



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2007년09월13일
(11) 등록번호 10-0758624
(24) 등록일자 2007년09월07일

(51) Int. Cl.

C07D 213/69(2006.01)

(21) 출원번호 10-2002-7013126

(22) 출원일자 2002년10월01일

심사청구일자 2006년03월24일

변역문제출일자 2002년10월01일

(65) 공개번호 10-2004-0012429

공개일자 2004년02월11일

(86) 국제출원번호 PCT/EP2001/003864

국제출원일자 2001년04월05일

(87) 국제공개번호 WO 2001/79204

국제공개일자 2001년10월25일

(30) 우선권주장

10019145.2 2000년04월18일 독일(DE)

(56) 선행기술조사문헌

JP 평11-152273 A

WO2001017972 A2

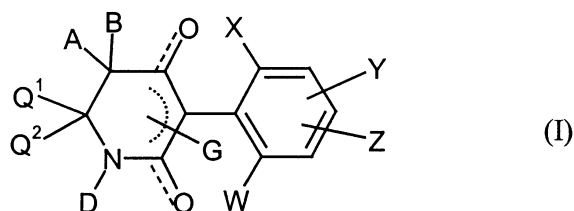
전체 청구항 수 : 총 7 항

심사관 : 이민정

(54) 페닐 치환된 4-하이드록시 테트라하이드로피리돈

(57) 요약

본 발명은 하기 일반식 (I)의 신규한 화합물, 다수의 그의 제조방법 및 페스티사이드(pesticide) 및 제초제로서의 그의 용도에 관한 것이다.



상기 식에서,

W, X, Y, Z, G, A, B, Q¹, Q² 및 D는 각각 명세서에 언급된 의미를 갖는다.

(72) 발명자

트라우트바인악셀

독일연방공화국51467버기쉬글라트바흐임아에흘레마르23

울만아스트리트

독일연방공화국50677켈른메로빙거스트라세31

슈나이더우도

독일연방공화국51373레버쿠젠헤이만스트라세38

비쉬나트랄프

독일연방공화국51061켈른모르겐그라벤14

드레베스마르크빌헬름

독일연방공화국40764랑엔펠트괴테스트라세38

에르델렌크리스트오프

독일연방공화국42799라이홀링겐운터뷔세르호프15

호이흐트디터

독일연방공화국40789몬하임악커벡9

(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, 키르기즈스탄, 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, 터키, 트리니다드토바고, 우크라이나, 우간다, 미국, 우즈베키스탄, 베트남, 세르비아 앤 몬테네그로, 남아프리카, 짐바브웨, 안티구와바부다, 벨리제, 코스타리카, 도미니카, 알제리, 모로코, 모잠비크, 탄자니아, 콜롬비아

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

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

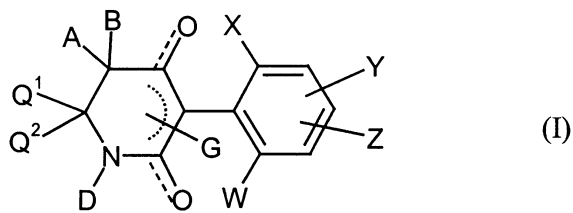
EP 유럽특허 : 오스트리아, 벨기에, 스위스, 사이프러스, 독일, 덴마크, 스페인, 핀란드, 프랑스, 영국, 그리스, 아일랜드, 이탈리아, 룩셈부르크, 모나코, 네덜란드, 포르투갈, 스웨덴, 터키

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

특허청구의 범위

청구항 1

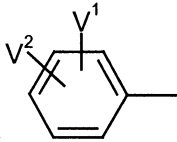
일반식 (I)의 화합물:



상기 식에서,

W는 수소, 불소, 염소, 브롬, 메틸 또는 에틸을 나타내고,

X는 염소, 브롬, 메틸, 에틸, 프로필 또는 트리플루오로메틸을 나타내며,

Y는 수소, 메틸, 에틸, 불소, 염소, 브롬 또는 래디칼  를 나타내고,

V¹은 수소, 불소, 염소, 브롬, 메틸, t-부틸, 메톡시, 트리플루오로메틸 또는 페닐을 나타내며,

V²는 수소, 불소, 염소, 메틸, 메톡시 또는 트리플루오로메틸을 나타내고,

Z는 수소, 염소, 브롬 또는 메틸을 나타내며,

A 및 B는 수소를 나타내고,

D는 수소, 메틸, 에틸, 프로필, 이소-프로필, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내며,

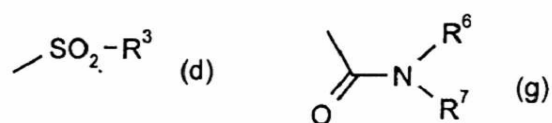
D 및 Q¹은 함께, 부탄디일을 나타내고

Q¹은 메틸, 에틸 또는 프로필을 나타내며,

Q²는 메틸을 나타내나; 단 D 및 Q¹이 함께, 부탄디일을 나타내는 경우 Q²는 또한 수소를 나타낼 수 있거나,

Q¹ 및 Q²는 이들이 결합된 탄소 원자와 함께, 임의로 하나의 환 멤버가 산소에 의해 대체되고 임의로 메틸-, 에틸-, 메톡시-, 에톡시-, 프로폭시- 또는 부톡시-치환된 6-C₆-사이클로알킬을 나타내고,

G는 수소(a)를 나타내거나, 하기 그룹중의 하나를 나타내며:



여기에서,

M은 산소 또는 황을 나타내고,

R^1 은 C_1-C_8 -알킬, C_2-C_4 -알케닐, 메톡시메틸, 에톡시메틸, 에틸티오메틸, 또는 임의로 불소-, 염소-, 메틸-, 에틸- 또는 메톡시-치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나,

임의로 불소-, 염소-, 브롬-, 시아노-, 니트로-, 메틸-, 에틸-, 이소-프로필-, t-부틸-, 메톡시-, 트리플루오로메틸- 또는 트리플루오로메톡시-치환된 페닐을 나타내거나,

각 경우에 임의로 염소- 또는 메틸-치환된 티에닐 또는 피리딜을 나타내며,

R^2 는 각 경우에 임의로 불소-치환된 C_1-C_8 -알킬, C_2-C_4 -알케닐, 메톡시에틸, 에톡시에틸, 프로폭시에틸, 이소프로폭시에틸, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나,

각 경우에 임의로 불소-, 염소-, 시아노-, 니트로-, 메틸-, 에틸-, 이소-프로필-, t-부틸-, 메톡시-, 트리플루오로메틸- 또는 트리플루오로메톡시-치환된 페닐 또는 벤질을 나타내고,

R^3 는 메틸을 나타내며,

R^6 및 R^7 은 함께, 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소에 의해 대체된 ω -알킬렌 래디칼을 나타낸다.

청구항 2

삭제

청구항 3

삭제

청구항 4

삭제

청구항 5

삭제

청구항 6

삭제

청구항 7

(A) 일반식 (II)의 화합물을 용매의 존재하 및 염기의 존재하에서 분자내 축합시켜 일반식 (I-a)의 화합물을 수득하거나,

(B) Y'가 염소, 브롬 또는 요오드를 나타내는 경우, 일반식 (I-a'), (I-b'), (I-c'), (I-d') 및 (I-g')의 화합물을 용매, 염기 및 촉매의 존재하에서 일반식 (V)의 보론산과 반응시켜 A, B, D, G, Q^1 , Q^2 , W, X, Y 및 Z가 각각 제 1 항에 정의된 바와 같은 일반식 (I-a), (I-b), (I-c), (I-d) 및 (I-g)의 화합물을 수득하거나,

(C) A, B, D, Q^1 , Q^2 , W, X, Y 및 Z가 각각 제 1 항에 정의된 바와 같은 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 용매의 존재하 및 경우에 따라 산 결합체의 존재하에서

a) 일반식 (VI)의 산 할라이드와 반응시키거나,

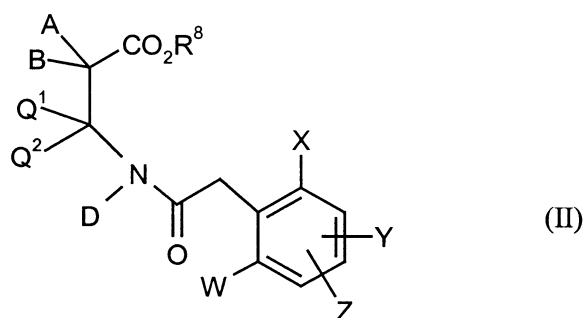
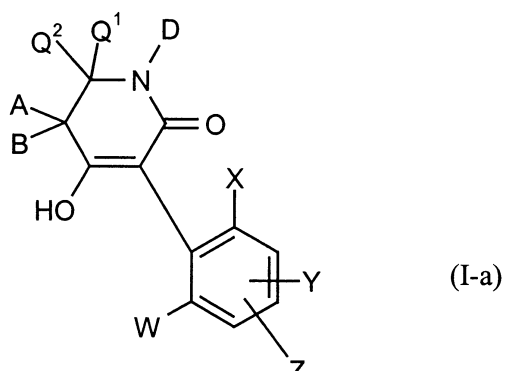
β) 일반식 (VII)의 무수 카복실산과 반응시켜 A, B, D, Q^1 , Q^2 , R^1 , W, X, Y 및 Z가 각각 제 1 항에 정의된 바와 같은 일반식 (I-b)의 화합물을 수득하거나,

(D) A, B, D, Q^1 , Q^2 , W, X, Y 및 Z가 각각 제 1 항에 정의된 바와 같은 일반식 (I-a)의 화합물을 경우에 따라 용매의 존재하 및 경우에 따라 산 결합체의 존재하에서 일반식 (VIII)의 클로로포름산 에스테르 또는 클로로포름산 티오에스테르와 반응시켜 A, B, D, Q^1 , Q^2 , R^2 , M, W, X, Y 및 Z가 각각 제 1 항에 정의된 바와 같고 L이

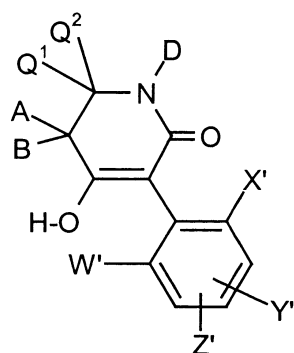
산소를 나타내는 일반식 (I-c)의 화합물을 수득하거나,

(F) A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z가 각각 제 1 항에 정의된 바와 같은 일반식 (I-a)의 화합물을 경우에 따라 용매의 존재하 및 경우에 따라 산 결합체의 존재하에서 일반식 (X)의 설폰닐 클로라이드와 반응시켜 A, B, D, Q¹, Q², R³, W, X, Y 및 Z가 각각 제 1 항에 정의된 바와 같은 일반식 (I-d)의 화합물을 수득하거나,

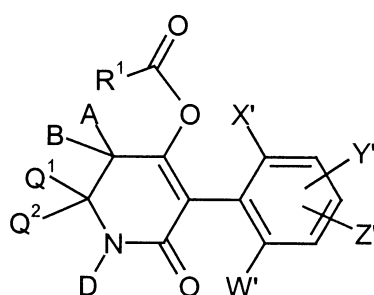
(I) A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z가 각각 제 1 항에 정의된 바와 같은 일반식 (I-a)의 화합물을 경우에 따라 용매의 존재하 및 경우에 따라 산 결합체의 존재하에서 일반식 (XV)의 카바모일 클로라이드와 반응시켜 A, B, D, Q¹, Q², R⁶, R⁷, W, X, Y 및 Z가 각각 제 1 항에 정의된 바와 같은 일반식 (I-g)의 화합물을 수득함을 특징으로 하여 일반식 (I)의 화합물을 제조하는 방법:



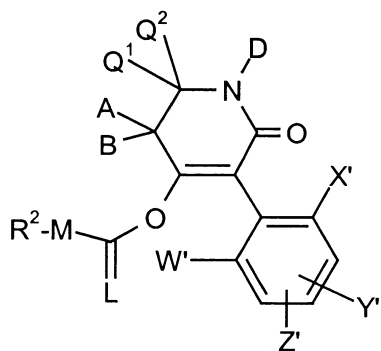
(I-a'):



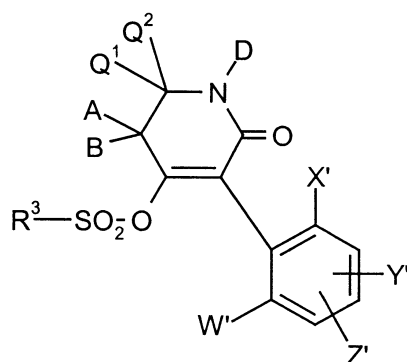
(I-b'):



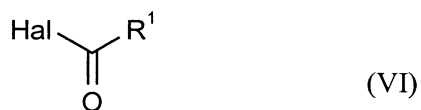
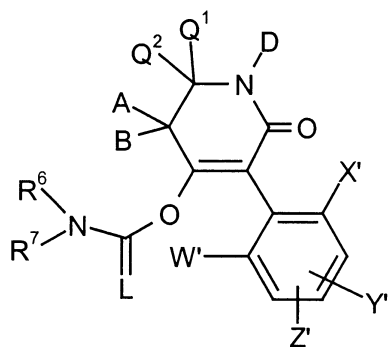
(I-c):



(I-d):



(I-g):



상기 식에서,

A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁶, R⁷ 및 M은 각각 제 1 항에 정의된 바와 같고,

W', X', Y' 및 Z'는 각각 제 1 항에 정의된 W, X, Y 및 Z와 동일한 의미를 가지나, 단 Y'는 염소, 브롬 또는 요오드를 나타내며, ,

L은 산소를 나타내고,

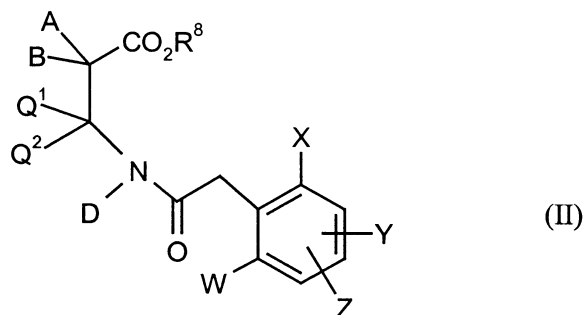
R⁸은 C₁-C₆-알킬을 나타내며,

일반식 (V)에서 Y는 V¹- 및 V²-치환된 페닐을 나타내고,

Hal은 할로젠을 나타낸다.

청구항 8

일반식 (II)의 화합물:



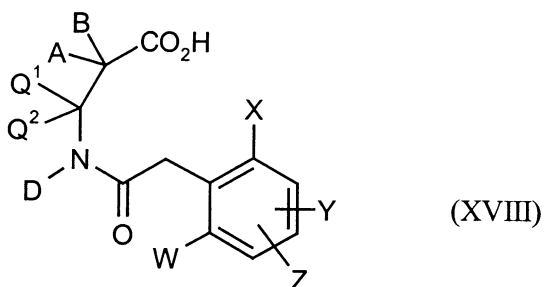
상기 식에서,

A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같고,

R⁸은 C₁-C₆-알킬을 나타낸다.

청구항 9

일반식 (XVIII)의 화합물:

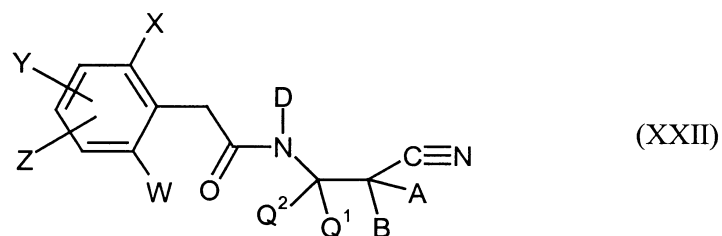


상기 식에서,

A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같다.

청구항 10

일반식 (XXII)의 화합물:



상기 식에서,

A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z는 각각 제 1 항에 정의된 바와 같다.

청구항 11

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

초제.

청구항 12

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

청구항 13

삭제

청구항 14

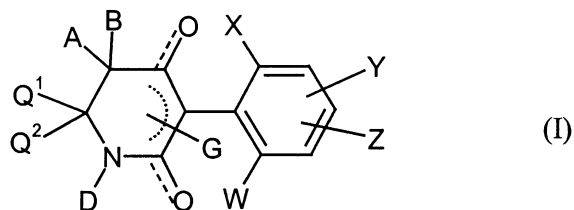
삭제

청구항 15

삭제

명세서

- <1> 본 발명은 신규한 페닐 치환된 4-하이드록시테트라하이드로피리돈, 다수의 그의 제조 방법, 및 페스티사이드(pesticide) 및 제초제로서의 그의 용도에 관한 것이다.
- <2> 특정의 테트라하이드로피리돈이 제초성을 가지고 있음은 이미 알려져 있다(참조: JP 0832530). 또한, 살비성, 살충성 및 제초성을 갖는 특정의 4-하이드록시테트라하이드로피리돈이 공지되었다(참조: JP 11152273).
- <3> 그러나, 이들 화합물의 활성 및 활성 스펙트럼은, 특히 적용 비율 및 농도가 낮은 경우에 항상 만족스러운 것은 아니다. 또한, 이들 화합물의 식물과의 상용성(compatibility)이 반드시 충분하지 않은 않다.
- <4> 따라서, 본 발명은 하기 일반식 (I)의 신규 화합물을 제공한다:



- <5>
- <6> 상기 식에서,
- <7> W는 수소, 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로젠, 할로게노알킬 또는 알콕시를 나타내고,
- <8> X는 할로젠, 알킬, 알콕시, 알케닐, 알키닐, 할로게노알킬, 할로게노알콕시, 시아노, 또는 각 경우에 임의로 치환된 페닐, 페녹시, 페닐티오, 페닐알콕시 또는 페닐알킬티오를 나타내며,
- <9> Y는 수소, 알킬, 할로젠, 알콕시, 알케닐, 알키닐, 또는 임의로 치환된 아릴 또는 헤트아릴을 나타내고,
- <10> Z는 수소, 할로젠, 알킬, 알콕시, 할로게노알킬, 할로게노알콕시 또는 시아노를 나타내며,
- <11> A는 수소, 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 알킬, 알케닐 또는 알콕시알킬, 임의로 적어도 하나의 환 원자가 헤테로 원자에 의해 대체되고 임의로 치환된 사이클로알킬 또는 사이클로알킬알킬, 또는 각 경우에 임의로 할로젠-, 알킬-, 할로게노알킬-, 알콕시-, 할로게노알콕시-, 시아노- 또는 니트로-치환된 아릴, 아릴알킬, 헤트아릴 또는 헤트아릴알킬을 나타내고,
- <12> B는 수소 또는 알킬을 나타내거나,
- <13> A 및 B는 이들이 결합된 탄소 원자와 함께, 임의로 적어도 하나의 헤테로 원자를 함유하며 포화 또는 불포화되고 비치환되거나 치환된 사이클을 나타내며,
- <14> A 및 Q¹은 함께, 각 경우에 임의로 치환된 알킬 또는 알콕시에 의해 임의로 치환된 알칸디일을 나타내고,
- <15> D는 수소를 나타내거나,

<16> D는 또한 각 경우에 임의로 치환된 알케닐, 알킬닐, 알콕시알킬, 임의로 하나 이상의 환 멤버가 헤테로 원자에 의해 대체되고 임의로 치환된 사이클로알킬 및 사이클로알킬알킬로 구성된 그룹중에서 선택된 래디칼을 나타내거나,

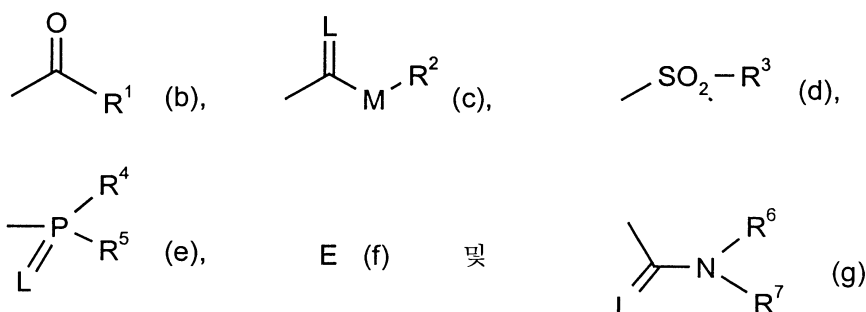
<17> D 및 Q¹은 함께, 각 경우에 임의로 치환된 알킬 또는 알콕시에 의해 임의로 치환된 알칸디일을 나타내거나,

<18> Q¹은 수소, 알킬, 알콕시알킬, 임의로 치환된 사이클로알킬(여기에서 임의로 하나의 메틸렌 그룹은 산소 또는 황에 의해 대체된다) 또는 임의로 치환된 페닐을 나타내며,

<19> Q²는 수소 또는 알킬을 나타내거나,

<20> Q¹ 및 Q²는 이들이 결합된 탄소 원자와 함께, 임의로 헤테로 원자를 함유하는 비치환 또는 치환 사이클을 나타내고,

<21> G는 수소(a), 또는 하기 그룹중의 하나를 나타내며:



<22>

<23> 여기에서,

<24> E는 금속이온 또는 암모늄 이온을 나타내고,

<25> L은 산소 또는 황을 나타내며,

<26> M은 산소 또는 황을 나타내고,

<27> R¹은 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 알킬, 알케닐, 알콕시알킬, 알킬티오알킬 또는 폴리알콕시알킬을 나타내거나, 임의로 하나 이상의 메틸렌 그룹이 헤테로 원자에 의해 대체될 수 있으며 임의로 할로젠-, 알킬- 또는 알콕시-치환된 사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 치환된 페닐, 페닐알킬, 헤트아릴, 페녹시알킬 또는 헤트아릴옥시알킬을 나타내며,

<28> R²는 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 알킬, 알케닐, 알콕시알킬 또는 폴리알콕시알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 치환된 사이클로알킬, 페닐 또는 벤질을 나타내고,

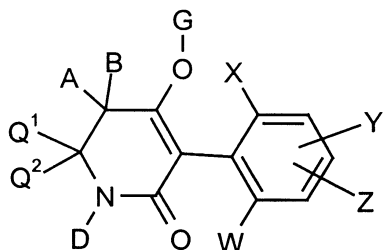
<29> R³, R⁴ 및 R⁵는 서로 독립적으로 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 알킬, 알콕실, 알킬아미노, 디알킬아미노, 알킬티오, 알케닐티오 또는 사이클로알킬티오를 나타내거나, 각 경우에 임의로 치환된 페닐, 벤질, 페녹시 또는 페닐티오를 나타내며,

<30> R⁶ 및 R⁷은 서로 독립적으로 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 알킬, 사이클로알킬, 알케닐, 알콕시 또는 알콕시알킬을 나타내거나, 임의로 치환된 페닐을 나타내거나, 임의로 치환된 벤질을 나타내거나, 이들이 결합된 N 원자와 함께, 임의로 산소 또는 황에 의해 차단된 환을 나타낸다.

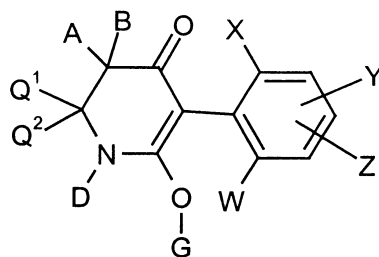
<31> 특히, 일반식 (I)의 화합물은 치환체의 성질에 따라, 기하 및/또는 광학 이성체 또는, 필요에 따라 통상의 방법으로 분리될 수 있는 다양한 조성의 이성체 혼합물로 존재할 수 있다. 본 발명은 순수한 이성체 및 이성체 혼합물, 이들의 제조방법 및 용도, 및 이들을 함유하는 조성물 모두를 제공한다. 그러나, 이하에서는 편의상, 항상 일반식 (I)의 화합물만이 언급되며, 이는 순수한 화합물 및 경우에 따라 다양한 함량의 이성체 화합물의 혼합물을 의미할 수도 있다.

<32> 치환체 G의 위치에 따라, 일반식 (I)의 화합물은 일반식 (I-A) 및 (I-B)의 두 이성체 형태로 존재할 수 있다(이

는 일반식 (I)에서 점선으로 표시되었다):



(I-A)



(I-B)

<33>

<34>

일반식 (I-A) 및 (I-B)의 화합물은 혼합물 및 순수한 이성체 형태 둘다로 존재할 수 있다. 일반식 (I-A) 및 (I-B)의 화합물의 혼합물은, 경우에 따라, 물리적 방법, 예를 들어 크로마토그래피 방법에 의해 그 자체가 공지된 방법으로 분리될 수 있다.

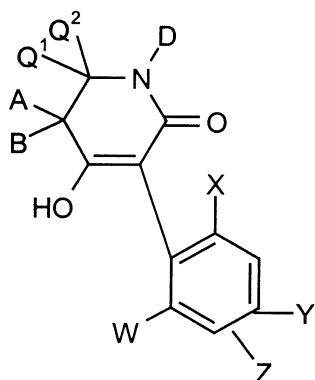
<35>

명쾌하게 하기 위하여, 이후에는 한가지 가능한 이성체만이 각 경우에 표시된다. 이는 화합물이, 경우에 따라 이성체 혼합물의 형태 또는 각각의 다른 이성체 형태로 존재할 수 있다는 사실을 배제하지 않는다.

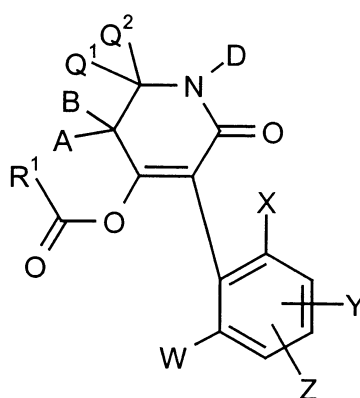
<36>

그룹 G의 상이한 의미 (a), (b), (c), (d), (e), (f) 및 (g)를 고려해 볼 때, 하기 주 구조 (I-a) 내지 (I-g)가 얻어진다:

(I-a):

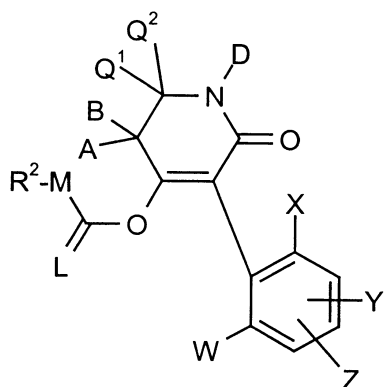


(I-b):

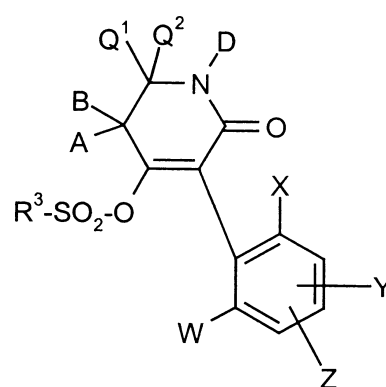


<37>

(I-c):

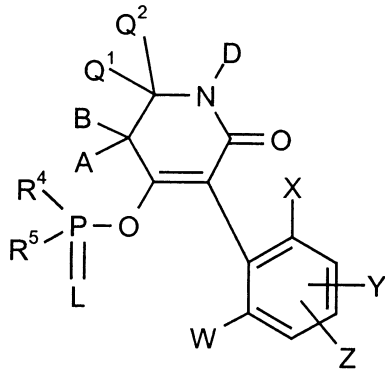


(I-d):



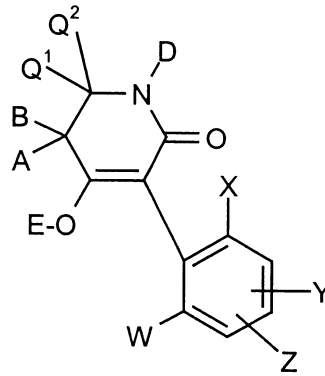
<38>

(I-e):

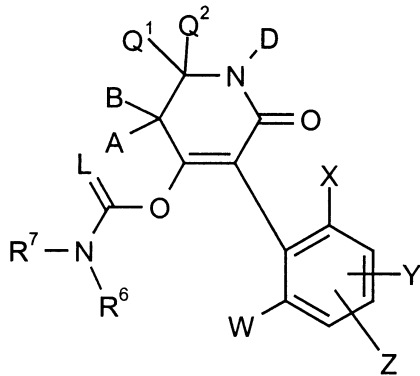


<39>

(I-f):



(I-g):



<40>

<41>

상기 식에서,

<42>

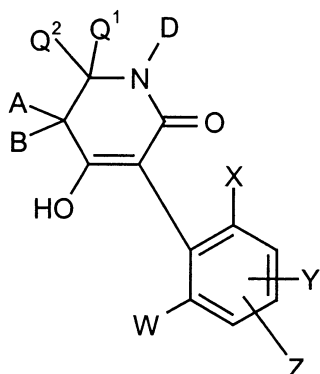
A, B, D, E, L, M, Q¹, Q², W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ 및 R⁷ 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

<43>

또한, 본 발명에 따라 일반식 (I)의 신규한 화합물은 하기 기술된 방법중 하나에 의해 수득될 수 있음이 밝혀졌다:

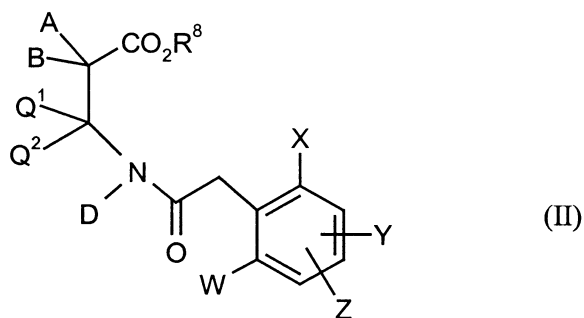
<44>

(A) 일반식 (I-a)의 치환된 테트라하이드로피리딘-2,4-디온은 일반식 (II)의 N-아실아미노산 에스테르를 회석제의 존재하 및 염기의 존재하에서 분자내 축합시킴으로써 수득된다:



(I-a)

<45>



<46>

<47> 상기 식에서,

<48> A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같고,

<49> R⁸은 알킬(바람직하게는 G-C₆-알킬)을 나타낸다.

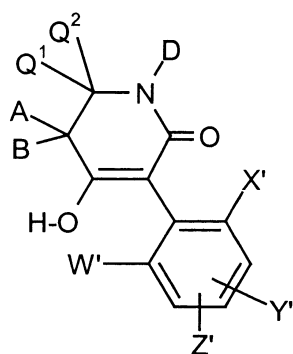
<50> (B) 또한, A, B, D, G, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같은 상기 일반식 (I-a) 내지 (I-g)의 화합물은 일반식 (I-a') 내지 (I-g')의 화합물을,

<51> α) 우선 용매, 염기 및 촉매(여기에서 특히 적합한 촉매는 팔라듐 복합체이다)의 존재하에서 일반식 (III)의 실릴아세틸렌과 반응시키고, 이어서 실릴 그룹을 제거하거나,

<52> β) 용매의 존재하, 경우에 따라 염기의 존재하 및 촉매(여기에서 특히 적합한 촉매는 팔라듐 복합체이다)의 존재하에서 일반식 (IV)의 비닐스타난 (vinylstannane)과 반응시키거나,

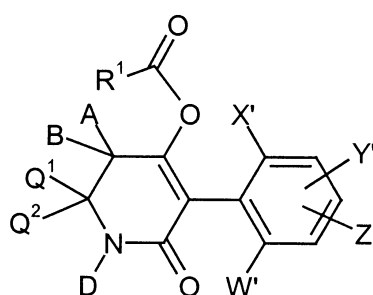
<53> γ) Y'가 염소, 브롬 또는 요오드, 바람직하게는 브롬을 나타내는 특정의 경우, 용매, 염기 및 촉매(여기에서 특히 적합한 촉매는 팔라듐 복합체이다)의 존재하에서 일반식 (V)의 보론산과 반응시킴으로써 수득됨이 밝혀졌다:

(I-a'):

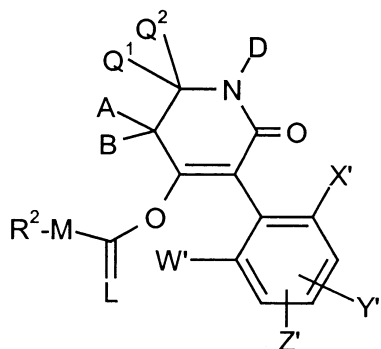


<54>

(I-b'):

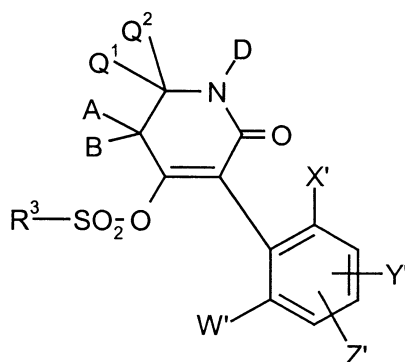


(I-c'):

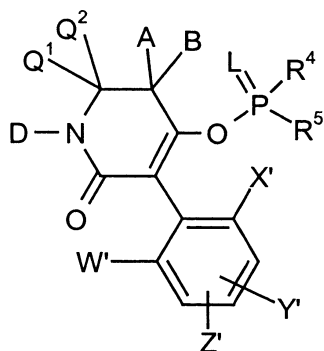


<55>

(I-d'):

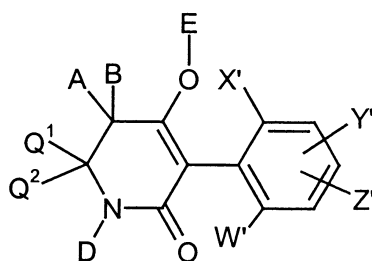


(I-e):

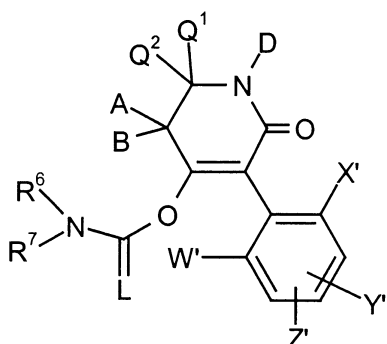


<56>

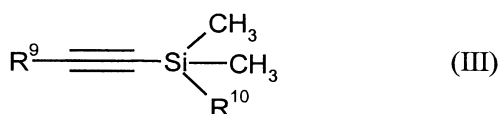
(I-f):



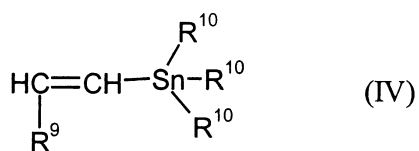
(I-g):



<57>



<58>



<59>



<60>

<61>

상기 식에서,

<62>

A, B, D, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, E, L, M, Q¹, Q², W', X', Y' 및 Z'는 각각 상기 정의된 바와 같고,

<63>

라디칼 W', X' 및 Y' 중 적어도 하나는 염소, 브롬 또는 요오드, 바람직하게는 브롬을 나타내며,

<64>

Z'는 브롬 또는 요오드를 나타내지 않고,

<65>

일반식 (III)에서 R⁹는 수소를 나타내며,

<66>

일반식 (IV)에서 R⁹는 수소, 메틸 또는 에틸을 나타내고,

<67>

일반식 (III)에서 R¹⁰은 C₁-C₄-알킬 또는 페닐, 특히 메틸 또는 t-부틸을 나타내며,

<68>

일반식 (IV)에서 R¹⁰은 C₁-C₄-알킬, 특히 부틸을 나타내고,

<69>

Y는 임의로 치환된 페닐 또는 헤트아릴을 나타낸다.

<70>

또한,

<71> (C) A, B, D, Q¹, Q², R¹, W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같은 일반식 (I-b)의 화합물은 A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같은 상기 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합체의 존재하에서

<72> α) 일반식 (VI)의 산 할라이드와 반응시키거나,

<73> β) 일반식 (VII)의 무수 카복실산과 반응시킴으로써 취득되거나;



<74>



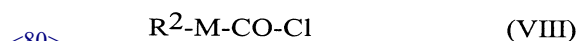
<75>

<76> (상기 식에서,

<77> R¹은 상기 정의된 바와 같고,

<78> Hal 은 할로젠(특히 염소 또는 브롬을 나타낸다))

<79> (D) A, B, D, Q¹, Q², R², M, W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같고 L이 산소를 나타내는 일반식 (I-c)의 화합물은 A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같은 상기 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합체의 존재하에서 일반식 (VIII)의 클로로포름산 에스테르 또는 클로로포름산 티오에스테르와 반응시킴으로써 취득되거나;

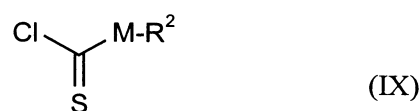


<80>

<81> (상기 식에서,

<82> R² 및 M 은 각각 상기 정의된 바와 같다)

<83> (E) A, B, D, Q¹, Q², R², M, W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같고 L이 황을 나타내는 일반식 (I-c)의 화합물은 A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같은 상기 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산결합체의 존재하에서 일반식 (IX)의 클로로모노티오포름산 에스테르 또는 클로로디티오포름산 에스테르와 반응시킴으로써 취득되거나;

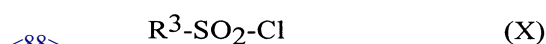


<84>

<85> (상기 식에서,

<86> M 및 R² 는 각각 상기 정의된 바와 같다)

<87> (F) A, B, D, Q¹, Q², R³, W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같은 일반식 (I-d)의 화합물은 A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같은 상기 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합체의 존재하에서 일반식 (X)의 설포닐 클로라이드와 반응시킴으로써 취득되거나;



<88>

<89> (상기 식에서, R³ 은 상기 정의된 바와 같다)

<90> (G) A, B, D, L, Q¹, Q², R⁴, R⁵, W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같은 일반식 (I-e)의 화합물은 A, B,

D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같은 상기 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XI)의 인 화합물과 반응시킴으로써 수득되거나;



<91>

<92>

(상기 식에서,

<93>

L, R⁴ 및 R⁵는 각각 상기 정의된 바와 같고,

<94>

Hal은 할로젠(특히 염소 또는 브롬)을 나타낸다)

<95>

(H) A, B, D, E, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같은 일반식 (I-f)의 화합물은 A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같은 상기 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하에서 일반식 (XII) 또는 (XIII)의 금속 화합물 또는 아민과 반응시킴으로써 수득되거나;



<96>

<97>

(상기 식에서,

<98>

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

<99>

t는 1 또는 2의 수를 나타내며,

<100>

R¹¹, R¹² 및 R¹³은 서로 독립적으로 각각 수소 또는 알킬(바람직하게는 C₈-알킬)을 나타낸다)

<101>

(I) A, B, D, L, Q¹, Q², R⁶, R⁷, W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같은 일반식 (I-g)의 화합물은 A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z가 각각 상기 정의된 바와 같은 상기 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에,

<102>

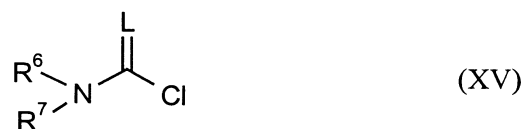
α) 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 촉매의 존재하에서 일반식 (XIV)의 이소시아네이트 또는 이소티오시아네이트와 반응시키거나,

<103>

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



<104>



<105>

<106>

(상기 식에서,

<107>

R⁶, L 및 R⁷은 각각 상기 정의된 바와 같다).

<108>

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

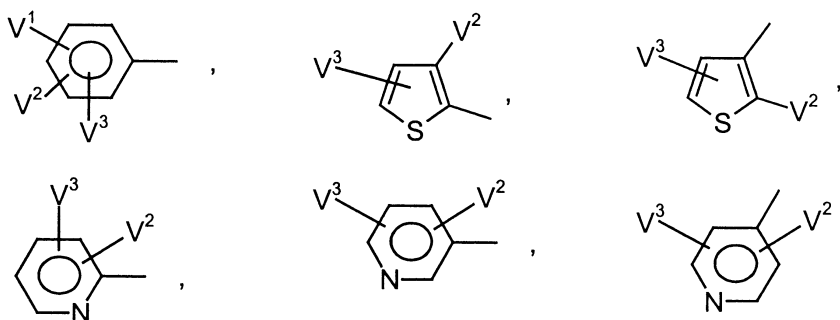
<109>

일반식 (I)은 본 발명에 따른 화합물의 일반 정의를 제공한다. 상기 및 이후 언급된 일반식들에 열거된 바람직한 치환체 또는 래디칼의 범위는 다음과 같다:

<110> W는 바람직하게는 수소, C₁-C₆-알킬, C₂-C₄-알케닐, 에티닐, 불소, 염소, 브롬, C₁-C₄-할로게노알킬 또는 C₁-C₆-알콕시를 나타내고,

<111> X는 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, C₁-C₆-알킬, C₁-C₄-할로게노알킬, C₁-C₆-알콕시, C₂-C₄-알케닐, 에티닐, C₁-C₄-할로게노알콕시 또는 시아노를 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-, C₁-C₆-알킬-, C₁-C₆-알콕시-, C₁-C₄-할로게노알킬-, C₁-C₄-할로게노알콕시-, 니트로- 또는 시아노-치환된 페닐 또는 벤질옥시를 나타내며,

<112> Y는 바람직하게는 수소, C₁-C₆-알킬, 불소, 염소, 브롬, C₁-C₆-알콕시, C₂-C₄-알케닐, 에티닐, 또는 하기 래디칼 중 하나를 나타내고:



<113>

<114> V¹은 바람직하게는 수소, 할로젠, C₁-C₁₂-알킬, C₁-C₆-알콕시, C₁-C₆-알킬티오, C₁-C₄-할로게노알킬, C₁-C₄-할로게노알콕시, 니트로 또는 시아노를 나타내거나, 각각 할로젠, C₁-C₆-알킬, C₁-C₆-알콕시, C₁-C₄-할로게노알킬, C₁-C₄-할로게노알콕시, 니트로 또는 시아노에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 페닐, 페녹시, 페녹시-C₁-C₄-알킬, 페닐-C₁-C₄-알콕시, 페닐티오-C₁-C₄-알킬 또는 페닐-C₁-C₄-알킬티오를 나타내며,

<115> V²는 바람직하게는 수소, 불소, 염소, C₁-C₆-알킬, C₁-C₆-알콕시, C₁-C₄-할로게노알킬 또는 C₁-C₄-할로게노알콕시를 나타내고,

<116> V³은 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 메틸 또는 메톡시를 나타내며,

<117> Z는 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, C₁-C₆-알킬, C₁-C₄-할로게노알킬, C₁-C₆-알콕시, C₁-C₄-할로게노알콕시 또는 시아노를 나타내나,

<118> 단 Y가 V¹-, V²- 및 V³-치환된 페닐 또는 헤트아릴을 나타내는 경우 W, X 및 Z는 브롬, C₂-C₄-알케닐 및 에티닐을 나타내지 않으며, 래디칼 W, X 및 Y중 최대 두개만이 C₂-C₄-알케닐 및 에티닐을 나타낼 수 있고, 다른 래디칼 W, X, Y 및 Z는 어느 것도 브롬을 나타낼 수 없으며,

<119> A는 바람직하게는 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C₁-C₁₂-알킬, C₃-C₈-알케닐, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₄-알킬, 또는 임의로 하나 또는 두 개의 직접 인접하지 않은 환 멤버가 산소 및/또는 황에 의해 대체되고 임의로 할로젠-, C₁-C₄-알킬- 또는 C₁-C₄-알콕시-치환된 C₃-C₈-사이클로알킬 또는 C₃-C₆-사이클로알킬-C₁-C₄-알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-, C₁-C₆-알킬-, C₁-C₆-할로게노알킬-, C₁-C₆-알콕시-, C₁-C₆-할로게노알콕시-, 시아노- 또는 니트로-치환된 페닐, 벤질, 5 또는 6개의 환 멤버를 갖는 헤트아릴(예를 들어 푸라닐, 피리딜, 이미다졸릴, 트리아졸릴, 피라졸릴, 피리미딜, 티아졸릴 또는 티에닐), 또는 5 또는 6개의 환 멤버를 갖는 헤트아릴-C₁-C₄-알킬(예를 들어 피리딜, 피리미딜 또는 티아졸릴)을 나타내고,

<120> B는 바람직하게는 수소 또는 C₁-C₆-알킬을 나타내거나,

<121> A, B 및 이들이 결합된 탄소 원자는 바람직하게는 임의로 하나의 환 멤버가 산소 또는 황에 의해 대체되고, C₁-C₆-알킬, C₃-C₈-사이클로알킬, C₁-C₆-할로게노알킬, C₁-C₆-알콕시, C₁-C₆-알킬티오, 할로젠 또는 페닐에 의해 임의

로 일- 또는 이치환된 포화 $G-C_{10}$ -사이클로알킬 또는 불포화 $G-C_{10}$ -사이클로알케닐을 나타내며,

<122> A 및 Q^1 은 바람직하게는 함께, C_1-C_4 -알킬 및 C_1-C_4 -알콕시로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 $G-C_6$ -알칸디일을 나타내고,

<123> D는 바람직하게는 수소를 나타내거나,

<124> D는 또한 바람직하게는 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C_3-C_8 -알케닐, C_3-C_8 -알키닐, C_1-C_6 -알콕시- C_2-C_6 -알킬, 또는 임의로 하나의 환 멤버가 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 할로젠-, C_1-C_4 -알킬-, C_1-C_4 -알콕시- 또는 C_1-C_4 -할로게노알킬-치환된 $G-C_8$ -사이클로알킬 또는 $G-C_6$ -사이클로알킬- $G-C_4$ -알킬을 나타내거나,

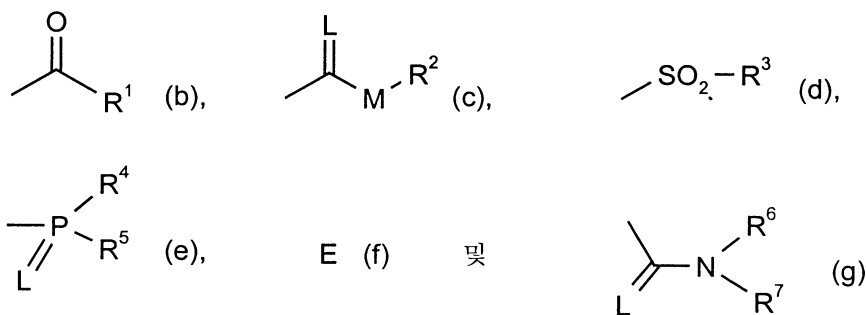
<125> D 및 Q^1 은 바람직하게는 함께, C_1-C_4 -알킬 및 C_1-C_4 -알콕시로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 $G-C_6$ -알칸디일을 나타내거나,

<126> Q^1 은 바람직하게는 수소, C_1-C_6 -알킬, C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_2 -알킬, 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 불소-, 염소-, C_1-C_4 -알킬-, C_1-C_2 -할로게노알킬- 또는 C_1-C_4 -알콕시-치환된 C_3-C_8 -사이클로알킬, 또는 임의로 할로젠-, C_1-C_4 -알킬-, C_1-C_4 -알콕시-, C_1-C_2 -할로게노알킬-, C_1-C_2 -할로게노알콕시-, 시아노- 또는 니트로-치환된 페닐을 나타내며,

<127> Q^2 는 바람직하게는 수소 또는 $G-C_4$ -알킬을 나타내거나,

<128> Q^1 및 Q^2 는 이들이 결합된 탄소 원자와 함께, 바람직하게는 임의로 하나의 환 멤버가 산소 또는 황에 의해 대체되고, 임의로 $G-C_6$ -알킬-, C_1-C_6 -알콕시- 또는 $G-C_2$ -할로게노알킬-치환된 $G-C_7$ -사이클로알킬을 나타내고,

<129> G는 바람직하게는 수소(a)를 나타내거나, 하기 그룹중의 하나, 특히 (a), (b), (c), (d) 또는 (g)를 나타내며:



<130>

<131> 여기에서,

<132> E는 금속 이온 또는 암모늄 이온을 나타내고,

<133> L은 산소 또는 황을 나타내며,

<134> M은 산소 또는 황을 나타내고,

<135> R^1 은 바람직하게는 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C_1-C_{20} -알킬, C_2-C_{20} -알케닐, C_1-C_8 -알콕시- C_1-C_8 -알킬, C_1-C_8 -알킬티오- C_1-C_8 -알킬, 폴리- C_1-C_8 -알콕시- C_1-C_8 -알킬, 또는 임의로 하나 이상(바람직하게는 하나 또는 두개)의 직접 인접하지 않은 환 멤버가 산소 및/또는 황에 의해 대체되고 임의로 할로젠-, C_1-C_6 -알킬- 또는 C_1-C_6 -알콕시-치환된 C_3-C_8 -사이클로알킬을 나타내거나,

<136> 임의로 할로젠-, 시아노-, 니트로-, C_1-C_6 -알킬-, C_1-C_6 -알콕시-, C_1-C_6 -할로게노알킬-, C_1-C_6 -할로게노알콕시-, C_1-C_6 -알킬티오- 또는 C_1-C_6 -알킬설폰-치환된 페닐을 나타내거나,

<137> 임의로 할로젠-, 니트로-, 시아노-, C_1-C_6 -알킬-, C_1-C_6 -알콕시-, C_1-C_6 -할로게노알킬- 또는 C_1-C_6 -할로게노알콕시-

-치환된 페닐- C_1-C_6 -알킬을 나타내거나,

<138> 임의로 할로젠-, C_1-C_6 -알킬- 또는 트리플루오로메틸-치환된 5- 또는 6-원 헤트아릴(예를 들어 피라졸릴, 티아졸릴, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐 또는 티에닐)을 나타내거나,

<139> 임의로 할로젠- 또는 $G-C_6$ -알킬-치환된 페녹시- $G-C_6$ -알킬을 나타내거나,

<140> 임의로 할로젠-, 아미노- 또는 C_1-C_6 -알킬-치환된 5- 또는 6-원 헤트아릴옥시- $G-C_6$ -알킬(예를 들어, 피리딜옥시- C_1-C_6 -알킬, 피리미딜옥시- $G-C_6$ -알킬 또는 티아졸릴옥시- $G-C_6$ -알킬)을 나타내며,

<141> R^2 는 바람직하게는 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C_1-C_{20} -알킬, C_2-C_{20} -알케닐, C_1-C_8 -알콕시- C_2-C_8 -알킬 또는 폴리- C_1-C_8 -알콕시- C_2-C_8 -알킬을 나타내거나,

<142> 임의로 할로젠-, $G-C_6$ -알킬- 또는 C_1-C_6 -알콕시-치환된 C_3-C_8 -사이클로알킬을 나타내거나,

<143> 각 경우에 임의로 할로젠-, 시아노-, 니트로-, C_1-C_6 -알킬-, C_1-C_6 -알콕시-, C_1-C_6 -할로게노알킬- 또는 C_1-C_6 -할로게노알콕시-치환된 페닐 또는 벤질을 나타내고,

<144> R^3 은 바람직하게는 임의로 할로젠-치환된 C_1-C_8 -알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-, C_1-C_6 -알킬-, C_1-C_6 -알콕시-, C_1-C_4 -할로게노알킬-, C_1-C_4 -할로게노알콕시-, 시아노- 또는 니트로-치환된 페닐 또는 벤질을 나타내며,

<145> R^4 및 R^5 는 바람직하게는 서로 독립적으로 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C_1-C_8 -알킬, C_1-C_8 -알콕시, C_1-C_8 -알킬아미노, 디-(C_1-C_8 -알킬)아미노, C_1-C_8 -알킬티오, C_2-C_8 -알케닐티오 또는 C_3-C_7 -사이클로알킬티오를 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-, 니트로-, 시아노-, C_1-C_4 -알콕시-, C_1-C_4 -할로게노알콕시-, C_1-C_4 -알킬티오-, C_1-C_4 -할로게노알킬티오-, $G-C_4$ -알킬- 또는 C_1-C_4 -할로게노알킬-치환된 페닐, 벤질, 페녹시 또는 페닐티오를 나타내고,

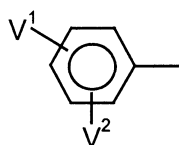
<146> R^6 및 R^7 은 바람직하게는 서로 독립적으로 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 할로젠-치환된 C_1-C_8 -알킬, C_3-C_8 -사이클로알킬, C_1-C_8 -알콕시, C_3-C_8 -알케닐 또는 C_1-C_8 -알콕시- C_1-C_8 -알킬을 나타내거나, 임의로 할로젠-, C_1-C_8 -할로게노알킬-, C_1-C_8 -알킬- 또는 C_1-C_8 -알콕시-치환된 페닐을 나타내거나, 임의로 할로젠-, C_1-C_8 -알킬-, C_1-C_8 -할로게노알킬- 또는 C_1-C_8 -알콕시-치환된 벤질을 나타내거나, 함께, 임의로 하나의 탄소 원자가 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 $G-C_4$ -알킬 치환된 C_3-C_6 -알킬렌 래디칼을 나타낸다.

<147> 상기 바람직한 것으로 언급된 래디칼 정의에서, 예를 들어 할로게노알킬에서와 같이 또한 치환체로서의 할로젠은 불소, 염소, 브롬 및 요오드, 특히 불소 및 염소를 나타낸다.

<148> W는 특히 바람직하게는 수소, C_1-C_4 -알킬, C_2-C_3 -알케닐, 에틸닐, 불소, 염소, 브롬, 트리플루오로메틸 또는 C_1-C_4 -알콕시를 나타내고,

<149> X는 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, C_1-C_4 -알킬, C_1-C_4 -알콕시, C_2-C_3 -알케닐, 에틸닐, C_1-C_2 -할로게노알킬, C_1-C_2 -할로게노알콕시 또는 시아노를 나타내며,

<150> Y는 특히 바람직하게는 수소, C_1-C_4 -알킬, 불소, 염소, 브롬, C_1-C_4 -알콕시, C_2-C_3 -알케닐, 에틸닐, 2-티에닐,

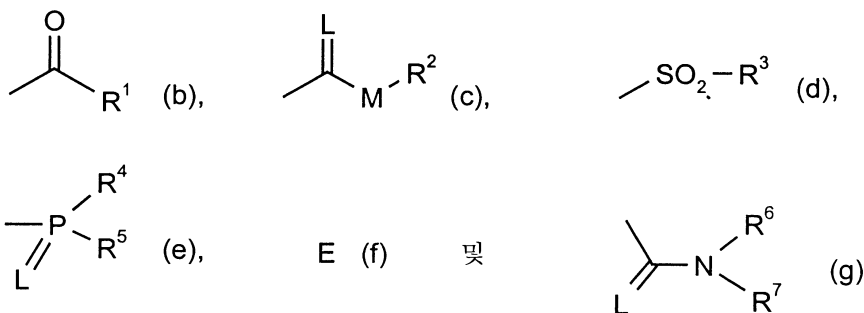


3-티에닐 또는 래디칼

<151> V^1 은 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, C_1-C_6 -알킬, C_1-C_4 -알콕시, C_1-C_4 -알킬티오, C_1-C_2 -할로게노알

킬, C₁-C₂-할로게노알콕시, 니트로, 시아노 또는 페닐을 나타내고,

- <152> V²는 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, C₁-C₄-알킬, C₁-C₄-알콕시, C₁-C₂-할로게노알킬 또는 C₁-C₂-할로게노알콕시를 나타내며,
- <153> Z는 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, C₁-C₄-알킬, C₁-C₂-할로게노알킬, C₁-C₄-알콕시 또는 C₁-C₂-할로게노알콕시를 나타내나,
- <154> 단 Y가 V¹- 및 V²-치환된 페닐, 2-티에닐 또는 3-티에닐을 나타내는 경우 W, X 및 Z는 브롬, C₂-C₃-알케닐 및 에티닐을 나타내지 않으며, 래디칼 W, X 및 Y중 하나만이 C₂-C₃-알케닐 및 에티닐을 나타낼 수 있고, 다른 래디칼 W, X, Y 및 Z는 어느 것도 브롬을 나타낼 수 없으며,
- <155> A는 특히 바람직하게는 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 불소-치환된 C₁-C₈-알킬, C₁-C₄-알콕시-C₁-C₂-알킬, 임의로 하나의 환 멤버가 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 불소-, 염소-, 메틸-, 에틸- 또는 메톡시-치환된 C₅-C₆-사이클로알킬 또는 C₃-C₆-사이클로알킬-C₁-C₂-알킬을 나타내거나, 각 경우에 임의로 불소-, 염소-, 브롬-, C₁-C₄-알킬-, C₁-C₂-할로게노알킬-, C₁-C₄-알콕시- 또는 C₁-C₂-할로게노알콕시-치환된 페닐 또는 벤질을 나타내고,
- <156> B는 특히 바람직하게는 수소 또는 G-C₄-알킬을 나타내거나,
- <157> A, B 및 이들이 결합된 탄소 원자는 특히 바람직하게는 임의로 하나의 환 멤버가 산소에 의해 대체되고, C₁-C₄-알킬, 트리플루오로메틸 또는 G-C₄-알콕시에 의해 임의로 일치환된 포화 G-C₇-사이클로알킬을 나타내며,
- <158> A 및 Q¹은 특히 바람직하게는 함께, G-C₄-알칸디일을 나타내고,
- <159> D는 특히 바람직하게는 수소를 나타내거나,
- <160> D는 또한 특히 바람직하게는 각 경우에 임의로 불소-치환된 C₃-C₆-알케닐 또는 C₁-C₄-알콕시-C₂-C₆-알킬을 나타내거나, 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소에 의해 대체된 C₃-C₇-사이클로알킬 또는 C₃-C₆-사이클로알킬-G₁-C₂-알킬을 나타내거나,
- <161> D 및 Q¹은 함께, 특히 바람직하게는 G-C₄-알칸디일을 나타내거나,
- <162> Q¹은 특히 바람직하게는 수소, C₁-C₄-알킬, C₁-C₄-알콕시-C₁-C₂-알킬, 또는 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소에 의해 대체되고 임의로 메틸- 또는 메톡시-치환된 G-C₆-사이클로알킬을 나타내며,
- <163> Q²는 특히 바람직하게는 수소, 메틸 또는 에틸을 나타내거나,
- <164> Q¹ 및 Q²는 이들이 결합된 탄소 원자와 함께, 특히 바람직하게는 임의로 하나의 환 멤버가 산소에 의해 대체되고, 임의로 G-C₄-알킬- 또는 C₁-C₄-알콕시-치환된 포화 G-C₆-사이클로알킬을 나타내고,
- <165> G는 특히 바람직하게는 수소(a)를 나타내거나, 하기 그룹중의 하나, 특히 (a), (b), (c), (d) 또는 (g)를 나타내며:



<166>

여기에서,

<167>

E는 금속 이온 또는 암모늄 이온을 나타내고,

<168>

L은 산소 또는 황을 나타내며,

<169>

M은 산소 또는 황을 나타내고,

<170>

R¹은 특히 바람직하게는 각 경우에 임의로 불소- 또는 염소-치환된 C₁-C₁₆-알킬, C₂-C₁₆-알케닐, C₁-C₄-알콕시-C₁-C₂-알킬, C₁-C₄-알킬티오-C₁-C₂-알킬, 또는 임의로 하나 또는 두 개의 직접 인접하지 않은 환 멤버가 산소 및/또는 황에 의해 대체되고 임의로 불소-, 염소-, C₁-C₅-알킬- 또는 C₁-C₅-알콕시-치환된 C₃-C₇-사이클로알킬을 나타내거나,

<171>

임의로 불소-, 염소-, 브롬-, 시아노-, 니트로-, C₁-C₄-알킬-, C₁-C₄-알콕시-, 트리플루오로메틸- 또는 트리플루오로메톡시-치환된 페닐을 나타내거나,

<172>

각 경우에 임의로 불소-, 염소-, 브롬-, 메틸-, 에틸- 또는 트리플루오로메틸-치환된 피리딜 또는 티에닐을 나타내며,

<173>

R²는 특히 바람직하게는 각 경우에 임의로 불소-치환된 C₁-C₁₆-알킬, C₂-C₁₆-알케닐 또는 C₁-C₄-알콕시-C₂-C₄-알킬을 나타내거나,

<174>

임의로 메틸-, 에틸- 또는 메톡시-치환된 C₆-C₇-사이클로알킬을 나타내거나,

<175>

각 경우에 임의로 불소-, 염소-, 브롬-, 시아노-, 니트로-, C₁-C₄-알킬-, C₁-C₃-알콕시-, 트리플루오로메틸- 또는 트리플루오로메톡시-치환된 페닐 또는 벤질을 나타내고,

<176>

R³은 특히 바람직하게는 임의로 불소-치환된 C₁-C₆-알킬을 나타내거나, 임의로 불소-, 염소-, 브롬-, C₁-C₄-알킬-, C₁-C₄-알콕시-, 트리플루오로메틸-, 트리플루오로메톡시-, 시아노- 또는 니트로-치환된 페닐을 나타내며,

<177>

R⁴는 특히 바람직하게는 C₁-C₆-알킬, C₁-C₆-알콕시, C₁-C₆-알킬아미노, 디-(C₁-C₆-알킬)아미노 또는 C₁-C₆-알킬티오를 나타내거나, 각 경우에 임의로 불소-, 염소-, 브롬-, 니트로-, 시아노-, C₁-C₃-알콕시-, 트리플루오로메톡시-, C₁-C₃-알킬- 또는 트리플루오로메틸-치환된 페닐, 벤질, 페녹시 또는 페닐티오를 나타내고,

<178>

R⁵는 특히 바람직하게는 C₁-C₄-알킬, C₁-C₄-알콕시 또는 C₁-C₄-알킬티오를 나타내며,

<179>

R⁶은 특히 바람직하게는 수소, C₁-C₆-알킬, C₃-C₆-사이클로알킬, C₁-C₆-알콕시, C₃-C₆-알케닐 또는 C₁-C₆-알콕시-C₁-C₆-알킬을 나타내거나, 임의로 불소-, 염소-, 브롬-, 트리플루오로메틸-, C₁-C₄-알킬 또는 C₁-C₄-알콕시-치환된 페닐을 나타내거나, 임의로 불소-, 염소-, 브롬-, 메틸-, 에틸-, 트리플루오로메틸- 또는 메톡시-치환된 벤질을 나타내고,

<180>

R⁷은 특히 바람직하게는 수소, C₁-C₆-알킬 또는 C₃-C₆-알케닐을 나타내거나,

<181>

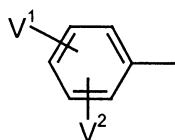
<182> R^6 및 R^7 은 함께, 특히 바람직하게는 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소 또는 황에 의해 대체되고 임의로 메틸- 또는 에틸-치환된 C_4-C_5 -알킬렌 래디칼을 나타낸다.

<183> 특히 바람직한 것으로 언급된 래디칼 정의에서, 할로게노알킬에서와 같이 또한 치환체로서의 할로겐은 불소, 염소, 브롬 및 요오드, 특히 불소 및 염소, 특히 바람직하게는 불소를 나타낸다.

<184> W는 매우 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, 프로필 또는 메톡시를 나타내고,

<185> X는 매우 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소-프로필, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 트리플루오로메틸, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시 또는 시아노(특히 염소, 브롬, 메틸, 에틸, n-프로필 또는 트리플루오로메틸)를 나타내며,

<186> Y는 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, 프로필, 이소-프로필, 불소, 염소, 브롬, 메톡시, 2-티에닐, 3-



티에닐 또는 래디칼 를 나타내고,

<187> V^1 은 매우 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소-프로필, n-부틸, 이소-부틸, t-부틸, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소-프로폭시, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시, 시아노 또는 페닐을 나타내며,

<188> V^2 는 매우 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 메틸, 메톡시 또는 트리플루오로메틸을 나타내고,

<189> Z는 매우 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, 메톡시 또는 트리플루오로메틸(특히 수소, 불소, 염소, 브롬 또는 메틸)을 나타내나,

<190> 단 Y가 V^1 및 V^2 -치환된 페닐, 2-티에닐 또는 3-티에닐을 나타내는 경우 W, X 및 Z는 브롬을 나타내지 않으며,

<191> A는 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, 프로필, 이소-프로필, 부틸, 이소-부틸, 메톡시메틸 또는 에톡시메틸을 나타내고,

<192> B는 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸 또는 에틸을 나타내거나,

<193> A, B 및 이들이 결합된 탄소 원자는 매우 특히 바람직하게는 임의로 하나의 환 멤버가 산소에 의해 대체되고, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소-프로필, 부틸, 트리플루오로메틸, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시 또는 n-부톡시에 의해 임의로 일치환된 포화 C_6-C_6 -사이클로알킬을 나타내며,

<194> A 및 Q^1 은 함께, 매우 특히 바람직하게는 C_4-C_4 -알칸디일을 나타내고,

<195> D는 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타내거나,

<196> D는 매우 특히 바람직하게는 또한 알릴, 2-부테닐, 메톡시에틸, 에톡시에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나,

<197> D 및 Q^1 은 함께, 매우 특히 바람직하게는 C_4-C_4 -알칸디일을 나타내며

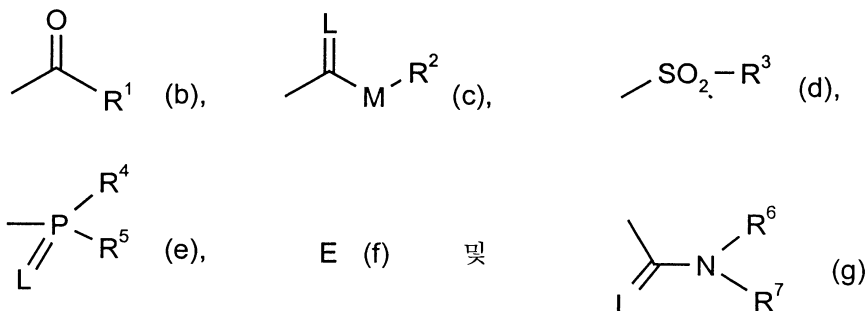
<198> Q^1 은 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, 프로필, 이소-프로필, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내고,

<199> Q^2 는 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸 또는 에틸을 나타내거나,

<200> Q^1 및 Q^2 는 매우 특히 바람직하게는 이들이 결합된 탄소 원자와 함께, 임의로 하나의 환 멤버가 산소에 의해 대체되고 임의로 메틸-, 에틸-, 프로필-, 이소-프로필-, 메톡시-, 에톡시, 프로폭시- 또는 부톡시-치환된 포화 C_5-C_6 -사이클로알킬을 나타내고,

<201> G는 매우 특히 바람직하게는 수소(a)를 나타내거나, 하기 그룹중의 하나, 특히 (a), (b), (c), (d) 또는 (g)를

나타내며:



<202>

<203>

여기에서,

<204>

E는 금속 이온 또는 암모늄 이온을 나타내고,

<205>

L은 산소 또는 황을 나타내며,

<206>

M은 산소 또는 황을 나타내고,

<207>

R¹은 매우 특히 바람직하게는 각 경우에 임의로 불소- 또는 염소-치환된 C₁-C₁₄-알킬, C₂-C₁₄-알케닐, C₁-C₄-알콕시-C₁-C₂-알킬 또는 C₁-C₄-알킬티오-C₁-C₂-알킬을 나타내거나,

<208>

임의로 하나 또는 두 개의 직접 인접하지 않은 환 멤버가 산소 및/또는 황에 의해 대체되고 임의로 불소-, 염소-, 메틸-, 에틸- 또는 메톡시-치환된 C₆-사이클로알킬을 나타내거나,

<209>

임의로 불소-, 염소-, 브롬-, 시아노-, 니트로-, 메틸-, 에틸-, 이소-프로필-, t-부틸-, 메톡시-, 트리플루오로 메틸- 또는 트리플루오로메톡시-치환된 페닐을 나타내거나,

<210>

각 경우에 임의로 불소-, 염소-, 브롬- 또는 메틸-치환된 티에닐 또는 피리딜을 나타내며,

<211>

R²는 매우 특히 바람직하게는 각 경우에 임의로 불소-치환된 C₁-C₁₄-알킬, C₂-C₁₄-알케닐 또는 C₁-C₄-알콕시-C₂-C₃-알킬을 나타내거나,

<212>

임의로 메틸-, 에틸- 또는 메톡시-치환된 C₆-사이클로알킬을 나타내거나,

<213>

각 경우에 임의로 불소-, 염소-, 시아노-, 니트로-, 메틸-, 에틸-, 이소-프로필-, t-부틸-, 메톡시-, 트리플루오로메틸- 또는 트리플루오로메톡시-치환된 페닐 또는 벤질을 나타내고,

<214>

R³는 매우 특히 바람직하게는 임의로 불소-치환된 메틸, 에틸, n-프로필 또는 이소-프로필을 나타내거나,

<215>

각 경우에 임의로 불소-, 염소-, 브롬-, 메틸-, t-부틸-, 메톡시-, 트리플루오로메틸-, 트리플루오로메톡시-, 시아노- 또는 니트로-치환된 페닐을 나타내며,

<216>

R⁴는 매우 특히 바람직하게는 C₁-C₄-알킬, C₁-C₄-알콕시, C₁-C₄-알킬아미노, 디-(C₁-C₄-알킬)아미노 또는 C₁-C₄-알킬티오를 나타내거나,

<217>

각 경우에 임의로 불소-, 염소-, 브롬-, 니트로-, 시아노-, C₁-C₂-알콕시-, 트리플루오로메톡시- 또는 C₁-C₃-알킬-치환된 페닐, 페녹시 또는 페닐티오를 나타내고,

<218>

R⁵는 매우 특히 바람직하게는 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 메틸티오 또는 에틸티오를 나타내며,

<219>

R⁶은 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타내거나, C₁-C₄-알킬, C₃-C₆-사이클로알킬, C₁-C₄-알콕시, C₃-C₄-알케닐 또는 C₁-C₄-알콕시-C₁-C₄-알킬을 나타내고,

<220>

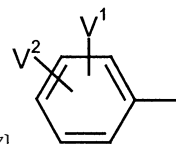
R⁷은 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타내거나, C₁-C₄-알킬 또는 C₃-C₄-알케닐을 나타내거나,

<221> R^6 및 R^7 은 매우 특히 바람직하게는 함께, 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소 또는 황에 의해 대체된 C_5-C_6 -알킬렌 래디칼을 나타낸다.

<222> 가장 바람직한 것으로 언급된 일반식 (I)의 화합물에서, 래디칼은 다음과 같이 정의된다:

<223> W는 가장 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 메틸 또는 에틸을 나타내고,

<224> X는 가장 바람직하게는 염소, 브롬, 메틸, 에틸, 프로필 또는 트리플루오로메틸을 나타내며,



<225> Y는 가장 바람직하게는 수소, 염소, 브롬, 불소, 메틸, 에틸 또는 래디칼을 나타내고,

<226> V^1 은 가장 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 메틸, t-부틸, 메톡시, 트리플루오로메틸 또는 페닐을 나타내며,

<227> V^2 는 가장 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 메틸, 메톡시 또는 트리플루오로메틸을 나타내고,

<228> Z는 가장 바람직하게는 수소, 브롬, 염소 또는 메틸을 나타내며,

<229> A는 가장 바람직하게는 메틸, 에틸 또는 프로필을 나타내고,

<230> B는 가장 바람직하게는 메틸 또는 에틸을 나타내거나,

<231> A, B 및 이들이 결합된 탄소 원자는 가장 바람직하게는 임의로 하나의 환 멤버가 산소에 의해 대체되고, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시 또는 n-부톡시에 의해 임의로 일치환된 포화 C_6 -사이클로알킬을 나타내며,

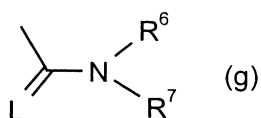
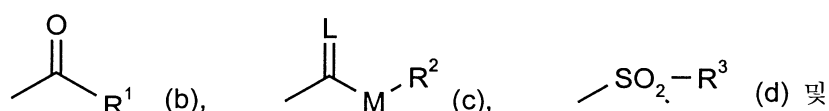
<232> D는 가장 바람직하게는 수소를 나타내거나,

<233> D는 가장 바람직하게는 또한 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내고,

<234> Q^1 및 Q^2 는 가장 바람직하게는 수소를 나타내며,

<235> D 및 Q^1 은 함께, 가장 바람직하게는 부탄디일을 나타내고

<236> G는 가장 바람직하게는 수소(a)를 나타내거나, 하기 그룹중의 하나를 나타내며:



<237>

<238> 여기에서,

<239> M은 산소 또는 황을 나타내고,

<240> R^1 은 가장 바람직하게는 C_1-C_8 -알킬, C_2-C_4 -알케닐, 메톡시메틸, 에톡시메틸, 에틸티오메틸, 또는 임의로 불소-, 염소-, 메틸-, 에틸- 또는 메톡시-치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나,

<241> 임의로 불소-, 염소-, 브롬-, 시아노-, 니트로-, 메틸-, 에틸-, 이소-프로필-, t-부틸-, 메톡시-, 트리플루오로메틸- 또는 트리플루오로메톡시-치환된 페닐을 나타내거나,

<242> 각 경우에 임의로 염소- 또는 메틸-치환된 티에닐 또는 피리딜을 나타내며,

<243> R^2 는 가장 바람직하게는 각 경우에 임의로 불소-치환된 C_1-C_8 -알킬, C_2-C_4 -알케닐, 메톡시에틸, 에톡시에틸, 프로폭시에틸, 이소프로폭시에틸, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나,

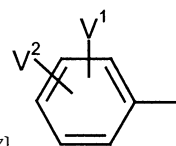
<244> 각 경우에 임의로 불소-, 염소-, 시아노-, 니트로-, 메틸-, 에틸-, 이소-프로필-, t-부틸-, 메톡시-, 트리플루오로메틸- 또는 트리플루오로메톡시-치환된 페닐 또는 벤질을 나타내고,

<245> R^3 는 가장 바람직하게는 메틸을 나타내며,

<246> R^6 및 R^7 은 가장 바람직하게는 함께, 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소에 의해 대체된 C_6 -알킬렌 래디칼을 나타내거나,

<247> W는 가장 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 메틸 또는 에틸을 나타내고,

<248> X는 가장 바람직하게는 염소, 브롬, 메틸, 에틸, 프로필 또는 트리플루오로메틸을 나타내며,



<249> Y는 가장 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, 불소, 염소, 브롬 또는 래디칼을 나타내고,

<250> V^1 은 가장 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 메틸, t-부틸, 메톡시, 트리플루오로메틸 또는 페닐을 나타내며,

<251> V^2 는 가장 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 메틸, 메톡시 또는 트리플루오로메틸을 나타내고,

<252> Z는 가장 바람직하게는 수소, 염소, 브롬 또는 메틸을 나타내며,

<253> A 및 B는 가장 바람직하게는 수소를 나타내고,

<254> D는 가장 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, 프로필, 이소-프로필, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내며,

<255> D 및 Q^1 은 함께, 가장 바람직하게는 부탄디일을 나타내고

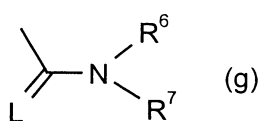
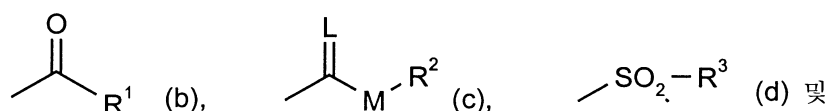
<256> Q^1 은 가장 바람직하게는 메틸, 에틸 또는 프로필을 나타내며,

<257> Q^2 는 가장 바람직하게는 메틸을 나타내나;

<258> 단 D 및 Q^1 이 함께, 부탄디일을 나타내는 경우 Q^2 는 또한 수소를 나타낼 수 있거나,

<259> Q^1 및 Q^2 는 이들이 결합된 탄소 원자와 함께, 가장 바람직하게는 임의로 하나의 환 멤버가 산소에 의해 대체되고 임의로 메틸-, 에틸-, 메톡시-, 에톡시-, 프로폭시- 또는 부톡시-치환된 C_6 -사이클로알킬을 나타내고,

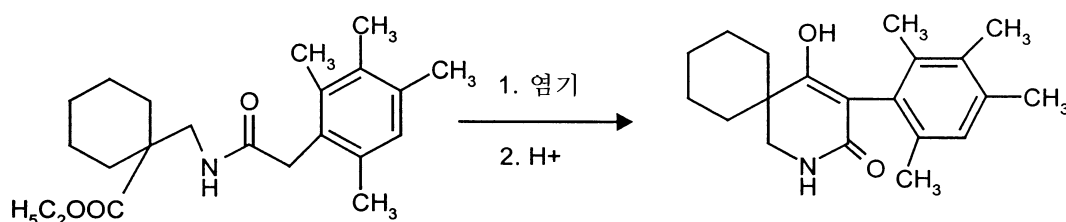
<260> G는 가장 바람직하게는 수소(a)를 나타내거나, 하기 그룹중의 하나를 나타내며:



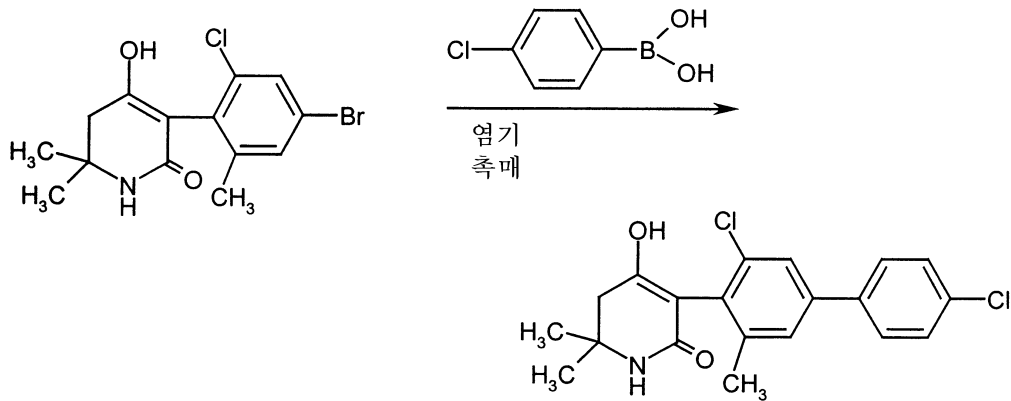
<261>

<262> 여기에서,

- <263> M은 산소 또는 황을 나타내고,
- <264> R¹은 가장 바람직하게는 C₁-C₈-알킬, C₂-C₄-알케닐, 메톡시메틸, 에톡시메틸, 에틸티오메틸, 또는 임의로 불소-, 염소-, 메틸-, 에틸- 또는 메톡시-치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나,
- <265> 임의로 불소-, 염소-, 브롬-, 시아노-, 니트로-, 메틸-, 에틸-, 이소-프로필-, t-부틸-, 메톡시-, 트리플루오로메틸- 또는 트리플루오로메톡시-치환된 페닐을 나타내거나,
- <266> 각 경우에 임의로 염소- 또는 메틸-치환된 티에닐 또는 피리딜을 나타내며,
- <267> R²는 가장 바람직하게는 각 경우에 임의로 불소-치환된 C₁-C₈-알킬, C₂-C₄-알케닐, 메톡시에틸, 에톡시에틸, 프로폭시에틸, 이소프로폭시에틸, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나,
- <268> 각 경우에 임의로 불소-, 염소-, 시아노-, 니트로-, 메틸-, 에틸-, 이소-프로필-, t-부틸-, 메톡시-, 트리플루오로메틸- 또는 트리플루오로메톡시-치환된 페닐 또는 벤질을 나타내고,
- <269> R³는 가장 바람직하게는 메틸을 나타내며,
- <270> R⁶ 및 R⁷은 가장 바람직하게는 함께, 임의로 하나의 메틸렌 그룹이 산소에 의해 대체된 C₆-알킬렌 래디칼을 나타낸다.
- <271> 상기 언급된 일반적인거나 바람직한 래디칼의 정의 또는 설명은 목적하는 바대로, 즉 각각의 범위와 바람직한 범위사이의 조합을 포함하여 서로 조합될 수 있다. 이것은 최종 생성물 및, 상응하게 전구체 및 중간체에 적용된다.
- <272> 본 발명에 있어서, 상기 바람직한(보다 바람직한) 것으로 언급된 의미들의 조합을 포함하는 일반식 (I)의 화합물이 바람직하다.
- <273> 본 발명에 있어서, 상기 특히 바람직한 것으로 언급된 의미들의 조합을 포함하는 일반식 (I)의 화합물이 특히 바람직하다.
- <274> 본 발명에 있어서, 상기 매우 특히 바람직한 것으로 언급된 의미들의 조합을 포함하는 일반식 (I)의 화합물이 매우 특히 바람직하다.
- <275> G가 수소를 나타내는 일반식 (I)의 화합물이 가장 바람직하다.
- <276> D가 수소를 나타내는 일반식 (I)의 화합물이 가장 바람직하다.
- <277> 또한, D가 임의로 치환된 알케닐, 알키닐, 알콕시알킬 또는 사이클로알킬을 나타내는 일반식 (I)의 화합물이 가장 바람직하다.
- <278> 예를 들어, 또한 알콕시에서와 같이 헤테로 원자와 결합된 것을 포함하여 알킬 또는 알케닐과 같은 포화 또는 불포화된 탄화수소 래디칼은 가능한, 각 경우에 직쇄 또는 측쇄일 수 있다.
- <279> 달리 언급이 없으면, 임의로 치환된 래디칼은 일- 또는 다치환될 수 있으며, 다치환된 경우 치환체는 동일하거나 상이할 수 있다.
- <280> 방법 (A)에 따라 에틸 N-[(2,3,4,6-테트라메틸)-페닐아세틸]-1-아미노메틸-사이클로헥산-카복실레이트가 출발 물질로 사용된 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:

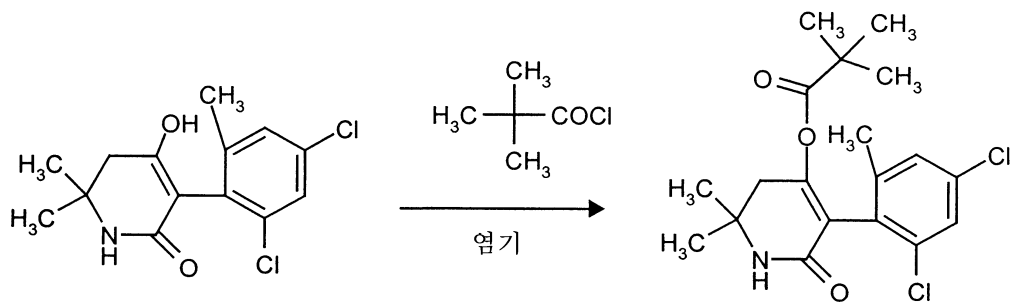


- <281>
- <282> 방법 (B_Ⅷ)에 따라, 3-[(2-클로로-4-브로모-4-메틸)-페닐]-6,6-디메틸-피페리딘-2,4-디온 및 4-클로로페닐보론 산이 출발 물질로 사용된 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



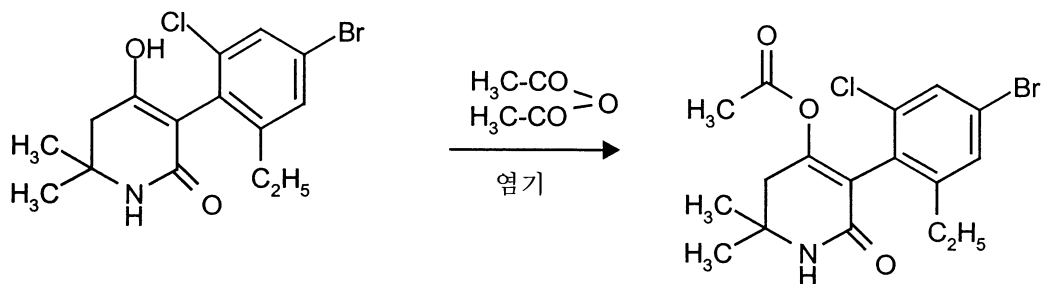
<283>

<284> 방법 (Ca)에 따라, 3-[(2,4-디클로로-6-메틸)-페닐]-6,6-디메틸-피페리딘-2,4-디온 및 피발로일 클로라이드가 출발 물질로 사용된 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



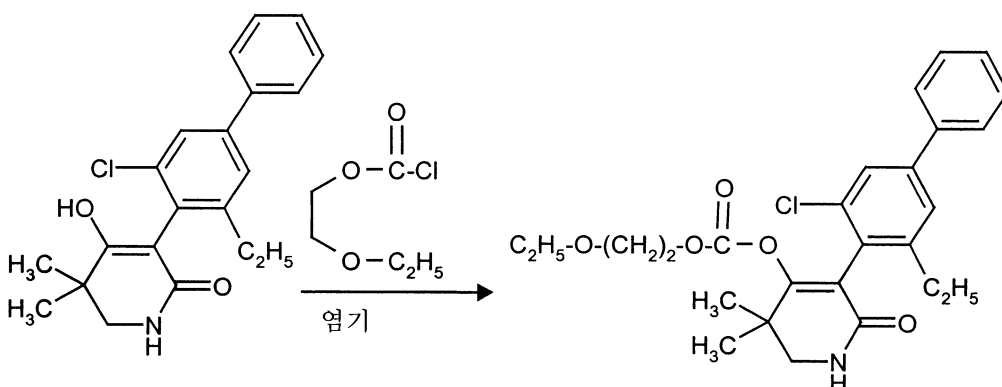
<285>

<286> 방법 (Cβ)에 따라, 3-[(4-브로모-2-클로로-6-에틸)-페닐]-6,6-디메틸-피페리딘-2,4-디온 및 무수 아세트산이 출발 물질로 사용된 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



<287>

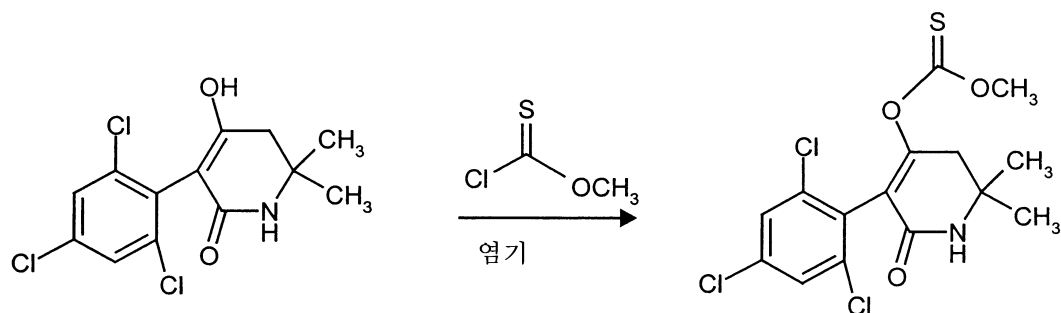
<288> 방법 (D)에 따라, 3-[(2-클로로-6-에틸-4-페닐)-페닐]-5,5-디메틸피페리딘-2,4-디온 및 에톡시에틸 클로로포름레이트가 출발 물질로 사용된 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



<289>

<290>

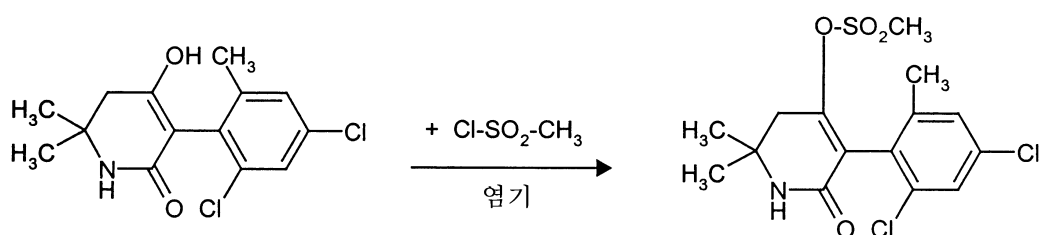
방법 (E)에 따라, 3-[2,4,6-트리클로로-페닐]-6,6-디메틸-피페리딘-2,4-디온 및 메틸 클로로모노티오포르메이트가 출발 물질로 사용된 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



<291>

<292>

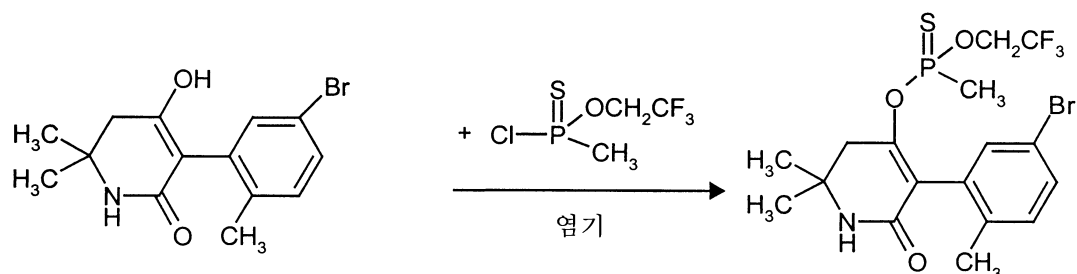
방법 (F)에 따라, 3-(2,4-디클로로-6-메틸-페닐)-6,6-디메틸-피페리딘-2,4-디온 및 메탄설폰일 클로라이드가 출발 물질로 사용된 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



<293>

<294>

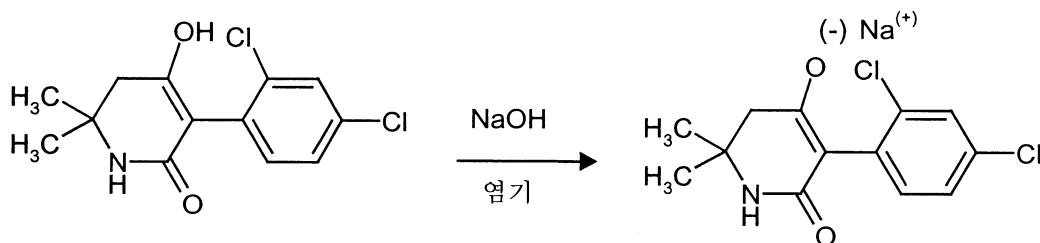
방법 (G)에 따라, 2-(2-메틸-5-브로모-페닐)-6,6-디메틸-피리딘-2,4-디온 및 2,2,2-트리플루오로에틸 메탄티오 포스포닐 클로라이드가 출발 물질로 사용된 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



<295>

<296>

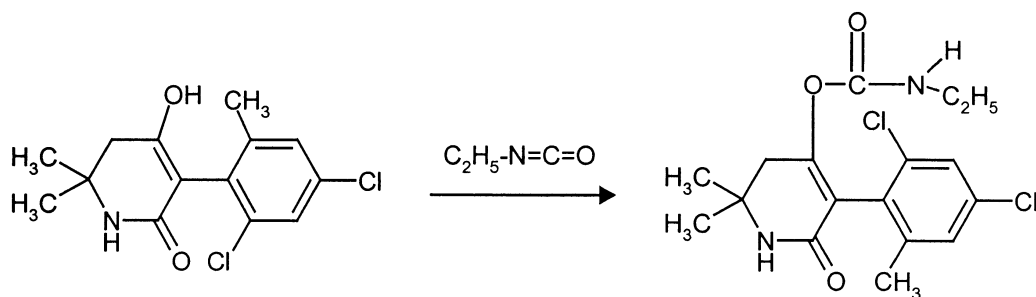
방법 (H)에 따라, 3-(2,4-디클로로-페닐)-6,6-디메틸-피페리딘-2,4-디온 및 NaOH가 성분들로 사용된 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



<297>

<298>

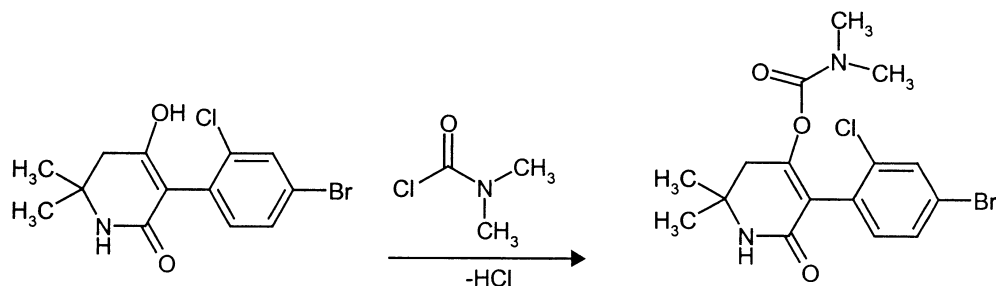
방법 (Ia)에 따라, 3-(2,4-디클로로-6-메틸-페닐)-6,6-디메틸-피페리딘-2,4-디온 및 에틸 이소시아네이트가 출발 물질로 사용된 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



<299>

<300>

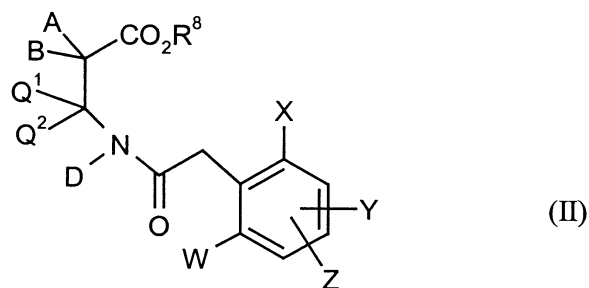
방법 (Iβ)에 따라, 3-(2-클로로-4-브로모-페닐)-6,6-디메틸-피페리딘-2,4-디온 및 디메틸카바모일 클로라이드가 출발 물질로 사용된 경우, 본 발명에 따른 방법의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



<301>

<302>

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



<303>

<304>

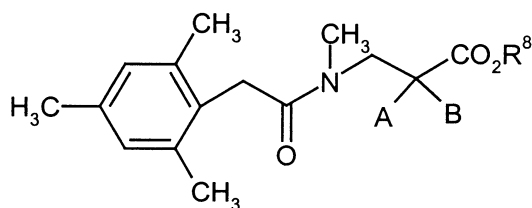
상기 식에서,

<305>

A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y, Z 및 R⁸은 각각 상기 정의된 바와 같으나,

<306>

단, 이들 화합물중에서 하기 화합물은 제외된다:



<307>

<308>

상기 식에서,

<309>

A 및 B는 각각 메틸을 나타내거나,

<310>

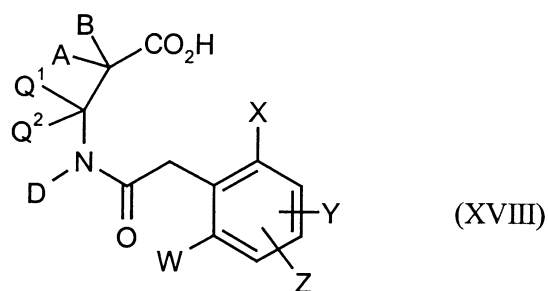
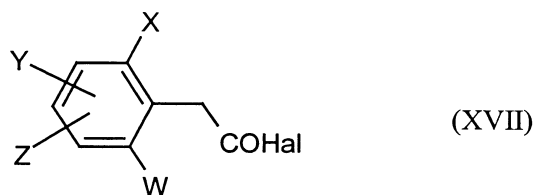
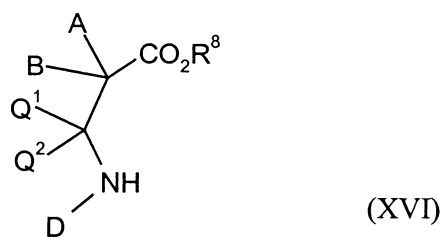
A 및 B는 -(CH₂)₅-를 나타내고,

<311>

R⁸은 알킬을 나타낸다.

<312>

일반식 (II)의 아실아미노산 에스테르는, 예를 들어 하기 일반식 (XVI)의 아미노산 유도체를 일반식 (XVII)의 치환된 페닐아세틸 할라이드로 아실화시키거나(참조: Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968), 하기 일반식 (VIII)의 아실아미노산을 에스테르화시킴으로써 취득된다(참조: Chem. Ind. (London) 1568(1968)):

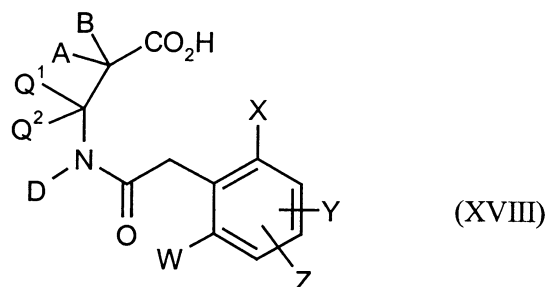


상기 식에서,

A, B, D, Q¹, Q², R⁸, W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같으며,

Hal 은 염소 또는 브롬을 나타낸다.

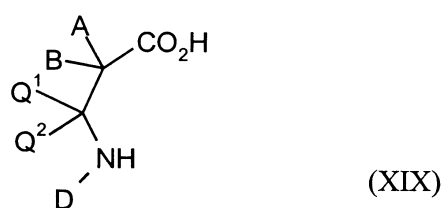
일반식 (XVIII)의 화합물은 신규하다:

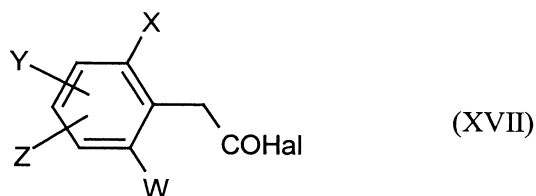


상기 식에서,

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

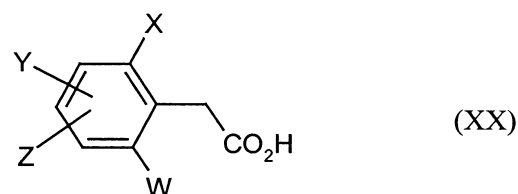
일반식 (XVIII)의 화합물은 일반식 (XIX)의 아미노산을, 예를 들어 쇼텐-바우만 (Schotten-Baumann)에 따라 하기 일반식 (XVII)의 치환된 페닐아세틸 할라이드로 아실화시킴으로써 수득된다(참조: Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, p.505):



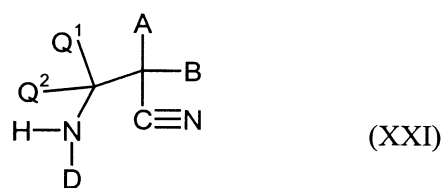
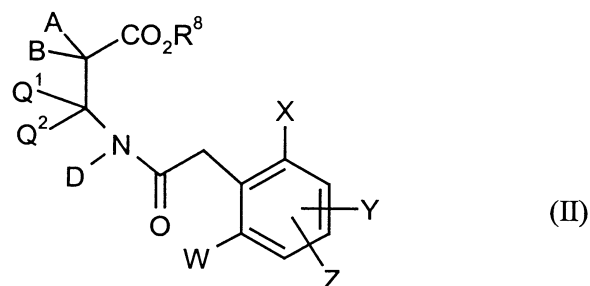


- <325>
- <326> 상기 식에서,
- <327> A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같으며,
- <328> Hal 은 염소 또는 브롬을 나타낸다.

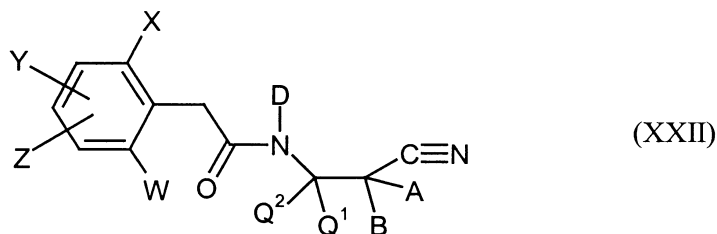
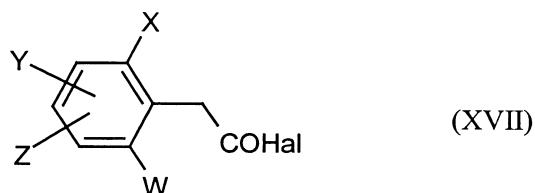
- <329> 일반식 (XVII)의 화합물은 공지되었다. 이들은 원칙적으로 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다(참조예: H. Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie [Methods of organic chemistry], Vol. 8, 467-469(1952)).
- <330> 일반식 (XVII)의 화합물은, 예를 들어 하기 일반식 (XX)의 치환된 페닐아세트산을, 경우에 따라 회석제(예: 임의로 염소화된 지방족 또는 방향족 탄화수소, 예를 들면 톨루엔 또는 메틸렌 클로라이드)의 존재하에 -20 내지 150 °C, 바람직하게는 -10 내지 100 °C의 온도에서 할로겐화제(예: 티오닐 클로라이드, 티오닐 브로마이드, 옥살릴 클로라이드, 포스겐, 삼염화인, 삼브롬화인 또는 오염화인)과 반응시킴으로써 수득된다:



- <331>
- <332> 상기 식에서,
- <333> W, X, Y 및 Z는 각각 상기 정의된 바와 같다.
- <334> 일반식 (XVI) 및 (XIX)의 화합물중 일부는 공지되어 있고/있거나, 공지된 방법으로 제조될 수 있다(참조예: T. Suzuki et al., Synthetic Commun. 28, 701 (1998), R. Graf, Justus Liebigs Ann. Chem. 661, 111(1963)).
- <335> 또한, 상기 방법 (A)에 사용된 일반식 (II)의 출발물질은 하기 일반식 (XXI)의 아미노니트릴을 하기 일반식 (XVII)의 치환된 페닐아세틸 할라이드와 반응시켜 하기 일반식 (XXII)의 화합물을 수득하고, 계속해서 이를 산 알콜분해(acid alcoholysis)시킴으로써 제조할 수 있다:



- <337>



상기 식에서,

A, B, D, Q¹, Q², X, Y, Z, R⁸ 및 Hal 은 각각 상기 정의된 바와 같다.

일반식 (XXII)의 화합물 또한 신규하다.

일반식 (XXI)의 아미노니트릴중 일부는 공지되어 있고/있거나, 공지된 방법으로 제조될 수 있다(참조예: T. Suzuki et al., Chem. Pharm. Bull. 46, 1116(1998)).

방법 (Ba)를 수행하는데 필요한 일반식 (III)의 실릴아세틸렌중 일부는 상업적으로 입수할 수 있거나, 일반적으로 공지된 방법으로 제조될 수 있다.

방법 (Bβ)를 수행하는데 필요한 일반식 (IV)의 비닐스타난중 일부가 또한 상업적으로 입수될 수 있거나, 공지된 방법으로 제조될 수 있다.

방법 (Bγ)를 수행하는데 필요한 일반식 (V)의 보론산중 일부는 상업적으로 입수할 수 있거나, 일반적으로 공지된 방법에 의해 간단하게 제조될 수 있다:



상기 식에서,

Y는 임의로 치환된 페닐 또는 헤트아릴을 나타낸다.

본 발명에 따른 방법 (C), (D), (E), (F), (G), (H) 및 (I)를 수행하는데 출발 물질로 추가로 필요한 일반식 (VI)의 산 할라이드, 일반식 (VII)의 무수 카복실산, 일반식 (VIII)의 클로로포름산 에스테르 또는 클로로포름산 티오에스테르, 일반식 (IX)의 클로로모노티오포름산 에스테르 또는 클로로디티오포름산 에스테르, 일반식 (X)의 설포닐 클로라이드, 일반식 (XI)의 인 화합물, 일반식 (XII) 및 (XIII)의 금속 수산화물, 금속 알콕사이드 또는 아민, 일반식 (XIV)의 이소시아네이트 및 일반식 (XV)의 카바모일 클로라이드는 유기 또는 무기 화학에 일반적으로 공지된 화합물이다.

방법 (A)는 A, B, D, Q¹, Q², W, X, Y, Z 및 R⁸이 각각 상기에 정의된 바와 같은 일반식 (II)의 화합물을 염기의 존재하에서 분자내 축합시킴을 특징으로 한다.

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

본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는데 적합한 염기(탈양성자화제)는 모든 통상의 양성자 수용체이다. 이들로 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 산화물, 수산화물 및 탄산염, 예를 들어, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 산화마그네슘, 산화칼슘, 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산칼슘을 사용하는 것이 바람직하며, 또한 이들은 상 전이 촉매, 예

를 들어, 트리에틸벤질암모늄 클로라이드, 테트라부틸암모늄 브로마이드, 아도젠 464(=메틸트리알킬(C₈-C₁₀)암모늄 클로라이드) 또는 TDA 1(=트리스(메톡시에톡시에틸)-아민)의 존재하에서 사용될 수 있다. 알칼리 금속, 예를 들어, 소듐 또는 포타슘이 또한 사용될 수 있다. 또한, 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 아미드 및 수소화물, 예를 들어, 소듐 아미드, 수소화나트륨 및 수소화칼슘, 및 추가로 또한 알칼리 금속 알콕사이드, 예를 들어, 소듐 메톡사이드, 소듐 에톡사이드 및 포타슘 t-부톡사이드가 사용될 수 있다.

- <354> 본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는 경우, 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로 반응은 -50 내지 200 °C, 바람직하게는 -20 내지 150 °C 사이의 온도에서 수행된다.
- <355> 본 발명에 따른 방법 (A)는 일반적으로 대기압하에서 수행된다.
- <356> 본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는 경우, 일반식 (II)의 반응성분 및 탈양성자화 염기는 일반적으로 대략 동 몰량으로 사용된다. 그러나, 한 성분 또는 다른 성분을 좀 더 많은(3몰 이하)으로 사용하는 것도 가능하다.
- <357> 본 발명에 따른 방법 B(α) 내지 B(γ)를 수행하는데 적합한 촉매는 팔라듐(0) 복합체이다. 예를 들어, 테트라키스(트리페닐포스핀)팔라듐이 사용된다. 또한, 팔라듐(II) 화합물, 예를 들어 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II) 클로라이드가 적합하다.
- <358> 본 발명에 따른 방법 B(α) 내지 B(γ)를 수행하는데 적합한 산 수용체는 무기 또는 유기 염기이다. 이들은 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, 중탄산칼륨, 알칼리 금속 플루오라이드, 예를 들어 불화칼륨, 불화세슘, 및 또한 삼급 아민, 예를 들어 트리메틸아민, 트리에틸아민, 트리부틸아민, N,N-디메틸아닐린, N,N-디메틸벤질아민, 피리딘, N-메틸피페리딘, N-메틸모르폴린, N,N-디메틸아미노피리딘, 디아자바이사이클로옥탄(DABCO), 디아자바이사이클로노넨(DBN) 또는 디아자바이사이클로운데센(DBU)이 포함된다.
- <359> 본 발명에 따른 방법 B(γ)를 수행하는데 적합한 희석제는 물, 유기 용매 및 이들의 혼합물이다. 방법 B(α) 내지 B(γ)에 예시적인 것으로 언급될 수 있는 유기 용매는 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-, i-, sec 또는 t-부탄올, 에탄디올, 프로판-1,2-디올, 에톡시에탄올, 메톡시에탄올, 디에틸렌 글리콜 모노메틸 에테르, 디에틸렌 글리콜 모노에틸 에테르; 물이다.
- <360> 본 발명에 따른 방법 (B)를 수행하는 경우, 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로 반응은 0 내지 +180 °C, 바람직하게는 +50 내지 +150 °C 사이의 온도에서 수행된다.
- <361> 방법 B(α)를 수행하는 경우, 일반식 (III)의 실릴아세틸렌과 일반식 (I-a) 내지 (I-g)의 화합물은 1:1 내지 10:1, 바람직하게는 1:1 내지 3:1의 몰비로 사용된다.
- <362> 방법 B(β)를 수행하는 경우, 일반식 (IV)의 비닐스탄과 일반식 (I-a) 내지 (I-g)의 화합물은 1:1 내지 10:1, 바람직하게는 1:1 내지 3:1의 몰비로 사용된다.
- <363> 방법 B(γ)를 수행하는 경우, 일반식 (V)의 보론산과 일반식 (I-a) 내지 (I-g)의 화합물은 1:1 내지 3:1, 바람직하게는 1:1 내지 2:1의 몰비로 사용된다.
- <364> 촉매는 일반적으로 화합물 (I-a) 내지 (I-g) 1 몰당 0.005 내지 0.5 몰, 바람직하게는 0.01 내지 0.1 몰의 양으로 사용된다. 염기는 일반적으로 과량으로 사용된다.
- <365> 방법 (C α)는 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합체의 존재하에서 일반식 (VI)의 카보닐 할라이드와 반응시킴을 특징으로 한다.
- <366> 본 발명에 따른 방법 (C α)에 사용하기에 적합한 희석제는 산 할라이드에 불활성인 모든 용매이다. 이들은 탄화수소, 예를 들어, 벤진, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 테트라린, 또한 할로젠화 탄화수소, 예를 들어, 메틸렌 클로라이드, 클로로포름, 사염화탄소, 클로로벤젠 및 o-디클로로벤젠, 및 또한 케톤, 예를 들어, 아세톤 및 메틸 이소프로필 케톤, 추가로 에테르, 예를 들어, 디에틸 에테르, 테트라하이드로푸란 및 디옥산, 카복실산 에스

테르, 예를 들어, 에틸 아세테이트, 니트릴, 예를 들어 아세토니트릴, 및 강한 극성 용매, 예를 들어, 디메틸포름아미드, 디메틸설폭사이드 및 설폴란을 사용하는 것이 바람직하다. 산 할라이드가 가수분해에 대하여 안정한 경우, 반응은 또한 물의 존재하에서 수행될 수도 있다.

<367> 본 발명에 따른 방법 (C α)의 반응에 적합한 산 결합체는 통상의 모든 산 수용체들이다. 이들로는 3급 아민, 예를 들어, 트리에틸아민, 피리딘, 디아자비사이클로옥탄(DABCO), 디아자비사이클로운데센(DBU), 디아자비사이클로노넨(DBN), 휘니그(Huenig) 염기 및 N,N-디메틸-아닐린, 추가로 알칼리 토금속 산화물, 예를 들어, 산화마그네슘 및 산화칼슘, 또한 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 탄산염, 예를 들어, 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산칼슘, 및 또한 알칼리 금속 수산화물, 예를 들어, 수산화나트륨 및 수산화칼륨을 사용하는 것이 바람직하다.

<368> 본 발명에 따른 방법 (C α)의 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 반응은 -20 내지 +150 °C, 바람직하게는 0 내지 100 °C 사이의 온도에서 수행된다.

<369> 본 발명에 따른 방법 (C α)를 수행하는 경우, 일반식 (I-a)의 출발 물질과 일반식 (VI)의 카보닐 할라이드는 일반적으로 각 경우에 대략 등가량으로 사용된다. 그러나, 카보닐 할라이드를 상대적 과량(5몰 이하)으로 사용하는 것도 가능하다. 후처리는 통상의 방법으로 수행된다.

<370> 방법 (C β)는 일반식 (I-a)의 화합물을, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합체의 존재하에서 일반식 (VII)의 무수 카복실산과 반응시킴을 특징으로 한다.

<371> 본 발명에 따른 방법 (C β)에 사용하기에 바람직한 희석제는 산 할라이드를 사용하는 경우 바람직하게 사용되는 희석제이다. 또한, 과량으로 사용된 무수 카복실산이 또한 동시에 희석제로도 작용할 수 있다.

<372> 방법 (C β)에서, 경우에 따라 첨가되는 산 결합체는 바람직하게는 산 할라이드를 사용한 경우 바람직한 산 결합체이다.

<373> 본 발명에 따른 방법 (C β)에서 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 반응은 -20 내지 +150 °C, 바람직하게는 0 내지 100 °C 사이의 온도에서 수행된다.

<374> 본 발명에 따른 방법 (C β)를 수행하는 경우, 일반식 (I-a)의 출발 물질과 일반식 (VII)의 무수 카복실산은 일반적으로 각각 대략 등가량으로 사용된다. 그러나, 무수 카복실산을 상대적 과량(5몰 이하)으로 사용하는 것도 가능하다. 후처리는 통상의 방법으로 수행된다.

<375> 일반적으로, 희석제 및 과량의 무수 카복실산 및, 또한 형성된 카복실산을 증류에 의해 또는 유기 용매나 물로 세척하여 제거하는 방법이 채용된다.

<376> 방법 (D)는 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 희석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합체의 존재하에서 일반식 (VIII)의 클로로포름산 에스테르 또는 클로로포름산 티오에스테르와 반응시킴을 특징으로 한다.

<377> 본 발명에 따른 방법 (D)의 반응에 사용하기에 적합한 산 결합체는 통상의 모든 산 수용체이다. 이들로는 3급 아민, 예를 들어, 트리에틸아민, 피리딘, DABCO, DBU, DBA, 휘니그 염기 및 N,N-디메틸아닐린, 추가로 알칼리 토금속 산화물, 예를 들어, 산화마그네슘 및 산화칼슘, 알칼리 금속 탄산염 및 알칼리 토금속 탄산염, 예를 들어, 탄산나트륨, 탄산칼륨 및 탄산칼슘, 및 또한 알칼리 금속 수산화물, 예를 들어, 수산화나트륨 및 수산화칼륨을 사용하는 것이 바람직하다.

<378> 본 발명에 따른 방법 (D)에 사용하기에 적합한 희석제는 클로로포름산 에스테르 또는 클로로포름산 티오에스테르에 불활성인 모든 용매이다. 이들로는 탄화수소, 예를 들어, 벤진, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 및 테트라린, 추가로 할로젠화탄화수소, 예를 들어, 메틸렌 클로라이드, 클로로포름, 사염화탄소, 클로로벤젠 및 o-디클로로벤젠, 케톤, 예를 들어, 아세톤 및 메틸이소프로필 케톤, 에테르, 예를 들어, 디에틸 에테르, 테트라하이드로푸란 및 디옥산, 또한 카복실산 에스테르, 예를 들어, 에틸 아세테이트, 니트릴, 예를 들어 아세토니트릴, 및 또한 강한 극성 용매, 예를 들어, 디메틸포름아미드, 디메틸 설폭사이드 및 설폴란을 사용하는 것이 바람직하다.

<379> 본 발명에 따른 방법 (D)를 수행하는 경우, 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 반응이 희석제 및 산 결합체의 존재하에 수행되는 경우, 반응 온도는 일반적으로 -20 내지 +100 °C, 바람직하게는 0 내지 50 °C 사이이다.

<380> 본 발명에 따른 방법 (D)는 일반적으로 대기압하에서 수행된다.

- <381> 본 발명에 따른 방법 (D)를 수행하는 경우, 일반식 (I-a)의 출발 물질과 일반식 (VIII)의 적합한 클로로포름산 에스테르 또는 클로로포름산 티오에스테르는 각 경우에 일반적으로 대략 등가량으로 사용된다. 그러나, 한 성분 또는 다른 성분을 상대적 과량(2몰 이하)으로 사용하는 것도 가능하다. 후처리는 통상적인 방법으로 수행된다. 일반적으로, 침전된 염을 제거한 후, 회석제를 탈거하여 잔류 반응 혼합물을 농축시킨다.
- <382> 본 발명에 따른 방법 (E)는 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 회석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (IX)의 화합물과 반응시킴을 특징으로 한다.
- <383> 제조 방법 (E)에서, 일반식 (I-a)의 출발 물질 1 몰당 약 1 몰의 일반식 (IX)의 클로로모노티오포름산 에스테르 또는 클로로디티오포름산 에스테르를 0 내지 120 °C, 바람직하게는 20 내지 60 °C에서 반응시킨다.
- <384> 경우에 따라 첨가되는 적합한 회석제는 모든 불활성 극성 유기 용매, 예를 들어, 니트릴, 에테르, 에스테르, 아미드, 설펜, 설펜사이드, 및 할로게노알칸이다.
- <385> 아세토니트릴, 에틸 아세테이트, 디메틸 설펜사이드, 테트라하이드로푸란, 디메틸포름아미드 또는 메틸렌 클로라이드를 사용하는 것이 바람직하다.
- <386> 바람직한 구체예에서, 일반식 (I-a)의 화합물의 에놀레이트 염을 강한 탈양성자화제, 예를 들어, 수소화나트륨 또는 포타슘 t-부톡사이드를 첨가하여 제조하는 경우, 산 결합제를 추가로 첨가하는 것은 필요치 않다.
- <387> 산 결합제가 사용되는 경우, 이들은 통상의 무기 또는 유기 염기, 예를 들어 수산화나트륨, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 피리딘 및 트리에틸아민이다.
- <388> 반응은 대기압 또는 승압하에서 수행될 수 있으며, 바람직하게는 대기압하에서 수행된다. 후처리는 통상적인 방법으로 수행된다.
- <389> 본 발명에 따른 방법 (F)는 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 회석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (X)의 설포닐 클로라이드와 반응시킴을 특징으로 한다.
- <390> 제조 방법 (F)에서, 일반식 (I-a)의 출발 물질 1 몰당 약 1몰의 일반식 (X)의 설포닐 클로라이드를 -20 내지 150 °C, 바람직하게는 20 내지 70 °C에서 반응시킨다.
- <391> 경우에 따라 첨가되는 적합한 회석제는 모든 불활성 극성 유기 용매, 예를 들어, 에스테르, 에테르, 아미드, 니트릴, 설펜, 설펜사이드 또는 할로젠화 탄화수소, 예를 들어 메틸렌 클로라이드이다.
- <392> 아세토니트릴, 에틸 아세테이트, 디메틸 설펜사이드, 테트라하이드로푸란, 디메틸포름아미드 또는 메틸렌 클로라이드를 사용하는 것이 바람직하다.
- <393> 바람직한 구체예에서, 화합물 (I-a)의 에놀레이트 염을 강한 탈양성자화제(예를 들어, 수소화나트륨 또는 포타슘 t-부톡사이드)를 첨가하여 제조하는 경우, 산 결합제를 추가로 첨가하는 것은 필요치 않다.
- <394> 산 결합제가 사용되는 경우, 이들은 통상의 무기 또는 유기 염기, 예를 들어 수산화나트륨, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 피리딘 및 트리에틸아민이다.
- <395> 반응은 대기압 또는 승압하에서 수행될 수 있으며, 바람직하게는 대기압하에서 수행된다. 후처리는 통상적인 방법으로 수행된다.
- <396> 본 발명에 따른 방법 (G)는 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에, 경우에 따라 회석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XI)의 인 화합물과 반응시킴을 특징으로 한다.
- <397> 제조 방법 (G)에서, 일반식 (I-a)의 화합물 1 몰당 1 내지 2 몰, 바람직하게는 1 내지 1.3 몰의 일반식 (XI)의 인 화합물을 -40 내지 150 °C, 바람직하게는 -10 내지 110 °C 사이의 온도에서 반응시켜 일반식 (I-e)의 화합물을 수득한다.
- <398> 경우에 따라 첨가되는 적합한 용매는 모든 불활성 극성 유기 용매, 예를 들어, 에테르, 아미드, 니트릴, 알콜, 설파이드, 설펜, 설펜사이드 등이다.
- <399> 아세토니트릴, 디메틸 설펜사이드, 테트라하이드로푸란, 디메틸포름아미드 또는 메틸렌 클로라이드를 사용하는 것이 바람직하다.
- <400> 경우에 따라 첨가되는 적합한 산 결합제는 통상의 무기 또는 유기 염기, 예를 들어 수산화물, 탄산염 또는 아민

이며, 이들의 예로는 수산화나트륨, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 피리딘 및 트리에틸아민이 포함된다.

- <401> 반응은 대기압 또는 증압하에서 수행될 수 있으며, 바람직하게는 대기압하에서 수행된다. 후처리는 유기화학의 통상의 방법에 의해 수행된다. 생성된 최종 생성물은 바람직하게는 결정화, 크로마토그래피 정제 또는 소위 "초기 증류법 (incipient distillation)", 즉 감압하에서 휘발 성분을 제거하는 방법으로 정제된다.
- <402> 방법 (H)는 일반식 (I-a)의 화합물을, 경우에 따라 회석제의 존재하에서 일반식 (XII)의 금속 수산화물 또는 금속 알콕사이드, 또는 일반식 (XIII)의 아민과 반응시킴을 특징으로 한다.
- <403> 본 발명에 따른 방법 (H)에 바람직한 회석제는 에테르, 예를 들어, 테트라하이드로푸란, 디옥산, 디에틸 에테르, 또는 알콜, 예를 들어, 메탄올, 에탄올, 이소프로판올, 및 또한 물이다.
- <404> 본 발명에 따른 방법 (H)는 일반적으로 대기압하에서 수행된다.
- <405> 반응 온도는 일반적으로 -20 내지 100 °C, 바람직하게는 0 내지 50 °C 사이이다.
- <406> 본 발명에 따른 방법 (I)는 일반식 (I-a)의 화합물을 각 경우에, (I α) 경우에 따라 회석제의 존재하 및 경우에 따라 촉매의 존재하에서 일반식 (XIV)의 화합물과 반응시키거나, (I β) 경우에 따라 회석제의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하에서 일반식 (XV)의 화합물과 반응시킴을 특징으로 한다.
- <407> 제조 방법 (I α)에서, 일반식 (I-a)의 출발 물질 1 몰당 약 1 몰의 일반식 (XIV)의 이소시아네이트를 0 내지 100 °C, 바람직하게는 20 내지 50 °C 사이의 온도에서 반응시킨다.
- <408> 경우에 따라 첨가되는 적합한 회석제는 모든 불활성 유기 용매, 예를 들어, 니트릴, 에스테르, 에테르, 아미드, 설펜, 설폭사이드이다.
- <409> 경우에 따라, 촉매를 첨가하여 반응을 촉진시킬 수 있다. 매우 유리하게 사용되는 촉매는 유기 주석 화합물, 예를 들어 디부틸틴 디라우레이트이다. 반응은 바람직하게는 대기압하에서 수행된다.
- <410> 제조 방법 (I β)에서, 일반식 (I-a)의 화합물 1 몰당 약 1 몰의 일반식 (XV)의 카바모일 클로라이드를 -20 내지 150 °C, 바람직하게는 0 내지 70 °C 사이의 온도에서 반응시킨다.
- <411> 경우에 따라 첨가되는 적합한 회석제는 모든 불활성 극성 유기 용매, 예를 들어, 니트릴, 에스테르, 에테르, 아미드, 설펜, 설폭사이드 또는 할로젠화 탄화수소이다.
- <412> 아세토니트릴, 에틸렌 아세테이트, 디메틸 설폭사이드, 테트라하이드로푸란, 디메틸포름아미드 또는 메틸렌 클로라이드를 사용하는 것이 바람직하다.
- <413> 바람직한 구체예에서, 일반식 (I-a)의 화합물의 에놀레이트 염을 강한 탈양성자화제(예를 들어, 수소화나트륨 또는 포타슘 t-부톡사이드)를 첨가하여 제조하는 경우, 산 결합제를 추가로 첨가하는 것은 필요치 않다.
- <414> 산 결합제가 사용되는 경우, 이들은 통상의 무기 또는 유기 염기, 예를 들어 수산화나트륨, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 트리에틸아민 또는 피리딘이다.
- <415> 반응은 대기압 또는 증압하에서 수행될 수 있으며, 바람직하게는 대기압하에서 수행된다. 후처리는 통상적인 방법으로 수행된다.
- <416> 활성 화합물은 동물 해충, 특히 농업, 임업, 저장 제품 및 재료의 보호 및 위생 분야에서 마주치게 되는 곤충, 거미류 및 선충을 구제하는데 적합하며, 식물에 대한 양호한 내약성을 제공하며, 유리한 온혈동물 독성을 갖는다. 이들은 바람직하게는 작물 보호제로 사용된다. 이들은 보통 정도로 민감하거나 내성인 종 및 모든 또는 개별 발달 단계에 대하여 활성적이다. 상기에서 언급한 해충에는 다음의 것들이 포함된다:
- <417> 쥐며느리(*Isopoda*)목, 예를 들어 오니스쿠스 아셀루스(*Oniscus asellus*), 아르마딜리디움 불가레(*Armadillidium vulgare*) 및 포르셀리오 스카베르(*Porcellio scaber*).
- <418> 노래기(*Diplopoda*)목, 예를 들어 블라니울루스 구툴라투스(*Blaniulus guttulatus*).
- <419> 지네(*Chilopoda*)목, 예를 들어 게오필루스 카르포파구스(*Geophilus carpophagus*) 및 스쿠티게라 종(*Scutigera spec.*).
- <420> 심필라(*Symphyla*)목, 예를 들어 스쿠티게렐라 임마쿨라타(*Scutigera immaculata*).
- <421> 줌(*Thysanura*)목, 예를 들어 레피스마 사카리나(*Lepisma saccharina*).

- <422> 툽토기(*Collembola*)목, 예를 들어 오니키우루스 아르마투스(*Onychiurus armatus*).
- <423> 메뚜기(*Orthoptera*)목, 예를 들어 아케타 도메스티쿠스(*Acheta domesticus*), 그릴로탈파 종(*Gryllotalpa* spp.), 로쿠스타 미그라토리아 미그라토리오이데스(*Locusta migratoria migratorioides*), 멜라노플루스 종(*Melanoplus* spp.) 및 쉬스토세르카 그레가리아(*Schistocerca gregaria*).
- <424> 바퀴(*Blattaria*)목, 예를 들어 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 류코파에아 마데라에(*Leucophaea maderae*), 블라텔라 게르마니카(*Blattella germanica*).
- <425> 짐제벌레(*Dermaptera*)목, 예를 들어 포르피쿨라 아우리쿨라리아(*Forficula auricularia*).
- <426> 흰개미(*Isoptera*)목, 예를 들어 레티쿨리테르메스 종(*Reticulitermes* spp.).
- <427> 이(*Phthiraptera*)목, 예를 들어 페디쿨루스 후마누스 코르포리스(*Pediculus humanus corporis*), 하에마토피누스 종(*Haematopinus* spp.), 리노그나투스 종(*Linognathus* spp.), 트리코덱테스 종(*Trichodectes* spp.) 및 다말리니아 종(*Damalinia* spp.).
- <428> 총채벌레(*Thysanoptera*)목, 예를 들어 헤르시노트리프스 페모랄리스(*Hercinothrips femoralis*), 트리프스 타바치(*Thrips tabaci*), 트리프스 팔미(*Thrips palmi*) 및 프랑클리니엘라 옥시덴탈리스(*Frankliniella occidentalis*).
- <429> 이시아(*Heteroptera*)목, 예를 들어 유리가스테르 종(*Eurygaster* spp.), 디스테르쿠스 인테르메디우스(*Dysdercus intermedius*), 피에스마 쿼드라타(*Piesma quadrata*), 시멕스 렉툴라리우스(*Cimex lectularius*), 로드니우스 프로릭수스(*Rhodnius prolixus*) 및 트리아토마 종(*Triatoma* spp.).
- <430> 매미(*Homoptera*)목, 예를 들어 알레우로데스 브라시카에(*Aleurodes brassicae*), 베미시아 타바치(*Bemisia tabaci*), 트리아레우로데스 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.), 마크로시퐁 아베나에(*Macrosiphum avenae*), 미주스 종(*Myzus* spp.), 포로돈 휴물리(*Phorodon humuli*), 로팔로시퐁 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.).
- <431> 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 크실로스텔라(*Plutella xylostella*), 말라코소마 네우스트리아(*Malacosoma neustria*), 유프록티스 크리스로레아(*Euproctis chrysorrhoea*), 리만트리아 종(*Lymantria* spp.), 부쿨라트릭스 투르베리엘라(*Bucculatrix thurberiella*), 필로크니스티스 시트렐라(*Phyllocnistis citrella*), 아그로티스 종(*Agrotis* spp.), 욱소아 종(*Euxoa* spp.), 펠티아 종(*Feltia* spp.), 예아리아스 인슐라나(*Earias insulana*), 헬리오티스 종(*Heliothis* spp.), 마메스트라 브라시카에(*Mamestra brassicae*), 파놀리스 플람메아(*Panolis flammea*), 스포도프테라 종(*Spodoptera* spp.), 트리코플루시아 니(*Trichoplusia ni*), 카르포카프사 포모넬라(*Carpocapsa pomonella*), 피에리스 종(*Pieris* spp.), 칠로 종(*Chilo* spp.), 피라우스타 누비랄리스(*Pyrausta nubilalis*), 에페스티아 쿠에니엘라(*Ephestia kuehniella*), 갈레리아 멜로넬라(*Galleria mellonella*), 티네올라 비셀리엘라(*Tineola bisselliella*), 티네아 펠리오넬라(*Tinea pellionella*), 호프만노필라 슈도스프레텔라(*Hofmannophila pseudospretella*), 카코에시아 포다나(*Cacoecia podana*), 카푸아 레티쿨라나(*Capua reticulana*), 코리스토네우라 푸미페라나(*Choristoneura fumiferana*), 클리시아 암비구엘라(*Clysia ambiguella*), 호모나 마그나니마(*Homona magnanima*), 토르트릭스 비리다나(*Tortrix viridana*), 크나팔로세루스 종(*Cnaphalocerus* spp.) 및 오울레마 오리자에(*Oulema oryzae*).
- <432> 딱정벌레(*Coleoptera*)목, 예를 들어, 아노비움 푼크타툼(*Anobium punctatum*), 리조페르타 도미니카(*Rhizophorthera dominica*), 브루키디우스 오브텍투스(*Bruchidius obtectus*), 아칸토스셀리데스 오브텍투스

(*Acanthoscelides obtectus*), 힐로트루페스 바줄루스(*Hylotrupes bajulus*), 아겔라스티카 알니 (*Agelastica alni*), 랩티노타르사 데셈리네아타(*Leptinotarsa decemlineata*), 파에돈 코클레아리아에(*Phaedon cochleariae*), 디아브로티카 종(*Diabrotica spp.*), 프실리오테스 크리소세팔라(*Psylliodes chrysocephala*), 에필라크나 바리베스티스 (*Epilachna varivestis*), 아토마리아 종(*Atomaria spp.*), 오리자에필루스 수리나멘시스 (*Oryzaephilus surinamensis*), 안토노무스 종(*Anthonomus spp.*), 시토피루스 종(*Sitophilus spp.*), 오티오린쿠스 술카투스(*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.*), 니프트루스 홀로레우쿠스 (*Niptus hololeucus*), 기비움 프실로이테스(*Gibbium psyllioides*), 트리볼리움 종(*Tribolium spp.*), 테네브리오 몰리토르(*Tenebrio molitor*), 아그리오테스 종(*Agriotes spp.*), 코노테루스 종(*Conoderus spp.*), 멜로론타 멜로론타(*Melolontha melolontha*), 암피말론 솔스티티알리스(*Amphimallon solstitialis*), 코스텔리트라 제알란디카(*Costelytra zealandica*) 및 리소르호프투스 오리조필루스(*Lissorhoptus oryzophilus*).

<433> 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.*).

<434> 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 에리트르세팔라(*Calliphora erythrocephala*), 루실리아 종(*Lucilia spp.*), 크리소미아 종(*Chrysomya spp.*), 쿠테레브라 종(*Cuterebra spp.*), 가스트로필루스 종 (*Gastrophilus spp.*), 히포보스카 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*), 오시넬라 프리트(*Oscinella frit*), 포르비아 종(*Phorbia spp.*), 페고미아 히오스키아미(*Pegomyia hyoscyami*), 세라티티스 카피타타(*Ceratitis capitata*), 다쿠스 올레아에(*Dacus oleae*), 티풀라 팔루도사(*Tipula paludosa*), 힐레미아 종(*Hylemyia spp.*) 및 리비오미자 종(*Liriomyza spp.*).

<435> 벼룩(Siphonaptera)목, 예를 들어 크세노프실라 케오피스(*Xenopsylla cheopis*) 및 세라토피루스 종(*Ceratophyllus spp.*).

<436> 거미(Arachnida)목, 예를 들어 소르피오 마우루스(*Scorpio maurus*), 라트로텍투스 막탄스(*Latrodectus mactans*), 아카루스 시로(*Acarus siro*), 아르가스 종(*Argas spp.*), 오르니토도로스 종(*Ornithodoros spp.*), 데르마니수스 갈리나에 (*Dermanyssus gallinae*), 에리오피에스 리비스(*Eriophyes ribis*), 필로콕트루타 올레이보라(*Phyllocoptura 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.*), 테트라니쿠스 종(*Tetranychus spp.*), 헤미타소네무스 종(*Hemitarsonemus spp.*) 및 브레비팔푸스 종(*Brevipalpus spp.*).

<437> 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.*), 글로보데라 종(*Globodera spp.*), 멜로이도기네 종(*Meloidogyne spp.*), 아펠렌코이데스 종(*Aphelenchoides spp.*), 롱기도루스 종(*Longidorus spp.*), 크시피네마 종(*Xiphinema spp.*), 트리코도루스 종(*Trichodorus spp.*) 및 부르사펠렌쿠스 종(*Bursaphelenchus spp.*)이 포함된다.

<438> 특정 농도 또는 적용 비율에서, 본 발명에 따른 화합물은 또한, 경우에 따라 제초제 및 살미생물제, 예를 들어 살진균제, 항균제 및 살균제로 사용될 수 있다. 경우에 따라, 이들은 또한 추가의 활성 화합물을 합성하기 위한 중간체 또는 전구체로도 사용될 수 있다.

<439> 본 발명에 따른 활성 화합물은 용액제, 유제, 수화성 산제, 현탁액, 산제, 분제, 페이스트, 가용성 산제, 과립제, 현탁액-유제 농축액, 활성 화합물이 주입된 천연 및 합성물질, 및 중합물질 중의 마이크로캡셀제와 같은 통상의 제제로 전환될 수 있다.

<440> 이들 제제는 공지된 방법으로, 예를 들어, 임의로 계면활성제, 즉 유화제 및/또는 분산제 및/또는 포움 형성제

를 사용하여 활성 화합물을 증량제, 즉 액체 용매 및/또는 고형 담체와 혼합하여 제조한다.

- <441> 사용된 증량제가 물인 경우, 예를 들어 유기용매가 또한 공동 용매로 사용될 수 있다. 액체 용매로서, 주로 크실렌, 톨루엔 또는 알킬나프탈렌과 같은 방향족 화합물, 클로로벤젠, 클로로에틸렌 또는 메틸렌 클로라이드와 같은 염소화 방향족 또는 염소화 지방족 탄화수소, 사이클로헥산 또는 파라핀, 예를 들어, 광유 분획물, 광유 및 식물유와 같은 지방족 탄화수소, 부탄올 또는 글리콜과 같은 알콜 및 이들의 에테르 및 에스테르, 아세톤, 메틸 에틸 케톤, 메틸 이소부틸 케톤 또는 사이클로헥사논과 같은 케톤, 디메틸포름아미드 및 디메틸설폭사이드와 같은 강한 극성 용매 또는 물이 적합하다.
- <442> 적합한 고형 담체는, 예를 들어 암모늄염, 및 카올린, 점토, 활석, 초크, 석영, 아타펄기트, 몬트모릴로나이트 또는 규조토와 같은 분쇄된 천연 광물, 및 고분산 실리카, 알루미늄 및 실리케이트와 같은 분쇄된 합성 물질이다. 적합한 과립제용 고형 담체는, 예를 들어 방해석, 대리석, 경석, 해포석 및 백운석과 같은 분쇄 및 분류된 천연 암석, 또는 무기 및 유기 가루의 합성 과립, 및 톱밥, 코코넛 껍질, 옥수수 속대 및 담배줄기와 같은 유기물질의 과립이다. 적합한 유화제 및/또는 포움 형성제는 예를 들어 비이온성 및 음이온성 유화제, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 지방산 에스테르, 폴리옥시에틸렌 지방 알콜 에테르, 예를 들어 알킬아릴 폴리글리콜 에테르, 알킬설포네이트, 알킬설페이트, 아릴설포네이트 또는 단백질 가수분해물이다. 적합한 분산제는, 예를 들어 리그닌-설파이트 폐액 및 메틸셀룰로오즈이다.
- <443> 점착제, 예를 들어 카복시메틸셀룰로오즈, 및 아라비아고무, 폴리비닐 알콜 및 폴리비닐 아세테이트와 같은 분말, 과립 또는 라텍스 형태의 천연 및 합성 중합체, 및 또한 세팔린 및 레시틴과 같은 천연 인지질, 및 합성 인지질이 제제에 사용될 수 있다. 그외의 첨가제는 광유 및 식물유일 수 있다.
- <444> 착색제, 예를 들어 산화철, 산화티탄 및 프루시안 블루 등의 무기안료, 및 알리자린 착색제, 아조 착색제 및 금속 프탈로시아닌 착색제 등의 유기 착색제 및 철, 망간, 붕소, 구리, 코발트, 몰리브덴 및 아연의 염과 같은 미량 영양소가 사용될 수도 있다.
- <445> 제제는 일반적으로 0.1 내지 95 중량%, 바람직하게는 0.5 내지 90 중량%의 활성 화합물을 함유한다.
- <446> 본 발명에 따른 활성 화합물은 살충제, 유인제, 소독제, 살균제, 살비제, 살선충제, 살진균제, 성장-조절 물질 또는 제초제와 같은 다른 활성 화합물과의 혼합물로서, 그의 상업적으로 입수가 가능한 제제 및 이들 제제로부터 제조된 사용형에 존재할 수 있다. 살충제로는 예를 들어, 포스페이트, 카바메이트, 카복실레이트, 염소화 탄화수소, 페닐우레아 및 미생물에 의해 생산된 물질이 포함된다.
- <447> 특히 유리한 혼합 성분의 예로 다음과 같은 화합물이 있다:
- <448> **살진균제:**
- <449> 알디모르프, 암프로필포스, 암프로필포스 포타슘, 안도프림, 아닐라진, 아자코나졸, 아족시스트로빈,
- <450> 벤알락실, 베노다닐, 베노밀, 벤자마크릴, 벤자마크릴-이소부틸, 비알라포스, 비나파크릴, 비페닐, 비터탄올, 블라스티시딘-S, 브로무코나졸, 부피리메이트, 부티오베이트,
- <451> 칼슘 폴리설파이드, 캅시마이신, 캅타폴, 캅탄, 카벤다짐, 카복신, 카르본, 퀴노메티오네이트, 클로벤티아존, 클로르페나졸, 클로로네브, 클로로피크린, 클로로탈로닐, 클로졸리네이트, 클로질라론, 쿠프라네브, 시목사닐, 사이프로코나졸, 사이프로디닐, 사이프로푸람,
- <452> 데바카브, 디클로로펜, 디클로부트라졸, 디클로플루아니드, 디클로메진, 디클로란, 디에토펜카브, 디페노코나졸, 디메티리몰, 디메토모르프, 디니코나졸, 디니코나졸-M, 디노캡, 디페닐아민, 디피리티온, 디탈립포스, 디티아논, 도데모르프, 도딘, 드라족솔론,
- <453> 에디펜포스, 에폭시코나졸, 에타코나졸, 에티리몰, 에트리디아졸,
- <454> 과목사돈, 페나파닐, 페나리몰, 펜부코나졸, 펜푸람, 페니트로판, 펜피클로닐, 펜프로피딘, 펜프로피모르프, 펜틴 아세테이트, 수산화 펜틴, 페르밤, 페림존, 플루아지남, 플루메토버, 플루오로미드, 플루퀸코나졸, 플루프리미돌, 플루실라졸, 플루설파미드, 플루톨라닐, 플루트리아폴, 플렛, 포세틸-알루미늄, 포세틸-소듐, 프탈리드, 푸베리다졸, 푸라락실, 푸라메트피르, 푸르카보닐, 푸르코나졸, 푸르코나졸-시스, 푸르메사이클록스,
- <455> 구아자틴,
- <456> 헥사클로로벤젠, 헥사코나졸, 하이맥사졸,

- <457> 이마잘릴, 이미벤코나졸, 이미녹타딘, 이미녹타딘 알베실레이트, 이미녹타딘 트리아세테이트, 요오도카브, 이프코나졸, 이프로벤포스(IPB), 이프로디온, 이루마마이신, 이소프로티올란, 이소발레디온,
- <458> 카수가마이신, 크레속심-메틸, 구리 제제, 예를 들어 수산화 구리, 코퍼 나프테네이트, 옥시염화구리, 황산구리, 산화구리, 옥신-구리 및 보르도(Bordeaux) 혼합물,
- <459> 만코퍼, 만코제브, 마네브, 메페림존, 메파니피림, 메프로닐, 메탈락실, 메트코나졸, 메타설포카브, 메트푸록삼, 메티람, 메토메클람, 메트설포박스, 밀디오마이신, 마이클로부타닐, 마이클로졸린,
- <460> 니켈 디메틸디티오카바메이트, 니트로탈-이소프로필, 누아리물,
- <461> 오푸라스, 옥사딕실, 옥사모카브, 옥솔린산, 옥시카복심, 옥시펜틴,
- <462> 파클로부트라졸, 페푸라조에이트, 펜코나졸, 펜시쿠론, 포스디펜, 피마리신, 피페랄린, 폴리옥신, 폴리옥소림, 프로베나졸, 프로클로라즈, 프로사이미돈, 프로파모카브, 프로파노신-소듐, 프로피코나졸, 프로피네브, 피라조포스, 피리페녹스, 피리메타닐, 피로퀼론, 피록시푸르,
- <463> 킨코나졸, 킨토젠(PCNB)
- <464> 황 및 황 제제,
- <465> 테부코나졸, 테클로프탈람, 테크나젠, 테트사이클라시스, 테트라코나졸, 티아벤다졸, 티사이오펜, 티플루자미드, 티오파네이트-메틸, 티람, 티옥시미드, 톨클로포스-메틸, 톨릴플루아니드, 트리아디메폰, 트리아디메놀, 트리아즈부틸, 트리아족사이드, 트리클라미드, 트리사이클라졸, 트리데모르프, 트리플루미졸, 트리포린, 트리티코나졸,
- <466> 유니코나졸,
- <467> 발리다마이신 A, 빈클로졸린, 비니코나졸,
- <468> 자릴라미드, 지네브, 지람, 및 또한
- <469> 다거(Dagger) G,
- <470> OK-8705,
- <471> OK-8801,
- <472> α -(1,1-디메틸에틸)- β -(2-페녹시에틸)-1H-1,2,4-트리아졸-1-에탄올,
- <473> α -(2,4-디클로로페닐)- β -플루오로- β -프로필-1H-1,2,4-트리아졸-1-에탄올,
- <474> α -(2,4-디클로로페닐)- β -메톡시- α -메틸-1H-1,2,4-트리아졸-1-에탄올,
- <475> α -(5-메틸-1,3-디옥산-5-일)- β -[[4-(트리플루오로메틸)페닐]메틸렌]-1H-1,2,4-트리아졸-1-에탄올,
- <476> (5RS,6RS)-6-하이드록시-2,2,7,7-테트라메틸-5-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)-3-옥타논,
- <477> (E)- α -(메톡시이미노)-N-메틸-2-페녹시-페닐아세트아미드,
- <478> 1-이소프로필 {2-메틸-1-[[[1-(4-메틸페닐)에틸]아미노]카보닐]프로필}카바메이트,
- <479> 1-(2,4-디클로로페닐)-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)-에타논 0-(페닐메틸)-옥심,
- <480> 1-(2-메틸-1-나프탈레닐)-1H-피롤-2,5-디온,
- <481> 1-(3,5-디클로로페닐)-3-(2-프로페닐)-2,5-피롤리딘디온,
- <482> 1-[(디오오도메틸)설포닐]-4-메틸벤젠,
- <483> 1-[[2-(2,4-디클로로페닐)-1,3-디옥솔란-2-일]메틸]-1H-이미다졸,
- <484> 1-[[2-(4-클로로페닐)-3-페닐옥시라닐]메틸]-1H-1,2,4-트리아졸,
- <485> 1-[1-[2-[(2,4-디클로로페닐)메톡시]페닐]에테닐]-1H-이미다졸,
- <486> 1-메틸-5-노닐-2-(페닐메틸)-3-피롤리디놀,

- <487> 2',6'-디브로모-2-메틸-4'-트리플루오로메톡시-4'-트리플루오로메틸-1,3-티아졸-5-카복시아닐리드,
- <488> 2,2-디클로로-N-[1-(4-클로로페닐)에틸]-1-에틸-3-메틸사이클로프로판카복사미드,
- <489> 2,6-디클로로-5-(메틸티오)-4-피리미디닐 티오시아네이트,
- <490> 2,6-디클로로-N-(4-트리플루오로메틸벤질)-벤즈아미드,
- <491> 2,6-디클로로-N-[[4-(트리플루오로메틸)페닐]메틸]벤즈아미드,
- <492> 2-(2,3,3-트리아오도-2-프로페닐)-2H-테트라졸,
- <493> 2-[(1-메틸에틸)설폰닐]-5-(트리클로로메틸)-1,3,4-티아디아졸,
- <494> 2-[[6-데옥시-4-O-(4-O-메틸-β-D-글리코피라노실)-α-D-글루코피라노실]아미노]-4-메톡시-1H-피롤로[2,3-d]피리미딘-5-카보니트릴,
- <495> 2-아미노부탄,
- <496> 2-브로모-2-(브로모메틸)펜탄디니트릴,
- <497> 2-클로로-N-(2,3-디하이드로-1,1,3-트리메틸-1H-인덴-4-일)-3-피리딘카복사미드,
- <498> 2-클로로-N-(2,6-디메틸페닐)-N-(이소티오시아네이토메틸)아세트아미드,
- <499> 2-페닐페놀(OPP),
- <500> 3,4-디클로로-1-[4-(디플루오로메톡시)페닐]-1H-피롤-2,5-디온,
- <501> 3,5-디클로로-N-[시아노-[(1-메틸-2-프로피닐)옥시]메틸]벤즈아미드,
- <502> 3-(1,1-디메틸프로필)-1-옥소-1H-인덴-2-카보니트릴,
- <503> 3-[2-(4-클로로페닐)-5-에톡시-3-이속사졸리디닐]피리딘,
- <504> 4-클로로-2-시아노-N,N-디메틸-5-(4-메틸페닐)-1H-이미다졸-1-설폰아미드,
- <505> 4-메틸테트라졸로[1,5-a]퀴나졸린-5(4H)-온,
- <506> 8-(1,1-디메틸에틸)-N-에틸-N-프로필-1,4-디옥사스피로[4,5]데칸-2-메탄아민,
- <507> 8-하이드록시퀴놀린 설페이트,
- <508> 9H-크산텐-2-[(페닐아미노)카보닐]-9-카복실산 하이드라지드,
- <509> 비스-(1-메틸에틸)-3-메틸-4-[(3-메틸벤조일)옥시]-2,5-티오펜디카복실레이트,
- <510> 시스-1-(4-클로로페닐)-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)-사이클로헥탄올,
- <511> 시스-4-[3-[4-(1,1-디메틸프로필)페닐-2-메틸프로필]-2,6-디메틸모르폴린 하이드로클로라이드,
- <512> 에틸 [(4-클로로페닐)아조]시아노아세테이트,
- <513> 탄산수소칼륨,
- <514> 메탄테트라티올 소듐염,
- <515> 메틸 1-(2,3-디하이드로-2,2-디메틸-1H-인덴-1-일)-1H-이미다졸-5-카복실레이트,
- <516> 메틸 N-(2,6-디메틸페닐)-N-(5-이속사졸릴카보닐)-DL-알라니네이트,
- <517> 메틸 N-(클로로아세틸)-N-(2,6-디메틸페닐)-DL-알라니네이트,
- <518> N-(2,3-디클로로-4-하이드록시페닐)-1-메틸-사이클로헥산카복사미드,
- <519> N-(2,6-디메틸페닐)-2-메톡시-N-(테트라하이드로-2-옥소-3-푸라닐)-아세트아미드,
- <520> N-(2,6-디메틸페닐)-2-메톡시-N-(테트라하이드로-2-옥소-3-티에닐)-아세트아미드,
- <521> N-(2-클로로-4-니트로페닐)-4-메틸-3-니트로-벤젠설폰아미드,

- <522> N-(4-사이클로헥실페닐)-1,4,5,6-테트라하이드로-2-피리미딘아민,
- <523> N-(4-헥실페닐)-1,4,5,6-테트라하이드로-2-피리미딘아민,
- <524> N-(5-클로로-2-메틸페닐)-2-메톡시-N-(2-옥소-3-옥사졸리디닐)-아세트아미드,
- <525> N-(6-메톡시)-3-피리디닐-사이클로프로판카복사미드,
- <526> N-[2,2,2-트리클로로-1-[(클로로아세틸)아미노]에틸]벤즈아미드,
- <527> N-[3-클로로-4,5-비스(2-프로피닐옥시)페닐]-N'-메톡시-메탄이미드아미드,
- <528> N-포르밀-N-하이드록시-DL-알라닌-소듐염,
- <529> 0,0-디에틸 [2-(디프로필아미노)-2-옥소에틸]-에틸포스포르아미도티오에이트,
- <530> 0-메틸 S-페닐 페닐프로필포스포르아미도티오에이트,
- <531> S-메틸 1,2,3-벤조티아디아졸-7-카보티오에이트,
- <532> 스피로[2H]-1-벤조피란-2,1'(3'H)-이소벤조푸란-3'-온.
- <533> **살균제:**
- <534> 브로노폴, 디클로로펜, 니트라피린, 니켈 디메틸디티오카바메이트, 카수가마이신, 옥틸리논, 푸란카복실산, 옥시테트라사이클린, 프로베나졸, 스트렙토마이신, 테클로프탈람, 황산구리 및 다른 구리 제제.
- <535> **살충제 / 살비제 / 살선충제:**
- <536> 아바멕틴, 아세페이트, 아세트아미프리드, 아크리나트린, 알라니카브, 알디카브, 알독시카브, 알파사이피메트린, 알파메트린, 아미트라즈, 아버멕틴, AZ 60541, 아자디라크틴, 아자메티포스, 아진포스 A, 아진포스 M, 아조사이클로틴,
- <537> 바실러스 포필리아에, 바실러스 스파에리쿠스, 바실러스 서브틸리스, 바실러스 투린기엔시스, 바쿨로바이러스, 뷰베리아 바시아나, 뷰베리아 데넬라, 벤디오카브, 벤푸라카브, 벤설탐, 벤족시메이트, 베타사이플루트린, 비페나제이트, 비펜트린, 비오에타노메트린, 비오피메트린, BPMC, 브로모포스 A, 부펜카브, 부프로페진, 부타티오포스, 부토카복심, 부틸피리다벤,
- <538> 카두사포스, 카바릴, 카보푸란, 카보페노티온, 카보설펜, 카탐, 클로에토카브, 클로르에톡시포스, 클로르페나피르, 클로르펜빈포스, 클로르플루아주론, 클로르메포스, 클로르피리포스, 클로르피리포스 M, 클로바포트린, 시스-레스메트린, 시스피메트린, 클로사이트린, 클로에토카브, 클로펜테진, 시아노포스, 사이클로프로펜, 사이클로프로트린, 사이플루트린, 사이할로트린, 사이헥사틴, 사이피메트린, 사이로마진,
- <539> 델타메트린, 데메톤 M, 데메톤 S, 데메톤-S-메틸, 디아펜티우론, 디아지논, 디클로르보스, 디플루벤주론, 디메토에이트, 디메틸빈포스, 디오페놀란, 디설포톤, 도쿠사트-소듐, 도페나파인,
- <540> 에플루실라네이트, 에마멕틴, 엠펜트린, 엔도설펜, 엔토모프토라 중(spp.), 에스펜발레레이트, 에티오펜카브, 에티온, 에토프로포스, 에토펜프록스, 에톡사졸, 에트림포스,
- <541> 펜아미포스, 펜아자린, 산화 펜부타틴, 페니트로티온, 페노티오카브, 페녹사크림, 페녹시카브, 펜프로파트린, 펜피라드, 펜피리트린, 펜피록시메이트, 펜발레레이트, 피프로닐, 플루아지남, 플루아주론, 플루브로사이트리네이트, 플루사이클록수론, 플루사이트리네이트, 플루페녹수론, 플루텐진, 플루발리네이트, 포노포스, 포스메틸란, 포스티아제이트, 푸브펜프록스, 푸라티오카브,
- <542> 그라눌로시스 바이러세스,
- <543> 할로페노지드, HCH, 햅테노포스, 헥사플루무론, 헥시티아족스, 하이드로프로펜,
- <544> 이미다클로프리드, 이사조포스, 이소펜포스, 이속사티온, 이버멕틴,
- <545> 람다-사이할로트린, 루페누론,
- <546> 말라티온, 메카르밤, 메탈알데하이드, 메트아미도포스, 메타리지움 아니소플리아에, 메타리지움 플라보비리데, 메티다티온, 메티오카브, 메토밀, 메톡시페노지드, 메톨카브, 메톡사디아존, 메빈포스, 밀베멕틴, 모노크로토포

스,

- <547> 날레드, 니텐피람, 니티아진, 노발우론, 뉴클레아 폴리헤드로시스 바이러세스,
- <548> 오메토에이트, 옥사밀, 옥시테메톤 M,
- <549> 파에실로마이세스 푸소소세우스, 파라티온 A, 파라티온 M, 퍼메트린, 펜토에이트, 포레이트, 포살론, 포스메트, 포스파미돈, 폭심, 피리미카브, 피리미포스 A, 피리미포스 M, 프로페노포스, 프로메카브, 프로폭수르, 프로티오포스, 프로토에이트, 피메트로진, 피라클로포스, 피레스메트린, 피레트럼, 피리다벤, 피리다티온, 피리미디펜, 피리프록시펜,
- <550> 퀴날포스,
- <551> 리바비린,
- <552> 살리티온, 세부포스, 실라플루오펜, 스피노사드, 설포텡, 설프로포스,
- <553> 타우-플루발리네이트, 테부페노지드, 테부펜피라드, 테부피리미포스, 테플루벤주론, 테플루트린, 테메포스, 테미빈포스, 터부포스, 테트라클로르빈포스, 테타-사이퍼메트린, 티아메톡삼, 티아프로닐, 티아트리포스, 티오시클람 하이드로젠 옥살레이트, 티오디카브, 티오파녹스, 투린기엔신, 트랄로사이트린, 트랄로메트린, 트리아라텐, 트리아자메이트, 트리아조포스, 트리아주론, 트리클로페니딘, 트리클로르폰, 트리플루무론, 트리메타카브,
- <554> 바미도티온, 바닐리프롤, 버티실리움 레카니,
- <555> YI 5302,
- <556> 제타-사이퍼메트린, 졸라프로포스,
- <557> (1R-시스)-[5-(페닐메틸)-3-푸라닐]-메틸-3-[(디하이드로-2-옥소-3(2H)-푸라닐리덴)-메틸]-2,2-디메틸사이클로프로판카복실레이트,
- <558> (3-페녹시페닐)-메틸-2,2,3,3-테트라메틸사이클로프로판 카복실레이트,
- <559> 1-[(2-클로로-5-티아졸릴)메틸]테트라하이드로-3,5-디메틸-N-니트로-1,3,5-트리아진-2(1H)-이민,
- <560> 2-(2-클로로-6-플루오로페닐)-4-[4-(1,1-디메틸에틸)페닐]-4,5-디하이드로-옥사졸,
- <561> 2-(아세틸옥시)-3-도데실-1,4-나프탈렌디온,
- <562> 2-클로로-N-[[[4-(1-페닐에톡시)-페닐]-아미노]-카보닐]-벤즈아미드,
- <563> 2-클로로-N-[[[4-(2,2-디클로로-1,1-디플루오로에톡시)-페닐]-아미노]-카보닐]-벤즈아미드,
- <564> 3-메틸페닐 프로필카바메이트,
- <565> 4-[4-(4-에톡시페닐)-4-메틸페닐]-1-플루오로-2-페녹시-벤젠,
- <566> 4-클로로-2-(1,1-디메틸에틸)-5-[[2-(2,6-디메틸-4-페녹시페녹시)에틸]티오]-3(2H)-피리다지논,
- <567> 4-클로로-2-(2-클로로-2-메틸프로필)-5-[(6-요오도-3-피리디닐)메톡시]-3(2H)-피리다지논,
- <568> 4-클로로-5-[(6-클로로-3-피리디닐)메톡시]-2-(3,4-디클로로페닐)-3(2H)-피리다지논,
- <569> 바실러스 투린기엔시스 스트레인 EG-2348,
- <570> 2-벤조일-1-(1,1-디메틸에틸)-하이드라지노벤조산,
- <571> 2,2-디메틸-3-(2,4-디클로로페닐)-2-옥소-1-옥사스피로[4.5]덱-3-엔-4-일 부타노에이트,
- <572> [3-[(6-클로로-3-피리디닐)메틸]-2-티아졸리디닐리덴]-시안아미드,
- <573> 디하이드로-2-(니트로메틸렌)-2H-1,3-티아진-3(4H)-카복스알데하이드,
- <574> 에틸 [2-[[1,6-디하이드로-6-옥소-1-(페닐메틸)-4-피리다지닐]옥시]에틸]-카바메이트,
- <575> N-(3,4,4-트리플루오로-1-옥소-3-부테닐)-글리신,

- <576> N-(4-클로로페닐)-3-[4-(디플루오로메톡시)페닐]-4,5-디하이드로-4-페닐-1H-피라졸-1-카복사미드,
- <577> N-[(2-클로로-5-티아졸릴)메틸]-N'-메틸-N"-니트로-구아니딘,
- <578> N-메틸-N'-(1-메틸-2-프로페닐)-1,2-하이드라진디카보티오아미드,
- <579> N-메틸-N'-2-프로페닐-1,2-하이드라진디카보티오아미드,
- <580> 0,0-디에틸 [2-(디프로필아미노)-2-옥소에틸]-에틸포스포르아미도티오에이트.
- <581> 제초제와 같은 그밖의 다른 공지된 활성 화합물 또는 비료 및 성장 조절제와의 혼합물이 또한 가능하다.
- <582> 살충제로 사용되는 경우, 본 발명에 따른 활성 화합물은 또한 상승제와의 혼합물로서 그의 상업적으로 입수가 가능한 제제 및 이들 제제로부터 제조된 사용형에 존재할 수 있다. 상승제는 첨가되는 상승제 그 자체가 활성화될 필요없이 활성 화합물의 작용을 증가시키는 화합물이다.
- <583> 상업적으로 입수가 가능한 제제로부터 제조된 사용형의 활성 화합물 함량은 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 사용형의 활성 화합물 농도는 0.0000001 내지 95 중량%, 바람직하게는 0.0001 내지 1 중량% 이다.
- <584> 화합물은 사용형에 적합한 통상적인 방법으로 사용된다.
- <585> 위생 해충 및 저장 제품 해충에 사용되는 경우, 활성 화합물은 목재 및 점토에 대해 뛰어난 잔류 활성을 나타낼 뿐만 아니라 석회 기질상의 알칼리에 대해 우수한 안정성을 나타낸다.
- <586> 본 발명에 따른 활성 화합물은 식물 해충, 위생 해충 및 저장 제품 해충 뿐만 아니라, 수의학 분야에서 동물 기생충(체외 기생충), 예를 들어, 견체 참진드기, 연체 참진드기, 움 진드기, 수확 진드기, 파리(쓰고 앓는), 기생성 파리 유충, 이, 털이, 조류이 및 벼룩에 대해 활성적이다. 이러한 기생충에는 다음의 것들이 포함된다:
- <587> 이(*Anoplurida*)목, 예를 들어 하에마토피누스 종(*Haematopinus spp.*), 리노그나투스 종(*Linognathus spp.*), 페디쿨루스 종(*Pediculus spp.*), 프티루스 종(*Phthirus spp.*), 솔레노포테스 종(*Solenopotes spp.*).
- <588> 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.*), 웨르네킨엘라 종(*Werneckiella spp.*), 레피켄트론 종(*Lepikentron spp.*), 다말리나 종 (*Damalina spp.*), 트리코텍테스 종(*Trichodectes spp.*), 펠리콜라 종(*Felicola spp.*).
- <589> 파리(*Diptera*)목 및 네마토세리나(*Nematocerina*) 및 브라키세리나 (*Brachyocerina*) 아목, 예를 들어 아에데스 종(*Aedes spp.*), 아노펠레스 종 (*Anopheles spp.*), 쿨렉스 종(*Culex spp.*), 시물리움 종(*Simulium spp.*), 유시물리움 종(*Eusimulium spp.*), 플레보토무스 종(*Phlebotomus spp.*), 루초미아 종(*Lutzomyia spp.*), 쿨리코이데스 종(*Culicoides spp.*), 크리소프스 종(*Crysops spp.*), 히보미트라 종(*Hybomitra spp.*), 아틸로투스 종(*Atylotus spp.*), 타바누스 종(*Tabanus spp.*), 하에마토포타 종(*Haematopota spp.*), 필리포미아 종(*Philipomyia spp.*), 브라울라 종(*Braula spp.*), 무스카 종(*Musca spp.*), 히드로테아 종(*Hydrotaea spp.*), 스토목시스 종(*Stomoxys spp.*), 하에마토비아 종 (*Haematobia spp.*), 모델리아 종(*Morellia spp.*), 판니아 종(*Fannia spp.*), 글로시시나 종(*Glossina spp.*), 칼리포라 종(*Calliphora spp.*), 루실리아 종(*Lucilia spp.*), 크리소미아 종(*Chrysomyia spp.*), 울파르티아 종(*Wohlfahrtia spp.*), 사르코파가 종(*Sarcophaga spp.*), 오에스트루스 종(*Oestrus spp.*), 히포더마 종 (*Hypoderma spp.*), 가스테로필루스 종(*Gasterophilus spp.*), 히포보스카 종 (*Hyppobosca spp.*), 리프테나 종(*Lipoptena spp.*), 멜로파구스 종(*Melophagus spp.*).
- <590> 벼룩(*Siphonapterida*)목, 예를 들어 풀렉스 종(*Pulex spp.*), 크테노세팔리데스 종(*Ctenocephalides spp.*), 크세노프실라 종(*Xenopsylla spp.*), 세라토피루스 종(*Ceratophyllus spp.*).
- <591> 이시아(*Heteropterida*) 목, 예를 들어 시멕스 종(*Cimex spp.*), 트리아토마 종(*Triatoma spp.*), 로드니우스 종(*Rhodnius spp.*), 판스트롱길루스 종 (*Panstrongylus spp.*).
- <592> 바퀴(*Blattarida*) 목, 예를 들어 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 블라타 게르마니카(*Blatta germanica*) 및 수펠라 종(*Supella spp.*).
- <593> 응애(*Acaria(Acarida)*) 아강 및 메타- 및 메소스티그마타(*Meta- and Mesostigmata*)목, 예를 들어 아르가스 종(*Argas spp.*), 오르니토도루스 종 (*Ornithodoros spp.*), 오토비우스 종(*Otobius spp.*), 익소테스 종(*Ixodes spp.*), 암블리움마 종(*Amblyomma spp.*), 부필루스 종(*Boophilus spp.*), 데르마센토 종 (*Dermacentor spp.*),

하에마피살리스 종(*Haemaphysalis* spp.), 히알롬마 종 (*Hyalomma* spp.), 리피세팔루스 종(*Rhipicephalus* spp.), 데르마니수스 종 (*Dermanyssus* spp.), 라일리테티아 종(*Raillietia* spp.), 뉴모니수스 종 (*Pneumonyssus* spp.), 스테르노스토마 종(*Sternostoma* spp.) 및 바로아 종(*Varroa* spp.).

<594> 아크티네디다(*Actiniedida*)(프로스티그마타(*Prostigmata*)) 및 아카리디다 (*Acaridida*)(아스티그마타(*Astigmata*)) 목, 예를 들어 아카라피스 종(*Acarapis* spp.), 체일레티엘라 종(*Cheyletiella* spp.), 오르니토체 일레티아 종 (*Ornithocheyletia* spp.), 미오비아 종(*Myobia* spp.), 소레르가테스 종 (*Psorergates* spp.), 데모 텍스 종(*Demodex* spp.), 트롬비쿨라 종(*Trombicula* spp.), 리스트로포루스 종(*Listrophorus* spp.), 아카루스 종(*Acarus* spp.), 티로파구스 종(*Tyrophagus* spp.), 칼로글리푸스 종(*Caloglyphus* spp.), 히포텍테스 종 (*Hypodectes* spp.), 프테롤리쿠스 종(*Pterolichus* spp.), 소로프테스 종(*Psoroptes* spp.), 코리오프테스 종 (*Chorioptes* spp.), 오토텍테스 종(*Otodectes* spp.), 사르코프테스 종(*Sarcoptes* spp.), 노토에드레스 종 (*Notoedres* spp.), 크네미도코프테스 종(*Knemidocoptes* spp.), 시토디테스 종(*Cytodites* spp.) 및 라미노시오 프테스 종(*Laminosioptes* spp.).

<595> 본 발명에 따른 활성 화합물은 또한 농업용 가축, 예를 들어 소, 양, 염소, 말, 돼지, 당나귀, 낙타, 물소, 토끼, 닭, 칠면조, 오리, 거위 및 꿀벌, 기타 집에서 기르는 동물, 예를 들어 개, 고양이, 새장의 새 및 어항속 물고기, 및 소위 실험용 동물, 예를 들어 햄스터, 기니아 피그, 랫트 및 마우스를 침습하는 절지동물을 구제하는데 적합하다. 절지동물을 구제하면, 사망 및 산출량 감소(고기, 우유, 양모, 가죽, 알, 벌꿀 등에 있어서)가 줄어들게 되므로, 본 발명에 따른 활성 화합물을 사용함으로써 더욱 경제적이고 간편한 동물 관리가 가능하다.

<596> 본 발명에 따른 활성 화합물은, 수의학 분야에서, 예를 들어 정제, 캡슐제, 음료, 물약, 과립제, 페이스트제, 거환제, 사료를 통한 방법, 좌약의 형태로 장내 투여에 의해, 비경구적 투여, 예를 들어 주사(근육내, 피하, 정맥내 및 복막내 등)에 의해, 삽입에 의해, 비강내 투여에 의해, 예를 들어, 침지 또는 담금, 분무, 붓기, 점적, 세척, 연무의 형태에 의해서나 활성 화합물을 함유하는 성형품 형태, 예를 들어, 목걸이, 귀표식(ear tags), 꼬리 표식, 다리 밴드, 굴레, 표시장치 등의 형태로 경피 투여에 의해 공지된 방식으로 사용된다.

<597> 가축, 가금류, 집에서 기르는 동물 등에 사용하는 경우에, 활성 화합물은 활성 화합물을 1 내지 80 중량%의 양으로 함유하는 제제(예를 들어 산제, 유제, 유동제(flowables))로서 직접 또는 100 내지 10,000 배 희석하여 사용될 수 있거나, 약품옥의 형태로 사용될 수 있다.

<598> 또한, 본 발명에 따른 활성 화합물은 산업 재료를 파괴하는 곤충에 대하여 강력한 살충 작용을 나타내는 것으로 밝혀졌다.

<599> 다음의 곤충들이 바람직한 예로서 언급될 수 있지만, 이들로만 제한되지 않는다:

<600> 딱정벌레(Beetles), 예를 들어 힐로트루페스 바줄루스(*Hylotrupes bajulus*), 클로로포루스 필로시스(*Chlorophorus pilosis*), 아노비움 푼크타툼(*Anobium punctatum*), 크세스토비움 루포빌로숨(*Xestobium rufovillosum*), 프틸리누스 펙티코르니스(*Ptilinus pecticornis*), 덴드로비움 페르티넥스(*Dendrobium pertinex*), 에르노비우스 몰리스(*Ernobius mollis*), 프리오비움 카르피니(*Priobium carpinii*), 릭투스 브룬네우스(*Lyctus brunneus*), 릭투스 아프리카누스(*Lyctus africanus*), 릭투스 플라니콜리스(*Lyctus planicollis*), 릭투스 리네아리스(*Lyctus linearis*), 릭투스 푸베센스(*Lyctus pubescens*), 트로곡실론 아에쿠알레(*Trogoxylon aequale*), 민테스 루기콜리스(*Minthes rugicollis*), 질레보루스 종(*Xyleborus* spp.), 트립토텐드론 종(*Tryptodendron spec.*), 아파테 모나쿠스(*Apate monachus*), 보스트리쿠스 카푸킨스(*Bostrychus capucins*), 헤테로보스트리쿠스 브룬네우스(*Heterobostrychus brunnes*), 시녹실론 종(*Synoxylon spec.*), 디노테루스 미누투스(*Dinoderus minutus*).

<601> 데르마프테란스(Dermapterans), 예를 들어, 시렉스 주벤쿠스(*Sirex jubencus*), 우로세루스 기가스(*Urocerus gigas*), 우로세루스 기가스 타이그누스(*Urocerus gigas taignus*), 우로세루스 아우구르(*Urocerus augur*).

<602> 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*).

- <603> 줌(*Bristletails*), 예를 들어, 레피스마 사카리나(*Lepisma saccharina*)
- <604> 본 발명에서 산업 재료는 무생 물질, 예를 들어, 바람직하게는 중합체, 접착제, 아교, 종이 및 판지(board), 가죽, 목재, 목제품 및 페인트의 의미로 이해된다.
- <605> 곤충의 침습으로부터 보호되어야 할 재료는 매우 특히 바람직하게는 목재 및 목제품이다.
- <606> 본 발명에 따른 조성물 또는 이를 포함하는 혼합물에 의해 보호될 수 있는 목재 및 목제품은 예를 들어, 건축용 목재, 목재 빔(beam), 철도 침목, 교량 구성 요소, 방파제, 목재로 만들어진 비히클(vehicle), 상자, 팔레트, 컨테이너, 전신주, 목재 표지판, 목재로 만들어진 창 및 문, 합판, 칩 보드, 접합품, 또는 가옥 건축 또는 건축용 가구에 매우 일반적으로 사용되는 목제품의 의미로 이해된다.
- <607> 활성 화합물은 그 자체로, 농축물 또는 일반적으로 통상의 제제, 예를 들어, 산제, 과립제, 용액제, 현탁제, 유제 또는 페이스트의 형태로 사용될 수 있다.
- <608> 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.
- <609> 목재 및 목제품을 보호하기 위해 사용되는 살충 조성물 또는 농축물은 본 발명에 따른 활성 화합물을 0.0001 내지 95 중량%, 특히 0.001 내지 60 중량%의 농도로 함유한다.
- <610> 사용되는 조성물 또는 농축물의 양은 곤충의 종 및 발생도와 매질에 따라 달라진다. 최적의 양은 적용시 각 경우에 일련의 시험에 의하여 결정될 수 있다. 그러나, 일반적으로, 보호되어야 할 재료를 기준으로 0.0001 내지 20 중량%, 바람직하게는 0.001 내지 10 중량%를 사용하면 충분할 것이다.
- <611> 적합한 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.
- <612> 바람직하게 사용되는 유기 화학 용매는 35 이상의 증발 지수(evaporation number) 및 30 °C 이상, 바람직하게는 45 °C 이상의 인화점(flash point)을 갖는 오일성 또는 오일형 용매이다. 저휘발성이며 수-불용성인 오일성 또는 오일형 용매로서, 적합한 광유 또는 그들의 방향족 분획물, 또는 광유를 함유하는 용매 혼합물, 바람직하게는 백유(white spirit), 석유 및/또는 알킬벤젠이 사용된다.
- <613> 170 내지 220 °C의 비등 범위를 갖는 광유, 170 내지 220 °C의 비등 범위를 갖는 백유, 250 내지 350 °C의 비등 범위를 갖는 스핀들 오일(spindle oil), 160 내지 280 °C의 비등 범위를 갖는 석유 및 방향족 화합물, 테레빈(terpentine) 오일 등이 유리하게 사용된다.
- <614> 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 스핀들 오일 및/또는 모노클로로나프탈렌, 바람직하게는 α -모노클로로나프탈렌이 사용된다.
- <615> 35 이상의 증발 지수 및 30 °C 이상, 바람직하게는 45 °C 이상의 인화점을 갖는 저휘발성의 유기 오일성 또는 오일형 용매는, 용매 혼합물이 또한 35 이상의 증발 지수 및 30 °C 이상, 바람직하게는 45 °C 이상의 인화점을 갖고 살충제-살진균제 혼합물이 용매 혼합물에 용해되거나 유화될 수 있는 경우에, 중간 또는 고휘발성 유기 화학 용매에 의해 부분적으로 대체될 수 있다.
- <616> 바람직한 구체예에서, 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물의 일부가 지방족 극성 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물에 의해 대체된다. 하이드록실 및/또는 에스테르 및/또는 에테르 그룹을 함유하는 지방족 유기 화학 용매, 예를 들어, 글리콜 에테르, 에스테르 등이 바람직하게 사용된다.
- <617> 본 발명의 목적을 위해 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, 인텐-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.

- <618> 결합제로서 사용된 합성 수지는 유제, 분산액 또는 용액의 형태로 사용될 수 있다. 역청(bitumen) 또는 역청질 물질이 또한 10 중량% 이하의 양으로 결합제로서 사용될 수 있다. 또한, 그 자체로 공지된 착색제, 안료, 방수제, 차향제 (odour-masking agent) 및 억제제 또는 부식 방지제 등이 사용될 수 있다.
- <619> 본 발명에 따라, 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 알키드 수지는 45 중량% 이상, 바람직하게는 50 내지 68 중량%의 오일 함량을 갖는 것이다.
- <620> 상기 언급된 결합제의 전부 또는 일부가 고정제(혼합물) 또는 가소제(혼합물)로 대체될 수 있다. 이 첨가제들은 활성 화합물의 휘발 및 또한 결정화 또는 침전을 방지하기 위해 사용된다. 이들은 바람직하게는 결합제의 0.01 내지 30%(사용된 결합제 100%를 기준으로)를 대체한다.
- <621> 가소제는 프탈산 에스테르, 예를 들어, 디부틸 프탈레이트, 디옥틸 프탈레이트 또는 벤질 부틸 프탈레이트, 인산 에스테르, 예를 들어, 트리부틸 포스페이트, 아디프산 에스테르, 예를 들어, 디-(2-에틸헥실)아디페이트, 스테아레이트, 예를 들어, 부틸 스테아레이트 또는 아밀 스테아레이트, 올레에이트, 예를 들어, 부틸 올레에이트, 글리세롤 에테르 또는 이보다 고분자량의 글리콜 에테르, 글리세롤 에스테르 및 p-톨루엔설폰산 에스테르의 화학그룹중에서 선택된다.
- <622> 고정제는 화학적으로 폴리비닐 알킬 에테르, 예를 들어, 폴리비닐 메틸 에테르, 또는 케톤 예를 들어, 벤조페논 및 에틸렌벤조페논을 기본으로 한다.
- <623> 그밖의 다른 적합한 용매 또는 희석제는 특히, 경우에 따라, 하나 이상의 상기 언급된 유기화학 용매 또는 희석제, 유화제 및 분산제와의 혼합물로서의 물이다.
- <624> 목적은 공업적 스케일의 주입 방법, 예를 들어, 진공, 이중 진공 또는 압축 처리에 의해 특히 효과적으로 보존된다.
- <625> 즉시 사용형(ready-to-use) 조성물은 또한 경우에 따라 하나 또는 그 이상의 다른 살충제 및, 경우에 따라 또한 하나 또는 그 이상의 살진균제를 함유할 수 있다.
- <626> 가능한 추가의 혼합 파트너는 바람직하게는 WO 제 94/29 268호에 언급되어 있는 살충제 및 살진균제이다. 이 문헌에 언급된 화합물은 본 출원의 명백한 구성요소이다.
- <627> 특히 바람직한 혼합 파트너로는 살충제, 예를 들어, 클로르피리포스, 폭심, 실라플루오핀, 알파메트린, 사이플루트린, 사이퍼메트린, 델타메트린, 페메트린, 이미다클로프로이드, NI-25, 플루페녹수론, 헥사플루무론, 트랜스플루트린, 티아클로프 리드, 메톡시페노자이드 및 트리플루무론, 및 살진균제, 예를 들어, 에폭시코나졸, 헥사코나졸, 아자코나졸, 프로피코나졸, 테부코나졸, 사이프로코나졸, 메트코나졸, 이마잘릴, 디클로르플루아니드, 톨릴플루아니드, 3-요오도-2-프로피닐부틸카바메이트, N-옥틸-이소티아졸린-3-온 및 4,5-디클로로-N-옥틸이소티아졸린-3-온이 언급될 수 있다.
- <628> 본 발명에 따른 배합물은 동시에 염수 또는 해수와 접촉하고 있는 물체, 예를 들어 선박 선체, 스크린, 그물, 구조물, 정박장 및 신호송신 시스템을 오염으로부터 보호하기 위해 사용될 수 있다.
- <629> 고착성 빈모강(*Oligochaetae*), 예를 들어 세르풀리아에(*Serpulidae*), 및 갑각류 및 레다모르파(*Ledamorpha*) 군(거위 조개삿갓굴(*goose barnacle*))의 종, 예를 들어 각종 레파스(*Lepas*) 및 스칼펠룸(*Scalpellum*) 종, 또는 굴등형아목(*Balanomorpha*) 군(도토리 조개삿갓굴)의 종, 예를 들어 발라누스(*Balanus*) 또는 폴리시페스(*Pollicipes*) 종에 의한 오염은 선박의 마찰 저항을 증가시키고, 그 결과 에너지 소비량이 높아지고 또한 건식독(dock)에 빈번히 정박함으로써 운전비용을 현저히 증가시키게 된다.
- <630> 조류, 예를 들어 엑토카르푸스 종(*Ectocarpus sp.*) 및 세라미움 종(*Ceramium sp.*)에 의한 오염 이외에도, 만각아강(*Cirripedia*) 속명(시리페드 크루스타세아(*cirriped crustacea*))에 속하는 고착성 절갑류(*Entomostraca*) 군에 의한 오염이 특히 중요하다.
- <631> 놀랍게도, 본 발명에 따른 배합물은 단독으로 또는 다른 활성 화합물과 배합시 뛰어난 방오 작용을 갖는 것으로 밝혀졌다.
- <632> 본 발명에 따른 배합물을 단독으로 또는 다른 활성 화합물과 배합 사용함으로써, 예를 들어 비스(트리알킬주석)설퍼아이드, 트리-n-부틸주석 라우레이트, 트리-n-부틸주석 클로라이드, 산화구리 (I), 트리에틸주석 클로라이드, 트리-n-부틸(2-페닐-4-클로로페녹시)주석, 트리부틸주석 옥사이드, 몰리브덴 디설퍼아이드, 산화안티몬, 중합

부틸 티타네이트, 페닐-(비스피리딘)-비스무스 클로라이드, 트리-n-부틸주석 플루오라이드, 망간 에틸렌비스티오카바메이트, 아연 디메틸디티오카바메이트, 아연 에틸렌비스티오카바메이트, 2-피리딘티올 1-옥사이드의 아연 염 및 구리 염, 비스디메틸디티오카바모일아연 에틸렌비스티오카바메이트, 산화아연, 구리(I) 에틸렌-비스디티오카바메이트, 구리 티오시아네이트, 구리 나프테네이트 및 트리부틸주석 할라이드에서의 중금속을 사용하지 않을 수 있거나, 이들 화합물의 농도를 상당히 감소시키는 것이 가능하다.

- <633> 필요에 따라, 즉석-사용 방오 페인트는 추가로 다른 활성 화합물, 바람직하게는 살조제, 살진균제, 제초제, 살연체동물제 또는 다른 방오 활성 화합물을 포함할 수 있다.
- <634> 바람직하게, 본 발명에 따른 방오 조성물과 배합하기에 적합한 성분은 다음과 같다:
- <635> 살조제, 예를 들어 2-t-부틸아미노-4-사이클로프로필아미노-6-메틸티오-1,3,5-트리아진, 디클로로펜, 디우론, 엔도탈, 펜틴 아세테이트, 이소프로투론, 메타벤즈티아주론, 옥시플루오르펜, 퀴노클라민 및 터부트린;
- <636> 살진균제, 예를 들어 벤조[b]티오펜카복실산 사이클로헥실아미드 S,S-디옥사이드, 디클로플루아니드, 플루오르폴렛, 3-요오도-2-프로피닐 부틸카바메이트, 톨릴플루아니드 및 아졸, 예를 들어 아자코나졸, 사이프로코나졸, 에폭시코나졸, 헥사코나졸, 메트코나졸, 프로피코나졸 및 테부코나졸;
- <637> 살연체동물제, 예를 들어 펜틴 아세테이트, 메트알데하이드, 메티오카브, 니클로사미드, 티오디카브 및 트리메타카브; 또는
- <638> 통상적인 방오 활성 화합물, 예를 들어 4,5-디클로로-2-옥틸-4-이소티아졸린 -3-온, 디요오도메틸파라트릴 설펜, 2-(N,N-디메틸티오카바모일티오)-5-니트로티아질, 2-피리딘티올 1-옥사이드의 포타슘, 구리, 소듐 및 아연 염, 피리딘-트리페닐보란, 테트라부틸디스탄옥산, 2,3,5,6-테트라클로로-4-(메틸설포닐)-피리딘, 2,4,5,6-테트라클로로이소프탈로니트릴, 테트라메틸티우람 디설파이드 및 2,4,6-트리클로로페닐말레이미드.
- <639> 사용된 방오 조성물은 본 발명에 따른 조성물중의 본 발명에 따른 활성 화합물을 0.001 내지 50 중량%, 특히 0.01 내지 20 중량%의 농도로 함유한다.
- <640> 추가로, 본 발명에 따른 방오 조성물은 예를 들어 문헌 [Ungerer, Chem. Ind. 1985, 37, 730-732] 및 [Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973]에 기술된 것과 같은 통상의 성분들을 함유한다.
- <641> 본 발명에 따른 살조, 살진균, 살연체동물 활성 화합물 및 살충 활성 화합물 이외에, 방오 페인트는 특히 결합제를 함유한다.
- <642> 승인된 결합제의 예로 용매 시스템중의 폴리비닐 클로라이드, 용매 시스템중의 염소화 러버, 용매 시스템, 특히 수성 시스템중의 아크릴 수지, 수성 분산물 또는 유기 용매 시스템 형태의 비닐 클로라이드/비닐 아세테이트 공중합체 시스템, 부타디엔/스티렌/아크릴로니트릴 러버, 건성유, 예를 들어 아마인유, 아스팔트 및 에폭시 화합물, 타르 또는 비투멘과 배합된 개질된 경화 수지 또는 수지 에스테르, 소량의 염소 러버, 염소화 폴리프로필렌 및 비닐 수지가 있다.
- <643> 필요에 따라, 페인트는 또한 염수중에 불용성인 것이 바람직한 무기 안료, 유기 안료 또는 착색제를 포함한다. 페인트는 또한 활성 화합물이 서서히 방출되도록 콜로이드와 같은 물질을 포함할 수 있다. 페인트는 또한 가소제, 유동성에 영향을 미치는 개질제 및 기타 통상적인 성분들을 포함할 수 있다. 본 발명에 따른 화합물 또는 상기 언급된 혼합물은 또한 자동-광택 방오 시스템에 도입될 수도 있다.
- <644> 활성 화합물은 또한 폐쇄 공간, 예를 들어 주택, 공장 홀, 사무실, 차량 캐빈 등에 출현하는 동물 해충, 특히 곤충, 거미류 및 응애를 구제하는데 적합하다. 이들은 이들 해충을 구제하기 위한 가정용 살충제 제품에서 단독으로 또는 다른 활성 화합물 및 부형제와 배합되어 사용될 수 있다. 이들은 민감성 및 내성 종 및 모든 발달 단계에 대하여 활성적이다. 이러한 해충에는 다음의 것들이 포함된다:
- <645> 전갈(Scorpionidea)목, 예를 들어 부투스 옥키타누스(*Buthus occitanus*).
- <646> 응애(Acarina)목, 예를 들어 아르가스 페르시쿠스(*Argas persicus*), 아르가스 레플렉수스(*Argas reflexus*), 브리오비아 종(*Bryobia spp.*), 데르마니수스 갈리나에(*Dermanyssus gallinae*), 글리시파구스 도메스티구스(*Glyciphagus domestigus*), 오르니토도루스 모우바트(*Ornithodoros moubat*), 리피세팔루스 산귀네우스(*Rhipicephalus sanguineus*), 트롬비쿨라 알프레드두게시(*Trombicula alfreddugesi*), 네우트롬비쿨라 아우툼날리스(*Neutrombicula autumnalis*), 데르마토파고이데스 프테로니시무스(*Dermatophagoides pteronissimus*), 데르

마토파고이데스 포리나에(*Dermatophagoides forinae*).

- <647> 진정거미(*Araneae*)목, 예를 들어 아비쿨라리다에(*Aviculariidae*), 아라네이다(*Araneidae*)
- <648> 장님거미목(*Opiliones*)목, 예를 들어 슈도스코르피오네스 첼리퍼 (*Pseudoscorpiones chelifer*), 슈도스코르피오네스 체이리디움(*Pseudoscorpiones cheiridium*), 오피리오네스 팔랑기움(*Opiliones phalangium*).
- <649> 쥐며느리(*Isopoda*)목, 예를 들어 오니스쿠스 아셀루스(*Oniscus asellus*), 포르셀리오 스카베르(*Porcellio scaber*).
- <650> 노래기(*Diplopoda*)목, 예를 들어 블라니울루스 구툴라투스(*Blaniulus guttulatus*), 폴리데스무스 종(*Polydesmus spp.*).
- <651> 지네(*Chilopoda*)목, 예를 들어 게오피루스 종(*Geophilus spp.*).
- <652> 좀(*Zygentoma*)목, 예를 들어 크테노레피스마 종(*Ctenolepisma spp.*), 레피스마 사카리나(*Lepisma saccharina*), 레피스모데스 인퀼리누스(*Lepismodes inquilinus*).
- <653> 바퀴(*Blattaria*)목, 예를 들어 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*), 블라텔라 게르마니카(*Blattella germanica*), 블라텔라 아사히나이(*Blattella asahinai*), 류코파에아 마데라에(*Leucophaea maderae*), 판클로라 종(*Panchlora spp.*), 파르코블라타 종(*Parcoblatta spp.*), 페리플라네타 아우스트랄라시아 (*Periplaneta australasiae*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 페리플라네타 브룬네아(*Periplaneta brunnea*), 페리플라네타 플리기노사 (*Periplaneta fuliginosa*), 수펠라 롱기팔파(*Supella longipalpa*).
- <654> 메뚜기(*Saltatoria*)목, 예를 들어 아케타 도메스티쿠스(*Acheta domesticus*).
- <655> 집게벌레(*Dermaptera*)목, 예를 들어 포르피쿨라 아우리쿨라리아(*Forficula auricularia*).
- <656> 흰개미(*Isoptera*)목, 예를 들어 칼로테르메스 종(*Kaloterms spp.*), 레티쿨리테르메스 종(*Reticulitermes spp.*).
- <657> 다듬이벌레(*Psocoptera*)목, 예를 들어 레피나투스 종(*Lepinatus spp.*), 리포셀리스 종(*Liposcelis spp.*).
- <658> 딱정벌레(*Coleoptera*)목, 예를 들어, 안트레누스 종(*Anthrenus spp.*), 아타게누스 종(*Attagenus spp.*), 더메스테스 종(*Dermestes spp.*), 라테티쿠스 오리자에(*Latheticus oryzae*), 네크로비아 종(*Necrobia spp.*), 프티누스 종(*Ptinus spp.*), 리조페르타 도미니카(*Rhizopertha dominica*), 시토피루스 그라나리우스 (*Sitophilus granarius*), 시토피루스 오리자에(*Sitophilus oryzae*), 시토피루스 제아마이스(*Sitophilus zeamais*), 스테고비움 파니세움(*Stegobium paniceum*).
- <659> 파리(*Diptera*)목, 예를 들어 아에데스 아에집티(*Aedes aegypti*), 아에데스 알보픽투스(*Aedes albopictus*), 아에데스 타에니오린쿠스(*Aedes taeniorhynchus*), 아노펠레스 종(*Anopheles spp.*), 칼리포라 에리트로세팔라(*Calliphora erythrocephala*), 크리소조나 플루비알리스(*Chrysosona pluvialis*), 쿨렉스 퀸쿠에파시아투스(*Culex quinquefasciatus*), 쿨렉스 피피엔스(*Culex pipiens*), 쿨렉스 타르살리스(*Culex tarsalis*), 드로소필라 종(*Drosophila spp.*), 판니아 카니쿨라리스 (*Fannia canicularis*), 무스카 도메스티카(*Musca domestica*), 플레보토무스 종(*Phlebotomus spp.*), 사르코파가 카르나리아(*Sarcophaga carnaria*), 시물리움 종(*Simulium spp.*), 스톱시스 칼시트란스(*Stomoxys calcitrans*), 티풀라 팔루도사(*Tipula paludosa*).
- <660> 나비(*Lepidoptera*)목, 예를 들어 아크로이아 그리셀라(*Achroia grisella*), 갈레리아 멜로넬라(*Galleria mellonella*), 플로디아 인터퐁크텔라(*Plodia interpunctella*), 티네아 클로아셀라(*Tinea cloacella*), 티네아 펠리오넬라(*Tinea pellionella*), 티네올라 비셀리엘라(*Tineola bisselliella*).
- <661> 벼룩(*Siphonaptera*)목, 예를 들어 크테노세팔리데스 카니스(*Ctenocephalides canis*), 크테노세팔리데스 펠리스(*Ctenocephalides felis*), 풀렉스 이리탄스(*Pulex irritans*), 툽가 페네트란스(*Tunga penetrans*), 크세노프실라 케오피스(*Xenopsylla cheopis*).
- <662> 벌(*Hymenoptera*)목, 예를 들어 캄포노투스 헤르쿨레아누스(*Camponotus herculeanus*), 라시우스 플리기노수스(*Lasius fuliginosus*), 라시우스 니거(*Lasius niger*), 라시우스 움브라투스(*Lasius umbratus*), 모노모리움 파라오니스(*Monomorium pharaonis*), 파라베스풀라 종(*Paravespula spp.*), 테트라모리움 카에스피툼(*Tetramorium caespitum*).
- <663> 이(*Anoplura*)목, 예를 들어 페디쿨루스 푸마누스 카피티스(*Pediculus humanus capitis*), 페디쿨루스 푸마누스

코르포리스(*Pediculus humanus corporis*), 프티루스 푸비스(*Pthirus pubis*).

- <664> 이시아(*Heteroptera*)목, 예를 들어 시멕스 헤미프테루스(*Cimex hemipterus*), 시멕스 렉투라리우스(*Cimex lectularius*), 로드니우스 프롤릭수스(*Rhodnius prolixus*), 트리아토마 인페스탄스(*Triatoma infestans*).
- <665> 가정용 살충제 분야에서, 이들은 단독으로 또는 다른 적합한 활성 화합물, 예를 들어 인산 에스테르, 카바메이트, 피레트로이드, 성장 조절제 또는 기타 공지된 살충제 그룹중에서 선택된 활성 화합물과 배합 사용된다.
- <666> 이들은 에어졸, 무압 스프레이 제품, 예를 들어 펌프 및 아토마이저(atomizer) 스프레이, 자동 분사 시스템, 분사기(fogger), 포움, 젤, 셀룰로오스 또는 중합체로 제조된 증발 정제, 액체 증발제, 젤 및 막 증발제를 구비한 증발 제품, 추진제-작동 증발기, 무에너지 또는 수동 증발 시스템, 모스 페이퍼(moth paper), 모스 백(bag) 및 모스 겔로서, 살포용 미끼 또는 유인 장소에서 과립 또는 분제로서 사용된다.
- <667> 본 발명에 따른 활성 화합물은 고엽제, 건조제, 줄기 킬러(haulm killer) 및 특히 잡초 킬러로서 사용될 수 있다. 잡초란, 가장 넓은 의미로 원치않는 장소에서 자라는 모든 식물을 의미한다. 본 발명에 따른 물질이 총체적 또는 선택적인 제초제로 작용하는지의 여부는 본질적으로 사용되는 양에 따라 달라진다.
- <668> 본 발명에 따른 활성 화합물은 예를 들어 하기 식물과 관련하여 사용될 수 있다:
- <669> 하기 속의 쌍떡잎 잡초: 아부틸론(*Abutilon*), 아마란투스(*Amaranthus*), 암브로시아(*Ambrosia*), 아노다(*Anoda*), 안테미스(*Anthemis*), 아파네스(*Apanes*), 아트리플렉스(*Atriplex*), 벨리스(*Belis*), 비덴스(*Bidens*), 캡셀라(*Capsella*), 카르두스(*Carduus*), 카시아(*Cassia*), 센타우레아(*Centaurea*), 케노포듐(*Chenopodium*), 시르썸(*Cirsium*), 콘볼불루스(*Convolvulus*), 다투라(*Datura*), 데스모듐(*Desmodium*), 에멕스(*Emex*), 에리시뮴(*Erysimum*), 유포르비아(*Euphorbia*), 갈레옵시스(*Galeopsis*), 갈린소가(*Galinsoga*), 갈륨(*Galium*), 히비스쿠스(*Hibiscus*), 이포모에아(*Ipomoea*), 코치아(*Kochia*), 라미움(*Lamium*), 레피듐(*Lepidium*), 린데르니아(*Lindernia*), 마트리카리아(*Matricaria*), 멘타(*Mentha*), 메르쿠리알리스(*Mercurialis*), 물루고(*Mullugo*), 미오소티스(*Myosotis*), 파파베르(*Papaver*), 파르비티스(*Pharbitis*), 플란타고(*Plantago*), 폴리곤눔(*Polygonum*), 포르툴라카(*Portulaca*), 라눈쿨루스(*Ranunculus*), 라파누스(*Raphanus*), 로리파(*Rorippa*), 로탈라(*Rotala*), 루멕스(*Rumex*), 살롤라(*Salsola*), 세네시오(*Senecio*), 세스바니아(*Sesbania*), 시다(*Sida*), 시나피스(*Sinapis*), 솔라눔(*Solanum*), 손쿠스(*Sonchus*), 스페노클레아(*Sphenoclea*), 스텔라리아(*Stellaria*), 타락사쿰(*Taraxacum*), 틀라스피(*Thlaspi*), 트리폴리움(*Trifolium*), 우르티카(*Urtica*), 베로니카(*Veronica*), 비올라(*Viola*) 및 크산튠(*Xanthium*).
- <670> 하기 속의 쌍떡잎 작물: 아라키스(*Arachis*), 베타(*Beta*), 브라시카(*Brassica*), 쿠쿠미스(*Cucumis*), 쿠쿠르비타(*Cucurbita*), 헬리안투스(*Helianthus*), 다우쿠스(*Daucus*), 글리시네(*Glycine*), 고시피움(*Gossypium*), 이포모에아(*Ipomoea*), 락투카(*Lactuca*), 리눔(*Linum*), 리코퍼시콘(*Lycopersicon*), 니코티아나(*Nicotiana*), 파세올루스(*Phaseolus*), 피숨(*Pisum*), 솔라눔(*Solanum*) 및 비시아(*Vicia*),
- <671> 하기 속의 외떡잎 잡초: 아에길롭스(*Aegilops*), 아그로피론(*Agropyron*), 아그로스티스(*Agrostis*), 알로페쿠루스(*Alopecurus*), 아페라(*Apera*), 아베나(*Avena*), 브라키아리아(*Brachiaria*), 브로무스(*Bromus*), 센크루스(*Cenchrus*), 코멜리나(*Commelina*), 시노돈(*Cynodon*), 사이페루스(*Cyperus*), 닥틸로크테니움(*Dactyloctenium*), 디기타리아(*Digitaria*), 에키노클로아(*Echinochloa*), 엘레오카리스(*Eleocharis*), 엘레우신(*Eleusin*), 에라그로티스(*Eragrotis*), 에리오클로아(*Eriochloa*), 페스투카(*Festuca*), 펴브리스틸리스(*Fimbristylis*), 헤테란테라(*Heteranthera*), 임페라타(*Imperata*), 이스카에뮴(*Ischaemum*), 랩토클로아(*Leptochloa*), 롤리움(*Lolium*), 모노코리아(*Monochoria*), 파니쿰(*Panicum*), 파스팔룸(*Paspalum*), 팔라리스(*Phalaris*), 플레움(*Phleum*), 포아(*Poa*), 로트보엘리아(*Rottboellia*), 사기타리아(*Sagittaria*), 쉬르푸스(*Scirpus*), 세타리아(*Setaria*) 및 소르굼(*Sorghum*).
- <672> 하기 속의 외떡잎 작물: 알리움(*Allium*), 아나나스(*Ananas*), 아스파라구스(*Asparagus*), 아베나(*Avena*), 호르데움(*Hordeum*), 오리자(*Oryza*), 파니쿰(*Panicum*), 사카룸(*Saccharum*), 세칼레(*Secale*), 소르굼(*Sorghum*), 트리티칼레(*Triticale*), 트리티쿰(*Triticum*) 및 제아(*Zea*).
- <673> 그러나, 본 발명에 따른 활성 화합물의 용도는 상기 속에 전혀 제한되지 않으며, 또한 동일한 방식으로 다른 식물들에까지 확대된다.
- <674> 본 발명에 따른 활성 화합물은, 농도에 따라, 예를 들어 산업 지역 및 철로위에, 그리고 나무가 자라거나 자라지 않는 보도 및 광장위에 있는 잡초들의 총체적인 방제에 적당하다. 유사하게, 본 발명에 따른 활성 화합물

은 다년생 작물, 예를 들면 조림지, 관상수 재배장, 과수원, 포도원, 감귤밭, 견과류 과수원, 바나나 농장, 커피 농장, 차 농장, 고무 농장, 야자 농장, 코코아 농장, 연한 과일 식림지 및 홉밭, 잔디, 땃장 및 목초지중의 잡초를 방제하고, 일년생 작물 중의 잡초를 선택적으로 방제하기 위해 사용될 수 있다.

- <675> 본 발명에 따른 화합물은 토양 또는 식물의 지상부에 사용한 경우 강력한 제초 활성 및 광범위 활성 스펙트럼을 나타낸다. 이들은 또한 어느 정도까지는 발아전 및 발아후 방법 둘 모두에 의해 외떡잎 및 쌍떡잎 작물에서 외떡잎 및 쌍떡잎 잡초를 선택적으로 방제하는데 적합하다.
- <676> 특정 농도 또는 적용 비율에서, 본 발명에 따른 활성 화합물은 또한 동물 해충 및 진균 또는 박테리아성 식물 질병을 구제하기 위해 사용될 수 있다. 경우에 따라, 본 발명에 따른 활성 화합물은 또한 다른 활성 화합물을 합성하기 위한 중간체 또는 전구체로도 사용될 수 있다.
- <677> 본 발명에 따라, 식물 전체 및 식물의 일부가 처리될 수 있다. 여기에서 식물이란 원하거나 원치않는 야생 식물 또는 작물(자연 발생 작물 포함)과 같은 모든 식물 및 식물 개체군을 의미한다. 작물은 식물 육종가의 권한으로 보호될 수 있거나 보호될 수 없는 식물 품종 및 유전자이식(transgenic) 식물을 포함하여, 통상적인 식물 육종 및 최적화 방법에 의해, 생명공학 및 재조합 방법에 의해 또는 이들 방법을 조합하여 얻을 수 있는 식물일 수 있다. 식물 부분은 식물의 모든 지상 및 지하 부분 및 기관, 예를 들어 싹, 잎, 꽃 및 뿌리를 의미하는 것으로 이해되어야 하며, 이들의 예로 잎, 침엽(needles), 자루(stalk), 줄기(stem), 꽃, 과실체, 과일, 종자, 뿌리, 괴경 및 뿌리 줄기가 언급될 수 있다. 식물의 일부는 또한 수확 식물, 및 영양 및 생식 번식 물질, 예를 들어 묘목, 괴경, 뿌리 줄기, 삽목 및 종자를 포함한다.
- <678> 본 발명에 따라 활성 화합물로 식물 및 식물의 일부를 처리하는 것은 통상의 처리 방법에 따라, 예를 들어 침지, 분무, 증발, 분사, 살포, 도포에 의해, 전과 물질, 특히 종자의 경우에는 또한 일 또는 다층 코팅에 의해 직접, 또는 그의 주변, 환경 또는 저장 공간에 작용시킴으로써 수행된다.
- <679> 상기 언급된 바와 같이, 본 발명에 따라 모든 식물 및 식물의 일부가 처리될 수 있다. 바람직한 구체예에서, 야생 식물종 및 식물 품종 또는 통상적인 생물학적 육종법, 예를 들어 교잡육종 또는 원형체 융합(protoplast fusion)에 의해 얻어진 식물종 및 식물 품종뿐 아니라 이들의 일부가 처리된다. 또 다른 바람직한 구체예에서, 적합하다면 통상적인 방법과 함께 유전자공학 방법에 의해 얻어진 유전자이식 식물(transgenic plant) 및 식물 품종(유전자 변형 유기체) 및 이들의 일부가 처리된다. 용어 "일부", "식물의 일부" 또는 "식물 부분"은 상술한 바와 같다.
- <680> 특히 바람직하게는, 각 경우에 시판되거나 사용중인 식물 품종의 식물이 본 발명에 따라 처리된다. 식물 품종이라는 것은 통상적인 육종 기술, 돌연변이형성 기술 또는 재조합 DNA 기술에 의해 얻어지고 있는 특정 성질("특성")을 갖는 식물로 이해된다. 이들은 품종(variety), 생리형(biotype) 또는 유전자형(genotype)일 수 있다.
- <681> 식물 종 또는 식물 품종, 이들의 위치 및 성장 조건(토양, 기후, 생장기, 사료)에 따라, 본 발명에 따라 처리함으로써 또한 상기("상승")적 효과가 나타날 수 있다. 따라서, 예를 들어 본 발명에 따라 사용될 수 있는 물질 및 조성물의 적용비율의 감소 및/또는 활성 스펙트럼의 확대 및/또는 활성 증가, 식물 성장성 향상, 고온 또는 저온 내성 증가, 가뭄, 또는 물 또는 토양 염분에 대한 내성 증가, 개화량 증가, 수확 용이성, 성숙성 촉진, 작화량 증가, 수확 작물의 질 향상 및/또는 영양가 증대, 및 수확 작물의 저장 품질 및/또는 처리성 증대와 같은 효과가 실제 기대되는 것 이상으로 나타날 수 있다.
- <682> 본 발명에 따라 바람직하게 처리되는 유전자이식 식물 또는 식물 품종(즉, 유전 공학적으로 얻어진 것)은 유전자 변형식 식물에 특히 유리한 유용성("특성")을 제공하는 유전자 물질을 수용하는 모든 식물을 포함한다. 이러한 특성의 예로는 식물 성장성 향상, 고온 또는 저온 내성 증가, 가뭄, 또는 물 또는 토양 염분에 대한 내성 증가, 개화량 증가, 수확 용이성, 성숙성 촉진, 작화량 증가, 수확 작물의 질 향상 및/또는 영양가 증대, 및 수확 작물의 저장 품질 및/또는 처리성 증대가 포함된다. 추가적으로 특히 주목할만한 상기 특성의 예로 동물 및 미생물 해충, 예를 들어 곤충, 응애, 식물병원성 진균, 박테리아 및/또는 바이러스에 대한 식물의 방어력 증가 및 또한 특정 제초 활성 화합물에 대한 식물의 내약성 증가가 있다. 유전자이식 식물의 예로 중요한 작물, 예를 들어 곡물(밀, 보리), 옥수수, 대두, 감자, 목화, 유채 및 또한 과수 식물(사과, 배, 감귤 및 포도 과일이 열리는)이 언급될 수 있으며, 옥수수, 대두, 감자, 목화 및 유채가 특히 주목된다. 특히 중요한 특성은 식물에 형성된 독소, 특히 바실러스 투링기엔시스(*Bacillus thuringiensis*)로부터 얻은 유전자 물질(예를 들어 유전자 CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb 및 CryIF 및 이들 조

합)에 의해 식물(이후 "Bt 식물"로 언급)에 형성된 독소로 인한 곤충에 대한 식물의 방어력 증가이다. 또한, 특히 중요한 특성은 전신적으로 획득한 내성(SAR), 시스테민, 피토알렉신, 엘리시터 및 내성 유전자 및 상응하게 발현된 단백질 및 독소로 인해 진균, 박테리아 및 바이러스에 대한 식물의 내성이 증가한 것이다. 특히 중요한 특성은 또한 특정 제초 활성 화합물, 예를 들어 이미다졸리논, 설폰닐우레아, 글리포세이트 또는 포스포노트리신(예를 들어 "PAT" 유전자)에 대한 식물의 내약성 증가다. 목적하는 해당 특성을 부여하는 유전자가 또한 상호 조합으로 유전자 식물에 존재할 수 있다. "Bt 식물"의 예로 YIELD GARD^R(예: 옥수수, 목화, 대두), KnockOut^R(예: 옥수수), StarLink^R(예: 옥수수), Bollgard^R(예: 목화), Nucotn^R(예: 목화) 및 NewLeaf^R(예: 감자) 상품명으로 시판되고 있는 옥수수 품종, 목화 품종, 대두 품종 및 감자 품종이 언급될 수 있다. 제초제-내약성 식물의 예로 Roundup Ready^R(글리포세이트 내약성, 예: 옥수수, 목화, 대두), Liberty Link^R(포스포노트리신 내약성, 예: 유채), IMI^R(이미다졸리논 내약성) 및 STS^R(설폰닐우레아 내약성, 예: 옥수수) 상품명으로 시판되고 있는 옥수수 품종, 목화 품종 및 대두 품종이 언급될 수 있다. 제초제-내약성 식물(제초제 내약성을 위해 통상적인 방법으로 육종된 식물)의 예로 Clearfield^R 명으로 시판되고 있는 품종(예: 옥수수)이 또한 언급될 수 있다. 물론, 상기 설명은 또한 미래에 개발될 수 있고/있거나 상품화될 식물로, 상술된 유전적 특성을 지니거나 유전자 특성이 여전히 개발될 여지가 남아 있는 식물 품종에도 적용된다.

- <683> 상기 언급된 식물들은 본 발명에 따라 일반식 (I)의 화합물로 특히 유리한 방식으로 처리될 수 있다. 이들 활성 화합물에 대한 상기 언급된 바람직한 범위가 또한 이들 식물을 처리하는데 적용된다. 본 명세서에 구체적으로 언급된 혼합물로 식물을 처리하는 것이 특히 유리하다.
- <684> 본 발명에 따른 활성 화합물은 용액제, 유제, 수화성 산제, 현탁액, 산제, 분제, 페이스트, 가용성 산제, 과립제, 현탁액-유제 농축액, 활성 화합물이 주입된 천연 및 합성물질, 및 중합물질 중의 마이크로캡셀제와 같은 통상의 제제로 전환될 수 있다.
- <685> 이들 제제는 공지된 방법으로, 예를 들어, 임의로 계면활성제, 즉 유화제 및/또는 분산제 및/또는 포움 형성제를 사용하여 활성 화합물을 증량제, 즉 액체 용매 및/또는 고형 담체와 혼합하여 제조한다.
- <686> 사용된 증량제가 물인 경우, 예를 들어 유기용매가 또한 공동 용매로 사용될 수 있다. 액체 용매로서, 주로 크실렌, 톨루엔 또는 알킬나프탈렌과 같은 방향족 화합물, 클로로벤젠, 클로로에틸렌 또는 메틸렌 클로라이드와 같은 염소화 방향족 또는 염소화 지방족 탄화수소, 사이클로헥산 또는 파라핀, 예를 들어, 광유 분획물, 광유 및 식물유와 같은 지방족 탄화수소, 부탄올 또는 글리콜과 같은 알콜 및 이들의 에테르 및 에스테르, 아세톤, 메틸 에틸 케톤, 메틸 이소부틸 케톤 또는 사이클로헥사논과 같은 케톤, 디메틸포름아미드 및 디메틸설폭사이드와 같은 강한 극성 용매 또는 물이 적합하다.
- <687> 적합한 고형 담체는, 예를 들어 암모늄염, 및 카올린, 점토, 활석, 초크, 석영, 아타펄기트, 몬트모릴로나이트 또는 규조토와 같은 분쇄된 천연 광물, 및 고분산 실리카, 알루미늄 및 실리케이트와 같은 분쇄된 합성 물질이다. 적합한 과립제용 고형 담체는, 예를 들어 방해석, 대리석, 경석, 해포석 및 백운석과 같은 분쇄 및 분류된 천연 암석, 또는 무기 및 유기 가루의 합성 과립, 및 톱밥, 코코넛 껍질, 옥수수 속대 및 담배줄기와 같은 유기물질의 과립이다. 적합한 유화제 및/또는 포움 형성제는 예를 들어 비이온성 및 음이온성 유화제, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 지방산 에스테르, 폴리옥시에틸렌 지방 알콜 에테르, 예를 들어 알킬아릴 폴리글리콜 에테르, 알킬설포네이트, 알킬설페이트, 아릴설포네이트 또는 단백질 가수분해물이다. 적합한 분산제는, 예를 들어 리그닌-설파이트 페액 및 메틸셀룰로오즈이다.
- <688> 점착제, 예를 들어 카복시메틸셀룰로오즈, 및 아라비아고무, 폴리비닐 알콜 및 폴리비닐 아세테이트와 같은 분말, 과립 또는 라텍스 형태의 천연 및 합성 중합체, 및 또한 세팔린 및 레시틴과 같은 천연 인지질, 및 합성 인지질이 제제에 사용될 수 있다. 그외의 첨가제는 광유 및 식물유일 수 있다.
- <689> 착색제, 예를 들어 산화철, 산화티탄 및 프루시안 블루 등의 무기안료, 및 알리자린 착색제, 아조 착색제 및 금속 프탈로시아닌 착색제 등의 유기 착색제 및 철, 망간, 붕소, 구리, 코발트, 몰리브덴 및 아연의 염과 같은 미량 영양소가 사용될 수도 있다.
- <690> 제제는 일반적으로 0.1 내지 95 중량%, 바람직하게는 0.5 내지 90 중량%의 활성 화합물을 함유한다.
- <691> 잡초를 방제하는 경우, 본 발명에 따른 활성 화합물은 그 자체로 또는 그의 제제 중에서 공지된 제초제 및/또는 작물과의 상용성(compatibility)을 향상시키는 물질("독성완화제"(safener))과의 혼합물로서 사용될 수 있으며,

완제품 제제 또는 탱크 믹스(tank mix)가 가능하다. 하나 이상의 공지된 제초제 및 독성완화제를 포함하는 잡초-킬러와의 혼합물이 또한 가능하다.

<692> 혼합물에 가능한 성분은 공지된 제초제, 예를 들어 아세트클로르, 아시플루오르펜(-소듐), 아클로니펜, 알라클로르, 알록시딤(-소듐), 아메트린, 아미카바존, 아미도클로르, 아미도설푸론, 아닐로포스, 아설람, 아트라진, 아자페니딘, 아짐설푸론, BAS-662H, 베플루타미드, 베나졸린(-에틸), 벤푸레세이트, 벤설푸론(-메틸), 벤타존, 벤즈펜디존, 벤조비사이클론, 벤조페납, 벤조일프로프(-에틸), 비알라포스, 비페녹스, 비스피리박(-소듐), 브로모부타이드, 브로모페녹심, 브로목시닐, 부타클로르, 부타페나실(-알릴), 부트록시딤, 부틸레이트, 카펜스트롤, 칼록시딤, 카베타미드, 카펜트라존(-에틸), 클로메톡시펜, 클로람벤, 클로리다존, 클로리무론(-에틸), 클로르니트로펜, 클로르설푸론, 클로르톨루론, 시니돈(-에틸), 신메틸린, 시노설푸론, 클레폭시딤, 클레토딤, 클로디나포프(-프로파길), 클로마존, 클로메프로프, 클로피랄리드, 클로피라설푸론(-메틸), 클로란설텐(-메틸), 쿠밀우론, 시아나진, 사이부트린, 사이클로에이트, 사이클로설푼, 시아클록시딤, 사이할로포프(-부틸), 2,4-D, 2,4-DB, 데스메디팜, 디알레이트, 디캄바, 디클로르프로프(-P), 디클로포프(-메틸), 디클로설텐, 디에타릴(-에틸), 디펜조쿠아트, 디플루페니칸, 디플루벤조피르, 디메푸론, 디메피페레이트, 디메타클로르, 디메타메트린, 디메텐아미드, 디멕시코람, 디니트라민, 디펜아미드, 디쿠아트, 디티오피르, 디우론, 덤론, 에프로포단, EPTC, 에스프로카브, 에탈플루랄린, 에타메트설푸론(-메틸), 에토푼메세이트, 에톡시펜, 에톡시설푸론, 에토벤자니드, 페녹사프로프(-P-에틸), 펜트라자미드, 플람프로프(-이소프로필, -이소프로필-L, -메틸), 플라자설푼, 플로라설텐, 플루아지포프(-P-부틸), 플루아졸레이트, 플루카바존(-소듐), 플루페나세트, 플루메트설푼, 플루미클로락(-펜틸), 플루미옥사진, 플루미프로핀, 플루메트설푼, 플루오메투론, 플루오로클로리돈, 플루오로글리코펜(-에틸), 플루록삼, 플루프로파실, 플루르피르설푼(-메틸, -소듐), 플루레놀(-부틸), 플루리돈, 플루록시피르(-부트록시프로필, -맵틸), 플루르프리미돌, 플루르타몬, 플루티아세트(-메틸), 플루티아미드, 포메사펜, 포람설푼, 글루포시네이트(-암모늄), 글리포세이트(-이소프로필암모늄), 할로사펜, 할록시포프(-에톡시에틸, -P-메틸), 헥사지논, 이마자메타벤즈(-메틸), 이마자메타피르, 이마자목스, 이마자픽, 이마자피르, 이마자핀, 이마제타피르, 이마조설푼, 요오도설푼(-메틸, -소듐), 이옥시닐, 이소프로팔린, 이소프로투론, 이소우론, 이속사벤, 이속사클로르톨, 이속사플루톨, 이속사피리포프, 락토펴, 레나실, 리누론, MCPA, 메코프로프, 메페나세트, 메소트리온, 메타미트론, 메타자클로르, 메타벤즈티아주론, 메토벤주론, 메토브로무론, (알파-)메톨라클로르, 메토설푼, 메톡수론, 메트리부진, 메트설푼(-메틸), 몰리네이트, 모놀리누론, 나프로아닐리드, 나프로파미드, 네부론, 니코설푼, 노르플루라존, 오르벤카브, 오리잘린, 옥사디아르길, 옥사디아존, 옥사설푼, 옥사지클로메폰, 옥시플루오르펜, 파라쿠아트, 펠라르곤산, 펜디메탈린, 펜드랄린, 펜톡사존, 펜메디팜, 피콜리나펜, 피페로포스, 프레틸라클로르, 프리미설푼(-메틸), 프로플루아졸, 프로메트린, 프로파클로르, 프로파닐, 프로파퀴자포프, 프로피소클로르, 프로카바존(-소듐), 프로피자미드, 프로설푼, 피라플루펜(-에틸), 피라조길, 피라졸레이트, 피라조설푼(-에틸), 피라족시펜, 피리벤족심, 피리부티카브, 피리데이트, 피리다톨, 피리프탈리드, 피리미노박(-메틸), 피리티오박(-소듐), 퀴클로락, 퀴메락, 퀴노클라민, 퀴잘로포프(-P-에틸, -P-테푸릴), 림설푼, 세톡시딤, 시마진, 시메트린, 설푼트리온, 설푼트라존, 설푼메투론(-메틸), 설푼세이트, 설푼설푼, 테부탐, 테부티우론, 테프랄록시딤, 터부틸라진, 터부트린, 테닐클로르, 티아플루아미드, 티아조피르, 티아디아지민, 티펜설푼(-메틸), 티오벤카브, 티오카바질, 트랄록시딤, 트리알레이트, 트리아설푼, 트리베누론(-메틸), 트리클로피르, 트리디관, 트리플루랄린, 트리플록시설푼, 트리플루설푼(-메틸) 및 트리토설푼이다.

<693> 살진균제, 살충제, 살비제, 살선충제, 새 퇴치제, 식물 영양제 및 토양 구조개선제와 같은 그 밖의 다른 공지된 활성 화합물과의 혼합물이 또한 가능하다.

<694> 활성 화합물은 그 자체로, 그의 제제 형태로 또는 이들을 추가로 희석하여 제조된 사용형태, 예를 들어 즉시 사용형 용액제, 현탁제, 유제, 산제, 페이스트 및 과립제로 사용될 수 있다. 이들은 통상적인 방법으로, 예를 들어 살수, 분무, 분사 또는 살포에 의해 사용된다.

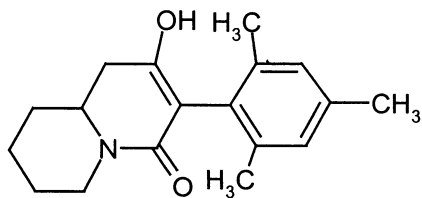
<695> 본 발명에 따른 활성 화합물은 식물의 발아 전후 모두에 적용될 수 있다. 이들은 또한 파종전에 토양에 혼입시킬 수도 있다.

<696> 사용되는 활성 화합물의 양은 비교적 넓은 범위내에서 변화될 수 있다. 이는 본질적으로 목적하는 효과의 특성에 따라 달라진다. 일반적으로 사용량은 토양 표면 1 헥타르당 활성 화합물 1 g 내지 10 kg, 바람직하게는 5 g 내지 5 kg이다.

<697> 본 발명에 따른 활성 화합물의 제조에 및 사용예가 하기 실시예로 설명된다.

<698> 제조 실시예:

<699> 실시예 I-a-1



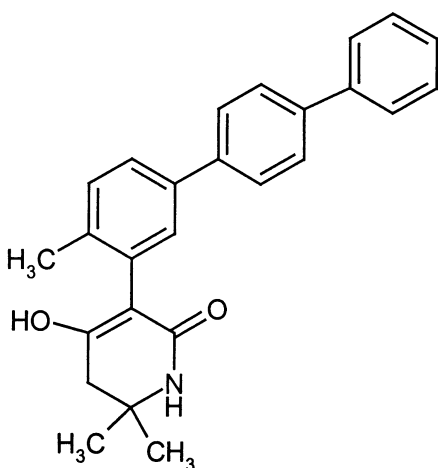
<700>

<701> 무수 톨루엔 70 ml중의 수소화나트륨 3.9 g(0.13 몰)을 가열환류시키고, 무수 톨루엔 100 ml중의 실시예 (II-1)의 화합물 33.1 g을 적가하였다. 반응을 박막 크로마토그래피로 모니터하였다. 냉각하면서, 에탄올을 수소가 발생하지 않을 때까지 첨가하고, 용매를 증발시킨 다음, 물을 첨가하였다. 톨루엔 상을 분리한 후, 수성 상을 0 내지 20 °C에서 농염산으로 산성화시키고, 침전을 여과하여 건조시켰다.

<702> 생성물을 실리카겔 칼럼 크로마토그래피(디클로로메탄/에틸 아세테이트 3:1)에 의해 정제하였다.

<703> 수율: 8.41 g(이론치의 30%), 융점 127 °C.

<704> 실시예 I-a-2



<705>

<706> 실온에서, 실시예 (I-a-4)의 화합물 3 밀리몰을 우선 DME(디메톡시에탄) 8 ml에 도입하고, 1M NaCO₃ 용액 6.9 ml를 첨가하였다. 비페닐보론산 4.5 밀리몰 및 이어서 Pd(PPh₃)₂Cl₂ 0.15 밀리몰을 차례로 첨가하고, 혼합물을 실온에서 1 시간동안 교반한 후, 85 °C에서 16 시간동안 교반하였다.

<707> 사이클로헥산/에틸 아세테이트(100:1 → 1:1 구배)를 이동상으로 사용하여 실리카겔상에서 정제하였다.

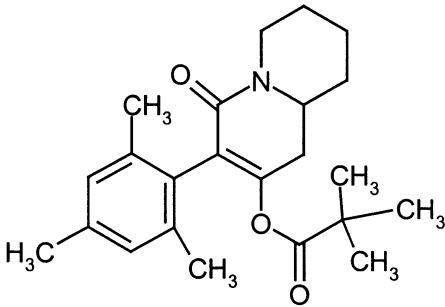
<708> 수율: 0.302 g(이론치의 26.3%), 오일.

<709> 실시예 (I-a-1) 및 (I-a-2)와 유사하게, 그리고 일반적인 제조설명에 따라 하기 일반식 (I-a)의 화합물을 수득하였다.

| 실시예번호 | W | X | Y | Z | A | B | D | Q ¹ | Q ² | m.p. °C |
|--------|-------------------------------|-----------------|---|-------------------|---|-----------------|------------------------------------|-----------------|-----------------|---------|
| I-a-12 | CH ₃ | CH ₃ | 4-CH ₃ | H | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | 138 |
| I-a-13 | CH ₃ | CH ₃ | 3-CH ₃ | 4-CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | 오일 |
| I-a-14 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | 214 |
| I-a-15 | CH ₃ | CH ₃ | 4-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | 204 |
| I-a-16 | CH ₃ | CH ₃ | 4-CH ₃ | H | -(CH ₂) ₅ - | | H | H | H | 206 |
| I-a-17 | CH ₃ | CH ₃ | 3-CH ₃ | 4-CH ₃ | -(CH ₂) ₅ - | | H | H | H | 193 |
| I-a-18 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | -(CH ₂) ₅ - | | H | H | H | 203 |
| I-a-19 | CH ₃ | Cl | 4-Cl | H | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | 182 |
| I-a-20 | CH ₃ | Cl | 4-Cl | H | -(CH ₂) ₅ - | | H | H | H | 135 |
| I-a-21 | Cl | Cl | H | H | H | H | -(CH ₂) ₄ - | | H | 206 |
| I-a-22 | H | Cl | 4-Cl | H | H | H | -(CH ₂) ₄ - | | H | 182 |
| I-a-23 | CH ₃ | CH ₃ | 4-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | -(CH ₂) ₅ - | | H | H | H | 204 |
| I-a-24 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | -(CH ₂) ₄ - | | H | 196 |
| I-a-25 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 196 |
| I-a-26 | CH ₃ | Cl | 4-Cl | H | H | H | ▷— | CH ₃ | CH ₃ | 191 |
| I-a-27 | C ₂ H ₅ | Cl | 4-Br | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | |
| I-a-28 | CH ₃ | Cl | 4-Cl | H | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | | H | H | H | 264 |
| I-a-29 | CH ₃ | CH ₃ | 4-Cl | H | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | | H | H | H | 300 |
| I-a-30 | CH ₃ | CH ₃ | 4-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | -(CH ₂) ₄ | | H | 315 |

| 실시예번호 | W | X | Y | Z | A | B | D | Q ¹ | Q ² | m.p. °C |
|--------|-----------------|-----------------|---|---|---|---|---|---|----------------|---------|
| I-a-31 | CH ₃ | Cl | 4-Cl | H | H | H | H | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | | 311 |
| I-a-32 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | H | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | | 154 |
| I-a-33 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | H | -(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ - | | |
| I-a-34 | CH ₃ | Cl | 4-Cl | H | H | H | H | -(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ - | | |

실시예 I-b-1

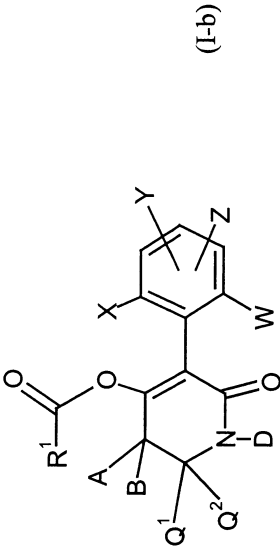


<716> 0 내지 10 ℃에서, 메틸 t-부틸 에테르 70 ml중의 실시예 (I-a-1)의 화합물 4.95 g을 무수 피리딘 1.4 ml 및 에틸디이소프로필아민 2.94 ml와 혼합하였다. 메틸 t-부틸 에테르 5 ml중의 피발로일 클로라이드 2.2 ml를 첨가하고, 혼합물을 실온에서 교반하였다. 혼합물을 흡인여과하여 잔류물을 메틸 t-부틸 에테르로 세척한 후, 용액을 농축시켰다. 반응 혼합물을 칼럼 크로마토그래피하였다(사이클로헥산/에틸아세테이트 1:1)에 의해 정제하였다.

<717> 수율: 3.42 g(이론치의 55%), 오일.

<718> 실시예 (I-b-1)과 유사하게, 그리고 일반적인 제조설명에 따라 하기 일반식 (I-b)의 화합물을 수득하였다.

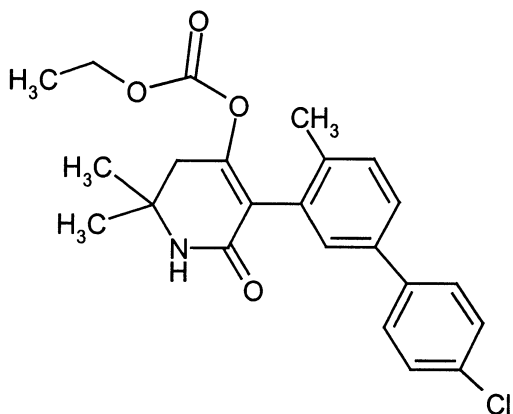
<719> 표 2



| 실시예번호 | W | X | Y | Z | A | B | D | Q ¹ | Q ² | R ¹ | m.p. °C |
|-------|----|-----------------|---|---|------------------------------------|---|------------------------------------|------------------------------------|-----------------|---------------------------------|---------|
| I-b-2 | Cl | Cl | H | H | H | H | -(CH ₂) ₄ - | -(CH ₂) ₄ - | H | CH ₃ | 124 |
| I-b-3 | Cl | Cl | H | H | H | H | -(CH ₂) ₄ - | -(CH ₂) ₄ - | H | t-C ₄ H ₉ | 130 |
| I-b-4 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | H | H | i-C ₃ H ₇ | 183 |
| I-b-5 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | i-C ₃ H ₇ | 167 |
| I-b-6 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | | 199 |
| I-b-7 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | | 234 |
| I-b-8 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | | 178 |

<720>

<721> 실시예 I-c-1



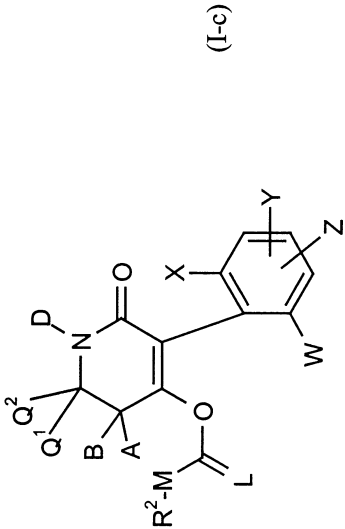
<722>

<723> 무수 디클로로메탄 30 ml중의 실시예 (I-a-5)의 화합물 1.3 g을 10 내지 20 ℃에서 트리에틸아민 0.42 ml와 혼합하고, 이어서 무수 디클로로메탄 2 ml중의 에틸 클로로포르메이트 0.3 ml와 혼합한 후, 혼합물을 실온에서 교반하였다. 반응 혼합물을 0.5N NaOH 10 ml로 2회 세척하고, 용액을 황산마그네슘상에서 건조시킨 후, 회전 증발기를 이용하여 농축시켰다. 생성물을 실리카겔 칼럼 크로마토그래피(디클로로메탄/에틸 아세테이트, 3/1)에 의해 정제하였다.

<724> 수율: 1.1 g(이론치의 88%), 융점: 195 ℃.

<725> 실시예 (I-c-1)과 유사하게, 그리고 일반적인 제조설명에 따라 하기 일반식 (I-c)의 화합물을 수득하였다.

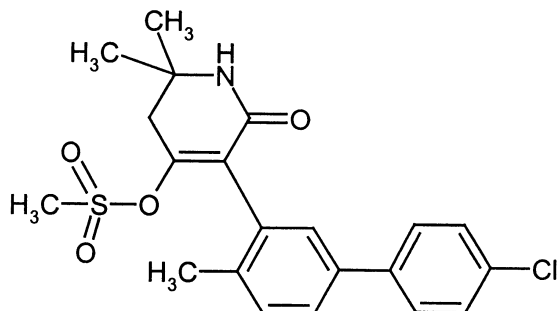
<726> 표 3



| 실시예번호 | W | X | Y | Z | A | B | D | Q ¹ | Q ² | L | M | R ² | m.p.°C |
|-------|-----------------|-----------------|---|---|-----------------|-----------------|---|-----------------|-----------------|---|---|-------------------------------|---------|
| I-c-2 | CH ₃ | CH ₃ | 4-CH ₃ | H | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | O | O | C ₂ H ₅ | 190 |
| I-c-3 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | O | O | C ₂ H ₅ | 203 |
| I-c-4 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₅) | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | O | O | | 180 |
| I-c-5 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | O | O | | 216 |
| I-c-6 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | O | S | | 165-167 |

<727>

<728> 실시예 I-d-1

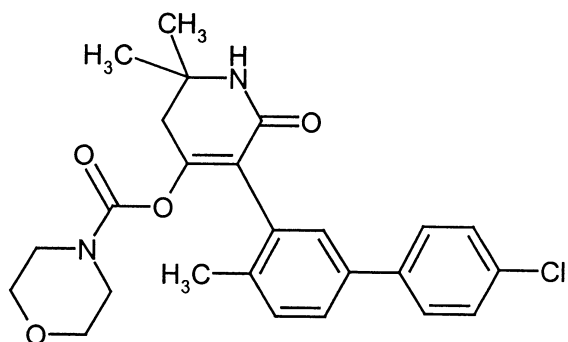


<729>

<730> 무수 디클로로메탄 10 ml중의 제조 실시예 (I-a-5)의 화합물 1.02 g(3 밀리몰)을 트리에틸아민 0.54 ml와 혼합하였다. 메탄설폰닐 클로라이드 0.26 ml(3.3 밀리몰)를 소량의 디클로로메탄에 용해시키고, 빙냉하면서 적가하였다. 혼합물을 실온에서 2 시간동안 교반하였다. 반응 용액을 10% 시트르산으로 세척한 후, 디클로로메탄으로 추출하였다. 유기상을 1N NaOH 용액으로 세척하고, 건조시켰다.

<731> 수율: 1.05 g(이론치의 83%), 융점: 198-200 °C.

<732> 실시예 I-A-g-1



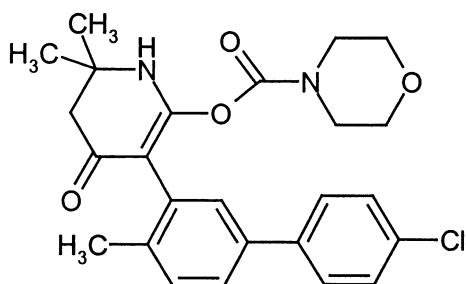
<733>

<734> 제조 실시예 (I-a-5)의 화합물 1.02 g(3 밀리몰) 및 트리에틸아민 0.54 ml(3.90 밀리몰)를 무수 에틸 아세테이트 10 ml에 용해시키고, 가열환류시켰다. 무수 에틸 아세테이트 2 ml중의 모르폴린-N-카보닐 클로라이드 0.47 g(3.15 밀리몰)을 첨가하였다. 혼합물을 2 시간동안 가열환류시켰다.

<735> 용매를 증류시킨 후, 잔류물을 디클로로메탄 50 ml에 용해시켰다. 혼합물을 반농축 NaCl 용액 30 ml로 2 회 세척하고, 0.5N NaOH 용액 30 ml로 2 회 추출하였다. 유기상을 건조시킨 후, 농축하였다. 생성물을 실리카 겔 칼럼 크로마토그래피(사이클로헥산/에틸 아세테이트, 5:1 →1:1)에 의해 정제하였다.

<736> 수율: 0.200 g(이론치의 15%), 융점: 221-223 °C.

<737> 실시예 I-B-g-1



<738>

<739> 제조 실시예 (I-a-5)의 화합물 1.02 g(3 밀리몰) 및 트리에틸아민 0.54 ml(3.90 밀리몰)를 무수 에틸 아세테이트 10 ml에 용해시키고, 가열환류시켰다. 무수 에틸 아세테이트 2 ml중의 모르폴린-N-카복실산 0.47 g(3.15

밀리몰)을 첨가하였다. 혼합물을 2 시간동안 가열환류시켰다.

<740>

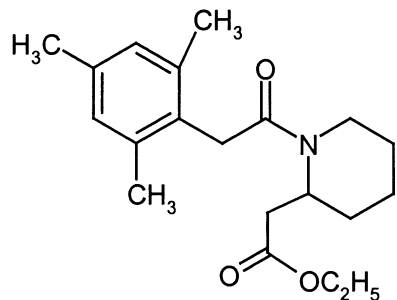
용매를 증류시킨 후, 잔류물을 디클로로메탄 50 ml에 용해시켰다. 혼합물을 반농축 NaCl 용액 30 ml로 2 회 세척하고, 0.5N NaOH 용액 30 ml로 2 회 추출하였다. 유기상을 건조시키고, 농축하였다. 생성물을 실리카겔 칼럼 크로마토그래피(사이클로헥산/에틸 아세테이트, 5:1 →1:1)에 의해 정제하였다.

<741>

수율: 0.480 g(이론치의 35%), 융점: 95-97 °C.

<742>

실시예 II-1



<743>

<744>

0 내지 10 °C에서, 트리에틸아민 14 ml를 무수 테트라하이드로푸란 130 ml중의 에틸 2-피페리딘-아세테이트 17.1 g에 첨가하였다. 실온에서, 무수 테트라하이드로푸란 20 ml중의 메시틸렌 아세틸 클로라이드 19.7 g을 첨가하였다.

<745>

반응 용액을 빙수 0.5 l에 첨가하고, 1N HCl 100 ml로 산성화시켰다. 용액을 디클로로메탄으로 추출하고, 추출물을 건조시킨 후, 용매를 증발시켰다.

<746>

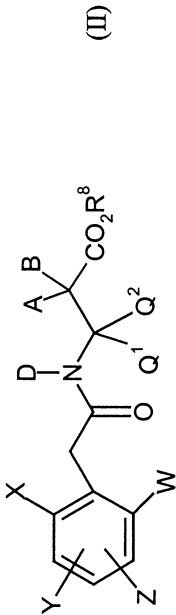
수율: 33.4 g(이론치의 100%).

<747>

실시예 (II-1)과 유사하게, 그리고 일반적인 제조설명에 따라 하기 일반식 (II)의 화합물을 수득하였다.



<748>

표 4



| 실시예번호 | W | X | Y | Z | A | B | D | Q ¹ | Q ² | R ⁸ | m.p.°C |
|-------|-------------------------------|-----------------|---|-------------------|-----------------|-----------------|------------------------------------|-----------------|-----------------|-------------------------------|--------|
| II-2 | Cl | Cl | H | H | H | H | -(CH ₂) ₄ - | CH ₃ | H | C ₂ H ₅ | 89 |
| II-3 | H | CH ₃ | 5-Br | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 101 |
| II-4 | CH ₃ | Cl | 4-Cl | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 87 |
| II-5 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 94 |
| II-6 | CH ₃ | Cl | 4-Br | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 118 |
| II-7 | C ₂ H ₅ | Cl | 4-Br | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 113 |
| II-8 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | C ₂ H ₅ | 97 |
| II-9 | H | CH ₃ | 4-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | C ₂ H ₅ | 123 |
| II-10 | CH ₃ | Cl | 4-Cl | H | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | C ₂ H ₅ | 114 |
| II-11 | CH ₃ | CH ₃ | 3-CH ₃ | 4-CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | C ₂ H ₅ | 124 |

<749>

| 실시예번호 | W | X | Y | Z | A | B | D | Q ¹ | Q ² | R ⁸ | m.p.°C |
|-------|-----------------|-------------------------------|---|-------------------|---|---|---|---|---|-------------------------------|--------|
| II-12 | CH ₃ | CH ₃ | 4-CH ₃ | H | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | C ₂ H ₅ | 123 |
| II-13 | CH ₃ | CH ₃ | 4-CH ₃ | H | -(CH ₂) ₅ - | -(CH ₂) ₅ - | H | H | H | C ₂ H ₅ | 126 |
| II-14 | CH ₃ | CH ₃ | 3-CH ₃ | 4-CH ₃ | -(CH ₂) ₅ - | -(CH ₂) ₅ - | H | H | H | C ₂ H ₅ | 146 |
| II-15 | CH ₃ | Cl | 4-Cl | H | -(CH ₂) ₅ - | -(CH ₂) ₅ - | H | H | H | C ₂ H ₅ | 123 |
| II-16 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | -(CH ₂) ₅ - | -(CH ₂) ₅ - | H | H | H | C ₂ H ₅ | 120 |
| II-17 | CH ₃ | CH ₃ | 4-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | -(CH ₂) ₅ - | -(CH ₂) ₅ - | H | H | H | C ₂ H ₅ | 150 |
| II-18 | H | Cl | 4-Cl | H | H | H | -(CH ₂) ₄ - | -(CH ₂) ₄ - | H | C ₂ H ₅ | 오일 |
| II-19 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | -(CH ₂) ₄ - | -(CH ₂) ₄ - | H | C ₂ H ₅ | 오일 |
| II-20 | CH ₃ | CH ₃ | 4-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | -(CH ₂) ₄ - | -(CH ₂) ₄ - | H | C ₂ H ₅ | 115 |
| II-21 | CH ₃ | Cl | 4-Cl | H | H | H |  | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 오일 |
| II-22 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H |  | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 오일 |
| II-23 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 오일 |
| II-24 | Cl | C ₂ H ₅ | 4-Br | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 오일 |
| II-25 | CH ₃ | CH ₃ | 6-CH ₃ | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 오일 |
| II-26 | CH ₃ | Cl | 4-Cl | H | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | H | H | H | C ₂ H ₅ | 121 |
| II-27 | CH ₃ | CH ₃ | 4-Cl | H | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | H | H | H | C ₂ H ₅ | 126 |
| II-28 | CH ₃ | Cl | 4-Cl | H | H | H | H | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | C ₂ H ₅ | 117 |
| II-29 | CH ₃ | CH ₃ | 4-Cl | H | H | H | H | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | C ₂ H ₅ | 117 |

| 실시예번호 | W | X | Y | Z | A | B | D | Q ¹ | Q ² | R ⁸ | m.p.°C |
|-------|-------------------------------|-----------------|---|---|---|---|---|---|-----------------|-------------------------------|--------|
| II-30 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | H | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | | C ₂ H ₅ | 118 |
| II-31 | CH ₃ | Cl | 4-(4-Cl-C ₆ H ₅) | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 99 |
| II-32 | C ₂ H ₅ | Cl | 4-(4-Cl-C ₆ H ₅) | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 오일 |
| II-33 | CH ₃ | Cl | 4-Cl | H | H | H | H | -(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ - | | C ₂ H ₅ | 113 |
| II-34 | C ₂ H ₅ | Cl | 4-Br | H | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | | H | H | H | C ₂ H ₅ | 139 |
| II-35 | H | CH ₃ | 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) | H | H | H | H | -(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ - | | C ₂ H ₅ | 124 |
| II-36 | C ₂ H ₅ | Cl | 5-Br | H | H | H | H | -(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ - | | C ₂ H ₅ | 115 |

사용 실시예

실시예 A

멜로이도기네 시험

용 매 : 디메틸포름아미드 30 중량부

유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

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

용기에 모래, 활성 화합물 용액, 멜로이도기네 인코그니타(*Meloidogyne incognita*) 알/유충 현탁액 및 상처씨를

도입하였다. 상치씨가 발아하여 식물로 자라났다. 뿌리에 흑벌레가 생겼다.

<759> 일정한 기간이 경과한 후에, 흑벌레 형성의 정도로 살선충 작용성을 %로 결정하였다. 100 %란 흑벌레가 전혀 관찰되지 않았음을 의미하고, 0 %란 처리 식물상의 흑벌레수가 비처리 대조군의 것에 상응함을 의미한다.

<760> 이 시험에서는, 예를 들어 제조 실시예 (I-a-4)의 화합물이 20 ppm의 예시적인 활성 화합물 농도에서, 14 일후 95%의 구제율을 나타내었다.

<761> 실시예 B

<762> 테트라니쿠스 시험(OP-내성/침지 처리)

<763> 용 매 : 디메틸포름아미드 30 중량부

<764> 유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

<765> 활성 화합물 1 중량부를 상기 언급된 양의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적 농도가 되도록 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

<766> 모든 단계의 점박이 응애(테트라니쿠스 우르티카에(*Tetranychus urticae*))로 심하게 감염된 대두 식물(파세올루스 불가리스(*Phaseolus vulgaris*))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하였다.

<767> 일정한 기간이 경과한 후에, 구제율 %를 결정하였다. 100 %란 모든 점박이 응애가 사멸되었음을 의미하며; 0 %란 점박이 응애가 하나도 사멸되지 않았음을 의미한다.

<768> 이 시험에서는, 예를 들어 제조 실시예 (I-a-5) 및 (I-c-1)의 화합물이 각각 100 ppm의 예시적인 활성 화합물 농도에서 7 일후, 99%(I-a-5) 및 95%(I-c-1)의 구제율을 나타내었다.

<769> 실시예 C

<770> 발아후 시험

<771> 용 매: 아세톤 5 중량부

<772> 유화제: 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

<773> 활성 화합물 1 중량부를 상기 언급된 양의 용매와 혼합하고, 상기 언급된 양의 유화제를 첨가한 후, 농축물을 목적 농도가 되도록 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

<774> 키 5 내지 15 cm의 시험 식물에 활성 화합물 제제를 단위 면적당 목적하는 활성 화합물의 특정량이 적용되도록 분무하였다. 목적하는 활성 화합물의 특정량이 물 1000 ℓ/ha에 적용되도록 분무액의 농도를 선택하였다.

<775> 3 주후, 식물의 손상도를 비처리 대조군의 전개와 비교하여 손상율% 로 기록하였다.

<776> 수치는 다음을 나타낸다:

<777> 0% = 효과없음(비처리 대조군과 같다)

<778> 100% = 완전 방제

<779> 실시예 D

<780> 발아전 시험

<781> 용 매: 아세톤 5 중량부

<782> 유화제: 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

<783> 활성 화합물 1 중량부를 상기 언급된 양의 용매와 혼합하고, 상기 언급된 양의 유화제를 첨가한 후, 농축물을 목적 농도가 되도록 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

<784> 시험 식물의 종자를 상토에 파종하였다. 약 24 시간후, 토양에 활성 화합물 제제를 단위 면적당 목적하는 활

성 화합물의 특정량이 적용되도록 분무하였다. 목적하는 활성 화합물의 특정량이 물 1000 ℓ/ha에 적용되도록 분무액의 농도를 선택하였다.

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

수치는 다음을 나타낸다:

0% = 효과없음(비처리 대조군과 같다)

100% = 완전 방제

| 발아후/온실 | g/ha | 사탕무 | 알로페쿠루스 | 에키노클로아 | 세타리아 | 아마란투스 |
|------------|------|-----|--------|--------|------|-------|
| 실시예 I-a-10 | 2000 | 0 | 70 | 80 | 80 | 70 |

| 발아전/온실 | g/ha | 밀 | 대두 | 디기타리아 | 에키노클로아 | 물류 | 세타리아 |
|------------|------|---|----|-------|--------|-----|------|
| 실시예 I-a-10 | 250 | 0 | 0 | 90 | 100 | 100 | 95 |

| 발아후/온실 | g/ha | 사탕무 | 알로페쿠루스 | 아베나 파투아 | 에키노클로아 | 세타리아 |
|------------|------|-----|--------|------------|--------|------|
| 실시예 I-a-11 | 2000 | 90 | 95 | 100 | 100 | 100 |

| 발아전/온실 | g/ha | 알로페쿠루스 | 아베나 파투아 | 에키노클로아 | 세타리아 |
|------------|------|--------|------------|--------|------|
| 실시예 I-a-11 | 2000 | 100 | 100 | 100 | 100 |

| 발아후/온실 | g/ha | 사탕무 | 에키노클로아 | 세타리아 | 아마란투스 |
|-----------|------|-----|--------|------|-------|
| 실시예 I-c-1 | 250 | 0 | 70 | 80 | 80 |

| 발아전/온실 | g/ha | 알로페쿠루스 | 아마란투스 | 감류 |
|-----------|------|--------|-------|-----|
| 실시예 I-a-3 | 500 | 70 | 70 | 100 |

실시예 E

임계 농도 시험/토양 곤충 - 유전자이식 식물의 처리

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

용 매 : 아세톤 7 중량부

유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

1 중량부의 활성 화합물을 상기 언급된 양의 용매와 혼합하고, 상기 언급된 양의 유화제를 첨가한 후, 농축물을 목적 농도가 되도록 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

활성 화합물 제제를 토양에 부었다. 이때, 제제중의 활성 화합물 농도는 실질적으로 무관하며, 토양 부피당 적용되는 활성 화합물의 중량(ppm(mg/ℓ)으로 제시)만이 중요한 요인이다. 토양을 0.25 ℓ 포트에 채우고, 20

℃에서 방치하였다.

<802> 준비후 즉시, YIELD GUARD 품종(Monsanto Comp., USA의 등록상표)의 발아전 옥수수 낱알 5 개를 각 포트에 도입하였다. 이틀후, 시험 곤충을 처리된 토양에 도입하였다. 7 일이 더 지난후, 발아된 옥수수 식물수를 세어 활성 화합물의 효율을 결정하였다(식물 하나 = 20%의 효율).

<803> 실시예 F

<804> 헬리오티스 비레센스(*Heliothis virescens*) 시험 - 유전자이식 식물의 처리

<805> 용 매 : 아세톤 7 중량부

<806> 유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

<807> 1 중량부의 활성 화합물을 상기 언급된 양의 용매 및 상기 언급된 양의 유화제와 혼합한 후, 농축물을 목적 농도가 되도록 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

<808> Roundup Ready 품종(Monsanto Comp., USA의 등록상표)의 대두 어린가지(글리신 맥스(*glycine max*))를 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하고, 잎이 축축한 동안에 담배 싹벌레 헬리오티스 비레센스로 감염시켰다.

<809> 일정한 기간이 경과한 후, 곤충의 구제율을 결정하였다.