesbania*), 시다(*Sida*), 시나피스(*Sinapis*), 솔라눔(*Solanum*), 손쿠스(*Sonchus*), 스펜노클레아(*Sphenoclea*), 스텔라리아(*Stellaria*), 타락사쿰(*Taraxacum*), 틀라스피(*Thlaspi*), 트리폴리움(*Trifolium*), 우르티카(*Urtica*), 베로니카(*Veronica*), 비올라(*Viola*) 및 칸튬(*Xanthium*).

하기 속의 쌍떡잎 작물: 아라키스(*Arachis*), 베타(*Beta*), 브라시카(*Brassica*), 쿠쿠미스(*Cucumis*), 쿠쿠르비타(*Cucurbita*), 헬리안투스(*Helianthus*), 다우쿠스(*Daucus*), 글리시네(*Glycine*), 고시피움(*Gossypium*), 이포모에아(*Ipomoea*), 락투카(*Lactuca*), 리눔(*Linum*), 리코퍼시콘(*Lycopersicon*), 니코티아나(*Nicotiana*), 파세올루스(*Phaseolus*), 피썃(*Pisum*), 솔라눔(*Solanum*) 및 비시아(*Vicia*),

하기 속의 외떡잎 잡초: 아에길롭스(*Aegilops*), 아그로피론(*Agropyron*), 아그로스티스(*Agrostis*), 알로페쿠루스(*Alopecurus*), 아페라(*Apera*), 아베나(*Avena*), 브라키아리아(*Brachiaria*), 브로무스(*Bromus*), 센크루스(*Cenchrus*), 코멜리나(*Commelina*), 시노돈(*Cynodon*), 사이페루스(*Cyperus*), 닥틸로크테니움(*Dactyloctenium*), 디기타리아(*Digitaria*), 에키노클로아(*Echinochloa*), 엘레오카리스(*Eleocharis*), 엘레우신(*Eleusine*), 에라그로스티스(*Eragrostis*), 에리오클로아(*Eriochloa*), 페스투카(*Festuca*), 펴브리스틸리스(*Fimbristylis*), 헤테란테라(*Heteranthera*), 임페라타(*Imperata*), 이스카에뮴(*Ischaemum*), 랩토클로아(*Leptochloa*), 롤리움(*Lolium*), 모노코리아(*Monochoria*), 파니쿰(*Panicum*), 파스팔룸(*Paspalum*), 팔라리스(*Phalaris*), 플레움(*Phleum*), 포아(*Poa*), 로트보엘리아(*Rottboellia*), 사기타리아(*Sagittaria*), 쉬르푸스(*Scirpus*), 세타리아(*Setaria*) 및 소르굼(*Sorghum*).

하기 속의 외떡잎 작물: 알리움(*Allium*), 아나나스(*Ananas*), 아스파라구스(*Asparagus*), 아베나(*Avena*), 호르데움(*Hordeum*), 오리자(*Oryza*), 파니쿰(*Panicum*), 사카룸(*Saccharum*), 세칼레(*Secale*), 소르굼(*Sorghum*), 트리티칼레(*Triticale*), 트리티쿰(*Triticum*) 및 제아(*Zea*).

그러나, 본 발명에 따른 활성 화합물의 용도는 상기 속에 전혀 제한되지 않으며, 또한 동일한 방식으로 다른 식물들에게까지 확대된다.

본 발명에 따른 활성 화합물은, 농도에 따라, 예를 들어 산업 지역 및 철로위에, 그리고 나무가 심어져 있거나 심어져 있지 않은 보도 및 광장위에 있는 잡초들의 총체적인 방제에 적당하다. 마찬가지로, 본 발명에 따른 활성 화합물은 예를 들면 조림지, 관상수 재배장, 과수원, 포도원, 감귤밭, 견과류 과수원, 바나나 농장, 커피 농장, 차 농장, 고무 농장, 야자 농장, 코코아 농장, 연한 과일 식림지 및 흙밭, 잔디, 뗏장 및 목초지에 자라는 다년생 작물 중의 잡초를 방제하기 위해, 그리고 일년생 작물 중의 잡초를 선택적으로 방제하기 위해 사용될 수 있다.

본 발명에 따른 화합물은 토양 및 식물의 지상부에 적용한 경우 강력한 제초 활성 및 광범위한 활성 스펙트럼을 나타낸다. 이들은 또한 어느 정도까지든 발아전 및 발아후 방법 둘 모두에 의해 외떡잎 및 쌍떡잎 작물에서 외떡잎 및 쌍떡잎 잡초를 선택적으로 방제하는데 적합하다.

특정 농도 또는 적용 비율에서, 본 발명에 따른 활성 화합물은 또한 동물 해충 및 진균 또는 박테리아 식물 질병을 방제하는데 사용될 수 있다. 경우에 따라, 이들 화합물은 다른 활성 화합물을 함성하기 위한 중간체 또는 전구체로서 또한 사용될 수 있다.

본 발명에 따라, 식물 전체 및 식물의 일부가 처리될 수 있다. 본 명세서에서 식물이란 원하거나 원치않는 야생 식물 또는 작물(자연 발생 작물 포함)과 같은 모든 식물 및 식물 개체군을 의미한다. 작물은 식물 육종가 권한에 의해 보호될 수 있거나 보호될 수 없는 식물 품종 및 유전자이식(transgenic) 식물을 포함하여, 통상적인 식물 육종 및 최적화 방법에 의해, 생명공학 및 재조합 방법에 의해 또는 이들 방법을 조합하여 얻을 수 있는 식물일 수 있다. 식물의 일부는 어린싹, 잎, 꽃 및 뿌리와 같이 지상 및 지하에 존재하는 식물의 모든 부분 및 기관을 의미하는 것으로 이해되며, 언급될 수 있는 예로서 잎, 침엽(needles), 자루(stalk), 줄기(stem), 꽃, 과실체, 과일, 종자, 뿌리, 괴경 및 뿌리 줄기가 언급될 수 있다. 식물의 일부는 또한 수확 물질, 및 영양 및 생식 번식 물질, 예를 들어 묘목, 괴경, 뿌리 줄기, 삽목 및 종자를 포함한다.

본 발명에 따라 활성 화합물로 식물 및 식물의 일부를 처리하는 것은 통상의 처리 방법에 따라, 예를 들어 침지, 분무, 증발, 분사, 살포, 도포에 의해, 전과 물질, 특히 종자의 경우에는 또한 일 또는 다층 코팅에 의해 직접, 또는 그의 주변, 환경 또는 저장 공간에 작용시킴으로써 수행된다.

상기 언급된 바와 같이, 본 발명에 따라 모든 식물 및 식물의 일부가 처리될 수 있다. 바람직한 구체예에서, 야생 식물종 및 식물 품종 또는 통상적인 생물학적 육종법, 예를 들어 교잡육종 또는 원형체 융합(protoplast fusion)에 의해 얻어진 식물종 및 식물 품종뿐 아니라 이들의 일부가 처리된다. 또 다른 바람직한 구체예에서, 적합하다면 통상적인 방법과 함께 유전자공학 방법에 의해 얻어진 유전자이식 식물 및 식물 품종(유전자 변형 유기체) 및 이들의 일부가 처리된다. 용어 "일부", "식물의 일부" 또는 "식물 부분"은 상술한 바와 같다.

특히 바람직하게는, 각 경우에 시판되거나 사용중인 식물 품종의 식물이 본 발명에 따라 처리된다.

식물 종 또는 식물 품종, 이들의 위치 및 성장 조건(토양, 기후, 생장기, 사료)에 따라, 본 발명에 따라 처리함으로써 또한 상가("상승")적 효과가 나타날 수 있다. 따라서, 예를 들어 본 발명에 따라 사용될 수 있는 물질 및 조성물의 적용비율의 감

소 및/또는 활성 스펙트럼의 확대 및/또는 활성 증가, 식물 성장성 향상, 고온 또는 저온 내성 증가, 가뭄, 또는 물 또는 토양 염분에 대한 내성 증가, 개화량 증가, 수확 용이성, 성숙성 촉진, 작화량 증가, 수확 작물의 질 향상 및/또는 영양가 증대, 및 수확 작물의 저장 품질 및/또는 처리성 증대와 같은 효과가 실제 기대되는 것 이상으로 나타날 수 있다.

본 발명에 따라 처리되는 바람직한 유전자이식 식물 또는 식물 품종(즉, 유전 공학적으로 얻어진 것)은 유전자 변형식 식물에 특히 유리한 유용성("특성")을 제공하는 유전자 물질을 수용하는 모든 식물을 포함한다. 이러한 특성의 예로는 식물 성장성 향상, 고온 또는 저온 내성 증가, 가뭄, 또는 물 또는 토양 염분에 대한 내성 증가, 개화량 증가, 수확 용이성, 성숙성 촉진, 작화량 증가, 수확 작물의 질 향상 및/또는 영양가 증대, 및 수확 작물의 저장 품질 및/또는 처리성 증대가 포함된다. 추가적으로 특히 주목할만한 상기 특성의 예로 동물 및 미생물 해충, 예를 들어 곤충, 응애, 식물병원성 진균, 박테리아 및/또는 바이러스에 대한 식물의 방어력 증가 및 또한 특정 제초 활성 화합물에 대한 식물의 내약성 증가가 있다. 유전자이식 식물의 예로 곡물(밀, 보리), 옥수수, 대두, 감자, 목화, 유채 및 또한 과수 식물(사과, 배, 감귤 및 포도 과일이 열리는)이 언급될 수 있으며, 옥수수, 대두, 감자, 목화 및 유채가 특히 주목된다. 특히 중요한 특성은 식물에 형성된 독소, 특히 바실러스 투링기엔시스(*Bacillus Thuringiensis*)로부터 얻은 유전자 물질(예를 들어 유전자 CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb 및 CryIF 및 이들 조합)에 의해 식물(이후 "Bt 식물"로 언급)에 형성된 독소로 인한 곤충에 대한 식물의 방어력 증가이다. 특히 중요한 특성은 또한 특정 제초 활성 화합물, 예를 들어 이미다졸리논, 설폰닐우레아, 글리포세이트 또는 포스포노트리신(예를 들어 "PAT" 유전자)에 대한 식물의 내약성 증가다. 필요한 해당 특성을 부여하는 유전자가 또한 상호 조합으로 유전자 식물에 존재할 수 있다. "Bt 식물"의 예로 YIELD GARD^R (예: 옥수수, 목화, 대두), KnockOut^R (예: 옥수수), StarLink^R (예: 옥수수), Bollgard^R (예: 목화), Nucotr^R (예: 목화) 및 NewLeaf^R (예: 감자) 상품명으로 시판되고 있는 옥수수 품종, 목화 품종, 대두 품종 및 감자 품종이 언급될 수 있다. 제초제-내약성 식물의 예로 Roundup Ready^R (글리포세이트 내약성, 예: 옥수수, 목화, 대두), Liberty Link^R (포스포노트리신 내약성, 예: 유채), IMI^R (이미다졸리논 내약성) 및 STS^R (설폰닐우레아 내약성, 예: 옥수수) 상품명으로 시판되고 있는 옥수수 품종, 목화 품종 및 대두 품종이 언급될 수 있다. 제초제-내약성 식물(제초제 내약성을 위해 통상적인 방법으로 육종된 식물)의 예로 Clearfield^R 명으로 시판되고 있는 품종(예: 옥수수)가 또한 언급될 수 있다. 물론, 상기 설명은 또한 미래에 개발될 수 있고/있거나 미래에 상품화될 식물로, 상술된 유전적 특성을 지니거나 유전자 특성이 여전히 개발될 여지가 남아 있는 식물 품종에 적용될 수 있다.

상기 언급된 식물들은 본 발명에 따라 본 발명에 따른 활성 혼합물로 특히 유리한 방식으로 처리될 수 있다. 이들 혼합물에 대해 상기 언급된 바람직한 범위가 또한 이들 식물을 처리하는데 적용된다. 본 명세서에 구체적으로 언급된 혼합물로 식물을 처리하는 것이 특히 유리하다.

활성 화합물은 용액제, 유제, 수화성 산제, 현탁제, 산제, 분제, 페이스트, 가용성 산제, 과립제, 현탁액-유제 농축액, 활성 화합물로 함침된 천연 및 합성물질, 및 중합물질 중의 극미세 캡셀과 같은 통상의 제제로 전환될 수 있다.

이들 제제는 공지된 방법으로, 예를 들어, 임의로 계면활성제, 즉 유화제 및/또는 분산제 및/또는 포움-형성제를 사용하여 활성 화합물을 증량제, 즉 액체 용매 및/또는 고형 담체와 혼합하여 제조된다.

사용된 증량제가 물인 경우, 예를 들어 유기 용매를 보조 용매로 사용하는 것이 또한 가능하다. 주로 적합한 액체 용매는 크실렌, 톨루엔 또는 알킬나프탈렌과 같은 방향족 화합물, 클로로벤젠, 클로로에틸렌 또는 메틸렌 클로라이드와 같은 염소화 방향족 및 염소화 지방족 탄화수소, 사이클로헥산 또는 파라핀, 예를 들어, 석유 분획물, 광유 및 식물유와 같은 지방족 탄화수소, 부탄올 또는 글리콜과 같은 알콜 및 이들의 에테르 및 에스테르, 아세톤, 메틸 에틸 케톤, 메틸 이소부틸 케톤 또는 사이클로헥사논과 같은 케톤, 디메틸포름아미드 및 디메틸설폭사이드와 같은 강한 극성 용매 및 물이다.

적합한 고형 담체는 예를 들어 암모늄염, 및 카올린, 점토, 활석, 백악, 석영, 아타펄가이트, 몬모릴로나이트 또는 규조토와 같은 분쇄된 천연 광물, 및 고분산 실리카, 알루미늄 및 실리콘이트와 같은 분쇄된 합성 광물이다. 적합한 과립제용 고형 담체는 예를 들어 방해석, 대리석, 경석, 해포석 및 백운석과 같은 분쇄 및 분류된 천연 암석, 및 무기 및 유기 가루의 합성 과립, 및 톱밥, 코코넛 껍질, 옥수수 속대 및 담배줄기와 같은 유기물질의 과립이다. 적합한 유화제 및/또는 포움 형성제는 예를 들어 비이온성 및 음이온성 유화제, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 지방산 에스테르, 폴리옥시에틸렌 지방 알콜 에테르, 예를 들어 알킬아릴 폴리글리콜 에테르, 알킬설포네이트, 알킬설페이트, 아릴설포네이트 및 단백질 가수분해물이다. 적합한 분산제는 예를 들어 리그노설파이트 폐액 및 메틸셀룰로오스이다.

점착제, 예를 들어 카복시메틸셀룰로오즈, 및 아라비아고무, 폴리비닐 알콜 및 폴리비닐 아세테이트와 같은 분말, 과립 또는 라텍스 형태의 천연 및 합성 중합체, 및 또한 세팔린 및 레시틴과 같은 천연 인지질, 및 합성 인지질이 제제에 사용될 수 있다. 다른 가능한 첨가제로 광유 및 식물유가 있다.

착색제, 예를 들어 산화철, 산화티탄 및 프루시안 블루와 같은 무기안료, 알리자린 염료, 아조 염료 및 금속 프탈로시아닌 염료와 같은 유기염료 및 철, 망간, 붕소, 구리, 코발트, 몰리브덴 및 아연의 염과 같은 미량 영양소를 사용할 수 있다.

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

잡초를 방제하는 경우, 본 발명에 따른 활성 화합물은 그 자체로 또는 그의 제제 형태로 또한 공지된 제초제 및/또는 작물과의 사용성을 향상시키기 위한 물질("독성 완화제")과의 혼합물로서 사용될 수 있으며, 완제품 제제 또는 탱크 믹스(tank mix)가 가능하다. 하나 이상의 공지된 제초제 및 독성 완화제를 함유하는 잡초-킬러와의 혼합물이 또한 가능하다.

혼합물에 가능한 성분은 공지된 제초제, 예를 들어 아세토클로르, 아시플루오르펜(-소듐), 아클로니펜, 알라클로르, 알록시디움(-소듐), 아메트린, 아미카바존, 아미도클로르, 아미도설푸론, 아닐로포스, 아설파, 아트라진, 아자페니딘, 아짐설푸론, BAS-662H, 베플루부타미드, 베나졸린(-에틸), 벤푸레세이트, 벤설푸론(-메틸), 벤타존, 벤즈벤디존, 벤조비사이클론, 벤조페남, 벤조일프로프(-에틸), 비알라포스, 비페녹스, 비스피리박(-소듐), 브로모부타이드, 브로모페녹심, 브로목시닐, 부타클로르, 부타페나실(-알릴), 부트록시디움, 부틸레이트, 카펜스트롤, 칼옥시디움, 카베타미드, 카펜트라존(-에틸), 클로메톡시펜, 클로람벤, 클로리다존, 클로리무론(-에틸), 클로르니트로펜, 클로르설푸론, 클로르톨루론, 시니돈(-에틸), 신메틸린, 시노설푸론, 클레폭시디움, 클레토디움, 클로리나포프(-프로파길), 클로마존, 클로메프로프, 클로피랄리드, 클로피라설푸론(-메틸), 클로란설파(-메틸), 쿠밀우론, 시아나진, 사이부트린, 사이클로에이트, 사이클로설파무론, 시아클록시디움, 사이할로포프(-부틸), 2,4-D, 2,4-DB, 데스메디팜, 디알레이트, 디캄바, 디클로르프로프(-P), 디클로포프(-메틸), 디클로설파, 디에타틸(-에틸), 디펜조쿠아트, 디플루페니칸, 디플루펜조피르, 디메푸론, 디메피페레이트, 디메타클로르, 디메타메트린, 디메텐아미드, 디메스플람, 디니트라민, 디펜아미드, 디쿠아트, 디티오피르, 디우론, 덤론, 에포프로단, EPTC, 에스프로카브, 에탈플루랄린, 에타메트설푸론(-메틸), 에토푸메세이트, 에톡시펜, 에톡시설푸론, 에토벤자니드, 페녹사프로프(-P-에틸), 펜트라자미드, 플람프로프(-이소프로필, -이소프로필-L, -메틸), 플라자설푸론, 플로라설파, 플루아지포프(-P-부틸), 플루아졸레이트, 플루카바존(-소듐), 플루페나세트, 플루메트설파, 플루미클로락(-펜틸), 플루미옥사진, 플루미프로핀, 플루메트설파, 플루오메투론, 플루오로클로리돈, 플루오로글리코펜(-에틸), 플루폭삼, 플루프로파실, 플루르피르설푸론(-메틸, -소듐), 플루레놀(-부틸), 플루리돈, 플루록시피르(-부톡시프로필, -헵틸), 플루르프리미돌, 플루르타몬, 플루티아세트(-메틸), 플루티아미드, 포메사펜, 포란설푸론, 글루포시네이트(-암모늄), 글리포세이트(-이소프로필암모늄), 할로사펜, 할록시포프(-에톡시에틸, -P-메틸), 헥사지논, 이마자메타벤즈(-메틸), 이마자메타피르, 이마자목스, 이마자픽, 이마자피르, 이마자퀸, 이마제타피르, 이마조설푸론, 요오도설푸론(-메틸, -소듐), 이옥시닐, 이소프로팔린, 이소프로투론, 이소우론, 이속사벤, 이속사클로르톨, 이속사플루톨, 이속사피리포프, 락토펴, 레나실, 리누론, MCPA, 메코프로프, 메페나세트, 메소트리온, 메타미트론, 메타자클로르, 메타벤즈티아주론, 메토벤주론, 메토브로무론, (알파-)메톨라클로르, 메토설파, 메톡수론, 메트리부진, 메트설푸론(-메틸), 몰리네이트, 모놀리누론, 나프로아닐리드, 나프로파미드, 네부론, 니코설푸론, 노르플루라존, 오르벤카브, 오리잘린, 옥사디아르길, 옥사디아존, 옥사설푸론, 옥사지클로메폰, 옥시플루오르펜, 파라쿠아트, 펠라르곤산, 펜디메탈린, 펜드랄린, 펜톡사존, 펜메디팜, 피콜리나펜, 피페로포스, 프레틸라클로르, 프리미설푸론(-메틸), 프로플루아졸, 프로메트린, 프로파클로르, 프로파닐, 프로파퀴자포프, 프로피소클로르, 프로폭시카바존(-소듐), 프로피자미드, 프로설파카브, 프로설푸론, 피라플루펜(-에틸), 피라조길, 피라졸레이트, 피라조설푸론(-에틸), 피라족시펜, 피리벤족심, 피리부티카브, 피리데이트, 피리다톨, 피리프탈리드, 피리미노박(-메틸), 피리티오박(-소듐), 퀴클로락, 퀴메락, 퀴노클라민, 퀴잘로포프(-P-에틸, -P-테푸틸), 림설푸론, 세톡시디움, 시마진, 시메트린, 설프트리온, 설프트라존, 설프메투론(-메틸), 설프세이트, 설프설푸론, 테부탐, 테부티우론, 테프랄록시디움, 테부틸라진, 테르부트린, 테닐클로르, 티아플루아미드, 티아조피르, 티디아지민, 티펜설푸론(-메틸), 티오벤카브, 티오카바질, 트랄록시디움, 트리알레이트, 트리아설푸론, 트리베누론(-메틸), 트리클로피르, 트리디팜, 트리플루랄린, 트리플록시설푸론, 트리플루설푸론(-메틸) 및 트리플루설푸론이다.

살진균제, 살충제, 살비제, 살선충제, 새 퇴치제, 식물 영양제 및 토양 구조개선제와 같은 그 밖의 다른 공지된 활성 화합물과의 혼합물이 또한 가능하다.

활성 화합물은 그 자체로, 그의 제제 형태로 또는 이들을 추가로 희석하여 제조된 사용형태, 예를 들어 즉시 사용형 용액, 현탁제, 유제, 산제, 페이스트 및 과립으로 사용될 수 있다. 이들은 통상적인 방법으로, 예를 들어 살수, 분무, 연무 또는 산포에 의해 사용된다.

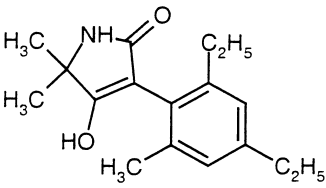
본 발명에 따른 활성 화합물은 식물의 발아 전후 모두에 적용될 수 있다. 이들을 파종전에 토양에 혼입시킬 수도 있다.

사용되는 활성 화합물의 양은 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 이는 본질적으로 목적하는 효과의 성질에 따라 달라진다. 일반적으로 사용량은 토양 표면 1 헥타르당 활성 화합물 1 g 내지 10 kg, 바람직하게는 5 g 내지 5 kg이다.

본 발명에 따른 활성 화합물의 제조에 및 사용예가 하기 실시예로 설명된다.

제조실시예

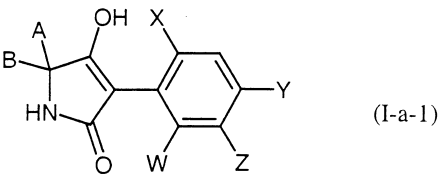
실시예 I-1-a-1



60 °C에서, 무수 디메틸포름아미드(DMF) 1 ml에 용해시킨 실시예 (II-1)의 화합물 7.4 g을 무수 DMF 25 ml 중 포타슘 t-부톡사이드 6.5 g에 적가하여 교반을 계속하고 박층 크로마토그래피에 의해 반응을 모니터링하였다. 반응이 종료된 후, 빙수 170 ml를 첨가하고 혼합물을 0 내지 10 °C에서 농염산을 사용하여 pH 2로 산성화시키고 흡인여과하여 여과 케이크를 빙수로 세척하였다. 잔류물을 메틸렌 클로라이드/메탄올 9:1의 이동상을 사용하여 실리카 겔 상에서 크로마토그래피하여 정제하였다.

수율: 3.90 g(이론치의 약 58.00%), m.p. 199 °C

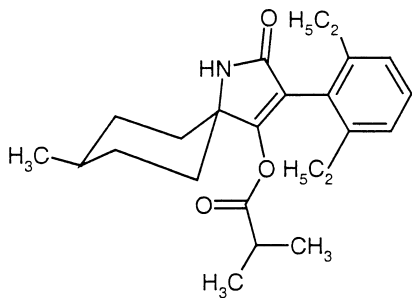
실시예 (I-1-a-1)과 유사하게 그리고 일반적인 제조 지침에 따라, 하기 일반식 (I-a-1)의 화합물을 수득하였다:



실시예 번호	W	X	Y	Z	A	B	m.p.°C	이성체
I-1-a-2	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		154	β
I-1-a-3	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		225	β
I-1-a-4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	200	-
I-1-a-5	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		115	β
I-1-a-6	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		222	β
I-1-a-7	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>230	β

실시예 번호	W	X	Y	Z	A	B	m.p. °C	이성체
I-1-a-8	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	>220	-
I-1-a-9	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		114	β
I-1-a-10	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>220	β
I-1-a-11	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>220	-
I-1-a-12	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	109	-
I-1-a-13	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		216	β
I-1-a-14	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	160	-
I-1-a-15	H	CH ₃	H	C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		197	β
I-1-a-16	H	CH ₃	H	C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		193	β
I-1-a-17	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		233	β
I-1-a-18	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		184	β
I-1-a-19	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		156	β
I-1-a-20	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		168	β
I-1-a-21	CH ₃	CH ₃	-C≡CH	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		127	β
I-1-a-22	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		211	β
I-1-a-23	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		210	β
I-1-a-24	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>220	-
I-1-a-25	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	192	-
I-1-a-26	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		181	β
I-1-a-27	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		222	β
I-1-a-28	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		278	β
I-1-a-29	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		268	β
I-1-a-30	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		248	α

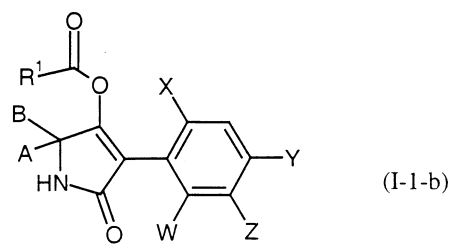
실시예 I-1-b-1



무수 에틸 아세테이트 50 ml 중 화합물 (I-1-a-10) 2.5 g을 트리에틸아민 1.7 ml과 함께 환류하에 가열하고, 무수 에틸 아세테이트 5 ml 중 이소부틸 클로라이드 1.3 ml를 적가한 다음 혼합물을 환류하에 교반하고 박층 크로마토그래피에 의해 반응을 모니터링하였다. 용매를 증류시킨 후 잔류물을 메틸렌 클로라이드에 용해시키고 50 ml의 0.5 N NaOH로 세척한 다음 건조시키고 회전 증발기를 사용하여 농축시켰다. 이어, 잔류물을 메틸 t-부틸 에테르(MTB 에테르)/n-헥산으로부터 재결정화시켰다.

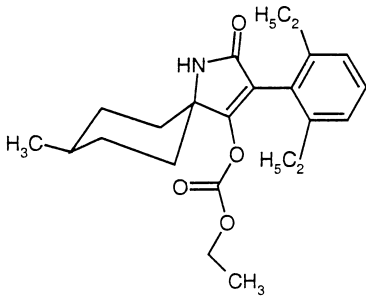
수율: 2 g(이론치의 약 65 %), m.p. 209 °C

실시예 (I-1-b-1)과 유사하게 그리고 일반적인 제조 지침에 따라 하기 일반식 (I-1-b)의 화합물을 제조하였다:



실시예 번호	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	m.p. °C	이성체
I-1-b-2	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇	145	-
I-1-b-3	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H ₅ C ₂ -O-CH ₂ -	135	β
I-1-b-4	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	H ₅ C ₂ -O-CH ₂ -	76	-
I-1-b-5	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	201	β
I-1-b-6	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₄ H ₉	215	β
I-1-b-7	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	190	-

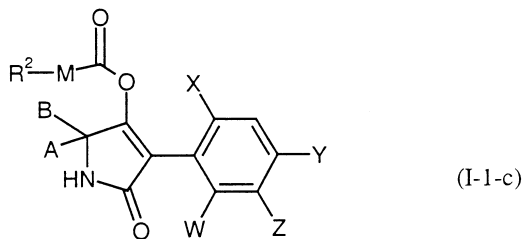
실시예 I-1-c-1



실시예 (I-1-a-10)의 화합물 2.51 g 및 트리에틸아민 1.2 ml을 우선 도입하였다. 0 내지 10 °C에서, 무수 디클로로메탄 5 ml중 에틸 클로로포르메이트 0.8 ml를 적가한 후 혼합물을 실온에서 교반하고 박층 크로마토그래피에 의해 반응을 모니터링하였다. 이어 혼합물을 0.5 N NaOH로 세척한 다음 건조시키고 용매를 증류시켰다. 잔류물을 메틸 t-부틸 에테르/n-헥산으로부터 재결정화시켰다.

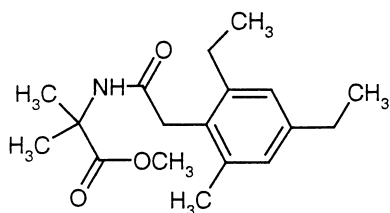
수율: 1.1 g(이론치의 약 30 %), m.p. 178 °C

실시예 (I-1-c-1)과 유사하게 그리고 일반적인 제조 지침에 따라 하기 일반식 (I-1-c)의 화합물을 제조하였다:



실시예 번호	W	X	Y	Z	A	B	M	R ²	m.p. °C	이성체
I-1-c-2	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	194	β
I-1-c-3	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	119	-
I-1-c-4	CH ₃	CH ₃	-C≡CH	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	171	β
I-1-c-5	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	i-C ₄ H ₉	155	β
I-1-c-6	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	215	-
I-1-c-7	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	137	β
I-1-c-8	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	168	β

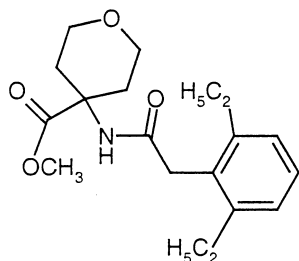
실시예 II-1



80 °C에서, 2,4-디에틸-6-메틸-페닐아세트산 7.5 g 및 티오닐 클로라이드 9.2 ml를 가스 발생이 중지할 때까지 가열하였다. 과량의 티오닐 클로라이드를 증류시키고, 잔류물을 무수 THF 30 ml에 용해시켰다. 0 내지 10 °C에서, 이 용액을 트리 에틸아민 24.6 ml와 혼합한 무수 THF 320 ml중 메틸 2-아미노-2-메틸프로파노에이트 12.3 g에 적가하고, 이 혼합물을 실온에서 1 시간 교반하였다. 그 후, 이 용액을 회전 증발기를 사용하여 농축한 잔류물을 메틸렌 클로라이드 및 1N HCl에 용해시키고, 생성물을 추출하고 유기 상을 건조시키고 회전 증발기를 사용하여 농축하였다. 잔류물을 MTB 에테르/n-헥산으로부터 재결정화시켰다.

수율: 8.07 g(이론치의 약 66 %), m.p. 120-122 °C

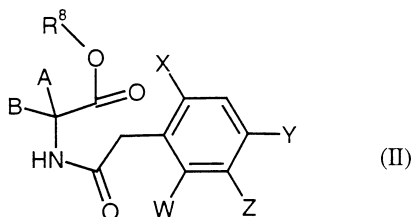
실시예 II-11



30 내지 40 °C의 내부온도에서, 메틸렌 클로라이드 110 ml중 현탁액으로서 실시예 (XXVII-1)의 화합물 10.3 g을 16.9 g의 농황산에 첨가하고, 이 혼합물을 2 시간 교반하였다. 무수 메탄올 23 ml를 적가한 다음, 이 혼합물을 40 내지 70 °C에서 6 시간 교반하였다. 이 용액을 0.18 kg의 얼음에 붓고 생성물을 메틸렌 클로라이드로 추출한 다음 유기 상을 NaHCO₃ 용액으로 세척하였다. 유기 상을 건조시키고 회전 증발기를 사용하여 농축시킨 다음 잔류물을 MTB 에테르/n-헥산으로부터 재결정화시켰다.

수율: 8.7 g(이론치의 76 %), m.p. 137 °C

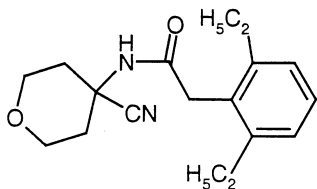
실시에 (II-1)의 방법과 유사하게 그리고 일반적인 제조 지침에 따라 하기 일반식 (II)의 화합물을 수득하였다:



실시예 번호	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	m.p.°C	이성체
II-2	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	169	β
II-3	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	94	β
II-4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	109	-
II-5	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	141	β
II-6	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	165	β
II-7	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	112	β
II-8	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	126	-
II-9	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	101	β
II-10	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	108	β
II-11	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	137	-
II-12	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	102	-
II-13	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	169	β
II-14	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	CH ₃	93	-
II-15	H	CH ₃	H	C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	112	β
II-16	H	CH ₃	H	C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	71	β
II-17	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	69	β
II-18	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	61	β
II-19	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	151	β
II-20	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	123	β
II-21	CH ₃	CH ₃	-C≡CH	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	141	β
II-22	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	98	β

실시예 번호	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	m.p.°C	이성체
II-23	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	149	β
II-24	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	164	-
II-25	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	141	-
II-26	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	103	β
II-27	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	Oil	β
II-28	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	234	β
II-29	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	140	β

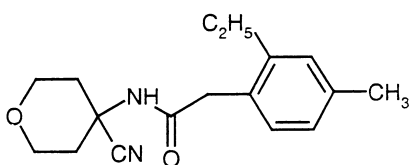
실시예 XXVII-1



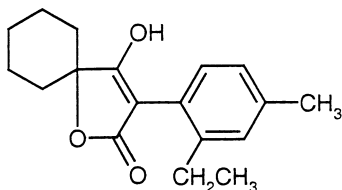
80 ℃에서, 2,4-디에틸-6-메틸-페닐아세트산 7.68 g 및 티오닐 클로라이드 9.1 ml를 가스 발생이 중지할 때까지 가열하였다. 과량의 티오닐 클로라이드를 증류시키고, 잔류물을 무수 톨루엔 40 ml에 용해시켰다. 0 내지 10 ℃에서, 이 용액을, 트리에틸아민 6.2 ml와 혼합한 무수 THF 80 ml중 4-아미노-4-시아노-테트라하이드로피란 9 g에 적가하고, 이 혼합물을 실온에서 1 시간 교반하였다. 이 용액을 회전 증발기를 사용하여 농축시킨 다음 잔류물을 메틸렌 클로라이드 중 1N HCl에 용해시키고, 유기 상을 건조시키고 회전 증발기를 사용하여 농축하였다. 잔류물을 MTB 에테르/n-헥산으로부터 재결정화시켰다.

수율: 10.3 g(이론치의 약 85 %), m.p. 155 ℃

실시예 (XXVII-1)과 유사하게, 융점 142 ℃를 가진 실시예 (XXVII-2)의 화합물을 수득하였다:



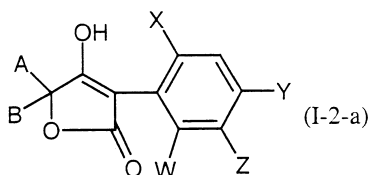
실시예 I-2-a-1



0 내지 10 ℃에서, 무수 DMF 50 ml에 용해시킨 실시예 (III-1)의 화합물 16.6 g을 무수 DMF 50 ml중 포타슘 t-부톡사이드 8.4 g에 적가하고, 이 혼합물을 실온에서 8 시간 교반하였다. 반응이 종료된 후, 1N HCl 1000 ml를 빙냉하에 적가하고, 이 혼합물을 30 분간 교반하였다. 침전물을 여과하고 물로 세척한 다음 감압하에 건조시켰다.

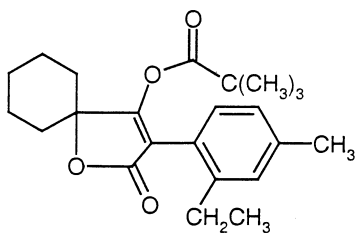
수율: 11.5 g(이론치의 약 80%), m.p. 135 ℃

실시예 (I-2-a-1)과 유사하게 그리고 일반적인 제조 지침에 따라 하기 일반식 (I-2-a)의 화합물을 수득하였다:



실시예 번호	W	X	Y	Z	A	B	m.p. °C
I-2-a-2	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		오일
I-2-a-3	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₅ -		223-225
I-2-a-4	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		175-178
I-2-a-5	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		오일

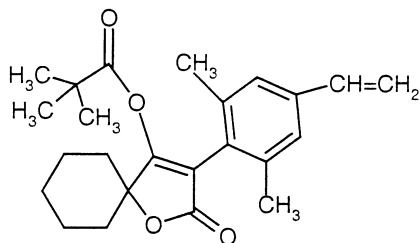
실시예 I-2-b-1



트리에틸아민 2.08 ml를, 40 ml의 무수 메틸렌 클로라이드(CH_2Cl_2)에 용해시킨 실시예 (I-2-a-1)의 화합물 2.86 g에 첨가하였다. 0-10 °C에서, 10 ml의 CH_2Cl_2 중 피발로일 클로라이드 1.5 g을 첨가하고, 혼합물을 실온에서 20 시간 교반하였다. 반응 용액을 우선 10 % 세기의 시트르산으로 세척한 다음 1 N NaOH로 세척하고, 건조시킨 다음 회전 증발기를 사용하여 농축시키고, 잔류물을 석유 에테르와 함께 교반하였다.

수율: 2.2 g(이론치의 약 60 %), m.p. 110-112 °C

실시예 I-2-b-2

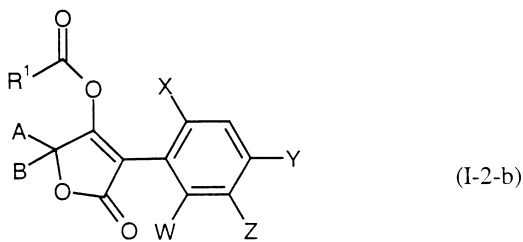


WO 97/02243으로부터의 실시예 (I-2-b-2)의 화합물 1.2 g(2.76 밀리몰)을 우선 20 ml의 톨루엔에 도입한 다음, 트리부틸-비닐 주석 3.5 g(11 밀리몰), $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ 133 mg(0.11 밀리몰) 및 2 개의 2,6-디-*t*-부틸-4-메틸크레졸 결정을 첨가하고, 혼합물을 환류하에 밤새 비등시킨 다음 회전 증발기를 사용하여 농축하였다.

정제시키기 위해, 조 혼합물을 실리카 겔 상에서 크로마토그래피하고, 우선 과량의 주석 화합물을 사이클로헥산으로 용리시킨 다음 이동상을 사이클로헥산/에틸 아세테이트(2:1)로 이동상을 바꿔 생성물을 용리시켰다. 조 생성물을 석유 에테르로 분쇄하여 추가 정제하였다.

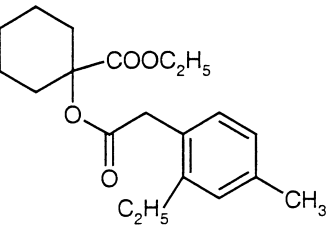
수율: m.p. 152-155 °C의 무색 결정 0.46 g(이론치의 44%)

실시예 (I-2-b-1) 및 (I-2-b-2)와 유사하게 그리고 일반적인 제조 지침에 따라 하기 일반식 (I-2-b)의 화합물을 수득하였다:



실시예 번호	W	X	Y	Z	A B	R ¹	m.p.°C
I-2-b-3	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₅ -	t-C ₄ H ₉ -CH ₂	162-164
I-2-b-4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	t-C ₄ H ₉	오일
I-2-b-5	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	t-C ₄ H ₉	158-160
I-2-b-6	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	t-C ₄ H ₉	143-145
I-2-b-7	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H		t-C ₄ H ₉	155-157
I-2-b-8	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	t-C ₄ H ₉	145
I-2-b-9	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₅ -	t-C ₄ H ₉	96-98
I-2-b-10	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	t-C ₄ H ₉	90-93
I-2-b-11	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	H ₅ C ₂ -CHCH ₃	오일
I-2-b-12	H	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	s-C ₄ H ₉	오일
I-2-b-13	H	CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	i-C ₃ H ₇	오일

실시예 III-1

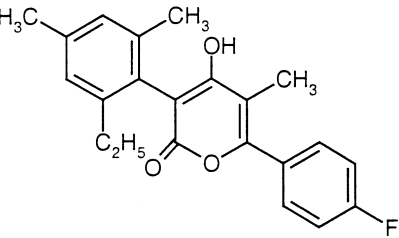


80 ℃에서, 티오닐 클로라이드 7.3 ml 및 무수 톨루엔 50 ml 중 2-에틸-4-메틸-페닐아세트산 8.9 g을 가스 발생이 중지할 때까지 가열하였다. 과량의 티오닐 클로라이드를 증류시키고, 잔류물을 무수 톨루엔 30 ml에 용해시켰다. 0 - 10 ℃에서, 이 용액을 무수 톨루엔 50 ml중 에틸 1-하이드록시-사이클로헥산카복실레이트 8.6 g에 적가하고, 이 혼합물을 환류하에 8 시간 교반하였다. 이어, 이 용액을 회전 증발기를 사용하여 농축하였다.

수율: 16.6 g(이론치의 약 99%)

잔류물을 응축하여 실시예(I-2-a-1)를 수득하는데 추가의 정제없이 사용되었다.

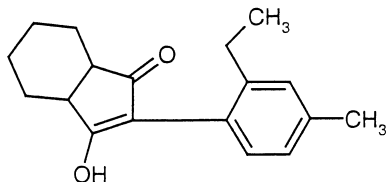
실시예 I-4-a-1



2-에틸-4,6-디메틸-2-페닐 클로로카보닐 케텐 2.4 g을 우선 30 ml의 무수 크실렌에 도입하고, 무수 크실렌 20 ml중 4-플루오로프로피오페논 1.5 g을 적가하였다. 혼합물을 환류하에 8 시간 가열하였다. 크실렌 용액을 물로 세척하고 황산나트륨으로 건조시킨 다음 감압하에 농축하였다. 톨루엔/에탄올 20:1의 이동상을 사용하여 실리카 겔 상에서 크로마토그래피 정제하였다.

수율: 1 g(이론치의 약 28 %), m.p. 161-162 °C

실시예 I-6-a-1

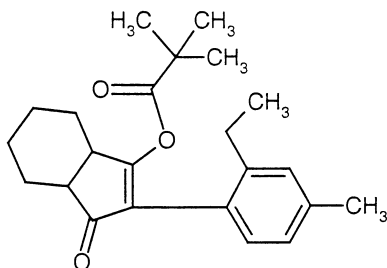


실시예 VIII-1의 화합물 5.3 g을 우선 50 ml의 무수 DMF에 도입하고 포타슘 t-부톡사이드 2.95 g과 혼합한 다음, 이 혼합물을 60 °C에서 1 시간 가열하였다.

반응 용액을 100 ml의 1N HCl과 혼합하고 CH₂Cl₂로 추출한 다음 유기 상을 건조 및 농축시켰다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(사이클로헥산:에틸아세테이트, 5:1)에 의해 정제하였다.

수율: 2.35 g(이론치의 49 %) m.p. 148 °C

실시예 I-6-b-1



실시예 (I-6-a-1)의 화합물 1 g을 우선 20 ml의 무수 메틸렌 클로라이드에 도입하여 0.77 ml의 트리에틸아민과 혼합하였다. 피발로일 클로라이드 0.68 ml을 1 ml의 메틸렌 클로라이드에 용해시키고 빙냉하에 적가한 다음, 혼합물을 실온에서 2 시간 교반하였다.

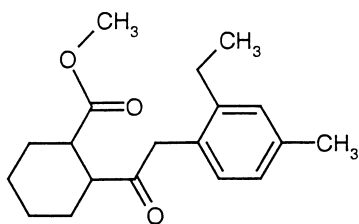
이 반응 용액을 10 % 시트르산 용액으로 2 회 추출하고, 유기 상을 1N NaOH로 두 번 세척한 다음 건조 및 농축하였다.

수율: 1.2 g(이론치의 92 %), 오일

¹H-NMR(500 MHz, CDCl₃):δ=1.1(s, 9H, -C(CH₃)₃),

2.31(s, 3H, Ar-CH₃); 2.45(q, 2H, Ar-CH₂-CH₃)ppm

실시예 VIII-1



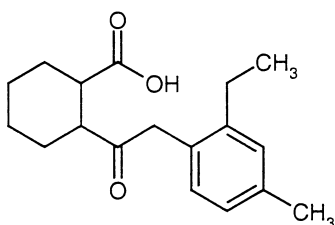
실시에 (XXXIV-1)로부터의 조 생성물 22.8 g을 우선 무수 아세톤 200 ml에 도입하여 탄산칼륨 10.9 g과 혼합하고, 메틸 요오다이드 33.6 g(14.75 ml)을 적가하였다. 이 혼합물을 환류하에 16 시간 교반하였다.

용매를 증류시키고, 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(메틸렌 클로라이드/석유 에테르=8:1)에 의해 정제하였다.

수율: 3.5 g(이론치의 30 %), 오일

이 생성물을 폐환하여 실시에 (I-6-a-1)을 수득하는데 직접 사용되었다.

실시에 XXXIV-1



무수 톨루엔 50 ml 중 DMF 한 방울, 티오닐 클로라이드 5.3 ml 및 모노메틸 사이클로헥산디카복실레이트 11.2 g을 가스 발생이 중지할 때까지 100 °C에서 가열하였다. 용매를 농축시켰다.

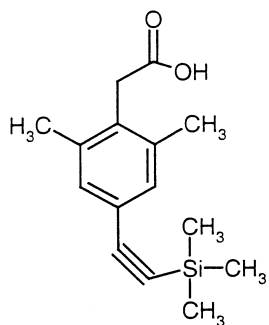
무수 THF 100 ml중 LDA 용액 50 ml의 용액을 -15 °C에서 무수 THF 20 ml중 메틸 2-에틸-4-메틸-페닐아세테이트 17.3 g의 용액과 적가 혼합한 다음 혼합물을 이 온도에서 30 분간 교반하였다.

-15 °C에서, 무수 THF 15 ml 중 상기 기술된 새로 제조한 산 클로라이드 용액을 적가하였다.

그 후 혼합물을 실온에서 1 시간 교반한 다음, 물 150 ml 및 암모늄 클로라이드 40 g을 첨가하였다. 중간체를 에테르로 추출하고 용액을 농축하였다. 잔류물을 KOH 100 g 및 물 330 ml과 함께 이틀동안 환류하에 비등시켰다.

수율: 23.70 g(이론치의 91%), 오일

실시에 XXV-1



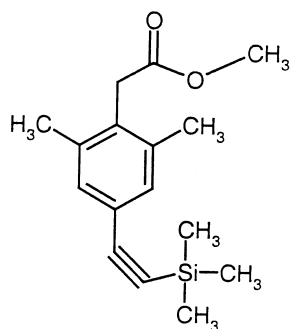
실온에서, 120 ml의 물에 용해시킨 수산화리튬 4.7 g을 THF 120 ml중 실시에 (XXX-1)의 화합물 26 g에 적가하고, 이 혼합물을 실온에서 8 시간 교반하였다.

이 반응 용액을 회전증발기를 사용하여 농축하여 물과 혼합하고 메틸 t-부틸 에테르로 추출하였다.

수정 상을 농염산을 사용하여 pH 2로 조정한 다음 침전물을 흡인여과하고 건조시켰다.

수율: 14 g(이론치의 59 %), m.p.: 156.3 °C

실시예 XXX-1



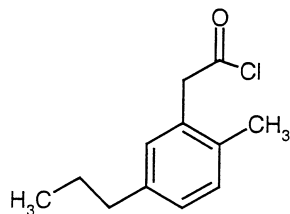
실온 및 아르곤 대기하에서, 트리에틸아민 70 ml 중 (WO 97/02243으로부터의 실시예 (XXVI-1)에 따른) 메틸 2,6-디메틸-4-브로모-페닐아세테이트 7.32 g의 용액에, 교반하면서 요오드화구리(I) 0.27 g, 트리페닐포스핀 0.745 g 및 비스(트리페닐포스핀)팔라듐 디클로라이드 1 g을 첨가한 다음 트리메틸실릴-아세틸렌 19.7 ml를 적가하였다.

이 반응을 가스 크로마토그래피에 의해 모니터링하였다.

석유 에테르/에틸 아세테이트(20:1)의 이동상을 사용하여 실리카 겔 컬럼 크로마토그래피에 의해 정제하였다.

수율: 6 g(이론치의 73 %)

실시예 XXII-1

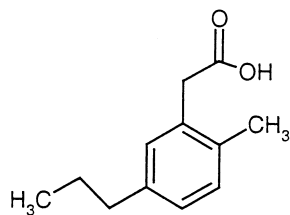


티오닐 클로라이드 300 ml 중 실시예 (XXV-2)의 화합물 39 g을 가스 발생이 중지될 때까지 50 °C에서 교반하였다.

과량의 티오닐 클로라이드를 증류시키고 잔류물을 무수 톨루엔 30 ml에 용해시킨 다음 증류시켰다.

수율: 37 g(이론치의 87 %), b.p.: 90-92 °C(0.05 밀리바아)

실시예 XXV-2

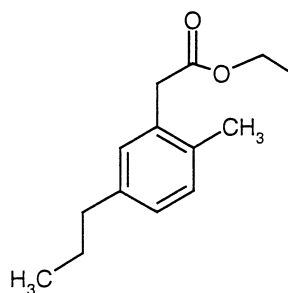


실시에 (XXX-2)의 화합물 50 g을 에탄올 60 ml, 물 30 ml 및 수산화칼륨 25 g과 혼합하고 이 혼합물을 환류하에 5 시간 가열하였다.

반응이 종료된 후, 용매를 증류시키고 잔류물을 물에 용해시킨 다음 이 혼합물을 농염산으로 산성화시켰다. 침전물을 흡인 여과하고 세척하고 건조시켰다.

수율: 41 g(이론치의 93 %)

실시예 XXV-2 (방법 (P))



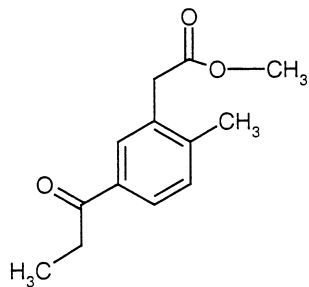
실시에 (XLII-1)의 화합물 60 g을 에탄올 600 ml에 용해시켜 농염산 50 ml와 혼합하고, 10 % Pd/C 5 g을 첨가하였다.

120 °C에서, 이 반응 혼합물에 150 바아의 수소 압력을 가했다.

반응이 종료된 후, 혼합물을 여과하여 용매를 증류시키고, 잔류물을 메틸렌 클로라이드 300 ml에 용해시킨 후 100 ml의 물로 세척하고 건조 및 농축시켰다.

수율: 51 g(이론치의 91 %)

실시예 XLII-1 (방법 (P))



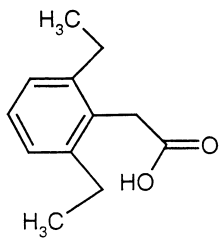
카본 디설파이드 200 g 및 염화알루미늄 86.7 g을 우선 도입하였다. 0 °C에서, 메틸 2-메틸페닐아세테이트 50 g 및 프로피오닐 클로라이드 28.2 g을 첨가하였다. 이 용액을 환류하에 4 시간 교반하였다.

이어, 이 용액을 1 kg의 빙수에 붓고 500 ml의 메틸렌 클로라이드로 추출하였다.

유기 상을 10 % 세기의 염산으로 세척한 다음 탄산나트륨 용액으로 세척하고 건조 및 농축시켰다.

수율: 60 g(이론치의 91%)

실시예 XXV-3

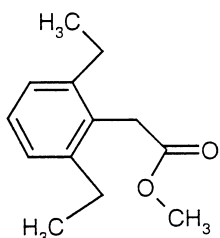


물 16 ml 및 메탄올 32 ml 중 실시예 (XXX-3)의 화합물 30 g을 수산화칼륨 12.2 g과 혼합하고, 이 혼합물을 환류하에 5 시간 교반하였다.

이 용액을 농축하여 잔류물을 물에 용해시키고, 혼합물을 에틸 아세테이트로 세척하고 수성 상을 농 HCl을 사용하여 pH 1로 조정하였다. 침전물을 흡인여과하고 세척하여 건조시켰다.

수율: 25 g(이론치의 99%), m.p. 55-56 °C

실시예 XXX-3 (방법 (Q))



(WO 97/02243으로부터의 실시예 (XXVI-6)에 따른) 화합물 메틸 2,6-디에틸-4-브로모-페닐아세테이트 20.8 g을 메탄올 100 ml에 용해시켰다. 나트륨 아세테이트 7.2 g 및 팔라듐 하이드록사이드 2 g을 첨가하였다. 이어 이 화합물을 수소를 사용하는 압력하에 수소첨가하였다.

반응이 종료된 후, 이 용액을 여과하여 농축시켰다. 잔류물을 메틸렌 클로라이드에 용해시키고 물로 세척하여 건조 및 농축시켰다.

수율: 12 g(이론치의 77%)

사용 실시예

실시예 A

미주스(*Myzus*) 시험

용 매 : 디메틸포름아미드 7 중량부

유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

활성 화합물 1 중량부를 상기 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적 농도가 되도록 유화제-함유 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

복숭아 흑진딧물(미주스 퍼시카에(*Myzus persicae*))로 심하게 감염된 양배추잎(브라시카 올레라세아(*Brassica oleracea*))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하였다.

일정한 기간이 경과한 후에, 구제율 %를 결정하였다. 100 %란 모든 흑진딧물이 사멸되었음을 의미하고; 0 %란 흑진딧물이 하나도 사멸되지 않았음을 의미한다.

이 시험에서는, 제조 실시예 (I-2-a-4), (I-2-b-5), (I-2-b-6), (I-1-a-6), (I-1-c-4), (I-4-a-1)의 화합물이 전형적인 활성 화합물 농도 1000 ppm에서 6 일후 100 % 구제율을 나타내었다.

실시예 B

네포테티스(*Nephotettix*) 시험

용 매 : 디메틸포름아미드 7 중량부

유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

활성 화합물 1 중량부를 상기 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적 농도가 되도록 유화제-함유 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

벼 묘(오리자 사티바(*Oryzae sativa*))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하고, 잎이 축축한 동안에 끝동매미충(네포테티스 신크티세프스 (*Nephotettix cincticeps*))으로 감염시켰다.

일정한 기간이 경과한 후에, 구제율 % 을 결정하였다. 100 % 란 모든 끝동 매미충이 사멸되었음을 의미하고; 0 % 란 끝동 매미충이 하나도 사멸되지 않았음을 의미한다.

이 시험에서는, 제조 실시예 (I-2-b-9), (I-2-a-4), (I-1-a-9), (I-1-a-8), (I-1-a-2), (I-1-a-1), (I-1-a-3), (I-4-a-1)의 화합물이 전형적인 활성 화합물 농도 1000 ppm에서 6 일후 100 % 구제율을 나타내었다.

실시예 C

파에돈(*Phaedon*) 유충 시험

용 매 : 디메틸포름아미드 7 중량부

유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

활성 화합물 1 중량부를 상기 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적 농도가 되도록 유화제-함유 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

양배추잎(브라시카 올레라세아(*Brassica oleracea*))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하고, 잎이 축축한 동안에 겨자 투구풍뎅이(파에돈 코클레아리에(*Phaedon cochleariae*)) 유충으로 감염시켰다.

일정한 기간이 경과한 후에, 구제율 % 를 결정하였다. 100 % 란 모든 투구 풍뎅이 유충이 사멸되었음을 의미하고; 0 % 란 유충이 하나도 사멸되지 않았음을 의미한다.

이 시험에서는, 제조 실시예 (I-2-a-3), (I-2-b-8), (I-2-b-6), (I-1-a-2), (I-1-a-3), (I-1-a-21), (I-4-a-1)의 화합물이 전형적인 활성 화합물 농도 1000 ppm에서 7 일후 100 % 구제율을 나타내었다.

실시예 D

플루텔라(*Plutella*) 시험

용 매 : 디메틸포름아미드 7 중량부

유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

활성 화합물 1 중량부를 상기 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적 농도가 되도록 유화제-함유 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

양배추잎(브라시카 올레라세아(*Brassica oleracea*))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하고, 잎이 축축한 동안에 아울릿 좀나방(owlet moth)(플루텔라 크실로스텔라(*Plutella xylostella*)) 모충으로 감염시켰다.

일정한 기간이 경과한 후에, 구제율 % 를 결정하였다. 100 % 란 모든 모충 이 사멸되었음을 의미하고; 0 % 란 모충이 하나도 사멸되지 않았음을 의미한다.

이 시험에서는, 제조 실시예 (I-1-a-8) 및 (I-4-a-1)의 화합물이 전형적인 활성 화합물 농도 1000 ppm에서 7 일후 100 % 구제율을 나타내었다.

실시예 E

스포도프테라 프루기페르다(*Spodoptera frugiperda*) 시험

용 매 : 디메틸포름아미드 7 중량부

유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

활성 화합물 1 중량부를 상기 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적 농도가 되도록 유화제-함유 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

양배추잎(브라시카 올레라세아(*Brassica oleracea*))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하고, 잎이 축축한 동안에 조밤나방(스포도프테라 프루기페르다(*Spodoptera frugiperda*)) 모충으로 감염시켰다.

일정한 기간이 경과한 후에, 구제율 % 를 결정하였다. 100 % 란 모든 모충이 사멸되었음을 의미하고; 0 % 란 모충이 하나도 사멸되지 않았음을 의미한다.

이 시험에서는, 제조 실시예 (I-2-a-3)의 화합물이 전형적인 활성 화합물 농도 1000 ppm에서 7 일후 100 % 구제율을 나타내었다.

실시예 F

테트라니쿠스(*Tetranychus*) 시험(OP 내성/침지 처리)

용 매 : 디메틸포름아미드 7 중량부

유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

활성 화합물 1 중량부를 상기 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적 농도가 되도록 유화제-함유 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

모든 단계의 온실 붉은 거미 응애(테트라니쿠스 우르티카에(*Tetranychus urticae*))로 심하게 감염된 콩 식물(파세올루스 불가리스(*Phaseolus vulgaris*))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지하였다.

일정한 기간이 경과한 후에, 구제율 % 를 결정한다. 100 % 란 모든 거미 응애가 사멸되었음을 의미하고; 0 % 란 거미 응애가 하나도 사멸되지 않았음을 의미한다.

이 시험에서는, 제조 실시예 (I-2-a-4), (I-2-b-10), (I-2-b-11), (I-2-b-8), (I-2-b-2), (I-1-a-3), (I-1-a-21), (I-1-c-4), (I-4-a-1)의 화합물이 전형적인 활성 화합물 농도 1000 ppm에서 7 일후 100 % 구제율을 나타내었다.

실시예 G

베미시아(*Bemisia*) 시험

용 매 : 디메틸포름아미드 7.5 중량부

유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 2.5 중량부

활성 화합물 1 중량부를 상기 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적 농도가 되도록 유화제-함유 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

담배가루이(베미시아 타바치(*Bemisia tabaci*))의 알, 유충 및 번데기에 의해 감염된 목화 식물(고시피움 히르수툼(*Gossypium hirsutum*))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지하였다.

일정한 기간이 경과한 후에, 구제율 % 를 결정한다. 100 % 란 모든 동물이 사멸되었음을 의미하고; 0 % 란 동물이 하나도 사멸되지 않았음을 의미한다.

이 시험에서는, 제조 실시예 (I-2-b-9), (I-2-a-4), (I-2-b-10)의 화합물이 전형적인 활성 화합물 농도 1000 ppm에서 10 일후 100 % 구제율을 나타내었다.

실시예 H

발아후 시험

용 매: 아세톤 5 중량부

유화제: 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

활성 화합물 1 중량부를 상기 지정량의 용매와 혼합하고, 상기 지정량의 유화제를 첨가한 후, 농축물을 목적하는 농도까지 물로 희석시켜 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

5 내지 15 cm 높이의 시험 식물에 활성 화합물 제제를 단위 면적당 목적하는 활성 화합물의 특정량이 적용되도록 분무하였다. 분무액의 농도는 목적하는 활성 화합물의 특정량이 헥타르당 물 1000 l로 적용되게 선택하였다.

3 주후, 식물의 손상도를 비처리 대조군의 전개와 비교하여 손상율% 로 기록하였다.

수치는 다음을 나타낸다:

0 % = 효과 없음(비처리 대조군과 같다)

100 % = 완전 방제

실시예 I

발아전 시험

용 매: 아세톤 5 중량부

유화제: 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

활성 화합물 1 중량부를 상기 지정량의 용매와 혼합하고, 상기 지정량의 유화제를 첨가한 후, 농축물을 목적하는 농도까지 물로 희석시켜 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

시험 식물의 종자를 상토에 파종하였다. 약 24 시간이 지난 후, 토양에 활성 화합물 제제를 단위 면적당 목적하는 활성 화합물의 특정량이 적용되도록 분무하였다. 분무액 중의 활성 화합물의 농도는 목적하는 활성 화합물의 특정량이 헥타르당 물 1000 l로 적용되게 선택하였다.

3 주후, 식물의 손상도를 비처리 대조군의 전개와 비교하여 손상율% 로 기록하였다.

수치는 다음을 나타낸다:

0 % = 효과 없음(비처리 대조군과 같다)

100 % = 완전 방제

발아 후 실시예 1-2-a-4	g ai/ha 60	밀 0	목화 0	알로페쿠루스 95	아베나 파루아 80	플리움 95	소르굼 80
발아 후	g ai/ha	사탕무	알로페쿠루스	아베나 파루아	디기타리아 플리움	세타리아 이포모에아	폴리고눔
실시예 1-1-a-21	125	0	100	90	100	95	70
실시예 1-1-c-4	60	10	90	90	95	-	-
발아 후	g ai/ha	대두	디기타리아	플리움	세타리아	소르굼	갈륨
실시예 1-1-a-5	125	10	90	-	100	95	80
실시예 1-1-a-3	125	-	80	70	90	-	80
발아 후	g ai/ha	사탕무	유채	디기타리아	플리움	세타리아	갈륨
실시예 1-1-a-2	125	0	0	80	70	95	80
발아 후	g ai/ha	사탕무	목화	알로페쿠루스	아베나 파루아	디기타리아	세타리아
실시예 1-1-a-9	15	10	0	100	95	95	100
발아 후	g ai/ha	사탕무	목화	디기타리아	에키노클로아	세타리아	소르굼
실시예 1-1-a-8	60	10	0	95	100	100	95

발아 후	g ai/ha	디지털리아	물리움	세타리아	소르골
실시예 1-1-a-6	125	95	80	95	100

발아 후	g ai/ha	밀	대두	목화	디지털리아	물리움	세타리아
실시예 1-2-b-12	125	-	0	0	95	90	95
실시예 1-2-b-13	125	10	0	0	80	70	95

발아 후	g ai/ha	밀	사탕무	목화	디지털리아	에키노 클로아	세타리아	소르골
실시예 1-4-a-1	125	20	0	0	100	90	95	90

발아 후	g ai/ha	밀	물리움	카시아	솔라눔	비올라
실시예 1-2-b-10	125	10	80	95	80	90

발아 전	g ai/ha	밀	옥수수	사탕무	대두	알로페쿠루스	아베나 파투아	브로무스	물리움	세타리아
실시예 1-2-a-4	125	-	5	0	0	100	80	70	100	100
실시예 1-1-a-8	60	0	10	0	0	100	90	100	100	100

발아 전	g ai/ha	알로페쿠루스	아베나 파투아	디지털리아	에키노클로아	물리움	세타리아
실시예 1-1-a-3	125	100	95	100	100	100	100

발아 전 실시에 I-I-a-6	g ai/ha 60	알로페쿠루스		아메나 파루아		에키노클로아	
		90	80	90	80	90	80
발아 전 실시에 I-I-a-1 실시에 I-I-a-2 실시에 I-I-a-9	g ai/ha 125	사탕무		대두		알로페쿠루스	
		0	0	0	0	100	100
		0	0	0	0	100	100
		0	0	0	0	100	100
발아 전 실시에 I-I-a-5	g ai/ha 60	밀		대두		알로페쿠루스	
		0	0	0	0	100	100
발아 전 실시에 I-I-c-4	g ai/ha 125	대두		알로페		사이페	
		20	95	100	100	100	100
		20	95	100	100	100	100
		20	95	100	100	100	100

실시에 J

제한 농도 시험/토양 곤충-유전자이식 식물의 처리

시험 곤충: 디아브로티카 발테아타(*Diabrotica balteata*)-토양 유충

용 매: 아세톤 7 중량부

유화제: 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

활성 화합물 1 중량부를 상기 지정량의 용매와 혼합하고, 상기 지정량의 유화제를 첨가하며, 농축물을 목적 농도가 되도록 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

활성 화합물 제제를 토양에 부었다. 여기서, 제제중의 활성 화합물의 농도는 거의 관계없고, 오직 ppm(=mg/ℓ)으로 주어지는 토양의 부피당 활성 화합물의 중량적 양이 결정적이다. 토양을 0.25 ℓ의 포트에 채우고 20 °C에서 방치하였다.

제조후 즉시, YIELD GUARD(미국 몬산토 캄파니의 상표명) 품종의 발아전 옥수수 난알 5 개를 각각의 포트에 옮겼다. 2 일후, 시험 곤충을 처리한 토양으로 옮겼다. 추가로 7 일후, 발아한 옥수수 모종을 계수하여 활성 화합물의 유효도를 측정하였다(1 모종=20% 유효도).

실시에 K

헬리오티스 비레스센스(*Heliothis virescens*) 시험-유전자이식 식물의 처리

용 매 : 아세톤 7 중량부

유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

활성 화합물 1 중량부를 상기 지정량의 용매 및 상기 지정량의 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적하는 농도가 되도록 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

Roundup Ready(미국 몬산토 캄파니의 상표명) 품종의 대두 어린싹(글리시네 맥스(*Glycine max*))을 목적하는 농도의 활성 화합물 제제에 침지하여 처리하고, 담배 모충(헬리오티스 비레스센스(*Heliothis virescens*))로 감염시켰다.

목적하는 시간후, 곤충의 구제율을 측정하였다.