

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.<sup>7</sup>  
C07D 417/14

(11) 공개번호 특2001-0052959  
(43) 공개일자 2001년06월25일

(21) 출원번호	10-2000-7014344	(87) 국제공개번호	WO 1999/65901
(22) 출원일자	2000년12월16일	(87) 국제공개일자	1999년12월23일
번역문제출일자	2000년12월16일		
(86) 국제출원번호	PCT/EP1999/03776		
(86) 국제출원출원일자	1999년06월01일		
(81) 지정국	AP ARIP0특허 : 케냐 레소토 말라위 수단 스와질랜드 우간다 시에라리온 가나 감비아 짐바브웨		
	EA 유라시아특허 : 아르메니아 아제르바이잔 벨라루스 키르기즈 카자흐스탄 몰도바 러시아 타지키스탄 투르크메니스탄		
	EP 유럽특허 : 오스트리아 벨기에 스위스 독일 덴마크 스페인 프랑스 영국 그리스 아일랜드 이탈리아 룩셈부르크 모나코 네덜란드 포르투갈 스웨덴 핀란드 사이프러스		
	OA OAPI특허 : 부르키나파소 베냉 중앙아프리카 콩고 코트디부아르 카메룬 가봉 기네 말리 모리타니 니제르 세네갈 차드 토고 기네비소		
	국내특허 : 알바니아 아르메니아 오스트레일리아 아제르바이잔 보스니아-헤르체고비나 바베이도스 불가리아 브라질 벨라루스 캐나다 중국 쿠바 체코 에스토니아 그루지야 헝가리 이스라엘 아이슬란드 일본 키르기즈 북한 대한민국 카자흐스탄 세인트루시아 스리랑카 라이베리아 리투아니아 라트비아 몰도바 마다가스카르 마케도니아 몽고 멕시코 노르웨이 뉴질랜드 슬로베니아 슬로바키아 타지키스탄 투르크메니스탄 터키 트리니다드토바고 우크라이나 우간다 미국 우즈베키스탄 베트남 폴란드 루마니아 러시아 싱가포르 아랍에미리트 남아프리카 그레나다 크로아티아 유고슬라비아 인도네시아 인도 시에라리온		
(30) 우선권주장	19826671.5 1998년06월16일 독일(DE)		
(71) 출원인	아벤티스 크롭사이언스 게엠베하 바이세르트, 리펠		
	독일 데-65929 프랑크푸르트 브뤼닝스트라세 50		
(72) 발명자	슈나테러 스테판		
	독일 데-65795 하터샤임 실레프링 10		
	케른 맨프레드		
	독일 데-55296 뢰르츠바일러 트라미너벡 8		
	산프트 올리치		
	독일 데-65817 엡스타인 암 포겔게상 7게		
	크리스티나 메르텐스		
	독일 데-45219 에센 커흐펠트스트라세 22		
(74) 대리인	김창세, 장성구		

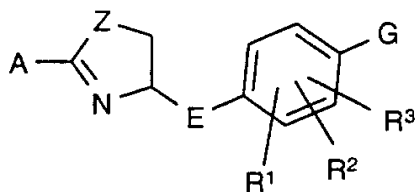
**심사청구 : 없음**

**(54) 1,3-옥사졸린 및 1,3-티아졸린 유도체, 그의 제조방법 및살충제로서의 그의 용도**

**요약**

본 발명은 하기 화학식 I의 1,3-옥사졸린 및 1,3-티아졸린 유도체에 관한 것이다.

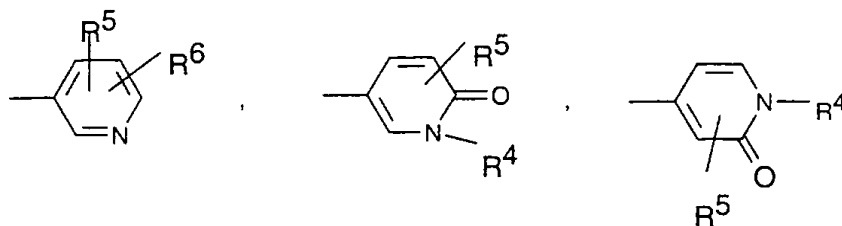
화학식 I



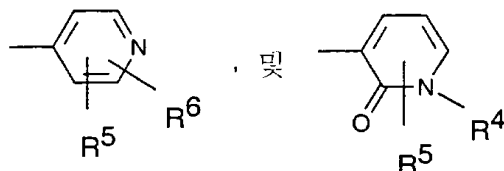
상기 식에서,

A는 페닐, 피리딜, 피리미딘일, 피라진일, 피라졸릴 또는 티에닐이고;

E는 단일결합, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬렌, -O-CH<sub>2</sub>- 또는 -CH<sub>2</sub>-O-이고;



G는



로 이루어지는 군으로부터 선택된 라디칼이고;

Z는 산소 또는 황이다.

화학식 I의 화합물은 특히 작용 및 효능에 있어서 매우 양호한 진드기 구충 및 살충 작용을 갖는다.

## 명세서

## 기술분야

본 발명은 디아릴-1,3-옥사졸린 및 -1,3-티아졸린, 이들의 제조방법, 이들을 포함하는 조성물, 및 유해 동물, 특히 곤충, 거미 진드기, 외부기생충 및 연충을 방제하기 위한 이들의 용도에 관한 것이다.

## 배경기술

일정한 1,3-옥사졸린 및 1,3-티아졸린은 그 생물학적 활성 때문에 유해 동물을 방제하는데 적합하다(예컨대 EP-A-0 345 775 및 EP-A-0 432 661; WO-A-97/06153; WO-A-93/24470 및 WO-A-95/04726 참조).

그러나 이들 종래 화합물의 작용 수준 및/또는 작용 기간은 특히 일정한 유기물에 대해서는 또는 낮은 농도가 적용될 때는 모든 적용분야에 있어서 아주 만족스러운 것은 아니다.

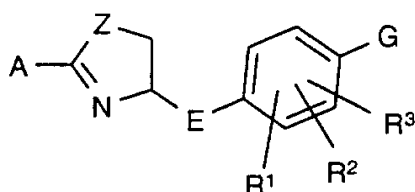
현재의 살충제는 예컨대 작용의 수준, 기간 및 범위, 사용 범위, 독성, 다른 활성 물질과의 조합, 조제 보조제와의 조합 또는 합성에 관한 넓은 범위의 요구를 만족하여야 하고, 내성이 생기는 것이 가능하게 때문에 이러한 물질의 개발은 결코 끝난 것으로 간주될 수 없으며, 적어도 몇가지 측면에 관한 한 공지된 화합물보다 이로운 신규한 화합물에 대한 요구가 계속 높아지고 있다.

## 발명의 상세한 설명

본 발명의 목적은 다양한 측면에서 살충제의 범위를 넓히는 화합물을 제공하는 것이다.

이러한 목적 및 명시하지는 않았으나 본원에서 논의된 사상으로부터 추론 또는 추단될 수 있는 기타 목적은 살충제로서 사용하기에 적합한 하기 화학식 I의 1,3-옥사졸린 및 1,3-티아졸린 유도체; 그의 순수 이성질체(광학 및 기하 이성질체) 및 이들의 이성질체 혼합물, 그의 N-옥사이드 및 그의 염에 의해 해결된다.

## 화학식 I



상기 식에서,

A는 페닐, 피리딜, 피리미딘일, 피라진일, 피라졸릴 또는 티에닐이되, 이들 기의 각각은 1개 이상, 바람직하게는 1, 2 또는 3개의 라디칼 X로 선택적으로 치환되고;

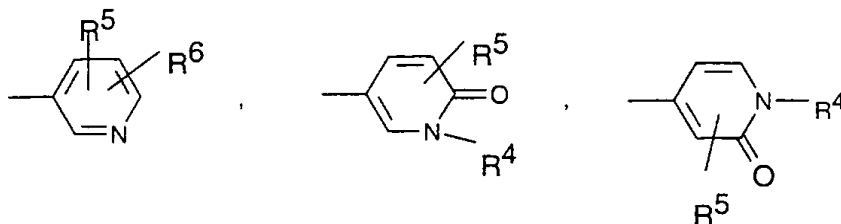
X는 동일 또는 상이한

a) 할로겐, 시아노, 니트로;

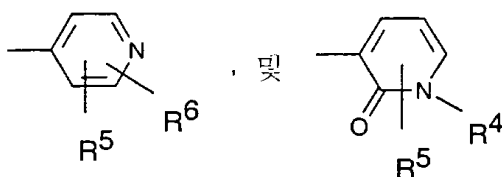
b) (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)알케닐, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)알키닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬술피닐, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알케닐, 페닐이되,

b기의 라디칼은 할로겐, 시아노, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시 및 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알콕시로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상, 바람직하게는 1, 2 또는 3개의 라디칼로 선택적으로 치환되고;

E는 단일결합, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬렌, -O-CH<sub>2</sub>- 또는 -CH<sub>2</sub>-O-이고;



G는



로 이루어지는 군으로부터 선택된 라디칼이고;

Z는 산소 또는 황이고;

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>은 동일 또는 상이한 수소, 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알콕시 또는 시아노이고;

R<sup>4</sup>는 수소이거나 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)알케닐, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)알키닐, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알케닐, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)사이클로알킬알킬 또는 (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)페닐알킬이되, 이들 기의 각각은 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알킬티오, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)페닐알콕시, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)알킬카보닐, 알콕시카보닐, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)모노알킬- 및 (C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)디알킬아미노카보닐, 시아노 및 트리(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬실릴로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상의 치환기로 선택적으로 치환되고;

R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>은 동일 또는 상이한

a) 수소, 할로겐, 시아노, 포르밀, (C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>)알킬카보닐, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)알콕시카보닐, (C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)모노알킬- 및 디알킬아미노카보닐,

b) (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알케닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알콕시알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬술피닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬설포닐, NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, 페닐, 페녹시, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)페닐알킬, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)페닐알콕시, 헤테로사이클릴, 바람직하게는 (C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>)옥사사이클로알킬, (C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>)옥사사이클로알케닐, (C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>)티아사이클로알킬, (C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>)티아사이클로알케닐, 피리딜, 피리미딘일, 피라진일, 푸라닐, 티에닐, 피롤릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 트리아졸릴, 티아졸릴, 옥사디아졸릴, 헤테로사이클릴옥시 유도체, 헤테로사이클릴(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)헤테로사이클릴알킬이되, b기의 각각은 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알킬티오, NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, 알킬카보닐(C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>), 알콕시카보닐(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), 모노알킬- 및 디알킬아미노카보닐(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>), 시아노 및 트리(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬실릴로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상, 바람직하게는 1 내지 3개의 라디칼로 선택적으로 치환되고;

c) (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알콕시이되, 이 c기의 각각은 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알킬티오, NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, 알킬카보닐(C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>), 알콕시카보닐(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), 모노알킬- 및 디알킬아미노카보닐(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>), 시아노 및 트리(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬실릴로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상, 바람직하게는 1 내지 3개의 라디칼로 선택적으로 치환되고;

d) R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>은 b)에서 언급된 기종 2개를 연결시킴으로써 생기는, 바람직하게는 단일고리 환, 바람직하게는 (C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)알킬렌, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)알킬렌옥시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알킬렌디옥시, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)알킬렌아미노 또는 알킬렌티오(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)를 함께 형성하고;

R<sup>7</sup> 및 R<sup>8</sup>은 동일 또는 상이한

a) 수소;

b) 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알

킬아미노, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)디알킬아미노, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, 시아노 및 트리(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬실릴로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상, 바람직하게는 1 내지 3개의 라디칼로 선택적으로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)페닐알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬카보닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬설폰닐이거나; 또는

c) R<sup>7</sup> 및 R<sup>8</sup>은 함께 알킬렌(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)옥사-, 아자- 또는 티아알킬렌, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)알킬렌카보닐 또는 (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)알킬렌설폰닐이다.

놀랍게도 화학식 I의 화합물은 공지된 1,3-옥사졸린 및 1,3-티아졸린 유도체보다 작용 및 효능의 범위에 관하여 더 양호한 진드기 구충 및 살충 작용을 갖는다.

화학식 I중의 기호는 바람직하게는 하기 의미를 갖는다:

A는 바람직하게는 페닐 또는 피리딜, 특히 바람직하게는 페닐이다.

X는 바람직하게는

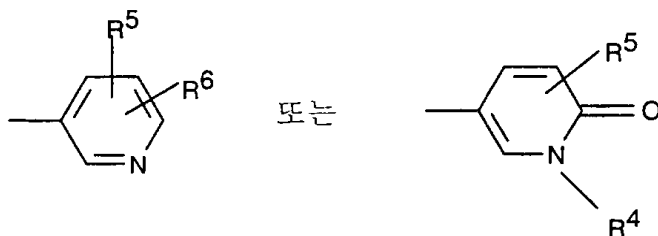
a) 할로겐, 시아노, 니트로 또는

b) (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알케닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알키닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬술피닐, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)사이클로알킬, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알케닐이되,

b기의 라디칼은 할로겐, 시아노, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시 및 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알콕시로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상, 바람직하게는 1, 2 또는 3개의 라디칼로 선택적으로 치환되고;

X는 특히 바람직하게는 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알콕시이다.

E는 바람직하게는 단일결합 또는 -CH<sub>2</sub>-, 특히 바람직하게는 단일결합이다.



G는 바람직하게는

이고, 특히 바람직하게는 3-피리딜이다.

Z는 바람직하게는 산소이다.

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>은 바람직하게는 H, 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알콕시 또는 시아노, 특히 바람직하게는 H, 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알콕시이다.

R<sup>4</sup>는 바람직하게는 H이거나 또는 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알킬티오, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, 시아노 또는 트리(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬실릴로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상, 바람직하게는 1 내지 3개의 라디칼로 선택적으로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬이다.

R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>은 바람직하게는

a) H, 할로겐, 시아노,

b) (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알케닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬술피닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬설폰닐, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)페닐알킬, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)페닐알콕시, (C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>)옥사사이클로알킬 또는 (C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>)옥사사이클로알케닐이되,

b기는 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알킬티오 및 시아노로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상, 바람직하게는 1 내지 3개의 라디칼로 선택적으로 치환되고;

c) 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알킬티오 및 시아노로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상, 바람직하게는 1 내지 3개의 라디칼로 선택적으로 치환될 수 있는 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알콕시이다.

R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>은 특히 바람직하게는

a) H, 할로겐, 시아노,

b) (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알콕시, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알케닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬술피닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬설폰닐, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)페닐알킬 또는 (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)페닐알콕시이되,

b기는 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알킬 및 시아노로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상, 바람직

하계는 1 내지 3개의 라디칼로 선택적으로 치환된다.

상기 식에서, "할로겐"은 플루오르, 염소, 브롬 또는 요오드 원자를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬"이라는 용어는 예컨대 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 1-부틸, 2-부틸, 2-메틸프로필 또는 3급-부틸 라디칼과 같은 탄소원자수 1 내지 4의 비분지 또는 분지 탄화수소 라디칼을 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬"이라는 용어는 상기 알킬 라디칼 및 예컨대 펜틸, 2-메틸부틸, 1,1-디메틸프로필, 헥실, 헵틸, 옥틸 또는 1,1,3,3-테트라메틸부틸 라디칼을 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬"이라는 용어는 "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬"이라는 용어에서 언급된 알킬기로서, 1개 이상의 수소원자가 상기 할로겐원자, 바람직하게는 염소 또는 플루오르로 치환된 알킬기, 예컨대 트리플루오로메틸기, 1-플루오로메틸기, 2,2,2-트리플루오로메틸기, 클로로메틸기, 플루오로메틸기, 디플루오로메틸기 또는 1,1,2,2-테트라플루오로메틸기를 의미하고;

"(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬"이라는 용어는 예컨대 사이클로프로필, 사이클로부틸 또는 사이클로펜틸기; 및 사이클로헥실, 사이클로헵틸 또는 사이클로옥틸 라디칼을 의미하고;

"(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)할로사이클로알킬"이라는 용어는 상기 (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬 라디칼 중의 하나로서, 하나 이상의 수소원자, 선택적으로 플루오르의 경우에는 또한 모든 수소원자가 할로겐, 바람직하게는 플루오르 또는 염소로 치환된 라디칼, 예컨대 2,2-디플루오로 또는 2,2-디클로로사이클로프로판기 또는 플루오로사이클로펜탄 라디칼을 의미하고;

"(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)알케닐"이라는 용어는 예컨대 비닐, 알릴, 2-메틸-2-프로페닐 또는 2-부테닐기를 의미하고;

"(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)할로알케닐"이라는 용어는 일부의 수소원자 또는 플루오르의 경우에는 또한 모든 수소원자가 할로겐, 바람직하게는 플루오르 또는 염소로 치환된 (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)알케닐기를 의미하고;

"(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)알키닐"이라는 용어는 예컨대 에티닐, 프로파르길, 2-메틸-2-프로핀일 또는 2-부티닐기를 의미하고;

"(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)알키닐"이라는 용어는 예컨대 상기 라디칼 및 예컨대 1-펜티닐, 2-펜티닐, 3-펜티닐 또는 1-옥티닐기를 의미하고;

"(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)할로알키닐"이라는 용어는 일부의 수소원자, 플루오르의 경우에는 또한 모든 수소원자가 할로겐원자, 바람직하게는 플루오르 또는 염소로 치환된 (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)알키닐기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)하이드록시알킬"이라는 용어는 예컨대 하이드록시메틸, 1-하이드록시에틸, 2-하이드록시에틸, 1-하이드록시-1-메틸에틸 또는 1-하이드록시프로필기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알카노일-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬"이라는 용어는 예컨대 아세틸메틸, 프로피오닐메틸, 2-아세틸에틸 또는 부티릴메틸기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알카노일"이라는 용어는 예컨대 포르밀, 아세틸, 프로피오닐, 2-메틸프로피오닐 또는 부티릴기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알카노일"이라는 용어는 상기 라디칼 및 예컨대 발레로일, 피발로일, 헥사노일, 헵타노일 또는 옥타노일기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)알카노일"이라는 용어는 예컨대 상기 라디칼 및 예컨대 노나노일, 데카노일 또는 도데카노일기를 의미하고;

"(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)할로알카노일"이라는 용어는 일부의 수소원자, 플루오르의 경우에는 또한 모든 수소원자가 할로겐원자, 바람직하게는 플루오르 또는 염소로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알카노일기를 의미하고;

"(C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)할로알카노일"이라는 용어는 일부의 수소원자, 플루오르의 경우에는 또한 모든 수소원자가 할로겐원자, 바람직하게는 플루오르 또는 염소로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)알카노일기를 의미하고;

"시아노(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬"이라는 용어는 탄화수소 라디칼이 "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬"이라는 용어에 대해 주어진 의미를 갖는 시아노알킬기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)니트로알킬" 또는 "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)티오시아노알킬"이라는 용어는 니트로 또는 티오시아노기로 치환된 상기 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬기중의 하나를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시카보닐"이라는 용어는 예컨대 메톡시카보닐, 에톡시카보닐, 프로톡시카보닐, 부톡시카보닐 또는 3급-부톡시카보닐기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알콕시카보닐"이라는 용어는 예컨대 상기 라디칼 및 예컨대 펜틸옥시카보닐, 헥실옥시카보닐 또는 옥틸옥시카보닐기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)알콕시카보닐"이라는 용어는 상기 라디칼 및 예컨대 노닐옥시카보닐, 2-메틸옥틸옥시카보닐, 데실옥시카보닐 또는 도데실옥시카보닐기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시카보닐-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬"이라는 용어는 예컨대 메톡시카보닐메틸, 에톡시카보닐메틸 또는 메톡시

카보닐에틸기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알콕시카보닐"이라는 용어는 하나 이상의 수소원자, 선택적으로 플루오르의 경우에는 또한 모든 수소원자가 할로겐, 바람직하게는 플루오르 또는 염소로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시카보닐기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬티오"라는 용어는 탄화수소 라디칼이 "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬"이라는 용어에 대해 주어진 의미를 갖는 알킬티오기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬티오"라는 용어는 알킬 라디칼이 "(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬"이라는 용어에 대해 주어진 의미를 갖는 알킬티오기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬티오"라는 용어는 탄화수소 부분의 하나 이상의 수소원자, 선택적으로 플루오르의 경우에는 또한 모든 수소원자가 할로겐, 특히 염소 또는 플루오르로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬티오기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬술피닐"이라는 용어는 예컨대 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 부틸, 이소부틸, 2급-부틸 또는 3급-부틸술피닐기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬술피닐"이라는 용어는 상기 알킬술피닐기중의 하나 및 예컨대 펜틸술피닐, 2-메틸부틸술피닐, 헥실술피닐 또는 옥틸술피닐기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬설폰닐"이라는 용어는 예컨대 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 부틸, 이소부틸, 2급-부틸 또는 3급-부틸설폰닐기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬설폰닐" 및 "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬설폰닐"이라는 용어는 상기 의미를 갖는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬설폰닐 및 -설폰닐 라디칼로서, 탄화수소 부분의 하나 이상의 수소원자, 선택적으로 플루오르의 경우에는 또한 모든 수소원자가 할로겐, 특히 염소 또는 플루오르로 치환된 라디칼을 의미하고;

"플루오로메틸술피닐" 및 "플루오로메틸설폰닐"이라는 용어는 모노-, 디- 및 트리플루오로메틸술피닐 및 -설폰닐기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시"라는 용어는 탄화수소 라디칼이 "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬"이라는 용어에 대해 주어진 의미를 갖는 알콕시기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알콕시"라는 용어는 탄화수소 라디칼이 "(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬"이라는 용어에 대해 주어진 의미를 갖는 알콕시기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬설폰닐"이라는 용어는 상기 알킬설폰닐기중의 하나 및 예컨대 펜틸설폰닐, 2-메틸부틸설폰닐, 헥실설폰닐, 헵틸설폰닐 또는 옥틸설폰닐기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬아미노"라는 용어는 예컨대 메틸아미노, 에틸아미노, 프로필아미노, 이소프로필아미노, 이소부틸아미노, 2급-부틸아미노 또는 3급-부틸아미노기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬아미노"라는 용어는 상기 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬아미노기중의 하나 및 예컨대 펜틸아미노, 헥실아미노, 헵틸아미노 또는 옥틸아미노기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)디알킬아미노"라는 용어는 예컨대 디메틸아미노, 메틸에틸아미노, 디에틸아미노, 디프로필아미노 또는 디부틸아미노기 뿐만 아니라 예컨대 피롤리딘 또는 피페리딘기와 같은 고리계를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)디알킬아미노"라는 용어는 상기 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)디알킬아미노기중의 하나 및 예컨대 디펜틸아미노, 디헥실아미노 또는 디옥틸아미노기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알콕시"라는 용어는 할로탄화수소 라디칼이 "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬"이라는 용어에 대해 주어진 의미를 갖는 할로알콕시기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬"이라는 용어는 예컨대 1-메톡시에틸기, 2-메톡시에틸기, 2-에톡시에틸기, 메톡시메틸기 또는 에톡시메틸기, 3-메톡시프로필기 또는 4-부톡시부틸기를 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알콕시-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬", "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬" 및

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알콕시-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬"이라는 용어는 상기 의미를 갖는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬 라디칼로서, 관련 탄화수소 부분의 하나 이상의 수소원자, 플루오르의 경우에는 또한 모든 수소원자가 할로겐, 특히 염소 또는 플루오르로 치환된 라디칼을 의미하고;

"(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬티오-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬"이라는 용어는 예컨대 메틸티오메틸, 에틸티오메틸, 프로필티오메틸, 2-메틸티오메틸, 2-에틸티오메틸 또는 3-메틸티오프로필을 의미하고;

"헤테로사이클릴"이라는 용어는 헤테로방향족 또는 헤테로지방족 고리계를 의미하고, 여기서 "헤테로방향족 고리계"는 하나 이상의 CH기가 N으로 치환되고 그리고/또는 2개 이상의 인접 CH기가 S, NH 또는 O로 치환된 아릴 라디칼, 예컨대 티오펜, 푸란, 피롤, 티아졸, 옥사졸, 이미다졸, 이소티아졸, 이속사졸, 피라졸, 1,3,4-옥사디아졸, 1,3,4-티아디아졸, 1,3,4-트리아졸, 1,2,4-옥사디아졸, 1,2,4-티아디아졸, 1,2,4-트리아졸, 1,2,3-트리아졸, 1,2,3,4-테트라졸, 벤조[b]티오펜, 벤조[b]푸란, 인돌, 벤조[c]티오펜, 벤조[c]푸란, 이소인돌, 벤족사졸, 벤조티아졸, 벤조이미다졸, 벤즈이속사졸, 벤즈이소티아졸, 벤조피라졸, 벤조티아디아졸, 벤조트리아졸, 디벤조푸란, 디벤조티오펜, 카바졸, 피리딘, 피라진, 피리디민, 피리다진, 1,3,5-트리아진, 1,2,4-트리아진, 1,2,4,5-트리아진, 퀴놀린, 이소퀴놀린, 퀴놀살린, 퀴나졸린, 신놀린, 1,8-나프틸리딘, 1,5-나프틸리딘, 1,6-나프틸리딘, 1,7-나프틸리딘, 프탈라진, 피리도피리미딘, 푸

린, 프테리딘 또는 4H-퀴놀리진의 라디칼을 의미하는 것으로 이해하여야 하고;

"헤테로지방족 고리계"라는 용어는 하나 이상의 탄소 단위가 O, S 또는 NR<sup>11</sup>기(R<sup>11</sup>은 수소, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시 또는 아릴이다)로 치환된 (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬 라디칼을 의미하고;

"헤테로사이클릴옥시" 또는 "헤테로사이클릴티오"라는 용어는 상기 헤테로사이클릴 라디칼중의 하나로서, 산소 또는 황 원자를 통해 연결된 라디칼을 의미하고;

"(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알콕시" 또는 "(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬티오"라는 용어는 상기 (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬 라디칼중의 하나로서 산소 또는 황 원자를 통해 연결된 라디칼을 의미하고;

"아릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알카노일"이라는 용어는 예컨대 페닐아세틸, 3-페닐프로피오닐, 2-페닐프로피오닐, 2-메틸-2-페닐프로피오닐, 4-페닐부티릴 또는 나프틸아세틸기를 의미하고;

"(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알카노일"이라는 용어는 예컨대 사이클로프로필카보닐, 사이클로부틸카보닐, 사이클로펜틸카보닐, 사이클로헥실카보닐, 사이클로헥실아세틸 또는 사이클로헥실부티릴기를 의미하고;

"헤테로사이클릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알카노일"이라는 용어는 예컨대 테노일, 푸로일, 니코티노일, 티에닐아세틸 또는 피리딘프로피오닐기를 의미하고;

"(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알콕시카보닐"이라는 용어는 예컨대 사이클로부틸옥시카보닐, 사이클로펜틸옥시카보닐, 사이클로헥실옥시카보닐 또는 사이클로헥실옥시카보닐기를 의미하고;

"(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시카보닐"이라는 용어는 예컨대 사이클로프로필메톡시카보닐, 사이클로부틸메톡시카보닐, 사이클로펜틸옥시메톡시카보닐, 사이클로헥실옥시메톡시카보닐, 1-(사이클로헥실)에톡시카보닐 또는 2-(사이클로헥실)에톡시카보닐기를 의미하는 것으로 이해하여야 하고;

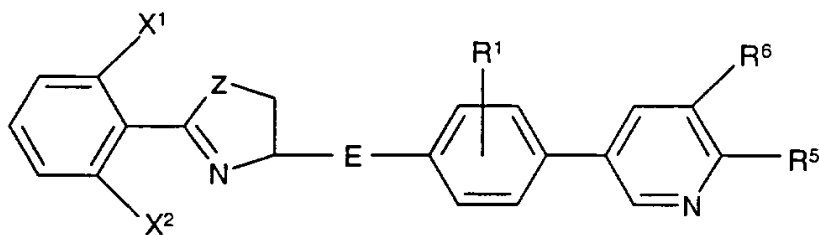
상기에 주어진 설명은 동족체 또는 이로부터 유도되는 라디칼에도 유사하게 적용된다.

본 발명은 유리 염기 또는 산부가염 형태의 화학식 I의 화합물에 관한 것이다. 염 형성에 사용될 수 있는 산은 염산, 브롬화수소산, 질산, 황산, 인산과 같은 무기산 또는 포름산, 아세트산, 프로피온산, 말론산, 옥살산, 푸마르산, 아디프산, 스테아르산, 올레산, 메탄설폰산, 벤젠설폰산 또는 톨루엔설폰산과 같은 유기산이다.

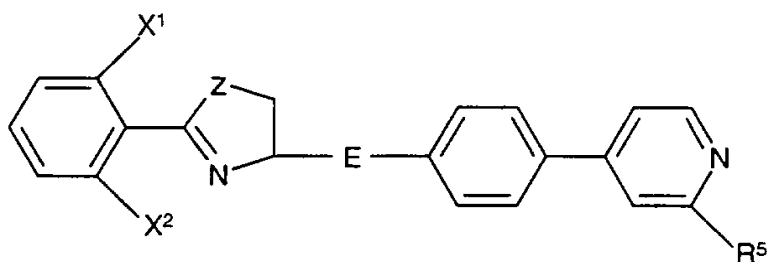
화학식 I의 화합물의 일부는 이중결합상에 하나 이상의 비대칭 탄소원자 또는 입체이성질체를 갖는다. 따라서 거울상이성질체 또는 부분입체이성질체가 발생할 수 있다. 본 발명은 순수 이성질체 뿐만 아니라 그의 혼합물도 포함한다. 부분입체이성질체 혼합물은 통상적인 방법에 의해, 예컨대 적합한 용매로부터의 선택적 결정화 또는 크로마토그래피에 의해 성분들로 분해될 수 있다. 라세미체는 또한 통상적인 방법, 예컨대 키랄성의 거울상이성질체적 순수 산에 의한 염 형성, 부분입체이성질체 염의 분리 및 염기에 의한 순수 거울상이성질체의 유리에 의해 분해될 수 있다.

아주 특히 바람직한 것은 하기 화학식 Ia 내지 Ie의 화합물군이다:

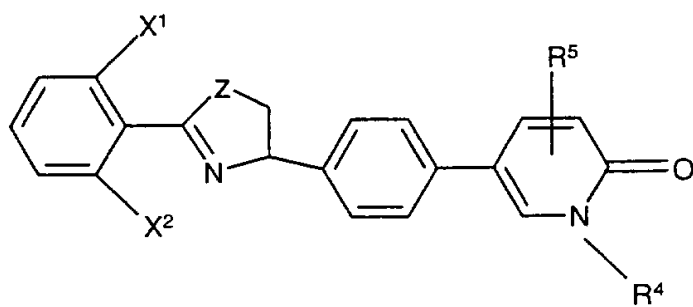
#### 화학식 Ia



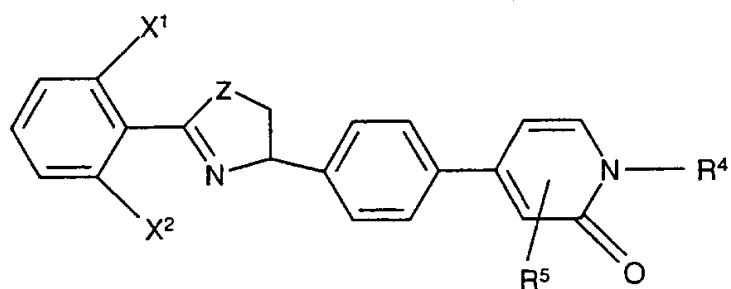
#### 화학식 Ib



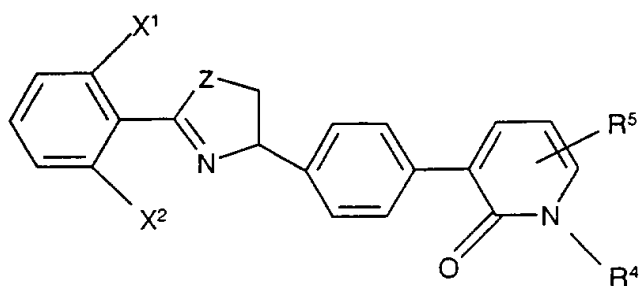
## 화학식 1c



## 화학식 1d

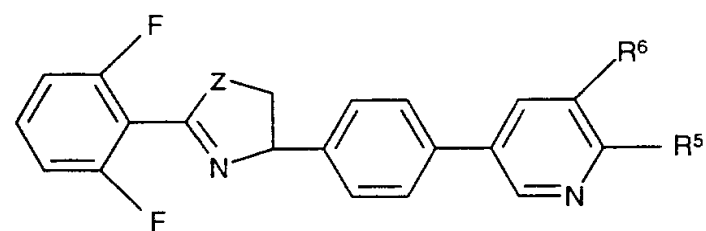


## 화학식 1e



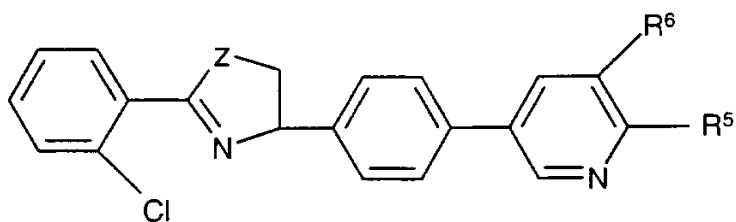
이들 식에서  $X^1$ ,  $X^2$ , Z,  $R^4$ ,  $R^5$  및  $R^6$ 은 각각 화학식 1에서 주어진 의미를 갖는다( $X^1$ ,  $X^2 \neq X$ ).  
 특히 바람직한 것은 하기 화학식 1a1 내지 1a4의 화합물이다:

## 화학식 1a1

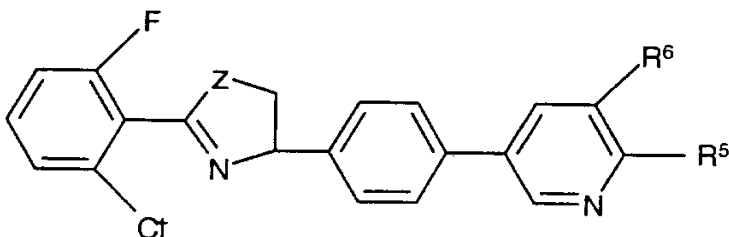




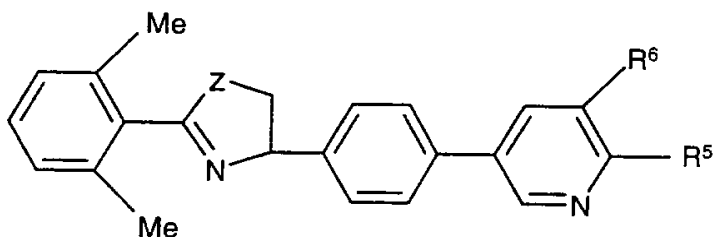
## 화학식 1a2



## 화학식 1a3



## 화학식 1a4



이 경우에 Z, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>은 각각 화학식 I에서 주어진 의미를 갖는다.

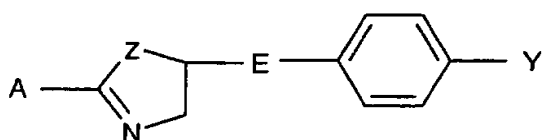
본 발명에 따른 화합물은 유기합성에 대한 표준 작업으로 기재되어 있는 바와 같이 문헌, 예컨대 Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie[Methods in Organic Chemistry], George-Thieme-Verlag, Stuttgart로부터 그 자체가 공지되어 있는 방법에 의해 제조된다.

상기 제조는 공지되어 있고 상기 반응에 적합한 반응 조건하에 수행된다. 본원에서는 상세히 설명하지 않았으나 그 자체가 공지된 다른 변수도 또한 사용할 수 있다.

원한다면 출발물질은 또한 반응 혼합물로부터 분리되지 않고 바로 더 반응하여 화학식 I의 화합물을 제공하도록 원위치에서 형성될 수도 있다.

1,3-옥사졸린의 일반화학은 예컨대 문헌 Tetrahedron, 1994, 50, 2297-2360 및 Nachr. Chem. Tech. Lab. 1996, 44, 744-750에 기재되어 있다.

본 발명은 또한 화학식 II의 공지된 1,3-옥사졸린 및 1,3-티아졸린(예컨대 EP-A-0 345 775 참조)(R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>이 적당히 치환됨)과 화학식 III의 메탈로이드-피리딘 화합물(R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>이 적당히 치환됨)을 반응시켜 화학식 I의 화합물을 제조하는 방법으로서, 할로겐 및 하기 화학식 II의 퍼플루오로알킬설포네이트 화합물과 하기 화학식 III의 유기금속 화합물을 팔라듐 촉매작용에 의해 반응시키는 것을 포함하는 방법에 관한 것이다.

**화학식 II**

상기 식에서,

Y는 Cl, Br, I 또는 퍼플루오로알킬설포네이트이고,

A, Z 및 E는 화학식 I에 주어진 의미를 갖는다.

**화학식 III**

G-M

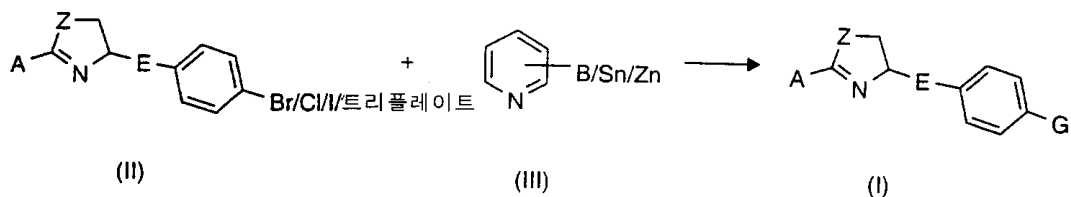
상기 식에서,

M은 B, Sn 또는 Zn 함유 이탈기이고,

G는 화학식 I에 주어진 의미를 갖는다.

화학식 I의 화합물의 다양한 부분군의 합성 방법 A 내지 H를 예로 들 수 있다.

방법 A

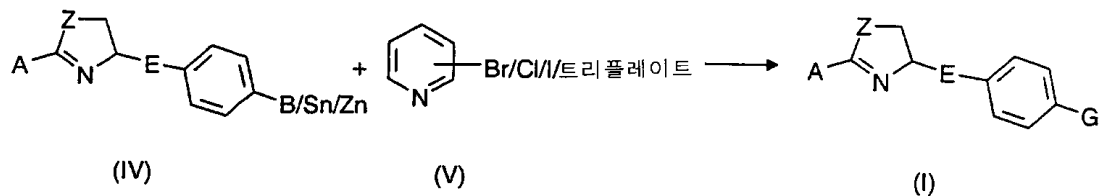
**반응식 1**

G = 3-피리딜, 4-피리딜, 2-피리돈-5-일, 2-피리돈-3-일(화학식 I 참조)

페닐환과 피리딘환의 연결은 예컨대 스즈키(Suzuki) 커플링, 스틸(Stille) 커플링 또는 네기시(Negishi) 커플링을 사용한 팔라듐 촉매작용에 의해 수행한다(예컨대 피. 노첸(P. Knochel)의 문헌[Chem. Review 1993, 93, 2117-2188] 또는 지로 츠지(Jiro Tsuji)의 문헌[Palladium Reagents and Catalysts, John Wiley & Sons, 1996] 참조).

연결에 요구되는 작용기가 하기와 같이 화학식 II와 III 사이에서 바뀌는 것도 또한 가능하다:

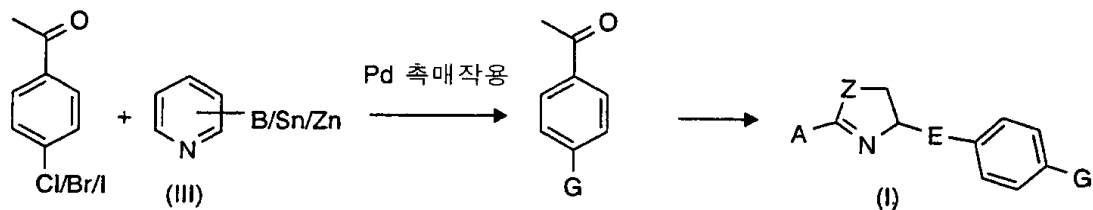
방법 B

**반응식 2**

또한 피리딜-페닐 구조 단위를 구성하고 이들 전구체를 화학식 I의 1,3-옥사졸린 및 1,3-티아졸린으로 전환하는 것도 또한 가능하다.

방법 C

## 반응식 3

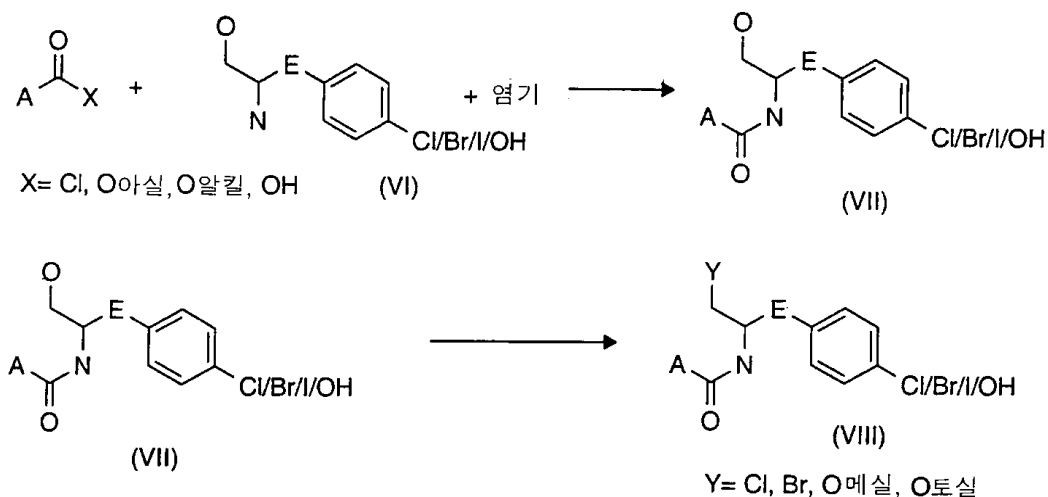


화학식 II의 옥사졸린 전구체는 예컨대 하기 경로에 의해 제조되는데, 이중 일부는 공지되어 있다(EP-A-0 432 661; 지. 헬첸(G. Helmchen)의 문헌[Tetrahedron 1996, 52, 7547-7583]).

즉, 활성화된 카복실산 유도체를 아미노알콜(VI)( $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ 이 적당히 치환됨)(Synthesis K. Drauz, J. Org. Chem. 1993, 58, 3568-3571)과 반응시켜 아미도알콜(VII)을 얻는다:

방법 D (실시에 VP3)

## 반응식 4

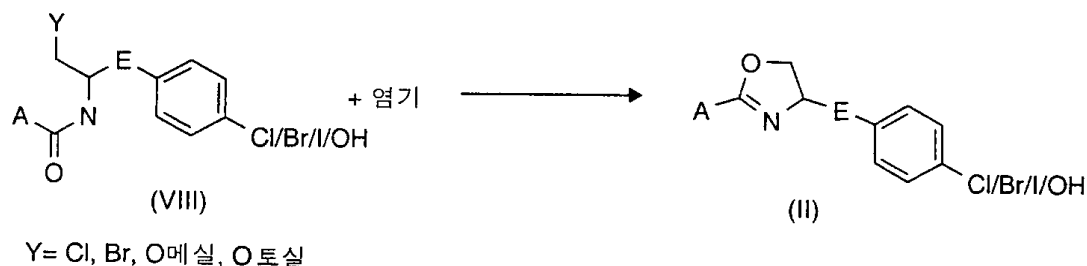


클로라이드(VIII)(Y=Cl)는 예컨대 염화티오닐을 사용하여 아미도알콜(VII)로부터 얻는다. 설폰 할라이드를 사용하는 경우에는 설포네이트(VIII)(Y=예컨대 메실레이트, 토실레이트)가 형성된다.

옥사졸린(II)은 염기의 작용에 의해 (VIII)로부터 형성한다.

방법 E (실시에 VP4)

## 반응식 5

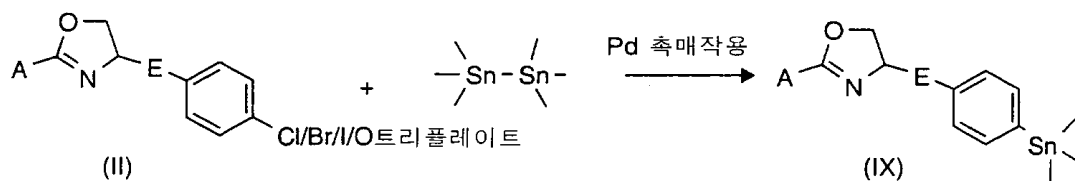


적합한 염기는 예컨대 알칼리금속 수산화물, 알칼리금속 카보네이트, 수소화물, 알콕사이드 및 아민과 같은 염기성 염이다. (II)의 4-하이드록시페닐 유도체로부터 출발하면 예컨대 트리플루오로메탄설포닐 클로라이드에 의한 설폰화에 의해 트리플레이트를 얻을 수 있다.

주석 기를 함유하는 화학식 IV의 옥사졸린 전구체는 디스탄난에 의한 스틸 커플링에 의해 얻을 수 있다.

방법 F (실시예 VP5)

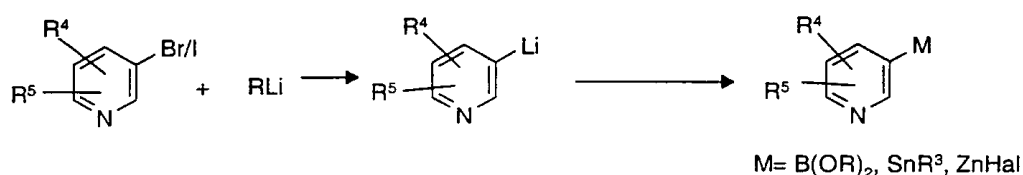
### 반응식 6



화학식 III의 피리딘 전구체는 예컨대 화학식 I대로 적합한 치환기  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ 을 갖는 금속화된 피리딘 유도체의 생성 및 이것과 예컨대 붕산 에스테르, 주석 할라이드 또는 아연 할라이드와의 반응에 의해 형성된다.

방법 G (실시예 VP7, VP8)

### 반응식 7

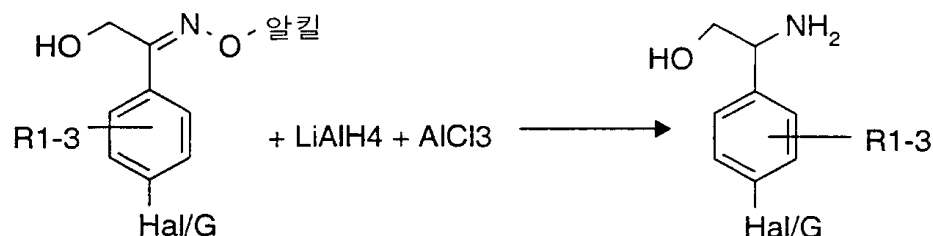


R= 알킬, 알킬렌

아미노알콜 전구체(VI)는 공지된 2-하이드록시아세트페논 옥시를 수소화물에 의해 환원시킴으로써 제조할 수 있다.

방법 H (실시예 VP2)

### 반응식 8



상기 반응식에 의해 합성될 수 있는 화학식 I의 화합물의 집합물은 또한 병렬 방식으로 제조될 수도 있고 이것은 수동으로, 또는 반자동 또는 완전자동 방식으로 수행될 수 있다. 이 경우에는 예컨대 반응 절차, 생성물 또는 중간체의 후처리 또는 정제를 자동화하는 것이 가능하다. 이것은 전부 예컨대 에스. 에이치. 드비트(S.H. DeWitt)에 의해 문헌 "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated synthesis", 제1권, Verlag Escom 1997, 69 내지 77페이지에 기재되어 있는 것과 같은 방법을 의미하는 것으로 이해하여야 한다.

예컨대 영국 시엠9 8에스이 에섹스 톨레스버리 우드롤프 로드 소재의 스템사(Stem Corporation) 또는 독일 85764 오버실라이스하임 브록크만링 28 소재의 하+페 라보테크닉사(H+P Labortechnik GmbH)가 제공하는 것과 같은 일련의 상업적으로 입수가능한 장치가 반응 및 후처리의 병렬방법에 사용될 수 있다. 화학식 I의 화합물 또는 그 제조 동안 얻어지는 중간체의 병렬 정제에는 특히 크로마토그래피 장치, 예컨대 미국 네브래스카주 68504 링컨 슈페리어 스트리트 4700 소재의 아이에스시오사(ISC0, Inc.)제의 것을 사용할 수 있다.

상기 장치는 모듈식 방법을 야기하고 이 때 각 공정 단계는 자동화되지만 공정 단계 사이에서는 수동 조작이 수행되어야 한다. 이것은 반통합 또는 완전통합된 자동화 시스템을 사용함으로써 방지될 수 있고 이 때 해당 자동화 모듈은 예컨대 로봇에 의해 작동된다. 이러한 자동화 시스템은 예컨대 미국 매사추세츠주 01748 흡킨튼 자이마크 센터 소재의 자이마크사(Zymark Corporation)로부터 구입할 수 있다.

본 명세서에 기재된 것 이외에, 화학식 1의 화합물은 고체상 지지법에 의해 일부 또는 전부가 제조될 수 있다. 이러한 목적을 위해, 합성 또는 해당 방법에 적합하도록 된 합성의 각 중간 단계 또는 모든 중간 단계는 합성 수지와 결합된다. 고체상 지지 합성법은 전문 문헌, 예컨대 배리 에이. 부닌(Barry A. Bunin)의 문헌 "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998에 상세하게 기재되어 있다. 고체상 지지 합성법의 사용에 의하면 문헌으로부터 공지되어 있고 수동으로 또는 자동화 방법으로 수행될 수 있는 일련의 프로토콜이 가능해진다. 예컨대 미국 캘리포니아주 92037 라 졸라 노스 트리 파인스 로드 11149 소재의 IRORI사의 제품을 사용하는 "티-백(tea-bag)법"(학텐(Houghten)의 미국 특허 제 4,631,211 호; 학텐 등의 문헌[Proc. Natl. Acad. Sci., 1985, 82, 5131-5135])은 반자동화될 수 있다. 고체상 지지 병렬 합성의 자동화는 예컨대 미국 캘리포니아주 94070 샌카를로스 인더스트리얼 로드 887 소재의 아거넛 테크놀로지스사(Argonaut Technologies, Inc.) 또는 독일 58454 빌텐 볼레너 펠트 4 소재의 멀티신테크사(MultiSynTech GmbH)제 장치에 의해 성공적으로 수행된다.

본 명세서에 기재된 방법을 준비하면 화학식 1의 화합물이 라이브러리라고 불리는 물질 집합물 형태로 얻어진다. 본 발명은 또한 2중 이상의 화학식 1의 화합물을 포함하는 라이브러리에 관한 것이다.

화학식 1의 화합물은 유해 동물, 특히 곤충, 거미류 동물, 연충 및 연체동물을 방제하고, 아주 특히 바람직하게는 농경지, 가축사육장, 삼림, 저장 식품 및 물질의 보호, 및 위생학 부문에서 직면하는 곤충 및 거미류 동물을 방제하는데 적합하고, 식물 내성이 양호하고 온혈 종에 대해서는 유리한 독성을 갖는다. 본 화합물은 통상적으로 민감하고 내성이 있는 종 및 모든 또는 각각의 발달 단계에 대해 활성이다. 상기 유해 동물로는 하기의 것을 들 수 있다.

아카리나(Acarina) 목: 아카루스 시로, 아르가스 spp., 오르니토도로스 spp., 더마니수스 갈리나에, 에리오피에스 리비스, 필로콧루타 올레이보라, 부필루스 spp., 리피세팔루스 spp., 암블리오마 spp., 히알로마 spp., 익소데스 spp., 프소플테스 spp., 코리움테스 spp., 사르콧테스 spp., 타르소네무스 spp., 브리오비아 프라에티오사, 파노니쿠스 spp., 테트라니쿠스 spp., 에오테트라니쿠스 spp., 올리고니쿠스 spp., 유테트라니쿠스 spp..

이소포다(Isopoda) 목: 오니스쿠스 아셀루스, 아르마디움 불가레, 포르셀리오 스카베르.

디플로포다(Diplopoda) 목: 블라니올루스 구톨라투스.

칠로포다(Chilopoda) 목: 지오피루스 카포파구스, 스쿠티게라 spp..

심필라(Symphyla) 목: 스쿠티게렐라 이마쿨라타.

티사누라(Thysanura) 목: 레피스마 사카리나.

콜렘볼라(Collembola) 목: 오니치우루스 아르마투스.

오르토포테라(Orthoptera) 목: 블라타 오리엔탈리스, 페리플라네타 아메리카나, 류코파에아 마더라에, 블라텔라 게르마니카, 아체타 도메스티쿠스, 그릴로탈파 spp., 로쿠스타 미그라토리아 미그라토리오이데스, 멜라노플루스 변종, 시스토세르카 그레가리아.

이슈테라(Isoptera) 목: 레티쿨리테르메스 spp..

아노플루라(Anoplura) 목: 필로에세라 바스타트릭스, 펌피구스 spp., 페디쿨루스 휴마누스 코르포르스, 하에마토피누스 spp., 리노그나투스 spp..

말로파가(Mallophage) 목: 트리코덱테스 spp., 다말리네아 spp..

티사놉테라(Thysanoptera) 목: 헤르키노트립스 페모랄리스, 트립스 타바키.

헤테로테라(Heteroptera) 목: 유리가스터 spp., 디스데르쿠스 인터메디우스, 피에스마 쿠아드라타, 시엑스 렉톨라리우스, 로드니우스 프롤리수스, 트리야토마 spp..

호모테라(Homoptera) 목: 알레우로데스 브라시카에, 베미시아 타바키, 트리알레우로데스 바포라리오룸, 아피스 고시피, 브레비코린 브라시카에, 크립토미주스 리비스, 도랄리스 파바에, 도랄리스 포미, 에리오소마 라니게툼, 히알롭테루스 아룬디니스, 마크로시폼 아베나에, 미주스 spp., 포로돈 휴물리, 로팔로시폼 파디, 엠포아스카 spp., 유스셀루스 빌로바투스, 네포테릭스 신크티셉스, 레카니움 코르나, 사이세티아 올레라에, 라오멜팍스 스트리아텔루스, 닐라파르바타 루겐스, 아오니디엘라 아우란티, 아스피디오투스 헤데라에, 슈도코쿠스 spp., 프실라 spp..

레피도테라(Lepidoptera) 목: 펙티노포라 고시피엘라, 부팔루스 피니아리우스, 케이마토비아 브루마타, 리토콜레티스 블랑카텔라, 히포노유타 파텔라, 플루텔라 마쿨리페니스, 말라코소마 뉴스트리아, 유프록티스 크리스소에아, 리만트리아 spp., 부쿨라트릭스 투르베리엘라, 필록니스티스 시트렐라, 아그로티스 spp., 육소아 spp., 펠티아 spp., 에아리아스 인솔라나, 헬리오티스 spp., 라피그마 엑시구아, 마메스트라 브라시카에, 파놀리스 플라메아, 프로데니아 리투라, 스포도테라 spp., 트리코플루시아니, 카르포캅사 포모넬라, 피에리스 spp., 칠로 spp., 피라우스타 누빌랄리스, 에페스티아 쿠에니엘라, 갈레리아 멜로넬라, 카코에키아 포다나, 카푸아 레티쿨라나, 코리스토네우라 푸미페라나, 클리시아 암비구엘라, 호모나 마그나니마, 토르트릭스 비리다나.

콜레옵테라(Coleoptera) 목: 아노비움 폰타툼, 리조페르타 도미니카, 브루키디우스 옴텍투스, 아칸토스켈리데스 옴텍투스, 힐로트루페스 바즐루스, 아젤라스티카 알니, 랩티노타르사 데셈리네아타, 파에돈 코클레아리아에, 디아브로티카 spp., 프실로이데스 크리스세팔라, 에필라크나 바리베스티스, 아토마리아 spp., 오리자에필루스 수리나멘시스, 안토노무스 spp., 시토피루스 spp., 오티오린쿠스 술카투스, 코스모폴리테스 소르디두스, 슈토린쿠스 아시밀리스, 히페라 포스티카, 데르메스테스 spp., 트로고데르마 spp., 안트레누스 spp., 아타게누스 spp., 릭투스 spp., 멜리게테스 아에네우스, 프티누스 spp., 님투스 홀로류쿠스, 기비움 실로이데스, 트리블리움 spp., 테네브리오 올리트르, 아그리오테스 spp., 코노데루스 spp.,

멜론론타 멜론론타, 암피말론 솔스티티알리스, 코스텔리트라 제알란디카.

히메노테라(Hymenoptera) 목: 디프리콘 spp., 호플로캄파 spp., 라시우스 spp., 모노모리움 파라오니스, 베스파 spp..

딤테라(Diptera) 목: 아에데스 spp., 아노펠레스 spp., 쿨렉스 spp., 드로소필라 멜라노가스테르, 무스카 spp., 파니아 spp., 칼리포라 에리트로세팔라, 루실리아 spp., 크리스미아 spp., 쿠터레브라 spp., 가스트로필루스 spp., 히포보스카 spp., 스토크시스 spp., 오에스트루스 spp., 히포데르마 spp., 타바누스 spp., 타니아 spp., 비비오 호르톨라누스, 오시벨라 프리트, 포르비아 spp., 페고마이아 히오시아미, 케라티티스 카피타타, 다쿠스 올레아에, 티폴라 팔루도사.

시포납테라(Siphonaptera) 목: 크세놉실라 케옵시스, 케라토피루스 spp..

아라크니다(Arachnida) 목: 스크로피오 마우루스, 라트로렉투스 막탄스.

헬민트스(Helminths) 강: 하에몬쿠스, 트리코스트론쿨루스, 오스테르타기아, 쿠페리아, 차베르티아, 스트론길로이데스, 오에소파고스토뿔, 히오스트론쿨루스, 안킬로스토마, 아스카리스 및 헤테라키스 및 파시올라.

가스트로포다(Gastropoda) 강: 데로세라스 spp., 아리온 spp., 림나에아 spp., 갈바 spp., 속시네아 spp., 비움팔라리아 spp., 볼리누스 spp. 및 온코멜라니아 spp.

비발바(Bivalva) 강: 드레이세나 spp..

본 발명에 따라 방제될 수 있는 식물 기생 선충으로는 예컨대 뿌리 기생성의 땅에 거주하는 선충, 예컨대 멜로이도긴(Meloidogyne)속(뿌리혹 선충, 예컨대 멜로이도긴 인코그니타, 멜로이도긴 해플라 및 멜로이도긴 자바니카), 헤테로데라(Heterodera) 및 글로보데라(Globodera)속(포낭 형성 선충, 예컨대 글로보데라 로스키엔시스, 글로보데라 팔리다, 헤테로데라 트리폴리) 및 라도폴루스(Radopholus)속(예컨대 라도폴루스 시말리스), 프라틸렌쿠스(Pratylenchus)속(예컨대 프라틸렌쿠스 네글렉투스, 프라틸렌쿠스 페넬트란스 및 프라틸렌쿠스 쿠르비타투스);

티렌쿨루스(Tylenchulus)속(예컨대 티렌쿨루스 세미페넬트란스), 티렌코린쿠스(Tylenchorhynchus)속(예컨대, 티렌코린쿠스 두비우스 및 티렌코린쿠스 클레이토니), 로틸렌쿠스(Rotylechus)속(예컨대 로틸렌쿠스 로부스투스), 헬리오코틸렌쿠스(Heliocotylechus)속(예컨대 할리오코틸렌쿠스 멀티신쿠스), 벨로노아이무스(Belonoaimus)속(예컨대, 벨로노아이무스 롱기카우다투스), 롱기도루스(Longidorus)속(예컨대 롱기도루스 엘롱가투스), 트리코도루스(Trichodorus)속(예컨대 트리코도루스 프리미티부스) 및 시피네마(Xiphinema)속(예컨대 시피네마 인덱스)를 들 수 있다.

본 발명에 따른 화합물을 사용하여 방제될 수 있는 디틸렌쿠스(Ditylenchus)(줄기 기생충, 예컨대 디틸렌쿠스 디프사시 및 디틸렌쿠스 디스트럭터), 아펠렌코이데스(Aphelenchoides)(잎 선충, 예컨대 아펠렌코이데스 리체마보시) 및 앙구이나(Anguina)(종자 선충, 예컨대 앙구이나 트리티시)이다.

본 발명은 또한 적합한 조제 보조제 이외에 1종 이상의 화학식 I의 화합물을 포함하는 조성물, 예컨대 농작물 보호 조성물, 바람직하게는 살충, 진드기 구충, 참진드기 구충, 살선충, 연체동물 구충 또는 살진균, 특히 바람직하게는 살충 및 진드기 구충 조성물에 관한 것이다.

일반적으로 본 발명에 따른 조성물은 화학식 I의 활성 물질 1 내지 95중량%를 포함한다.

본 발명에 따른 조성물을 제조하기 위해서는 활성 물질 및 다른 첨가제를 조합하고 적합한 사용 형태로 만든다.

본 조성물은 널리 이용되고 있는 생물학적 및/또는 물리화학적 인자에 따라 다양한 방법으로 조제될 수 있다. 가능한 제형의 예는 다음과 같다:

습윤 분말(WP), 유화성 농축액(EC), 수용액(SL), 유화액, 분무액, 오일- 또는 수분산액(SC), 현탁유화액(SE), 더스트(DP), 종자 처리 생성물, 미세과립, 분무과립, 피복된 과립 및 흡수과립 형태의 과립, 수분산성 과립(WG), ULV 제형, 마이크로캡슐, 왁스 또는 베이트(bait).

제형의 이러한 각각의 유형은 원칙적으로 공지되어 있으며, 예컨대 문헌[Winnacker-Kuchler, "Chemical Technology", Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Ed. 1986; van Falkenberg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker N.Y., 2nd Ed. 1972-73; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London]에 기술되어 있다.

불활성 물질, 계면활성제, 용매 및 기타 첨가제와 같은 필요한 제형 보조제는 예들 들어 문헌[Watkin, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J.; H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry, 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; Marsden, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1950; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Copr., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schonfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte"[Surface-active ethylene oxide adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1967; 및 Winnacker-Kuchler, "Chemical Technology", Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Ed. 1986]에 기술되어 있다.

이들을 제형을 기본으로 하여 기타 살충제 활성 물질, 비료 및/또는 성장 조절제와의 조합물을 예들 들어 준비된 믹스 제형 또는 탱크 믹스의 형태로 제조하는 것도 가능하다. 습윤 분말은 물에 균일하게 분산되며, 활성 물질 이외에 습윤제, 예컨대 폴리옥시에틸화 알킬 페놀, 폴리옥시에틸화 지방 알콜, 알킬설포네이트 또는 알킬페놀설포네이트, 및 분산제, 예컨대 나트륨 리그노설포네이트 또는 나트륨 2,2'-디나프틸메탄-6,6'-디설포네이트를 희석제 또는 불활성 물질 이외에 추가로 포함한다.

유화성 농축액은 활성 물질을 하나 이상의 유화제와 함께 부탄올, 사이클로헥산온, 디메틸포름아미드, 크실렌 또는 고비점의 방향족 또는 탄화수소와 같은 유기 용매에 용해시켜 제조된다. 유화제로서는 예컨대 칼슘 알킬아릴설포네이트(예: 칼슘 도데실벤젠설포네이트) 또는 비이온성 유화제(예: 지방산 폴리글리콜 에스테르, 알킬아릴 폴리글리콜 에테르, 지방 알콜 폴리글리콜 에테르, 프로필렌 옥사이드/에틸렌 옥사이드 축합물, 알킬 폴리에테르, 소르비탄 지방산 에스테르, 폴리옥시에틸렌 소르비탄 지방산 에스테르 또는 폴리옥시에틸렌 소르비톨 에스테르)를 사용할 수 있다.

더스트(dust) 조성물은 활성 물질을 활석 및 천연 점토(예: 카올린, 벤토나이트, 피로필라이트 또는 규조토)와 같은 미분된 고형 물질과 함께 분쇄하여 수득된다. 과립은 활성 물질을 흡착성의 과립화된 불활성 물질 상으로 분무하거나, 또는 폴리비닐 알콜, 나트륨 폴리아크릴레이트 또는 광유와 같은 결합제에 의해 활성 물질 농축액을 모래 또는 카올리나이트와 같은 담체 물질 또는 과립화된 불활성 물질의 표면에 살포하여 제조될 수 있다. 적합한 활성 물질은 과립 비료의 통상적인 제조방법으로 원한다면 비료와의 혼합물 형태로 과립화될 수도 있다.

습윤 분말의 활성 물질 농도는 예를 들어 약 10 내지 90중량%이며, 100중량%가 되도록 하는 나머지는 통상적인 제형 보조제로 구성되어 있다. 유화성 농축액의 경우에는, 활성 물질 농도는 약 5 내지 80 중량%이다. 더스트 형태의 제형은 일반적으로 5 내지 20 중량%의 활성 물질, 분무 용액은 약 2 내지 20중량%의 활성 물질을 함유한다. 과립의 경우에는 활성 물질 함량은 활성 물질이 액체형인지 고체형인지, 어떠한 과립 보조제, 충전제 등이 사용되는지에 부분적으로 변화한다.

또한, 활성 물질의 상기 언급한 제형은 적당한 경우 각 경우에 통상적인 점착제, 습윤제, 분산제, 유화제, 침투제, 용매, 충전제 또는 담체를 포함한다.

사용을 위해서는, 상업적으로 입수가 가능한 형태로 존재하는 농축액은 원한다면 통상적인 방법으로, 예컨대 습윤 분말, 유화성 농축액, 분산액, 또한 일부의 경우 마이크로과립인 경우는 물을 이용하여 희석한다. 더스트, 과립 및 분무 용액 형태의 제제는 통상적으로는 사용전에 기타 불활성 물질로 더 이상 희석되지 않는다.

요구되는 살포량은 특히 온도 및 습도와 같은 외부 조건에 따라 변화한다. 활성성분은 예컨대 0.0005 내지 10.0kg/ha 이상, 바람직하게는 0.001 내지 5kg/ha의 넓은 범위내에서 변화될 수 있다.

상업적으로 입수가 가능한 제형 및 이들 제형으로부터 제조된 사용 형태(상기 조성물 참조)의 본 발명에 따른 활성 물질은 살충제, 유인제, 멸균제, 진드기 구충제, 살선충제, 살진균제, 연체동물 구충제, 성장 조절물질 또는 제초제와 같은 기타 활성 물질과의 혼합물로 존재할 수도 있다.

본 살충제는 예를 들어 인산 에스테르, 카바메이트, 카복실산에스테르, 포름아미딘, 주석 화합물 및 미생물로부터 제조된 물질을 포함한다.

혼합물의 바람직한 성분은 다음과 같다.

#### 1. 인 화합물 그룹

아세페이트, 아자메티포스, 아지포스-에틸, 아지포스-메틸, 브로모포스, 브로모포스-에틸, 카두사포스(F-67825), 클로르에톡시포스, 클로르펜빈포스, 클로르메포스, 클로르피리포스, 클로르피리포스-에틸, 데메톤, 데메톤-S-에틸, 데메톤-S-메틸설포, 디알리포스, 디아지논, 디클로로보스, 디크로토포스, 디메토에이트, 디설포톤, EPN, 에티온, 에토프로포스, 에트리포스, 팜푸르, 페나미포스, 페니트로티온, 펜설포티온, 펜티온, 포노포스, 포르모티온, 포스티아제이트(ASC-66824), 헵테노포스, 이사조포스, 이소티오에이트, 이속사티온, 말라티온, 메타크리포스, 메타미도포스, 메티다티온, 살리티온, 메빈포스, 모노크로토포스, 날레드, 오메토에이트, 옥시데메톤-메틸, 파라티온, 파라티온-메틸, 펜토에이트, 포레이트, 포살론, 포스폴란, 포스포카브(BAS-301), 포스멧, 포스파미돈, 폭삼, 피리미포스, 피리미포스-에틸, 피리미포스-메틸, 프로페노포스, 프로파포스, 프로에탐포스, 프로티오포스, 피라클로포스, 피리다펜티온, 퀴날포스, 설프로포스, 테메포스, 테르부포스, 테르부피르포스, 테트라클로르빈포스, 티오메톤, 트리아조포스, 트리클로로폰, 바미도티온.

#### 2. 카바메이트 그룹

알라니카르브(OK-135), 알디카르브, 2-s-부틸페닐 메틸카바메이트(BPMC), 카바릴, 카보푸란, 카보셀판, 클로에도카르브, 벤푸라카르브, 에티오펜카르브, 푸라티오펜카르브, HCN-801, 이소프로카르브, 메토밀, 5-메틸-m-쿠메닐 부티릴(메틸)카바메이트, 옥사밀, 피리미카르브, 프로폭서, 티오디카르브, 티오파녹스, 1-메틸티오(에틸리덴아미노)-N-메틸-N-(모르폴리노)카바메이트(UC 51717), 트리아자메이트.

#### 3. 카복실산 에스테르 그룹

아크리나트린, 알레트린, 알파메트린, 5-벤질-3-푸릴메틸 (E)-(1R)-시스-2,2-디메틸-3-(2-옥소티올란-3-일리덴메틸)사이클로프로판카복실레이트, 베타-사이플루트린, 베타-사이퍼메트린, 바이오알레트린, 바이오알레트린((S)-사이클로펜틸 이성질체), 바이오레스메트린, 비펜트린, (RS)-1-시아노-1-(6-페녹시-2-피리딘)메틸 (1RS)-트랜스-3-(4-t-부틸페닐)-2,2-디메틸사이클로프로판카복실레이트(NC1 85193), 사이클로프로트린, 사이플루트린, 사이할로트린, 사이티트린, 사이퍼메트린, 사이페노트린, 델타메트린, 엠펜트린, 에스펜발러레이트, 펜플루트린, 펜프로파트린, 펜발러레이트, 플루시트리네이트, 플루메트린, 플루발리네이트(D 이성질체), 이미프로트린(S-41311), 람다-사이할로트린, 퍼메트린, 페오트린((R) 이성질체), 프랄레트린, 피레트린(천연물), 레스메트린, 테플루트린, 테트라메트린, 세타-사이퍼메트린(TD-2344), 트랄로메트린, 트랜스플루트린, 제타-사이퍼메트린(F-56701).

#### 4. 아미딘 그룹

아미트라즈, 클로르디메포름.

#### 5. 주석 화합물 그룹

시핵사틴, 펜부타틴 옥사이드.

## 6. 기타

아바멕틴, ABG-9008, 아세타미프리트, 아나그라파 팔시테라, AKD-1022, AKD-3059, ANS-118, 바실루스 투린지엔시스, 베아우베리아 바시아네아, 벤셀탐, 비페나제이트(D-2341), 비나파크릴, BJI-932, 브로모프로필레이트, BTG-504, BTG-505, 부프로페진, 캄페클로르, 카탐, 클로로벤질레이트, 클로르페나피르, 클로르플루아주론, 2-(4-(클로로페닐)-4,5-디페닐티오펜(UBI-T 930), 클로르펜테진, 클로마페노지드(ANS-118), CG-216, CG-217, CG-234, A-184699, 2-나프틸메틸 사이클로프로판카복실레이트(Ro12-0470), 시로마진, 디아클로덴(티아메톡삼), 디아펜티우론, 에틸 2-클로로-N-(3,5-디클로로-4-(1,1,2,3,3,3-헥사플루오로-1-프로필옥시)페닐)카바모일)-2-카복시이미데이트, DDT, 디코폴, 디플루벤주론, N-(2,3-디하이드로-3-메틸-1,3-티아졸-2-일리덴)-2,4-크실리딘, 디노부톤, 디노캅, 디노페놀란, DPX-062, 에마멕틴, 벤조에이트(MK-244), 엔도설판, 에티프롤(설페티프롤), 에토펙스, 에톡사졸(YI-5301), 페나자퀸, 페녹시카브, 피프로닐, 플루아주론, 플루미트(플루펜진, SZI-121), 2-플루오로-5-(4-(4-에톡시페닐-4-메틸-1-펜틸)디페닐에테르(MTI 800), 과립상(granulosis) 및 핵 폴리헤드로시스(nuclear polyhedrosis) 바이러스, 펜피록시메이트, 펜티오카르브, 플루벤지민, 플루사이클록수론, 플루페녹수론, 플루펜프록스(ICI-A5683), 플루프록시펜,  $\gamma$ -HCH, 할로페노자이드(RH-0345), 할로펜프록스(MTI-732), 헥사플루오론(DE-473), 헥사티아옥스, H01-9004, 하이드라메틸논(AC 217300), 루페누론, 이미다클로프리트, 이독사카브(DPX-MP062), 카네마이트(AKD-2023), M-020, MTI-446, 이베르멕틴, M-020, 메톡시페노자이드(인트레피드, RH-2485), 말베멕틴, NC-196, 님가드, 니텐피람(TI-304), 2-니트로메틸-4,5-디하이드로-6H-티아진(SD 52618), 2-니트로메틸-3,4-디하이드로티아졸(SD 35651), 2-니트로메틸렌-1,2-티아지나-3-일카밤알데히드(WL 108477), 피리프록시펜(S-71639), NC-196, NC-1111, NNI-9768, 노발루론(MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, 프로파기트, 피메트로진, 피리다벤, 피리미디펜(SU-8801), RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SB7242, SI-8601, 실라플루오펜, 실로마딘(CG-177), 스피노사드, SU-9118, 테부페노자이드, 테부펜피라드(MK-239), 테플루벤주론, 테트라디폰, 테트라셀, 티아클로프리트, 티오사이클람, TI-435, 톨펜피라드(OMI-88), 트리아자메이트(RH-7988), 트리플루오론, 베르부틴, 베르탈렉(미코탈), YI-5301.

상업적으로 입수가 가능한 제형으로부터 제조되는 사용 형태의 활성 물질 함량은 활성 물질 0.00000001 내지 95중량%, 바람직하게는 0.00001 내지 1중량%이다. 적용은 사용 형태에 적합하도록 된 통상적인 방법으로 수행된다.

본 발명은 또한 해충, 진드기, 연체동물 및/또는 선충을 방제하는 방법에 있어서, 본 발명에 따른 화합물 또는 본 발명에 따른 조성물의 유효량을 이들 또는 이들로 감염된 식물, 구역 또는 배양기에 적용하는 방법에 관한 것이다.

해충, 진드기, 연체동물 및/또는 선충을 방제하기 위한 본 발명에 따른 화합물 또는 본 발명에 따른 조성물의 용도도 또한 본 발명의 대상이다.

본 발명에 따른 활성 물질은 또한 수의학적 의약 부문에 사용하기에 적합하고, 바람직하게는 내부기생충 및 외부기생충을 방제하기에 적합하고, 동물 사육의 부문에 적합하다.

본 발명에 따른 활성 물질은 공지된 방법으로, 예컨대 정제, 캡슐, 드링크제 또는 과립 형태로의 경구 투여에 의해, 예컨대 침지, 분무, 붓기, 스포팅 및 뿌리기 형태로의 피부 도포에 의해, 그리고 예컨대 주사 형태로의 비경구 투여에 의해 적용될 수 있다.

더욱이 본 발명에 따른 화합물은 또한 과학기술에서, 예컨대 목재 보존제, 도료의 보존제, 금속세공용 냉각 윤활제의 보존제, 또는 천공 및 절삭유의 보존제로서 사용하기에 적합하다.

따라서, 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물은 또한 가축류 사육(예컨대 소, 양, 돼지, 및 닭, 거위 등과 같은 가금)에 특히 유리하게 사용될 수 있다. 본 발명의 바람직한 실시태양에서는, 적합하다면 적당한 제형(상기 참조)의 신규한 화합물을, 적합하다면 식수 또는 사료와 함께 동물에 경구 투여한다. 분변중의 배설물은 아주 유효하므로 동물 대소변내에서의 곤충의 발달은 이러한 방법으로 매우 쉽게 예방될 수 있다. 각각의 경우에 적합한 투여량 및 제형은 특히 생산력 있는 가축류의 종 및 발달 단계, 및 기생충이 침입할 위험에 좌우되고, 관행의 방법에 의해 쉽게 결정 및 확립될 수 있다. 예컨대 본 화합물은 소에는 체중 1kg당 0.01 내지 1mg의 투여량으로 사용될 수 있다.

본 발명에 따른 화학식 I의 화합물은 또한 현저한 살진균 작용에 의해 구별된다. 식물 조직에 이미 침입한 진균 병원균은 치료적 방법으로 성공적으로 방제될 수 있다. 이것은 일단 감염이 일어나면 다른 통상적인 살진균제에 의해서는 더 이상 효과적으로 방제될 수 없는 진균 질환의 경우에 특히 중요하고 이롭다. 청구된 화합물의 작용 범위는 예컨대 플라스모파라 비티콜라(*Plasmopara viticola*), 피토프토라 인페스탄스(*Phytophthora infestans*), 에리시페 그라미니스(*Erysiphe graminis*), 피리쿨라리아 오리자에(*Pyricularia oryzae*), 피레노포라 테레스(*Pyrenophora teres*), 랩토스파에레아 노도럼(*Leptosphaeria nodorum*) 및 펠리쿨라리아 사사키(*Pellicularia sasakii*) 및 푸시니아 레콘디타(*Puccinia recondita*)와 같은 다양한 경제적으로 중요한 식물 병원성 진균을 포함한다.

이러한, 그러나 또한 주로 살충, 진드기 구충, 연체동물 구충 또는 살선충에도 활성인 화학식 I의 화합물은 그것의 상업적으로 입수가 가능한 제형으로 단독으로 또는 문헌으로부터 공지된 다른 살진균제와 조합하여 적용될 수 있다.

문헌으로부터 공지되고 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물과 조합될 수 있는 살진균제는 예컨대 하기 제품이다:

알디모르프, 안도프림, 아닐라진, BAS 480F, BAS 450F, 베날락실, 베노다닐, 베노밀, 비나파크릴, 비터타놀, 브로무코나졸, 부티오베이트, 캅타폴, 캅탄, 카벤다짐, 카르복신, CGA 173506, 시프로푸람, 디클로플루아니드, 디클로메진, 디클로부트라졸, 디에토펙카르브, 디펜코나졸(CGA 169374), 디플루코나졸, 디메티리올, 디메토모르프, 디니코나졸, 디노캅, 디티아논, 도데모르프, 도딘, 에디펜포스, 에티리올, 에트리디



아졸, 페나리몰, 펜푸람, 펜피클로닐, 펜프로피딘, 펜프로피모르프, 펜틴 아세테이트, 수산화 펜틴, 페림 존(TF 164), 플루아지남, 플루오벤지민, 플루코코나졸, 플루오리미드, 플루실라졸, 플루톨라닐, 플루트리 아폴, 폴렛, 포세틸 알루미늄, 푸베리다졸, 풀설파미드(MT-F 651), 푸칼락실, 푸르코나졸, 푸르메사이클 톡스, 구아자틴, 핵사코나졸, ICI A5504, 이마잘릴, 이미벤코나졸, 이프로벤포스, 이프로디온, 이소프로 톡스란, KNF 317, 구리 화합물(예컨대, 구리 옥시클로라이드, 옥신-구리, 산화 구리), 만코젠, 마넵, 메 파니피람(KIF 3535), 메트코나졸, 메트로닐, 메탈락실, 메타설포카르브, 메트푸록삼, MON 24000, 미클로 부타닐, 나밤, 니트로탈리도프로필, 누아리몰, 오프레이스, 옥사디실, 옥시카복신, 펜코나졸, 펜시쿰론, PP 969, 프로베나졸, 프로피네브, 프루클로라즈, 프로시미돈, 프로파모카르브, 프로피코나졸, 프로티오카 르브, 피라카볼리드, 피라조포스, 피리페녹스, 피로퀼론, 라벤자졸, RH7592, 황, 테부코나졸, TF 167, 티 아벤다졸, 티시오펜, 티오파네이트-메틸, 티람, 톨글로포스-메틸, 톨릴플루아니드, 트리아디메폰, 트리 아 디메놀, 트리아이클라졸, 트리데모르프, 트리플루미졸, 트리포린, 발리다마이신, 빈클로졸린, XPD 563, 지네브, 나트륨 도데실설포네이트, 나트륨 도데실설포레이트, 나트륨 C13/C15-알콜 에테르 설포네이트, 나 트륨 세토스테아릴 포스페이트 에스테르, 나트륨 디옥틸 설포숙시네이트, 나트륨 이소프로필아프탈렌 설포네이트, 나트륨 메틸렌비스나프탈렌 설포네이트, 세틸트리메틸암모늄 클로라이드, 장쇄 1차, 2차 또는 3차 아민염, 알킬프로필렌아민 라우릴피리미디늄 브로마이드, 에톡실화 4차 지방산 아민, 알킬디메틸벤질 암모늄 클로라이드 및 1-하이드록시에틸-2-알킬이미다졸.

조합을 위한 상기 성분은 공지된 활성 물질이고, 이들중 다수는 시.디.에스. 톰린(C.D.S. Tomlin), 에스.비. 월커(S.B. Walker)의 문헌[The Pesticide Manual, 11th Ed., British Crop Protection Council Farnham 1997]에 기재되어 있다.

상업적으로 입수가 가능한 제형으로부터 제조되는 사용 형태의 활성 물질 함량은 넓은 범위내에서 변화될 수 있고, 사용 형태의 활성 물질 농도는 활성 물질 0.0001 내지 95중량%, 바람직하게는 0.0001 내지 1중량% 이다. 본 화합물은 제형에 적합하도록 된 통상적인 방법으로 적용된다.

본 화합물은 제형에 적합하도록 된 통상적인 방법으로, 예컨대 병원성 진균을 방제하기 위해 본 발명에 따른 화합물 또는 본 발명에 따른 조성물의 살진균 유효량을 이들 진균 또는 이들로 감염된 식물, 배양기 구역, 또는 종자에 적용함으로써 사용된다.

본 발명은 또한 본 발명에 따른 화합물 또는 본 발명에 따른 조성물의 유효량으로 처리 또는 코팅된 종자 에 관한 것이다.

화학식 I의 화합물은 또한 공지된 유전공학 식물 또는 이제부터 개발될 유전공학 식물의 농작물에서 유해 유기체를 방제하는데 사용될 수 있다. 일반적으로 트랜스제닉 식물은 특히 유리한 특성에 의해, 예컨대 특수한 농작물 보호제에 대한 내성, 식물 병에 대한 내성, 또는 특정 곤충 또는 미생물, 예컨대 진균, 박 테리아 또는 바이러스와 같은 식물 병의 병원체에 대한 내성에 의해 구별된다. 다른 특별한 특성은 예컨 대 양, 품질, 저장성, 조성 및 특정 구성성분과 관련하여 수확된 물질에 관련된다. 따라서 전분 함량이 증가되거나 전분 품질이 변경되거나 또는 수확된 물질이 상이한 지방산 조성을 갖는 트랜스제닉 식물은 공지되어 있다.

유용한 식물 및 관상식물, 예컨대 밀, 보리, 호밀, 귀리, 수수, 벼, 카사바 및 옥수수과 같은 곡물 또는 사탕무, 목화, 콩, 지방종자 평지, 감자, 토마토, 완두 및 다른 종류의 야채와 같은 그밖의 농작물을 경 제적으로 중요한 트랜스제닉 농작물에 사용하는 것은 바람직하다.

트랜스제닉 농작물에 사용되는 경우, 다른 농작물에서 관찰되는 유해 유기물에 대한 효과 이외에도 특히 곤충에 대한 내성을 갖는 효과, 예컨대 방제될 수 있는 유해 동물의 범위가 변경되거나 특이적으로 확장 되는 효과, 또는 살포에 사용될 수 있는 살포율이 변경되는 효과가 자주 관찰되는데, 이것은 해당 트랜스 제닉 농작물에서의 적용에 특이적인 것이다.

따라서 본 발명은 또한 트랜스제닉 농작물에서 유해 유기물을 방제하기 위한 화학식 I의 화합물의 용도에 관한 것이다.

예컨대 살충제, 진드기 구충제, 연체동물 구충제, 살선충제 또는 살진균제로서의 화학식 I의 화합물 또는 이들을 포함하는 조성물의 본 발명에 따른 용도는 또한 화학식 I의 화합물 또는 그의 염이 예컨대 곤충, 식물 또는 토양에 살포된 후에만 전구체로부터 형성되는 경우도 포함한다.

따라서 본원이 우선권을 주장하고 있는 독일 특허 출원 제 198 15 026.1 호의 내용 및 첨부된 초록의 내 용은 명백히 참고로 포함되어 있고, 인용에 의해 본 명세서의 일부가 되고 있다.

하기 실시예는 본 발명을 이에 한정하지 않으면서 설명하고자 하는 것이다.

## 실시예

### A. 제조예

전구체 VP1: 4'-브로모-2-하이드록시아세토페논 0-메틸옥심

포름산나트륨(244.6g, 3597mmol)을 에탄올/물(7:3, 1ℓ)에 도입하였다. 2,4'-디브로모아세토페논(200g, 719mmol)을 약 60°C에서 나누어 가하고, 이어서 혼합물을 7시간 동안 환류하였다. 이어서 물(1ℓ)을 혼 합하였다. 냉각시 하이드록시 케톤이 결정화되었는데 이것을 흡인에 의해 여과하여 분리하였다. 이로써 순수한 형태의 하이드록시 케톤 중간체(143.6g, =93% 수율)를 얻었다. 이것을 디옥산/물(9:1, 700ml)중 의 0-메틸하이드록실아민 염산염(59.0g, 706mmol) 및 아세트산나트륨(57.9g, 706mmol)과 혼합하고, 혼합 물을 3시간 동안 환류하였다. 물(1.3ℓ)과 함께 교반하고 헵탄/에틸 아세테이트(1:1)에 의해 추출한 후, 4'-브로모-2-하이드록시아세토페논 0-메틸옥심 174.3g을 유상물로서 얻었다. 순도 약 90%, 이성질체 2개.

전구체 VP2: 2-아미노-2-(4-브로모페닐)에탄올(화학식 VI의 아미노 알콜)

4'-브로모-2-하이드록시아세토페논 0-메틸옥심(54.8g, 224mmol)을 THF(350ml)중의 수소화알루미늄리튬(20g, 505mmol) 및 염화알루미늄(15.3g, 112mmol)의 혼합물에 THF중의 용액으로서 질소하에 20℃에서 적가하였다. 4시간 후, 혼합물을 가수분해하고(메탄올 40ml; 2N NaOH 200ml), 헵탄/에틸 아세테이트에 의해 추출하였다. 조질 생성물(42g)을 헵탄/에틸 아세테이트(2:1)로 재결정화하였다. 이로써 2-아미노-2-(4-브로모페닐)에탄올을 얻었다. 29.3g, 무색 결정, 융점 95℃.

전구체 VP3: N-[1-(4'-브로모페닐)-2-하이드록시에틸]-2,6-디플루오로벤즈아미드(화학식 VII)

2,6-디플루오로벤조일 클로라이드(13.8ml, 110mmol)를 THF(150ml)중의 2-아미노-2-(4-브로모페닐)에탄올(25.0g, 116mmol) 및 트리에틸아민(19.5ml, 139mmol)에 20℃에서 적가하였다. 15시간 후, 혼합물을 물과 함께 교반하고 헵탄/에틸 아세테이트에 의해 추출하였다. 이로써 아미도 알콜 생성물을 얻었다. 38.6g, 담황색 고체, 융점 141℃.

전구체 VP4: 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-브로모페닐)옥사졸린(화학식 III)

염화티오닐/알칼리금속 수산화물법을 사용한 합성

아미도 알콜 VP3(38.5g, 108mmol)을 디클로로메탄중에서 염화티오닐(9.7ml, 130mmol)과 혼합하고 40℃에서 5시간 동안 가열하였다. 혼합물을 농축하고 잔류물(=아미도클로라이드, 36.5g)을 디옥산(180ml)중의 6N NaOH(32.5ml)와 함께 환류하였다(6시간). 혼합물을 물과 함께 교반하고 에틸 아세테이트에 의해 추출하였다. 조질 생성물(유상물, 31.8g)을 헵탄/에틸 아세테이트(9:1)로부터 재결정화하였다. 이로써 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-브로모페닐)옥사졸린을 얻었다. 17.8g, 무색 결정, 융점 98℃; 비점 365℃(GC).

염화토실/아민법을 사용한 합성

아미도 알콜 VP3(5.0g, 14.0mmol)을 디클로로메탄(40ml)중에서 트리메틸아민(5.67g, 56mmol) 및 염화토실(2.94g, 15.5mmol)과 혼합하고 5시간 동안 환류하였다. 혼합물을 농축하고 잔류물을 물과 함께 교반하고 에틸 아세테이트에 의해 추출하였다. 조질 생성물(4.6g)을 재결정화하고 에탄올/물(8:2)에 의해 재결정화하였다. 이로써 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-브로모페닐)옥사졸린을 얻었다. 3.4g, 무색 결정, 융점 97℃;  $^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3, \text{ppm})$ : 4.24, 4.81, 5.43, 옥사졸린; 7.00, 7.43,  $\text{F}_2\text{C}_6\text{H}_3$ ; 7.23, 7.51,  $\text{BrC}_6\text{H}_4$ .

전구체 VP5: 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-트리메틸스탄닐페닐)옥사졸린(화학식 IX)

VP4 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-브로모페닐)옥사졸린(16.4g, 48.8mmol)을 질소하에 디옥산에 도입하고, 헥사메틸디스탄난(20g, 61.2mmol),  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (1.4g, 1.2mmol) 및 염화리튬(0.38g, 4.4mmol)을 가하고, 혼합물을 7시간 동안 환류하였다. 반응혼합물을 물과 함께 교반하고 헵탄/에틸 아세테이트에 의해 추출하였다. 조질 생성물(19.6g, 유상물)은 약 70%의 Sn 생성물을 함유하였다. 크로마토그래피로 분리하여(용출제: 헵탄/에틸 아세테이트(2:1)) 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-트리메틸스탄닐페닐)옥사졸린을 수득하였다. 13.4g, 유상물, 결정성으로 바뀜, DC Rf 0.59(VP4 Rf 0.49).

전구체 VP6: 5-브로모-2-트리플루오로에톡시피리딘

수소화나트륨(18.6g, 60%, 464mmol)을 질소하에 DMF(500ml)에 도입하였다. 트리플루오로에탄올(32.2ml, 443mmol)을 10℃에서 적가하였다. 1시간 후, 2,5-디브로모피리딘(100g, 422mmol)을 나누어 가하고 혼합물을 수욕에서 24℃에서 24시간 동안 교반하였다. 이어서 이것을 물과 함께 교반하고 헵탄/에틸 아세테이트(9:1)에 의해 추출하였다. 조질 생성물(105g)을 증류하여 5-브로모-2-트리플루오로에톡시피리딘을 얻었다. 82.1g(순도 93%), 무색 유체, 비점 18밀리바에서 97-104℃.

다른 알콕시피리딘 및 알킬티오피리딘을 유사하게 제조하였다.

전구체 VP7: 5,5-디메틸-2-(2-트리플루오로에톡시피리딘-5-일)-1,3,2-디옥사보리난

5-브로모-2-트리플루오로에톡시피리딘(30.0g, 117mmol)을 질소하에 THF/디에틸 에테르(2:1, 250ml)에 도입하고 냉각하였다. n-부틸리튬 용액(2.5M, 53.9ml, 135mmol)을 시린지를 사용하여 약 -85℃에서 가하였다. 10분 후, 이소프로필 보레이트(33.1ml, 141mmol)를 약 -80℃에서 적가하였다. 혼합물의 온도를 -10℃로 상승시키고 아세트산(10.1ml, 176mmol) 및 2,2-디메틸프로판디올(15.9g, 152mmol)을 가하였다. 20℃에서 15시간 후, 혼합물을 물과 함께 교반하고 헵탄/에틸 아세테이트에 의해 추출하였다. 조질 생성물(31.5g)을 헵탄/에틸 아세테이트(95:5)를 사용하여 재결정화하였다. 이로써 5,5-디메틸-2-(2-트리플루오로에톡시피리딘-5-일)-1,3,2-디옥사보리난을 얻었다. 20.3g, 백색 고체;  $^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3, \text{ppm})$ : 1.02, Me; 3.75,  $\text{OCH}_2$ ; 4.77,  $\text{PyOCH}_2$ ; 6.82, 7.97, 8.50, PyH.

다른 2-피리딜-1,3,2-디옥사보리난을 유사하게 얻었다.

전구체 VP8: 2-에톡시-5-트리메틸스탄닐피리딘

5-브로모-2-에톡시피리딘(14.9g, 68mmol)을 질소하에 THF/디에틸 에테르(2:1, 120ml)에 도입하였다. n-부틸리튬/헥산 용액(2.5M, 33ml, 82mmol)을 -80℃에서 가하였다. 15분 후, THF에 용해된 클로로트리메틸주석(16.4g, 82mmol)을 적가하였다. 혼합물의 온도를 0℃로 상승시키고 혼합물을 물과 함께 교반하고 헵탄/에틸 아세테이트에 의해 추출하였다. 조질 생성물(15.7g)을 진공에서 증류하였다. 이로써 2-에톡시-5-트리메틸스탄닐피리딘을 얻었다. 11.2g, 비점 1.2밀리바에서 66-75℃.

다른 스타닐피리딘을 유사하게 제조하였다.

전구체 VP9: 5-[4-1-아미노-2-하이드록시에틸]-2-트리플루오로에톡시피리딘

2-아미노-2-(4-브로모페닐)에탄올 VP2(3.8g, 17.1mmol) 및 5,5-디메틸-2-(2-트리플루오로에톡시피리딘-5-일)-1,3,2-디옥사보리난 VP7(6.55g, 20.4mmol)을 톨루엔/에탄올/물(8:2:1, 50ml)중의 테트라키스(트리페

닐포스핀)팔라듐(0.63g, 3몰%), 탄산나트륨(3.7g, 35.4mmol)과 함께 7시간 동안 환류하였다. 추출 후 처리 및 컬럼 크로마토그래피에 의한 정제 후, 5-[4-(1-아미노-2-하이드록시에틸)페닐]-2-트리플루오로에톡시피리딘(2.2g, 융점 129°C)을 얻었다.

옥사졸린 생성물:

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-에톡시피리딘-5-일)페닐]옥사졸린(실시예 No. 2)

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-브로모페닐)옥사졸린(VP4)(5.00g, 14.8mmol)을 디옥산(40ml)중의 2-에톡시-5-트리메틸스탄닐피리딘(VP8)(5.06g, 17.8mmol), Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub> (0.68g, 0.59mmol) 및 염화리튬(0.12g, 17.8mmol)과 혼합하고 혼합물을 질소하에 환류하였다(7시간). 추출 및 크로마토그래피 후, 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-에톡시피리딘-5-일)페닐]옥사졸린을 얻었다. 3.86g, 융점 119°C; <sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>, ppm): 1.42, 4.35, OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>; 4.40, 4.84, 5.51, 옥사졸린; 6.79, 7.77, 8.36, 피리딘; 7.00, 7.41, 7.54, 페닐.

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-트리플루오로에톡시피리딘-5-일)페닐]옥사졸린(실시예 No. 3)

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-브로모페닐)옥사졸린(VP4)(2.0g, 5.9mmol)을 디옥산(30ml)중의 2-트리플루오로에톡시-5-트리메틸스탄닐피리딘(2.61g, 7.7mmol), 테트라키스(트리페닐포스핀)팔라듐(0.22g, 0.18mmol) 및 염화리튬(0.38g, 8.9mmol)과 혼합하고 9시간 동안 환류하였다. 추출 후처리 및 컬럼 크로마토그래피 후, 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-트리플루오로에톡시피리딘-5-일)페닐]옥사졸린을 얻었다. 1.37g, 무색 결정.

<sup>19</sup>F NMR(CDCl<sub>3</sub>): -75.05(CF<sub>3</sub>), -110.45(ArF).

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-n-프로필옥시피리딘-5-일)페닐]옥사졸린(실시예 No. 4)

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-브로모페닐)옥사졸린(VP4)(2.0g, 2.9mmol)을 디옥산중의 2-n-프로필옥시-5-트리메틸스탄닐피리딘(4.6g, 50%, 7.7mmol), Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>(0.35g, 0.3mmol) 및 염화리튬(50mg)과 혼합하고 질소하에 환류하였다(7시간). 크로마토그래피 및 헵탄/에틸 아세테이트(95:5)중에서의 재결정화 후, 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-n-프로필옥시피리딘-5-일)페닐]옥사졸린을 얻었다. 1.21g, 무색 결정;

<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>, ppm): 1.05, 1.82, 4.29, OC<sub>3</sub>H<sub>7</sub>; 4.32, 4.86, 5.51, 옥사졸린; 6.80, 7.78, 8.37, 피리딘; 7.02, 7.42, 7.54, 페닐.

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-이소부틸옥시피리딘-5-일)페닐]옥사졸린(실시예 No. 8)

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-브로모페닐)옥사졸린(1.00g, 2.96mmol)을 톨루엔/에탄올/물(8:2:1, 15ml)중의 5,5-디메틸-2-(2-이소부틸옥시피리딘-5-일)-1,3,2-디옥사보리난(1.4g, 순도 80%, 4.3mmol), Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>(0.17g, 0.15mmol) 및 탄산나트륨(0.62g, 5.9mmol)과 혼합하고 질소하에 8시간 동안 환류하였다. 추출 및 크로마토그래피 후, 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-이소부틸옥시피리딘-5-일)페닐]옥사졸린을 얻었다. 1.14g, 무색 유상물.

<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>, ppm): 1.04, 2.11, 4.10, o-이소부틸; 4.33, 4.84, 5.51, 옥사졸린; 7.00, 7.42, 7.55, 페닐; 6.81, 7.77, 8.37, 피리딘.

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-트리플루오로에톡시피리딘-5-일)페닐]티아졸린(실시예 No. 19)

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-브로모페닐)티아졸린(0.90g, 2.5mmol, 톨루엔중의 전구체 VP3 및 로웨슨(Lawesson) 시약으로부터 얻어짐)을 디옥산(10ml)중의 2-트리플루오로에톡시-5-트리메틸스탄닐피리딘(1.21g, 3.6mmol), Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>(0.15g) 및 염화리튬(0.16g)과 혼합하고 혼합물을 8시간 동안 환류하였다. 추출 및 컬럼 크로마토그래피 후, 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-트리플루오로에톡시피리딘-5-일)페닐]티아졸린을 얻었다. 0.46g, 베이지색 고체; MS: M<sup>+</sup> 450.

<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>, ppm): 3.45, 3.94, 5.83, 티아졸린; 4.82, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>; 6.95, 7.87, 8.36, 피리딘; 7.00, 7.40, 7.53, 페닐.

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-n-프로필피리딘-5-일)페닐]옥사졸린(실시예 No. 34)

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-브로모페닐)옥사졸린(0.8g, 2.4mmol)을 톨루엔/에탄올/물(8:2:1, 11ml)중의 디메틸-2-(2-n-프로필피리딘-5-일)-1,3,2-디옥사보리난(0.72g, 3.1mmol), Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub> (0.14g, 0.12mmol) 및 탄산나트륨(0.5g)과 혼합하였다. 추출 및 크로마토그래피 후, 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-n-프로필피리딘-5-일)페닐]옥사졸린을 얻었다. 0.20g, 옅은 색의 고체.

<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>, ppm): 1.01, 1.80, 2.81, n-프로필; 4.34, 4.85, 5.53, 옥사졸린; 7.00, 7.44, 7.59, 페닐; 7.21, 7.79, 8.76, 피리딘.

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-에틸술폰피리딘-5-일)페닐]옥사졸린(실시예 No. 40)

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-에틸티오피리딘-5-일)페닐]옥사졸린(실시예 No. 39; 0.60g, 1.5mmol)을 디클로로에탄(10ml)중의 3-클로로퍼벤조산(0.41g, 1.7mmol)과 함께 20°C에서 5시간 동안 교반하였다. 추출 및 크로마토그래피 후, 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-에틸술폰피리딘-5-일)페닐]옥사졸린을 얻었다. 0.21g, 무색 유상물.

$^1\text{H}$  NMR( $\text{CDCl}_3$ , ppm): 1.24, 2.98, 3.21,  $\text{SO}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ ; 4.33, 4.87, 5.56, 옥사졸린; 7.01, 7.48, 7.64, 페닐; 8.03, 8.11, 8.84, 피리딘.

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-N-아세틸에틸아미노)피리딘-5-일]페닐]옥사졸린(실시예 No. 51)

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-트리메틸스탄닐페닐)옥사졸린(0.84g, 2.0mmol)을 디옥산(10ml)중의 2-(N-아세틸에틸아미노)-5-요오도피리딘(0.93g, 3.2mmol),  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (0.12g) 및 염화리튬(0.15g)과 혼합하고 혼합물을 8시간 동안 환류하였다. 크로마토그래피(용출제: 에틸 아세테이트)로 분리한 후, 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(2-N-아세틸에틸아미노)피리딘-5-일]페닐]옥사졸린을 얻었다. 0.31g, 옅은 색 유상물.

$^1\text{H}$  NMR( $\text{CDCl}_3$ , ppm): 1.19, 3.94,  $\text{NC}_2\text{H}_5$ ; 2.08,  $\text{COCH}_3$ ; 4.33, 4.87, 5.54, 옥사졸린; 7.00, 7.43, 7.48, 7.61, 페닐; 7.32, 7.96, 8.75, 피리딘.

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(1-n-프로필-2-피리돈-5-일)페닐]옥사졸린(실시예 No. 152)

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-(4-트리메틸스탄닐페닐)옥사졸린(0.5g, 1.2mmol)을 디옥산(10ml)중의 1-n-프로필-5-브로모-2-피리돈(0.51g, 2.4mmol),  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (70mg) 및 염화리튬(0.20g)과 혼합하고 질소하에 8시간 동안 환류하였다. 추출 후처리 및 크로마토그래피(용출제: 에틸 아세테이트) 후, 2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[4-(1-n-프로필-2-피리돈-5-일)페닐]옥사졸린을 옅은 색 유상물로서 얻었다. 0.20g, 유상물.

$^1\text{H}$  NMR( $\text{CDCl}_3$ , ppm): 1.00, 1.81, 3.96,  $\text{NC}_3\text{H}_7$ ; 4.30, 4.83, 5.49, 옥사졸린; 6.64, 피리돈; 7.00, 7.4-7.7, 페닐 및 피리돈.

2-(2-클로로페닐)-4-[4-(2-트리플루오로에톡시피리딘-5-일)페닐]옥사졸린(실시예 No. 25)

2-(2-클로로페닐)-4-(4-브로모페닐)옥사졸린(VP4와 유사하게 제조됨)(0.80g, 2.4mmol) 및 5,5-디메틸-2-(2-트리플루오로에톡시피리딘-5-일)-1,3,2-디옥사보리난 VP7(1.03g, 3.6mmol)을 톨루엔/에탄올/물(8:2:1, 11ml)중의  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (0.1g) 및 탄산나트륨(0.5g)과 함께 환류하였다(8시간). 추출 및 컬럼 크로마토그래피 후, 2-(2-클로로페닐)-4-[4-(2-트리플루오로에톡시피리딘-5-일)페닐]옥사졸린을 옅은 색 유상물로서 얻었다. 0.86g;  $^1\text{H}$  NMR( $\text{CDCl}_3$ ): 4.31, 4.80, 5.50, 옥사졸린; 4.80,  $\text{OCH}_2\text{CF}_3$ ; 6.93, 7.3-7.5, 7.84, 8.35, 피리딘 및 페닐.

2-(2,6-디플루오로페닐)-4-[2-에톡시-4-(2-트리플루오로에톡시피리딘-5-일)페닐]옥사졸린(실시예 No. 106)

실시예 No. 106을 실시예 No. 25와 유사하게 제조하였다.

$^1\text{H}$  NMR( $\text{CDCl}_3$ ): 1.45, 4.15,  $\text{OEt}$ ; 4.45, 4.92, 5.73, 옥사졸린; 4.81,  $\text{OCH}_2\text{CF}_3$ ; 6.94, 7.84, 8.35, 피리딘; 6.98, 7.12, 7.41, 7.53, 페닐.

2-(2-플루오로페닐)-4-[4-(2-트리플루오로에톡시피리딘-5-일)페닐]옥사졸린(실시예 No. 402)

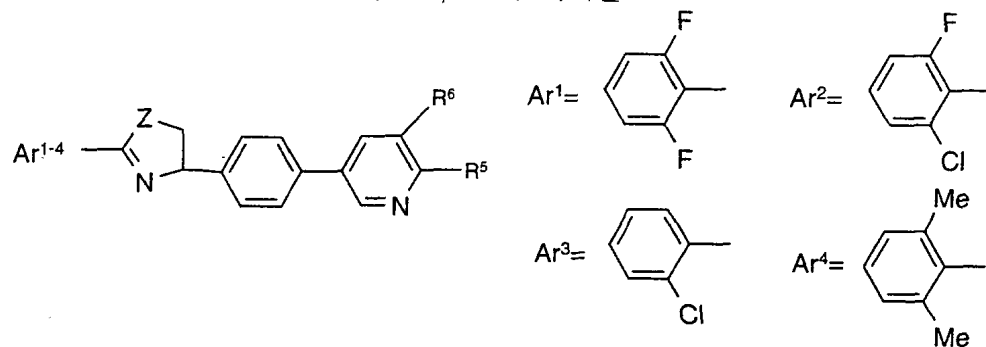
실시예 No. 402를 실시예 No. 25와 유사하게 제조하였다.

$^1\text{H}$  NMR( $\text{CDCl}_3$ ): 4.31, 4.82, 5.48, 옥사졸린; 4.80,  $\text{OCH}_2\text{CF}_3$ ; 6.92, 7.84, 8.35, 피리딘; 7.20, 7.40, 7.50, 8.00, 페닐.

A. 화학적 실시예(표 1 내지 8)

## [표 1a]

화학식 I의 옥사졸린 및 티아졸린, G= 3-피리딜



실시예

No.	Ar	Z	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	물리적 데이터 (m.p., MS)
1	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>3</sub>	H	m.p. 120°C
2	Ar <sup>1</sup>	O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	m.p. 118°C, NMR
3	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	NMR
4	Ar <sup>1</sup>	O	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	NMR
5	Ar <sup>1</sup>	O	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
6	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H	
7	Ar <sup>1</sup>	O	OnC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	
8	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	NMR
9	Ar <sup>1</sup>	O	O 2급 부틸	H	
10	Ar <sup>1</sup>	O	OnC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	
11	Ar <sup>1</sup>	O	OCH(CH <sub>3</sub> )C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
12	Ar <sup>1</sup>	O	OnC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	
13	Ar <sup>1</sup>	O	OnC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	
14	Ar <sup>1</sup>	O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	
15	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	
16	Ar <sup>1</sup>	O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	
17	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
18	Ar <sup>1</sup>	S	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
19	Ar <sup>1</sup>	S	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	MS 450, NMR
20	Ar <sup>1</sup>	S	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
21	Ar <sup>2</sup>	O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
22	Ar <sup>2</sup>	O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	

## [표 1b]

23	Ar <sup>2</sup>	O	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
24	Ar <sup>3</sup>	O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
25	Ar <sup>3</sup>	O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
26	Ar <sup>3</sup>	O	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
27	Ar <sup>4</sup>	O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
28	Ar <sup>4</sup>	O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	

m.p.: 136-137°C  
<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, TMS: δ =  
2.46 (s, 6H, CH<sub>3</sub>); 4.33, 4.88,  
5.57 (각각 dd, 1H, 옥사졸린);  
4.85 8q, 2H, CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>); 6.97  
7.90, 8.39 (각각 dd, 1H, PyH);  
7.59, 7.51 (각각 m, 2H, C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>),  
7.08-7.28 (m, 3H, C<sub>6</sub>H<sub>3</sub>).  
<sup>19</sup>F-NMR (CDCl<sub>3</sub>, CFCl<sub>3</sub>):  
δ = - 74.3

29	Ar <sup>4</sup>	O	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
30	Ar <sup>1</sup>	O	OCH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	
31	Ar <sup>1</sup>	O	CH <sub>3</sub>	H	
32	Ar <sup>1</sup>	O	CF <sub>3</sub>	H	
33	Ar <sup>1</sup>	O	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
34	Ar <sup>1</sup>	O	nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
35	Ar <sup>1</sup>	O	nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	m.p. 117°C
36	Ar <sup>1</sup>	O	nC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	
37	Ar <sup>1</sup>	O	nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	
38	Ar <sup>1</sup>	O	SCF <sub>3</sub>	H	
39	Ar <sup>1</sup>	O	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	m.p. 100°C
40	Ar <sup>1</sup>	O	SO-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
41	Ar <sup>1</sup>	O	SO <sub>2</sub> -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
42	Ar <sup>1</sup>	O	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
43	Ar <sup>1</sup>	O	S-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	m.p. 90°C
44	Ar <sup>1</sup>	O	SO-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
45	Ar <sup>1</sup>	O	SO <sub>2</sub> -nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
46	Ar <sup>1</sup>	O	S-nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	
47	Ar <sup>1</sup>	O	Br	H	MS 414, 416
48	Ar <sup>1</sup>	O	Cl	Cl	
49	Ar <sup>1</sup>	O	NH-COCH <sub>3</sub>	H	

## [附 1c]

50	Ar <sup>1</sup>	O	NH-COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	NMR m.p. 170°C
51	Ar <sup>1</sup>	O	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )COCH <sub>3</sub>	H	
52	Ar <sup>1</sup>	O	1-모르폴린일	H	
53	Ar <sup>1</sup>	O	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	
54	Ar <sup>1</sup>	O	CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
55	Ar <sup>1</sup>	O	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	H	m.p. 120°C
56	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	
57	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>2</sub> CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	
58	Ar <sup>1</sup>	O	OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	
59	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>2</sub> CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )CH <sub>3</sub>	H	
60	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	H	<sup>19</sup> F NMR: -90.1, d; -110.5, ArF
61	Ar <sup>1</sup>	O	OCHF <sub>2</sub>	H	
62	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	
63	Ar <sup>1</sup>	O	OCH(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	H	
64	Ar <sup>1</sup>	O	OC <sub>3</sub> H <sub>6</sub> CF <sub>3</sub>	H	
65	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	
66	Ar <sup>1</sup>	O	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
67	Ar <sup>1</sup>	O	N(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
68	Ar <sup>1</sup>	O	N(CH <sub>3</sub> )nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
69	Ar <sup>1</sup>	O	NHnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
70	Ar <sup>1</sup>	O	NHnC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	
71	Ar <sup>1</sup>	O	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	H	
72	Ar <sup>1</sup>	O	1-피페리딘일	H	
73	Ar <sup>1</sup>	O	SO-CF <sub>3</sub>	H	
74	Ar <sup>1</sup>	O	SCHF <sub>2</sub>	H	
75	Ar <sup>1</sup>	O	SO-CHF <sub>2</sub>	H	
76	Ar <sup>1</sup>	O	SO-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
77	Ar <sup>1</sup>	O	SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
78	Ar <sup>1</sup>	O	SO <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	H	
79	Ar <sup>1</sup>	O	SO <sub>2</sub> -CHF <sub>2</sub>	H	
80	Ar <sup>1</sup>	O	SCH <sub>3</sub>	H	
81	Ar <sup>1</sup>	O	SO-CH <sub>3</sub>	H	
82	Ar <sup>1</sup>	O	SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	H	
83	Ar <sup>1</sup>	O	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> CF <sub>3</sub>	H	
84	Ar <sup>1</sup>	O	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
85	Ar <sup>1</sup>	O	cC <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	
86	Ar <sup>1</sup>	O	CH <sub>2</sub> cC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	

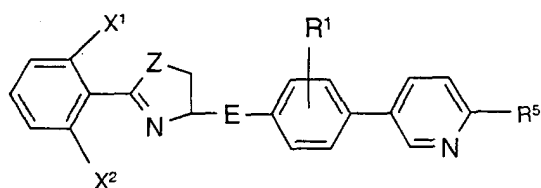
## [H 1d]

87	Ar <sup>1</sup>	O	CN	H
88	Ar <sup>1</sup>	O	OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H
89	Ar <sup>1</sup>	O	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H
90	Ar <sup>1</sup>	O	4(OCF <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H
91	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CN
92	Ar <sup>1</sup>	O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>
93	Ar <sup>1</sup>	O	R <sup>5</sup> +R <sup>6</sup> =-C <sup>3</sup> H <sub>6</sub> O-	
94	Ar <sup>1</sup>	O	R <sup>5</sup> +R <sup>6</sup> =-OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O-	
95	Ar <sup>3</sup>	O	SCF <sub>3</sub>	H
96	Ar <sup>3</sup>	O	OCHF <sub>2</sub>	H
97	Ar <sup>3</sup>	O	OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	H



## [표 2a]

화학식 1의 옥사졸린, G= 3-피리딜



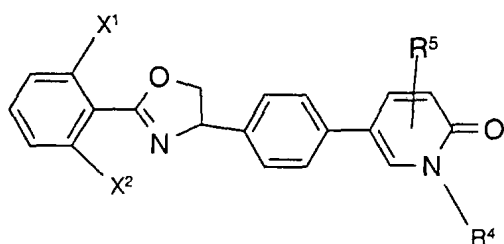
실시예 No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	Z	E	R <sup>1</sup>	R <sup>5</sup>	물리적 데이터
100	F	F	O	CH <sub>2</sub>	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	m.p. 105°C
101	F	F	O	CH <sub>2</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
102	F	F	O	CH <sub>2</sub>	H	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
103	F	F	O	-	2-F	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
104	F	F	O	-	2-Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
105	F	F	O	-	2-OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
106	F	F	O	-	2-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NMR
107	F	F	O	-	3-Cl	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
108	F	F	O	-	2-F	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
109	F	F	O	-	2-Cl	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
110	F	F	O	-	2-OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
111	F	F	O	-	2-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
112	F	F	O	-	2-OCH <sub>3</sub>	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
113	F	F	O	-	2-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
114	F	F	O	-	3-F	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
115	F	Cl	O	-	2-OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
116	Br	H	O	-	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
117	Br	H	O	-	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
118	I	H	O	-	H	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
119	F	H	O	-	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
120	CF <sub>3</sub>	H	O	-	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
121	OCH <sub>3</sub>	H	O	-	H	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
122	CN	H	O	-	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
123	OCHF <sub>2</sub>	H	O	-	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
124	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O	-	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
125	OCH <sub>3</sub>	F	O	-	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
126	F	H	O	-	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
127	OCH <sub>3</sub>	F	O	-	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	

## [표 2b]

128	CF <sub>3</sub>	H	O	-	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
129	CH <sub>3</sub>	H	O	-	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
130	CH <sub>3</sub>	H	O	-	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
131	F	F	O	-	CH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
132	F	F	O	-	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
133	F	F	O	-	OCHF <sub>2</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
134	F	F	O	CH <sub>2</sub> O	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

## [표 3]

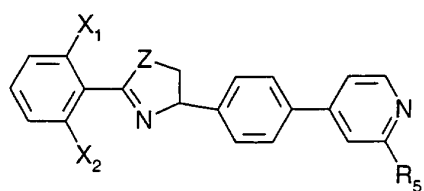
화학식 1의 옥사졸린, G= 2-피리돈-5-일



실시예 No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	물리적 데이터
150	F	F	H	H	m.p. 197°C
151	F	F	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
152	F	F	nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	NMR
153	F	F	CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	H	
154	F	F	CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>3</sub>	H	
155	F	F	CH <sub>2</sub> CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	
156	F	F	CHF <sub>2</sub>	H	
157	F	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
158	F	F	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	
159	F	F	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	
160	F	F	CH <sub>2</sub> -CCH	H	
161	F	F	CH <sub>2</sub> -CC-CH <sub>3</sub>	H	
162	F	F	cC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	
162	F	F	cC <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	
163	F	F	CH <sub>2</sub> cC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	
164	F	F	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
165	F	F	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	
166	F	F	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Cl	
167	F	F	nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	3-Cl	
168	F	F	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-CH <sub>3</sub>	
169	F	F	nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	3-CH <sub>3</sub>	

## [표 4]

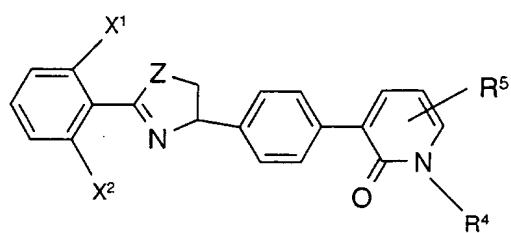
화학식 I의 옥사졸린, G= 4-피리딜



실시예 No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	Z	R <sup>5</sup>	물리적 데이터
170	F	F	O	H	m.p. 137°C
171	F	F	O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
172	F	F	O	Cl	
173	F	Cl	O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
174	F	F	O	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
175	F	F	O	nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
176	F	F	O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
177	F	F	O	CF <sub>3</sub>	
178	F	F	O	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
179	F	F	O	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
180	F	F	O	SO-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
181	F	F	O	SO <sub>2</sub> -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
182	F	F	S	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
183	F	F	S	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
184	F	F	O	OCH <sub>2</sub> -3-피리딜	
185	F	F	O	1- 피롤릴	
186	F	F	O		

## [표 5]

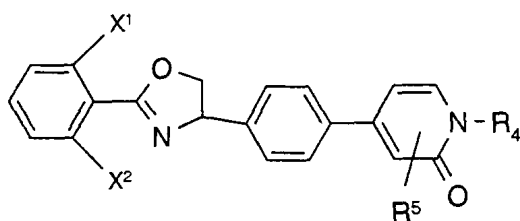
화학식 I의 옥사졸린, G= 2-피리돈-3-일



실시예 No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	Z	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	물리적 데이터
200	F	F	O	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
201	F	F	O	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
202	F	F	O	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
203	F	F	O	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
204	F	F	O	CH <sub>3</sub>	H	
205	F	F	O	CH <sub>3</sub>	6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
206	F	F	O	CH <sub>3</sub>	6-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
207	F	F	O	CH <sub>3</sub>	6-OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
208	F	F	O	CH <sub>3</sub>	5-Cl	
209	F	F	O	CH <sub>3</sub>	5-Br	
210	F	F	O	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
211	F	F	O	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	

## [표 6]

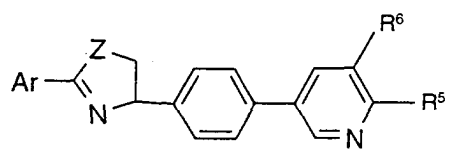
화학식 I의 옥사졸린, G= 2-피리돈-4-일



실시예 No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	물리적 데이터
250	F	F	CH <sub>3</sub>	H	
251	F	F	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
252	F	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
253	F	F	nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
254	F	F	iC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
255	F	F	nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	
256	F	F	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	
257	F	F	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	
258	F	F	CH <sub>2</sub> cC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	
259	F	F	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	H	
260	F	F	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
261	F	F	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	5-Cl	

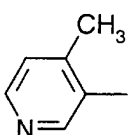
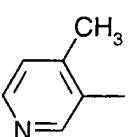
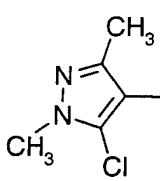
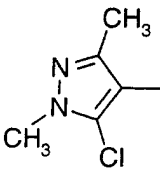
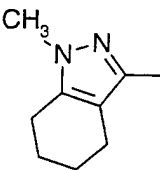
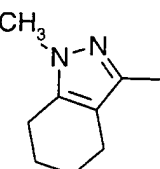
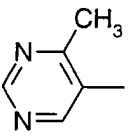
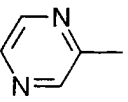
## [표 7a]

화학식 I의 옥사졸린, G= 3-피리딘일, Ar= 헤테로아릴

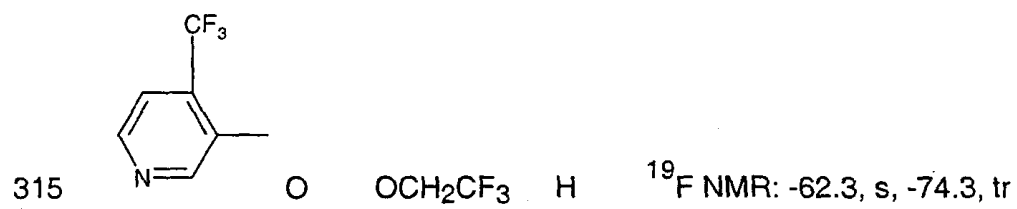
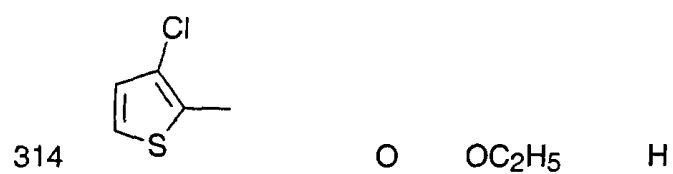


실시예 No.	Ar	Z	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	물리적 데이터
300		O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
301		O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
302		O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
303		O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
304		O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	
305		O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	

## [H 7b]

306		O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
307		O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
308		O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
309		O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
310		O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
311		O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
312		O	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
313		O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H

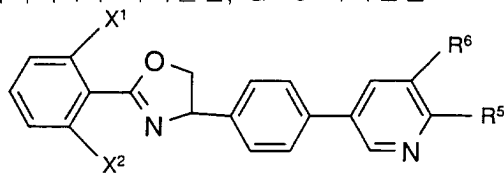
[H 7c]





## [표 8a]

화학식 I의 옥사졸린, G= 3-피리딘일

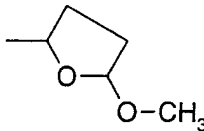
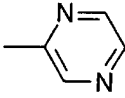
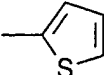
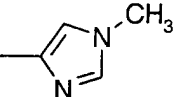
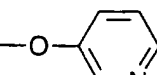
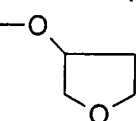
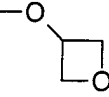
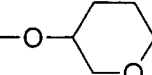
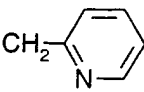
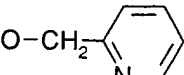
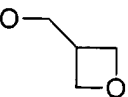
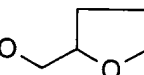
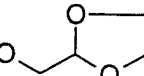
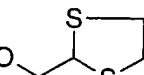


R<sup>5</sup> = 헤테로사이클릴,  
헤테로사이클릴옥시,  
헤테로사이클릴알킬,  
헤테로사이클릴알콕시

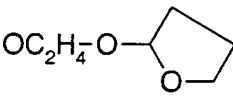
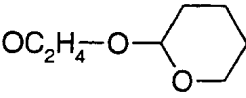
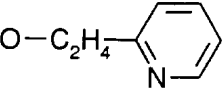
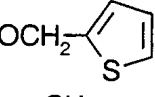
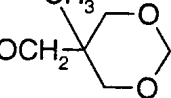
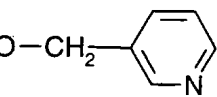
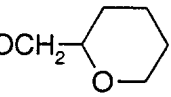
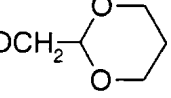
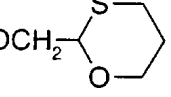
실시예 No.      X<sup>1</sup>      X<sup>2</sup>      R<sup>6</sup>      R<sup>5</sup>      물리적 데이터

350	F	F	H	
351	F	F	H	
352	F	F	H	
353	F	F	H	
354	F	F	H	
355	F	F	H	
356	F	F	H	
357	F	F	H	
358	F	F	H	
359	F	F	H	

[H 8b]

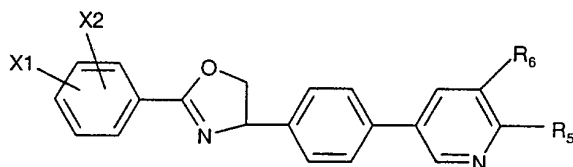
360	F	F	H	
361	F	F	H	
362	F	F	H	
363	F	F	H	
364	F	F	H	
365	F	F	H	
366	F	F	H	
367	F	F	H	
369	F	F	H	
370	F	F	H	
371	F	F	H	
372	F	F	H	
373	F	F	H	
374	F	F	H	

## [H 8c]

375	F	F	H	
376	F	F	H	
377	F	F	H	
378	F	F	H	
379	F	F	H	
380	F	F	H	
381	F	F	H	
382	F	F	H	
383	F	F	H	

## [표 9a]

화합식 I의 옥사졸린, G= 3-피리딘일



실시예 No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>5</sup>	물리적 데이터
400	2-F	4-F	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	<sup>19</sup> F NMR: -75.1, tr, CF <sub>3</sub> , -105.4, m, ArF
401	2-F	5-F	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	<sup>19</sup> F NMR: -74.3, CF <sub>3</sub> ; -115.1, -118.7, ArF
402	2-F	H	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NMR, m.p. 101°C
403	2-CH <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	유상물, <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS): δ = 2.67 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 4.24, 4.78, 5.48 (각각 dd, 1H, 옥사졸린), 4.81 (q, 2H, CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> ), 6.93, 8.35 (각각 d, 1H, PyH), 7.84 (dd, 1H, PyH); 7.52, 7.42 (각각 m, 2H, C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ); 7.91 (d, 1H, MeC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.2 - 7.4 (m, 3H, MeC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ). <sup>19</sup> F-NMR (CDCl <sub>3</sub> , CFCl <sub>3</sub> ): δ = -74.3
404	2-CH <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
405	2-CH <sub>3</sub>	H	H	OnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
406	2-Et	H	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
407	2-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
408	2-F	4-CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
409	2-F	4-Cl	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
410	2-SCH <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
411	2-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	

## [표 9b]

412	2-OCH <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	유상물, <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , TMS): δ = 3.97 (s, 3H, OCH <sub>3</sub> ); 4.30, 4.80, 5.50 (각각 dd, 1H, 옥사졸린); 4.84 (q, CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> ); 6.95, 7.90, 8.37 (각각 dd, 1H, PyH); 7.46, 7.54 (각각 M, 2H, C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ); 7.0 - 7.08 (m, 2H, MeOC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.43 - 7.58 (m, 1H, MeOC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 7.87 (dd, 1H, MeOC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ).
2H,					<sup>19</sup> F-NMR (CDCl <sub>3</sub> , CFCI <sub>3</sub> ): δ = -74.3

## B. 제형예

a) 더스트는 활성 물질 10중량부 및 불활성 물질로서 활석 90중량부를 혼합하고 혼합물을 해머밀로 분쇄함으로써 얻는다.

b) 물에 쉽게 분산가능한 습윤 분말은 활성 물질 25중량부, 불활성 물질로서 카올린 함유 석영 65중량부, 습윤제 및 분산제로서 칼륨 리그노설포네이트 10중량부 및 나트륨 올레오일메틸타우리네이트 1중량부를 혼합하고 혼합물을 핀 부착 디스크밀로 분쇄함으로써 얻는다.

c) 물에 쉽게 분산가능한 분산 농축액은 활성 물질 40중량부를 설포숙신산 모노에스테르 7중량부, 나트륨 리그노설포네이트 2중량부 및 물 51중량부와 혼합하고 혼합물을 볼 밀로 미세도가 5미크론 이하가 되도록 분쇄함으로써 제조한다.

d) 유화성 농축액은 활성 물질 15중량부, 용매로서 사이클로헥산 75중량부 및 유화제로서 옥시에틸화 노닐페놀(10 E0) 10중량부로부터 제조할 수 있다.

e) 과립은 활성 물질 2 내지 15중량부 및 애터펄자이트, 부식 과립 및/또는 규사와 같은 불활성 과립 담체 물질로부터 제조할 수 있다. 30%의 고형분 함량을 갖는 실시예 b)의 습윤 분말의 현탁액을 사용하는 것이 편리한데, 이것을 애터펄자이트 과립의 표면에 분무하고, 이들을 건조하고 긴밀하게 혼합한다. 습윤 분말의 양은 마무리처리된 과립의 약 5중량%이고, 불활성 담체 물질은 마무리처리된 과립의 약 95중량%이다.

## C. 생물학적 예

## 예 1: 거미 진드기 테트라니쿠스 우르티카에 대한 효과

완전한 거미 진드기 군집에 의해 여러번 감염된 콩과 식물(파세올러스 불가리스)에 조제된 시험용 제제의 수용액을 흘려내릴 때까지 분무하였다. 모든 진드기 단계의 치사율을 7일후 측정하였다. 실시예 1, 2, 3, 4, 7, 8, 9, 14, 18, 21, 31, 40, 41, 43, 44, 47, 51, 106, 152 및 153의 제제는 300ppm(활성 물질의 함량 기준)의 농도에서 90 내지 100%의 치사율을 나타내었다.

## 예 2: 진딧물 아피스 파베에 대한 효과

검은콩 진딧물(아피스 파바에)이 조밀하게 살고 있는 발 콩(비시아 파바(Vicia faba))에 조제된 시험용 제제의 수용액을 흘려내릴 때까지 분무하였다. 진딧물의 치사율을 3일후 측정하였다. 실시예 1, 2, 3, 4, 7, 8, 152의 제제는 300ppm(활성 물질의 함량 기준)의 농도에서 90 내지 100%의 치사율을 나타내었다.

## 예 3: 나비 유충 스포돔테라 리토랄리스에 대한 효과

이집트산 목화 잎연충(스포돔테라 리토랄리스)의 L4 유충 10마리를 바닥이 여과지로 덮이고 약 5ml의 영양배지가 담긴 페트리 접시에 도입하다. 이어서 여과지, 영양 종이 및 도입된 유충에 조제된 시험용 제제의 수용액을 분무하였다. 계속해서 페트리 접시를 뚜껑으로 밀봉하였다. 약 30°C에서 4일 보관한 후, 유충에 미치는 제제의 영향을 측정하였다. 실시예 3, 4, 22, 105, 106의 제제는 300ppm(활성 물질의 함량 기준)의 농도에서 90 내지 100%의 치사율을 나타내었다.

## 예 4: 헬리오티스 비레센스(Heliothis virescens)의 알유충 단계에 대한 효과

바닥이 여과지로 덮이고 영양 배지 약 5ml가 담긴 페트리 접시를 준비하였다. 담배 싹연충(헬리오티스 비레센스)의 20시간 된 알 약 30개를 함유하는 여과지 단편을 조제된 시험용 제제의 수용액에 5초 동안

침지하고 계속해서 페트리 접시에 놓았다. 상기 수용액 200 $\mu$ l를 영양 배지상에 더 분포시켰다. 페트리 접시를 밀봉한 후 환경이 제어된 캐비닛안에 약 25℃에서 저장하였다. 6일 저장 후, 알 및 이로부터 부화된 어떤 유충에 대한 제형의 치사율을 측정하였다. 실시예 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 14, 17, 21, 22, 23, 34, 35, 39, 40, 43, 44, 106의 제제는 300ppm(활성 물질의 함량 기준)의 농도에서 90 내지 100%의 치사율을 초래하였다.

예 5: 옥수수 싹연충 디아브로티카 운데십퍽타타(*Diabrotica undecimpunctata*)에 대한 효과

옥수수 씨를 물속에 담그고 6시간 동안 예비발아킨 다음 10ml 유리관에 넣고 각 경우에 2ml의 흙으로 덮었다. 물 1ml를 가한 후, 식물을 식물 길이가 약 3cm가 될 때까지 21℃에서 유리관내에 두었다. 이어서 옥수수 싹연충(디아브로티카 운데십퍽타타)의 L2 유충 10마리를 흙위의 각 관에 도입하였다. 2시간 후, 조제된 시험용 제제의 수용액 1ml를 관내의 흙 표면위로 피펫으로 옮겼다. 21℃에서 실험실 조건하에 5일 동안 저장한 후, 흙 및 뿌리 부분을 살아있는 디아브로티카 유충에 대해 시험하고 치사율을 측정하였다. 실시예 2, 3, 5, 9, 19, 39의 제제는 300ppm(활성 물질의 함량 기준)의 농도에서 사용한 시험 동물의 100% 치사율을 나타내었다.

예 6: 쿠퍼보틀 루실리아 쿠프리나(*Lucilia cuprina*)의 유충에 대한 효과

시료 용기에 쿠퍼보틀 루실리아 쿠프리나의 최근에 부화된 유충 20마리를, 시험 물질을 100ppm의 농도로 함유한 분쇄된 양고기의 유충 영양 배지위에 놓았다. 영양 배지상에서의 유충 성장을 유충이 될 때까지 72시간에 걸쳐 모니터링하였다. 실시예 2, 3, 4, 5, 105, 106의 제제는 100ppm(활성 물질의 함량 기준)의 농도에서 사용한 총해 유충에 있어서 100%의 치사율을 나타내었다.

예 7: 고양이 벼룩 크테노세팔리데스 펠리스(*Ctenocephalides felis*)의 발달 단계에 대한 효과

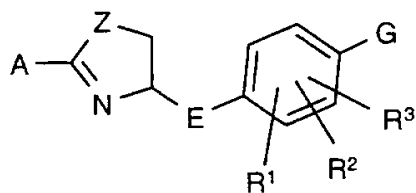
동일한 부분의 혈액 분말 및 규사로 구성된, 고양이 벼룩의 유충 영양 배지를 1000ppm의 농도로 시험 물질과 혼합하였다. 번식된 콜로니로부터 새로 얻어진 약 30개의 벼룩 알을 상기 배지로 옮겼다. 제제의 영향을 평가하기 위해 벼룩 유충의 부화 및 그것의 번데기 및 성충으로의 발달을 관찰하였다. 실시예 2, 3 및 4의 시험 물질은 100%의 치사율을 초래하였다.

## (57) 청구의 범위

### 청구항 1

하기 화학식 I의 1,3-옥사졸린 유도체 및 1,3-티아졸린 유도체.

화학식 I



상기 식에서,

A는 페닐, 피리딜, 피리미딘일, 피라진일, 피라졸릴 또는 티에닐이되, 이들 기의 각각은 1개 이상의 라디칼 X로 선택적으로 치환되고;

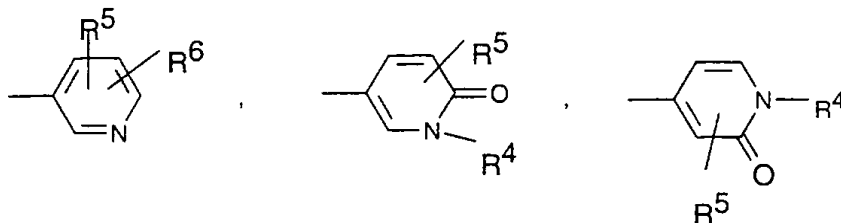
X는 동일 또는 상이한

a) 할로겐, 시아노, 니트로;

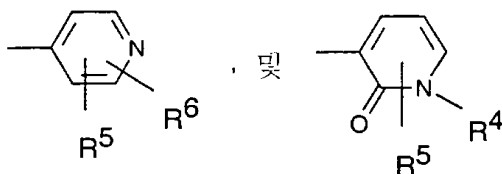
b) (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)알케닐, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)알키닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬술피닐, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알케닐, 페닐이되,

b기의 라디칼은 할로겐, 시아노, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시 및 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알콕시로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상의 라디칼로 선택적으로 치환되고;

E는 단일결합, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬렌, -O-CH<sub>2</sub>- 또는 -CH<sub>2</sub>-O-이고;



G는



로 이루어지는 군으로부터 선택된 라디칼이고;

Z는 산소 또는 황이고;

$R^1$ ,  $R^2$  및  $R^3$ 은 동일 또는 상이한 수소, 할로겐,  $(C_1-C_4)$ 할로알킬,  $(C_1-C_4)$ 알킬,  $(C_1-C_4)$ 알콕시,  $(C_1-C_4)$ 할로알콕시 또는 시아노이고;

$R^4$ 는 수소이거나 또는  $(C_1-C_8)$ 알킬,  $(C_2-C_8)$ 알케닐,  $(C_2-C_8)$ 알키닐,  $(C_3-C_8)$ 사이클로알킬,  $(C_3-C_8)$ 사이클로알케닐,  $(C_4-C_{10})$ 사이클로알킬알킬 또는  $(C_7-C_{12})$ 페닐알킬이되, 이들 기의 각각은 할로겐,  $(C_1-C_4)$ 알킬,  $(C_1-C_3)$ 할로알킬,  $(C_1-C_4)$ 알콕시,  $(C_1-C_3)$ 할로알콕시,  $(C_1-C_3)$ 알킬티오,  $(C_3-C_8)$ 사이클로알킬,  $(C_7-C_{12})$ 페닐알콕시,  $(C_2-C_4)$ 알킬카보닐, 알콕시카보닐,  $(C_2-C_6)$ 모노알킬- 및  $(C_3-C_9)$ 디알킬아미노카보닐, 시아노 및 트리  $(C_1-C_4)$ 알킬실릴로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상의 치환기로 선택적으로 치환되고;

$R^5$  및  $R^6$ 은 동일 또는 상이한

a) 수소, 할로겐, 시아노, 포르밀,  $(C_2-C_5)$ 알킬카보닐,  $(C_2-C_8)$ 알콕시카보닐,  $(C_3-C_9)$ 모노알킬- 및 디알킬아미노카보닐,

b)  $(C_1-C_8)$ 알킬,  $(C_3-C_8)$ 사이클로알킬,  $(C_4-C_8)$ 사이클로알케닐,  $(C_1-C_8)$ 알콕시알킬,  $(C_1-C_8)$ 알킬티오,  $(C_1-C_8)$ 알킬술피닐,  $(C_1-C_8)$ 알킬설포닐,  $NR^7R^8$ , 페닐, 페녹시,  $(C_7-C_{12})$ 페닐알킬,  $(C_7-C_{12})$ 페닐알콕시, 헤테로사이클릴, 헤테로사이클릴옥시 유도체, 헤테로사이클릴  $(C_1-C_4)$ 알콕시,  $(C_3-C_{12})$ 헤테로사이클릴알킬이되, b)의 각각은 할로겐,  $(C_1-C_4)$ 알킬,  $(C_1-C_3)$ 할로알킬,  $(C_1-C_3)$ 알콕시,  $(C_1-C_3)$ 할로알콕시,  $(C_1-C_3)$ 알킬티오,  $NR^7R^8$ , 알킬카보닐  $(C_2-C_5)$ , 알콕시카보닐  $(C_2-C_8)$ , 모노알킬- 및 디알킬아미노카보닐  $(C_3-C_9)$ , 시아노 및 트리  $(C_1-C_4)$ 알킬실릴로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상의 라디칼로 선택적으로 치환되고;

c)  $(C_1-C_8)$ 알콕시이되, 이 c)의 각각은 할로겐,  $(C_1-C_3)$ 알킬티오,  $NR^7R^8$ , 알킬카보닐  $(C_2-C_5)$ , 알콕시카보닐  $(C_2-C_8)$ , 모노알킬- 및 디알킬아미노카보닐  $(C_3-C_9)$ , 시아노 및 트리  $(C_1-C_4)$ 알킬실릴로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상의 라디칼로 선택적으로 치환되고;

d)  $R^5$  및  $R^6$ 은 b)에서 언급된 기중 2개를 연결시킴으로써 생기는 환을 함께 형성하되, 바람직하게는  $(C_3-C_5)$ 알킬렌,  $(C_2-C_4)$ 알킬렌옥시,  $(C_1-C_3)$ 알킬렌디옥시,  $(C_2-C_4)$ 알킬렌아미노 또는 알킬렌티오  $(C_2-C_4)$ 이고;

$R^7$  및  $R^8$ 은 동일 또는 상이한

a) 수소;

b) 할로겐,  $(C_1-C_4)$ 알킬,  $(C_1-C_3)$ 할로알킬,  $(C_1-C_4)$ 알콕시,  $(C_1-C_3)$ 할로알콕시,  $(C_1-C_3)$ 알킬티오,  $(C_1-C_3)$ 알킬아미노,  $(C_1-C_3)$ 디알킬아미노,  $(C_3-C_8)$ 사이클로알킬, 시아노 및 트리  $(C_1-C_4)$ 알킬실릴로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상의 라디칼로 선택적으로 치환된  $(C_1-C_8)$ 알킬,  $(C_3-C_8)$ 사이클로알킬,  $(C_7-C_{12})$ 페닐알킬,  $(C_1-C_6)$ 알킬카보닐,  $(C_1-C_6)$ 알킬설포닐이거나; 또는

c)  $R^7$  및  $R^8$ 은 함께 알킬렌  $(C_3-C_7)$ ,  $(C_3-C_7)$ 옥사-, 아자- 또는 티아알킬렌,  $(C_3-C_7)$ 알킬렌카보닐 또는  $(C_3-C_7)$ 알킬렌설포닐이다.

## 청구항 2

제 1 항에 있어서,

A가 페닐 또는 피리딜이고;

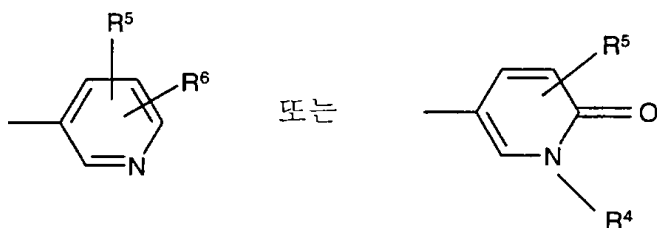
X가

a) 할로겐, 시아노, 니트로 또는

b) (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알케닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알키닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬술피닐, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)사이클로알킬, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알케닐이되,

b기의 라디칼은 할로겐, 시아노, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시 및 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알콕시로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상의 라디칼로 선택적으로 치환되고;

E가 단일결합 또는 -CH<sub>2</sub>-이고;



G가

이고;

Z가 산소이고;

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>이 H, 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알콕시 또는 시아노이고;

R<sup>4</sup>가 H이거나 또는 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알킬티오, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, 시아노 또는 트리(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬실릴로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬이고;

R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>이

a) H, 할로겐, 시아노;

b) (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알케닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬술피닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬설폰닐, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)페닐알킬, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)페닐알콕시, (C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>)옥사사이클로알킬 또는 (C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>)옥사사이클로알케닐이되,

b기는 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알킬티오 및 시아노로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상의 라디칼로 선택적으로 치환되고; 또는

c) 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알킬티오 및 시아노로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상의 라디칼로 선택적으로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알콕시인 화학식 I의 화합물.

### 청구항 3

제 1 항 또는 제 2 항에 있어서,

A가 페닐이고;

X가 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알콕시이고;

E가 단일결합이고;

G가 3-피리딜이고;

Z가 산소이고;

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>이 H, 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)할로알콕시이고;

R<sup>4</sup>가 H이거나 또는 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)알킬티오, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, 시아노 또는 트리(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬실릴로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상의 라디칼로 선택적으로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬이고;

R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>이

a) H, 할로겐, 시아노;

b) (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알콕시, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알킬, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)사이클로알케닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬티오, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬술피닐, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)알킬설폰닐, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)페닐알킬 또는 (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)페닐알콕시이되,

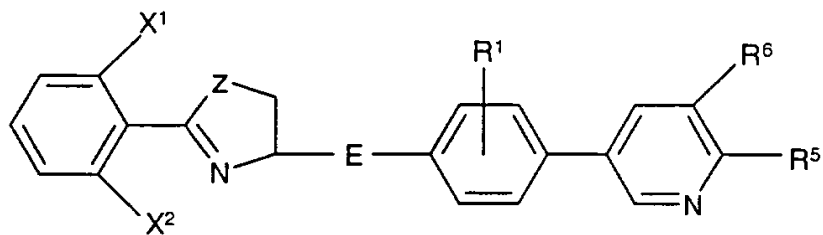
b기는 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)할로알킬 및 시아노로 이루어지는 군으로부터 선택된 1개 이상의 라디칼로 선택적으로 치환된 화학식 I의 화합물.



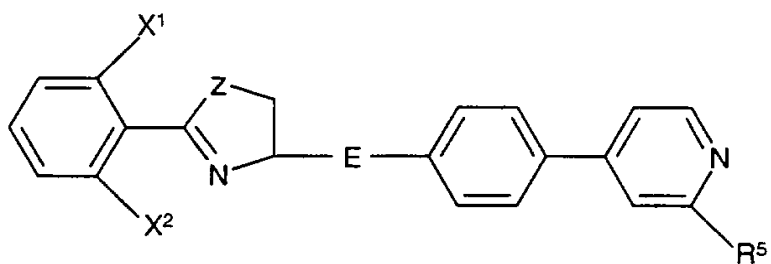
**청구항 4**

제 1 항 내지 제 3 항 중 어느 한 항에 있어서, 하기 화학식 Ia 내지 Ie로 이루어지는 군으로부터 선택된 화학식 I의 화합물:

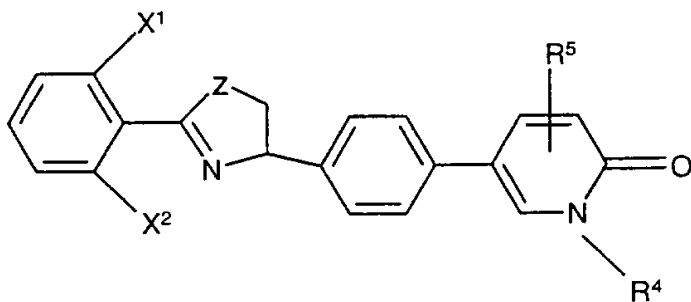
화학식 Ia



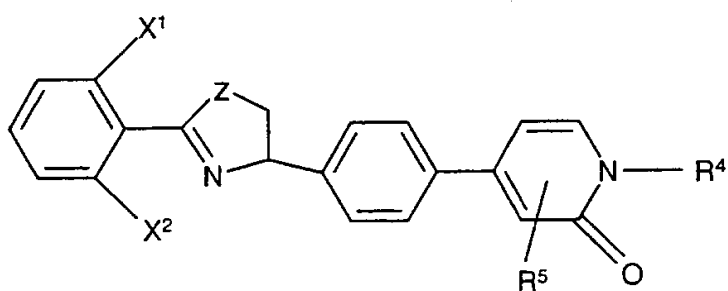
화학식 Ib



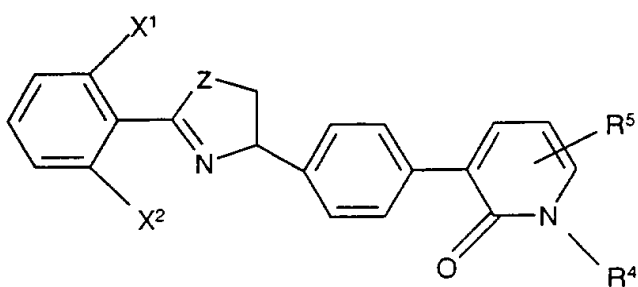
화학식 Ic



화학식 Id



화학식 Ie

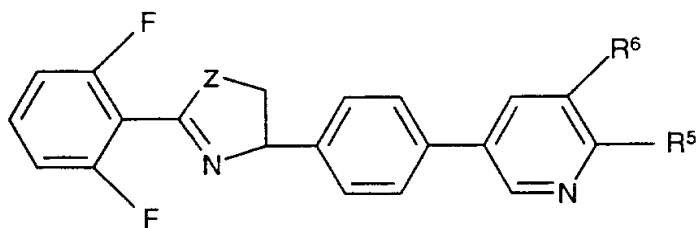


상기 식에서, 기호는 제 1 항 내지 제 3 항 중 어느 한 항에서 화학식 I에 주어진 의미를 갖는다.

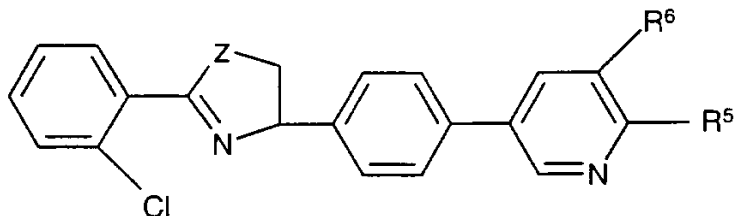
**청구항 5**

제 4 항에 있어서, 하기 화학식 Ia1 내지 Ia4로 이루어지는 군으로부터 선택된 화학식 I의 화합물:

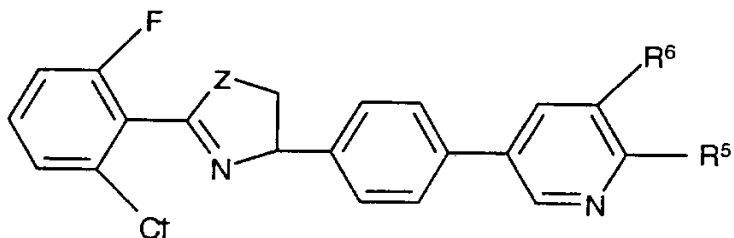
화학식 Ia1



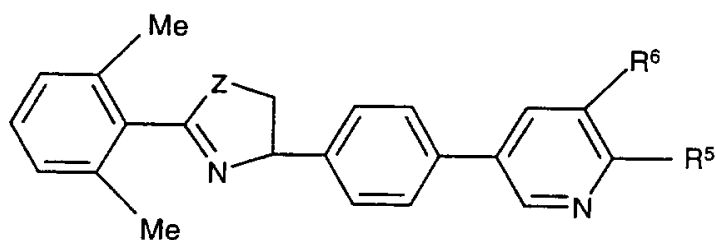
화학식 Ia2



화학식 Ia3



화학식 Ia4



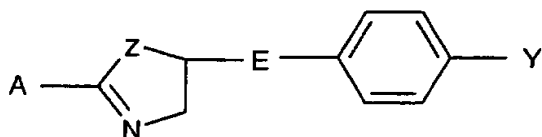
상기 식에서, 기호는 제 1 항 내지 제 3 항 중 어느 한 항에서 화학식 I에 주어진 의미를 갖는다.

#### 청구항 6

제 1 항 내지 제 5 항 중 어느 한 항에 청구된 화학식 I의 화합물의 제조방법으로서,

할로겐 및 하기 화학식 II의 퍼플루오로알킬설포네이트 화합물과 하기 화학식 III의 유기금속 화합물을 팔라듐 촉매작용에 의해 반응시키는 것을 포함하는 방법.

화학식 II



상기 식에서,

Y는 Cl, Br, I 또는 퍼플루오로알킬설포네이트이고,

A, Z 및 E는 화학식 I에 주어진 의미를 갖는다.

화학식 III

G-M

상기 식에서,

M은 B, Sn 또는 Zn 함유 이탈기이고,

G는 제 1 항에서 화학식 I에 주어진 의미를 갖는다.

#### 청구항 7

제 1 항 내지 제 5 항 중 어느 한 항에 청구된 하나 이상의 화합물을 하나 이상의 조제 보조제와 함께 포함하는 농작물 보호 조성물.

#### 청구항 8

제 7 항에 있어서,

제 1 항 내지 제 7 항 중 어느 한 항에 청구된 하나 이상의 화합물의 살진균적 유효량을 살진균 용도에 통상적으로 사용되는 첨가제 또는 보조제와 함께 포함하는 살진균 조성물.

#### 청구항 9

제 7 항에 있어서,

제 1 항 내지 제 5 항 중 어느 한 항에 청구된 하나 이상의 화합물의 유효량을 살충, 진드기 구충 또는 살선충 용도에 통상적으로 사용되는 첨가제 또는 보조제와 함께 포함하는 살충, 진드기 구충 또는 살선충 조성물.

#### 청구항 10

제 1 항 내지 제 5 항 중 어느 한 항에 청구된 하나 이상의 화합물의 살진균, 살충, 진드기 구충 또는 살선충적 유효량 및 하나 이상의 추가의 활성 물질을 살진균, 살충, 진드기 구충 또는 살선충 용도에 통상적으로 사용되는 보조제 및 첨가제와 함께 포함하는 농작물 보호 조성물.

#### 청구항 11

제 1 항 내지 제 5 항 중 어느 한 항에 청구된 하나 이상의 화합물의 유효량을 목재 보호 용도, 또는 밀봉제, 도료, 금속세공용 냉각 윤활제 또는 천공 및 절삭유의 보존제 용도에 통상적으로 사용되는 보조제 및 첨가제와 함께 포함하는, 목재 보호에 사용하거나 또는 밀봉제, 도료, 금속세공용 냉각 윤활제 또는 천공 및 절삭유의 보존제로서 사용하기 위한 조성물.

#### 청구항 12

수의학적 약제로서 사용하기 위한 제 1 항 내지 제 5 항 중 어느 한 항에 청구된 화합물 또는 제 7 항, 제 9 항 및 제 10 항 중 어느 한 항에 청구된 조성물.

#### 청구항 13

제 7 항 내지 제 11 항 중 어느 한 항에 청구된 조성물의 제조방법으로서, 활성 물질 및 다른 첨가제를 조합하고 혼합물을 적합한 사용 형태로 만드는 것을 포함하는 방법.

#### 청구항 14

살진균제로서의 제 1 항 내지 제 5 항 중 어느 한 항에 청구된 화합물 또는 제 7 항, 제 8 항, 제 10 항 및 제 11 항 중 어느 한 항에 청구된 조성물의 용도.

#### 청구항 15

목재 보존제, 또는 밀봉제, 도료, 금속세공용 냉각 윤활제 또는 천공 및 절삭유의 보존제로서의 제 1 항 내지 제 5 항 중 어느 한 항에 청구된 화합물 또는 제 7 항, 제 8 항 및 제 11 항 중 어느 한 항에 청구된 조성물의 용도.

#### 청구항 16

해충, 진드기, 연체동물 및 선충을 방제하기 위한 제 1 항 내지 제 5 항 중 어느 한 항에 청구된 화합물 또는 제 7 항, 제 8 항, 제 10 항 및 제 11 항 중 어느 한 항에 청구된 조성물의 용도.

#### 청구항 17

식물 병원성 진균을 방제하는 방법으로서, 제 1 항 내지 제 5 항 중 어느 한 항에 청구된 화합물 또는 제 7 항, 제 8 항, 제 10 항 및 제 11 항 중 어느 한 항에 청구된 조성물의 살진균적 유효량을 이들 진균 또는 이들 진균으로 감염된 식물, 구역 또는 배양기, 또는 종자에 살포하는 것을 포함하는 방법.

#### 청구항 18

해충, 진드기, 연체동물 및 선충을 방제하는 방법으로서, 제 1 항 내지 제 5 항 중 어느 한 항에 청구된 화합물 또는 제 7 항, 제 9 항 및 제 10 항 중 어느 한 항에 청구된 조성물의 유효량을 해충, 진드기, 연체동물 및 선충 또는 이들로 감염된 식물, 구역 또는 배양기에 살포하는 것을 포함하는 방법.

#### 청구항 19

제 1 항 내지 제 5 항 중 어느 한 항에 청구된 화합물 또는 제 7 항, 제 9 항 또는 제 10 항에 청구된 조성물의 유효량으로 처리 또는 코팅된 종자.