



(19)대한민국특허청(KR)  
(12) 등록특허공보(B1)

(51) 。 Int. Cl. C07D 207/20 (2006.01)	(45) 공고일자 (11) 등록번호 (24) 등록일자	2007년03월12일 10-0693354 2007년03월05일
--	-------------------------------------	--

(21) 출원번호	10-2000-7011879	(65) 공개번호	10-2001-0043021
(22) 출원일자	2000년10월25일	(43) 공개일자	2001년05월25일
심사청구일자	2004년02월13일		
번역문 제출일자	2000년10월25일		
(86) 국제출원번호	PCT/EP1999/003062	(87) 국제공개번호	WO 1999/59967
국제출원일자	1999년05월05일	국제공개일자	1999년11월25일

(81) 지정국

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

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

EA 유라시아특허 : 아르메니아, 아제르바이잔, 벨라루스, 키르키즈스탄, 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,

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

(30) 우선권주장                    19822245.9                    1998년05월18일                    독일(DE)

(73) 특허권자                    바이엘 악티엔게젤샤프트  
독일 데-51368 레버쿠센

(72) 발명자                    플랜트앤드류  
독일연방공화국데-51373레버쿠젠발터-플렉스-스트라세20

박크하우스디르크  
독일연방공화국데-50672쾰른프리젠발130

에르텔렌크리스토프  
독일연방공화국데-42799라이홀링겐운터뷔세르호프15

투르베르크안드레아스  
독일연방공화국데-42781한진터스트트라세86

멘케노르버트  
독일연방공화국데-51381레버쿠젠그룬더뮐레2

(74) 대리인                      최규팔  
  이은선

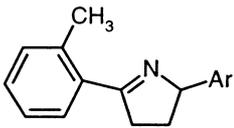
심사관 : 성선영

전체 청구항 수 : 총 7 항

**(54) 2-(2-메틸페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤 유도체**

**(57) 요약**

본 발명은 신규한 하기 일반식 (I)의 2-(2-메틸페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤 유도체, 다수의 그의 제조방법 및 페스티사이드로서의 그의 용도에 관한 것이다:



(I)

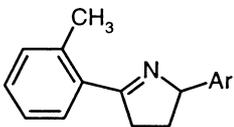
상기 식에서,

Ar 은 치환된 페닐을 나타낸다.

**특허청구의 범위**

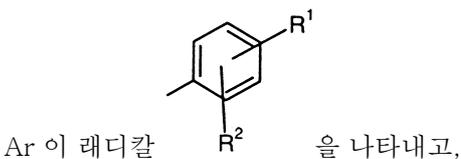
**청구항 1.**

하기 일반식 (I)의 화합물:

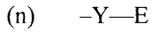
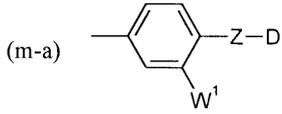
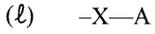


(I)

상기 식에서,



R<sup>1</sup> 은 수소, 불소, 염소, 브롬, 시아노, -CO-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, 테트라하이드로피라닐 및 하기 그룹중의 하나중에서 선택된 메타 또는 파라 위치에서의 치환체를 나타내며:



R<sup>2</sup> 는 수소, 불소, 염소, 브롬, 요오드, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 메틸티오, 에틸티오, 트리플루오로메틸, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시 또는 트리플루오로메틸티오를 나타내고,

단, R<sup>2</sup> 가 요오드인 경우 R<sup>1</sup> 은 수소를 나타내지 않으며,

R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup> 는 서로 독립적으로 각각 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸 또는 t-부틸을 나타내거나, 각각 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 일치환되거나 비치환된 페닐 또는 벤질을 나타내고,

X 는 직접 결합, 산소, 황, 카보닐, -CH<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -CH=CH-(E 또는 Z), -C≡C-, -CH<sub>2</sub>O-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O-, -CH(CH<sub>3</sub>)O-, -OCH<sub>2</sub>-, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -SCH<sub>2</sub>-, -S(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -SCH(CH<sub>3</sub>)-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌디옥시를 나타내며,

A 는 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 페닐을 나타내거나, 각각 W<sup>2</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 푸릴, 벤조푸릴, 티에닐, 벤조티에닐, 옥사졸릴, 벤족사졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 피롤릴, 피리디, 피리미딜, 1,3,5-트리아지닐, 퀴놀리닐, 이소퀴놀리닐, 인돌릴, 퓨리닐, 벤조디옥솔릴, 인다닐, 벤조디옥사닐 또는 크로마닐을 나타내고,

Z 는 산소 또는 황을 나타내며,

D 는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 펜틸 이성체들, 헥실 이성체들, n-헵틸, n-옥틸, n-이소옥틸, n-노닐, n-데실, n-운데실, n-도데실, n-트리데실, n-테트라데실, n-펜타데실, n-헥사데실, 2-프로페닐, 부테닐, 펜테닐, 헥세닐, 프로파길, 부티닐, 펜티닐, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub> 또는 -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 를 나타내거나, 각각 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 에테닐, 1-프로페닐, 2,2-디메틸에테닐, -CH=CCl<sub>2</sub>, 페닐, 스티릴, 또는 각 경우에 불소-, 염소- 또는 브롬-치환된 페닐 또는 4-클로로스티릴에 의해 일- 내지 삼치환되거나 비치환된 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로프로필메틸, 사이클로부틸메틸, 사이클로펜틸메틸 또는 사이클로헥실메틸을 나타내거나, 각각 불소, 염소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸 또는 t-부틸에 의해 치환되거나 비치환된 사이클로펜테닐, 사이클로헥세닐, 사이클로헥세닐메틸 또는 사이클로펜테닐메틸을 나타내거나, 각각 니트로, 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소프로폭시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시 또는 클로로디플루오로메톡시에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 벤질, 펜에틸, 나프틸메틸, 테트라하이드로나프틸메틸, 푸릴메틸, 티에닐메틸, 피롤릴메틸, 옥사졸릴메틸, 이속사졸릴메틸, 티아졸릴메틸 또는 피리디메틸을 나타내거나, -CO-R<sup>6</sup> 또는 -CO-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> 을 나타내거나, 그룹 -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-(CR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)<sub>q</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-G 를 나타내거나,

Z 및 D 는 함께, 또한 니트로, 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, n-프로필, i-프로필, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, i-프로폭시, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시 또는 클로로디플루오로메톡시에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 페녹시메틸을 나타낼 수 있고,

Y 는 직접 결합, 산소, 황, 카보닐,  $-\text{CH}_2-$ ,  $-(\text{CH}_2)_2-$ ,  $-\text{CH}=\text{CH}-$ (E 또는 Z),  $-\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_2\text{O}-$ ,  $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{O}-$ ,  $-\text{OCH}_2-$ ,  $-\text{O}(\text{CH}_2)_2-$ ,  $-\text{SCH}_2-$ ,  $-\text{S}(\text{CH}_2)_2-$ ,  $-\text{SCH}(\text{CH}_3)-$ ,  $\text{C}_1-\text{C}_4$ -알킬렌디옥시를 나타내거나,  $\text{W}^1$  중에서 선택된 래디칼에 의해 일치환되거나 비치환된 p-페닐렌을 나타내며,

E 는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 펜틸 이성체들, 헥실 이성체들, n-헵틸, n-옥틸, n-이소옥틸, n-노닐, n-데실, n-운데실, n-도데실, n-트리데실, n-테트라데실, n-펜타데실, n-헥사데실, 2-프로페닐, 부테닐, 펜테닐, 헥세닐, 프로파길, 부티닐, 펜티닐,  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{CHF}_2$ ,  $-\text{CClF}_2$ ,  $-\text{CF}_2\text{CHFCl}$ ,  $-\text{CF}_2\text{CH}_2\text{F}$ ,  $-\text{CF}_2\text{CHF}_2$ ,  $-\text{CF}_2\text{CCl}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CF}_2\text{CHF}_2$  또는  $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$  를 나타내거나, 각각 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 에테닐, 1-프로페닐, 2,2-디메틸에테닐,  $-\text{CH}=\text{CCl}_2$ , 페닐, 스티릴, 또는 각 경우에 불소-, 염소- 또는 브롬-치환된 페닐 또는 4-클로로스티릴에 의해 일- 내지 삼치환되거나 비치환된 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나, 각각 불소, 염소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸 또는 t-부틸에 의해 치환되거나 비치환된 사이클로펜테닐 또는 사이클로헥세닐을 나타내거나,  $\text{W}^1$  중에서 선택된 래디칼에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 페닐을 나타내거나, 각각  $\text{W}^2$  중에서 선택된 래디칼에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 푸릴, 티에닐, 피롤릴, 옥사졸릴, 이속사졸릴, 티아졸릴 또는 피리딜을 나타내거나, 그룹  $-(\text{CH}_2)_p-(\text{CR}^9\text{R}^{10})_q-(\text{CH}_2)_r-\text{G}$  를 나타내고,

$\text{R}^6$  은 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소프로폭시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시, 사이클로프로필, 사이클로헥실, 사이클로헥실옥시, 사이클로헥실메틸옥시, 페닐, 2-클로로페닐, 3-클로로페닐, 2,6-디플루오로페닐, 2,4-디클로로페닐, 3,4-디클로로페닐, 2-트리플루오로메톡시페닐 또는 4-트리플루오로메톡시페닐을 나타내며,

$\text{R}^7$  은 수소를 나타내고,

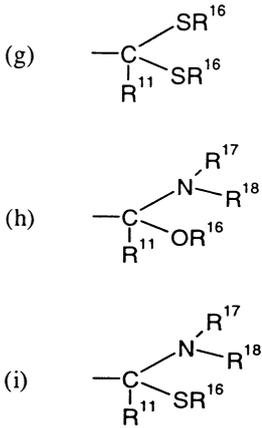
$\text{R}^8$  은 메틸 또는 에틸을 나타내거나, 염소에 의해 일치환되거나 비치환된 페닐을 나타내며,

p, q 및 r 은 서로 독립적으로 각각 0, 1, 2 또는 3 을 나타내고, 단 이들의 합은 1 보다 크고 4 보다 작으며,

$\text{R}^9$  및  $\text{R}^{10}$  은 서로 독립적으로 각각 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸 또는 t-부틸을 나타내고,

G 는 시아노를 나타내거나, 각각 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필 또는 트리플루오로메틸에 의해 일- 내지 삼치환되거나 비치환되고 결합 위치에서 래디칼  $\text{R}^{11}$  에 의해 치환되거나 비치환된 5,6-디하이드로디옥사진-2-일, 3-피리딜, 3-푸릴, 3-티에닐, 2-티아졸릴, 5-티아졸릴, 2-디옥솔라닐, 1,3-디옥산-2-일, 2-디티올라닐, 1,3-디티안-2-일 또는 1,3-티옥산-2-일을 나타내거나, 하기 그룹중의 하나를 나타내며:

- (a)  $-\text{CO}-\text{R}^{11}$
- (b)  $-\text{CO}-\text{OR}^{12}$
- (c)  $-\text{CO}-\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$
- (d)  $-\text{CS}-\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$
- (e)  $\begin{array}{c} -\text{C}=\text{N}-\text{R}^{15} \\ | \\ \text{R}^{11} \end{array}$
- (f)  $\begin{array}{c} \text{OR}^{16} \\ \diagdown \\ -\text{C} \\ \diagup \\ \text{OR}^{16} \\ | \\ \text{R}^{11} \end{array}$



R<sup>11</sup> 은 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 펜틸 이성체들, 헥실 이성체들, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, 또는 불소 또는 염소에 의해 일- 내지 삼치환되거나 비치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐을 나타내거나, 각각 불소, 염소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub> 또는 -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나, 메틸카보닐아미노, 에틸카보닐아미노, 메틸카보닐-메틸아미노 및/또는 W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 페닐을 나타내고,

R<sup>12</sup> 는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 또는 알릴을 나타내거나, 각각 불소, 염소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub> 또는 -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실메틸, 사이클로프로필에틸, 사이클로펜틸에틸 또는 사이클로헥실에틸을 나타내거나, 각각 W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 벤질 또는 페닐을 나타내며,

R<sup>13</sup> 및 R<sup>14</sup> 는 서로 독립적으로 각각 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, 메톡시, 에톡시 또는 알릴을 나타내거나, 각각 불소, 염소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필 또는 트리플루오로메틸에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸메틸 또는 사이클로헥실메틸을 나타내거나, 각각 W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 페닐, 벤질 또는 페닐을 나타내거나, -OR<sup>12</sup> 또는 -NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> 를 나타내고,

R<sup>15</sup> 는 -OR<sup>12</sup>, -NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> 또는 -N(R<sup>11</sup>)-COOR<sup>12</sup> 를 나타내며,

R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup> 및 R<sup>18</sup> 은 서로 독립적으로 각각 메틸, 에틸, n-프로필 또는 이소프로필을 나타내고,

W<sup>1</sup> 은 수소, 불소, 염소, 브롬, 시아노, 포르밀, 니트로, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소프로폭시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 클로로디플루오로메톡시, 아세틸, 프로피오닐, 부티릴, 이소부티릴, 메톡시카보닐, 에톡시카보닐, n-프로폭시카보닐, 이소프로폭시카보닐, n-부톡시카보닐, 이소부톡시카보닐, sec-부톡시카보닐, t-부톡시카보닐 또는 -S(O)<sub>o</sub>R<sup>3</sup> 을 나타내며,

o 는 0 또는 2 를 나타내고,

R<sup>3</sup> 은 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, 디플루오로메틸 또는 트리플루오로메틸을 나타내며,

W<sup>2</sup> 는 불소, 염소, 브롬, 시아노, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 클로로디플루오로메톡시, 아세틸, 트리플루오로메틸티오, -CH=N-OCH<sub>3</sub>, -CH=N-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH=N-OC<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -C(CH<sub>3</sub>)=N-OCH<sub>3</sub>, -C(CH<sub>3</sub>)=N-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(CH<sub>3</sub>)=N-OC<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)=N-OCH<sub>3</sub>, -C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)=N-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub> 또는 -C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)=N-OC<sub>3</sub>H<sub>7</sub> 을 나타내고,

W<sup>3</sup> 은 불소, 염소, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 메틸티오, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로메틸티오, 디메틸아미노, 디에틸아미노, -COOR<sup>19</sup> 또는 -CONR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> 을 나타내며,

R<sup>19</sup> 는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, t-부틸 또는 -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 를 나타내거나, 각각 불소, 염소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필 또는 -CF<sub>3</sub> 에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나, W<sup>4</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 페닐을 나타내고,

R<sup>20</sup> 및 R<sup>21</sup> 은 서로 독립적으로 각각 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, 메톡시, 에톡시 또는 알릴을 나타내거나, 각각 불소 또는 염소에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸메틸 또는 사이클로헥실메틸을 나타내거나, 각각 W<sup>4</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 일- 또는 이치환되거나 비치환된 페닐, 벤질 또는 펜에틸을 나타내거나, -OR<sup>16</sup> 또는 -NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 을 나타내며,

W<sup>4</sup> 는 불소, 염소, 브롬, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, t-부틸, 메톡시, 에톡시, 메틸티오, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시 또는 트리플루오로메틸티오를 나타낸다.

## 청구항 2.

삭제

## 청구항 3.

삭제

## 청구항 4.

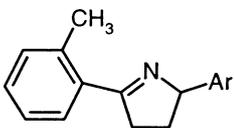
삭제

## 청구항 5.

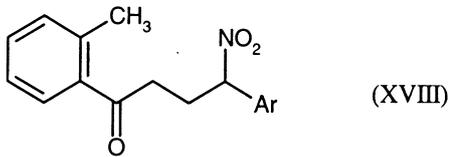
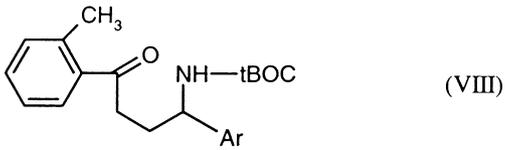
a) 일반식 (VIII)의 아미노케톤 유도체를 산과 반응시킨 후, 폐환축합(cyclocondensation)시키거나,

b) 일반식 (XVIII)의 니트로케톤의 니트로 그룹을 환원시키고, 형성된 일반식 (II)의 아미노케톤 중간체를 동일 반응계에서 (I)로 폐환축합시키거나,

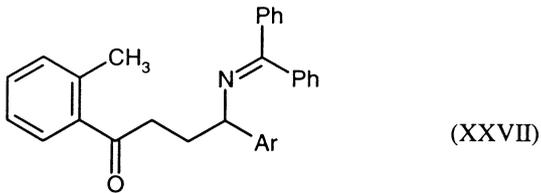
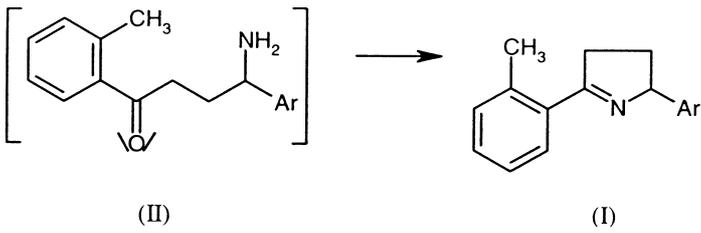
c) 일반식 (XXVII)의 이민을 수성 산으로 가수분해시키고, 형성된 일반식 (II)의 아미노케톤 중간체를 동일 반응계에서 (I)로 폐환축합시켜 일반식 (I)의 사이클릭 이민을 수득함을 특징으로 하여 제 1 항에 따르는 일반식 (I)의 화합물을 제조하는 방법:



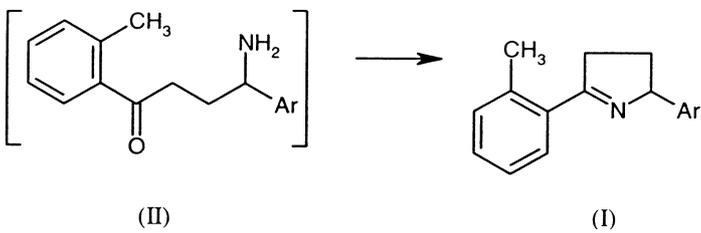
(I)



방법 b)에서,



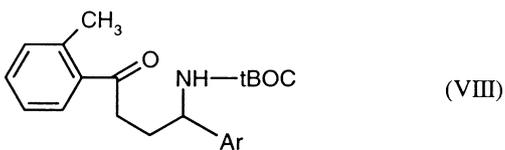
방법 c)에서,



상기 식에서, Ar은 제 1 항에 정의된 바와 같다.

### 청구항 6.

하기 일반식 (VIII)의 화합물:



상기 식에서, Ar 은 제 1 항에 정의된 바와 같다.

### 청구항 7.

삭제

청구항 8.

삭제

청구항 9.

삭제

청구항 10.

삭제

청구항 11.

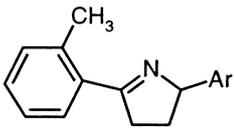
삭제

청구항 12.

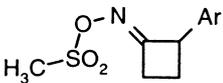
삭제

청구항 13.

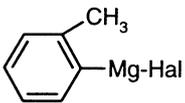
일반식 (III)의 화합물을 희석제의 존재하에서 일반식 (IV)의 아릴 그리냐드(Grignard) 화합물과 반응시킴을 특징으로 하여 제 1 항에 따르는 일반식 (I)의 화합물을 제조하는 방법:



(I)



(III)



(IV)

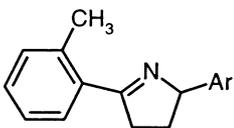
상기 식에서,

Ar은 제 1 항에 정의된 바와 같으며,

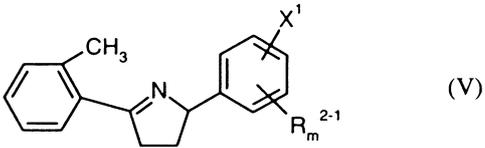
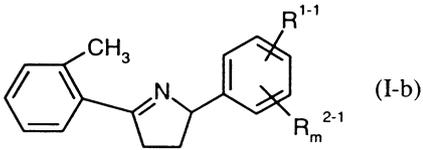
Hal 은 염소, 브롬 또는 요오드를 나타낸다.

청구항 14.

일반식 (V)의 화합물을 촉매의 존재하, 산 결합제의 존재하 및 용매의 존재하에서 일반식 (VI)의 보론산과 커플링(coupling)시켜 일반식 (I-b)의 화합물을 수득함을 특징으로 하여 제 1 항에 따르는 일반식 (I)의 화합물을 제조하는 방법:



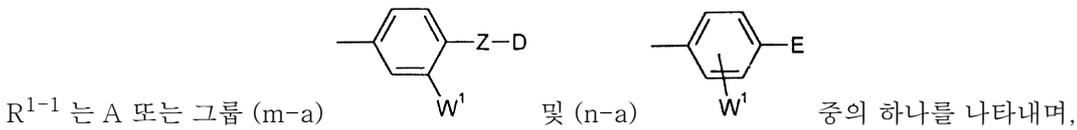
(I)



상기 식에서,

Ar 은 제 1 항에 정의된 바와 같으며,

m 은 1 이고,



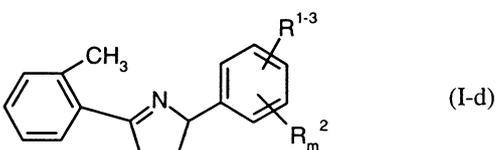
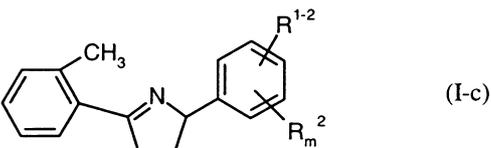
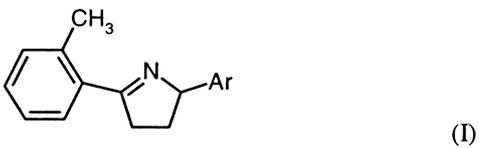
여기에서 A, D, E, W<sup>1</sup> 및 Z 는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같고,

R<sup>2-1</sup> 는 수소, 불소, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 트리플루오로메틸, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시 또는 트리플루오로메틸티오를 나타내며,

X<sup>1</sup> 은 브롬, 요오드 또는 -OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 를 나타낸다.

### 청구항 15.

일반식 (I-d)의 사이클릭 이민을 일반식 (VII)의 화합물과 축합시켜 일반식 (I-c)의 사이클릭 이민을 수득함을 특징으로 하여 제 1 항에 따르는 일반식 (I)의 화합물을 제조하는 방법:

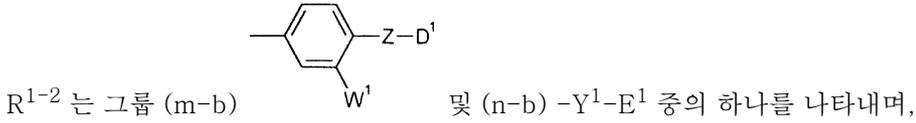




상기 식에서,

Ar 및 R<sup>2</sup> 는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같으며,

m 은 1 이고,

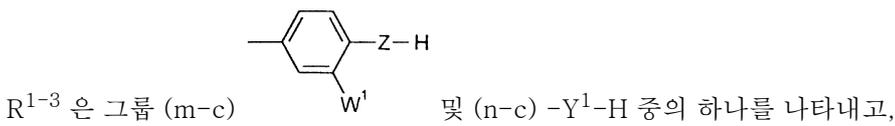


여기에서 W<sup>1</sup> 및 Z 는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같고,

Y<sup>1</sup> 은 산소 또는 황을 나타내며,

D<sup>1</sup> 및 E<sup>1</sup> 은 그룹  $-(\text{CH}_2)_p-(\text{CR}^9\text{R}^{10})_q-(\text{CH}_2)_r-\text{G}$  를 나타내고,

R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, G, p, q 및 r 은 각각 제 1 항에 정의된 바와 같으며,



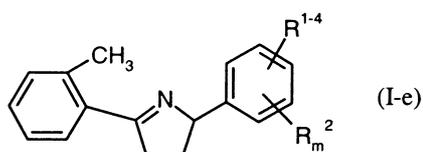
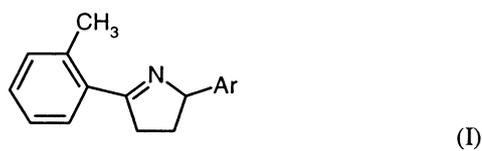
여기에서,

W<sup>1</sup>, Y<sup>1</sup> 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같으며,

Ab 는 이탈 그룹을 나타낸다.

### 청구항 16.

G 가 시아노 또는 제 1 항에 언급된 그룹 (a) 내지 (d) 중의 하나를 나타내는 일반식 (I)의 화합물을 일반적으로 통상적이고 공지된 방법으로 유도체화시켜 일반식 (I-e)의 사이클릭 이민을 수득함을 특징으로 하여 제 1 항에 따르는 일반식 (I)의 화합물을 제조하는 방법:



상기 식에서,

Ar 및 R<sup>2</sup> 는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같으며,

m 은 1 이고,

R<sup>1-4</sup> 는 래디칼 G 를 포함한 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명부분중에서 선택된 그룹을 나타내며, 여기에서 G 는 제 1 항에 언급된 그룹 (e) 내지 (i) 중의 하나를 나타낸다.

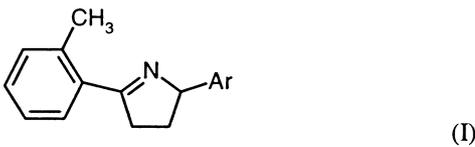
**명세서**

본 발명은 신규한 2-(2-메틸페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤 유도체, 다수의 그의 제조방법 및 페스티사이드(pesticide)로서의 그의 용도에 관한 것이다.

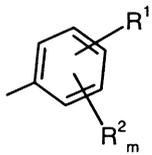
지금까지, 다음과 같은 불과 몇개의 치환된 사이클릭 α,α'-디페닐이민이 알려졌을 뿐이다: 2-페닐 환에서 알콕시-치환된 세 개의 2,5-디페닐-1-피롤린[문헌 Chem. Ber. 96, 93 (1963)으로부터의 5-(2,5-디메톡시페닐)-2-페닐-3,4-디하이드로-2H-피롤 및 5-(4-메톡시페닐)-2-페닐-3,4-디하이드로-2H-피롤, 및 문헌 J. Prakt. Chem., Series 4, 1, 57 (1955)으로부터의 상응하는 4-프로폭시 화합물] 및 비치환된 2,6-디페닐-3,4,5,6-테트라하이드로피리딘[참조예: Bull. Soc. Chim. Fr. 1974, 258 및 Chem. Ber. 116, 3931 (1983)].

그러나, 이들 화합물을 페스티사이드로 사용하는 것에 관해서는 알려진 바 없다.

따라서, 본 발명은 신규한 하기 일반식 (I)의 2-(2-메틸페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤 유도체에 관한 것이다:



상기 식에서,



Ar 은 래디칼 을 나타내고,

여기에서,

m 은 0, 1, 2, 3 또는 4 를 나타내며,

R<sup>1</sup> 은 수소, F, Cl, Br, 시아노, 트리알킬실릴, -CO-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, 테트라하이드로피라닐 또는 하기 그룹중의 하나를 나타내고:

(ℓ) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E,

R<sup>2</sup> 는 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, 알킬, 알콕시, 할로게노알킬, 할로게노알콕시, 알콕시알콕시 또는 -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup> 을 나타내며,

단, m 이 1 이고 R<sup>2</sup> 가 요오드인 경우 R<sup>1</sup> 은 수소를 나타내지 않고,

o 는 0, 1 또는 2 를 나타내며,

R<sup>3</sup> 은 알킬 또는 할로게노알킬을 나타내고,

R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup> 는 서로 독립적으로 각각 수소, 알킬 또는 할로게노알킬을 나타내거나, 각각 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 페닐 또는 페닐알킬을 나타내며,

X 는 직접 결합, 산소, 황, 카보닐, 카보닐옥시, 옥시카보닐, 알킬렌, 알케닐렌, 알키닐렌, 알킬렌옥시, 옥시알킬렌, 티오알킬렌, 알킬렌디옥시 또는 디알킬실릴렌을 나타내고,

A 는 각각 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 페닐, 나프틸 또는 테트라하이드로나프틸을 나타내거나, 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹중에서 선택된 하나이상의 헤테로 원자 및 1 또는 2 개의 방향족 환을 가지며 W<sup>2</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 5 내지 10-원(membered) 헤테로사이클릴을 나타내며,

B 는 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 p-페닐렌을 나타내고,

Z 는 산소 또는 황을 나타내며,

D 는 수소, 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로게노알킬, 할로게노알케닐, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, 알킬-, 알케닐-, 할로게노알케닐-, 페닐-, 스티릴-, 할로게노페닐- 또는 할로게노스티릴-치환된 사이클로알킬 또는 사이클로알킬알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠- 또는 알킬-치환된 사이클로알케닐 또는 사이클로알케닐알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 니트로-, 할로젠-, 알킬-, 알콕시-, 할로게노알킬- 또는 할로게노알콕시-치환된 페닐알킬, 나프틸알킬, 테트라하이드로나프틸알킬 또는 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2 개의 헤테로 원자 및 5 또는 6 개의 환 멤버를 갖는 헤트아릴알킬을 나타내거나, -CO-R<sup>6</sup> 또는 -CO-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> 를 나타내거나, 그룹 -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-(CR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)<sub>q</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-G 를 나타내거나,

Z 및 D 는 함께, 임의로 니트로-, 할로젠-, 알킬-, 알콕시-, 할로게노알킬- 또는 할로게노알콕시-치환된 페녹시알킬을 나타내고,

Y 는 직접 결합, 산소, 황, 카보닐, 카보닐옥시, 옥시카보닐, 알킬렌, 알케닐렌, 알키닐렌, 알킬렌옥시, 옥시알킬렌, 티오알킬렌, 알킬렌디옥시, 또는 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 p-페닐렌을 나타내며,

E 는 수소, 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로게노알킬, 할로게노알케닐, 또는 임의로 할로젠-, 알킬-, 알케닐-, 할로게노알케닐-, 페닐-, 스티릴-, 할로게노페닐- 또는 할로게노스티릴-치환된 사이클로알킬을 나타내거나, 임의로 할로젠- 또는 알킬-치환된 사이클로알케닐을 나타내거나, W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 페닐을 나타내거나, 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2 개의 헤테로 원자를 가지며 W<sup>2</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 5- 또는 6-원 헤트아릴을 나타내거나, 그룹 -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-(CR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)<sub>q</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-G 를 나타내고,

R<sup>6</sup> 는 알킬, 알콕시, 알케닐, 알케닐옥시, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, 알킬-, 알케닐-, 할로게노알킬- 또는 할로게노알케닐-치환된 사이클로알킬, 사이클로알킬옥시 또는 사이클로알킬알킬옥시를 나타내거나, 각 경우에 임의로 니트로-, 할로젠-, 알킬-, 알콕시-, 할로게노알킬- 또는 할로게노알콕시-치환된 페닐 또는 나프틸을 나타내며,

R<sup>7</sup> 은 수소 또는 알킬을 나타내고,

R<sup>8</sup> 은 알킬, 할로게노알킬, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, 알킬-, 알케닐-, 할로게노알킬- 또는 할로게노알케닐-치환된 사이클로알킬 또는 사이클로알킬알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-, 알킬-, 알콕시-, 할로게노알킬- 또는 할로게노알콕시-치환된 페닐 또는 페닐알킬을 나타내며,

p, q 및 r 은 서로 독립적으로 각각 0, 1, 2 또는 3 을 나타내고, 단 이들의 합은 1 보다 크고 6 보다 작으며,

R<sup>9</sup> 및 R<sup>10</sup> 은 서로 독립적으로 각각 수소 또는 알킬을 나타내고,

G 는 시아노를 나타내거나, 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹중에서 선택된 1 내지 3 개의 동일하거나 상이한 헤테로 원자를 가지며 할로젠, 알킬 또는 할로게노알킬에 의해 임의로 치환되고 결합 위치에서 R<sup>11</sup> 에 의해 임의로 치환된 5- 또는 6-원 헤테로사이클을 나타내거나, 하기 그룹중의 하나를 나타내며:

- (a)  $\text{—CO—R}^{11}$
- (b)  $\text{—CO—OR}^{12}$
- (c)  $\text{—CO—NR}^{13}\text{R}^{14}$
- (d)  $\text{—CS—NR}^{13}\text{R}^{14}$
- (e)  $\begin{array}{c} \text{—C=N—R}^{15} \\ | \\ \text{R}^{11} \end{array}$
- (f)  $\begin{array}{c} \text{—C—OR}^{16} \\ | \quad \diagdown \\ \text{R}^{11} \quad \text{OR}^{16} \end{array}$
- (g)  $\begin{array}{c} \text{—C—SR}^{16} \\ | \quad \diagdown \\ \text{R}^{11} \quad \text{SR}^{16} \end{array}$
- (h)  $\begin{array}{c} \text{—C—N—R}^{17} \\ | \quad \diagdown \quad | \\ \text{R}^{11} \quad \text{OR}^{16} \quad \text{R}^{18} \end{array}$
- (i)  $\begin{array}{c} \text{—C—N—R}^{17} \\ | \quad \diagdown \quad | \\ \text{R}^{11} \quad \text{SR}^{16} \quad \text{R}^{18} \end{array}$
- (j)  $\begin{array}{c} \text{—C=N—R}^{17} \\ | \\ \text{OR}^{18} \end{array}$
- (k)  $\begin{array}{c} \text{—C=N—R}^{17} \\ | \\ \text{SR}^{18} \end{array}$

R<sup>11</sup> 은 수소, 알킬, 알케닐, 할로게노알킬, 할로게노알케닐, 또는 임의로 할로젠-, 알킬- 또는 할로게노알킬-치환된 사이클로알킬을 나타내거나, 알킬카보닐아미노, 알킬카보닐알킬아미노 및/또는 W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일-내지 오치환된 페닐을 나타내고,

R<sup>12</sup> 는 수소, 알킬, 알케닐, 할로게노알킬, 할로게노알케닐, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, 알킬- 또는 할로게노알킬-치환된 사이클로알킬 또는 사이클로알킬알킬을 나타내거나, W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일-내지 오치환된 아릴알킬을 나타내며,

R<sup>13</sup> 및 R<sup>14</sup> 는 서로 독립적으로 각각 수소, 알킬, 알케닐, 할로게노알킬, 할로게노알케닐, 알콕시, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, 알킬- 또는 할로게노알킬-치환된 사이클로알킬 또는 사이클로알킬알킬을 나타내거나, 각각 W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 오치환된 아릴 또는 아릴알킬을 나타내거나, -OR<sup>12</sup> 또는 -NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> 를 나타내거나, 함께, 하나의 메틸렌 그룹이 산소에 의해 임의로 대체된 2 내지 6 원의 알킬렌 쇠를 나타내고,

R<sup>15</sup> 는 -OR<sup>12</sup>, -NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> 또는 -N(R<sup>11</sup>)-COOR<sup>12</sup> 를 나타내며,

R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup> 및 R<sup>18</sup> 은 서로 독립적으로 각각 알킬을 나타내고,

W<sup>1</sup> 은 수소, 할로젠, 시아노, 포르밀, 니트로, 알킬, 트리알킬실릴, 알콕시, 할로게노알킬, 할로게노알콕시, 할로게노알케닐옥시, 알킬카보닐, 알콕시카보닐, 펜타플루오로티오 또는 -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup> 을 나타내며,

W<sup>2</sup> 는 할로젠, 시아노, 포르밀, 니트로, 알킬, 트리알킬실릴, 알콕시, 할로게노알킬, 할로게노알콕시, 알킬카보닐, 알콕시카보닐, 펜타플루오로티오, -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup> 또는 -C(R<sup>11</sup>)=N-R<sup>15</sup> 를 나타내며,

W<sup>3</sup> 은 할로젠, 시아노, 니트로, 알킬, 알콕시, 할로게노알킬, 할로게노알콕시, 디알킬아미노, -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup>, -COOR<sup>19</sup> 또는 -CONR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> 을 나타내며,

R<sup>19</sup> 는 수소, 알킬, 할로게노알킬, 또는 임의로 할로젠-, 알킬- 또는 할로게노알킬-치환된 사이클로알킬을 나타내거나, W<sup>4</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 오치환된 페닐을 나타내고,

R<sup>20</sup> 및 R<sup>21</sup> 은 서로 독립적으로 각각 수소, 알킬, 알케닐, 할로게노알킬, 할로게노알케닐, 알콕시, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, 알킬- 또는 할로게노알킬-치환된 사이클로알킬 또는 사이클로알킬알킬을 나타내거나, 각각 W<sup>4</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 오치환된 아릴 또는 아릴알킬을 나타내거나, -OR<sup>16</sup> 또는 -NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 를 나타내거나, 함께, 하나의 메틸렌 그룹이 산소에 의해 임의로 대체된 2 내지 6 원의 알킬렌 쇠를 나타내며,

W<sup>4</sup> 는 할로젠, 시아노, 니트로, 알킬, 알콕시, 할로게노알킬, 할로게노알콕시, 디알킬아미노, 알콕시카보닐, 디알킬아미노 카보닐 또는 -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup> 을 나타낸다.

일반식 (I)의 화합물은 특히 치환체의 성질에 따라 기하 및/또는 광학 이성체 또는, 경우에 따라 통상적인 방법으로 분리될 수 있는 다양한 조성의 이성체 혼합물로서 존재할 수 있다. 본 발명은 순수한 이성체 및 또한 이성체 혼합물, 이들의 제조 방법 및 용도, 및 이들을 함유하는 조성물에 관한 것이다. 그러나, 이후에는 편의상 항상 일반식 (I)의 화합물이 언급될 것이지만, 이들은 순수한 화합물 및 또한 경우에 따라 이성체 화합물이 다양한 비율로 존재하는 혼합물을 의미할 수 있다.

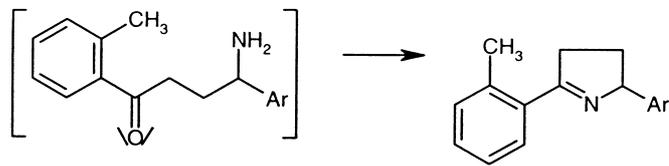
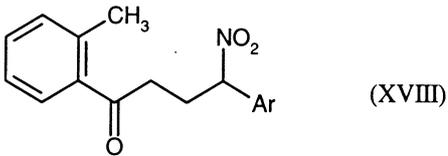
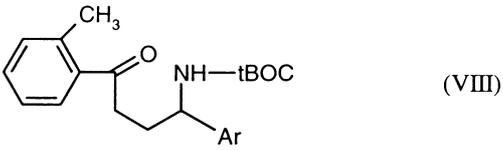
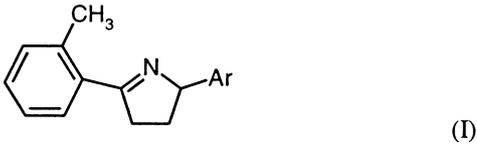
또한, 본 발명에 따라 일반식 (I)의 신규한 화합물은 후술하는 방법중 하나로 수득됨이 밝혀졌다:

A) 일반식 (I)의 사이클릭 이민은

a) 하기 일반식 (VIII)의 아미노케톤 유도체를, 경우에 따라 산 결합체의 존재하에서 산과 반응시킨 후, 폐환축합 (cyclocondensation)시키거나,

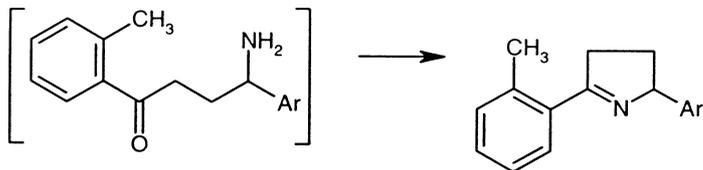
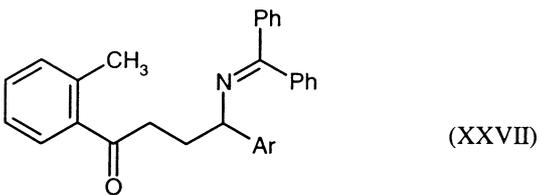
b) 하기 일반식 (XVIII)의 니트로케톤의 니트로 그룹을 환원시키고, 형성된 일반식 (II)의 아미노케톤 중간체를 특히 산성 매질중의 동일 반응계에서 (I)로 폐환축합시키거나,

c) 하기 일반식 (XXVII)의 이민을 수성 산으로 가수분해시키고, 형성된 일반식 (II)의 아미노케톤 중간체를 동일 반응계에서 (I)로 폐환축합시킴으로써 수득됨이 밝혀졌다:



방법 b) 에서 (II)

(I)



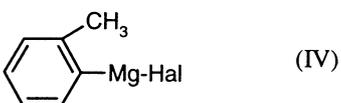
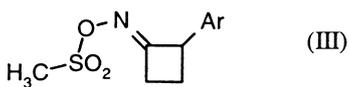
방법 c) 에서 (II)

(I)

상기 식에서,

Ar 은 상기 정의된 바와 같다.

B) 일반식 (I)의 사이클릭 이민은 또한 하기 일반식 (III)의 사이클릭 O-메틸설포닐 옥심을 희석제의 존재하에서 하기 일반식 (IV)의 아릴 그리냐드 (Grignard) 화합물과 반응시킴으로써 제조될 수 있다:

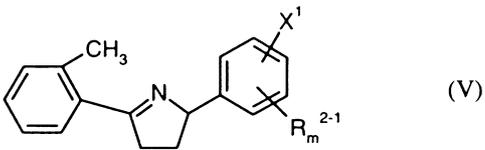
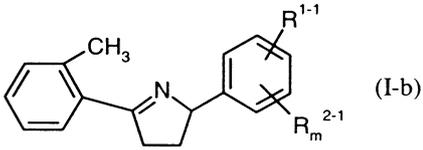


상기 식에서,

Ar 은 상기 정의된 바와 같고,

Hal 은 염소, 브롬 또는 요오드를 나타낸다.

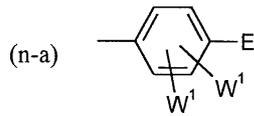
C) 하기 일반식 (I-b)의 사이클릭 이민은 하기 일반식 (V)의 화합물을 촉매의 존재하, 산 결합제의 존재하 및 용매의 존재하에서 하기 일반식 (VI)의 보론산과 커플링(coupling)시킴으로써 제조될 수 있다:



$R^{1-1}B(OH)_2$  (VI)

상기 식에서,

m 은 상기 정의된 바와 같고,



$R^{1-1}$  은 A, 또는 그룹 (m) -B-Z-D 및

중의 하나를 나타내며,

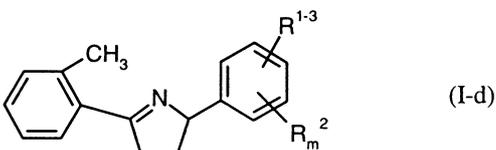
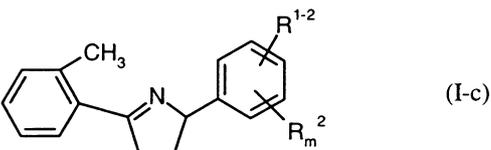
여기에서,

A, B, D, E, W<sup>1</sup> 및 Z 는 각각 상기 정의된 바와 같고,

$R^{2-1}$  는 수소, 불소, 시아노, 니트로, 알킬, 알콕시, 할로게노알킬, 할로게노알콕시, 알콕시알콕시 또는  $-SR^3$  을 나타내며, 여기에서  $R^3$  는 상기 정의된 바와 같고,

$X^1$  은 브롬, 요오드 또는  $-OSO_2CF_3$  를 나타낸다.

D) 하기 일반식 (I-c)의 사이클릭 이민은 하기 일반식 (I-d)의 사이클릭 이민을 하기 일반식 (VII)의 화합물과 축합시킴으로써 제조될 수 있다:





상기 식에서,

$\text{R}^2$ ,  $m$ ,  $\text{R}^9$ ,  $\text{R}^{10}$ ,  $\text{G}$ ,  $p$ ,  $q$  및  $r$  은 각각 상기 정의된 바와 같고,

$\text{R}^{1-2}$  는 그룹  $(m-b) -\text{B}-\text{Z}-\text{D}^1$  및  $(n-b) -\text{Y}^1-\text{E}^1$  중의 하나를 나타내며,

여기에서,

$\text{B}$  및  $\text{Z}$  는 각각 상기 정의된 바와 같고,

$\text{Y}^1$  은 산소 또는 황을 나타내며,

$\text{D}^1$  및  $\text{E}^1$  은 각각 그룹  $(m-b) -\text{B}-\text{Z}-\text{D}^1$  및  $(n-b) -\text{Y}^1-\text{E}^1$  중의 하나를 나타내며, 여기서  $\text{R}^9$ ,  $\text{R}^{10}$ ,  $\text{G}$ ,  $p$ ,  $q$  및  $r$  은 각각 상기 정의된 바와 같으며,

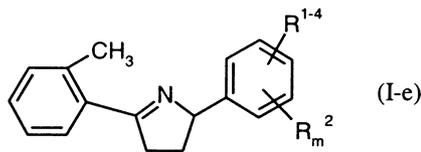
$\text{R}^{1-3}$  은 그룹  $(m-c) -\text{B}-\text{Z}-\text{H}$  및  $(n-c) -\text{Y}^1-\text{H}$  중의 하나를 나타내며,

여기에서,

$\text{B}$ ,  $\text{Y}^1$  및  $\text{Z}$  는 각각 상기 정의된 바와 같으며,

$\text{Ab}$  는 이탈 그룹을 나타낸다.

E) 하기 일반식 (I-e)의 사이클릭 이민은 상응하는 케토 유도체, 카복실산 유도체 또는 니트릴, 즉  $\text{G}$  가 시아노 또는 그룹 (a) 내지 (d) 중의 하나를 나타내는 일반식 (I)의 화합물을 일반적으로 통상적이고 공지된 방법으로 유도체화시킴으로써 제조될 수 있다:



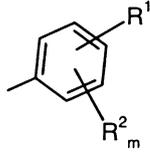
상기 식에서,

$\text{R}^2$  및  $m$  은 각각 상기 정의된 바와 같고,

$\text{R}^{1-4}$  는 래디칼  $\text{G}$  를 포함한 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명부분중에서 선택된 그룹을 나타내며, 여기서  $\text{G}$  는 상기 언급된 그룹 (e) 내지 (k) 중의 하나를 나타낸다.

또한, 본 발명에 따라 일반식 (I)의 신규한 화합물은 페스티사이드로서, 특히 농업에서 절지동물에 대해서 뿐만 아니라 유용한 동물 및 애완동물 관리시 기생충에 대해 매우 우수한 활성을 나타냄과 동시에 우수한 식물 화합성을 나타냄이 밝혀졌다.

일반식 (I)은 본 발명에 따른 화합물의 일반 정의를 제공한다. 상기 및 이후 언급되는 일반식에 기술된 래디칼의 바람직한 치환체 또는 래디칼 범위가 이후 설명된다.



Ar 은 바람직하게는 래디칼

여기에서,

m 은 바람직하게는 0, 1, 2 또는 3 을 나타내고,

R<sup>1</sup> 은 바람직하게는 수소, F, Cl, Br, 시아노, 트리(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬)-실릴, -CO-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, 테트라하이드로피라닐 및 하기 그룹 중의 하나중에서 선택된 메타 또는 파라 위치에서의 치환체를 나타내며:

(ℓ) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E,

R<sup>2</sup> 는 바람직하게는 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-알콕시 또는 -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup> 을 나타내고,

단, m 이 1 이고 R<sup>2</sup> 가 요오드인 경우 R<sup>1</sup> 은 수소를 나타내지 않으며,

o 는 바람직하게는 0, 1 또는 2 를 나타내고,

R<sup>3</sup> 은 바람직하게는 임의로 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬을 나타내며,

R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup> 는 서로 독립적으로 각각 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬을 나타내거나, 각각 W<sup>1</sup> 중 에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 페닐 또는 페닐-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내고,

X 는 바람직하게는 직접 결합, 산소, 황, 카보닐, 카보닐옥시, 옥시카보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알케닐렌, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알키닐렌, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌옥시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-옥시알킬렌, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-티오알킬렌, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌디옥시 또는 디-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬실릴렌을 나타내며,

A 는 바람직하게는 각각 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 페닐, 나프틸 또는 테트라하이드로나프틸을 나타내거나, 0 내지 4 개의 질소 원자, 0 내지 2 개의 산소 원자 및 0 내지 2 개의 황 원자를 포함한 1 내지 4 개의 헤테로 원자 및 1 또는 2 개의 방향족 환을 가지며 각 경우에 W<sup>2</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 5 내지 10-원 헤테로사이클릴(특히, 푸릴, 벤조푸릴, 티에닐, 벤조티에닐, 옥사졸릴, 벤조사졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 피롤릴, 피리디닐, 피리미디닐, 1,3,5-트리아지닐, 퀴놀리닐, 이소퀴놀리닐, 인돌릴, 퓨리닐, 벤조디옥솔릴, 인다닐, 벤조디옥사닐 또는 크로마닐)을 나타내고,

B 는 바람직하게는 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 p-페닐렌을 나타내며,

Z 는 바람직하게는 산소 또는 황을 나타내고,

D 는 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알키닐, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-할로게노알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-할로게노알케닐, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬-, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알케닐-, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알케닐-, 페닐-, 스티릴-, 할로게

노페닐- 또는 할로게노스티릴-치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠- 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬-치환된 C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알케닐 또는 C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알케닐-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 니트로-, 할로젠-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬- 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시-치환된 페닐-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, 나프틸-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, 테트라하이드로나프틸-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬 또는 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2 개의 헤테로 원자 및 5 또는 6 개의 환 멤버를 갖는 헤트아릴-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬(특히, 푸릴메틸, 티에닐메틸, 피롤릴메틸, 옥사졸릴메틸, 이속사졸릴메틸, 티아졸릴메틸 또는 피리딜메틸)을 나타내거나, -CO-R<sup>6</sup> 또는 -CO-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> 를 나타내거나, 그룹 -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-(CR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)<sub>q</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-G 를 나타내거나,

Z 및 D 는 또한 바람직하게는 함께, 임의로 니트로-, 할로젠-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬- 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시-치환된 페녹시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내며,

Y 는 바람직하게는 직접 결합, 산소, 황, 카보닐, 카보닐옥시, 옥시카보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알케닐렌, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌옥시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-옥시알킬렌, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-티오알킬렌, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌디옥시, 또는 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 p-페닐렌을 나타내고,

E 는 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알키닐, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-할로게노알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-할로게노알케닐, 또는 임의로 할로젠-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬-, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알케닐-, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알케닐-, 페닐-, 스티릴-, 할로게노페닐- 또는 할로게노스티릴-치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 임의로 할로젠- 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬-치환된 C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알케닐을 나타내거나, W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 페닐을 나타내거나, 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2 개의 헤테로 원자를 가지며 W<sup>2</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 5- 또는 6-원 헤트아릴(특히, 푸릴, 티에닐, 피롤릴, 옥사졸릴, 이속사졸릴, 티아졸릴 또는 피리딜)을 나타내거나, 그룹 -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-(CR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)<sub>q</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-G 를 나타내며,

R<sup>6</sup> 는 바람직하게는 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>-알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>-알케닐옥시, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬-, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알케닐-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬- 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알케닐-치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬옥시 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬옥시를 나타내거나, 각 경우에 니트로, 할로젠, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-할로게노알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-할로게노알콕시에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 페닐 또는 나프틸을 나타내고,

R<sup>7</sup> 은 바람직하게는 수소 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-알킬을 나타내며,

R<sup>8</sup> 은 바람직하게는 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-할로게노알킬, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬-, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알케닐-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬- 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알케닐-치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬을 나타내거나, 각각 할로젠, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-할로게노알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-할로게노알콕시에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 페닐 또는 페닐-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬을 나타내고,

p, q 및 r 은 서로 독립적으로 각각 바람직하게는 0, 1, 2 또는 3 을 나타내고, 단 이들의 합은 1 보다 크고 6 보다 작으며,

R<sup>9</sup> 및 R<sup>10</sup> 은 서로 독립적으로 각각 바람직하게는 수소 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내고,

G 는 바람직하게는 시아노를 나타내거나, 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹중에서 선택된 1 내지 3 개의 동일하거나 상이한 헤테로 원자를 가지며 할로젠, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬에 의해 임의로 일- 내지 삼치환되고 결합 위치

에서 래디칼 R<sup>11</sup> 에 의해 임의로 치환된 5- 또는 6-원 헤테로사이클(특히, 5,6-디하이드로디옥사진-2-일, 3-피리딜, 3-푸릴, 3-티에닐, 2-티아졸릴, 5-티아졸릴, 2-디옥솔라닐, 1,3-디옥산-2-일, 2-디티올라닐, 1,3-디티안-2-일 또는 1,3-티옥산-2-일)을 나타내거나, 하기 그룹중의 하나를 나타내며:

- (a)  $-\text{CO}-\text{R}^{11}$
- (b)  $-\text{CO}-\text{OR}^{12}$
- (c)  $-\text{CO}-\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$
- (d)  $-\text{CS}-\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$
- (e)  $-\text{C}(\text{R}^{11})=\text{N}-\text{R}^{15}$
- (f)  $-\text{C}(\text{R}^{11})(\text{OR}^{16})_2$
- (g)  $-\text{C}(\text{R}^{11})(\text{SR}^{16})_2$
- (h)  $-\text{C}(\text{R}^{11})(\text{OR}^{16})(\text{NR}^{17}\text{R}^{18})$
- (i)  $-\text{C}(\text{R}^{11})(\text{SR}^{16})(\text{NR}^{17}\text{R}^{18})$
- (j)  $-\text{C}(\text{OR}^{18})=\text{N}-\text{R}^{17}$
- (k)  $-\text{C}(\text{SR}^{18})=\text{N}-\text{R}^{17}$

R<sup>11</sup> 은 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알케닐, 또는 임의로 할로젠-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬- 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬-치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬카보닐아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬카보닐-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬아미노 및/또는 W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 오치환된 페닐을 나타내고,

R<sup>12</sup> 는 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알케닐, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬- 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬-치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내거나, W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-아릴-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬(특히 페닐-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 나프틸-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬)을 나타내며,

R<sup>13</sup> 및 R<sup>14</sup> 는 서로 독립적으로 각각 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알케닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬- 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬-치환된 C<sub>3</sub>-

C<sub>6</sub>-사이클로알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내거나, 각각 W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 오치환된 페닐 또는 페닐-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내거나, -OR<sup>12</sup> 또는 -NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> 을 나타내거나, 함께, 하나의 메틸렌 그룹이 산소에 의해 임의로 대체된 4 내지 6 원의 알킬렌쇄를 나타내고,

R<sup>15</sup> 는 바람직하게는 -OR<sup>12</sup>, -NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> 또는 -N(R<sup>11</sup>)-COOR<sup>12</sup> 를 나타내며,

R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup> 및 R<sup>18</sup> 은 서로 독립적으로 각각 바람직하게는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬을 나타내고,

W<sup>1</sup> 은 바람직하게는 수소, 할로젠, 시아노, 포르밀, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, 트리-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬실릴, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알케닐옥시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬카보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알콕시카보닐, 펜타플루오로티오 또는 -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup> 을 나타내며,

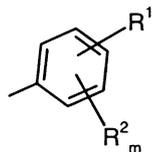
W<sup>2</sup> 는 바람직하게는 할로젠, 시아노, 포르밀, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, 트리-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬실릴, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬카보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알콕시카보닐, 펜타플루오로티오, -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup> 또는 -C(R<sup>11</sup>)=N-R<sup>15</sup> 를 나타내며,

W<sup>3</sup> 은 바람직하게는 할로젠, 시아노, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, 디-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬아미노, -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup>, -COOR<sup>19</sup> 또는 -CONR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> 을 나타내며,

R<sup>19</sup> 는 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, 또는 임의로 할로젠-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬- 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬-치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, W<sup>4</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 오치환된 페닐을 나타내고,

R<sup>20</sup> 및 R<sup>21</sup> 은 서로 독립적으로 각각 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알케닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬- 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬-치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내거나, 각각 W<sup>4</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 오치환된 페닐 또는 페닐-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내거나, -OR<sup>16</sup> 또는 -NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 을 나타내거나, 함께, 하나의 메틸렌 그룹이 산소에 의해 임의로 대체된 4 내지 6 원의 알킬렌쇄를 나타내며,

W<sup>4</sup> 는 바람직하게는 할로젠, 시아노, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, 디-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시카보닐, 디-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬아미노카보닐 또는 -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup> 을 나타낸다.



Ar 은 특히 바람직하게는 래디칼 을 나타내고,

m 은 특히 바람직하게는 0, 1 또는 2 를 나타내며,

R<sup>1</sup> 은 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 시아노, 트리(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬)-실릴, -CO-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, 테트라하이드로피라닐 및 하기 그룹중의 하나중에서 선택된 메타 또는 파라 위치에서의 치환체를 나타내고:

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E,

$R^2$  는 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 요오드, 시아노, 니트로,  $C_1-C_{16}$ -알킬,  $C_1-C_{16}$ -알콕시, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된  $C_1-C_6$ -알킬 또는  $C_1-C_6$ -알콕시를 나타내거나,  $C_1-C_8$ -알콕시- $C_1-C_8$ -알콕시 또는  $-S(O)_oR^3$  을 나타내며,

단, m 이 1 이고  $R^2$  가 요오드인 경우  $R^1$  은 수소를 나타내지 않고,

o 는 특히 바람직하게는 0, 1 또는 2 를 나타내며,

$R^3$  은 특히 바람직하게는  $C_1-C_4$ -알킬을 나타내거나, 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 메틸 또는 에틸을 나타내고,

$R^4$  및  $R^5$  는 서로 독립적으로 각각 특히 바람직하게는 수소,  $C_1-C_6$ -알킬, 또는 불소- 또는 염소-치환된  $C_1-C_6$ -알킬을 나타내거나, 각각  $W^1$  중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 페닐 또는 벤질을 나타내며,

X 는 특히 바람직하게는 직접 결합, 산소, 황, 카보닐, 카보닐옥시, 옥시카보닐,  $C_1-C_4$ -알킬렌,  $C_2-C_4$ -알케닐렌,  $C_2-C_4$ -알킬렌,  $C_1-C_4$ -알킬렌옥시,  $C_1-C_4$ -옥시알킬렌,  $C_1-C_4$ -티오알킬렌,  $C_1-C_4$ -알킬렌디옥시 또는 디- $C_1-C_4$ -알킬실릴렌을 나타내고,

A 는 특히 바람직하게는 각각  $W^1$  중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 페닐, 나프틸 또는 테트라하이드로나프틸을 나타내거나, 0 내지 4 개의 질소 원자, 0 내지 2 개의 산소 원자 및 0 내지 2 개의 황 원자를 포함한 1 내지 4 개의 헤테로 원자 및 1 또는 2 개의 방향족 환을 가지며 각 경우에  $W^2$  중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 5 내지 10-원 헤테로사이클릴(특히, 푸릴, 벤조푸릴, 티에닐, 벤조티에닐, 옥사졸릴, 벤조사졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 피롤릴, 피리딜, 피리미딜, 1,3,5-트리아지닐, 퀴놀리닐, 이소퀴놀리닐, 인돌릴, 퓨리닐, 벤조디옥솔릴, 인다닐, 벤조디옥사닐 또는 크로마닐)을 나타내며,

B 는 특히 바람직하게는  $W^1$  중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 p-페닐렌을 나타내고,

Z 는 특히 바람직하게는 산소 또는 황을 나타내며,

D 는 특히 바람직하게는 수소,  $C_1-C_{16}$ -알킬,  $C_2-C_{16}$ -알케닐,  $C_2-C_6$ -알킬, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된  $C_1-C_4$ -알킬 또는  $C_2-C_4$ -알케닐을 나타내거나, 각각 불소, 염소, 브롬,  $C_1-C_4$ -알킬,  $C_2-C_4$ -알케닐, 불소- 또는 염소-치환된  $C_2-C_4$ -알케닐, 페닐, 스티릴, 각 경우에 불소-, 염소- 또는 브롬-치환된 페닐 또는 스티릴에 의해 임의로 치환된  $C_3-C_6$ -사이클로알킬 또는  $C_3-C_6$ -사이클로알킬- $C_1-C_4$ -알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 불소-, 염소-, 브롬- 또는  $C_1-C_4$ -알킬-치환된  $C_5-C_6$ -사이클로알케닐 또는  $C_5-C_6$ -사이클로알케닐- $C_1-C_4$ -알킬을 나타내거나, 각각 니트로, 불소, 염소, 브롬,  $C_1-C_6$ -알킬,  $C_1-C_6$ -알콕시, 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된  $C_1-C_4$ -알킬 또는  $C_1-C_4$ -알콕시에 의해 임의로 치환된 페닐- $C_1-C_4$ -알킬, 나프틸- $C_1-C_4$ -알킬, 테트라하이드로나프틸- $C_1-C_6$ -알킬 또는 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2 개의 헤테로 원자 및 5 또는 6 개의 환 멤버를 갖는 헤프타릴- $C_1-C_4$ -알킬(특히, 푸릴메틸, 티에닐메틸, 피롤릴메틸, 옥사졸릴메틸, 이속사졸릴메틸, 티아졸릴메틸 또는 피리딜메틸)을 나타내거나,  $-CO-R^6$  또는  $-CO-NR^7R^8$  을 나타내거나, 그룹  $-(CH_2)_p-(CR^9R^{10})_q-(CH_2)_r-G$  를 나타내거나,

Z 및 D 는 또한 특히 바람직하게는 함께, 니트로, 불소, 염소, 브롬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시에 의해 임의로 치환된 페녹시-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬을 나타내고,

Y 는 특히 바람직하게는 직접 결합, 산소, 황, 카보닐, 카보닐옥시, 옥시카보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알케닐렌, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알키닐렌, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌옥시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-옥시알킬렌, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-티오알킬렌, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌디옥시, 또는 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 p-페닐렌을 나타내며,

E 는 특히 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알키닐, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알케닐을 나타내거나, 불소, 염소, 브롬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알케닐, 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알케닐, 페닐, 스티릴, 또는 각 경우에 불소-, 염소- 또는 브롬-치환된 페닐 또는 스티릴에 의해 임의로 치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 임의로 불소-, 염소-, 브롬- 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬-치환된 C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알케닐을 나타내거나, W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 페닐을 나타내거나, 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2 개의 헤테로 원자를 가지며 W<sup>2</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 5- 또는 6-원 헤테아릴(특히, 푸릴, 티에닐, 피롤릴, 옥사졸릴, 이속사졸릴, 티아졸릴 또는 피리딜)을 나타내거나, 그룹 - (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-(CR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)<sub>q</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-G 를 나타내고,

R<sup>6</sup> 은 특히 바람직하게는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐옥시, 또는 각각 불소, 염소, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-알킬 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-알케닐에 의해 임의로 치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬옥시 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-알킬옥시를 나타내거나, 불소, 염소, 브롬, 요오드, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 페닐을 나타내며,

R<sup>7</sup> 은 특히 바람직하게는 수소 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내고,

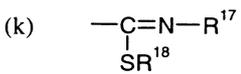
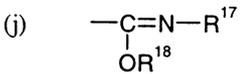
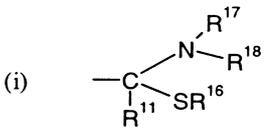
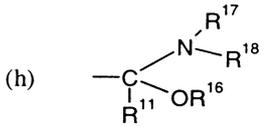
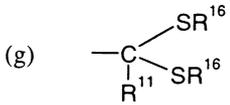
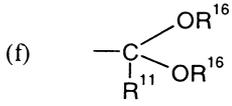
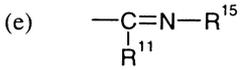
R<sup>8</sup> 은 특히 바람직하게는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내거나, 각각 불소, 염소, 브롬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 페닐 또는 벤질을 나타내며,

p, q 및 r 은 서로 독립적으로 각각 특히 바람직하게는 0, 1, 2 또는 3 을 나타내고, 단 이들의 합은 1 보다 크고 6 보다 작으며,

R<sup>9</sup> 및 R<sup>10</sup> 은 서로 독립적으로 각각 특히 바람직하게는 수소 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내고,

G 는 특히 바람직하게는 시아노를 나타내거나, 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹중에서 선택된 1 내지 3 개의 동일하거나 상이한 헤테로 원자를 가지며 불소, 염소, 브롬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬에 의해 임의로 일- 내지 삼치환되고 결합 위치에서 래디칼 R<sup>11</sup> 에 의해 임의로 치환된 5- 또는 6-원 헤테로사이클(특히, 5,6-디하이드로 디옥사진-2-일, 3-피리딜, 3-푸릴, 3-티에닐, 2-티아졸릴, 5-티아졸릴, 2-디옥솔라닐, 1,3-디옥산-2-일, 2-디티올라닐, 1,3-디티안-2-일 또는 1,3-티옥산-2-일)을 나타내거나, 하기 그룹중의 하나를 나타내며:

- (a) —CO—R<sup>11</sup>
- (b) —CO—OR<sup>12</sup>
- (c) —CO—NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>
- (d) —CS—NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>



R<sup>11</sup> 은 특히 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐을 나타내거나, 불소, 염소, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬에 의해 임의로 치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬카보닐아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬카보닐-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬아미노 및/또는 W<sup>3</sup> 중 에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 페닐을 나타내고,

R<sup>12</sup> 는 특히 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐을 나타내거나, 각각 불소, 염소, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 또는 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬에 의해 임의로 치 환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내거나, 각각 W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 페닐-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 나프틸-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내며,

R<sup>13</sup> 및 R<sup>14</sup> 는 서로 독립적으로 각각 특히 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐을 나타내거나, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시를 나타내거나, 각각 불소, 염소, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알 킬, 또는 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬에 의해 임의로 치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내거나, 각각 W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 페닐 또는 페닐-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알 킬을 나타내거나, -OR<sup>12</sup> 또는 -NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> 를 나타내거나, 함께, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>- 또는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- 를 나타 내고,

R<sup>15</sup> 는 특히 바람직하게는 -OR<sup>12</sup>, -NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> 또는 -N(R<sup>11</sup>)-COOR<sup>12</sup> 를 나타내며,

R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup> 및 R<sup>18</sup> 은 서로 독립적으로 각각 특히 바람직하게는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내고,

W<sup>1</sup> 은 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 요오드, 시아노, 포르밀, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시를 나타내거나, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬카보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시카보닐 또는 -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup> 을 나타내며,

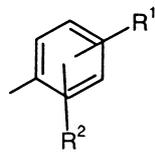
W<sup>2</sup> 는 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, 시아노, 포르밀, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시를 나타내거나, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬카보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시카보닐, -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup> 또는 -C(R<sup>11</sup>)=N-R<sup>15</sup> 를 나타내며,

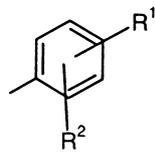
W<sup>3</sup> 은 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, 시아노, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시를 나타내거나, 디-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬아미노, -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup>, -COOR<sup>19</sup> 또는 -CONR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> 을 나타내며,

R<sup>19</sup> 는 특히 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 또는 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내거나, 불소, 염소, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 또는 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬에 의해 임의로 치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, W<sup>4</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 페닐을 나타내고,

R<sup>20</sup> 및 R<sup>21</sup> 은 서로 독립적으로 각각 특히 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, 또는 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐을 나타내거나, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시를 나타내거나, 각각 불소, 염소, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 또는 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬에 의해 임의로 치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내거나, 각각 W<sup>4</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 페닐 또는 페닐-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내거나, -OR<sup>16</sup> 또는 -NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 를 나타내거나, 함께, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>- 또는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- 를 나타내며,

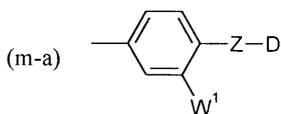
W<sup>4</sup> 는 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, 시아노, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, 디-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시카보닐, 디-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬아미노카보닐 또는 -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup> 을 나타낸다.



Ar 은 매우 특히 바람직하게는 래디칼  을 나타내고,

R<sup>1</sup> 은 매우 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 시아노, -CO-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, 테트라하이드로피라닐 및 하기 그룹중의 하나중에서 선택된 메타 또는 파라 위치에서의 치환체를 나타내며:

(l) -X-A



(n) -Y-E

R<sup>2</sup>는 매우 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 요오드, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 메틸티오, 에틸티오, 트리플루오로메틸, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시 또는 트리플루오로메틸티오를 나타내고,

단, m 이 1 이고 R<sup>2</sup> 가 요오드인 경우 R<sup>1</sup> 은 수소를 나타내지 않으며,

o 는 매우 특히 바람직하게는 0 또는 2 를 나타내고,

R<sup>3</sup> 은 매우 특히 바람직하게는 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, 디플루오로메틸 또는 트리플루오로메틸을 나타내며,

R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup> 는 서로 독립적으로 각각 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸 또는 t-부틸을 나타내거나, 각각 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일치환된 페닐 또는 벤질을 나타내며,

X 는 매우 특히 바람직하게는 직접 결합, 산소, 황, 카보닐, -CH<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -CH=CH-(E 또는 Z), -C≡C-, -CH<sub>2</sub>O-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O-, -CH(CH<sub>3</sub>)O-, -OCH<sub>2</sub>-, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -SCH<sub>2</sub>-, -S(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -SCH(CH<sub>3</sub>)-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌디옥시, 특히 -OCH<sub>2</sub>O-, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O- 또는 -OCH(CH<sub>3</sub>)O- 를 나타내고,

A 는 매우 특히 바람직하게는 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 페닐을 나타내거나, 각각 W<sup>2</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 푸릴, 벤조푸릴, 티에닐, 벤조티에닐, 옥사졸릴, 벤조사졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 피롤릴, 피리딜, 피리미딜, 1,3,5-트리아지닐, 퀴놀리닐, 이소퀴놀리닐, 인돌릴, 퓨리닐, 벤조디옥솔릴, 인다닐, 벤조디옥사닐 또는 크로마닐을 나타내며,

Z 는 매우 특히 바람직하게는 산소 또는 황을 나타내며,

D 는 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 펜틸 이성체들, 헥실 이성체들, n-헵틸, n-옥틸, n-이소옥틸, n-노닐, n-데실, n-운데실, n-도데실, n-트리데실, n-테트라데실, n-펜타데실, n-헥사데실, 2-프로페닐, 부테닐, 펜테닐, 헥세닐, 프로파길, 부티닐, 펜티닐, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub> 또는 -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 를 나타내거나, 각각 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 에테닐, 1-프로페닐, 2,2-디메틸에테닐, -CH=CCL<sub>2</sub>, 페닐, 스티릴, 또는 각 경우에 불소-, 염소- 또는 브롬-치환된 페닐 또는 4-클로로스티릴에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로프로필메틸, 사이클로부틸메틸, 사이클로펜틸메틸 또는 사이클로헥실메틸을 나타내거나, 각각 불소, 염소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸 또는 t-부틸에 의해 임의로 치환된 사이클로펜테닐, 사이클로헥세닐, 사이클로헥세닐메틸 또는 사이클로펜테닐메틸을 나타내거나, 각각 니트로, 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소프로폭시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시 또는 클로로디플루오로메톡시에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 벤질, 펜에틸, 나프틸메틸, 테트라하이드로나프틸메틸, 푸릴메틸, 티에닐메틸, 피롤릴메틸, 옥사졸릴메틸, 이속사졸릴메틸, 티아졸릴메틸 또는 피리딜메틸을 나타내거나, -CO-R<sup>6</sup> 또는 -CO-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> 을 나타내거나, 그룹 -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-(CR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)<sub>q</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-G 를 나타내거나,

Z 및 D 는 또한 매우 특히 바람직하게는 함께, 니트로, 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, n-프로필, i-프로필, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, i-프로폭시, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시 또는 클로로디플루오로메톡시에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 페녹시메틸을 나타내고,

Y 는 매우 특히 바람직하게는 직접 결합, 산소, 황, 카보닐, -CH<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -CH=CH-(E 또는 Z), -C≡C-, -CH<sub>2</sub>O-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O-, -CH(CH<sub>3</sub>)O-, -OCH<sub>2</sub>-, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -SCH<sub>2</sub>-, -S(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -SCH(CH<sub>3</sub>)-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌디옥시, 특히 -OCH<sub>2</sub>O- 또는 -O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O- 를 나타내거나, W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일치환된 p-페닐렌을 나타내며,

E 는 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 펜틸 이성체들, 헥실 이성체들, n-헵틸, n-옥틸, n-이소옥틸, n-노닐, n-데실, n-운데실, n-도데실, n-트리데실, n-테트라데실, n-펜타데실, n-헥사데실, 2-프로페닐, 부테닐, 펜테닐, 헥세닐, 프로파길, 부티닐, 펜티닐, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub> 또는 -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 를 나타내거나, 각각 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 에테닐, 1-프로페닐, 2,2-디메틸에테닐, -CH=CCl<sub>2</sub>, 페닐, 스티릴, 또는 각 경우에 불소-, 염소- 또는 브롬-치환된 페닐 또는 4-클로로스티릴에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나, 각각 불소, 염소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸 또는 t-부틸에 의해 임의로 치환된 사이클로펜테닐 또는 사이클로헥세닐을 나타내거나, W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 페닐을 나타내거나, 각각 W<sup>2</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 푸릴, 티에닐, 피롤릴, 옥사졸릴, 이속사졸릴, 티아졸릴 또는 피리딜을 나타내거나, 그룹 -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-(CR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)<sub>q</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-G 를 나타내고,

R<sup>6</sup> 은 매우 특히 바람직하게는 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소프로폭시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시, 사이클로프로필, 사이클로헥실, 사이클로헥실옥시, 사이클로헥실메틸옥시, 페닐, 2-클로로페닐, 3-클로로페닐, 2,6-디플루오로페닐, 2,4-디클로로페닐, 3,4-디클로로페닐, 2-트리플루오로메톡시페닐 또는 4-트리플루오로메톡시페닐을 나타내며,

R<sup>7</sup> 은 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타내고,

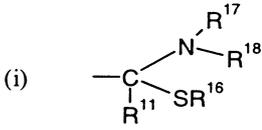
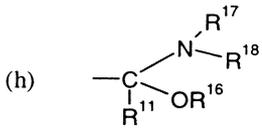
R<sup>8</sup> 은 매우 특히 바람직하게는 메틸 또는 에틸을 나타내거나, 염소에 의해 임의로 일치환된 페닐을 나타내며,

p, q 및 r 은 서로 독립적으로 각각 매우 특히 바람직하게는 0, 1, 2 또는 3 을 나타내고, 단 이들의 합은 1 보다 크고 4 보다 작으며,

R<sup>9</sup> 및 R<sup>10</sup> 은 서로 독립적으로 각각 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸 또는 t-부틸을 나타내고,

G 는 매우 특히 바람직하게는 시아노를 나타내거나, 각각 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필 또는 트리플루오로메틸에 의해 임의로 일- 내지 삼치환되고 결합 위치에서 래디칼 R<sup>11</sup> 에 의해 임의로 치환된 5,6-디하이드로디옥사진-2-일, 3-피리딜, 3-푸릴, 3-티에닐, 2-티아졸릴, 5-티아졸릴, 2-디옥솔라닐, 1,3-디옥산-2-일, 2-디티올라닐, 1,3-디티안-2-일 또는 1,3-티옥산-2-일을 나타내거나, 하기 그룹중의 하나를 나타내며:

- (a) —CO—R<sup>11</sup>
- (b) —CO—OR<sup>12</sup>
- (c) —CO—NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>
- (d) —CS—NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>
- (e)  $\begin{array}{c} \text{—C=N—R}^{15} \\ | \\ \text{R}^{11} \end{array}$
- (f)  $\begin{array}{c} \text{OR}^{16} \\ \diagup \\ \text{—C} \\ \diagdown \quad | \\ \text{OR}^{16} \quad \text{R}^{11} \end{array}$
- (g)  $\begin{array}{c} \text{SR}^{16} \\ \diagup \\ \text{—C} \\ \diagdown \quad | \\ \text{SR}^{16} \quad \text{R}^{11} \end{array}$



R<sup>11</sup> 은 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 펜틸 이성체들, 헥실 이성체들, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, 또는 불소 또는 염소에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐을 나타내거나, 각각 불소, 염소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub> 또는 -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나, 메틸카보닐아미노, 에틸카보닐아미노, 메틸카보닐-메틸아미노 및/또는 W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 페닐을 나타내고,

R<sup>12</sup> 는 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 또는 알릴을 나타내거나, 각각 불소, 염소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub> 또는 -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실메틸, 사이클로프로필에틸, 사이클로펜틸에틸 또는 사이클로헥실에틸을 나타내거나, 각각 W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 벤질 또는 페닐을 나타내고,

R<sup>13</sup> 및 R<sup>14</sup> 는 서로 독립적으로 각각 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, 메톡시, 에톡시 또는 알릴을 나타내거나, 각각 불소, 염소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필 또는 트리플루오로메틸에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸메틸 또는 사이클로헥실메틸을 나타내거나, 각각 W<sup>3</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 페닐, 벤질 또는 페닐을 나타내거나, -OR<sup>12</sup> 또는 -NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> 를 나타내고,

R<sup>15</sup> 는 매우 특히 바람직하게는 -OR<sup>12</sup>, -NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> 또는 -N(R<sup>11</sup>)-COOR<sup>12</sup> 를 나타내며,

R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup> 및 R<sup>18</sup> 은 서로 독립적으로 각각 매우 특히 바람직하게는 메틸, 에틸, n-프로필 또는 이소프로필을 나타내고,

W<sup>1</sup> 은 매우 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 시아노, 포르밀, 니트로, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소프로폭시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 클로로디플루오로메톡시, 아세틸, 프로피오닐, 부티릴, 이소부티릴, 메톡시카보닐, 에톡시카보닐, n-프로폭시카보닐, 이소프로폭시카보닐, n-부톡시카보닐, 이소부톡시카보닐, sec-부톡시카보닐, t-부톡시카보닐 또는 -S(O)<sub>0</sub>R<sup>3</sup> 을 나타내며,

W<sup>2</sup> 는 매우 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, 시아노, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 클로로디플루오로메톡시, 아세틸, 트리플루오로메틸티오, -CH=N-OCH<sub>3</sub>, -CH=N-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -CH=N-OC<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -C(CH<sub>3</sub>)=N-OCH<sub>3</sub>, -C(CH<sub>3</sub>)=N-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -C(CH<sub>3</sub>)=N-OC<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, -C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)=N-OCH<sub>3</sub>, -C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)=N-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub> 또는 -C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)=N-OC<sub>3</sub>H<sub>7</sub> 을 나타내며,

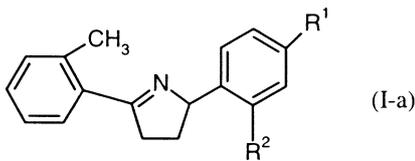
W<sup>3</sup> 은 매우 특히 바람직하게는 불소, 염소, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 메틸티오, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로메틸티오, 디메틸아미노, 디에틸아미노, -COOR<sup>19</sup> 또는 -CONR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> 을 나타내며,

R<sup>19</sup> 는 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, t-부틸 또는 -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 를 나타내거나, 각각 불소, 염소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필 또는 -CF<sub>3</sub> 에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나, W<sup>4</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 페닐을 나타내고,

R<sup>20</sup> 및 R<sup>21</sup> 은 서로 독립적으로 각각 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, 메톡시, 에톡시 또는 알릴을 나타내거나, 각각 불소 또는 염소에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸메틸 또는 사이클로헥실메틸을 나타내거나, 각각 W<sup>4</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 페닐, 벤질 또는 페닐을 나타내거나, -OR<sup>16</sup> 또는 -NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> 을 나타내며,

W<sup>4</sup> 는 매우 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, t-부틸, 메톡시, 에톡시, 메틸티오, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시 또는 트리플루오로메틸티오를 나타낸다.

또한, 하기 일반식 (I-a)의 화합물이 바람직하다:



상기 식에서,

R<sup>2</sup> 는 상기 언급된 일반적이거나, 바람직하거나, 특히 바람직하거나 또는 매우 특히 바람직한 의미를 가지며,

R<sup>1</sup> 은 수소, 또는 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 일- 또는 이치환된 페닐을 나타내거나, 하기 그룹중의 하나를 나타내고:

(m-b) -B-O-D

(ℓ) -Y-E,

B 는 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일치환된 p-페닐렌을 나타내고,

Y 는 직접 결합 또는 W<sup>1</sup> 중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 p-페닐렌을 나타내며,

D 및 E 는 각각 상기 언급된 매우 특히 바람직한 의미를 가지며,

여기에서,

G 는 시아노 또는 하기 그룹중의 하나를 나타내고:

(a) -CO-R<sup>11</sup>

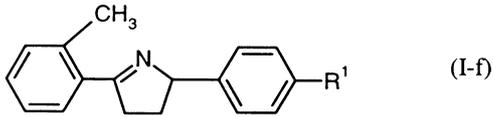
(e)  $\begin{matrix} \text{---C=N---R}^{15} \\ | \\ \text{R}^{11} \end{matrix}$

여기에서,

$R^{11}$  및  $R^{15}$  는 각각 상기 언급된 일반적이거나, 바람직하거나, 특히 바람직하거나 또는 매우 특히 바람직한 의미를 가지며,

$W^1$  은 상기 언급된 일반적이거나, 바람직하거나, 특히 바람직하거나 또는 매우 특히 바람직한 의미를 갖는다.

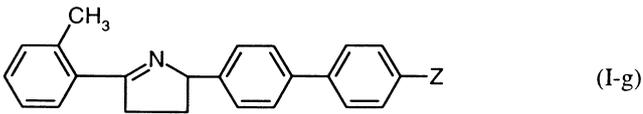
또한, 하기 일반식 (I-f)의 화합물이 바람직하다:



상기 식에서,

$R^1$  은 수소, a)  $W^2$  중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 페닐 또는 b)  $W^2$  중에서 선택된 래디칼에 의해 임의로 일 또는 이치환된 헤트라릴(특히, 푸릴, 티에닐, 피롤릴, 옥사졸릴, 이속사졸릴, 티아졸릴 또는 피리딜, 특히 티에닐)을 나타낸다.

또한, 하기 일반식 (I-g)의 화합물이 바람직하다:

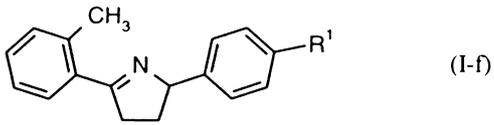


상기 식에서,

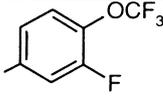
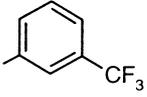
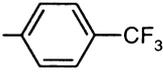
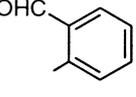
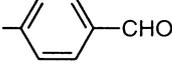
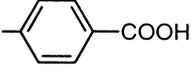
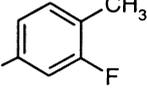
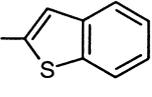
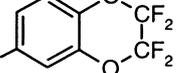
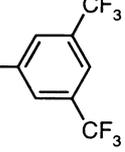
Z는 수소, 불소, 브롬, 시아노, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 클로로디플루오로메톡시, 아세틸, 트리플루오로메틸티오,  $-CH=N-OCH_3$ ,  $-CH=N-OC_2H_5$ ,  $-CH=N-OC_3H_7$ ,  $-C(CH_3)=N-OCH_3$ ,  $-C(CH_3)=N-OC_2H_5$ ,  $-C(CH_3)=N-OC_{13}H_7$ ,  $-C(C_2H_5)=N-OC_2H_5$  또는  $-C(C_2H_5)=N-OC_3H_7$  을 나타낸다.

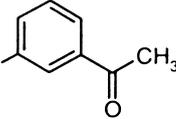
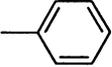
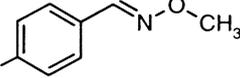
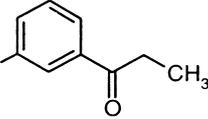
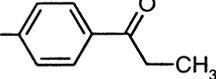
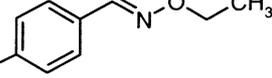
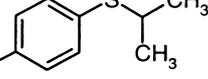
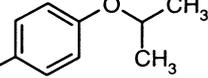
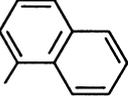
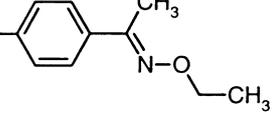
추가로 하기 표 1에 기재된 일반식 (I-f)의 화합물이 바람직하다.

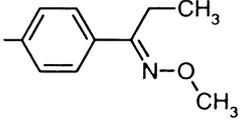
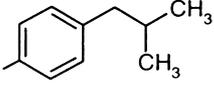
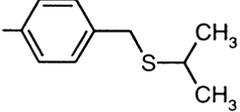
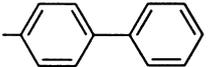
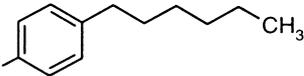
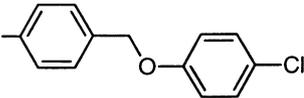
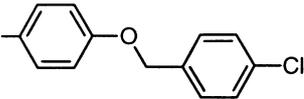
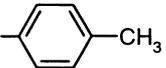
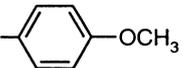
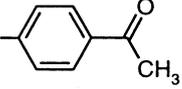
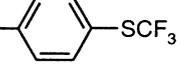
표 1

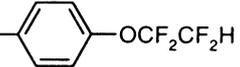


실시예 번호	R <sup>1</sup>
I-1	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>
I-2	
I-3	
I-4	
I-5	
I-6	
I-7	
I-8	
I-9	
I-10	

실시예 번호	R <sup>1</sup>
I-11	
I-12	
I-13	
I-14	
I-15	
I-16	
I-17	
I-18	
I-19	
I-20	

실시예 번호	R <sup>1</sup>
I-21	
I-22	-H
I-23	
I-24	
I-25	
I-26	
I-27	
I-28	
I-29	
I-30	
I-31	

실시예 번호	R <sup>1</sup>
I-32	
I-33	
I-34	
I-35	
I-36	
I-37	
I-38	
I-39	
I-40	
I-41	
I-42	

실시예 번호	R <sup>1</sup>
I-43	

상기 언급된 일반적이거나 바람직한 래디칼 정의 또는 설명은 목적하는 바에 따라, 즉, 각각의 범위와 바람직한 범위사이의 조합을 포함하여 서로 조합할 수 있다. 이들은 최종 생성물 및 또한 상응하게 전구체 및 중간체에 적용된다.

본 발명에 따른 바람직한 화합물은 상기 바람직한 것으로 기술된 정의들의 조합을 포함하는 일반식 (I)의 화합물이다.

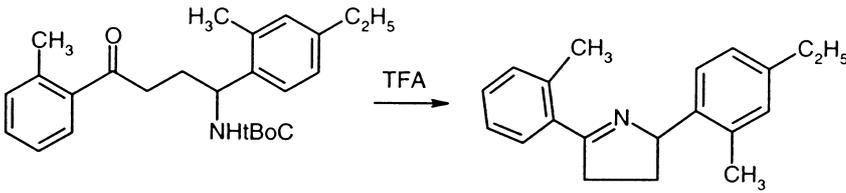
본 발명에 따른 특히 바람직한 화합물은 상기 특히 바람직한 것으로 기술된 정의들의 조합을 포함하는 일반식 (I)의 화합물이다.

본 발명에 따른 매우 특히 바람직한 화합물은 상기 매우 특히 바람직한 것으로 정의된 정의들의 조합을 포함하는 일반식 (I)의 화합물이다.

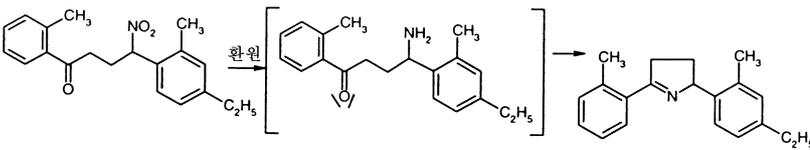
알킬 또는 알케닐과 같은 포화 또는 불포화 탄화수소 래디칼은, 예를 들어 알콕시와 같은 헤테로 원자와 결합된 경우에도, 각 경우, 가능하다면 직쇄 또는 측쇄이다.

임의로 치환된 래디칼은 일- 또는 다치환될 수 있으며, 이때 다치환된 경우 치환체는 동일하거나 상이할 수 있다. 예를 들어 m 개의 래디칼 R<sup>5</sup> 에서 m 이 1 보다 큰 경우와 같이, 동일한 지수를 갖는 복수개의 래디칼은 동일하거나 상이할 수 있다.

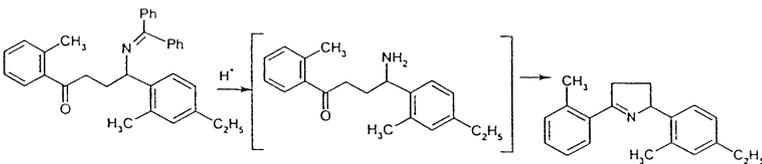
예를 들어, tBOC-[1-(4-에틸-2-메틸-페닐)-3-(2-메틸페닐-카복실)-1-프로필]-아민을 출발물질로 사용한 경우, 본 발명에 따른 방법 (A) a)의 반응과정은 하기 반응식으로 나타낼 수 있다:



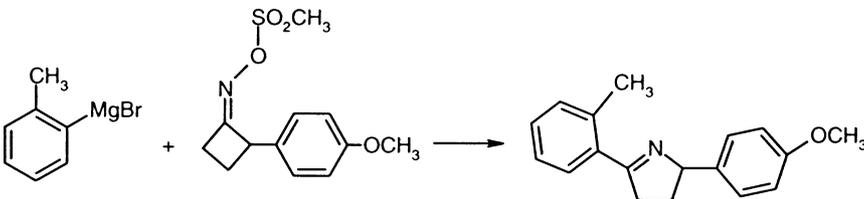
예를 들어, 1-(4-에틸-2-메틸-페닐)-1-니트로-3-(2-메틸페닐-카복실)-프로판을 출발물질로 사용한 경우, 본 발명에 따른 방법 (A) b)의 반응과정은 하기 반응식으로 나타낼 수 있다:



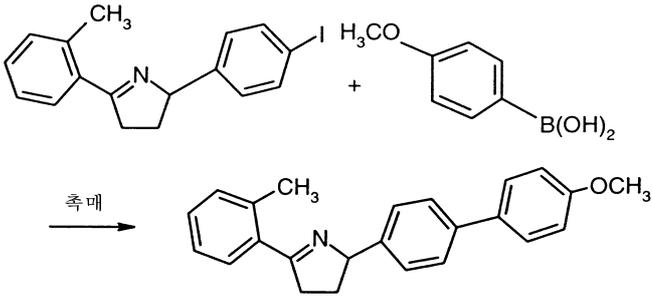
예를 들어, 1-(4-에틸-2-메틸-페닐)-1-(디페닐메틸렌아미노)-3-(2-메틸페닐카복실)-프로판을 출발물질로 사용한 경우, 본 발명에 따른 방법 (A) c)의 반응과정은 하기 반응식으로 나타낼 수 있다:



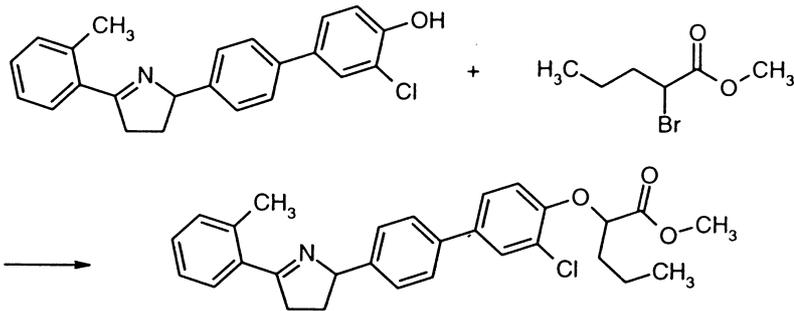
예를 들어, 2-(4-메톡시페닐)-사이클로부탄 O-메탄설포닐옥심 및 2-톨릴마그네슘 브로마이드를 출발물질로 사용한 경우, 본 발명에 따른 방법 (B)의 반응과정은 하기 반응식으로 나타낼 수 있다:



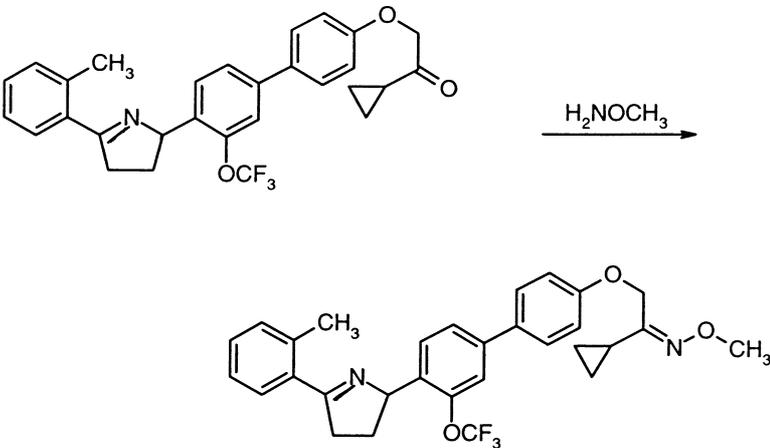
예를 들어, 2-(2-메틸페닐)-5-(4-요오도페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤 및 4-메톡시페닐보론산을 출발물질로 사용한 경우, 본 발명에 따른 방법 (C)의 반응과정은 하기 반응식으로 나타낼 수 있다:



예를 들어, 2-(2-메틸페닐)-5-(3'-클로로-4'-하이드록시비페닐-4-일)-3,4-디하이드로-2H-피롤 및 메틸 α-브로모발레이트를 출발물질로 사용한 경우, 본 발명에 따른 방법 (D)의 반응과정은 하기 반응식으로 나타낼 수 있다:

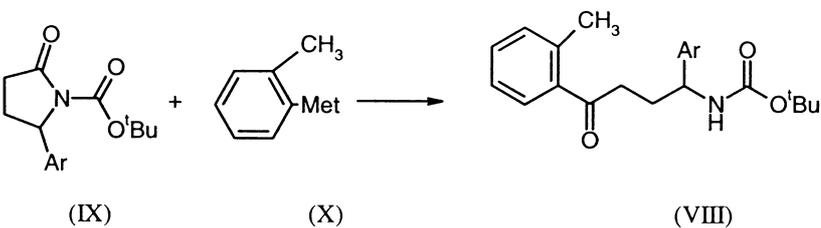


예를 들어, 5-(4'-사이클로프로필카보닐메톡시-3-트리플루오로메톡시비페닐-4-일)-(2-메틸페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤 및 O-메틸하이드록실아민을 출발물질로 사용한 경우, 본 발명에 따른 방법 (E)의 반응과정은 하기 반응식으로 나타낼 수 있다:



일반식 (VIII)은 본 발명에 따른 방법 (A) a)를 수행하는데 필요한 아미노케톤 유도체의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식에서, Ar 은 바람직하게는 일반식 (I)의 사이클릭 이민의 설명과 관련하여 바람직한 것으로 이미 언급된 의미를 나타낸다. 일반식 (VIII)의 아미노케톤 유도체는 신규하다.

일반식 (VIII)의 아미노케톤 유도체는, 예를 들어 하기 반응식의 방법에 따라, 일반식 (IX)의 BOC-보호된 락탐을 0 내지 80 °C의 온도에서 일반식 (X)의 금속화된 방향족 화합물과 반응시켜 제조할 수 있다:

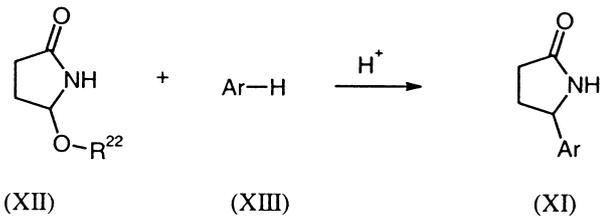


일반식 (X)에서, Met 는 Li, MgI, MgBr 또는 MgCl 과 같은 일가 금속 래디칼을 나타낸다.

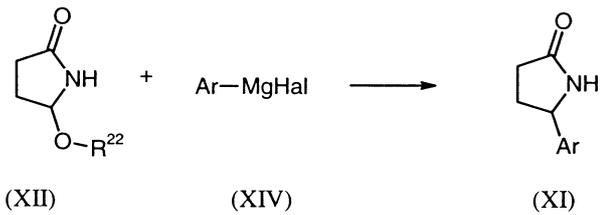
일반식 (X)의 금속화된 방향족 화합물의 일부는 공지되어 있거나, 공지된 방법에 따라, 예를 들어 상응하는 방향족 화합물 또는 할로게노 방향족 화합물을 리튬화(lithiation)시키거나, 그리냐드(Grignard) 반응시켜 제조할 수 있다.

일반식 (IX)의 보호된 락탐은, 예를 들어 일반식 (XI)의 락탐을 통상적인 방법으로 BOC-보호시켜, 예를 들면 부틸 리튬으로 금속화시키고, 디-*t*-부틸 디카보네이트와 반응시킴으로써 수득할 수 있다(참조예: T.W. Greene, P.G.M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd Ed., John Wiley & Sons, New York 1991).

일반식 (XI)의 락탐은, 예를 들어 일반식 (XII)의  $\omega$ -알콕시락탐으로부터 출발하여 두가지 방법에 의해 제조할 수 있다.  $\omega$ -알콕시락탐을 하기 반응식에 따라 산성 촉매, 예를 들어 황산, 아세트산 또는 염화알루미늄의 존재하 및 경우에 따라 희석제, 예를 들어 디클로로메탄 또는 아세토니트릴의 존재하에서 일반식 (XIII)의 방향족 화합물과 반응시킬 수 있다:



또한, 일반식 (XII)의  $\omega$ -알콕시락탐을 하기 반응식에 따라 희석제, 예를 들면 테트라하이드로푸란의 존재하에서 일반식 (XIV)의 아릴 그리냐드 화합물과 반응시킬 수 있다[참조: Org. Prep. Proced. Int. 25, 255 (1993)]:



일반식 (XII)에서, R<sup>22</sup> 는 메틸 또는 에틸을 나타내고,

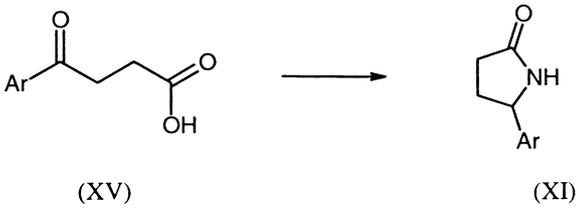
일반식 (XIV) 에서, Hal 은 염소, 브롬 또는 요오드를 나타낸다.

일반식 (XII)의  $\omega$ -알콕시락탐은 공지되어 있고 이중 일부는 상업적으로 입수할 수 있으며, 이들은 각 경우에 메탄올 또는 에탄올의 존재하에서 상응하는 비치환된 이미드를 음극(cathodic) 환원 또는 소듐 보로하이드라이드 환원시키거나, 비치환된 락탐을 양극(anodic) 산화시킴으로써 제조될 수 있다(참조예: J. Org. Chem. 56, 1822 (1991); Synthesis 1980, 315).

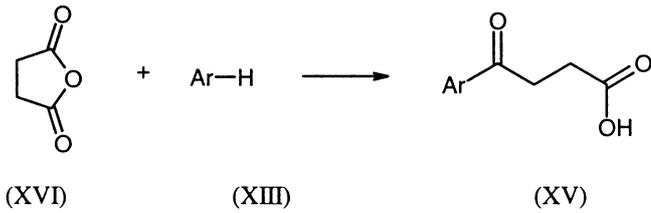
일반식 (XIII)의 방향족 화합물은 일반적으로 공지되었거나 유기화학의 일반적으로 공지된 다양한 방법을 이용하여 제조될 수 있는 벤젠 유도체이다.

일반식 (XIV)의 아릴 그리냐드 화합물은 상응하는 아릴 할라이드 및 마그네슘으로부터 통상적인 방법으로 제조될 수 있다. 아릴 할라이드는 유기화학의 일반적으로 공지된 화합물이다.

일반식 (XI)의 락탐은 또한, 예를 들어 일반식 (XV)의 치환된  $\omega$ -벤조일카복실산을 하기 반응식에 따라 비등점에서 탄산암 모늄 및 포름산으로부터 제조된 시약으로 폐환시킴으로써 제조될 수 있다[참조: Recl. Trav. Chim. Bays-Bas 81, 788 (1962)]:



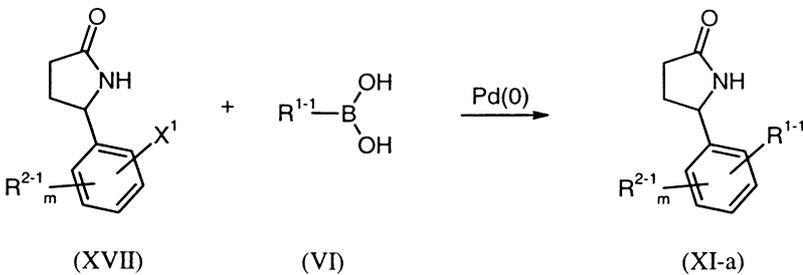
상기 반응에 필요한 일반식 (XV)의 ω-벤조일카복실산은 일반식 (XVI)의 디카복실산 무수물을 하기 반응식에 따라 루이스 산, 예를 들어 염화알루미늄의 존재하 및, 경우에 따라 희석제, 예를 들어 벤젠의 존재하에서 일반식 (XIII)의 방향족 화합물과 반응시킴으로써 제조될 수 있다[참조: Recl. Trav. Chim. Pays-Bas 81, 788 (1962)]:



상기 반응에 필요한 무수물(숙신산 무수물)은 상업적으로 입수가능하다.

일반식 (XI)의 락탐으로부터 출발하는 방법 A) a)에 따른 폐환축합을 포함한 일반식 (I)의 사이클릭 이민을 제조하기 위한 모든 방법 단계는 "단일-용기(one-pot) 반응"으로 수행될 수 있다(참조: 실시예 I-9 "단일-용기 방법").

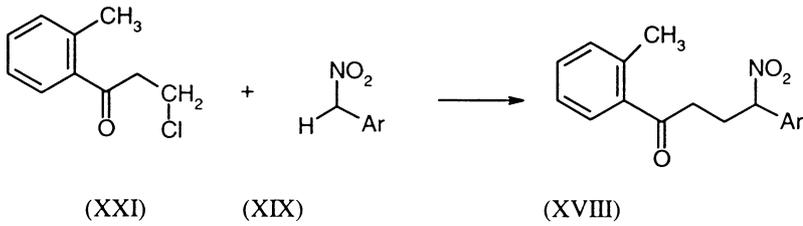
본 발명에 따른 일반식 (I)의 활성 화합물에서 Ar 이 상기 나타난 일반식 (I-b)에서와 같이 임의로 치환된 비페닐릴을 나타내는 경우에, 일반식 (XI-a)의 상응하는 비페닐 락탐은 상기 언급된 방법 (C) 및 후술하는 방법과 유사하게 일반식 (XVII)의 특정 페닐 락탐을 하기 반응식에 따라 일반식 (VI)의 보론산과 반응시킴으로써 상기 방법을 유리하게 변형시킨 방법으로 제조될 수 있다:



X<sup>1</sup> 이 브롬 또는 요오드를 나타내는 일반식 (XVII)의 페닐 락탐은 제조방법이 상기 언급되어 있는 일반식 (XI)의 화합물의 일 부분이다. X<sup>1</sup> 이 트리플루오로메탄설포닐을 나타내는 일반식 (XVII)의 페닐 락탐은 Ar 이 R<sup>1</sup>=하이드록실에 의해 치환된 일반식 (XI)의 상응하는 화합물로부터 방법 (C)에 기술된 경로와 유사하게 제조될 수 있다.

일반식 (XVIII)은 방법 A) b)를 수행하기 위해 필요한 니트로케톤의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식에서, Ar 은 바람직하게는 일반식 (I)의 사이클릭 이민의 설명과 관련하여 바람직한 것으로 이미 언급된 의미를 나타낸다. 일반식 (XVIII)의 니트로케톤은 신규하다.

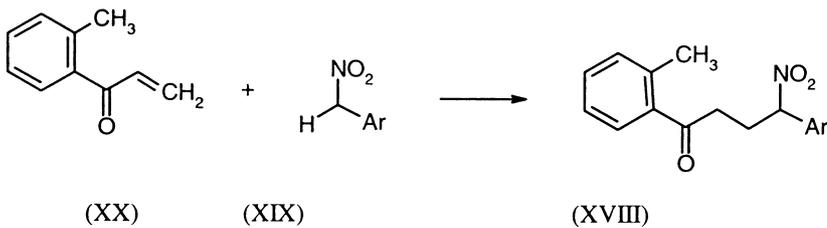
일반식 (XVIII)의 니트로케톤은, 예를 들어 일반식 (XXI)의 ω-클로로알킬 페닐 케톤을 희석제, 예를 들면 메탄올, 에탄올, 그밖의 다른 저급 지방족 알콜 또는 테트라하이드로푸란의 존재하 및 산 결합제, 예를 들면 수소화나트륨 또는, 바람직하게는 희석제로 사용된 상응하는 알콜의 알칼리 금속 알콕사이드의 존재하에서 하기 반응식에 따라 축합시켜 제조할 수 있다:



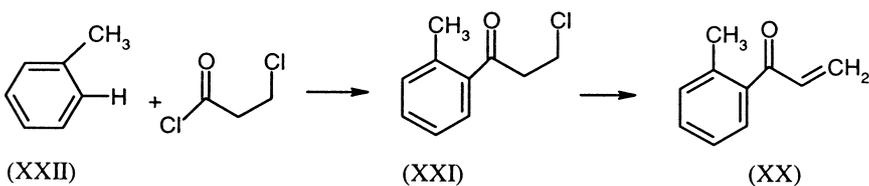
일반식 (XXI)의 ω-클로로알킬 페닐 케톤은 공지된 방법을 이용하여, 예를 들어 톨루엔을 3-클로로프로피오닐 클로라이드로 프리델-크라프트(Friedel-Crafts) 아실화시켜 제조할 수 있다.

일반식 (XIX)의 니트로메틸 벤젠은 공지되어 있거나, 공지된 방법으로, 예를 들면 상응하는 톨루엔의 측쇄를 니트로화(nitration)시키거나, 상응하는 벤질 할라이드를 아질산염과 반응시킴으로써 제조될 수 있다[참조예: J. Am. Chem. Soc. 77, 6269 (1955); J. Am. Chem. Soc. 86, 2681 (1964); Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Georg Thieme Verlag Stuttgart, Volume 10/1, 46-57(할로젠 치환), Volume E16, 145-154(양 방법 모두)]. 이 목적에 필요한 톨루엔 또는 벤질 할라이드는 유기화학의 일반적으로 공지된 화합물이다.

일반식 (XVIII)의 니트로케톤은, 예를 들어 하기 반응식에 따라, 일반식 (XIX)의 니트로메틸벤젠을 희석제, 예를 들면 메탄올, 에탄올 또는 그밖의 다른 저급 지방족 알코올의 존재하 및 산 결합제, 예를 들면, 바람직하게는 희석제로 사용된 상응하는 알코올의 알칼리 금속 알콕사이드의 존재하에서 일반식 (XX)의 페닐 비닐 케톤에 마이클 부가(Michael addition)시킴으로써 제조될 수 있다(참조예: J. Prakt. Chem., Series 4, 1, 57 (1955); Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Georg Thieme Verlag Stuttgart, Volume 10/1, 199-206):

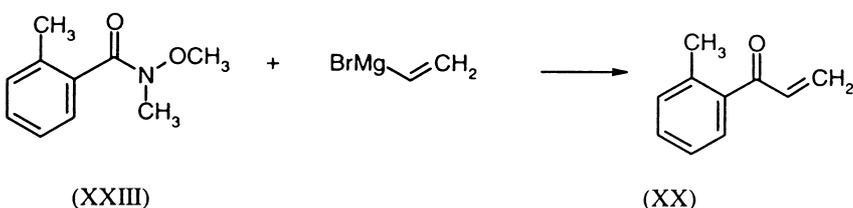


일반식 (XX)의 페닐 비닐 케톤은, 예를 들어 하기 반응식에 따라, 일반식 (XXII)의 톨루엔을 3-클로로프로피오닐 클로라이드와 프리델-크라프트 아실화시켜 수득할 수 있는 일반식 (XXI)의 β-클로로프로피오페논으로부터 산 결합제, 예를 들면 포타슘 아세테이트의 존재하 및 희석제, 예를 들면 메탄올의 존재하에서 염화수소를 제거함으로써 제조될 수 있다[참조예: J. Prakt. Chem., Series 4, 1, 57 (1955)].



일반식 (XXII)의 톨루엔은 상업적으로 입수가 가능하다.

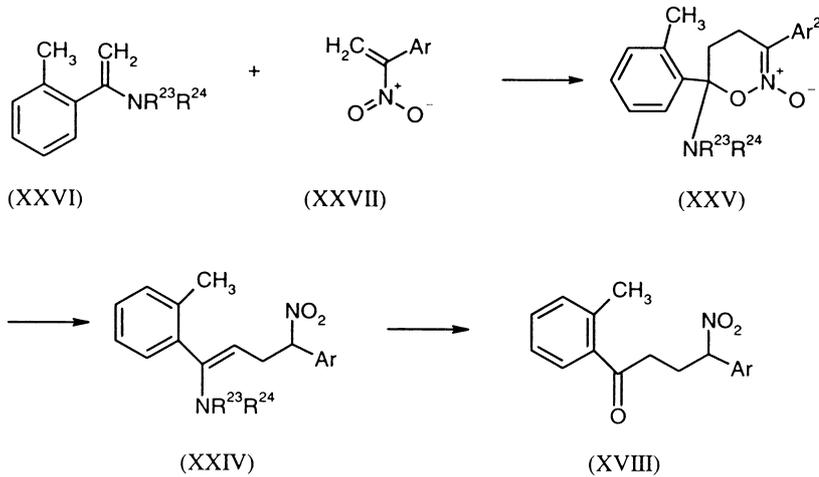
일반식 (XX)의 페닐 비닐 케톤은 또한 일반식 (XXIII)의 O-메틸 메틸-2-메틸-벤조하이드록사메이트를 하기 반응식에 따라 비닐마그네슘 브로마이드와 반응시킴으로써 제조될 수 있다:



일반식 (XXIII)의 O-메틸 메틸-2-메틸-벤조하이드록사메이트는 공지되어 있거나, 공지된 방법에 의해, 예를 들면 상응하는 벤조산 유도체로부터 제조될 수 있다[참조예: Tetrahedron Lett. 22, 3815 (1981)].

일반식 (XX)의 페닐 비닐 케톤은 민감하기 때문에 일반식 (XIX)의 니트로메틸벤젠과 직접 반응시켜 일반식 (XVIII)의 니트로케톤을 제조하는 방법이 바람직하다.

일반식 (XVIII)의 니트로케톤은 또한 하기 반응식에 따라 일반식 (XXVI)의 메틸 페닐 케톤의 엔아민을 일반식 (XXVII)의  $\alpha$ -니트로스티렌에 부가하고, 반응 생성물을 산 가수분해시킴으로써 제조될 수 있다:



일반식 (XXIV), (XXV) 및 (XXVI)에서, R<sup>23</sup> 및 R<sup>24</sup> 는 이들이 결합된 질소 원자와 함께 사이클릭 아미노 래디칼, 예를 들어 1-피롤리디노, 1-피페리디노 또는 4-모르폴리노를 나타낸다.

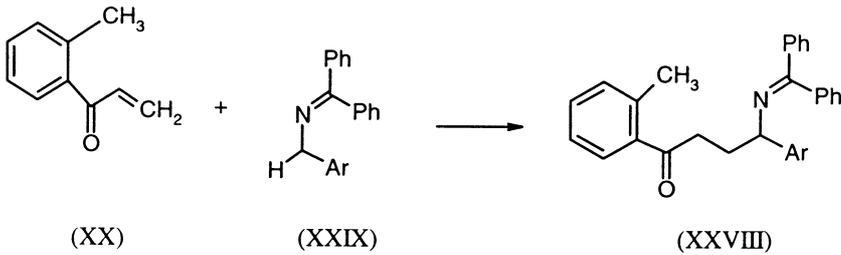
대부분의 경우, 부가는 [4+2]-사이클로부가로 진행되어 분리될 수 있는 일반식 (XXV)의 1,2-옥사진 N-옥사이드 유도체가 형성되고, 반응은 경우에 따라 비극성 희석제, 예를 들면 디에틸 에테르의 존재하에 예를 들어 -80 내지 +20 °C에서 수행된다. 가수분해는, 예를 들어, 경우에 따라 메탄올 또는 에탄올의 존재하에서 염산과 같은 수성 광산을 사용하여 수행된다[참조예: Helv. Chim. Acta 68, 162 (1985); Tetrahedron 45, 2099 (1989)]. 많은 경우에, 상응하는 디케토 화합물을 제공하는 바람직하지 않은 네프(Nef) 반응이 경쟁 반응으로서 일어날 것이기 때문에, 우선 1,2-옥사진-N-옥사이드 유도체를 단순히 메탄올 또는 에탄올에 용해시켜 개환시킴으로써 일반식 (XXIV)의 화합물을 수득하는 것이 유리하다[참조예: Tetrahedron 45, 2099 (1989)].

일반식 (XXVI)의 엔아민의 일부는 공지되어 있거나, 또는 예를 들어 적절히 치환된 아세트페논 및 사이클릭 아민으로부터 표준방법에 의해 제조될 수 있다(예: Org. Syntheses Vol. 58, 56, John Wiley & Sons, New York). 이 목적을 위해 필요한 아세트페논의 일부는 상업적으로 입수가능하거나, 방향족 화합물에 대한 화학의 공지된 방법으로 제조될 수 있다.

일반식 (XXVII)의 니트로스티렌의 일부는 공지되어 있거나, 또는 예를 들어 상기 언급된 일반식 (XIX)의 니트로메틸벤젠을 포르밀화시켜 제조될 수 있다(참조예: Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Georg Thieme Verlag Stuttgart, Volume E16, 215).

일반식 (XXVIII)은 방법 (A) c)를 수행하는데 필요한 이민의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식에서, Ar 은 바람직하게는 일반식 (I)의 사이클릭 이민의 설명과 관련하여 바람직한 것으로 이미 언급된 의미를 나타낸다.

일반식 (XXVIII)의 이민은, 예를 들어 하기 반응식에 따라 일반식 (XXIX)의 N-디페닐메틸렌벤질아민을 일반식 (XX)의 페닐 비닐 케톤에 마이클(Michael) 부가시킴으로써 제조될 수 있다:

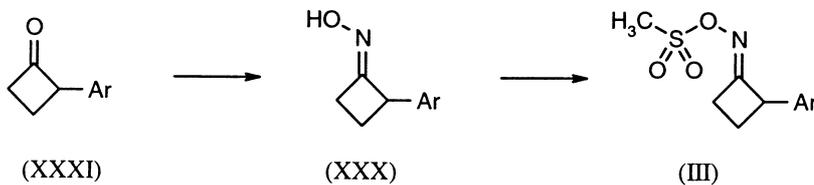


부가는 산 결합체의 존재하 및 희석제, 예를 들면 아세트니트릴 또는 디클로로메탄의 존재하 및, 경우에 따라 반응 보조제의 존재하에 예를 들어 실온에서 수행된다. 바람직한 산 결합체는 반응 보조제로서 예를 들어 트리에틸벤질암모늄 클로라이드와 같은 상 전이 촉매의 존재하의 50% 세기 수산화나트륨 수용액과 같은 수성 알칼리이다[참조예: Synth. Commun. 17, 211 (1987)].

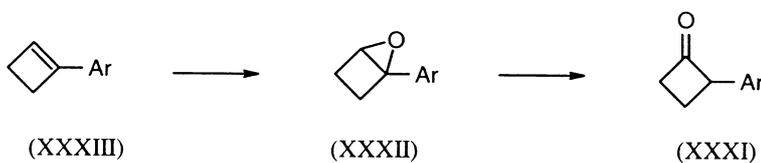
일반식 (XX)의 페닐 비닐 케톤의 제조방법은 상기 언급되어 있다. 일반식 (XXIX)의 N-디메틸메틸렌 벤질아민은, 예를 들어 상응하는 벤질아민을 벤조페논과 반응시켜 수득된다(참조예: Tetrahedron Lett. 1978, 2641). 상기 목적에 필요한 벤질아민은 공지되어 있거나, 또는 공지된 방법에 의해, 예를 들면 상응하는 벤질 할라이드를 아미노분해(aminolysis)시켜 제조할 수 있다(상기 참조).

일반식 (III)은 본 발명에 따른 방법 (B)를 수행하는데 필요한 사이클릭 O-메탄설포닐 옥심의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식에서, Ar 은 바람직하게는 일반식 (I)의 사이클릭 이민의 설명과 관련하여 바람직한 것으로 이미 언급된 의미를 나타낸다. 일반식 (III)의 O-메탄설포닐 옥심은 신규하다.

일반식 (III)의 O-메탄설포닐 옥심은, 예를 들어 하기 반응식에 따라, 우선 일반식 (XXXI)의 사이클릭 α-아릴 케톤을 일반적으로 공지된 방법에 의해 일반식 (XXX)인 그의 옥심으로 전환시키고, 이를 알콜의 메실화와 유사하게 메탄설포닐 클로라이드와 반응시킴으로써 제조될 수 있다:

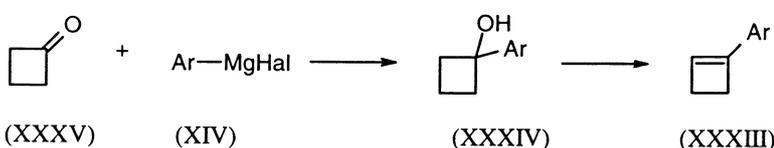


일반식 (XXXI)의 사이클릭 α-아릴 케톤은, 예를 들어 하기 반응식에 따라, 일반식 (XXXIII)의 1-아릴사이클로알켄을 통상적인 방법에 의해, 예를 들면 m-클로로퍼벤조산을 사용하여 에폭시화시켜 일반식 (XXXII)의 옥시란을 수득한 다음, 이를 산성 후처리하여 이성체화시킴으로써 제조될 수 있다[참조예: Tetrahedron 30, 2027 (1974)]:



물론, 다른 경로로 수득한 일반식 (XXXII)의 옥시란을 이성체화시켜, 예를 들면 클로로포름중의 용액을 20% 세기의 황산과 진탕시킴으로써 일반식 (XXXI)의 사이클릭 α-아릴 케톤을 수득하는 것도 가능하다.

일반식 (XXXIII)의 1-아릴사이클로알켄은, 예를 들어 하기 반응식에 따라 상기 언급된 일반식 (XIV)의 아릴 그리냐드 화합물을 통상의 그리냐드 조건하에서 일반식 (XXXV)의 사이클로부타논과 반응시키고, 예를 들어 이러한 방법으로 수득된 일반식 (XXXIV)의 사이클릭 벤질 알콜을 탈수시킴으로써 제조될 수 있다:



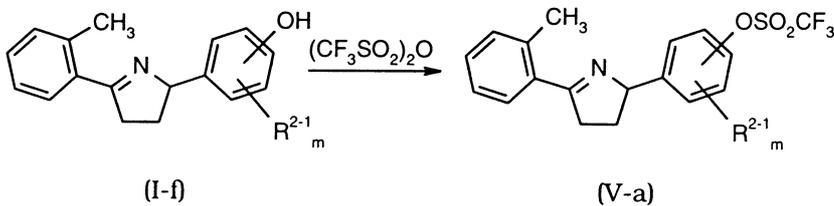
탈수는, 예를 들어 알콜을 헥산과 같은 저극성 용매에 용해시키고 반-농축 황산과 예를 들어 0 내지 20 °C에서 교반함으로써 수행될 수 있다[참조예: Tetrahedron 30, 2027 (1974)].

일반식 (XXXV)의 사이클로부타논은 상업적으로 입수가 가능하다.

일반식 (IV)는 본 발명에 따른 방법 (B)에 또한 필요한 아릴 그리냐드 화합물의 일반 정의를 제공한다.

일반식 (IV)의 아릴 그리냐드 화합물은 *o*-톨릴 할라이드와 마그네슘을 그리냐드 반응시켜 제조할 수 있다. *o*-톨릴 할라이드는 유기화학의 일반적으로 공지된 화합물이다.

본 발명에 따른 방법 (C)에 필요한 일반식 (V)의 사이클릭 이민은  $X^1$  이 브롬 또는 요오드를 나타낸다면 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 일부를 이루며, 이들은 예를 들어 방법 (A) 및 (B)에 의해 제조될 수 있다.  $X^1$  이 트리플루오로메탄설포닐을 나타내는 경우, 일반식 (V-a)의 화합물은 방법 (A) 및 (B)에 의해 제조될 수 있는 일반식 (I-f)의 하이드록실 화합물을 하기 반응식에 따라 산 결합제, 예를 들어 피리딘의 존재하 및 경우에 따라 희석제의 존재하에서 트리플루오로메탄설포닐 클로라이드 또는 트리플루오로메탄설포닐산 무수물과 반응시킴으로써 제조될 수 있다:



일반식 (VI)는 본 발명에 따른 방법 (C)에 또한 필요한 보론산의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식에서,  $R^{1-1}$  은 바람직하게는 일반식 (I-b)의 사이클릭 이민의 설명과 관련하여 바람직한 것으로 이미 언급된 의미를 나타낸다.

일반식 (VI)의 방향족 보론산은 공지되어 있거나, 또는 공지된 방법으로 제조될 수 있다[참조예: Chem. Rev. 45, 2457 (1995); Pure Appl. Chem. 66, 213 (1994)].

본 발명에 따른 방법 (D)를 수행하는데 필요한 일반식 (I-d)의 사이클릭 이민은 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 일부이며, 예를 들어 방법 (A) 내지 (C)에 의해 제조될 수 있다.

일반식 (VII)은 본 발명에 따른 방법 (D)를 수행하는데 추가로 필요한 화합물의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식에서,  $R^9$ ,  $R^{10}$ , G, p, q 및 r 은 각각 바람직하게는 일반식 (I)의 사이클릭 이민의 설명과 관련하여 바람직한 것으로 이미 언급된 의미를 나타낸다. Ab 는 통상적인 이탈 그룹, 예를 들면 할로젠, 특히 염소 또는 브롬; 알킬설포닐옥시, 특히 메틸설포닐옥시; 또는 임의로 치환된 아렌설포닐옥시, 특히 페닐설포닐옥시, *p*-클로로페닐설포닐옥시 또는 *p*-톨릴설포닐옥시를 나타낸다.

일반식 (VII)의 화합물은 유기화학의 일반적으로 공지된 화합물이다.

본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는데 적합한 산은 유기 또는 무기 브뢴스테트(Bronstedt)산, 예를 들어 불화수소, 염화수소, 황산, 인산, 포름산, 아세트산, 벤조산, 시트르산, 트리플루오로아세트산, 메탄설포닐산, 트리플루오로메탄설포닐산 또는 톨루엔설포닐산이다.

*t*-부톡시카보닐 아미노 보호 그룹을 분리시키기 위해 일반적으로 사용되는 트리플루오로아세트산에 의한 애시돌리시스(acidolysis)가 특히 적합하다(참조예: T.W. Greene, P.G.M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd Ed., John Wiley & Sons, New York 1991).

경우에 따라, 본 발명에 따른 방법 A) a)는 적합한 산 수용체의 존재하에서 수행된다. 적합한 산 수용체는 모든 통상의 무기 또는 유기 염기이다. 이들은 바람직하게는 알칼리 토금속 또는 알칼리 금속 수산화물, 아마이드, 알콕사이드, 아세테이트, 탄산염 또는 중탄산염, 예를 들어 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화암모늄, 소듐 아마이드, 리튬 디이소프로필아미드,

소듐 메톡사이드, 소듐 에톡사이드, 포타슘 t-부톡사이드, 소듐 아세테이트, 포타슘 아세테이트, 칼슘 아세테이트, 암모늄 아세테이트, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산암모늄, 중탄산나트륨 또는 중탄산칼륨, 및 또한 트리메틸아민, 트리에틸아민, 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.

경우에 따라, 본 발명에 따른 방법 A) a)는 희석제의 존재하에서 수행된다. 적합한 희석제는 물, 유기 용매 및 이들의 혼합물이다. 이들의 예로는 지방족, 지환식 또는 방향족 탄화수소, 예를 들어 석유 에테르, 헥산, 헵탄, 사이클로헥산, 메틸사이클로헥산, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 데칼린; 할로젠화 탄화수소, 예를 들어 클로로벤젠, 디클로로벤젠, 디클로로메탄, 메틸렌 클로라이드, 클로로포름, 사염화탄소, 디클로로에탄, 트리클로로에탄 또는 테트라클로로에틸렌; 에테르, 예를 들어 디에틸 에테르, 디이소프로필 에테르, 메틸 t-부틸 에테르, 메틸 t-아밀 에테르, 디옥산, 테트라하이드로푸란, 1,2-디메톡시에탄, 1,2-디에톡시에탄, 디에틸렌 글리콜 디메틸 에테르 또는 아니솔; 케톤, 예를 들어 아세톤, 부타논, 메틸 이소부틸 케톤 또는 사이클로헥사논; 니트릴, 예를 들어 아세토니트릴, 프로피오니트릴, n- 또는 i-부티로니트릴, 또는 벤조니트릴; 아마이드, 예를 들어 폼아미드, N,N-디메틸폼아미드, N,N-디메틸아세트아미드, N-메틸폼아닐리드, N-메틸피롤리돈 또는 헥사메틸인산 트리아미드; N-옥사이드, 예를 들어 N-메틸모르폴린 N-옥사이드; 에스테르, 예를 들어 메틸 아세테이트, 에틸 아세테이트 또는 부틸 아세테이트; 설폭사이드, 예를 들어 디메틸 설폭사이드; 설펜, 예를 들어 설포란; 알콜, 예를 들어 메탄올, 에탄올, n- 또는 i-프로판올, n-, 이소-, sec- 또는 t-부탄올, 에탄디올, 프로판-1,2-디올, 에톡시에탄올, 메톡시에탄올, 디에틸렌 글리콜 모노메틸 에테르, 디에틸렌 글리콜 모노에틸 에테르가 포함된다.

방법 A) a)를 수행하는 경우, 과량의 산이 일반적으로 사용된다.

본 발명에 따른 방법 A) b)는 촉매적 수소화로서 수행되거나, 니트로 그룹을 환원시키기 위해 일반적으로 공지된 그밖의 다른 방법을 이용하여 수행된다(참조예: Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Georg Thieme Verlag Stuttgart, volume 11/1, 394-409 and volume 4/1c, 490-506).

본 발명에 따른 방법 A) c)는 일반적으로 공지된 방법에 따라, 예를 들어 염산을 사용한 가수분해로서 수행된다.

방법 A) b) 및 A) c)를 수행하는데 적합한 희석제는 상기 방법 A) a)에 언급된 희석제이다.

본 발명에 따른 방법 (B)를 수행하는데 적합한 희석제는 불활성 유기용매 및 이들의 혼합물이다. 이들의 예로는 지방족, 지환식 또는 방향족 탄화수소, 예를 들어 석유 에테르, 헥산, 헵탄, 사이클로헥산, 메틸사이클로헥산, 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, 메틸 t-아밀 에테르, 디옥산, 테트라하이드로푸란, 1,2-디메톡시에탄, 1,2-디에톡시에탄, 디에틸렌 글리콜 디메틸 에테르 또는 아니솔이 포함된다.

에테르중의 일반식 (IV)의 그리냐드 화합물 용액 및 탄화수소중의 일반식 (III)의 O-메틸설포닐 옥심 용액을 사용하는 것이 바람직하다.

본 발명에 따른 방법 (B)의 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 반응은 -100 °C 내지 +50 °C, 바람직하게는 -80 °C 내지 +30 °C의 온도에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (B)를 수행하는 경우, 일반식 (IV)의 그리냐드 화합물 및 일반식 (III)의 O-메틸설포닐 옥심은 1:1 내지 3:1, 바람직하게는 1:1 내지 2:1의 몰비로 사용된다.

본 발명에 따른 방법 (C)를 수행하는데 적합한 촉매는 팔라듐(0)착물이다. 예를 들어 테트라키스(트리페닐포스핀)팔라듐이 바람직하다.

본 발명에 따른 방법 (C)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, 수산화암모늄, 소듐 아세테이트, 포타슘 아세테이트, 칼슘 아세테이트, 암모늄 아세테이트, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산암모늄, 중탄산나트륨 또는 중탄산칼륨, 알칼리 금속 플루오라이드, 예를 들면 불화세슘, 및 트리메틸아민, 트리에틸아민, 트리

부틸아민, 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 (C)를 수행하는데 적합한 희석제는 물, 유기 용매 및 이들의 혼합물이다. 이들의 예로는 지방족, 지환식 또는 방향족 탄화수소, 예를 들어 석유 에테르, 헥산, 헵탄, 사이클로헥산, 메틸사이클로헥산, 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, 메틸 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-, 이소-, sec- 또는 t-부탄올, 에탄디올, 프로판-1,2-디올, 에톡시에탄올, 메톡시에탄올, 디에틸렌 글리콜 모노메틸 에테르, 디에틸렌 글리콜 모노에틸 에테르가 포함된다.

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

본 발명에 따른 방법 (C)를 수행하는 경우, 일반식 (VI)의 보론산 및 일반식 (V)의 화합물은 1:1 내지 3:1, 바람직하게는 1:1 내지 2:1의 몰비로 사용된다. 촉매는 일반적으로, 일반식 (V)의 화합물 1 몰당 0.005 내지 0.5 몰, 바람직하게는 0.01 내지 0.1 몰의 양으로 사용된다. 일반적으로, 과량의 염기가 사용된다.

본 발명에 따른 방법 (D)는 바람직하게는 적합한 산 수용체의 존재하에서 수행된다. 적합한 산 수용체는 모든 통상적인 무기 또는 유기 염기이다. 이들로는 바람직하게는 알칼리 토금속 또는 알칼리 금속 수소화물, 수산화물, 아마이드, 알콕사이드, 아세테이트, 탄산염 또는 중탄산염, 예를 들어 수소화나트륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화암모늄, 소듐 아마이드, 리튬 디이소프로필아미드, 소듐 메톡사이드, 소듐 에톡사이드, 포타슘 t-부톡사이드, 소듐 아세테이트, 포타슘 아세테이트, 칼슘 아세테이트, 암모늄 아세테이트, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산암모늄, 중탄산나트륨 또는 중탄산칼륨, 및 트리메틸아민, 트리에틸아민, 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 (D)는 적합한 상 전이 촉매의 존재하에서 수행될 수 있다. 이러한 촉매의 예로 테트라부틸암모늄 요오다이드, 테트라부틸암모늄 브로마이드, 테트라부틸암모늄 클로라이드, 트리부틸메틸포스포늄 브로마이드, 트리메틸-C<sub>13</sub>/C<sub>15</sub>-알킬암모늄 클로라이드, 트리메틸-C<sub>13</sub>/C<sub>15</sub>-알킬암모늄 브로마이드, 디벤질디메틸암모늄 메틸설페이트, 디메틸-C<sub>12</sub>/C<sub>14</sub>-알킬벤질암모늄 클로라이드, 15-크라운-5, 18-크라운-6 또는 트리스-[2-(2-메톡시에톡시)에틸]아민이 포함된다.

본 발명에 따른 방법 (D)는 바람직하게는 희석제의 존재하에서 수행된다. 적합한 희석제는 예를 들어 방법 (A)에 기술된 모든 용매이다.

본 발명에 따른 방법 (D)의 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 이 반응은 -20 °C 내지 +100 °C, 바람직하게는 0 °C 내지 60 °C의 온도에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 (D)를 수행하는 경우, 대략 동몰량의 출발물질이 일반적으로 사용된다. 그러나, 일반식 (VII)의 화합물을 과량으로 사용하는 것도 가능하다.

본 발명에 따른 방법 (E)의 반응은 특히 당 업계의 숙련자들에게 공지된 케톤 및 카복실산 에스테르 및 케톤의 유도체화 반응이다(참조예: Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Georg Thieme Verlag Stuttgart, Vol. VII/2b, 특히 1912 ff; 카복실산 에스테르 및 그의 유도체에 대해 Vol. VIII; Vol. E5, 특히 p. 812 ff 및 인용 문헌).

본 발명에 따른 방법의 반응은 대기압 또는 승압에서 수행될 수 있지만, 대기압에서 수행하는 것이 바람직하다. 후처리는 유기화학의 통상적인 방법으로 수행된다. 최종 생성물은 바람직하게는 결정화, 크로마토그래피 정제에 의해서나, 또는 경우에 따라 감압하에서 휘발 성분을 제거함으로써 정제된다.

활성 화합물은 농업, 임업, 저장 제품 및 재료의 보호, 및 위생 분야에서 마주치게 되는 동물 해충, 특히 곤충, 거미류 및 선충을 구제하는데 적합하고, 우수한 식물 내약성을 나타내며, 온혈동물에 저독성을 갖는다. 이들은 보통 정도로 민감하거나 내성인 종 및 발육의 모든 단계 또는 일부 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 게오피루스 카르포파구스(*Geophilus carpophagus*) 및 스쿠티게라 종(*Scutigera spec.*).

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

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

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

메뚜기(Orthoptera)목, 예를 들어 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 류코파에아 마데라에 (*Leucophaea maderae*), 블라텔라 게르마니카(*Blattella germanica*), 아케타 도메스티쿠스(*Acheta domesticus*), 그릴로탈파 종(*Gryllotalpa spp.*), 로쿠스타 미그라토리아 미그라토리오이데스(*Locusta migratoria migratorioides*), 멜라노플루스 디페렌티알리스(*Melanoplus differentialis*) 및 쉬스토세르카 그레가리아(*Schistocerca gregaria*).

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

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

이(Anoplura)목, 예를 들어 페디쿨루스 후마누스 코르포리스(*Pediculus humanus corporis*), 하에마토피누스 종(*Haematopinus spp.*) 및 리노그나투스 종 (*Linognathus spp.*).

털이(Mallophaga)목, 예를 들어 트리코텍테스 종(*Trichodectes spp.*) 및 다말리네아 종(*Damalinea spp.*).

총채벌레(Thysanoptera)목, 예를 들어 헤르시노트리프스 페모랄리스 (*Hercinothrips femoralis*) 및 트리프스 타바치(*Thrips tabaci*).

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 트리아토마 종(*Triatoma spp.*).

매미(Homoptera)목, 예를 들어 알레우로테스 브라시카에(*Aleurodes brassicae*), 베미시아 타바치(*Bemisia tabaci*), 트리알레우로테스 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*), 닐라파르바타 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 블란카르델라(*Lithocolletis blancardella*), 히포노메우타 파델라(*Hyponomeuta padella*), 플루텔라 마쿨리펜니스(*Plutella maculipennis*), 말라코소마 네우스트리아

(*Malacosoma neustria*), 유프록티스 크리소레아(*Euproctis chrysorrhoea*), 리만트리아 종(*Lymantria* spp.), 부쿨라트릭스 투르베리엘라(*Bucculatrix thurberiella*), 필로크니스티스 시트렐라(*Phyllocnistis citrella*), 아그로티스 종(*Agrotis* spp.), 육소아 종(*Euxoa* spp.), 펠티아 종 (*Feltia* spp.), 에아리아스 인슐라나(*Earias insulana*), 헬리오티스 종(*Heliothis* spp.), 라피그마 엑시구아(*Laphygma exigua*), 마메스트라 브라시카에 (*Mamestra brassicae*), 파놀리스 플라메아(*Panolis flammea*), 프로데니아 리투라(*Prodenia litura*), 스포도프테라 종(*Spodoptera* spp.), 트리코플루시아 니(*Trichoplusia ni*), 카르포카프사 포모넬라(*Carpocapsa pomonella*), 피에리스 종(*Pieris* spp.), 칠로 종(*Chilo* spp.), 피라우스타 누비탈리스(*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*) 및 토르트릭스 비리다나(*Tortrix viridana*).

딱정벌레(Coleoptera)목, 예를 들어, 아노비움 폰크타툼(*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 크리소세팔라(*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.), 릭투스 종(*Lyctus* spp.), 멜리게테스 아에네우스(*Meligethes aeneus*), 프티누스 종(*Ptinus* spp.), 니프투스 홀로레우쿠스 (*Niptus hololeucus*), 기비움 프실로이테스(*Gibbium psylloides*), 트리볼리움 종(*Tribolium* spp.), 테네브리오 몰리토르(*Tenebrio molitor*), 아그리오테스 종(*Agriotes* spp.), 코노데루스 종(*Conoderus* spp.), 멜로론타 멜로론타 (*Melolontha melolontha*), 암피말론 솔스티티알리스(*Amphimallon solstitialis*) 및 코스텔리트라 제알란디카(*Costelytra zealandica*).

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.), hippobosca 종(*Hyppobosca* spp.), 스톱시스 종(*Stomoxys* spp.), 오에스트루스 종(*Oestrus* spp.), 히포더마 종(*Hypoderma* spp.), 타바누스 종(*Tabanus* spp.), 탄니아 종(*Tannia* spp.), 비비오 호르툴라누스(*Bibio hortulanus*), 오스넬라 프리트(*Oscinella frit*), 포르비아 종(*Phorbia* spp.), 페고미아 히오스키아미(*Pegomyia hyoscyami*), 세라티티스 카피타타(*Ceratitis capitata*), 다쿠스 올레아에(*Dacus oleae*) 및 티풀라 팔루도사(*Tipula paludosa*).

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

거미(Arachnida)목, 예를 들어 소르피오 마우루스(*Scorpio maurus*) 및 라트로덱투스 막탄스(*Latrodectus mactans*).

진드기(Acarina)목, 예를 들어, 아카루스 시로(*Acarus siro*), 아르가스 종(*Argas* spp.), 오르니토도로스 종(*Ornithodoros* spp.), 데르마니수스 갈리나에 (*Dermanyssus gallinae*), 에리오피에스 리비스(*Eriophyes ribis*), 필로콥트루타 올레이보라(*Phyllocoptruta oleivora*), 부필루스 종(*Boophilus* spp.), 리피세팔루스 종(*Rhipicephalus* spp.), 앰블리움마 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.) 및 테트라니쿠스 종(*Tetranychus* spp.).

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

본 발명에 따른 일반식 (I)의 활성 화합물은 특히 거자 딱정벌레 유충(파에돈 코클레아리아에), 아울릿 모스(owllet moth) (스포도프테라 프루기페르다 (frugiperda)) 모충, 끝동매미충(네포테틱스 신크티세프스) 유충, 복숭아혹 진딧물 (미주스 퍼시카에(persicae)) 및 모든 단계의 일반 거미 응애(테트라니쿠스 우르티카에 (urticae))에 대해 뛰어난 활성을 나타낸다.

활성 화합물은 용액제, 유제, 수화성 분제, 현탁제, 분제, 산제, 페이스트, 가용성 분제, 과립제, 현탁액-유제 농축물, 활성 화합물이 함유된 천연 및 합성 미네랄 및 중합물질중의 극미세 캡슐제와 같은 통상의 제제로 전환시킬 수 있다.

이들 제제는 공지된 방법으로, 예를 들어, 바람직하게는 필요에 따라 계면활성제, 즉 유화제 및/또는 분산제 및/또는 포움-형성제를 사용하여 활성 화합물을 증량제, 즉 액상 용매 및/또는 고형 담체와 혼합함으로써 제조된다.

사용된 증량제가 물인 경우에는, 예를 들어 유기용매가 또한 보조용매로 사용될 수 있다. 적합한 액상 용매는, 주로 크실렌, 톨루엔 또는 알킬나프탈렌과 같은 방향족 화합물; 클로로벤젠, 클로로에틸렌 또는 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 그들의 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 암모늄 염, 및 카올린, 점토, 활석, 백악, 석영, 아타펠기트, 몬모릴로나이트 또는 규조토와 같은 분쇄된 천연 광물 및 고분산 실리카, 알루미늄 및 실리케이트와 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 유기가루의 합성과 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, 알킬아릴 폴리글리콜 에테르와 같은 폴리옥시에틸렌 지방 알콜 에테르, 알킬설포네이트, 알킬설페이트, 아릴설포네이트뿐 아니라 단백질 가수분해 생성물이다. 적합한 분산제는 예를 들어 리그닌-설파이트 폐액 및 메틸셀룰로오즈이다.

점착제, 예를 들어 카복시메틸셀룰로오즈, 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. 그외의 다른 첨가제로는 광유 및 식물유가 사용될 수 있다.

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

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

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

특히 유리한 혼합 성분의 예는 다음과 같다:

**살진균제:**

2-아미노부탄; 2-아닐리노-4-메틸-6-사이클로프로필-피리미딘; 2',6'-디브로모-2-메틸-4'-트리플루오로메톡시-4'-트리플루오로-메틸-1,3-티아졸-5-카복시아닐리드; 2,6-디클로로-N-(4-트리플루오로메틸벤질)-벤즈아미드; (E)-2-메톡시이미노-N-메틸-2-(2-페녹시페닐)-아세트아미드; 8-하이드록시퀴놀린 설페이트; 메틸 (E)-2-{2-[6-(2-시아노페녹시)-피리미딘-4-일옥시]-페닐}-3-메톡시아크릴레이트; 메틸 (E)-메톡시이미노[알파-(o-톨릴옥시)-o-톨릴]아세테이트; 2-페닐페놀(OPP), 알디모르프, 암프로필포스, 아닐라진, 아자코나졸,

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

칼슘 폴리실파이드, 갑타폴, 갑탄, 카르벤다짐, 카복신, 퀴노메티오네이트, 클로로네브, 클로로피크린, 클로로탈로닐, 클로졸리네이트, 쿠프라네브, 시목사닐, 사이프로코나졸, 사이프로푸람,

디클로로펜, 디클로부트라졸, 디클로플루아니드, 디클로메진, 디클로란, 디에토펜카브, 디페노코나졸, 디메티리몰, 디메토모르프, 디니코나졸, 디노캡, 디페닐아민, 디피리티온, 디탈림포스, 디티아논, 도딘, 드라족솔론,

에디펜포스, 에폭시코나졸, 에티리몰, 에트리디아졸,

페나리몰, 펜부코나졸, 펜푸람, 페니트로판, 펜피클로닐, 펜프로피딘, 펜프로피모르프, 펜틴 아세테이트, 수산화 펜틴, 페르밤, 페림존, 플루아지남, 플루디옥소닐, 플루오로미드, 플루퀸코나졸, 플루실라졸, 플루설파미드, 플루톨라닐, 플루트리아폴, 플페트, 포세틸-알루미늄, 프탈리드, 푸베리다졸, 푸라락실, 푸르메사이클록스,

구아자틴,

헥사클로로벤젠, 헥사코나졸, 하이멕사졸,

이마잘릴, 이미벤코나졸, 이미녹타딘, 이프로벤포스(IBP), 이프로디온, 이소프로티올란, 카수가마이신, 구리 제제, 예를 들어 수산화구리, 코퍼 나프테네이트, 옥시염화구리, 황산구리, 산화구리, 옥신-구리 및 보르도(Bordeaux) 혼합물,

만코퍼, 만코제브, 마네브, 메파니피림, 메프로닐, 메탈락실, 메트코나졸, 메타설포카브, 메트푸록삼, 메티람, 메트설포박스, 마이클로부타닐,

니켈 디메틸디티오카바메이트, 니트로탈-이소프로필, 누아리몰,

오푸라스, 옥사딕실, 옥사모카브, 옥시카복신,

페푸라조에이트, 펜코나졸, 펜시쿠론, 포스디펜, 프탈라이드, 피마리신, 피페랄린, 폴리카바메이트, 폴리옥신, 프로베나졸, 프로클로라즈, 프로시미돈, 프로파모카브, 프로피코나졸, 프로피네브, 피라조포스, 피리페녹스, 피리메타닐, 피로켈론,

퀸토젠(PCNB),

황 및 황 제제,

테부코나졸, 테클로프탈람, 테크나젠, 테트라코나졸, 티아벤다졸, 티사이오펜, 티오파네이트-메틸, 티람, 톨클로포스-메틸, 톨릴플루아니드, 트리아디메폰, 트리아디메놀, 트리아족사이드, 트리클라미드, 트리사이클라졸, 트리데모르프, 트리플루미졸, 트리포린, 트리티코나졸,

발리다마이신 A, 빈클로졸린,

지네브, 지람.

**살균제:**

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

**살충제 / 살비제 / 살선충제 :**

아바멕틴, AC 303 630, 아세페이트, 아크리나트린, 알라니카브, 알디카브, 알파메트린, 아미트라즈, 아버멕틴, AZ 60541, 아자디라크틴, 아진포스 A, 아진포스 M, 아조사이클로틴, 바실러스 투린기엔시스, 벤디오카브, 벤푸라카브, 벤설탑, 베타-사이플루트린, 비펜트린, BPMC, 브로펜프록스, 브로모포스 A, 부펜카브, 부프로페진, 부토카복심, 부틸피리다벤,

카두사포스, 카바릴, 카보푸란, 카보페노티온, 카보설판, 카탑, CGA 157419, CGA 184699, 클로에토카브, 클로르에톡시포스, 클로르펜빈포스, 클로르플루아주론, 클로르메포스, 클로르피리포스, 클로르피리포스 M, 시스-레스메트린, 클로사이트린, 클로펜테진, 시아노포스, 사이클로프로트린, 사이플루트린, 사이할로트린, 사이헥사틴, 사이퍼메트린, 사이로마진,

델타메트린, 데메톤 M, 데메톤 S, 데메톤-S-메틸, 디아펜티우론, 디아지논, 디클로펜티온, 디클로르보스, 디클리포스, 디크로토포스, 디에티온, 디플루벤주론, 디메토에이트, 디메틸빈포스, 디옥사티온, 디설포톤,

에디펜포스, 에마멕틴, 에스펜발레레이트, 에티오펜카브, 에티온, 에토펜프록스, 에토프로포스, 에트림포스,

펜아미포스, 펜아자퀸, 산화 펜부타틴, 페니트로티온, 페노부카브, 페노티오카브, 페녹시카브, 펜프로파트린, 펜피라드, 펜피록시메이트, 펜티온, 펜발레레이트, 피프로닐, 플루아지남, 플루사이클록수론, 플루사이트리네이트, 플루페녹수론, 플루펜프록스, 플루발리네이트, 포노포스, 포르모티온, 포스티아제이트, 푸브펜프록스, 푸라티오카브,

HCH, 헵테노포스, 헥사플루무론, 헥시티아족스,

이미다클로프리드, 이프로벤포스, 이사조포스, 이소펜포스, 이소프로카브, 이속사티온, 이버멕틴, 람다-사이할로트린, 루페누론,

말라티온, 메카르밤, 메빈포스, 메설펜포스, 메트알데하이드, 메트아크리포스, 메트아미도포스, 메티다티온, 메티오카브, 메토밀, 메틀카브, 밀베멕틴, 모노크로토포스, 목시텍틴,

날레드, NC 184, NI 25, 니텐피람,

오메토에이트, 옥사밀, 옥시데메톤 M, 옥시데프로포스,

파라티온 A, 파라티온 M, 퍼메트린, 펜토에이트, 포레이트, 포살론, 포스메트, 포스파미돈, 폭심, 피리미카브, 피리미포스 M, 피리미포스 A, 프로페노포스, 프로메카브, 프로파포스, 프로폭수르, 프로티오포스, 프로토에이트, 피메트로진, 피라클로포스, 피리다펜티온, 피레스메트린, 피레트럼, 피리다벤, 피리미디펜, 피리프로폭시펜,

퀴날포스,

RH 5992,

살리티온, 세부포스, 실라플루오펜, 설포텡, 설프로포스,

테부페노지드, 테부펜피라드, 테부피리미포스, 테플루벤주론, 테플루트린, 테메포스, 테르밤, 테르부포스, 테트라클로르빈포스, 티아페녹스, 티오디카브, 티오파녹스, 티오메톤, 티오나진, 투린기엔신, 트랄로메트린, 트리아라텐, 트리아조포스, 트리아주론, 트리클로르폰, 트리플루무론, 트리메타카브,

바미도티온, XMC, 크실릴카브, YI 5301/5302, 제타메트린.

제조제와 같은 공지된 활성 화합물과의 혼합물, 또는 비료 및 식물-생장 조절제와의 혼합물이 또한 가능하다.

본 발명에 따른 활성 화합물은 또한 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 방법으로 사용된다.

위생 해충 및 저장품 해충에 사용하는 경우에, 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 해충 뿐만 아니라, 수의학 분야에서 동물 기생충(체외 기생충), 예를 들어, 참 진드기, 공주 진드기, 딱지 진드기, 트롬비쿨리드(trombiculid) 응애, 파리(쏘고 빠는), 기생성 파리 유충, 이, 털에 사는 이, 조류 이 및 벼룩에 대해 활성적이다. 이러한 기생충에는 다음의 것들이 포함된다:

이(Anoplurida)목, 예를 들어 하에마토피누스 종(Haematopinus spp.), 리노그나투스 종(Linognathus spp.), 페디쿨루스 종(Pediculus spp.), 프티루스 종 (Pthirus 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.), 트리코텍테스 종 (Trichodectes spp.), 펠리콜라 종(Felicola spp.).

파리(Diptera)목 및 네마토세리나(Nematocerina) 및 브라키세리나 (Brachycerina) 아목, 예를 들어 아에테스 종(Aedes spp.), 아노펠레스 종(Anopheles spp.), 쿨렉스 종(Culex spp.), 시물리움 종(Simulium spp.), 유시물리움 종Eusimulium 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.), 하에마토포타 종(Haematopota spp.), 필리포미아 종(Philipomyia spp.), 브라울라 종(Braula spp.), 무스카 종 (Musca spp.), 히드로타에아 종(Hydrotaea spp.), 스토크시스 종(Stomoxys spp.), 하에마토비아 종 (Haematobia spp.), 모델리아 종 (Morellia spp.), 판니아 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.), 익소데스 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(Railletia 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.), 소로

프테스 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.).

예를 들어, 본 발명에 따른 활성 화합물은 모든 유충 단계의 파리 루실리아 쿠프리나(Lucilia cuprina) 및 모든 발달 단계의 진드기 암블리움마 바리에가툼(variegatum)에 뛰어난 활성을 나타낸다.

본 발명에 따른 일반식 (I)의 활성 화합물은 또한 농업 가축, 예를 들어 소, 양, 염소, 말, 돼지, 당나귀, 낙타, 물소, 토끼, 닭, 칠면조, 오리, 거위 및 벌, 및 기타 집에서 기르는 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, 벌꿀의 생산에 있어서)가 줄어들게 되므로, 본 발명에 따른 활성 화합물을 사용함으로써, 더욱 경제적이고 간편한 동물 관리가 가능하다.

수의학 분야에서, 본 발명에 따른 활성 화합물은 정제, 캡슐제, 드링크제, 물약, 과립제, 페이스트제, 거환제의 형태로 장내 투여에 의해, 사료를 통한 방법 및 좌약에 의해, 비경구적 투여, 예를 들어 주사(근육내, 피하, 정맥내 및 복막내 등)에 의해, 삽입의 형태에 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 표시장치등의 형태로 경피 투여에 의해 공지된 방식으로 사용된다.

가축, 가금류, 집에서 기르는 동물 등에 투여하는 경우에, 일반식 (I)의 활성 화합물은 1 내지 80 중량%의 활성 화합물을 함유하는 제제(예를 들어 분제, 유제, 유동제(flowables))로서 직접 또는 100 내지 10,000 배 희석하여 사용할 수 있거나, 약품욕의 형태로 사용할 수 있다.

또한, 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물은 산업 재료를 파괴하는 곤충에 대하여 유효한 살충 작용을 나타내는 것으로 밝혀졌다.

다음의 곤충들이 바람직한 예로서 언급되지만, 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.), 디노테루스 미누투스(Dinoderus minutus).

테르마프테란스(Dermapterans) 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), 코프토테르메스 포르모사누스(Coptotermes formosanus)

좀(Bristletails), 예를 들어, 레피스마 사카리나(Lepisma saccharina)

본 발명에서 산업 재료는 무생물 물질, 예를 들어, 바람직하게는 합성 물질, 아교, 호재(sizes), 종이 및 판지(board), 가죽, 목재 및 목제품(timber products), 및 페인트의 의미로 이해된다.

곤충의 침습으로부터 매우 특별히 보호되어야 할 재료는 목재 및 목제품이다.

본 발명에 따른 조성물 또는 이러한 조성물을 함유하는 혼합물에 의해 보호될 수 있는 목재 및 목제품은 예를 들어, 건축용 목재, 목재 빔(beam), 철도 침목, 교량 구성 요소, 방파제, 목재 비히클(vehicle), 상자, 파레트, 컨테이너, 전신주, 목재 표지판, 목재로 만들어진 창 및 문, 합판, 칩 보드, 접합품, 또는 일반적으로 가옥 건축 또는 가구에 사용되는 목제품의 의미로 이해된다.

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

언급된 제제는 그 자체가 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 착색제 및 안료 및 다른 가공 보조제와 혼합함으로써 제조될 수 있다.

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

사용되는 조성물 또는 농축물의 양은 곤충의 종류 및 빈도와 매질에 따라 달라진다. 최적의 적용비율은 각 경우에 일련의 시험에 의하여 결정될 수 있다. 그러나, 일반적으로, 보호되어야 할 물질을 기준으로 0.0001 내지 20중량%, 바람직하게는 0.001 내지 10중량%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(flashpoint)을 갖는 오일성 또는 오일형 용매이다. 저휘발성이며 수-불용성인 오일성 및 오일형 용매로서 사용되는 물질은 적합한 광유 또는 그들의 방향족 분획물, 또는 광유-함유 용매 혼합물, 바람직하게는 백유(White spirit), 석유 및/또는 알킬벤젠이다,

유리하게 사용되는 물질은 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 또는 방향족 화합물, 테레빈(turpentine) 에센스 등이다.

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 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 살충제가 용매 혼합물에 용해되거나 유화될 수 있는 경우에, 부분적으로 중간 또는 고휘발성 유기 화학 용매로 대체될 수 있다.

바람직한 구체예에서, 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물의 일부가 지방족 극성 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물로 대체된다. 바람직하게 사용되는 물질은 예를 들어, 글리콜 에테르, 에스테르 등과 같은 하이드록실 및/또는 에스테르 및/또는 에테르 그룹을 갖는 지방족 유기 화학 용매이다.

본 발명의 범위내에서 사용되는 유기 화학 결합제는 그 자체로서 공지되어 있고, 물로 희석될 수 있고/있거나 사용된 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, 인덴/쿠마론(coumarone) 수지, 실리콘 수지, 건성 식물유 및/또는 건성유 및/또는 천연 및/또는 합성 수지를 기본으로 한 물리적 건조 결합제로 구성되거나 이들을 포함하는 결합제이다.

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

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

상기 언급된 결합제의 전부 또는 일부는 고정제(혼합물) 또는 가소제(혼합물)로 대체될 수 있다. 이 첨가제들은 활성 화합물의 휘발 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 프탈레이트, 디옥틸 프탈레이트 또는 벤질부틸 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 비교적 고분자량의 글리콜 에테르, 글리세롤 에스테르 및 p-톨루엔설폰산 에스테르의 화학그룹중에서 선택된다.

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

경우에 따라, 하나 이상의 상기 언급된 유기화학 용매 또는 희석제, 유화제 및 분산제와의 혼합물로서의 물이 또한 용매 또는 희석제로서 특히 적합하다.

목재는 대규모 공업적 주입 방법, 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 또는 그 이상의 살진균제를 함유할 수 있다.

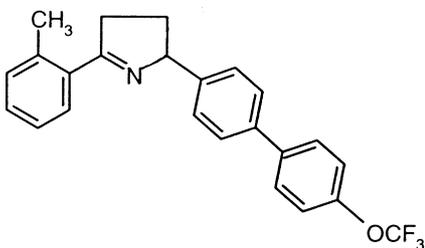
혼합될 수 있는 적합한 추가의 성분은 바람직하게는 WO 제 94/29 268 호에 언급되어 있는 살충제 및 살진균제이다. 이 문헌에 언급된 화합물은 명백히 본 출원에 포함된다.

혼합될 수 있는 매우 특히 바람직한 성분은 살충제, 예를 들어, 클로르피리포스, 폭심, 실라플루오핀, 알파메트린, 사이플루트린, 사이퍼메트린, 델타메트린, 페메트린, 이미다클로프리드, NI-25, 플루페녹수론, 헥사플루무론 및 트리플루무론, 및 살진균제, 예를 들어, 에폭시코나졸, 헥사코나졸, 아자코나졸, 프로피코나졸, 테부코나졸, 사이프로코나졸, 메트코나졸, 이마잘릴, 디클로플루아니드, 툴릴플루아니드, 3-요오도-2-프로피닐부틸카바메이트, N-옥틸-이소티아졸린-3-온 및 4,5-디클로로-N-옥틸이소티아졸린-3-온이다.

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

**제조 실시예:**

**실시예 I-9**



1-t-부톡시카보닐아미노-1-[4'-트리플루오로메톡시비페닐-4-일]-3-[O-메틸벤조일]프로판 210 mg(0.4 밀리몰)을 우선 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> 5 ml에 도입하고, 이 용액을 0 °C로 냉각하였다. 이어서 트리플루오로아세트산 1 ml를 첨가하고, 혼합물을 실온에서 4 시간동안 교반하였다. 용매를 감압하에서 제거하였다.

후처리로서, 생성물 혼합물을 톨루엔과 반복 혼합하고, 톨루엔을 감압하에서 제거한다. 마지막으로 잔류물을 에테르에 용해시키고, 물로 2 회 세척한 후, 건조시키고, 농축시킨다.

2-[2-메틸페닐]-5-[4'-트리플루오로메톡시비페닐-4-일]-3,4-디하이드로-2H-피롤 150 mg(이론치의 93.1%)을 오일로 수득하였다.

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ , TMS):  $\delta$  [ppm] = 1.88 (m, 1H,  $\text{CHNCHH}$ ), 2.61 (m, 1H,  $\text{CHNCHH}$ ), 2.62 (s, 3H,  $\text{CH}_3$ ), 3.10 (m, 2H,  $\text{CNCH}_2$ ), 5.38 (t, 1H, CHN), 7.20-7.35 (5H, ArH), 7.46 (m, 2H, ArH), 7.53 (m, 1H, ArH), 7.60 (m, 2H, ArH)

HPLC  $\log P^*$  (중성) = 6.05.

LC-MS: 10.53 분에서  $396\text{M}^+$

\*  $\log P$  = 이동상으로서 물/아세트니트릴을 사용하여  $125 \times 4.0$  mm Kromasil 120 °C 18( $5 \mu\text{m}$ ) 상에서 유량을 1.5 ml/분으로 하여 HPLC 분석에 의해 결정된 것으로, 알칸/물 분배계수의 10 을 베이스로 한 음성 대수(negative logarithm)이다.

### 실시예 I-9 "단일-용기 방법"

XI-a-2 0.964 g(3 밀리몰)을 우선 THF 20 ml에 도입하고,  $-78^\circ\text{C}$ 로 냉각하였다. 그후  $-78^\circ\text{C}$ 에서, n-부틸리튬(헥산중 1.6N 용액) 2.05 ml(3.3 밀리몰)을 적가한 후, 혼합물을  $-78^\circ\text{C}$ 에서 30 분동안 교반하였다.  $-78^\circ\text{C}$ 에서, THF 6 ml중의 디-t-부틸 디카보네이트 0.72 g(3.3 밀리몰)을 적가하였다. 혼합물을  $-78^\circ\text{C}$ 에서 수분동안 교반한 후,  $0^\circ\text{C}$ 로 가온하고, 다시 한 번  $-78^\circ\text{C}$ 로 냉각하였다. o-톨릴마그네슘 브로마이드( $\text{Et}_2\text{O}$  중 2.0M) 19.5 ml(3.9 밀리몰)를  $-78^\circ\text{C}$ 에서 적가한 후, 혼합물을 교반하면서  $0^\circ\text{C}$ 로 가온하였다.  $0^\circ\text{C}$ 에서, 트리플루오로아세트산 7.5 ml를 첨가하고, 혼합물을 실온에서 4 시간동안 교반하였다. 회전 증발기를 사용하여 테트라하이드로푸란을 제거하고, 잔류물을 메틸렌 클로라이드 25 ml에 용해시킨후, 트리플루오로아세트산 7.5 ml와 혼합하였다.

혼합물을 실온에서 6 시간동안 더 교반하였다. 이어서, 회전 증발기를 사용하여 휘발 성분을 모두 제거한 후, 잔류물을 1:2 에틸 아세테이트/사이클로헥산을 사용하여 실리카겔 상에서 크로마토그래피하였다.

두 분획이 분리되었다. 제 2 분획은 목적하는 생성물 I-9 를 434 mg 함유하였다.

제 1 분획은 I-9 의 트리플루오로아세테이트를 함유하였으며, 다음과 같이 추가로 처리되었다:

분획을 우선 에틸 아세테이트에 용해시키고,  $\text{NaHCO}_3$  용액으로 추출한 후, 에틸 아세테이트 100 ml 및 20% NaOH 와 혼합한 다음, 실온에서 밤새 교반하였다.

용액을 포화 염화나트륨 용액으로 3 회 세척하고, 건조시킨 후, 회전 증발기를 사용하여 용매를 제거하였다. 잔류물을 톨루엔과 3 회 혼합하는데, 이때 각 경우 톨루엔은 감압하에서 제거된다.

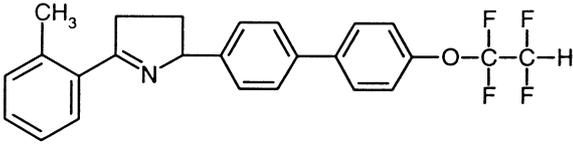
감압하에서 휘발성분을 모두 제거한 후, 혼합물을 1:3 에틸 아세테이트/사이클로헥산을 사용하여 실리카겔 상에서 다시 한 번 크로마토그래피하였다.

두 분획이 분리되었다; 제 1 분획은 I-9 를 36 mg 함유하였으며, 제 2 분획은 트리플루오로아세테이트 61 mg을 함유하였다.

총 수율은 I-9 470(434+ 36) mg(이론치의 46%)이었다.

(물리적 데이터는 "단계식 방법(stepwise variant)" 참조).

### 실시예 I-43



화합물 (VIII-43) 1 g을 우선  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  10 ml에 도입하고, 0 °C로 냉각하였다. 트리플루오로아세트산 1.39 ml를 첨가한 후, 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. 회전 증발기를 사용하여 트리플루오로아세트산을 감압하에서 제거하고, 잔류물을 에틸 아세테이트에 용해시켰다. 1N NaOH 를 사용하여 pH 를 11 로 조정하였다. 유기상을 물로 세척하여  $\text{MgSO}_4$  상에서 건조시키고, 여과한 후, 농축시켰다.

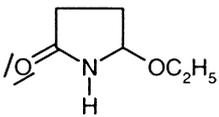
고체 0.23 g을 수득하였다.

융점: 87 °C.

HPLC: logP (pH 2.3) = 3.02.

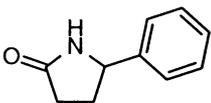
**출발물질의 제조**

$\gamma$ -에톡시- $\gamma$ -부티로락탐



0 °C에서, 숙신이미드 9.91 g을 우선 에탄올 415 ml에 도입하고, 총 5.53 g의 소듐 보로하이드라이드를 한 번에 조금씩 나누어 혼합하였다. 이 온도에서, 매 15 분마다 2N 에탄올성 염화수소 2 내지 3 적을 4 1/2 시간에 걸쳐 적가하였다. 계속해서, 혼합물을 더 많은 산을 사용하여 pH 3으로 산성화시켰다. 0 °C에서 1 시간동안 교반한 후, 혼합물을 1% 세기의 에탄올성 수산화칼륨 용액을 사용하여 중화시키고, 혼합물을 15 분동안 더 교반한 다음, 증발시켰다. 잔류물을 물에 용해시키고, 디클로로메탄으로 3 회 추출하였다. 황산나트륨상에서 건조시킨 후, 농축시켜  $\gamma$ -에톡시- $\gamma$ -부티로락탐 7.61 g(이론치의 55%)을 수득하였다.

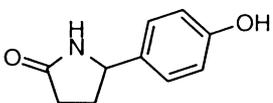
실시예 XI-1



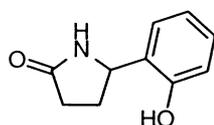
0 °C에서,  $\gamma$ -에톡시- $\gamma$ -부티로락탐 6.45 g 및 진한 황산 50 ml를 우선 도입하고, 벤젠 18.8 ml를 가하였다. 해동후, 혼합물을 실온에서 4 일동안 교반하였다. 후처리를 위해, 혼합물을 얼음에 붓고, 에틸 아세테이트로 3 회 추출한 다음, 추출물을 합하여 물 및 포화 염화나트륨 수용액으로 각각 1 회씩 세척하고, 건조시킨 후, 증발시켰다.  $\gamma$ -페닐- $\gamma$ -부티로락탐 8.1 g (이론치의 100%)을 수득하였다.

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $d_6$ -DMSO)  $\delta$  [ppm]: 1.75 (m, 1H); 2.23 (t, 2H); 2.45 (m, 1H); 4.67 (t, 1H); 7.26-7.39 (m, 5H); 8.08 (brd, 1H).

실시예 XI-2



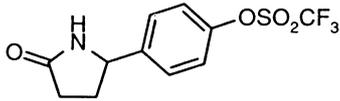
(XI-2a)



(XI-2b)

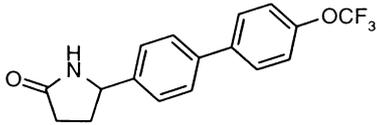
$\gamma$ -에톡시- $\gamma$ -부티로락탐 12.9 g, 진한 황산 10 ml 및 빙초산 90 ml를 우선 0 °C에서 도입하고, 총 18.8 g의 페놀을 한 번에 조금씩 가하여 혼합하였다. 해당후, 혼합물을 실온에서 2 일동안 교반하였다. 후처리를 위해, 혼합물을 얼음에 붓고, 에틸 아세테이트로 3 회 추출한 다음, 추출물을 합하여 물 및 포화 염화나트륨 수용액으로 각각 1 회씩 세척하고, 건조시킨 후, 농축시켰다. 잠시후, 융점 220 °C인  $\gamma$ -2-하이드록시페닐- $\gamma$ -부티로락탐(XI-2b)(6.4 g, 이론치의 36%)이 수성상으로부터 결정화되었다. 농축후 수득한 잔류물을 사이클로헥산/에틸 아세테이트 1:1 혼합물과 교반하고, 흡인여과하여 융점 183 °C인  $\gamma$ -4-하이드록시페닐- $\gamma$ -부티로락탐(XI-2a) 4.65 g을 수득하였다. 여액을 농축하였다. 디클로로메탄/헥산으로 재결정하여  $\gamma$ -4-하이드록시페닐- $\gamma$ -부티로락탐 3.35 g(이론치의 총 45%)을 추가로 수득하였다.

**실시예 XVII-2**



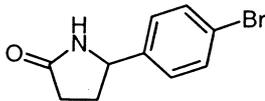
0 °C에서, 트리플루오로메탄설폰산 무수물 10 g을 피리딘 60 ml중의  $\gamma$ -4-하이드록시페닐- $\gamma$ -부티로락탐(예를 들어 실시예 XI-2에 의한 것) 5.23 g에 적가하였다. 혼합물을 실온에서 밤새 교반한 후, 얼음에 붓고, 10% 세기의 염산을 사용하여 산성화시킨 다음, 에틸 아세테이트를 사용하여 3 회 추출하였다. 용매를 건조시킨 후 증발시켜 융점 127 °C인  $\gamma$ -4-트리플루오로메틸설폰닐옥시페닐- $\gamma$ -부티로락탐 6.4 g(이론치의 70%)을 수득하였다.

**실시예 XI-a-2**



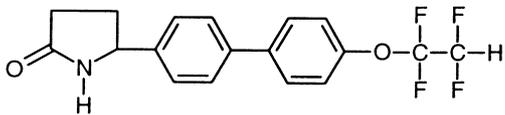
아르곤하에서,  $\gamma$ -4-트리플루오로메틸설폰닐옥시페닐- $\gamma$ -부티로락탐(예를 들어 실시예 XVII-2에 의한 것) 5.4 g을 우선 디메톡시에탄 43 ml에 도입하였다. 4-트리플루오로메톡시보론산 5.87 g 및 테트라키스(트리페닐포스핀)팔라듐 1.01 g을 연속해서 첨가하였다. 15 분후, 2M 탄산나트륨 수용액 28 ml를 첨가하고, 혼합물을 80 °C로 가열하여 밤새 교반하였다. 반응 종료후, 혼합물을 물/에틸 아세테이트에 용해시키고, 상을 분리하여 수성상을 에틸 아세테이트로 2 회 추출하였다. 유기상을 합하여 포화 염화나트륨 용액으로 세척하고, 건조시켰다. 농축후 융점 128 °C인  $\gamma$ -4'-트리플루오로메톡시비페닐-4-일- $\gamma$ -부티로락탐 5.5 g(이론치의 98%)을 수득하였다.

**실시예 XI-3**



교반기 및 증류 브릿지가 장치된 3 l 삼목 플라스크에서, 암모늄 포르메이트 199.3 g을 우선 포름산 127.9 g에 도입하고, 톨루엔으로 재결정시킨 4-브로모벤조일프로피온산 210 g을 가하였다. 그후, 플라스크를 200 °C 오일욕에 담겼다. 60 °C에서, 플라스크의 내용물이 가스를 발생하면서 용해되기 시작하였다. 혼합물을 140 °C에서 167 °C로 증가되는 바닥 온도에서 약 2 시간에 걸쳐 증류시켰다. 60 °C이하로 냉각시킨 후, 디클로로메탄 1 l를 조심스럽게 가하고, 침전 염을 낫쉬(nutsch) 필터를 통해 흡인여과하여 분리하였다. 유기상을 물 1 l로 세척하고, 황산마그네슘상에서 건조시킨 다음, 감압하에서 농축시켰다. 정제를 위해, 조 생성물을 디클로로메탄/에탄올/트리에틸아민(95:5:3)을 사용하여 실리카겔 1 kg을 통해 여과한 후, 메틸 t-부틸 에테르로 결정화시켰다. 융점 142 °C인  $\gamma$ -4-브로모페닐- $\gamma$ -부티로락탐 38 g(이론치의 19%)을 수득하였다.

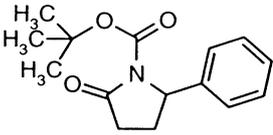
**실시예 XI-43**



HF 400 ml를 오토클레이브에서 응축시켰다.  $\gamma$ -에톡시- $\gamma$ -부티로락탐 38.7 g 및 테트라플루오로에톡시비페닐 40.6 g을 함께  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  100 ml에 용해시키고, 혼합물을 오토클레이브에 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. HF를 빼낸 후, 잔류물을  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ 에 용해시키고, 중탄산나트륨 수용액으로 세척하였다. 유기상을  $\text{MgSO}_4$  상에서 건조시키고, 여과한 후, 농축시켰다. 조 생성물을 톨루엔 500 ml로 재결정하였다. 백색 고체 20.9 g을 수득하였다.

HPLC:  $\log P(\text{pH } 2-3) = 2.79$ .

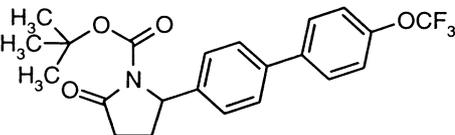
**실시예 IX-1**



$\gamma$ -페닐- $\gamma$ -부티로락탐(예를 들어 실시예 XI-1에 의한 것) 3.4 g을 우선 테트라하이드로푸란(THF) 63 ml에 도입하고,  $-78^\circ\text{C}$ 에서 n-헥산중의 2.4N 부틸리튬 용액 9.24 ml와 혼합하였다. 이 온도에서 혼합물을 0.5 시간동안 교반하고, THF 20 ml중의 디-t-부틸 디카보네이트 용액 5.04 g을 추가로 냉각하면서 적가한 다음, 혼합물을  $-78^\circ\text{C}$ 에서 3 시간동안 더 교반하고, 냉각없이 밤새 교반하였다. 그후, 혼합물을 포화 염화암모늄 수용액을 사용하여 가수분해시키고, 물로 희석한 후, 에틸 아세테이트로 3 회 추출하였다. 유기상을 합하여 포화 염화나트륨 수용액으로 세척하고, 황산마그네슘상에서 건조시켰다. 농축후 N-t-부톡시카보닐- $\gamma$ -페닐- $\gamma$ -부티로락탐 1.54 g(이론치의 28%)을 수득하였다.

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $d_6$ -DMSO)  $\delta$  [ppm]: 1.18 (s, 9H); 1.73 (m, 1H); 2.40-2.60 (m, 3H); 5.10 (m, 1H); 7.24 (m, 2H); 7.30 (m, 1H); 7.38 (m, 2H).

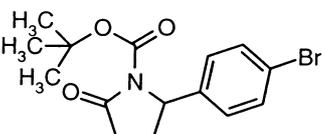
**실시예 IX-2**



$\gamma$ -4'-트리플루오로메톡시비페닐-4-일- $\gamma$ -부티로락탐(예를 들어 실시예 XI-a-2에 의한 것) 1.7 g을 우선 테트라하이드로푸란(THF) 30 ml에 도입하고,  $-78^\circ\text{C}$ 에서 n-헥산중의 2.4N 부틸리튬 용액 2.42 ml와 혼합하였다. 이 온도에서 혼합물을 0.5 시간동안 교반하고, THF 10 ml중의 디-t-부틸 디카보네이트 용액 1.27 g을 추가로 냉각하면서 적가하였다. 그후, 냉각을 중지하고, 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. 그후, 혼합물을 포화 염화암모늄 수용액을 사용하여 가수분해시키고, 2N 염산으로 산성화시킨 다음, 디클로로메탄으로 3 회 추출하였다. 추출물을 건조 및 농축시킨 후, 생성물을 칼럼 크로마토그래피(정지상: 실리카겔; 이동상: 사이클로헥산:에틸 아세테이트 구배 = 5:1.3 내지 1.1:1)에 의해 정제하였다. 부분 결정성인 N-t-부톡시카보닐- $\gamma$ -4'-트리플루오로메톡시비페닐-4-일- $\gamma$ -부티로락탐 1.14 g(이론치의 47%)을 수득하였다.

$^1\text{H-NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  [ppm]: 1.22 (s, 9H); 1.79 (m, 1H); 2.48-2.60 (m, 3H); 5.17 (m, 1H); 7.36 (d, 2H); 7.46 (d, 2H); 7.71 (d, 2H); 7.80 (d, 2H).

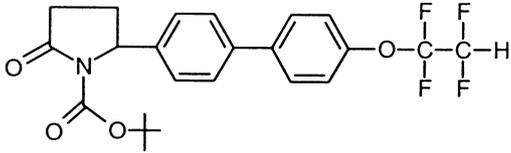
**실시예 IX-3**



$-78^\circ\text{C}$ 에서, 디이소프로필아민 3.24 ml를 우선 THF 90 ml에 도입하고, n-헥산중의 2.4N 부틸리튬 용액 9.24 ml와 혼합하였다. 이 온도에서 혼합물을 1/2 시간동안 교반하고, THF 20 ml중의  $\gamma$ -4-브로모페닐- $\gamma$ -부티로락탐 용액(예를 들어 실

시예 XI-3에 의한 것) 5.02 g을 적가하였다. 혼합물을 -78 °C에서 1/2 시간동안 추가로 교반하고, THF 20 ml중의 디-t-부틸 디카보네이트 용액 5.04 g을 적가한 다음, 혼합물을 해동시켜 실온에서 밤새 교반하였다. 그후, 혼합물을 포화 염화암모늄 수용액을 사용하여 가수분해시키고, 2N 염산으로 산성화시킨 후, 매회 150 ml의 디클로로메탄으로 3 회 추출하였다. 추출물을 황산마그네슘상에서 건조시키고, 농축시킨 후, 생성물을 디클로로메탄/헥산으로 결정화시켜 정제하였다. 총 7.61 g(이론치의 97%)의 결정성 N-t-부톡시카보닐-γ-4-브로모페닐-γ-부티로락탐을 수득하였다. 가장 순수한 결정 분획(2.34 g)이 122 내지 124 °C에서 용융되었다.

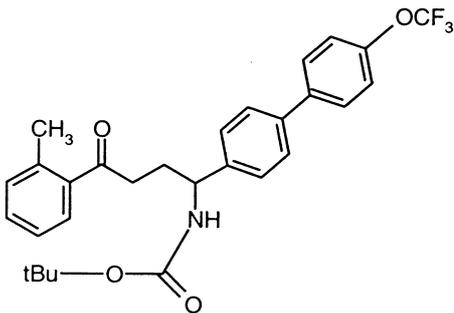
**실시예 IX-43**



화합물 (XI-43) 8.8 g을 톨루엔 80 ml중의 불화칼륨 0.2 g 및 t-부틸 피로카보네이트 8.1 g과 함께 108 °C에서 6 시간동안 가열하고, 이어서 혼합물을 실온에서 밤새 정치시켰다. 고체 침전 6.3 g(고체 침전은 또한 목적 생성물에 상응한다)을 흡인여과하였다. 톨루엔 용액을 물로 세척하고, 유기상을 MgSO<sub>4</sub> 상에서 건조시킨 후, 여과하고, 회전 증발기를 사용하여 농축시켰다. 백색 고체 6.1 g을 수득하였다.

용점 134 °C; logP(pH 2.3) = 3.96.

**실시예 VIII-2**



N-t-부톡시카보닐-γ-4'-트리플루오로메톡시비페닐-4-일-γ-부티로락탐(예를 들어 실시예 IX-2에 의한 것) 420 mg(1 밀리몰)을 우선 THF 25 ml에 도입하고, -78 °C로 냉각하였다.

-78 °C에서, o-톨릴마그네슘 브로마이드(Et<sub>2</sub>O 중 2M) 6.5 ml(13 밀리몰)를 교반하면서 적가하였다.

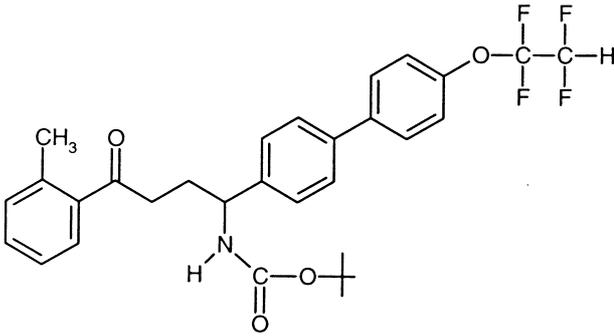
그후 반응 혼합물을 포화 염화암모늄 용액을 사용하여 가수분해시키고, 에틸 아세테이트로 추출하였다. 유기상을 합하여 건조시킨 후, 농축하였다.

마지막으로 조 생성물을 1:5 에틸 아세테이트/사이클로헥산을 사용하여 실리카겔 상에서 크로마토그래피하였다.

1-t-부틸옥시카보닐아미노-1-[4'-트리플루오로메톡시비페닐-4-일]-3-[o-메틸벤조일]프로판 0.228 g(이론치의 44.9%)을 오일로서 수득하였다.

<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>, TMS): δ [ppm] = 1.19 (s, 9H, [CH<sub>3</sub>]<sub>3</sub>), 1.79, 2.12, 2.22, 2.53 (m, 1H, CHH), 2.58 (s, 3H, CH<sub>3</sub>), 5.11 (d, 1H, CHN), 5.49 (s, 1H, NH), 7.15-7.65 (12H, ArH).

**실시예 VIII-3**



상기 화합물을 실시예 VIII-2의 방법에 의해 제조하였다.

logP(pH 2.3) = 5.05.

융점 134 내지 135 °C.

### 생물학적 실시예

#### 실시예 A

헬리오티스 아르미게라(Heliothis armigera) 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 유화제를 함유하는 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

대두의 새가지(글리신 맥스(Glycine max))를 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하고, 잎이 축축한 동안에 목화씨벌레(헬리오티스 아르미게라) 모충으로 감염시켰다.

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

이 시험에서는, 예를 들어 제조 실시예 I-9의 화합물이 0.004 %의 전형적인 활성 화합물 농도에서 6 일후에 100%의 구제율을 나타내었다.

#### 실시예 B

파에돈 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 유화제를 함유하는 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

양배추잎(브라시카 올레라세아(Brassica oleracea))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하고, 잎이 축축한 동안에 겨자 딱정벌레 유충(파에돈 코클레아리에)으로 감염시켰다.

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

이 시험에서는, 예를 들어 제조 실시예 I-9의 화합물이 0.004 %의 전형적인 활성 화합물 농도에서 6 일후에 100%의 구제율을 나타내었고, 제조 실시예 I-43의 화합물이 0.01 %의 전형적인 활성 화합물 농도에서 7 일후에 100%의 구제율을 나타내었다.

### 실시예 C

플루텔라 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 유화제를 함유하는 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

양배추잎(브라시카 올레라세아)을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하고, 잎이 축축한 동안에 배추좀나방(플루텔라 자일로스텔라(*Plutella xylostella*)) 모충으로 감염시켰다.

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

이 시험에서는, 예를 들어 제조 실시예 I-9의 화합물이 0.004 %의 전형적인 활성 화합물 농도에서 6 일후에 100%의 구제율을 나타내었다.

### 실시예 D

스포도프테라 프루기페르다 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 유화제를 함유하는 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

양배추잎(브라시카 올레라세아)을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하고, 잎이 축축한 동안에 행털구더기(스포도프테라 프루기페르다) 모충으로 감염시켰다.

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

이 시험에서는, 예를 들어 제조 실시예 I-9의 화합물이 0.004 %의 전형적인 활성 화합물 농도에서 6 일후에 100%의 구제율을 나타내었고, 제조 실시예 I-43의 화합물이 0.01 %의 전형적인 활성 화합물 농도에서 7 일후에 100%의 구제율을 나타내었다.

### 실시예 E

테트라니쿠스 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 목적하는 농도가 되도록 유화제를 함유하는 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

모든 단계의 온실 붉은 거미 응애(테트라니쿠스 우르티카에) 로 심하게 감염된 대두 식물(파세올루스 불가리스(Phaseolus vulgaris))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켰다.

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

이 시험에서는, 예를 들어 제조 실시예 I-9의 화합물이 0.004 %의 전형적인 활성 화합물 농도에서 7 일후에 98%의 구제율을 나타내었고, 제조 실시예 I-43의 화합물이 0.01 %의 전형적인 활성 화합물 농도에서 7 일후에 100%의 구제율을 나타내었다.