



(19) 대한민국특허청(KR)

(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2019년07월15일

(11) 등록번호 10-2000320

(24) 등록일자 2019년07월09일

- (51) 국제특허분류(Int. Cl.)
C07C 317/42 (2006.01) *A01N 37/52* (2006.01)
C07C 323/36 (2006.01) *C07C 323/44* (2006.01)
C07C 323/63 (2006.01)
- (21) 출원번호 10-2014-7019893
- (22) 출원일자(국제) 2012년12월12일
 심사청구일자 2017년12월11일
- (85) 번역문제출일자 2014년07월16일
- (65) 공개번호 10-2014-0109977
- (43) 공개일자 2014년09월16일
- (86) 국제출원번호 PCT/EP2012/075269
- (87) 국제공개번호 WO 2013/092350
 국제공개일자 2013년06월27일
- (30) 우선권주장
 11194855.0 2011년12월21일
 유럽특허청(EPO)(EP)
- (56) 선행기술조사문헌
 JP2011042611 A*
 WO2007131680 A1*
 *는 심사관에 의하여 인용된 문헌
- (73) 특허권자
 바이엘 크롭사이언스 악티엔게젤샤프트
 독일 40789 몬하임 암 라인 알프레드-노벨-스트라
 세 50
 바이엘 인텔렉처 프로퍼티 게엠베하
 독일, 40789 몬하임 엠 라인, 알프레드-노엘-스트
 라쎄 10
- (72) 발명자
 쾰러, 아들린느
 독일 40764 랑겐펠트 하임켄베크 9
 알릭, 베르트
 독일 53639 쾨닉스빈터 임 로트지펜 7
 (뒷면에 계속)
- (74) 대리인
 양영준, 위혜숙

전체 청구항 수 : 총 35 항

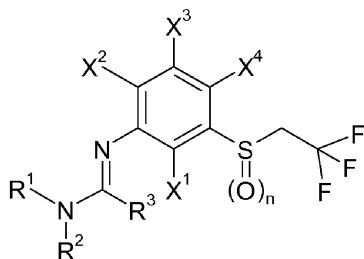
심사관 : 김예훈

(54) 발명의 명칭 살충에제 및 살곤충제로서의 N-아릴아미딘-치환된 트리플루오로에틸 술폰드 유도체

(57) 요약

본 발명은 하기 화학식 I의 신규 N-아릴아미딘-치환된 트리플루오로에틸 술폰드 유도체, 동물 해충을 방제하기 위한 살충에제 및 살곤충제로서의 그의 용도, 및 그의 제조를 위한 방법 및 중간체에 관한 것이다.

<화학식 I>



상기 식에서, X^1 , X^2 , X^3 , X^4 , R^1 , R^2 , R^3 , n 은 각각 상세한 설명에 명시된 바와 같이 정의된다.

(72) 발명자

벡커, 앙겔라

독일 40235 뒤셀도르프 호프펠트슈트라쎄 86

보에르슈테, 아른트

독일 50674 쾰른 모짜르트슈트라쎄 3-5

피르겐스, 올리히

독일 40882 라팅엔 페스터 슈트라쎄 37

피셔, 라이너

독일 40789 몬하임 넬리-작스-슈트라쎄 23

모라디, 바헤드, 아메트

독일 40789 몬하임 마리아-메리안-슈트라쎄 7

쎄레조-갈베즈, 실비아

독일 40764 랑겐펠트 페슈탈로치슈트라쎄 39아

한, 율리아 요안나

독일 40591 뒤셀도르프 켈르너 란트슈트라쎄 146

일크, 케르슈틴

독일 50670 쾰른 노이서 발 32

슈바르츠, 한스-게오르크

독일 46282 도르스텐 아우프 템 베렌캄프 82베

고미부치, 타쿠야

일본 이바라키 305-0032 이바라키켄 츠쿠바시 타케조노 1-8-2 1512

이토, 마사히토

일본 이바라키 300-1232 이바라키켄 우시쿠시 카미카시와다 4-3-27

야마자키, 다이에이

일본 야마구치 717-0001 야마구치켄 호후시 이와바타케 3-8-23

시부야, 카츠히코

일본 도치기 329-0433 도치기켄 시모즈케시 미도리 6-14-4

시모조, 에이이치

일본 오사카 586-0018 카와치나가노시 치요다미나미초 8-8 201-고우 푸레미아무코호토치요다

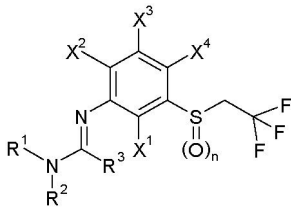
명세서

청구범위

청구항 1

하기 화학식 I의 N-아릴아미딘-치환된 트리플루오로에틸 술폰드 유도체, 또는 화학식 I의 화합물의 부분입체 이성질체, 거울상이성질체, 회전이성질체, 호변이성질체 또는 염.

<화학식 I>



상기 식에서,

n이 0, 1 또는 2의 수를 나타내고,

X^1 , X^2 , X^3 , X^4 가 서로 독립적으로 수소, 할로젠, 히드록시, 아미노, OCN, SCN, SF_5 , 트리-(C_1-C_6)-알킬실릴, (C_1-C_6)-알킬, (C_1-C_6)-할로알킬, (C_1-C_6)-시아노알킬, (C_1-C_6)-히드록시알킬, 히드록시카르보닐-(C_1-C_4)-알콕시, (C_1-C_6)-알콕시카르보닐-(C_1-C_4)-알킬, (C_1-C_6)-알콕시-(C_1-C_6)-알킬, (C_2-C_6)-알케닐, (C_2-C_6)-할로알케닐, (C_2-C_6)-시아노알케닐, (C_2-C_6)-알키닐, (C_2-C_6)-할로알키닐, (C_2-C_6)-시아노알키닐, (C_1-C_6)-알콕시, (C_1-C_6)-할로알콕시, (C_1-C_6)-시아노알콕시, (C_1-C_7)-알콕시카르보닐-(C_1-C_6)-알콕시, (C_1-C_6)-알콕시-(C_1-C_6)-알콕시, (C_1-C_7)-알킬히드록시이미노, (C_1-C_7)-알콕시이미노, (C_1-C_6)-알킬-(C_1-C_7)-알콕시이미노, (C_1-C_6)-할로알킬-(C_1-C_7)-알콕시이미노, (C_1-C_6)-알킬티오, (C_1-C_6)-할로알킬티오, (C_1-C_6)-알콕시-(C_1-C_6)-알킬티오, (C_1-C_6)-알킬티오-(C_1-C_6)-알킬, (C_1-C_6)-알킬술폰, (C_1-C_6)-할로알킬술폰, (C_1-C_6)-알콕시-(C_1-C_6)-알킬술폰, (C_1-C_6)-알킬술폰-(C_1-C_6)-알킬, (C_1-C_6)-알킬술폰옥시, (C_1-C_7)-알킬카르보닐, (C_1-C_7)-할로알킬카르보닐, 카르복실, (C_1-C_7)-알킬카르보닐옥시, (C_1-C_7)-알콕시카르보닐, (C_1-C_7)-할로알콕시카르보닐, (C_1-C_7)-알콕시카르보닐-(C_1-C_6)-알킬, 아미노카르보닐, (C_1-C_7)-알킬아미노카르보닐, 디-(C_1-C_7)-알킬아미노카르보닐, (C_1-C_7)-알케닐아미노카르보닐, 디-(C_1-C_7)-알케닐아미노카르보닐, (C_3-C_8)-시클로알킬아미노카르보닐, (C_1-C_6)-알킬술폰아미노, 아미노술폰, (C_1-C_6)-알킬아미노술폰, 디-(C_1-C_6)-알킬아미노술폰, (C_1-C_6)-알킬술폰이미노, 아미노티오카르보닐, (C_1-C_6)-알킬아미노티오카르보닐, 디-(C_1-C_6)-알킬아미노티오카르보닐을 나타내거나,

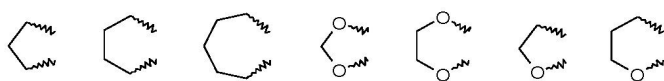
또는, 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, (C_1-C_6)-알킬, (C_1-C_6)-할로알킬, (C_2-C_8)-알케닐, (C_2-C_8)-할로알케닐, (C_2-C_6)-알키닐, (C_1-C_6)-알콕시, (C_1-C_6)-할로알콕시, (C_1-C_6)-알킬티오, (C_1-C_6)-알킬술폰, (C_1-C_6)-알킬술폰옥시, (C_1-C_6)-할로알킬티오, (C_1-C_6)-할로알킬술폰, (C_1-C_6)-알킬아미노, 디-(C_1-C_6)-알킬아미노, (C_1-C_7)-알킬카르보닐아미노, (C_1-C_7)-알콕시카르보닐, (C_1-C_7)-알킬카르보닐, (C_1-C_7)-알킬카르보닐옥시, 아미노카르보닐, (C_1-C_6)-알킬아미노카르보닐, 디-(C_1-C_6)-알킬아미노카르보닐, 아미노티오카르보닐, (C_1-C_6)-알킬아미노티오카르보닐, 디-(C_1-C_6)-알킬아미노티오카르보닐, (C_3-C_8)-시클로알킬아미노, (C_1-C_6)-알킬술폰아미노, 아미노술폰, (C_1-C_6)-알킬아미노술폰 및 디-(C_1-C_6)-알킬아미노술폰으로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 치환되며 0, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 헤테로원자가 임의로 개재된 임의로 포화 또는 불포화된 (C_3-C_8)-시클로알킬, (C_3-C_8)-시클로알콕시, (C_3-C_8)-시클로알킬-(C_1-C_6)-알킬 또는 (C_3 -

C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알콕시에 의해 치환된, 페닐-(C₁-C₆)-알킬, 페녹시, 페닐-(C₁-C₄)-알킬옥시, 페녹시-(C₁-C₄)-알킬, 페닐티오, 페닐티오-(C₁-C₄)-알킬, 페닐술피닐, 페닐술포닐, 헤타릴-(C₁-C₆)-알킬, 헤타릴옥시, 헤타릴-(C₁-C₄)-알킬옥시, 헤타릴티오, 헤타릴술피닐, 헤타릴술포닐, 임의로 포화 또는 불포화된 (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₈)-알킬, (C₃-C₈)-시클로알킬옥시, (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알콕시, (C₃-C₈)-시클로알킬티오, (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알킬티오, (C₃-C₈)-시클로알킬술피닐, (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알킬술피닐, (C₃-C₈)-시클로알킬술포닐, (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알킬술포닐을 나타내거나,

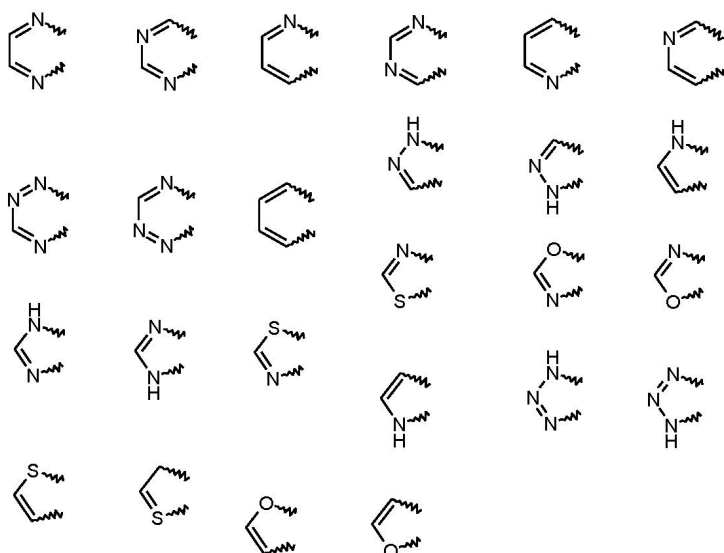
또는 NR⁴R⁵ (여기서, R⁴ 및 R⁵는 서로 독립적으로 수소, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₁-C₆)-시아노알킬, (C₁-C₆)-히드록시알킬, (C₁-C₆)-알콕시-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알킬-(C₁-C₆)-티오알킬, (C₂-C₈)-알케닐, (C₂-C₈)-할로알케닐, (C₂-C₈)-시아노알케닐, (C₂-C₈)-알키닐, (C₂-C₈)-할로알키닐, (C₂-C₈)-시아노알키닐, 아실, (C₁-C₇)-알콕시카르보닐을 나타내거나, 또는 R⁴ 및 R⁵는, 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 할로젠, 시아노, 히드록시, 아미노, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-할로알콕시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 할로젠, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-할로알킬로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 치환되며 O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 (C₃-C₈)-시클로알킬 또는 (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알킬에 의해 임의로 치환되고, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 포화 또는 불포화된 5- 내지 7-원 고리를 형성할 수 있음)를 나타내거나,

또는, 할로젠, 시아노, 니트로, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-할로알콕시, (C₁-C₆)-알킬티오, (C₁-C₆)-알킬술피닐, (C₁-C₆)-알킬술포닐, (C₁-C₆)-알킬술포닐옥시, (C₁-C₆)-할로알킬티오, (C₁-C₆)-할로알킬술피닐, (C₁-C₆)-할로알킬술포닐로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 할로젠, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-할로알킬에 의해 임의로 치환되며 O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 (C₃-C₈)-시클로알킬, (C₃-C₈)-시클로알콕시, (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알킬 또는 (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알콕시에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된, (C₃-C₈)-시클로알킬, (C₃-C₈)-시클로알콕시, (C₃-C₈)-시클로알킬티오, (C₃-C₈)-시클로알케닐, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아지닐, 티아졸릴, 티아디아졸릴, 옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 피라졸릴 또는 트리아졸릴을 나타내거나,

또는 X² 및 X³ 또는 X³ 및 X⁴가 할로젠, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₈)-시클로알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₃-C₈)-할로시클로알킬, (C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-할로알콕시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 치환된 하기 5- 또는 6-원 고리를 형성할 수 있거나,



또는 X² 및 X³ 또는 X³ 및 X⁴가 수소, 할로젠, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₈)-시클로알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₃-C₈)-할로시클로알킬, (C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-할로알콕시, (C₁-C₆)-알콕시-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알킬티오, (C₁-C₆)-알킬술포닐, 아미노, (C₁-C₆)-알킬아미노, 디-(C₁-C₆)-알킬아미노 및 (C₃-C₈)-시클로알킬아미노로 이루어진 군으로부터 서로 독립적으로 선택될 수 있는 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된 하기 융합된 고리를 형성할 수 있고,



R^3 이 (C_1-C_6) -알콕시- (C_1-C_6) -알킬 또는 (C_1-C_6) -시아노알킬을 나타내거나,

또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있으며 할로젠, 시아노, 니트로, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -할로알킬 및 (C_1-C_6) -알콕시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된 3- 내지 6-원 포화 또는 부분 포화 고리를 나타내거나,

또는, 할로젠, 시아노, 니트로, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -할로알킬 및 (C_1-C_6) -알콕시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된 1 내지 3개의 N을 함유하는 폐닐을 나타내고,

R^1 및 R^2 가 서로 독립적으로 수소, 시아노, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -할로알킬, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -시아노알킬, (C_1-C_6) -히드록시알킬, (C_1-C_6) -알콕시- (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -알킬티오- (C_1-C_6) -알킬, (C_2-C_6) -알케닐, (C_2-C_6) -할로알케닐, (C_2-C_6) -시아노알케닐, (C_2-C_6) -알키닐, (C_2-C_6) -할로알키닐, (C_2-C_6) -시아노알키닐을 나타내거나,

할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -할로알킬, (C_2-C_8) -알케닐, (C_2-C_8) -할로알케닐, (C_2-C_8) -알키닐, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -할로알콕시, (C_1-C_6) -알킬티오, (C_1-C_6) -알킬술피닐, (C_1-C_6) -알킬술포닐, (C_1-C_6) -알킬아미노, 디- (C_1-C_6) -알킬아미노로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 치환된, (C_1-C_6) -알킬카르보닐, (C_1-C_7) -알콕시카르보닐, 아릴카르보닐, 헤타릴카르보닐, 아릴옥시카르보닐, 헤타릴옥시카르보닐, (C_1-C_6) -알킬술피닐, (C_1-C_6) -할로알킬술피닐, 아릴술피닐, 아릴- (C_1-C_6) -알킬술피닐, 헤타릴술피닐, 헤타릴- (C_1-C_6) -알킬술피닐, (C_1-C_6) -알킬술포닐, (C_1-C_6) -할로알킬술포닐, 아릴술포닐, 아릴- (C_1-C_6) -알킬술포닐, 헤타릴술포닐, 헤타릴- (C_1-C_6) -알킬술포닐을 나타내거나,

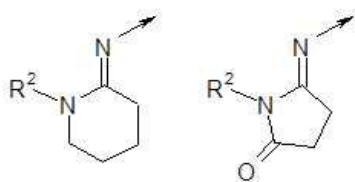
또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O, SO 또는 SO_2 가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -할로알킬, (C_2-C_6) -알케닐, (C_2-C_6) -할로알케닐, (C_2-C_6) -알키닐, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -할로알콕시, (C_1-C_6) -알킬티오, (C_1-C_6) -알킬술피닐, (C_1-C_6) -알킬술포닐, (C_1-C_6) -알킬술포닐옥시, (C_1-C_6) -할로알킬티오, (C_1-C_6) -할로알킬술피닐, (C_1-C_6) -할로알킬술포닐, (C_1-C_6) -알킬아미노, 디- (C_1-C_6) -알킬아미노, (C_1-C_7) -알킬카르보닐아미노, (C_1-C_7) -알콕시카르보닐, (C_1-C_7) -알킬카르보닐, (C_1-C_7) -알킬카르보닐옥시, 아미노카르보닐, (C_1-C_7) -아릴아미노카르보닐, 디- (C_1-C_7) -알킬아미노카르보닐, 아미노티오카르보닐, (C_1-C_7) -알킬아미노티오카르보닐, 디- (C_1-C_7) -알킬아미노티오카르보닐, (C_3-C_8) -시클로알킬아미노, (C_1-C_6) -알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, (C_1-C_6) -알킬아미노술포닐 및 디- (C_1-C_6) -알킬아미노술포닐로 이루어진 군으로

부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 0, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 (C₃-C₈)-시클로알킬, (C₃-C₈)-시클로알콕시, (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알킬 또는 (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알콕시에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내거나,

또는 -(CH₂)_m-R⁶, -O-(CH₂)_m-R⁶, -(CH₂)_m-O-R⁶ (여기서, R⁶은, 0, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-할로알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-할로알콕시, (C₁-C₆)-알킬티오, (C₁-C₆)-알킬술피닐, (C₁-C₆)-알킬술포닐, (C₁-C₆)-알킬술포닐옥시, (C₁-C₆)-할로알킬티오, (C₁-C₆)-할로알킬술피닐, (C₁-C₆)-할로알킬술포닐, (C₁-C₆)-알킬아미노, 디-(C₁-C₆)-알킬아미노, (C₁-C₇)-알킬카르보닐아미노, (C₁-C₇)-알콕시카르보닐, (C₁-C₇)-알킬카르보닐, (C₁-C₇)-알킬카르보닐옥시, 아미노카르보닐, (C₁-C₇)-알킬아미노카르보닐, 디-(C₁-C₇)-알킬아미노카르보닐, 아미노티오카르보닐, (C₁-C₇)-알킬아미노티오카르보닐, 디-(C₁-C₇)-알킬아미노티오카르보닐, (C₃-C₈)-시클로알킬아미노, (C₁-C₆)-알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, (C₁-C₆)-알킬아미노술포닐 또는 디-(C₁-C₆)-알킬아미노술포닐로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₂-C₈)-알케닐, (C₂-C₈)-할로알케닐, (C₂-C₈)-알키닐, (C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-할로알콕시, (C₁-C₆)-알킬티오, (C₁-C₆)-알킬술피닐, (C₁-C₆)-알킬술포닐, (C₁-C₆)-알킬술포닐옥시, (C₁-C₆)-할로알킬티오, (C₁-C₆)-할로알킬술피닐, (C₁-C₆)-할로알킬술포닐, (C₁-C₆)-알킬아미노, 디-(C₁-C₆)-알킬아미노, (C₁-C₇)-알킬카르보닐아미노, (C₁-C₇)-알콕시카르보닐, (C₁-C₇)-알킬카르보닐, (C₁-C₇)-알킬카르보닐옥시, 아미노카르보닐, (C₁-C₆)-알킬아미노카르보닐, 디-(C₁-C₆)-알킬아미노카르보닐, 아미노티오카르보닐, (C₁-C₆)-알킬아미노티오카르보닐, 디-(C₁-C₆)-알킬아미노티오카르보닐, (C₃-C₈)-시클로알킬아미노, (C₁-C₆)-알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, (C₁-C₆)-알킬아미노술포닐 또는 디-(C₁-C₆)-알킬아미노술포닐에 의해 임의로 치환되며 0, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 (C₃-C₈)-시클로알킬, (C₃-C₈)-시클로알콕시, (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알킬 및 (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알콕시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 여기서 m은 1, 2 또는 3의 수를 나타냄)을 나타내거나, 또는

R¹ 및 R²가 이들이 부착되어 있는 원자와 함께, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-알콕시, 할로젠, (C₁-C₄)-할로알킬에 의해 임의로 일치환 또는 다치환되며 황, 산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 추가의 헤테로원자 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및/또는 1개 이상의 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 4- 내지 8-원 고리를 형성할 수 있고,

R¹ 및 R³이 이들이 부착되어 있는 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 시아노, 시클로프로필, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 메틸시클로프로필, (C₃-C₄)-알칸디일, (C₃-C₄)-알켄디일, 부탄디에닐 (여기서, 부탄디에닐은 메틸, 메톡시, 플루오린, 염소, 브로민 또는 트리플루오로메틸에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고/거나 1개 이상의 산소 또는/및 질소 원자가 임의로 개재될 수 있음)로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환되며 황, 산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 추가의 헤테로원자 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및/또는 1개 이상의 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 5- 내지 6-원 포화 또는 불포화된 고리를 형성할 수 있는 것이되, 하기의 기를 나타내지 않는다 (식 중 화살표가 분자의 나머지를 나타냄).



청구항 2

제1항에 있어서,

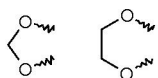
n이 0 또는 1의 수를 나타내고,

X^1 , X^2 , X^3 , X^4 가 서로 독립적으로 수소, 플루오린, 염소, 브로민, 아이오딘, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₂-C₄)-알케닐, (C₂-C₄)-알키닐, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-할로알콕시, 아미노티오카르보닐을 나타내거나,

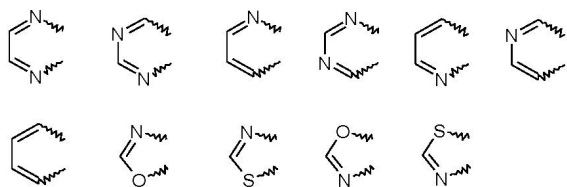
또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-할로알콕시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 임의로 포화 또는 불포화된 (C₃-C₆)-시클로알킬에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, 페닐-(C₁-C₄)-알킬, 페녹시, 헤타릴-(C₁-C₄)-알킬, 헤타릴옥시, 임의로 포화 또는 불포화된 (C₃-C₆)-시클로알킬-(C₁-C₄)-알킬, (C₃-C₆)-시클로알킬옥시, (C₃-C₆)-시클로알킬-(C₁-C₄)-알콕시를 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-할로알콕시, (C₃-C₆)-시클로알킬로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, (C₃-C₆)-시클로알킬, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아지닐, 티아졸릴, 티아디아졸릴, 옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 피라졸릴, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타내거나,

또는 X^2 및 X^3 또는 X^3 및 X^4 가 플루오린 또는 (C₁-C₄)-알킬에 의해 임의로 일치환 내지 사치환된 하기 5- 또는 6-원 고리를 형성할 수 있거나,



또는 X^2 및 X^3 또는 X^3 및 X^4 가 수소, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, (C₁-C₄)-알킬, (C₃-C₆)-시클로알킬, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-할로알콕시로 이루어진 군으로부터 서로 독립적으로 선택될 수 있는 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된 하기 융합된 고리를 형성할 수 있고,



R^3 이 (C₁-C₄)-알콕시-(C₁-C₄)-알킬 또는 (C₁-C₄)-시아노알킬을 나타내거나,

또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있으며 플루오린, 염소, 브로민, 아이오딘, 시아노, 니트로, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-할로알킬 및 (C₁-C₄)-알콕시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환된 3- 내지 6-원 포화 또는 부분 포화 고리를 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 아이오딘, 시아노, 니트로, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-할로알킬 및 (C₁-C₄)-알콕시로

이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환된 1 내지 2개의 N을 함유하는 페닐을 나타내고,

R^1 및 R^2 가 서로 독립적으로 수소, 시아노, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -할로알킬, (C_1-C_4) -알콕시, (C_1-C_4) -시아노알킬, (C_1-C_4) -히드록시알킬, (C_1-C_4) -알콕시- (C_1-C_4) -알킬, (C_2-C_4) -알케닐, (C_2-C_4) -알키닐을 나타내거나,

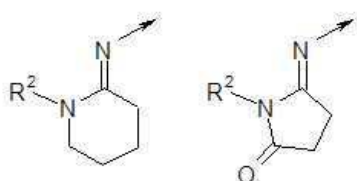
플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -할로알킬, (C_2-C_4) -알케닐, (C_2-C_4) -할로알케닐, (C_2-C_4) -알키닐, (C_1-C_4) -알콕시, (C_1-C_4) -할로알콕시, (C_1-C_4) -알킬티오, (C_1-C_4) -알킬술피닐, (C_1-C_4) -알킬술포닐, (C_1-C_4) -알킬아미노, 디- (C_1-C_4) -알킬아미노로 이루어진 군으로부터의 치환기에 의해 서로 독립적으로 임의로 일치환 내지 삼치환된, (C_1-C_4) -알킬카르보닐, (C_1-C_5) -알콕시카르보닐, 아릴카르보닐, 티오펜카르보닐, 피리딜카르보닐, 피리미딜카르보닐, 티아졸릴카르보닐, 피라졸릴카르보닐, (C_1-C_4) -알킬술피닐, (C_1-C_4) -할로알킬술피닐, 아릴술피닐, 아릴- (C_1-C_4) -알킬술피닐, 헤타릴술피닐, 헤타릴- (C_1-C_4) -알킬술피닐, (C_1-C_4) -알킬술포닐, (C_1-C_4) -할로알킬술포닐, 아릴술포닐, 아릴- (C_1-C_4) -알킬술포닐, 헤타릴술포닐, 헤타릴- (C_1-C_4) -알킬술포닐을 나타내거나,

또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -할로알킬, (C_2-C_4) -알케닐, (C_2-C_4) -알키닐, (C_1-C_4) -알콕시, (C_1-C_4) -할로알콕시 또는 (C_3-C_6) -시클로알킬로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환된 3- 내지 6-원 포화 또는 방향족 고리를 나타내거나,

또는 $-(CH_2)_m-R^6$, $-(CH_2)_m-O-R^6$ (여기서, R^6 은, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -할로알킬, (C_2-C_4) -알케닐, (C_2-C_4) -알키닐, (C_1-C_4) -알콕시, (C_1-C_4) -할로알콕시 또는 (C_3-C_6) -시클로알킬로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환된 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 여기서 m은 1 또는 2의 수를 나타냄)을 나타내거나, 또는

R^1 및 R^2 가 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 플루오린, 염소, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -알콕시, (C_1-C_4) -할로알킬에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환되며 황, 산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 추가의 헤테로원자 및/또는 1개 이상의 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 3- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있고,

R^1 및 R^3 이 이들이 부착되어 있는 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 시클로프로필, 시아노, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 메틸시클로프로필, (C_3-C_4) -알칸디일, (C_3-C_4) -알켄디일 및 부탄디에닐 (여기서, 부탄디에닐은 메틸, 플루오린, 염소, 브로민, 메톡시 또는 트리플루오로메틸에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고/거나 1개 이상의 산소 또는/및 질소 원자가 임의로 개재될 수 있음)에 의해 임의로 일치환 또는 이치환되며 황, 산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 추가의 헤테로원자 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및/또는 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 5- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있는 것이 되, 하기의 기를 나타내지 않는 것인 (식 중 화살표가 분자의 나머지를 나타냄),



화학식 I의 화합물.

청구항 3

제1항에 있어서,

n 이 0 또는 1의 수를 나타내고,

X^1 및 X^3 이 수소를 나타내고,

X^2 및 X^4 가 서로 독립적으로 수소, 플루오린, 염소, 브로민, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, OCH_2CF_3 을 나타내고,

R^1 이 수소, 메틸, 에틸, 프로필, 부틸, sec-부틸, 이소프로필, tert-부틸, (2,2,2)-트리플루오로에틸, (2,2)-디플루오로메틸, 메톡시, 에톡시, 메톡시메틸, 메톡시에틸을 나타내거나,

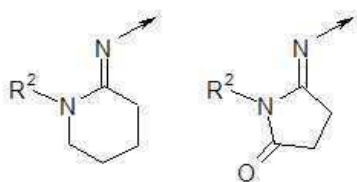
또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환된 아틸을 나타내고,

또는 $-(CH_2)_m-R^6$ (여기서, R^6 은 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환, 이치환 또는 삼치환된 아틸을 나타내고, 여기서 m 은 1의 수를 나타냄)을 나타내고,

R^2 가 수소, 메틸 또는 에틸을 나타내거나, 또는

R^1 및 R^2 가 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 산소 원자를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 5-내지 6-원 고리를 형성할 수 있고,

R^1 및 R^3 이 이들이 부착되어 있는 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 시아노, 시클로프로필, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 메틸시클로프로필, (C_3-C_4) -알칸디일, (C_3-C_4) -알켄디일 및 부탄디에닐 (여기서, 부탄디에닐은 메틸, 플루오린, 염소, 브로민, 메톡시 또는 트리플루오로메틸에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고/거나 1개 이상의 산소 또는/및 질소 원자가 임의로 개재될 수 있음)에 의해 임의로 일치환 또는 이치환되며, 황, 산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 추가의 헤테로원자 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및/또는 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 5-내지 6-원 고리를 형성할 수 있는 것이되, 하기의 기를 나타내지 않는 것인 (식 중 화살표가 분자의 나머지를 나타냄),



화학식 I의 화합물.

청구항 4

제3항에 있어서,

X^2 및 X^4 가 하기 조합 X^2/X^4 : F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, 메틸/메틸, 메틸/F, F/메틸, 메틸/Cl, Cl/메틸, 메틸/Br, Br/메틸, 에틸/에틸, 에틸/F, F/에틸, 에틸/Cl, Cl/에틸, 에틸/Br, 또는 Br/에틸을 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 5

제3항에 있어서,

R^1 이 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환된 페닐을 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 6

제3항에 있어서,

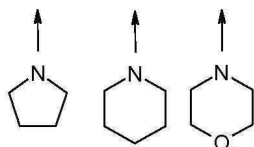
R^6 이 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환, 이치환 또는 삼치환된 페닐을 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 7

제3항에 있어서,

R^1 및 R^2 가 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께 하기 고리를 나타내고,



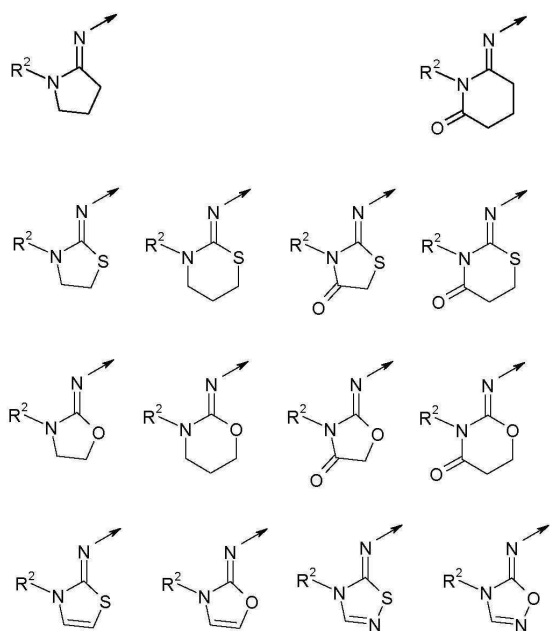
식 중, R^1 및 R^2 에 부착되어 있는 질소 원자가 사이클을 나타내고, 화살표가 분자의 나머지를 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 8

제3항에 있어서,

R^1 및 R^3 이 이들이 부착되어 있는 원자와 함께 하기 기를 나타내고,



이들 각각이 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 시클로프로필, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 메틸시클로프로필에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고,

식 중, 화살표가 분자의 나머지를 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 9

제1항에 있어서,

n 이 0 또는 1의 수를 나타내고,

X^1 및 X^3 이 수소를 나타내고,

X^2 및 X^4 가 서로 독립적으로 수소, 플루오린, 염소, 브로민, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 비닐, 에틸닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, OCH_2CF_3 , 아미노티오카르보닐을 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, 페닐메틸, 페녹시, 피리딜메틸, 피리미딜메틸, 티아졸릴메틸, 피라졸릴메틸, 피리딜옥시, 피리미딜옥시, 티아졸릴옥시, 피라졸릴옥시, 시클로프로필메틸, 시클로프로필메톡시를 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, (C_3-C_6) -시클로알킬, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아지닐, 티아졸릴, 티아디아졸릴, 옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 피라졸릴, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타내고,

R^3 이 메톡시메틸, 메톡시에틸, 시아노메틸을 나타내거나,

또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있으며 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 메톡시 및 에톡시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화 또는 부분 포화 고리를

나타내거나,

또는 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 메톡시 및 에톡시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있는 1 내지 3개의 N을 함유하는 페닐을 나타내고,

R^1 이 시아노, 시아노메틸, 메틸카르보닐, 에틸카르보닐, 프로필카르보닐, 이소프로필카르보닐, 메톡시카르보닐, 에톡시카르보닐을 나타내거나,

플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 트리플루오로메틸, 알릴, 부테닐, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 메틸티오, 메틸술피닐, 메틸술포닐, 메틸아미노, 디메틸아미노에 의해 서로 독립적으로 임의로 일치환 또는 이치환된, 아릴카르보닐, 피리딜카르보닐, 피리미딜카르보닐, 티아졸릴카르보닐, 피라졸릴카르보닐, 메틸술피닐, 트리플루오로메틸술피닐, 메틸술포닐, 트리플루오로메틸술포닐을 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환될 수 있는, 옥세타닐, 티에타닐, 트리메틸렌술포닐, 트리메틸렌술피닐, 옥사닐 또는 티아닐을 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된, 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실을 나타내고,

R^2 가 수소, 메틸 또는 에틸을 나타내거나, 또는

R^1 및 R^2 가 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸에 의해 임의로 일치환, 이치환, 삼치환 또는 사치환되며 황 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 추가의 헤테로원자를 함유하는 포화 또는 불포화된 3- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있거나,

또는, 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸에 의해 임의로 일치환, 이치환, 삼치환 또는 사치환되며 산소, 황 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1개의 추가의 헤테로원자를 임의로 함유하는 포화 또는 불포화된 4-원 고리를 형성할 수 있는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 10

제9항에 있어서,

X^2 및 X^4 가 하기 조합 X^2/X^4 : F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, 메틸/메틸, 메틸/F, F/메틸, 메틸/Cl, Cl/메틸, 메틸/Br, Br/메틸, 에틸/에틸, 에틸/F, F/에틸, 에틸/Cl, Cl/에틸, 에틸/Br, Br/에틸, 메톡시/메틸, 메틸/메톡시, 메틸/H, 에틸/H, 염소/H, 브로민/H, 플루오린/H, 메톡시/H, H/염소, H/플루오린, H/브로민, H/메틸, H/메톡시 또는 H/에틸을 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 11

제9항에 있어서,

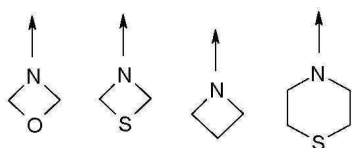
R^3 이 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 메톡시 및 에톡시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있는 시클로프로필, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 티아졸릴, 피라졸릴 또는 티에닐인 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 12

제9항에 있어서,

R^1 및 R^2 가 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께 하기 고리를 나타내고,



식 중, R^1 및 R^2 가 부착되어 있는 질소 원자가 사이클을 나타내고, 화살표가 분자의 나머지를 나타내고, 이들이 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸 또는 디플루오로메틸에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 13

제1항에 있어서,

n 이 0 또는 1의 수를 나타내고,

X^1 및 X^3 이 수소를 나타내고,

X^2 및 X^4 가 서로 독립적으로 수소, 플루오린, 염소, 브로민, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 비닐, 에틸닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, OCH_2CF_3 , 아미노티오카르보닐을 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, 페닐메틸, 페녹시, 피리딜메틸, 피리미딜메틸, 티아졸릴메틸, 피라졸릴메틸, 피리딜옥시, 피리미딜옥시, 티아졸릴옥시, 피라졸릴옥시, 시클로프로필메틸, 시클로프로필메톡시를 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, (C_3-C_6) -시클로알킬, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 피라지닐, 피라지닐, 트리아지닐, 티아졸릴, 티아디아졸릴, 옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 피라졸릴, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타내고,

R^3 이 메톡시메틸, 메톡시에틸, 시아노메틸, 옥솔라닐을 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 메톡시 및 에톡시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환될 수 있는, 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 피리딜, 피리미딜, 피라지닐, 피라다지닐, 피롤릴, 푸라닐, 티아졸릴, 피라졸릴 또는 티에닐을 나타내고,

R^1 및 R^2 가 서로 독립적으로 수소, 시아노, 메틸, 에틸, 프로필, 부틸, sec-부틸, 이소프로필, tert-부틸, (2,2,2)-트리플루오로에틸, (2,2)-디플루오로메틸, 메톡시, 에톡시, 시아노메틸, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 알릴, 부테닐, 프로피닐, 메틸카르보닐, 에틸카르보닐, 프로필카르보닐, 이소프로필카르보닐, 메톡시카르보닐, 에톡시카르보닐을 나타내거나,

플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 트리플루오로메틸, 알릴, 부테닐, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 메틸티오, 메틸술피닐, 메틸술포닐, 메틸아미노, 디메틸아미노에 의해 서로 독립적으로 임의로 일치환 또는 이치환된, 알릴카르보닐, 피리딜카르보닐, 피리미딜카르보닐, 티아졸릴카르보닐, 피라졸릴카르보닐, 메틸술피닐, 트리플루오로메틸술피닐, 메틸술포닐, 트리플루오로메틸술포닐을 나타내거나,

또는, 0, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1, 2 또는

는 3회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화 또는 방향족 고리를 나타내거나,

또는 $-(CH_2)_m-R^6$ (여기서, R^6 은, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환, 이치환 또는 삼치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 여기서 m 은 1의 수를 나타냄)을 나타내거나, 또는

R^1 및 R^2 가 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸에 의해 임의로 일치환, 이치환, 삼치환 또는 사치환되며 황, 산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 추가의 헤테로원자 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및/또는 카르보닐 기에 의해 대체되는 1개 이상의 CH_2 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 3- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 14

제13항에 있어서,

X^2 및 X^4 가 하기 조합 X^2/X^4 : F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, 메틸/메틸, 메틸/F, F/메틸, 메틸/Cl, Cl/메틸, 메틸/Br, Br/메틸, 에틸/에틸, 에틸/F, F/에틸, 에틸/Cl, Cl/에틸, 에틸/Br, Br/에틸, 메톡시/메틸, 메틸/메톡시, 메틸/H, 에틸/H, 염소/H, 브로민/H, 플루오린/H, 메톡시/H, H/염소, H/플루오린, H/브로민, H/메틸, H/메톡시 또는 H/에틸을 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 15

제13항에 있어서,

R^1 및 R^2 가 서로 독립적으로 하기의 고리: 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환될 수 있는 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 옥세탄, 페닐, 티에닐 또는 피리딜을 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 16

제13항에 있어서,

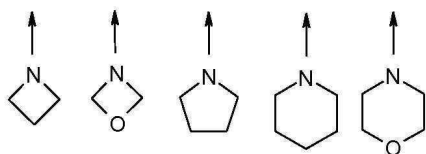
R^6 이 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환, 이치환 또는 삼치환될 수 있는 시클로프로필, 페닐 또는 피리딜인 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 17

제13항에 있어서,

R^1 및 R^2 가 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께 하기 고리를 나타내고,



식 중, R^1 및 R^2 가 부착되어 있는 질소 원자가 사이클을 나타내고, 화살표가 분자의 나머지를 나타내고, 이들이 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸 또는 디플루오로메틸에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 18

제1항에 있어서,

n 이 0 또는 1의 수를 나타내고,

X^1 및 X^3 이 수소를 나타내고,

X^2 및 X^4 가 하기 조합 X^2/X^4 : 비닐/H, H/비닐, 에틸/H, H/에틸, 메톡시/H, H/메톡시, 에톡시/H, H/에톡시, 아미노티오키아르보닐/H, H/아미노티오키아르보닐, 비닐/메틸, 메틸/비닐, 에틸/메틸, 메틸/에틸, 메톡시/메틸, 메틸/메톡시, 에톡시/메틸, 메틸/에톡시, 아미노티오키아르보닐/메틸, 메틸/아미노티오키아르보닐, 비닐/F, F/비닐, 에틸/F, F/에틸, 메톡시/F, F/메톡시, 에톡시/F, F/에톡시, 아미노티오키아르보닐/F, F/아미노티오키아르보닐, 비닐/Cl, Cl/비닐, 에틸/Cl, Cl/에틸, 메톡시/Cl, Cl/메톡시, 에톡시/Cl, Cl/에톡시, 아미노티오키아르보닐/Cl, Cl/아미노티오키아르보닐을 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, 페닐메틸, 페녹시, 피리딜메틸, 피리미딜메틸, 티아졸릴메틸, 피라졸릴메틸, 피리딜옥시, 피리미딜옥시, 티아졸릴옥시, 피라졸릴옥시, 시클로프로필메틸, 시클로프로필메톡시를 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, (C_3-C_6) -시클로알킬, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아지닐, 티아졸릴, 티아디아졸릴, 옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 피라졸릴, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타내고,

R^3 이 메톡시메틸, 메톡시에틸 또는 시아노메틸을 나타내거나,

또는, 0, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있으며 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 메톡시 및 에톡시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화 또는 부분 포화 고리를 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 메톡시 및 에톡시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있는 1 내지 3개의 N을 함유하는 페닐을 나타내고,

R^1 및 R^2 가 서로 독립적으로 수소, 시아노, 메틸, 에틸, 프로필, 부틸, sec-부틸, 이소프로필, tert-부틸, (2,2,2)-트리플루오로에틸, (2,2)-디플루오로메틸, 메톡시, 에톡시, 시아노메틸, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 알릴, 부테닐, 프로피닐, 메틸카르보닐, 에틸카르보닐, 프로필카르보닐, 이소프로필카르보닐, 메톡시카르보닐, 에톡시카르보닐을 나타내거나,

플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 트리플루오로메틸, 알릴, 부테닐, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 메틸티오, 메틸술피닐, 메틸술포닐, 메틸아미노, 디메틸아미노에 의해 서로 독립적으로 임

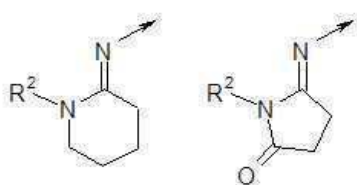
의로 일치환 또는 이치환된, 아릴카르보닐, 피리딜카르보닐, 피리미딜카르보닐, 티아졸릴카르보닐, 피라졸릴카르보닐, 메틸술피닐, 트리플루오로메틸술피닐, 메틸술포닐, 트리플루오로메틸술포닐을 나타내거나,

또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1, 2 또는 3회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에틸닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화 또는 방향족 고리를 나타내거나,

또는 $-(CH_2)_m-R^6$ (여기서, R^6 은, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에틸닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환, 이치환 또는 삼치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 여기서 m은 1의 수를 나타냄)을 나타내거나, 또는

R^1 및 R^2 가 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸에 의해 임의로 일치환, 이치환, 삼치환 또는 사치환되며 황, 산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 추가의 헤테로원자 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및/또는 카르보닐 기에 의해 대체되는 1개 이상의 CH_2 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 3- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있고,

R^1 및 R^3 이 이들이 부착되어 있는 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 시아노, 시클로프로필, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 메틸시클로프로필, (C_3-C_4) -알칸디일, (C_3-C_4) -알켄디일 및 부탄디에닐 (여기서, 부탄디에닐은 메틸, 플루오린, 염소, 브로민, 메톡시 또는 트리플루오로메틸에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고/거나 1개 이상의 산소 또는/및 질소 원자가 임의로 개재될 수 있음)에 의해 임의로 일치환 또는 이치환되며 황, 산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 추가의 헤테로원자 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및/또는 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 5- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있는 것이되, 하기의 기를 나타내지 않는 것인 (식 중 화살표가 분자의 나머지를 나타냄),



화학식 I의 화합물.

청구항 19

제18항에 있어서,

R^3 이 하기의 고리: 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 메톡시 및 에톡시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있는 시클로프로필, 피리딜, 피리미딜, 티아졸릴, 피라졸릴 또는 티에닐을 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 20

제18항에 있어서,

R^1 및 R^2 가 서로 독립적으로 하기의 고리: 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로

메틸, 비닐, 에틸, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환될 수 있는 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 옥세탄, 페닐, 티에닐 또는 피리딜을 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 21

제18항에 있어서,

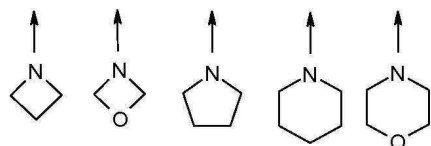
R^6 이 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에틸, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환, 이치환 또는 삼치환될 수 있는 시클로프로필, 페닐 또는 피리딜을 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 22

제18항에 있어서,

R^1 및 R^2 가 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께 하기 고리를 나타내고,



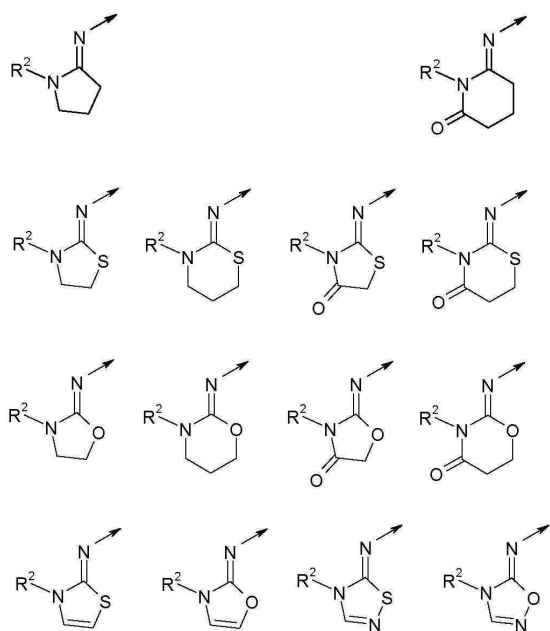
식 중, R^1 및 R^2 가 부착되어 있는 질소 원자가 사이클을 나타내고, 화살표가 분자의 나머지를 나타내고, 이들이 임의로 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸에 의해 일치환 또는 이치환될 수 있는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 23

제18항에 있어서,

R^1 및 R^3 이 이들이 부착되어 있는 원자와 함께 하기 기를 나타내고,



이들 각각이 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 시클로프로필, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 또는 메틸시클로프로필에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고,

식 중, 화살표가 분자의 나머지를 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 24

제1항에 있어서,

n 이 0 또는 1의 수를 나타내고,

X^1 및 X^3 이 수소를 나타내고,

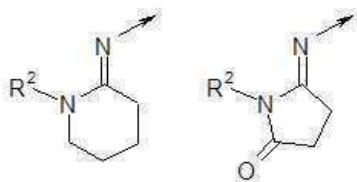
X^2 및 X^4 가 서로 독립적으로 수소, 플루오린, 염소, 브로민, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 비닐, 에틸닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, OCH_2CF_3 , 아미노티오키아보닐을 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, 페닐메틸, 페녹시, 피리딜메틸, 피리미딜메틸, 티아졸릴메틸, 피라졸릴메틸, 피리딜옥시, 피리미딜옥시, 티아졸릴옥시, 피라졸릴옥시, 시클로프로필메틸, 시클로프로필메톡시를 나타내거나,

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, (C_3-C_6) -시클로알킬, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아지닐, 티아졸릴, 티아디아졸릴, 옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 피라졸릴, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타내고,

R^1 및 R^3 이 이들이 부착되어 있는 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 시아노, 시클로프로필, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 메틸시클로프로필, (C_3-C_4) -알칸디일, (C_3-C_4) -알켄디일, 부탄디에닐 (여기서, 부탄디에닐은 메틸, 플루오린, 염소, 브로민, 메톡시 또는 트리플루오로메틸에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고/있거나 1개 이상의 산소 또는/및 질소 원자가 임의로 개재될 수 있음)에 의해 임의로 일치환 또는 이치환되며 황,

산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 추가의 헤테로원자 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및/또는 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 5- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있는 것이되, 하기의 기를 나타내지 않고 (식 중 화살표가 분자의 나머지를 나타냄),



R^2 가 시아노, (2,2,2)-트리플루오로에틸, (2,2)-디플루오로메틸, 2-클로로-(2,2)-디플루오로에틸, (2,2)-디클로로-2-플루오로에틸, (2,2,2)-트리클로로에틸, 펜타플루오로에틸, 2-클로로테트라플루오로에틸, 알릴, 부테닐, 프로피닐, 메틸술피닐, 트리플루오로메틸술피닐, 메틸술포닐, 트리플루오로메틸술포닐을 나타내거나,

또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1, 2 또는 3회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화 또는 방향족 고리를 나타내고,

또는 $-(CH_2)_m-R^6$ (여기서, R^6 은, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환, 이치환 또는 삼치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 여기서 m은 1의 수를 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 25

제24항에 있어서,

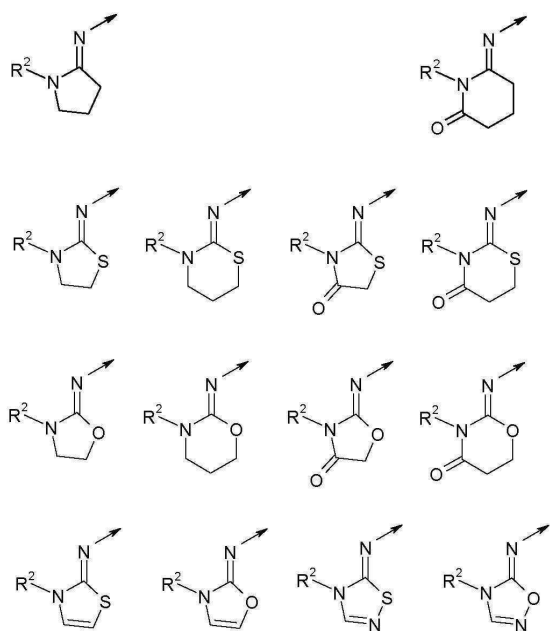
X^2 및 X^4 가 하기 조합 X^2/X^4 : F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, 메틸/메틸, 메틸/F, F/메틸, 메틸/Cl, Cl/메틸, 메틸/Br, Br/메틸, 에틸/에틸, 에틸/F, F/에틸, 에틸/Cl, Cl/에틸, 에틸/Br, Br/에틸, 메톡시/메틸, 메틸/메톡시, 메틸/H, 에틸/H, 염소/H, 브로민/H, 플루오린/H, 메톡시/H, H/염소, H/플루오린, H/브로민, H/메틸, H/메톡시 또는 H/에틸을 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 26

제24항에 있어서,

R^1 및 R^3 이 이들이 부착되어 있는 원자와 함께 하기 기를 나타내고,



이들 각각이 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 시클로프로필, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 또는 메틸시클로프로필에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고,

식 중, 화살표가 분자의 나머지를 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 27

제24항에 있어서,

R^2 가 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환될 수 있는 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 옥세탄, 페닐, 티에닐 또는 피리딜을 나타내는 것인,

화학식 I의 화합물.

청구항 28

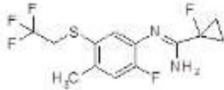
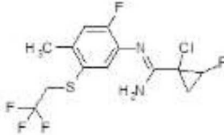
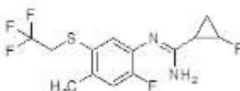
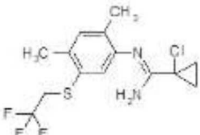
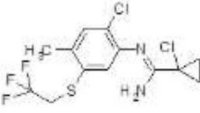
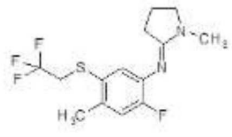
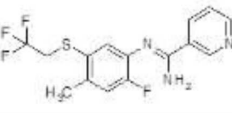
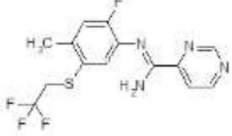
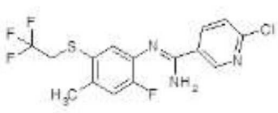
제24항에 있어서,

R^6 이 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환, 이치환 또는 삼치환될 수 있는 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 페닐, 또는 피리딜을 나타내는 것인,

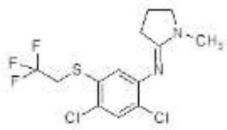
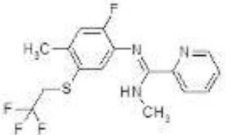
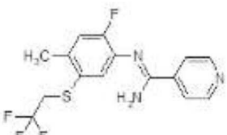
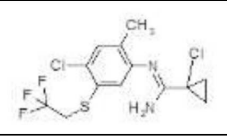
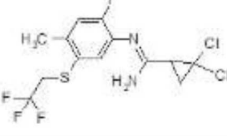
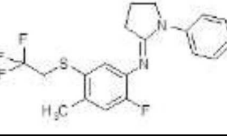
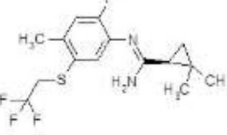
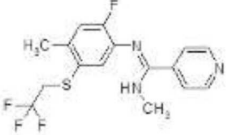
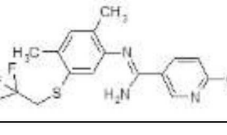
화학식 I의 화합물.

청구항 29

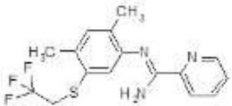
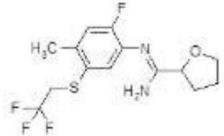
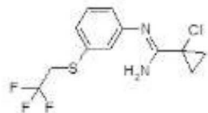
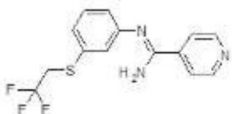
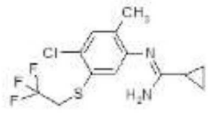
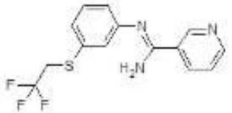
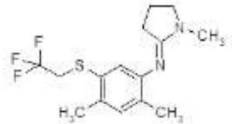
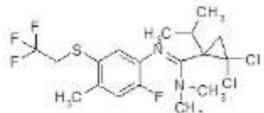
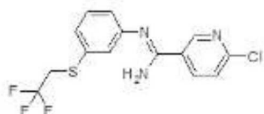
제1항에 있어서,

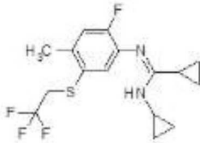
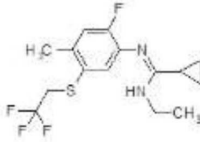
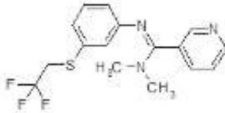
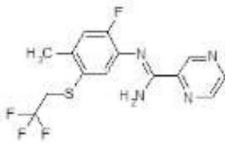
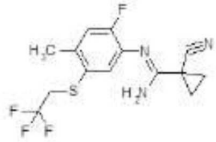
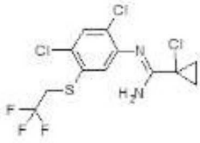
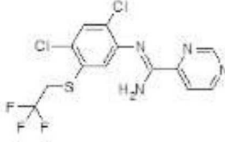
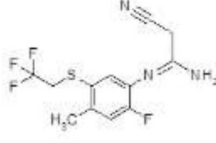
실시예 번호	구조
Ia-27	
Ia-29	
Ia-33	
Ia-34	
Ia-36	
Ia-39	
Ia-40	
Ia-42	
Ia-46	

실시예 번호	구조
Ia-49	
Ia-55	
Ia-58	
Ia-59	
Ia-61	
Ia-63	
Ia-64	
Ia-66	
Ia-67	

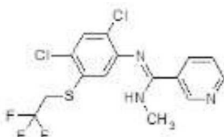
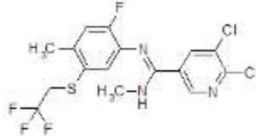
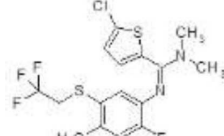
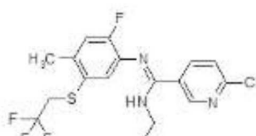
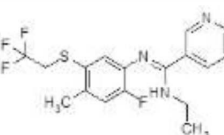
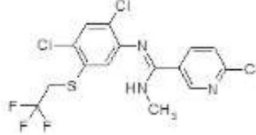
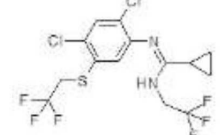
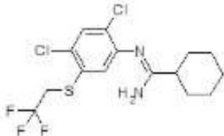
실시예 번호	구조
Ia-68	
Ia-72	
Ia-73	
Ia-74	
Ia-75	
Ia-78	
Ia-79	
Ia-80	
Ia-81	

실시예 번호	구조
Ia-82	
Ia-83	
Ia-86	
Ia-88	
Ia-91	
Ia-92	
Ia-93	
Ia-94	
Ia-95	

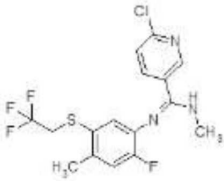
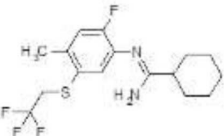
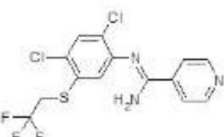
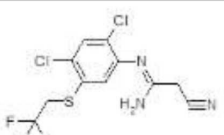
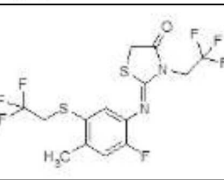
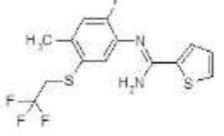
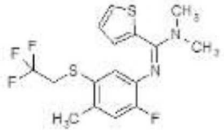
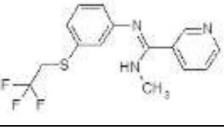
실시예 번호	구조
Ia-98	
Ia-99	
Ia-100	
Ia-101	
Ia-102	
Ia-104	
Ia-105	
Ia-106	
Ia-107	

실시예 번호	구조
Ia-108	
Ia-110	
Ia-114	
Ia-117	
Ia-118	
Ia-123	
Ia-130	
Ia-132	

실시예 번호	구조
Ia-134	
Ia-135	
Ia-136	
Ia-138	
Ia-139	
Ia-140	
Ia-141	
Ia-145	

실시예 번호	구조
Ia-146	
Ia-148	
Ia-149	
Ia-150	
Ia-151	
Ia-152	
Ia-153	
Ia-156	

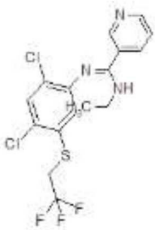
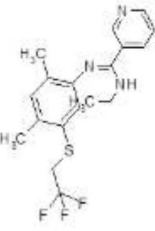
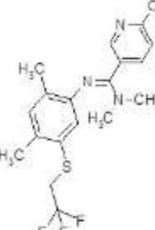
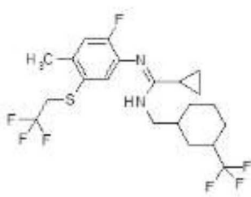
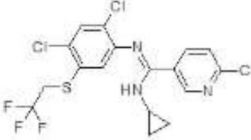
실시예 번호	구조
Ia-158	
Ia-159	
Ia-160	
Ia-161	
Ia-162	
Ia-163	
Ia-166	
Ia-167	

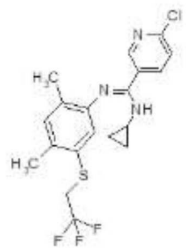
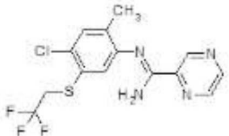
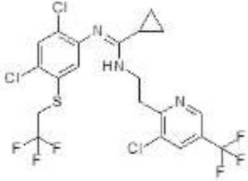
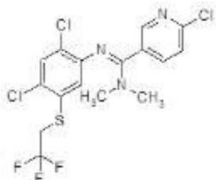
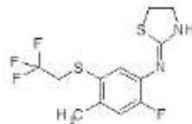
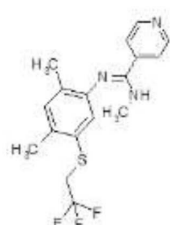
실시예 번호	구조
Ia-168	
Ia-169	
Ia-172	
Ia-173	
Ia-175	
Ia-181	
Ia-182	
Ia-183	

실시예 번호	구조
Ia-187	
Ia-188	
Ia-189	
Ia-190	
Ia-191	
Ia-192	
Ia-194	

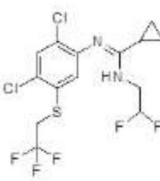
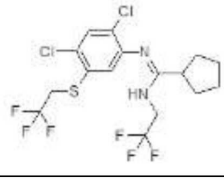
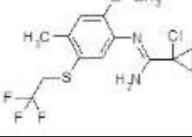
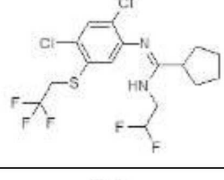
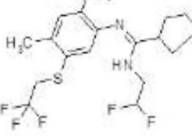
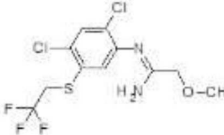
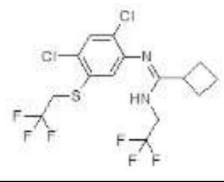
실시예 번호	구조
Ia-195	
Ia-196	
Ia-197	
Ia-198	
Ia-199	
Ia-200	
Ia-201	

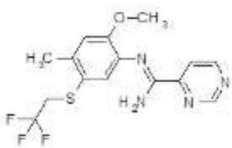
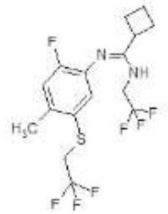
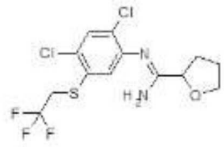
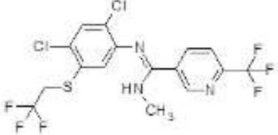
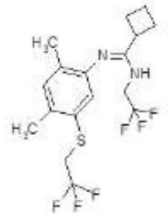
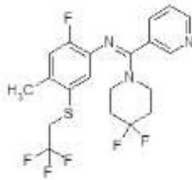
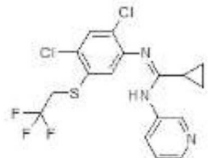
실시예 번호	구조
Ia-206	
Ia-208	
Ia-209	
Ia-214	
Ia-218	
Ia-219	

실시예 번호	구조
Ia-220	
Ia-224	
Ia-227	
Ia-228	
Ia-229	

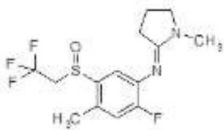
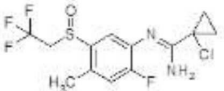
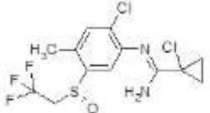
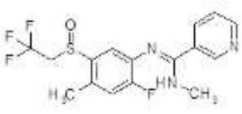
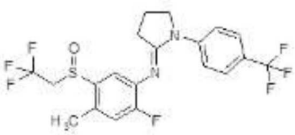
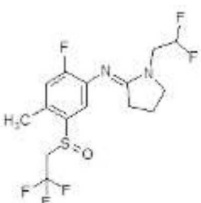
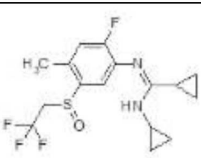
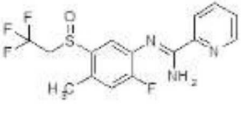
실시예 번호	구조
Ia-232	
Ia-234	
Ia-235	
Ia-237	
Ia-238	
Ia-239	

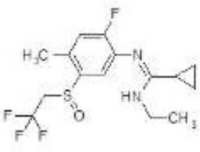
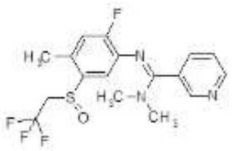
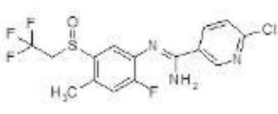
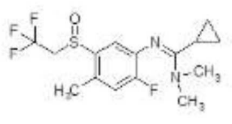
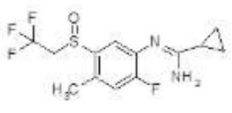
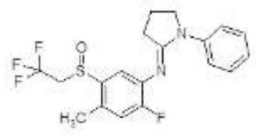
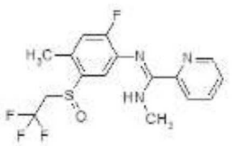
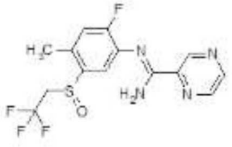
실시예 번호	구조
Ia-241	
Ia-243	
Ia-244	
Ia-247	
Ia-248	
Ia-249	
Ia-251	

실시예 번호	구조
Ia-253	
Ia-254	
Ia-255	
Ia-256	
Ia-257	
Ia-258	
Ia-259	

실시예 번호	구조
Ia-260	
Ia-261	
Ia-262	
Ia-264	
Ia-267	
Ia-269	
Ia-271	

실시예 번호	구조
Ia-272	
Ia-273	
Ia-275	
Ia-276	
Ia-277	
Ia-278	
Ia-279	
Ib-19	

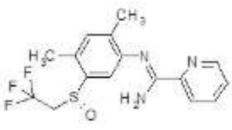
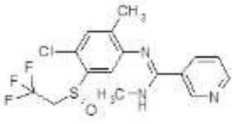
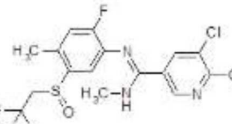
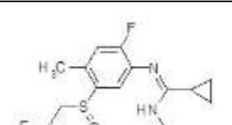
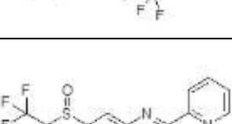
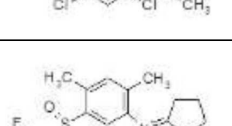
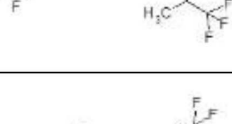
실시예 번호	구조
Ib-20	
Ib-22	
Ib-27	
Ib-28	
Ib-30	
Ib-33	
Ib-39	
Ib-45	

실시예 번호	구조
Ib-46	
Ib-47	
Ib-48	
Ib-51	
Ib-53	
Ib-55	
Ib-58	
Ib-62	

실시예 번호	구조
Ib-63	
Ib-64	
Ib-65	
Ib-69	
Ib-71	
Ib-72	
Ib-75	

실시예 번호	구조
Ib-79	
Ib-81	
Ib-82	
Ib-83	
Ib-84	
Ib-88	
Ib-89	

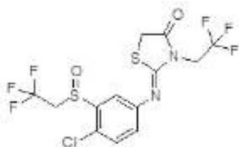
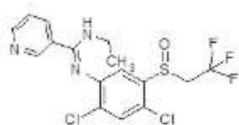
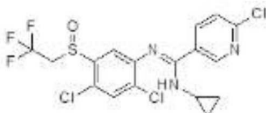
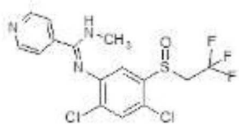
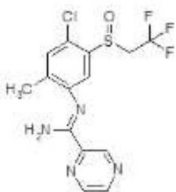
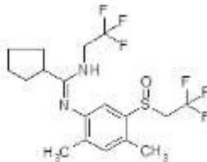
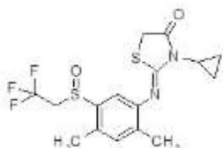
실시예 번호	구조
Ib-92	
Ib-93	
Ib-94	
Ib-95	
Ib-97	
Ib-98	
Ib-99	

실시예 번호	구조
Ib-102	
Ib-103	
Ib-104	
Ib-106	
Ib-109	
Ib-112	
Ib-115	

실시예 번호	구조
Ib-116	
Ib-117	
Ib-119	
Ib-120	
Ib-121	
Ib-122	
Ib-123	

실시예 번호	구조
Ib-129	
Ib-130	
Ib-131	
Ib-132	
Ib-133	
Ib-134	
Ib-135	

실시예 번호	구조
Ib-136	
Ib-137	
Ib-138	
Ib-139	
Ib-141	
Ib-142	
Ib-144	

실시예 번호	구조
Ib-146	
Ib-150	
Ib-151	
Ib-152	
Ib-153	
Ib-155	
Ib-156	

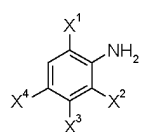
실시예 번호	구조
Ib-158	
Ib-159	
Ib-160	
Ib-163	
Ib-165	
Ib-166	
Ib-167	

실시예 번호	구조
Ib-168	
Ib-169	
Ib-170	
Ib-171	
Ib-172	
Ib-173	
Ib-174	

청구항 30

(A) 하기 화학식 VII의 아닐린을 하기 화학식 VIII의 산, 산 무수물 또는 산 클로라이드의 존재 하에 하기 화학식 VI의 아닐리드로 전환시키고,

<화학식 VII>

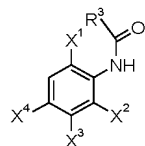


<화학식 VIII>



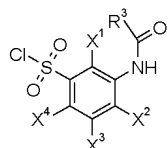
(식 중, AG는 OH, O(CO)-R³ 또는 Cl를 나타냄)

<화학식 VI>



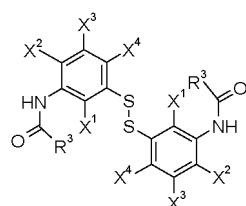
(B) 화학식 VI의 아닐리드를 클로로술폰산을 사용한 클로로술폰화에 의해 하기 화학식 V의 술폰일 클로라이드로 전환시키고,

<화학식 V>



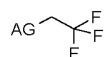
(C) 화학식 V의 술폰일 클로라이드를 염산 중 철 또는 아이오다이드를 사용한 환원에 의해 하기 화학식 IV의 디설피드로 전환시키고,

<화학식 IV>



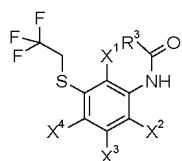
(D) 화학식 IV의 디설피드를 하기 화학식 IX의 트리플루오로에틸 친전자체를 사용하여 하기 화학식 III의 설피드로 전환시키고,

<화학식 IX>



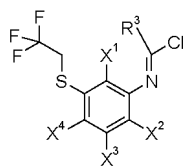
(식 중, AG는 염소, 브로민, 토실레이트, 메실레이트 또는 트리플레이트로부터 선택되는 이탈기를 나타냄)

<화학식 III>



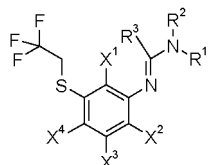
(E) 화학식 III의 화합물을 디페닐 클로로포스페이트 또는 오염화인을 사용하여 하기 화학식 II의 이미도일 클로라이드로 전환시키고,

<화학식 II>



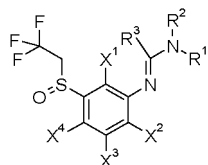
(F) 화학식 II의 화합물을 아민을 사용하여 하기 화학식 Ia의 아미딘으로 전환시키고,

<화학식 Ia>



(G) 화학식 Ia의 화합물을 산화제를 사용하여 하기 화학식 Ib의 술폭시드로 전환시키는 것

<화학식 Ib>



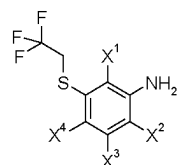
(식 중, X^1 , X^2 , X^3 , X^4 , R^1 , R^2 및 R^3 은 청구항 1의 정의에 따름)

을 특징으로 하는, 화학식 Ib의 화합물을 제조하는 방법.

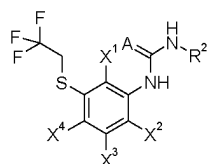
청구항 31

(A) 하기 화학식 X의 아닐린을 임의로 염기의 존재 하에 및 임의로 유기 용매의 존재 하에 이소시아네이트 또는 이소티오시아네이트를 사용하여 하기 화학식 XXXVIII의 화합물로 전환시키고,

<화학식 X>

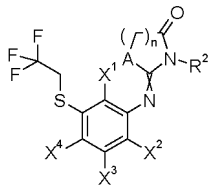


<화학식 XXXVIII>



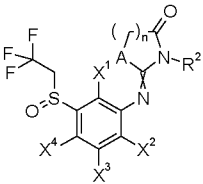
(B) 화학식 XXXVIII의 화합물을 시클로아실화에 의해 하기 화학식 Ia-g의 화합물로 임의로 전환시키고,

<화학식 Ia-g>



(C) 화학식 Ia-g의 이들 화합물을 하기 화학식 Ib-g의 화합물로 산화시키는 것

<화학식 Ib-g>



(식 중, X^1 , X^2 , X^3 , X^4 및 R^2 는 청구항 1의 정의에 따르고, A는 O 또는 S이며, n은 0 또는 1을 나타낼 수 있음)을 특징으로 하는, 화학식 Ib-g의 화합물을 제조하는 방법.

청구항 32

제1항 내지 제29항 중 어느 한 항에 청구된 바와 같은 화학식 I의 하나 이상의 화합물 및 증량제 및/또는 계면활성제를 포함하는 것을 특징으로 하는 농약 조성물.

청구항 33

제1항 내지 제29항 중 어느 한 항에 청구된 바와 같은 화학식 I의 화합물을 증량제 및/또는 계면활성제와 혼합하는 것을 특징으로 하는, 농약 조성물을 제조하는 방법.

청구항 34

제1항 내지 제29항 중 어느 한 항에 청구된 바와 같은 화학식 I의 화합물이 동물 해충 및/또는 그의 서식지에 작용하도록 하는 것을 특징으로 하는, 동물 해충을 방제하는 방법.

청구항 35

제1항 내지 제29항 중 어느 한 항에 청구된 바와 같은 화학식 I의 화합물을 사용하여 작물 보호에서, 물질 보호에서 및/또는 수의학 분야에서 동물 해충을 방제하는 방법.

발명의 설명

기술 분야

[0001] 본 발명은 신규 N-아릴아미딘-치환된 트리플루오로에틸 술피드 유도체, 동물 해충을 방제하기 위한 살충제 및 살균제로서의 그의 용도, 및 그의 제조를 위한 방법 및 중간체에 관한 것이다.

배경 기술

[0002] 다양한 치환된 N-아릴아미딘 및 그의 살균 및 살충에 작용은 이미 WO 2007/131680의 문헌에 기재된 바 있다.

[0003] 적용시, 상기 언급된 공개물로부터 이미 공지된 활성 화합물은, 이들이, 특히 비교적 낮은 적용률에서 동물 해충에 대해 살균 및/또는 살충에 활성을 전혀 갖지 않거나 또는 다르게는 단지 불충분한 살균 및/또는 살충에 활성을 가질 수 있다는 단점을 갖는다.

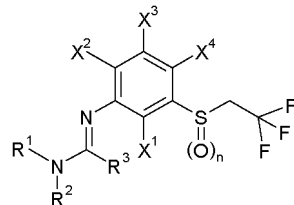
발명의 내용

[0004] 따라서, 본 발명의 목적은, 특히 비교적 낮은 적용률에서 동물 해충에 대해 만족스러운 살곤충 및/또는 살응애 활성을 갖고 유용한 식물 작물에서 높은 선택성 및 개선된 호환성을 갖는 살곤충제 및/또는 살응애제로서 사용될 수 있는, 상응하는 N-아릴아미딘-치환된 트리플루오로에틸 술피드 유도체를 제공하는 것이다.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

[0005] 본 발명은 이제 하기 화학식 I의 신규 화합물을 제공한다.

[0006] <화학식 I>



[0007]

[0008] 상기 식에서,

[0009] n 은 0, 1 또는 2의 수를 나타내고,

[0010] X^1 , X^2 , X^3 , X^4 는 서로 독립적으로 수소, 할로젠, 히드록시, 아미노, OCN, SCN, SF_5 , 트리알킬실릴, 알킬, 할로알킬, 시아노알킬, 히드록시알킬, 알콕시카르보닐알킬, 알콕시알킬, 알케닐, 할로알케닐, 시아노알케닐, 알키닐, 할로알키닐, 시아노알키닐, 알콕시, 할로알콕시, 시아노알콕시, 히드록시카르보닐알콕시, 알콕시카르보닐알콕시, 알콕시알콕시, 알킬히드록시이미노, 알콕시이미노, 알킬알콕시이미노, 할로알킬알콕시이미노, 알킬티오, 할로알킬티오, 알콕시알킬티오, 알킬티오알킬, 알킬술피닐, 할로알킬술피닐, 알콕시알킬술피닐, 알킬술피닐알킬, 알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 알콕시알킬술포닐, 알킬술포닐알킬, 알킬술포닐옥시, 알킬카르보닐, 할로알킬카르보닐, 카르복실, 알킬카르보닐옥시, 알콕시카르보닐, 할로알콕시카르보닐, 알콕시카르보닐알킬, 아미노카르보닐, 알킬아미노카르보닐, 디알킬아미노카르보닐, 알케닐아미노카르보닐, 디알케닐아미노카르보닐, 시클로알킬아미노카르보닐, 알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, 알킬아미노술포닐, 디알킬아미노술포닐, 알킬술포시미노, 아미노티오카르보닐, 알킬아미노티오카르보닐, 디알킬아미노티오카르보닐을 나타내거나,

[0011] 또는 임의로 치환된 페닐알킬, 페녹시, 페닐알킬옥시, 페녹시알킬, 페닐티오, 페닐티오알킬, 페닐술피닐, 페닐술포닐, 헤타릴알킬, 헤타릴옥시, 헤타릴알킬옥시, 헤타릴티오, 헤타릴술피닐, 헤타릴술포닐을 나타내거나,

[0012] 또는 임의로 치환된 포화 또는 불포화된 시클로알킬알킬, 시클로알킬옥시, 시클로알킬알콕시, 시클로알킬티오, 시클로알킬알킬티오, 시클로알킬술피닐, 시클로알킬알킬술피닐, 시클로알킬술포닐, 시클로알킬알킬술포닐을 나타내거나,

[0013] 또는 NR^4R^5 (여기서, R^4 및 R^5 는 서로 독립적으로 수소, 시아노, 알킬, 할로알킬, 시아노알킬, 히드록시알킬, 알콕시알킬, 알킬티오알킬, 알케닐, 할로알케닐, 시아노알케닐, 알키닐, 할로알키닐, 시아노알키닐, 아실, 알콕시카르보닐을 나타내거나, 또는 R^4 및 R^5 는 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 임의로 치환된 포화 또는 불포화된 5- 내지 8-원 고리를 형성할 수 있음)를 나타내거나,

[0014] 또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있으며 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, 알킬, 할로알킬, 알케닐, 할로알케닐, 알키닐, 알콕시, 할로알콕시, 알킬티오, 알킬술피닐, 알킬술포닐, 알킬술포닐옥시, 할로알킬티오, 할로알킬술피닐, 할로알킬술포닐, 알킬아미노, 디알킬아미노, 알킬카르보닐아미노, 알콕시카르보닐, 알킬카르보닐, 알킬카르보닐옥시, 아미노카르보닐, 알킬아미노카르보닐, 디알킬아미노카르보닐, 아미노티오카르보닐, 알킬아미노티오카르보닐, 디알킬아미노티오카르보닐, 시클로알킬아미노, 알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, 알킬아미노술포닐 및 디알킬아미노술포닐로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 임의로 치환된 시클로알킬, 시클로알콕시, 시클로알킬알킬 또는 시클로알킬알콕시에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내거나,

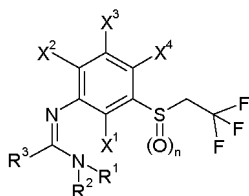
- [0015] 또는 X^2 및 X^3 또는 X^3 및 X^4 는 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 임의로 치환되며 O, S, N 및 CO로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 5- 또는 6-원 고리를 형성하고,
- [0016] R^3 은 수소, (C_2-C_8) -알킬, 시아노, 할로알킬, 알콕시알킬, 시아노알킬, 알킬티오알킬, 알케닐, 할로알케닐, 알키닐, 할로알키닐을 나타내거나,
- [0017] 또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있으며 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, 알킬, 할로알킬, 알케닐, 할로알케닐, 알키닐, 알콕시, 할로알콕시, 알킬티오, 알킬술피닐, 알킬술포닐, 알킬술포닐옥시, 할로알킬티오, 할로알킬술피닐, 할로알킬술포닐, 알킬아미노, 디알킬아미노, 알킬카르보닐아미노, 알콕시카르보닐, 알킬카르보닐, 알킬카르보닐옥시, 아미노카르보닐, 알킬아미노카르보닐, 디알킬아미노카르보닐, 아미노티오카르보닐, 알킬아미노티오카르보닐, 디알킬아미노티오카르보닐, 시클로알킬아미노, 알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, 알킬아미노술포닐 및 디알킬아미노술포닐로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 임의로 치환된 시클로알킬, 시클로알콕시, 시클로알킬알킬 또는 시클로알킬알콕시에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고,
- [0018] R^1 및 R^2 는 서로 독립적으로 수소, 시아노, 알킬, 할로알킬, 알콕시, 시아노알킬, 히드록시알킬, 알콕시알킬, 알킬티오알킬, 알케닐, 할로알케닐, 시아노알케닐, 알키닐, 할로알키닐, 시아노알키닐을 나타내고, 임의로 치환된 알킬카르보닐, 알콕시카르보닐, 아릴카르보닐, 헤타릴카르보닐, 아릴옥시카르보닐, 헤타릴옥시카르보닐, 알킬술피닐, 할로알킬술피닐, 아릴술피닐, 아릴알킬술피닐, 헤타릴술피닐, 헤타릴알킬술피닐, 알킬술포닐, 할로알킬술포닐, 아릴술포닐, 아릴알킬술포닐, 헤타릴술포닐, 헤타릴알킬술포닐을 나타내거나,
- [0019] 또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O, SO 또는 SO₂가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, 알킬, 할로알킬, 알케닐, 할로알케닐, 알키닐, 알콕시, 할로알콕시, 알킬티오, 알킬술피닐, 알킬술포닐, 알킬술포닐옥시, 할로알킬티오, 할로알킬술피닐, 할로알킬술포닐, 알킬아미노, 디알킬아미노, 알킬카르보닐아미노, 알콕시카르보닐, 알킬카르보닐, 알킬카르보닐옥시, 아미노카르보닐, 알킬아미노카르보닐, 디알킬아미노카르보닐, 아미노티오카르보닐, 알킬아미노티오카르보닐, 디알킬아미노티오카르보닐, 시클로알킬아미노, 알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, 알킬아미노술포닐 및 디알킬아미노술포닐로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 임의로 치환된 시클로알킬, 시클로알콕시, 시클로알킬알킬 또는 시클로알킬알콕시에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내거나,
- [0020] 또는 $-(CH_2)_m-R^6$, $-O-(CH_2)_m-R^6$, $-(CH_2)_m-O-R^6$ (여기서, R^6 은, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, 알킬, 할로알킬, 알케닐, 할로알케닐, 알키닐, 알콕시, 할로알콕시, 알킬티오, 알킬술피닐, 알킬술포닐, 알킬술포닐옥시, 할로알킬티오, 할로알킬술피닐, 할로알킬술포닐, 알킬아미노, 디알킬아미노, 알킬카르보닐아미노, 알콕시카르보닐, 알킬카르보닐, 알킬카르보닐옥시, 아미노카르보닐, 알킬아미노카르보닐, 디알킬아미노카르보닐, 아미노티오카르보닐, 알킬아미노티오카르보닐, 디알킬아미노티오카르보닐, 시클로알킬아미노, 알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, 알킬아미노술포닐 및 디알킬아미노술포닐로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 임의로 치환된 시클로알킬, 시클로알콕시, 시클로알킬알킬 또는 시클로알킬알콕시에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 여기서 m은 1, 2, 3 또는 4의 수를 나타냄)을 나타내거나, 또는
- [0021] R^1 및 R^2 는 또한 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 황, 산소 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1개 이상의 추가의 헤테로원자 및/또는 임의로 1개 이상의 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 및 임의로 치환된 4- 내지 8-원 고리를 형성할 수 있거나, 또는
- [0022] R^1 및 R^3 은 또한 이들이 부착되어 있는 원자와 함께, 황, 산소 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1개 이상의 추가의 헤테로원자 및/또는 임의로 1개 이상의 카르보

닐 기를 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 및 임의로 치환된 4- 내지 8-원 고리를 형성할 수 있다.

[0023] 적절한 경우에, 화학식 I의 화합물은 다양한 다형체 형태로 또는 상이한 다형체 형태의 혼합물로서 존재할 수 있다. 순수한 다형체 및 다형체 혼합물 둘 다가 본 발명에 의해 제공되고, 본 발명에 따라 사용될 수 있다.

[0024] 화학식 I의 화합물은 임의로 화학식 I의 화합물의 부분입체이성질체 또는 거울상이성질체 및 또한 회전이성질체, 호변이성질체 및 염을 포함한다.

[0025] 화학식 I의 화합물은 특히 E/Z 부분입체이성질체, 예컨대 예를 들어 하기를 포함한다.



[0026]

[0027] 본 발명에 따른 화합물의 일반적 정의는 화학식 I에 의해 제공된다. 상기 및 하기 제시된 화학식 하에 제공된 바람직한 치환기 또는 라디칼의 범위는 하기와 같이 정의된다:

[0028] 상기 식에서,

[0029] n은 바람직하게는 0, 1 또는 2의 수를 나타내고,

[0030] X^1 , X^2 , X^3 , X^4 는 서로 독립적으로 바람직하게는 수소, 할로젠, 히드록시, 아미노, OCN, SCN, SF_5 , 트리-(C_1-C_6)-알킬실릴, (C_1-C_6)-알킬, (C_1-C_6)-할로알킬, (C_1-C_6)-시아노알킬, (C_1-C_6)-히드록시알킬, 히드록시카르보닐-(C_1-C_4)-알콕시, (C_1-C_6)-알콕시카르보닐-(C_1-C_4)-알킬, (C_1-C_6)-알콕시-(C_1-C_6)-알킬, (C_2-C_6)-알케닐, (C_2-C_6)-할로알케닐, (C_2-C_6)-시아노알케닐, (C_2-C_6)-알키닐, (C_2-C_6)-할로알키닐, (C_2-C_6)-시아노알키닐, (C_1-C_6)-알콕시, (C_1-C_6)-할로알콕시, (C_1-C_6)-시아노알콕시, (C_1-C_7)-알콕시카르보닐-(C_1-C_6)-알콕시, (C_1-C_6)-알콕시-(C_1-C_6)-알콕시, (C_1-C_7)-알킬히드록시이미노, (C_1-C_7)-알콕시이미노, (C_1-C_6)-알킬-(C_1-C_7)-알콕시이미노, (C_1-C_6)-할로알킬-(C_1-C_7)-알콕시이미노, (C_1-C_6)-알킬티오, (C_1-C_6)-할로알킬티오, (C_1-C_6)-알콕시-(C_1-C_6)-알킬티오, (C_1-C_6)-알킬티오-(C_1-C_6)-알킬, (C_1-C_6)-알킬술피닐, (C_1-C_6)-할로알킬술피닐, (C_1-C_6)-알콕시-(C_1-C_6)-알킬술피닐, (C_1-C_6)-알킬술피닐-(C_1-C_6)-알킬, (C_1-C_6)-알킬술포닐, (C_1-C_6)-할로알킬술포닐, (C_1-C_6)-알콕시-(C_1-C_6)-알킬술포닐, (C_1-C_6)-알킬술포닐-(C_1-C_6)-알킬, (C_1-C_6)-알킬술포닐옥시, (C_1-C_7)-알킬카르보닐, (C_1-C_7)-할로알킬카르보닐, 카르복실, (C_1-C_7)-알킬카르보닐옥시, (C_1-C_7)-알콕시카르보닐, (C_1-C_7)-할로알콕시카르보닐, (C_1-C_7)-알콕시카르보닐-(C_1-C_6)-알킬, 아미노카르보닐, (C_1-C_7)-알킬아미노카르보닐, 디-(C_1-C_7)-알킬아미노카르보닐, (C_1-C_7)-알케닐아미노카르보닐, 디-(C_1-C_7)-알케닐아미노카르보닐, (C_3-C_8)-시클로알킬아미노카르보닐, (C_1-C_6)-알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, (C_1-C_6)-알킬아미노술포닐, 디-(C_1-C_6)-알킬아미노술포닐, (C_1-C_6)-알킬술포시미노, 아미노티오카르보닐, (C_1-C_6)-알킬아미노티오카르보닐, 디-(C_1-C_6)-알킬아미노티오카르보닐을 나타내거나,

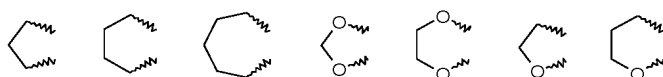
[0031] 또는, 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, (C_1-C_6)-알킬, (C_1-C_6)-할로알킬, (C_2-C_8)-알케닐, (C_2-C_8)-할로알케닐, (C_2-C_6)-알키닐, (C_1-C_6)-알콕시, (C_1-C_6)-할로알콕시, (C_1-C_6)-알킬티오, (C_1-C_6)-알킬술피닐, (C_1-C_6)-알킬술포닐, (C_1-C_6)-알킬술포닐옥시, (C_1-C_6)-할로알킬티오, (C_1-C_6)-할로알킬술피닐, (C_1-C_6)-할로알킬술포닐, (C_1-C_6)-알킬아미노, 디-(C_1-C_6)-알킬아미노, (C_1-C_7)-알킬카르보닐아미노, (C_1-C_7)-알콕시카르보닐, (C_1-C_7)-알킬카르보닐, (C_1-C_7)-알킬카르보닐옥시, 아미노카르보닐, (C_1-C_6)-알킬아미노카르보닐, 디-(C_1-C_6)-알킬아미노카르보닐, 아미노티오카르보닐, (C_1-C_6)-알킬아미노티오카르보닐, 디-(C_1-C_6)-알킬아미노티오카르보닐, (C_3-C_8)-시클로알킬아미노, (C_1-C_6)-알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, (C_1-C_6)-알킬아미노술포닐 및 디-(C_1-C_6)-알킬아미노술포닐로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 치환되며 0, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 헤테로원자가 임의로 개재된 임의로

포화 또는 불포화된 (C_3-C_8) -시클로알킬, (C_3-C_8) -시클로알콕시, (C_3-C_8) -시클로알킬- (C_1-C_6) -알킬 또는 (C_3-C_8) -시클로알킬- (C_1-C_6) -알콕시에 의해 치환된, 페닐- (C_1-C_6) -알킬, 페녹시, 페닐- (C_1-C_4) -알킬옥시, 페녹시- (C_1-C_4) -알킬, 페닐티오, 페닐티오- (C_1-C_4) -알킬, 페닐술피닐, 페닐술포닐, 헤타릴- (C_1-C_6) -알킬, 헤타릴옥시, 헤타릴- (C_1-C_4) -알킬옥시, 헤타릴티오, 헤타릴술피닐, 헤타릴술포닐, 임의로 포화 또는 불포화된 (C_3-C_8) -시클로알킬- (C_1-C_8) -알킬, (C_3-C_8) -시클로알킬옥시, (C_3-C_8) -시클로알킬- (C_1-C_6) -알콕시, (C_3-C_8) -시클로알킬티오, (C_3-C_8) -시클로알킬- (C_1-C_6) -알킬티오, (C_3-C_8) -시클로알킬술피닐, (C_3-C_8) -시클로알킬- (C_1-C_6) -알킬술피닐, (C_3-C_8) -시클로알킬술포닐, (C_3-C_8) -시클로알킬- (C_1-C_6) -알킬술포닐을 나타내거나,

[0032] 또는 NR^4R^5 (여기서, R^4 및 R^5 는 서로 독립적으로 수소, 시아노, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -할로알킬, (C_1-C_6) -시아노알킬, (C_1-C_6) -히드록시알킬, (C_1-C_6) -알콕시- (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -알킬- (C_1-C_6) -티오알킬, (C_2-C_8) -알케닐, (C_2-C_8) -할로알케닐, (C_2-C_8) -시아노알케닐, (C_2-C_8) -알키닐, (C_2-C_8) -할로알키닐, (C_2-C_8) -시아노알키닐, 아실, (C_1-C_7) -알콕시카르보닐을 나타내거나, 또는 R^4 및 R^5 는, 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 할로젠, 시아노, 히드록시, 아미노, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -할로알킬, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -할로알콕시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 할로젠, 시아노, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -할로알킬로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 치환되며 O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 (C_3-C_8) -시클로알킬 또는 (C_3-C_8) -시클로알킬- (C_1-C_6) -알킬에 의해 임의로 치환되고, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 포화 또는 불포화된 5- 내지 7-원 고리를 형성할 수 있음)를 나타내거나,

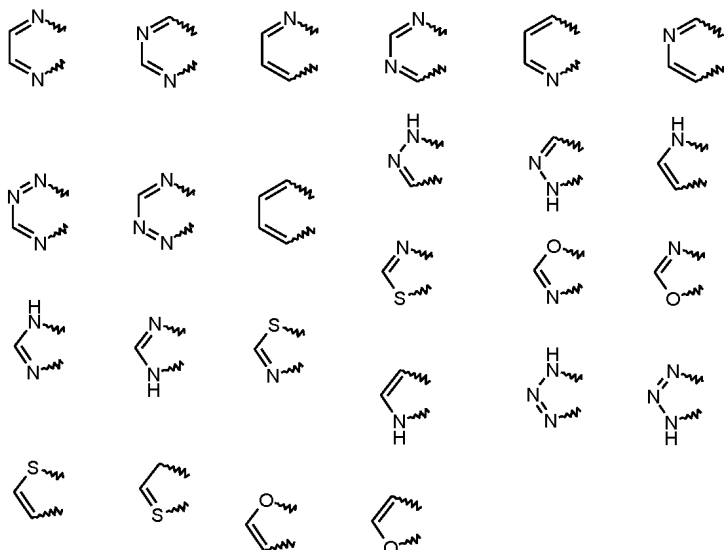
[0033] 또는, 할로젠, 시아노, 니트로, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -할로알킬, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -할로알콕시, (C_1-C_6) -알킬티오, (C_1-C_6) -알킬술피닐, (C_1-C_6) -알킬술포닐, (C_1-C_6) -알킬술포닐옥시, (C_1-C_6) -할로알킬티오, (C_1-C_6) -할로알킬술피닐, (C_1-C_6) -할로알킬술포닐로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 할로젠, 시아노, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -할로알킬에 의해 임의로 치환되며 O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 (C_3-C_8) -시클로알킬, (C_3-C_8) -시클로알콕시, (C_3-C_8) -시클로알킬- (C_1-C_6) -알킬 또는 (C_3-C_8) -시클로알킬- (C_1-C_6) -알콕시에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된, (C_3-C_8) -시클로알킬, (C_3-C_8) -시클로알콕시, (C_3-C_8) -시클로알킬티오, (C_3-C_8) -시클로알케닐, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아지닐, 티아졸릴, 티아디아졸릴, 옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 피라졸릴 또는 트리아졸릴을 나타내거나,

[0034] 또는 X^2 및 X^3 또는 X^3 및 X^4 는 할로젠, 시아노, (C_1-C_6) -알킬, (C_3-C_8) -시클로알킬, (C_1-C_6) -할로알킬, (C_3-C_8) -할로시클로알킬, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -할로알콕시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 치환된 하기 5- 또는 6-원 고리를 형성할 수 있거나,



[0035]

[0036] 또는 X^2 및 X^3 또는 X^3 및 X^4 는 수소, 할로젠, 시아노, (C_1-C_6) -알킬, (C_3-C_8) -시클로알킬, (C_1-C_6) -할로알킬, (C_3-C_8) -할로시클로알킬, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -할로알콕시, (C_1-C_6) -알콕시- (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -알킬티오, (C_1-C_6) -알킬술포닐, 아미노, (C_1-C_6) -알킬아미노, 디- (C_1-C_6) -알킬아미노 및 (C_3-C_8) -시클로알킬아미노로 이루어진 군으로부터 서로 독립적으로 선택될 수 있는 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된 하기 융합된 고리를 형성할 수 있고,



[0037]

[0038]

R^3 은 바람직하게는 수소, (C_2-C_6) -알킬, 시아노, (C_1-C_6) -할로알킬, (C_1-C_6) -알콕시- (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -시아노알킬, (C_1-C_6) -알킬티오- (C_1-C_6) -알킬, (C_2-C_6) -알케닐, (C_2-C_6) -할로알케닐, (C_2-C_6) -알키닐, (C_2-C_6) -할로알키닐을 나타내거나,

[0039]

또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있으며 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -할로알킬, (C_2-C_6) -알케닐, (C_2-C_6) -할로알케닐, (C_2-C_6) -알키닐, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -할로알콕시, (C_1-C_6) -알킬티오, (C_1-C_6) -알킬술피닐, (C_1-C_6) -알킬술포닐, (C_1-C_6) -알킬술포닐옥시, (C_1-C_6) -할로알킬티오, (C_1-C_6) -할로알킬술피닐, (C_1-C_6) -할로알킬술포닐, (C_1-C_6) -알킬아미노, 디- (C_1-C_6) -알킬아미노, (C_1-C_7) -알킬카르보닐아미노, (C_1-C_7) -알콕시카르보닐, (C_1-C_7) -알킬카르보닐, (C_1-C_7) -알킬카르보닐옥시, 아미노카르보닐, (C_1-C_7) -아릴아미노카르보닐, 디- (C_1-C_6) -알킬-아미노카르보닐, 아미노티오카르보닐, (C_1-C_6) -알킬아미노티오카르보닐, 디- (C_1-C_6) -알킬아미노티오카르보닐, (C_3-C_8) -시클로알킬아미노, (C_1-C_6) -알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, (C_1-C_6) -알킬아미노술포닐 및 디- (C_1-C_6) -알킬아미노술포닐로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환되거나, 또는 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -할로알킬, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -할로알콕시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 치환되며 O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 (C_3-C_8) -시클로알킬, (C_3-C_8) -시클로알콕시, (C_3-C_8) -시클로알킬- (C_1-C_6) -알킬 또는 (C_3-C_8) -시클로알킬- (C_1-C_6) -알콕시에 의해 치환된 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고,

[0040]

R^1 및 R^2 는 서로 독립적으로 바람직하게는 수소, 시아노, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -할로알킬, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -시아노알킬, (C_1-C_6) -히드록시알킬, (C_1-C_6) -알콕시- (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -알킬티오- (C_1-C_6) -알킬, (C_2-C_6) -알케닐, (C_2-C_6) -할로알케닐, (C_2-C_6) -시아노알케닐, (C_2-C_6) -알키닐, (C_2-C_6) -할로알키닐, (C_2-C_6) -시아노알키닐을 나타내거나,

[0041]

할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -할로알킬, (C_2-C_8) -알케닐, (C_2-C_8) -할로알케닐, (C_2-C_8) -알키닐, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -할로알콕시, (C_1-C_6) -알킬티오, (C_1-C_6) -알킬술피닐, (C_1-C_6) -알킬술포닐, (C_1-C_6) -알킬아미노, 디- (C_1-C_6) -알킬아미노로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 치환된, (C_1-C_6) -알킬카르보닐, (C_1-C_7) -알콕시카르보닐, 아릴카르보닐, 헤타릴카르보닐, 아릴옥시카르보닐, 헤타릴옥시카르보닐, (C_1-C_6) -알킬술피닐, (C_1-C_6) -할로알킬술피닐, 아릴술피닐, 아릴- (C_1-C_6) -알킬술피닐, 헤타릴술피닐, 헤타릴- (C_1-C_6) -알킬술피닐, (C_1-C_6) -알킬술포닐, (C_1-C_6) -할로알킬술포닐, 아릴

술포닐, 아릴-(C₁-C₆)-알킬술포닐, 헤타릴술포닐, 헤타릴-(C₁-C₆)-알킬술포닐을 나타내거나,

[0042] 또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O, SO 또는 SO₂가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-할로알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-할로알콕시, (C₁-C₆)-알킬티오, (C₁-C₆)-알킬술피닐, (C₁-C₆)-알킬술포닐, (C₁-C₆)-알킬술포닐옥시, (C₁-C₆)-할로알킬티오, (C₁-C₆)-할로알킬술피닐, (C₁-C₆)-할로알킬술포닐, (C₁-C₆)-알킬아미노, 디-(C₁-C₆)-알킬아미노, (C₁-C₇)-알킬카르보닐아미노, (C₁-C₇)-알콕시카르보닐, (C₁-C₇)-알킬카르보닐, (C₁-C₇)-알킬카르보닐옥시, 아미노카르보닐, (C₁-C₇)-아릴아미노카르보닐, 디-(C₁-C₇)-알킬아미노카르보닐, 아미노티오카르보닐, (C₁-C₇)-알킬아미노티오카르보닐, 디-(C₁-C₇)-알킬아미노티오카르보닐, (C₃-C₈)-시클로알킬아미노, (C₁-C₆)-알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, (C₁-C₆)-알킬아미노술포닐 및 디-(C₁-C₆)-알킬아미노술포닐로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 (C₃-C₈)-시클로알킬, (C₃-C₈)-시클로알콕시, (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알킬 또는 (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알콕시에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내거나,

[0043] 또는 -(CH₂)_m-R⁶, -O-(CH₂)_m-R⁶, -(CH₂)_m-O-R⁶ (여기서, R⁶은, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-할로알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-할로알콕시, (C₁-C₆)-알킬티오, (C₁-C₆)-알킬술피닐, (C₁-C₆)-알킬술포닐, (C₁-C₆)-알킬술포닐옥시, (C₁-C₆)-할로알킬티오, (C₁-C₆)-할로알킬술피닐, (C₁-C₆)-할로알킬술포닐, (C₁-C₆)-알킬아미노, 디-(C₁-C₆)-알킬아미노, (C₁-C₇)-알킬카르보닐아미노, (C₁-C₇)-알콕시카르보닐, (C₁-C₇)-알킬카르보닐, (C₁-C₇)-알킬카르보닐옥시, 아미노카르보닐, (C₁-C₇)-알킬아미노카르보닐, 디-(C₁-C₇)-알킬아미노카르보닐, 아미노티오카르보닐, (C₁-C₇)-알킬아미노티오카르보닐, 디-(C₁-C₇)-알킬아미노티오카르보닐, (C₃-C₈)-시클로알킬아미노, (C₁-C₆)-알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, (C₁-C₆)-알킬아미노술포닐 또는 디-(C₁-C₆)-알킬아미노술포닐로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 할로젠, 시아노, 니트로, 히드록시, 아미노, 카르복시, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₂-C₈)-알케닐, (C₂-C₈)-할로알케닐, (C₂-C₈)-알키닐, (C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-할로알콕시, (C₁-C₆)-알킬티오, (C₁-C₆)-알킬술피닐, (C₁-C₆)-알킬술포닐, (C₁-C₆)-알킬술포닐옥시, (C₁-C₆)-할로알킬티오, (C₁-C₆)-할로알킬술피닐, (C₁-C₆)-할로알킬술포닐, (C₁-C₆)-알킬아미노, 디-(C₁-C₆)-알킬아미노, (C₁-C₇)-알킬카르보닐아미노, (C₁-C₇)-알콕시카르보닐, (C₁-C₇)-알킬카르보닐, (C₁-C₇)-알킬카르보닐옥시, 아미노카르보닐, (C₁-C₆)-알킬아미노카르보닐, 디-(C₁-C₆)-알킬아미노카르보닐, 아미노티오카르보닐, (C₁-C₆)-알킬아미노티오카르보닐, 디-(C₁-C₆)-알킬아미노티오카르보닐, (C₃-C₈)-시클로알킬아미노, (C₁-C₆)-알킬술포닐아미노, 아미노술포닐, (C₁-C₆)-알킬아미노술포닐 또는 디-(C₁-C₆)-알킬아미노술포닐에 의해 임의로 치환되며 O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 개재된 (C₃-C₈)-시클로알킬, (C₃-C₈)-시클로알콕시, (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알킬 및 (C₃-C₈)-시클로알킬-(C₁-C₆)-알콕시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 여기서 m은 1, 2 또는 3의 수를 나타냄)을 나타내거나, 또는

[0044] R¹ 및 R²는 이들이 부착되어 있는 원자와 함께, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-알콕시, 할로젠, (C₁-C₄)-할로알킬에 의해 임의로 일치환 또는 다치환되며 황, 산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 추가의 헤테로원자 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및/또는 1개 이상의 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 4- 내지 8-원 고리를 형성할 수 있고,

[0045] R¹ 및 R³은 이들이 부착되어 있는 원자와 함께, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-알콕시, 할로젠, (C₁-C₄)-할로알킬,

시아노, (C₃-C₆)-시클로알킬, (C₃-C₆)-할로시클로알킬, (C₃-C₆)-시아노시클로알킬, (C₁-C₂)-알킬-(C₃-C₆)-시클로알킬, (C₂-C₄)-알칸디일, (C₂-C₄)-알켄디일, 부탄디에닐 (여기서, 알칸디일, 알켄디일 및 부탄디에닐은 (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-알콕시, 할로젠, (C₁-C₄)-할로알킬에 의해 임의로 치환될 수 있고/거나 1개 이상의 산소 또는/및 질소 원자가 임의로 개재될 수 있음)로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환되며 황, 산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 추가의 헤테로원자 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및/또는 1개 이상의 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 4- 내지 8-원 포화 또는 불포화된 고리를 형성할 수 있다.

[0046] 본 발명에 따른 화합물의 일반적 정의는 화학식 I에 의해 제공된다. 상기 및 하기 제시된 화학식 하에 제공된 특히 바람직한 치환기 또는 라디칼의 범위는 하기에 정의된다:

[0047] 상기 식에서,

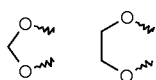
[0048] n은 특히 바람직하게는 0 또는 1의 수를 나타내고,

[0049] X¹, X², X³, X⁴는 서로 독립적으로 특히 바람직하게는 수소, 플루오린, 염소, 브로민, 아이오딘, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₂-C₄)-알케닐, (C₂-C₄)-알키닐, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-할로알콕시, 아미노티오키르보닐을 나타내거나,

[0050] 또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-할로알콕시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해, 또는 O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 헤테로원자가 임의로 개재된 임의로 포화 또는 불포화된 (C₃-C₆)-시클로알킬에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, 페닐-(C₁-C₄)-알킬, 페녹시, 헤타릴-(C₁-C₄)-알킬, 헤타릴옥시, 임의로 포화 또는 불포화된 (C₃-C₆)-시클로알킬-(C₁-C₄)-알킬, (C₃-C₆)-시클로알킬옥시, (C₃-C₆)-시클로알킬-(C₁-C₄)-알콕시를 나타내거나,

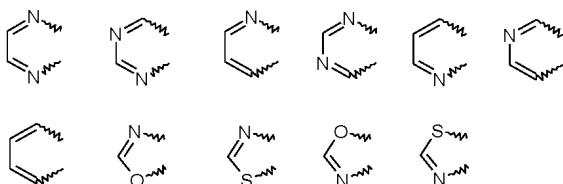
[0051] 또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-할로알콕시, (C₃-C₆)-시클로알킬로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, (C₃-C₆)-시클로알킬, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아지닐, 티아졸릴, 티아디아졸릴, 옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 피라졸릴, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타내거나,

[0052] 또는 X² 및 X³ 또는 X³ 및 X⁴는 플루오린 또는 (C₁-C₄)-알킬에 의해 임의로 일치환 내지 사치환된 하기 5- 또는 6-원 고리를 형성할 수 있거나,



[0053]

[0054] 또는 X² 및 X³ 또는 X³ 및 X⁴는 수소, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, (C₁-C₄)-알킬, (C₃-C₆)-시클로알킬, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-할로알콕시로 이루어진 군으로부터 서로 독립적으로 선택될 수 있는 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된 하기 융합된 고리를 형성할 수 있고,



[0055]

[0056] R³은 특히 바람직하게는 수소, (C₂-C₄)-알킬, 시아노, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₁-C₄)-알콕시-(C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-시아노알킬을 나타내거나,

[0057] 또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있으며 플루오린, 염

소, 브로민, 아이오딘, 시아노, 니트로, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₂-C₄)-알케닐, (C₂-C₄)-알키닐, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-할로알콕시로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환되거나 또는 (C₃-C₆)-시클로알킬에 의해 치환된 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고,

[0058] R¹ 및 R²는 서로 독립적으로 특히 바람직하게는 수소, 시아노, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-시아노알킬, (C₁-C₄)-히드록시알킬, (C₁-C₄)-알콕시-(C₁-C₄)-알킬, (C₂-C₄)-알케닐, (C₂-C₄)-알키닐을 나타내거나,

[0059] 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₂-C₄)-알케닐, (C₂-C₄)-할로알케닐, (C₂-C₄)-알키닐, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-할로알콕시, (C₁-C₄)-알킬티오, (C₁-C₄)-알킬술피닐, (C₁-C₄)-알킬술포닐, (C₁-C₄)-알킬아미노, 디-(C₁-C₄)-알킬아미노로 이루어진 군으로부터의 치환기에 의해 서로 독립적으로 임의로 일치환 내지 삼치환된, (C₁-C₄)-알킬카르보닐, (C₁-C₅)-알콕시카르보닐, 아릴카르보닐, 티오펜카르보닐, 피리딜카르보닐, 피리미딜카르보닐, 티아졸릴카르보닐, 피라졸릴카르보닐, (C₁-C₄)-알킬술피닐, (C₁-C₄)-할로알킬술피닐, 아릴술피닐, 아릴-(C₁-C₄)-알킬술피닐, 헤타릴술피닐, 헤타릴-(C₁-C₄)-알킬술피닐, (C₁-C₄)-알킬술포닐, (C₁-C₄)-할로알킬술포닐, 아릴술포닐, 아릴-(C₁-C₄)-알킬술포닐, 헤타릴술포닐, 헤타릴-(C₁-C₄)-알킬술포닐을 나타내거나,

[0060] 또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₂-C₄)-알케닐, (C₂-C₄)-알키닐, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-할로알콕시 또는 (C₃-C₆)-시클로알킬로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환된 3- 내지 6-원 포화 또는 방향족 고리를 나타내거나,

[0061] 또는 -(CH₂)_m-R⁶, -(CH₂)_m-O-R⁶ (여기서, R⁶은, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-할로알킬, (C₂-C₄)-알케닐, (C₂-C₄)-알키닐, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-할로알콕시 또는 (C₃-C₆)-시클로알킬로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환된 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 여기서 m은 1 또는 2의 수를 나타냄)을 나타내거나, 또는

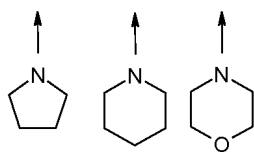
[0062] R¹ 및 R²는 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 플루오린, 염소, (C₁-C₄)-알킬, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-할로알킬에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환되며 황, 산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 추가의 헤테로원자 및/또는 1개 이상의 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 3- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있고,

[0063] R¹ 및 R³은 이들이 부착되어 있는 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 시클로프로필, 시아노, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 메틸시클로프로필, (C₂-C₄)-알칸디일, (C₂-C₄)-알켄디일 및 부탄디에닐 (여기서, 부탄디에닐은 메틸, 플루오린, 염소, 브로민, 메톡시 또는 트리플루오로메틸에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고/거나 1개 이상의 산소 또는/및 질소 원자가 임의로 개재될 수 있음)에 의해 임의로 일치환 또는 다치환되며 추가의 황 또는 산소 또는 질소 원자 및/또는 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 5- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있다.

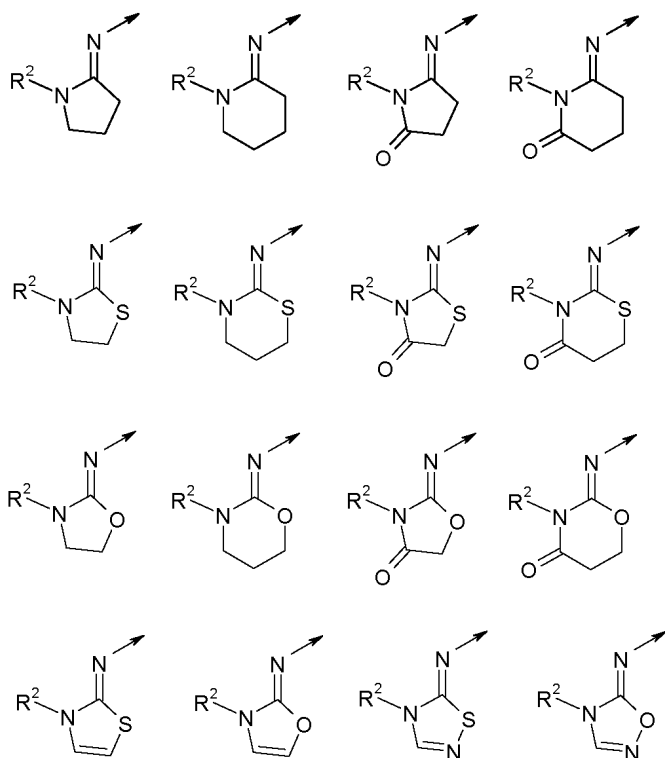
[0064] 본 발명에 따른 화합물의 일반적 정의는 화학식 I에 의해 제공된다. 상기 및 하기 제시된 화학식 하에 제공된 매우 특히 바람직한 치환기 또는 라디칼의 범위는 하기에 정의된다:

[0065] 상기 식에서,

- [0066] n은 매우 특히 바람직하게는 0 또는 1의 수를 나타내고,
- [0067] X^1 및 X^3 은 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타내고,
- [0068] X^2 및 X^4 는 매우 특히 바람직하게는 서로 독립적으로 수소, 플루오린, 염소, 브로민, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, OCH_2CF_3 을 나타내고,
- [0069] 특별히 바람직하게는, X^2 및 X^4 는 하기 조합 X^2/X^4 : F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, 메틸/메틸, 메틸/F, F/메틸, 메틸/Cl, Cl/메틸, 메틸/Br, Br/메틸, 에틸/에틸, 에틸/F, F/에틸, 에틸/Cl, Cl/에틸, 에틸/Br, Br/에틸을 나타내고,
- [0070] R^3 은 매우 특히 바람직하게는 수소, 에틸, 프로필, 시아노, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 디클로로메틸, 클로로메틸, 트리클로로메틸, 디플루오로클로로메틸, 디클로로플루오로메틸, (2,2,2)-트리플루오로에틸, 2-클로로-(2,2)-디플루오로에틸, (2,2)-디클로로-2-플루오로에틸, (2,2,2)-트리클로로에틸, 펜타플루오로에틸을 나타내거나,
- [0071] 또는 아틸을 나타내고, 특별히 바람직하게는 페닐을 나타내고,
- [0072] R^1 은 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, 프로필, 부틸, sec-부틸, 이소프로필, tert-부틸, (2,2,2)-트리플루오로에틸, (2,2)-디플루오로메틸, 메톡시, 에톡시, 메톡시메틸, 메톡시에틸을 나타내거나,
- [0073] 또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환된 아틸을 나타내고, 특별히, 매우 특히 바람직한 것 하에 언급된 치환기에 의해 임의로 치환될 수 있는 페닐이 명확하게 언급되거나,
- [0074] 또는 $-(\text{CH}_2)_m-R^6$ (여기서, R^6 은 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환, 이치환 또는 삼치환된 아틸을 나타내고, 여기서 m은 1의 수를 나타내고, 특별히, 매우 특히 바람직한 것 하에 언급된 치환기에 의해 임의로 치환될 수 있는 페닐이 R^6 에 대해 명확하게 언급됨)을 나타내고,
- [0075] R^2 는 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸 또는 에틸을 나타내거나, 또는
- [0076] R^1 및 R^2 는 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 산소 원자를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 5- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있고, 특별히 하기 고리가 명확하게 언급되고,



- [0077]
- [0078] 식 중, R^1 및 R^2 에 부착되어 있는 질소 원자는 사이클을 나타내고, 화살표는 분자의 나머지를 나타내고,
- [0079] R^1 및 R^3 은 이들이 부착되어 있는 원자와 함께, 포화 또는 불포화된 5- 내지 6-원 고리, 및/또는 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 시아노, 시클로프로필, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 메틸시클로프로필, (C_3-C_4) -알칸디일, (C_3-C_4) -알켄디일 및 부탄디에닐 (여기서, 부탄디에닐은 메틸, 플루오린, 염소, 브로민, 메톡시 또는 트리플루오로메틸에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고/거나 1개 이상의 산소 또는/및 질소 원자가 임의로 개재될 수 있음)에 의해 임의로 일치환 또는 이치환되며 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 5- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있고, 특별히 R^1 및 R^3 은 이들이 부착되어 있는 원자와 함께 하기 기를 나타내고,



[0080]

[0081]

이들 각각은 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 시클로프로필, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 메틸시클로프로필에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고,

[0082]

식 중, 화살표는 분자의 나머지를 나타낸다.

[0083]

본 발명에 따른 화합물의 일반적 정의는 화학식 I에 의해 제공된다. 마찬가지로 상기 및 하기 제시된 화학식 하에 제공된 매우 특히 바람직한 치환기 또는 라디칼의 범위는 하기에 정의된다:

[0084]

n 은 매우 특히 바람직하게는 0 또는 1의 수를 나타내고,

[0085]

X^1 및 X^3 은 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타내고,

[0086]

X^2 및 X^4 는 매우 특히 바람직하게는 서로 독립적으로 수소, 플루오린, 염소, 브로민, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 비닐, 에틸, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, OCH_2CF_3 , 아미노 디오텐카르보닐을 나타내거나,

[0087]

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, 페닐메틸, 페녹시, 피리딜메틸, 피리미딜메틸, 티아졸릴메틸, 피라졸릴메틸, 피리딜옥시, 피리미딜옥시, 티아졸릴옥시, 피라졸릴옥시, 시클로프로필메틸, 시클로프로필메톡시를 나타내거나,

[0088]

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, (C_3-C_6) -시클로알킬, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아지닐, 티아졸릴, 티아디아졸릴, 옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 피라졸릴, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타내고,

[0089]

특별히 바람직하게는, X^2 및 X^4 는 하기 조합 X^2/X^4 : F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, 메틸/메틸, 메틸/F, F/메틸, 메틸/Cl, Cl/메틸, 메틸/Br, Br/메틸, 에틸/에틸, 에틸/F, F/에틸, 에틸/Cl, Cl/에틸, 에틸/Br, Br/에틸, 메톡시/메틸, 메틸/메톡시, 메틸/H, 에틸/H, 염소/H, 브로민/H, 플루오린/H, 메톡시/H, H/염소, H/플루오린, H/브로민, H/메틸, H/메톡시, H/에틸을 나타내고,

[0090] R^3 은 매우 특히 바람직하게는 수소, 에틸, 프로필, 시아노, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 디클로로메틸, 트리클로로메틸, 디플루오로클로로메틸, 디클로로플루오로메틸, (2,2,2)-트리플루오로에틸, 2-클로로-(2,2)-디플루오로에틸, (2,2)-디클로로-2-플루오로에틸, (2,2,2)-트리클로로에틸, 펜타플루오로에틸, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 시아노메틸, 알릴, 부테닐을 나타내거나,

[0091] 또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있으며 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 특별히 하기 고리: 매우 특히 바람직한 것 하에 언급된 치환기에 의해 임의로 치환될 수 있는, 시클로프로필, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 티아졸릴, 피라졸릴 및 티에닐이 명확하게 언급되고,

[0092] R^1 은 매우 특히 바람직하게는

[0093] 시아노, 시아노메틸, 메틸카르보닐, 에틸카르보닐, 프로필카르보닐, 이소프로필카르보닐, 메톡시카르보닐, 에톡시카르보닐을 나타내거나,

[0094] 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 트리플루오로메틸, 알릴, 부테닐, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 메틸티오, 메틸술피닐, 메틸술포닐, 메틸아미노, 디메틸아미노에 의해 서로 독립적으로 임의로 일치환 또는 이치환된, 아릴카르보닐, 피리딜카르보닐, 피리미딜카르보닐, 티아졸릴카르보닐, 피라졸릴카르보닐, 메틸술피닐, 트리플루오로메틸술피닐, 메틸술포닐, 트리플루오로메틸술포닐을 나타내거나,

[0095] 또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환될 수 있는, 옥세타닐, 티에타닐, 트리메틸렌술포닐, 트리메틸렌술피닐, 옥사닐 또는 티아닐을 나타내거나,

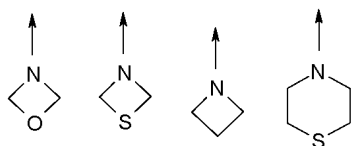
[0096] 또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환된, 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실을 나타내고,

[0097] R^2 은 매우 특히 바람직하게는 수소, 메틸 또는 에틸을 나타내거나, 또는

[0098] R^1 및 R^2 은 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸에 의해 임의로 일치환, 이치환, 삼치환 또는 사치환되며 황 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 추가의 헤테로원자를 함유하는 포화 또는 불포화된 3- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있거나,

[0099] 또는, 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸에 의해 임의로 일치환, 이치환, 삼치환 또는 사치환되며 산소, 황 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1개의 추가의 헤테로원자를 임의로 함유하는 포화 또는 불포화된 4-원 고리를 형성할 수 있고,

[0100] 특별히 하기 고리가 명확하게 언급되고,



[0101]

[0102] 식 중, R^1 및 R^2 가 부착되어 있는 질소 원자는 사이클을 나타내고, 화살표는 분자의 나머지를 나타내고, 이들은 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있다.

[0103] 본 발명에 따른 화합물의 일반적 정의는 화학식 I에 의해 제공된다. 마찬가지로 상기 및 하기 제시된 화학식

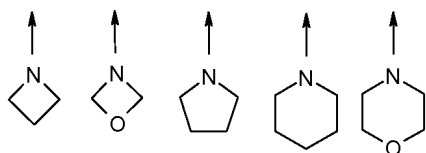
하에 제공된 매우 특히 바람직한 치환기 또는 라디칼의 범위는 하기에 정의된다:

- [0104] 상기 식에서,
- [0105] n은 매우 특히 바람직하게는 0 또는 1의 수를 나타내고,
- [0106] X^1 및 X^3 은 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타내고,
- [0107] X^2 및 X^4 는 매우 특히 바람직하게는 서로 독립적으로 수소, 플루오린, 염소, 브로민, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, OCH_2CF_3 , 아미노 티오펜을 나타내거나,
- [0108] 또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, 페닐메틸, 페녹시, 피리디메틸, 피리미디메틸, 티아졸릴메틸, 피라졸릴메틸, 피리디옥시, 피리미디옥시, 티아졸릴옥시, 피라졸릴옥시, 시클로프로필메틸, 시클로프로필메톡시를 나타내거나,
- [0109] 또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, (C_3-C_6) -시클로알킬, 페닐, 피리디, 피리미디, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아지닐, 티아졸릴, 티아디아졸릴, 옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 피라졸릴, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타내고,
- [0110] 특별히 바람직하게는, X^2 및 X^4 는 하기 조합 X^2/X^4 : F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, 메틸/메틸, 메틸/F, F/메틸, 메틸/Cl, Cl/메틸, 메틸/Br, Br/메틸, 에틸/에틸, 에틸/F, F/에틸, 에틸/Cl, Cl/에틸, 에틸/Br, Br/에틸, 메톡시/메틸, 메틸/메톡시, 메틸/H, 에틸/H, 염소/H, 브로민/H, 플루오린/H, 메톡시/H, H/염소, H/플루오린, H/브로민, H/메틸, H/메톡시, H/에틸을 나타내고,
- [0111] R^3 은 매우 특히 바람직하게는 메톡시메틸, 메톡시에틸, 시아노메틸, 알릴, 부테닐, 옥솔라닐, 펜탄디에닐, 부타디에닐을 나타내거나,
- [0112] 또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 다치환될 수 있는, 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 피리디, 피리미디, 피라지닐, 피리다지닐, 피롤릴, 푸라닐, 티아졸릴, 피라졸릴 또는 티에닐을 나타내거나,
- [0113] 또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 일치환 또는 다치환된 아릴, 특히 페닐을 나타내고,
- [0114] R^1 및 R^2 는 매우 특히 바람직하게는 서로 독립적으로 수소, 시아노, 메틸, 에틸, 프로필, 부틸, sec-부틸, 이소프로필, tert-부틸, (2,2,2)-트리플루오로에틸, (2,2)-디플루오로메틸, 메톡시, 에톡시, 시아노메틸, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 알릴, 부테닐, 프로피닐, 메틸카르보닐, 에틸카르보닐, 프로필카르보닐, 이소프로필카르보닐, 메톡시카르보닐, 에톡시카르보닐을 나타내거나,
- [0115] 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 트리플루오로메틸, 알릴, 부테닐, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 메틸티오, 메틸술피닐, 메틸술포닐, 메틸아미노, 디메틸아미노에 의해 서로 독립적으로 임의로 일치환 또는 이치환된, 아릴카르보닐, 피리디카르보닐, 피리미디카르보닐, 티아졸릴카르보닐, 피라졸릴카르보닐, 메틸술피닐, 트리플루오로메틸술피닐, 메틸술포닐, 트리플루오로메틸술포닐을 나타내거나,
- [0116] 또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1, 2 또는 3회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 특별히 하기 고리: 매우 특히 바람직한 것 하에 언급된 치환기에 의해 임의로 치환될 수 있는, 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 옥세탄, 페닐, 티에닐 및 피리디이 명

확하게 언급되거나,

[0117] 또는 $-(CH_2)_m-R^6$ (여기서, R^6 은, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환, 이치환 또는 삼치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 여기서 m은 1의 수를 나타내고, 특별히 하기 R^6 : 매우 특히 바람직한 것 하에 언급된 치환기에 의해 임의로 치환될 수 있는, 시클로프로필, 페닐 및 피리딜이 명확하게 언급됨)을 나타내거나, 또는

[0118] R^1 및 R^2 는 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸에 의해 임의로 일치환, 이치환, 삼치환 또는 사치환되며 황, 산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 추가의 헤테로원자 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및/또는 카르보닐 기에 의해 대체되는 1개 이상의 CH_2 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 3- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있고, 특별히 하기 고리가 명확하게 언급되고:



[0119]

[0120] 식 중, R^1 및 R^2 가 부착되어 있는 질소 원자는 사이클을 나타내고, 화살표는 분자의 나머지를 나타내고, 이들은 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있다.

[0121] 본 발명에 따른 화합물의 일반적 정의는 화학식 I에 의해 제공된다. 마찬가지로 상기 및 하기 제시된 화학식 하에 제공된 매우 특히 바람직한 치환기 또는 라디칼의 범위는 하기에 정의된다:

[0122] n은 매우 특히 바람직하게는 0 또는 1의 수를 나타내고,

[0123] X^1 및 X^3 은 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타내고,

[0124] X^2 및 X^4 는 매우 특히 바람직하게는 하기 조합 X^2/X^4 : 비닐/H, H/비닐, 에티닐/H, H/에티닐, 메톡시/H, H/메톡시, 에톡시/H, H/에톡시, 아미노티오키아르보닐/H, H/아미노티오키아르보닐, 비닐/메틸, 메틸/비닐, 에티닐/메틸, 메틸/에티닐, 메톡시/메틸, 메틸/메톡시, 에톡시/메틸, 메틸/에톡시, 아미노티오키아르보닐/메틸, 메틸/아미노티오키아르보닐, 비닐/F, F/비닐, 에티닐/F, F/에티닐, 메톡시/F, F/메톡시, 에톡시/F, F/에톡시, 아미노티오키아르보닐/F, F/아미노티오키아르보닐, 비닐/Cl, Cl/비닐, 에티닐/Cl, Cl/에티닐, 메톡시/Cl, Cl/메톡시, 에톡시/Cl, Cl/에톡시, 아미노티오키아르보닐/Cl, Cl/아미노티오키아르보닐을 나타내거나,

[0125] 또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, 페닐메틸, 페녹시, 피리딜메틸, 피리미딜메틸, 티아졸릴메틸, 피라졸릴메틸, 피리딜옥시, 피리미딜옥시, 티아졸릴옥시, 피라졸릴옥시, 시클로프로필메틸, 시클로프로필메톡시를 나타내거나,

[0126] 또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, (C_3-C_6) -시클로알킬, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아지닐, 티아졸릴, 티아디아졸릴, 옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 피라졸릴, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타내고,

[0127] R^3 은 매우 특히 바람직하게는 수소, 에틸, 프로필, 시아노, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 디클로로메틸, 트리클로로메틸, 디플루오로클로로메틸, 디클로로플루오로메틸, (2,2,2)-트리플루오로에틸, 2-클로로-(2,2)-디플루오로에틸, (2,2)-디클로로-2-플루오로에틸, (2,2,2)-트리클로로에틸, 펜타플루오로에틸, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 시아노메틸, 알릴, 부테닐을 나타내거나,

[0128] 또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 3개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있으며 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 특별히 하기 고리: 매우 특히 바람직한 것 하에 언급된 치환기에 의해 임의로 치환될 수 있는, 시클로프로필, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 티아졸릴, 피라졸릴 및 티에닐이 명확하게 언급되고,

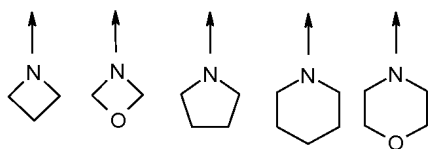
[0129] R^1 및 R^2 는 매우 특히 바람직하게는 서로 독립적으로 수소, 시아노, 메틸, 에틸, 프로필, 부틸, sec-부틸, 이소프로필, tert-부틸, (2,2,2)-트리플루오로에틸, (2,2)-디플루오로메틸, 메톡시, 에톡시, 시아노메틸, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 알릴, 부테닐, 프로피닐, 메틸카르보닐, 에틸카르보닐, 프로필카르보닐, 이소프로필카르보닐, 메톡시카르보닐, 에톡시카르보닐을 나타내거나,

[0130] 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 트리플루오로메틸, 알릴, 부테닐, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 메틸티오, 메틸술피닐, 메틸술폰닐, 메틸아미노, 디메틸아미노에 의해 서로 독립적으로 임의로 일치환 또는 이치환된, 알릴카르보닐, 피리딜카르보닐, 피리미딜카르보닐, 티아졸릴카르보닐, 피라졸릴카르보닐, 메틸술피닐, 트리플루오로메틸술피닐, 메틸술폰닐, 트리플루오로메틸술폰닐을 나타내거나,

[0131] 또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1, 2 또는 3회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 특별히 하기 고리: 매우 특히 바람직한 것 하에 언급된 치환기에 의해 임의로 치환될 수 있는, 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 옥세탄, 페닐, 티에닐 및 피리딜이 명확하게 언급되거나,

[0132] 또는 $-(CH_2)_m-R^6$ (여기서, R^6 은, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에티닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환, 이치환 또는 삼치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 여기서 m은 1의 수를 나타내고, 특별히 하기 R^6 : 매우 특히 바람직한 것 하에 언급된 치환기에 의해 임의로 치환될 수 있는, 시클로프로필, 페닐 및 피리딜이 명확하게 언급됨)을 나타내거나, 또는

[0133] R^1 및 R^2 는 이들이 부착되어 있는 질소 원자와 함께, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸에 의해 임의로 일치환, 이치환, 삼치환 또는 사치환되며 황, 산소 및 질소로 이루어진 군으로부터의 1 또는 2개의 추가의 헤테로원자 (여기서, 산소 원자는 서로 직접적으로 인접하지 않아야 함) 및/또는 카르보닐 기에 의해 대체되는 1개 이상의 CH_2 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 3- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있고, 특별히 하기 고리가 명확하게 언급되고,

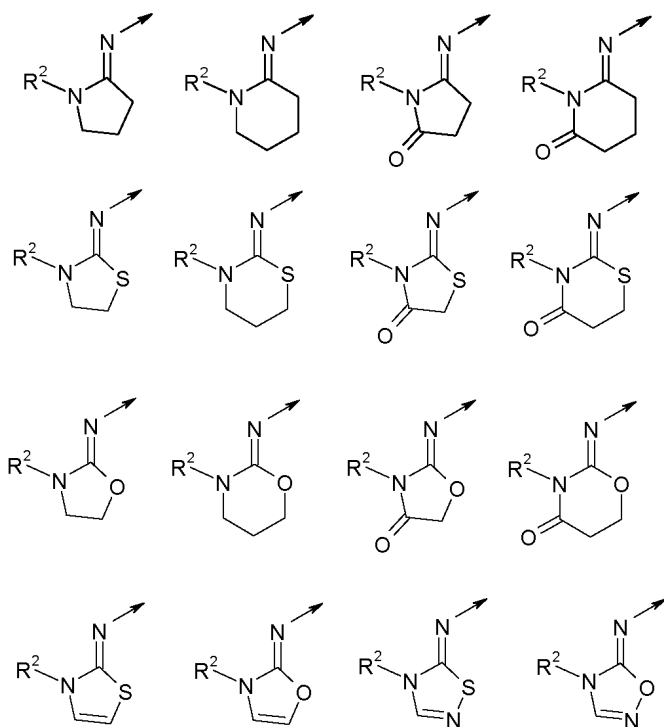


[0134]

[0135] 식 중, R^1 및 R^2 가 부착되어 있는 질소 원자는 사이클을 나타내고, 화살표는 분자의 나머지를 나타내고, 이들은 임의로 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 브로민, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸에 의해 일치환 또는 이치환될 수 있고,

[0136] R^1 및 R^3 은 이들이 부착되어 있는 원자와 함께, 포화 또는 불포화된 5- 내지 6-원 고리, 및/또는 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 시아노, 시클로프로필, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 메틸시클로프로필, (C_3-C_4) -알칸디일, (C_3-C_4) -알켄디일 및 부탄디에닐 (여기서, 부탄디에닐은 메틸, 플루오린, 염소, 브로민, 메톡시 또는 트리플루오로메틸

에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고/거나 1개 이상의 산소 또는/및 질소 원자가 임의로 개재될 수 있음)에 의해 임의로 일치환 또는 이치환되며 추가의 황 또는 산소 또는 질소 원자 및/또는 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 5- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있고, 특별히 R^1 및 R^3 은 이들이 부착되어 있는 원자와 함께 하기 기를 나타내고,



[0137]

[0138]

이들 각각은 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 시클로프로필, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 메틸시클로프로필에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고,

[0139]

식 중, 화살표는 분자의 나머지를 나타낸다.

[0140]

본 발명에 따른 화합물의 일반적 정의는 화학식 I에 의해 제공된다. 마찬가지로 상기 및 하기 제시된 화학식 하에 제공된 매우 특히 바람직한 치환기 또는 라디칼의 범위는 하기에 정의된다:

[0141]

n 은 매우 특히 바람직하게는 0 또는 1의 수를 나타내고,

[0142]

X^1 및 X^3 은 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타내고,

[0143]

X^2 및 X^4 는 매우 특히 바람직하게는 서로 독립적으로 수소, 플루오린, 염소, 브로민, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 비닐, 에틸닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, OCH_2CF_3 , 아미노 티오카르보닐을 나타내거나,

[0144]

또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, 페닐메틸, 페녹시, 피리딜메틸, 피리미딜메틸, 티아졸릴메틸, 피라졸릴메틸, 피리딜옥시, 피리미딜옥시, 티아졸릴옥시, 피라졸릴옥시, 시클로프로필메틸, 시클로프로필메톡시를 나타내거나,

[0145]

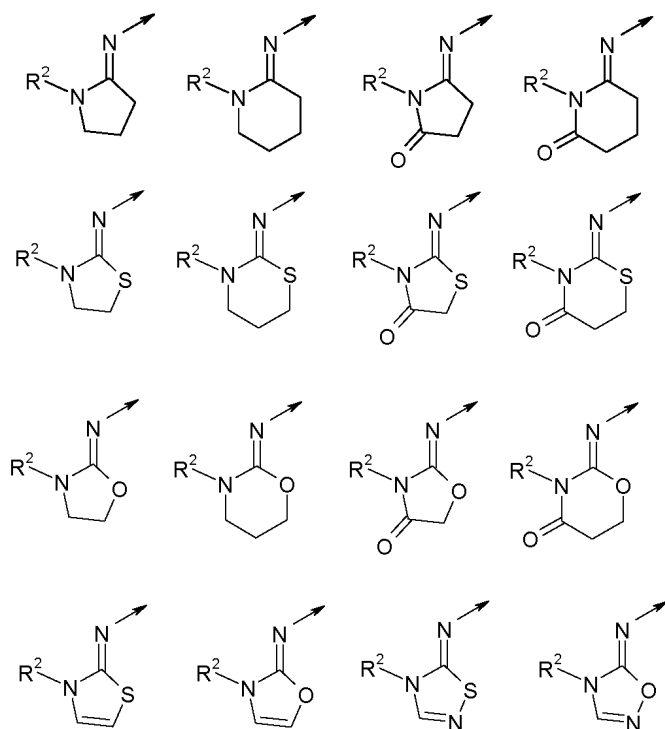
또는, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시 또는 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 이치환된, (C_3-C_6) -시클로알킬, 페닐, 피리딜, 피리미딜, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아지닐, 티아졸릴, 티아디아졸릴, 옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 피라졸릴, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타내고,

[0146]

특별히 바람직하게는, X^2 및 X^4 는 하기 조합 X^2/X^4 : F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, 메틸/메틸, 메틸/F, F/메틸, 메틸/Cl, Cl/메틸, 메틸/Br, Br/메틸, 에틸/에틸, 에틸/F, F/에틸, 에틸

/Cl, Cl/에틸, 에틸/Br, Br/에틸, 메톡시/메틸, 메틸/메톡시, 메틸/H, 에틸/H, 염소/H, 브로민/H, 플루오린/H, 메톡시/H, H/염소, H/플루오린, H/브로민, H/메틸, H/메톡시, H/에틸을 나타내고,

- [0147] R^1 및 R^3 은 이들이 부착되어 있는 원자와 함께, 포화 또는 불포화된 5- 내지 6-원 고리, 및/또는 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 시아노, 시클로프로필, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 메틸시클로프로필, (C_3-C_4) -알칸디일, (C_3-C_4) -알켄디일, 부탄디에닐 (여기서, 부탄디에닐은 메틸, 플루오린, 염소, 브로민, 메톡시 또는 트리플루오로메틸에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고/있거나 1개 이상의 산소 또는 질소 원자가 임의로 개재될 수 있음)에 의해 임의로 일치환 또는 이치환되며 추가의 황 또는 산소 또는 질소 원자 및/또는 카르보닐 기를 임의로 함유할 수 있는 포화 또는 불포화된 5- 내지 6-원 고리를 형성할 수 있고, 특별히 R^1 및 R^3 은 이들이 부착되어 있는 원자와 함께 하기 기를 나타내고,



[0148]

- [0149] 이들 각각은 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 플루오린, 염소, 트리플루오로메틸, 디플루오로메틸, 시클로프로필, 클로로시클로프로필, 플루오로시클로프로필, 시아노시클로프로필, 메틸시클로프로필에 의해 임의로 일치환 또는 이치환될 수 있고,

- [0150] 식 중, 화살표는 분자의 나머지를 나타내고,

- [0151] R^2 은 매우 특히 바람직하게는 시아노, (2,2,2)-트리플루오로에틸, (2,2)-디플루오로에틸, 2-클로로-(2,2)-디플루오로에틸, (2,2)-디클로로-2-플루오로에틸, (2,2,2)-트리클로로에틸, 펜타플루오로에틸, 2-클로로테트라플루오로에틸, 알릴, 부테닐, 프로피닐, 메틸술피닐, 트리플루오로메틸술피닐, 메틸술폰닐, 트리플루오로메틸술폰닐을 나타내거나,

- [0152] 또는, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유할 수 있고, C=O가 1, 2 또는 3회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에틸닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환 또는 삼치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 특별히 하기 고리: 매우 특히 바람직한 것 하에 언급된 치환기에 의해 임의로 치환될 수 있는, 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 옥세탄, 페닐, 티에닐 및 피리딜이 명확하게 언급되거나,

- [0153] 또는 $-(CH_2)_m-R^6$ (여기서, R^6 은, O, S 및 N으로 이루어진 군으로부터의 1 내지 2개의 헤테로원자를 임의로 함유

할 수 있고, C=O가 1 또는 2회 임의로 개재될 수 있으며, 플루오린, 염소, 브로민, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 비닐, 에틸닐, 메톡시, 에톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로 에톡시 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터의 동일하거나 상이한 치환기에 의해 임의로 일치환, 이치환 또는 삼치환될 수 있는 3- 내지 6-원 포화, 부분 포화 또는 방향족 고리를 나타내고, 여기서 m은 1의 수를 나타내고, 특별히 하기 R⁶: 매우 특히 바람직한 것 하에 언급된 치환기에 의해 임의로 치환될 수 있는, 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 페닐 및 피리딜이 명확하게 언급됨)을 나타낸다.

[0154] 상기 언급된 일반적인 또는 바람직한 라디칼 정의 또는 설명은, 바람직한 경우에 서로 조합될 수 있으며, 즉 각각의 범위 및 바람직한 범위 사이의 조합을 포함한다. 이는 최종 생성물 및, 상응하게는 전구체 및 중간체에 모두 적용된다.

[0155] 본 발명에 따라, 바람직한 것으로 (바람직함) 상기 열거된 의미의 조합을 함유하는 화학식 I의 화합물이 바람직하다.

[0156] 본 발명에 따라, 특히 바람직한 것으로 상기 열거된 의미의 조합을 함유하는 화학식 I의 화합물이 특히 바람직하다.

[0157] 본 발명에 따라, 매우 특히 바람직한 것으로 상기 열거된 의미의 조합을 함유하는 화학식 I의 화합물이 매우 특히 바람직하다.

[0158] 포화 또는 불포화된 탄화수소 라디칼, 예컨대 알킬, 알칸디일 또는 알케닐은 각각의 경우에 가능하다면 직쇄 또는 분지형일 수 있고, 예를 들어 알콕시에서와 같은 헤테로원자와의 조합을 포함한다.

[0159] 달리 나타내지 않는 한, 임의로 치환된 라디칼은 일치환 또는 다치환될 수 있고, 여기서 다치환의 경우에 치환기는 동일하거나 상이할 수 있다.

[0160] 바람직한 것으로서 언급되는 라디칼 정의에서, 할로젠은 플루오린, 염소, 브로민 및 아이오딘, 특히 바람직하게는 플루오린, 염소 및 브로민, 매우 특히 바람직하게는 플루오린 및 염소를 나타낸다.

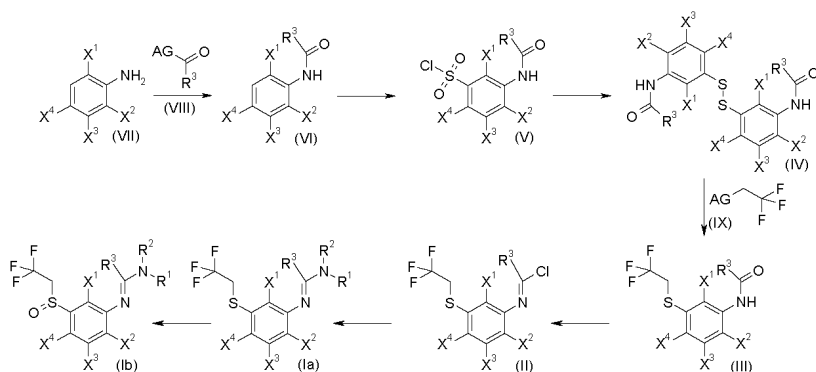
[0161] 제조 방법

[0162] 화학식 I의 화합물은 출원 WO 2007/131680에 기재되어 있는 방법에 의해 제조될 수 있다. 이들 기재된 방법에 대해 대안적으로, 화학식 I의 화합물은 또한 방법 A, 방법 B, 방법 C, 방법 E, 방법 F, 방법 G, 방법 H, 방법 I, 방법 J 및 방법 K에 의해 제조될 수 있다. 방법 D는 전구체의 제조에 대한 대안을 제공한다.

[0163] 아미딘을 제조하기 위한 다수의 일반적 방법은 문헌 [S. Patai and Z. Rappoport, The Chemistry of Amidines and Imidates, Vol. 27, John Wiley & Sons, New York, NY, USA, 1991]에 기재되어 있다.

[0164] 또한, 트리플루오로보레이트의 도움을 받는 아릴아미딘의 팔라듐(II)-촉매화 합성은 문헌에 기재되어 있고, 예를 들어, 문헌 [J.Saevmarker, Ph.D. thesis University of Uppsala, 2012 또는 J.Saevmarker, Org. Lett. 14 (2012), 2394-2397]을 참조한다.

[0165] 방법 A



[0166]

[0167] 상기 식에서, X¹, X², X³, X⁴, R¹, R² 및 R³은 상기 제공된 의미를 갖고, AG는 이탈기를 나타내고, PG는 보호기를 나타낸다.

[0168] 화학식 VII의 아닐린은 상업적으로 입수가가능하거나, 또는 이들은 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다. 화학식 VIII의 산, 산 무수물 또는 산 클로라이드의 존재 하에, 아닐린 (VII)은 상응하는 아닐리드 (VI)로 전환된다. 클로로술포산을 사용한 아닐리드 (VI)의 클로로술포화는 상응하는 술폰일 클로라이드 (V)를 제공한다. 술폰일 클로라이드 (V)의 디설피드 (IV)로의 환원은 문헌으로부터 공지된 방법, 예컨대 염산 중 철 또는 아이오다이드를 사용하여 수행될 수 있다. 디설피드 (IV)와 화학식 XVI의 트리플루오로에틸 친전자체와의 반응 (여기서, AG는 이탈기, 예컨대 예를 들어, 염소, 브로민, 토실레이트, 메실레이트 또는 트리플레이트를 나타냄)은 설피드 (III)을 제공한다.

[0169] 아닐리드 (III)은, 예를 들어 디페닐 클로로포스페이트 또는 오염화인을 사용하여 염소화되어 화학식 II의 이미도일 클로라이드를 제공하고, 아민과 반응하여 아미딘 (Ia)를 제공한다.

[0170] 티오에테르 (Ia)는 산화제, 예컨대, 예를 들어, 메타-클로로퍼벤조산과의 반응에 의해 상응하는 설피드 (Ib)로 전환된다.

[0171] 화학식 Ia의 화합물의 화학식 Ib의 화합물로의 산화는 적합한 용매 및 희석제 중 산화제를 사용하여 수행될 수 있다. 적합한 산화제는, 예를 들어, 묽은 질산, 과산화수소 및 퍼옥시카르복실산, 예컨대 메타-클로로퍼벤조산이다. 적합한 용매는 불활성 유기 용매, 전형적으로 아세토니트릴 및 할로젠화 용매, 예컨대 디클로로메탄, 클로로포름 또는 디클로로에탄이다.

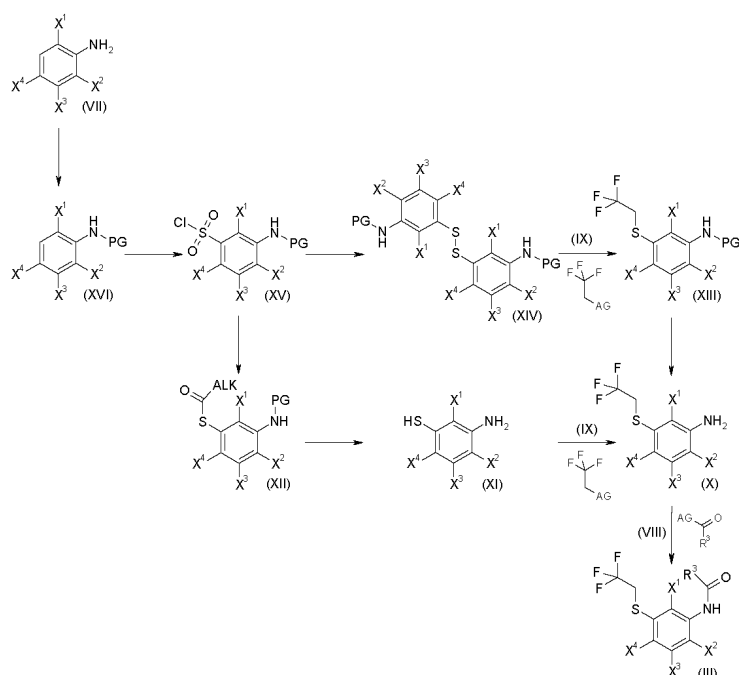
[0172] 다수의 다양한 방법은 문헌 [A.R. Maguire in ARKIVOC, 2011(i), 1-110] 또는 WO2011/006646에 의해 기재된 바와 같이 거울상이성질체적으로 풍부한 설피드를 제조하는데 적합하다: 키랄 리간드 및 산화제, 예컨대 tert-부틸 히드رو퍼옥시드 (TBHP), 2-페닐프로판-2-일 히드رو퍼옥시드 (CHP) 또는 과산화수소와 함께, 예를 들어, 가장 자주 사용되는 촉매 공급원으로서 $Ti(O^iPr)_4$ 및 $VO(acac)_2$ 형태의 티타늄 및 바나듐을 사용하는 티오에테르의 금속-촉매화 비대칭 산화; 키랄 산화제 또는 키랄 촉매를 사용하는 비-금속-촉매화 비대칭 산화; 전기화학적 또는 생물학적 비대칭 산화 및 또한 설피드의 동역학적 분해 및 친핵성 이동 (안데르센(Andersen)의 방법에 따름).

[0173] 거울상이성질체는 또한 라세미체로부터, 예를 들어 키랄 HPLC에 의해 정제용 규모로 이들을 분리함으로써 수득될 수 있다.

[0174] 방법 A에서 화학식 II, III, IV 및 V의 화합물은 특히 제조 실시예에 언급된 조건 하에 제조될 수 있다.

[0175] 대안적으로, 화학식 III의 티오에테르는 방법 B에 의해 제조될 수 있다.

[0176] 방법 B



[0177]

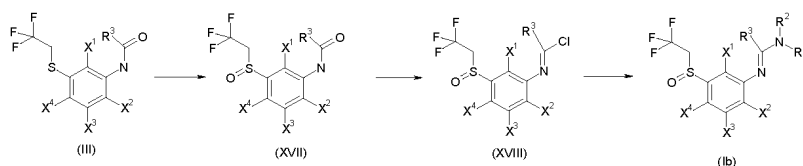
[0178] 상기 식에서 X^1 , X^2 , X^3 , X^4 및 R^3 은 상기 제공된 의미를 갖고, AG는 이탈기를 나타내고, PG는 보호기를 나타낸다.

[0179] 아닐린 (VII)은 문헌으로부터 공지된 적합한 보호기, 예컨대 예를 들어, 아세틸 기로 보호되어 화학식 XVI의 화합물을 제공할 수 있다. 클로로술폰산을 사용한 화학식 XVI의 화합물의 클로로술폰화는 상응하는 술폰일 클로라이드 (XV)를 제공한다. 술폰일 클로라이드 (XV)에서 디설피드 (XIV)로의 환원은 문헌으로부터 공지된 방법, 예컨대 염산 중 철 또는 아이오다이드를 사용하여 수행될 수 있다. 디설피드 (XIV)와 화학식 IX의 트리플루오로에틸 친전자체 (여기서, AG는 이탈기, 예컨대, 예를 들어, 염소, 브로민, 토실레이트, 메실레이트 또는 트리플레이트를 나타냄)와의 반응은 설피드 (XIII)을 제공한다. 보호기는 문헌으로부터 공지된 적합한 방법에 의해 제거되어 화학식 X의 아닐린을 제공한다. 이것은 화학식 VIII의 산, 산 무수물 또는 산 클로라이드의 존재 하에 상응하는 아닐리드 (III)으로 전환된다.

[0180] 디설피드 (XIV)로의 환원 대신에, 또한 적합한 환원제, 예컨대 예를 들어, 아이오딘/인을 사용하여 환원시켜 알킬 티오에이트 (XI)을 제공하고, 이어서 이를 적합한 방법, 예를 들어 수산화칼륨 용액을 사용하여 탈보호시켜 화학식 X의 화합물을 제공하는 것이 가능하다. 티올 (XI)과 화학식 IX의 트리플루오로에틸 친전자체 (여기서, AG는 이탈기, 예컨대, 예를 들어, 염소, 브로민, 토실레이트, 메실레이트 또는 트리플레이트를 나타냄)와의 반응은 설피드 (X)을 제공한다. 이것은 화학식 VIII의 산, 산 무수물 또는 산 클로라이드의 존재 하에 상응하는 아닐리드 (III)으로 전환된다.

[0181] 방법 B에서 화학식 III, X, XI, XII, XV 및 XVI의 화합물은 특히 제조 실시예에 언급된 조건 하에 제조될 수 있다.

[0182] 방법 C



[0183]

[0184] 상기 식에서, X^1 , X^2 , X^3 , X^4 , R^1 , R^2 및 R^3 은 상기 제공된 의미를 갖는다.

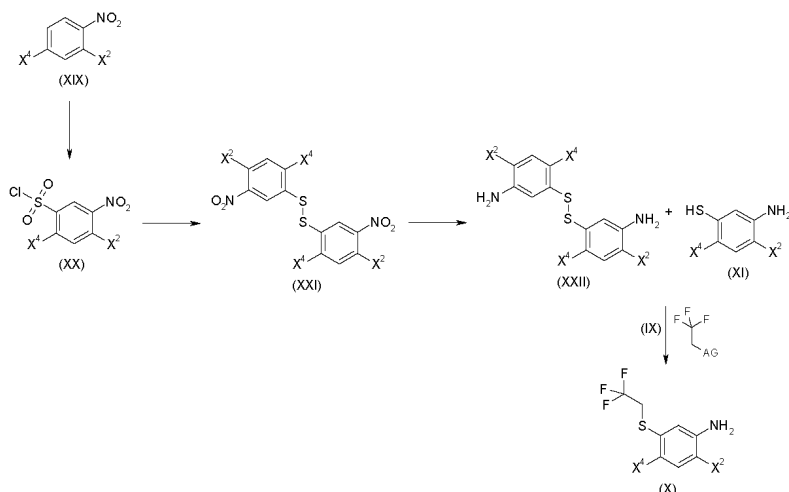
[0185] 또한, 키랄 화합물 (Ib)는 화학식 III의 화합물이 화학식 XVII의 설폰사이드로 키랄성으로 산화되는 경우에 방법 C에 의해 수득된다는 것이 밝혀졌다.

[0186] 아닐리드 (XVII)은, 예를 들어 디페닐 클로로포스페이트 또는 오염화인을 사용하여 염소화되어 화학식 XVIII의 이미도일 클로라이드를 제공하고, 아민과 반응하여 아미딘 (Ib)를 제공한다.

[0187] 방법 C에서 화학식 XVII의 화합물 중 일부는 신규이고, 이들은 특히 제조 실시예에 언급된 조건 하에 제조될 수 있다.

[0188] 방법 D

[0189] 대안적으로, 화학식 X의 티오에테르는 방법 D에 의해 제조될 수 있다.



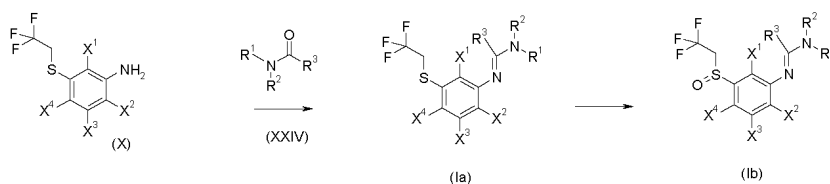
[0190]

[0191] X^2 , X^4 는 서로 독립적으로 특히 바람직하게는 수소, 플루오린, 염소, 브로민을 나타낼 수 있다.

[0192] 클로로술포산을 사용한 화학식 XIX의 니트로방향족의 클로로술포화는 상응하는 술포닐 클로라이드 (XX)을 제공한다. 술포닐 클로라이드 (XX)의 비스(니트로아릴) 디설피드 (XXI)로의 환원은 문헌으로부터 공지된 방법, 예를 들어 아이오다이드를 사용하여 수행될 수 있다. 디설피드 (XXI)의 디설피판디일디아닐린 (XXII) (이들 중 일부는 상응하는 아미노아릴티올 (XI)과의 혼합물로서 형성됨)으로의 환원은 불균질 촉매, 예컨대, 예를 들어, 라니(Raney) 니켈, 활성 탄소상 백금 또는 활성 탄소상 팔라듐의 도움을 받아 환원제, 예컨대, 예를 들어, 수소를 사용하여 가능하다. 디설피드 (XXII) 또는 티오펜올 (XI)과 화학식 IX의 트리플루오로에틸 친전자체 (여기서, AG는 이탈기, 예컨대, 예를 들어, 염소, 브로민, 아이오딘, 토실레이트, 메실레이트 또는 트리플레이트를 나타냄)와의 반응은 화학식 X의 3-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술포닐] 아닐린을 제공한다.

[0193] 방법 D에서 화학식 X, XI, XII, XX 및 XXI의 화합물은 특히 제조 실시예에 언급된 조건 하에 제조될 수 있다.

[0194] 방법 E



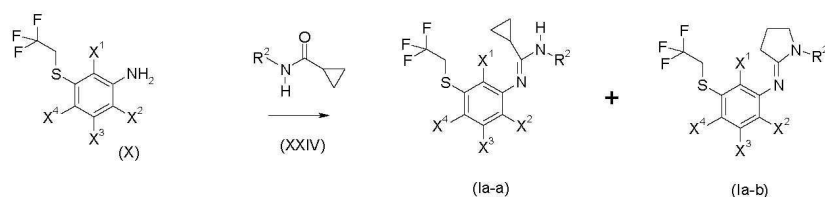
[0195]

[0196] 상기 식에서, X^1 , X^2 , X^3 , X^4 , R^1 , R^2 및 R^3 은 상기 제공된 의미를 갖는다.

[0197] 화학식 X의 아닐린은 문헌으로부터 공지된 방법에 의해, 예를 들어 화학식 XXIV의 아미드 및 포스포릴 클로라이드와의 반응에 의해, 적절한 경우에, 불활성 유기 용매의 존재 하에 화학식 Ia의 트리플루오로에틸 술포이드 유도체로 전환될 수 있다.

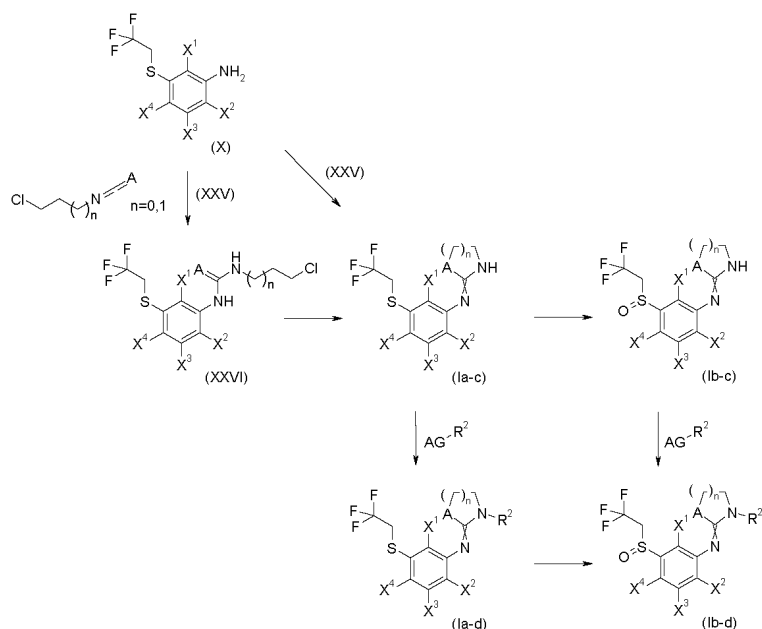
[0198] 술포시드 (Ib)는 문헌으로부터 공지된 방법에 의해 티오에테르 (Ia)의 산화에 의해 획득될 수 있다.

[0199] 화학식 XXIV의 아미드 (여기서, R^3 은 임의로 치환된 시클로프로필을 나타내고, R^1 은 수소를 나타내고, R^2 는 임의로 치환된 할로알킬을 나타냄)는, 포스포릴 클로라이드의 존재 하에 화학식 X의 아닐린과 반응하는 경우에, 본 발명에 따른 화학식 Ia-a 및 Ia-b의 N-아릴아미딘의 혼합물을 제공한다.



[0200]

- [0201] 상기 식에서, X^1 , X^2 , X^3 , X^4 및 R^2 는 상기 제공된 의미를 갖는다.
- [0202] 문헌으로부터 공지된 방법에 의한 티오에테르 (Ia-a)의 산화는, R^3 이 임의로 치환된 시클로프로필을 나타내고, R^1 이 수소를 나타내고, R^2 가 임의로 치환된 할로알킬을 나타내는 것인 화학식 Ib의 술폭시드를 제공한다.
- [0203] 문헌으로부터 공지된 방법에 의한 티오에테르 (Ia-b)의 산화는, R^1 및 R^3 이 함께 5-원 고리를 형성하고, R^2 가 임의로 치환된 할로알킬을 나타내는 것인 화학식 Ib의 술폭시드를 제공한다.
- [0204] 화학식 XXIV의 아미드는 상업적으로 입수가 가능하거나, 또는 일반적으로 공지된 방법에 의해, 예를 들어 문헌 [Houben-Weyl VIII, 655]과 유사하게, 임의로 염기의 존재 하에 및 임의로 용매의 존재 하에, 예를 들어 산 클로라이드를 아민과 반응시킴으로써 제조될 수 있다.
- [0205] 방법 E에서 화학식 X 및 XXIV의 화합물은 특히 제조 실시예에 언급된 조건 하에 제조될 수 있다.
- [0206] 방법 F
- [0207] 화학식 I의 3-치환된 2-아릴이미노-1,3-티아졸리딘 ($n=0$, $A=S$), 2-아릴이미노-1,3-티아지난 ($n=1$, $A=S$), 2-아릴이미노-1,3-옥사졸리딘 ($n=0$, $A=O$) 및 2-아릴이미노-1,3-옥사지난 ($n=1$, $A=O$)은, 예를 들어, 방법 F에 의해 제조될 수 있다.



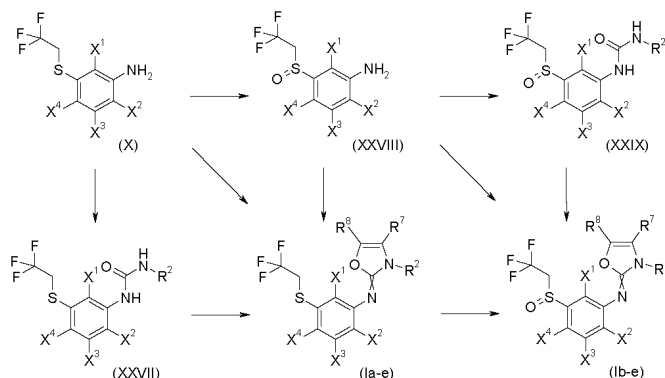
- [0208]
- [0209] 상기 식에서, X^1 , X^2 , X^3 , X^4 및 R^2 는 상기 제공된 의미를 갖는다.
- [0210] 화학식 X의 아닐린은 이소시아네이트 (XXV, $A=O$) 또는 이소티오시아네이트 (XXV, $A=S$)와의 반응에 의해 직접 반응시켜 화학식 Ia-c의 시클릭 아미딘을 제공할 수 있다. 화학식 XXVI의 (티오)우레아의 중간체 단리의 경우에, 이들은 염기의 존재 하에 화학식 Ia-c의 시클릭 아미딘으로 전환될 수 있다.
- [0211] 특히 JP2011/042611에서, (티오)우레아 및 그의 술폭시드는 살충제로서 청구된다. 화학식 XXVI의 (티오)우레아는 신규이고, 또한 본 발명의 대상의 일부를 형성한다.
- [0212] 화학식 Ib-c의 술폭시드는 문헌으로부터 공지된 방법에 의해 티오에테르 (Ia-c)의 산화에 의해 수득될 수 있다.
- [0213] 티오에테르 (Ia-c) 및 술폭시드 (Ib-c)는 이어서 문헌으로부터 공지된 방법에 의해 각각 화학식 Ia-d 및 Ib-d의 화합물 (여기서, R^2 는 상기 제공된 의미를 가질 수 있음)로 전환될 수 있다. 적합한 알킬화제는, 예를 들어 알킬 할라이드 (알킬 클로라이드, 알킬 브로마이드 및 알킬 아이오다이드), 알킬 트리플레이트, 알킬 메실레이트 및 디알킬 술폰레이트이다.
- [0214] 화학식 Ib의 술폭시드는 문헌으로부터 공지된 방법에 의해 화학식 Ia의 티오에테르의 산화에 의해 수득될 수 있다.

다.

방법 F에서 화학식 X 및 XXVI의 화합물은 특히 제조 실시예에 언급된 조건 하에 제조될 수 있다.

방법 G

화학식 I의 3-치환된 2-아릴이미노-1,3-옥사졸은, 예를 들어, 방법 G에 의해 제조될 수 있다.



상기 식에서, X^1 , X^2 , X^3 , X^4 및 R^2 는 상기 제공된 의미를 갖는다.

R^7 및 R^8 은 R^1 및 R^3 에 의해 이들이 부착되어 있는 원자와 함께 형성된 고리에서의 치환기이다.

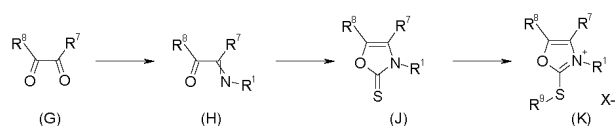
화학식 XXVIII의 아닐린은, 예를 들어 불활성 유기 용매 중 산화제로서의 메타-클로로벤조산을 사용한 화학식 X의 아닐린의 산화에 의해 제조될 수 있다. 화학식 XXVIII의 아닐린은 신규이고, 또한 본 발명의 대상의 일부를 형성한다.

화학식 X 및 XXVIII의 아닐린은 문헌으로부터 공지된 방법에 의해, 예를 들어 JP2011/042611에 따라, 임의로 염기의 존재 하에 및 임의로 유기 용매의 존재 하에 이들을 이소시아네이트로 처리함으로써 각각 화학식 XXVII 및 XXIX의 우레아로 전환될 수 있다. 대안적으로, 이들 아닐린은 일반적으로 공지된 방법에 의해 그의 이소시아네이트로 전환될 수 있고, 이어서 이는 아민을 사용하여 우레아로 전환된다.

3-치환된 2-아릴이미노옥사졸 (Ia-e) 및 (Ib-e)는, 예를 들어 문헌 [M. Han in Bull. Korean Chem. Soc. 2012, 33(4), 1371-1374]의 방법에 의해 각각 우레아 (XXVII) 및 (XXIX)로부터 합성될 수 있으며, 여기서 처음에는 사염화탄소 및 트리페닐포스핀을 사용하여, N'-치환된 N-아릴이미도포름아미드가 제조되고, 이어서 이는 $Ku(I)$ 촉매작용 하에 불활성 고비점 용매 중에서 적절한 히드록시카르보닐 화합물과 반응하여 2-아릴이미노옥사졸을 선택적으로 산출할 수 있다.

술포시드 (Ib)는 문헌으로부터 공지된 방법에 의해 티오에테르 (Ia)의 산화에 의해 수득될 수 있다.

이들 2-아릴이미노옥사졸 (I)은 문헌 [Gompper in Chem. Ber. 1959, 92, 1928-1932]에 기재된 바와 같이 화학식 X 또는 XXVIII의 아닐린으로부터, 예를 들어 임의로 염기의 존재 하에 및 임의로 불활성 용매 중에서, 일반적으로 고온에서 화학식 J의 3-알킬-1,3-옥사졸린티온 또는 그의 옥사졸륨 염과의 반응에 의해 직접 합성될 수 있다.



화학식 J의 3-치환된 1,3-옥사졸린티온은 상업적 공급원으로부터 수득될 수 있거나, 또는 문헌으로부터 공지된 방법에 의해, 예를 들어 $R^7=R^8$ =아릴의 경우에 문헌 [K. N. Mehrotra in Bull. Chem. Soc. Jap. 1985, 58 (8), 2399-2402]의 절차와 유사하게, 황 공급원으로서 이황화탄소를 사용하여, 합성 중간체 (H)를 통해 화학식 G의 디카르보닐 화합물로부터 제조될 수 있다.

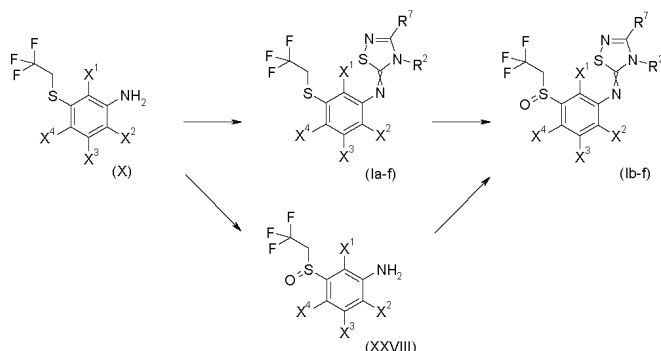
화학식 K의 옥사졸륨 염은 화학식 J의 상응하는 옥사졸린티온의 알킬화에 의해 제조될 수 있다. 적합한 알킬화제는, 예를 들어 알킬 할라이드 (알킬 클로라이드, 알킬 브로마이드 및 알킬 아이오다이드), 알킬

트리플레이트, 알킬 메실레이트 및 디알킬 술페이트이다. 화학식 K에서 음이온 X의 성질은 이 작용제에 의해 결정되고, 예를 들어 클로라이드, 브로마이드, 아이오다이드, 트리플레이트, 메실레이트 또는 술페이트일 수 있다.

[0229] 방법 G에서 화학식 X 및 XXVIII의 화합물은 특히 제조 실시예에 언급된 조건 하에 제조될 수 있다.

[0230] 방법 H

[0231] 화학식 I의 3-치환된 2-아릴이미노티아디아졸은, 예를 들어, 방법 H에 의해 제조될 수 있다.



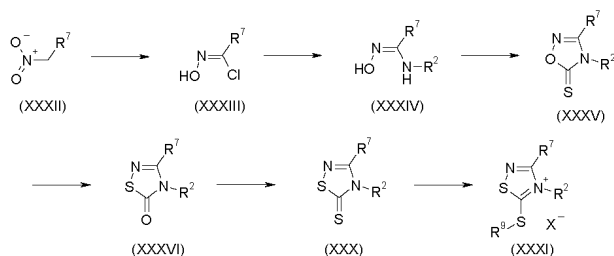
[0232]

[0233] 상기 식에서, X^1 , X^2 , X^3 , X^4 및 R^2 는 상기 제공된 의미를 갖는다.

[0234] R^7 은 R^1 및 R^3 에 의해 이들이 부착되어 있는 원자와 함께 형성된 고리에서의 치환기이다.

[0235] 화학식 X 또는 화학식 XXVIII의 아릴린은, 예를 들어 화학식 XXX의 티아디아졸린티온과 또는 화학식 XXXI의 상응하는 티아디아졸롤 염과 반응하여 각각 화학식 Ia-f 및 Ib-f의 2-아릴이미노티아디아졸을 제공할 수 있다. 이것은 임의로 염기 존재 하에, 임의로 불활성 용매 중에, 또는 염기 및 용매로서 동시에 작용할 수 있는 작용제, 예를 들어 피리딘 중에 성공한다.

[0236] 화학식 XXX의 티아디아졸린티온 및 그의 티아디아졸롤 염 (XXXI)의 합성은, 예를 들어, 하기 방법에 의해 수행될 수 있다:



[0237]

[0238] 화학식 XXXIV의 N-치환된 아미드옥심의 합성은 문헌에 상세하게 기재되어 있다. 이들은, 예를 들어 문헌 [J. Org. Chem. 1980, 45 (21), 4198]에 따라, 화학식 XXXIII의 상응하는 이미도일 클로라이드로부터 바람직한 아민과의 반응에 의해 이루어질 수 있다. 임의로, 이것은 불활성 용매 중 0°C 내지 100°C의 온도에서 1시간 내지 36시간의 반응 시간으로 수행된다. 이미도일 클로라이드의 제조를 위해, 문헌으로부터 공지된 방법, 예를 들어 임의로 용매로서의 상응하는 알콜 중 화학식 XXXII의 적절한 니트로 화합물과 알콕실레이트와의 반응을 적용하고, 이어서 염소화제, 예를 들어 사염화티타늄을 첨가하는 것이 가능하다.

[0239] 문헌은 화학식 XXXV의 옥사디아졸린티온을 합성하기 위한 다수의 방법, 예를 들어 문헌 [D. Suemngen in J. Chem. Soc. Perkin Trans 1 1983, 4, 687-691]에 의해 기재된 1,2,4-옥사디아졸린-5-온과 오황화인의 반응을 개시하고 있다. 1,2,4-옥사디아졸린-5-온은 상업적으로 입수가능하거나, 또는 N-치환된 아미드옥심 (XXXIV)로부터, 적합한 할로카르보닐 유도체와의 반응에 의해, 문헌 [H. Argibas in Phosp., Sulf., Silicon and rel. elem. 1998, 134/135, 381-319]에 기재된 바와 같이 수득될 수 있다. 대안적으로, 옥사디아졸린티온은 화학식 XXXIV의 N-치환된 아미도옥심으로부터, 예를 들어 티오포스젠과의 반응에 의해, 또한 닥터. 소멩겐(D. Suemngen)에 의해 공개된 바와 같이 직접 수득될 수 있다.

[0240] 화학식 XXXV의 옥사디아졸린티온으로부터의 화학식 XXXVI의 티아디아졸리논의 합성을 위해, 문헌 [D. Suemengen in J. Chem. Soc. Perkin Trans 1 1983, 4, 687-691]의 방법을 사용하는 것이 가능하며, 이것은 승온에서 고비점 불활성 용매 중 구리 촉매작용 하에 3,4-이치환된 1,2,4-옥사디아졸린-5-티온의 재배열이다.

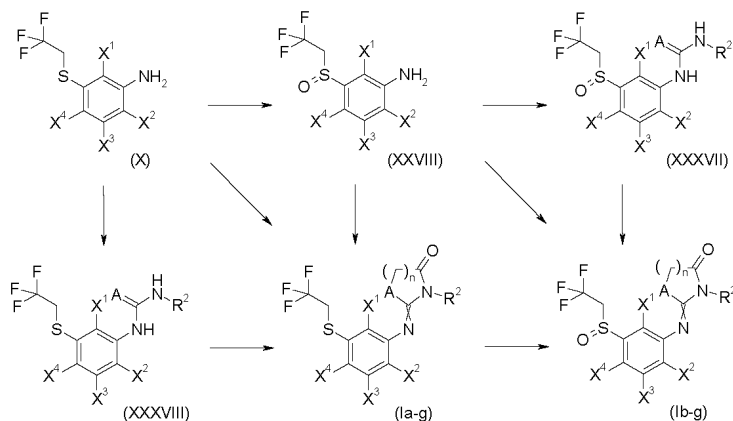
[0241] 화학식 XXX의 티아디아졸린티온은 예를 들어 임의로 불활성 용매 중 140℃ 이하의 온도에서 적합한 황화제, 예컨대, 예를 들어, 오황화인 또는 라웨슨(Lawesson) 시약으로의 처리에 의해 화학식 XXXVI의 티아디아졸리논으로부터 제조될 수 있다.

[0242] 화학식 XXXI의 티아디아졸류 염은 화학식 XXX의 상응하는 티아디아졸린티온의 알킬화에 의해 문헌으로부터 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다. 적합한 알킬화제는, 예를 들어 알킬 할라이드 (알킬 클로라이드, 알킬 브로마이드 및 알킬 아이오다이드), 알킬 트리플레이트, 알킬 메실레이트 및 디알킬 술페이트이다.

[0243] 방법 H에서 화학식 XXVIII의 화합물은 특히 제조 실시예에 언급된 조건 하에 제조될 수 있다.

[0244] 방법 I

[0245] 화학식 I의 3-치환된 2-아릴이미노-1,3-옥사졸리딘-4-온 (A=O, n=0), 2-아릴이미노-1,3-옥사지난-4-온 (A=O, n=1), 2-아릴이미노-1,3-티아졸리딘-4-온 (A=S, n=0) 및 2-아릴이미노-1,3-티아지난-4-온 (A=S, n=1)은, 예를 들어, 방법 I에 의해 제조될 수 있다



[0246]

[0247] 상기 식에서, X¹, X², X³, X⁴ 및 R²는 상기 제공된 의미를 갖고, n은 0 또는 1을 나타낼 수 있다.

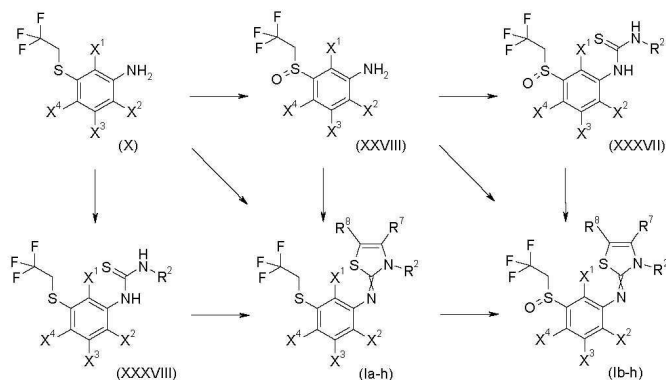
[0248] 화학식 X 및 XXVIII의 아닐린은 문헌으로부터 공지된 방법에 의해, 예를 들어 JP2011/042611에 따라, 임의로 염기의 존재 하에 및 임의로 유기 용매의 존재 하에 이들을 이소시아네이트 (A=O인 경우) 및 이소티오시아네이트 (A=S인 경우)로 처리하거나, 또는 일반적으로 공지된 방법에 의해 이들을 이들의 이소시아네이트 (A=O) 및 이소티오시아네이트 (A=S)로 전환시키거나 이들을 아민과 반응시켜 티오우레아를 제공함으로써 각각 화학식 XXXVIII 및 XXXVII의 우레아 (A=O) 및 티오우레아 (S)로 전환될 수 있다.

[0249] 각각 화학식 XXXVIII 및 XXXVII의 우레아 (A=O) 및 티오우레아 (A=S)으로부터, 예를 들어 불활성 용매 중에서, 대부분의 경우에 100℃ 초과 온도에서 적당한 할로카르보닐 유도체를 사용한 시클로아실화에 의해, 각각 화학식 Ia-g 및 Ib-g의 2-아릴이미노-1,3-옥사졸리딘-4-온 (A=O) 및 -티아졸리딘-4-온 (A=S)을 합성하는 것이 가능하다. 적합한 할로카르보닐 유도체는, 예를 들어 n=0인 경우에, 클로로아세트산 및 그의 산 클로라이드, 브로모아세트산 및 그의 산 클로라이드 또는 브로마이드이고; n=1인 경우에, 문헌은 옥사졸리딘-4-온의 유사한 전환의 경우에 문헌 [C. F. Howell in J. Org. Chem. 1962, 27, 1686 and 1691] 및 티아졸리딘-4-온의 경우에 문헌 [V.N. Britsun in Russ. J. Org. Chem. 2006, 41 (11), 1719-1729]에 의해 기재된 바와 같이 3-치환된 2-프로페노일 클로라이드를 언급한다.

[0250] 방법 I에서 화학식 XXVIII, XXXVIII 및 XXXVII의 화합물은 특히 제조 실시예에 언급된 조건 하에 제조될 수 있다.

[0251] 방법 J

[0252] 화학식 I의 3-치환된 2-아릴이미노-1,3-티아졸은, 예를 들어, 방법 J에 의해 제조될 수 있다.



[0253]

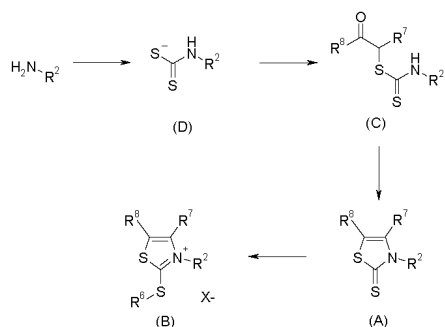
[0254] 상기 식에서, X^1 , X^2 , X^3 , X^4 및 R^2 는 상기 제공된 의미를 갖는다.

[0255] R^7 및 R^8 은 R^1 및 R^3 에 의해 이들이 부착되어 있는 원자와 함께 형성된 고리에서의 치환기이다.

[0256] 3-치환된 2-아릴이미노티아졸 (Ia-h) 및 (Ib-h)는, 예를 들어 불활성 용매 중 적당한 할로카르보닐 유도체와의 반응에 의해 각각 티오우레아 (XXXVIII) 및 (XXXVII)로부터 합성될 수 있다. 이것은, 예를 들어, α -할로케토 화합물 또는 그의 유도체, 예를 들어 문헌 [A. Yahyazadeh in J. Pharm. Res. 1998, 9, 536-537(S), 2126-2139(M)]에 의해 기재된 바와 같이 $R^7=R^8$ =메틸의 경우에 3-브로모-2-부타논을 사용한, 또는 특허 US4079144에 기재된 바와 같이 $R^7=R^8$ =H의 경우에 2-클로로-1,1-디에톡시에탄을 사용한 시클로아실화에 의해 수행될 수 있다.

[0257] 술폭시드 (Ib)는 문헌으로부터 공지된 방법에 의해 티오에테르 (Ia)의 산화에 의해 수득될 수 있다. 술폭시드의 거울상 이성질체 선택적 농축의 공지된 방법은 이 목적을 위해 사용될 수 있다.

[0258] 이들 2-아릴이미노-1,3-티아졸 (I)은 또한 임의로 염기의 존재 하에 및 임의로 불활성 용매 중, 예를 들어 화학식 A의 3-알킬-1,3-티아졸리딘티온 또는 그의 티아졸륨 염과의 반응에 의해, 화학식 X 또는 XXVIII의 아닐린으로부터 직접 합성될 수 있다.



[0259]

[0260] 화학식 A의 3-치환된 1,3-티아졸리딘티온은 상업적 공급원으로부터 수득될 수 있거나, 또는 예를 들어, 문헌 [K. Janikowska in Phosp. Sulf. Sil. and rel.elem. 2011, 186(1), 12-20]에 기재된 바와 같이 문헌으로부터 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다. 문헌 [J. Amer. Chem. Soc. 1987, 109 (2), 492-507]에서와 같이, 아민은 이 황화탄소와 반응하여 화학식 D의 디티오키르바메이트를 제공하고, 이어서 이는 적당한 할로카르보닐 신포를 사용하여 화학식 C의 알킬화 화합물을 제공할 수 있다. 적합한 할로카르보닐 화합물은, 예를 들어, $R^7=R^8$ =H인 경우에 클로로에탄알 또는 2-클로로-1,1-디에톡시에탄, R^7 =H 및 R^8 =메틸인 경우에 클로로프로판, $R^7=R^8$ =메틸인 경우에 3-브로모-2-부타논, R^7 =메틸 및 R^8 =에틸인 경우에 2-브로모-3-펜타논 등일 수 있다. 화학식 C의 화합물은 목적하는 티아졸리딘티온 (A)로 또는 단지 탈수 후에, 대부분의 경우에 산성 조건 하에 및 가열로 자발적으로 고리화할 수 있다.

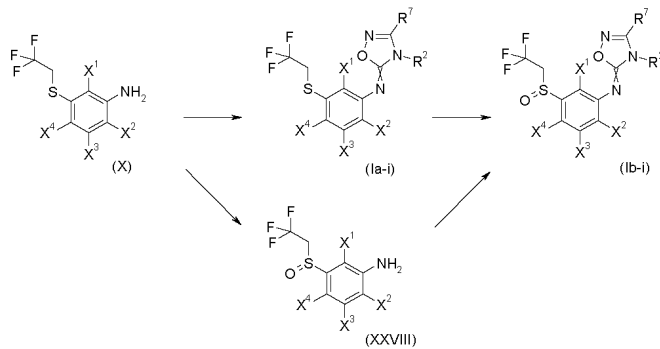
[0261] 화학식 B의 티아졸리늄 염은 화학식 B의 상응하는 티아디아졸리딘티온의 알킬화에 의해 제조될 수 있다. 적합한 알킬화제는, 예를 들어 알킬 할라이드 (알킬 클로라이드, 알킬 브로마이드 및 알킬 아이오다이드), 알킬 트리플

레이트, 알킬 메실레이트 및 디알킬 술페이트이다.

[0262] 방법 J에서 화학식 XXVIII, XXXVII 및 XXXVIII의 화합물은 특히 제조 실시예에 언급된 조건 하에 제조될 수 있다.

[0263] 방법 K

[0264] 화학식 I의 3-치환된 2-아릴이미노옥사디아졸은, 예를 들어, 방법 K에 의해 제조될 수 있다.



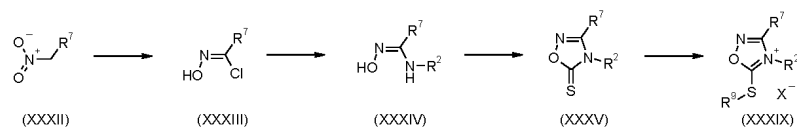
[0265]

[0266] 상기 식에서, X^1 , X^2 , X^3 , X^4 및 R^2 는 상기 제공된 의미를 갖는다.

[0267] R^7 은 R^1 및 R^3 에 의해 이들이 부착되어 있는 원자와 함께 형성된 고리에서의 치환기이다.

[0268] 화학식 X 또는 화학식 XXVIII의 아닐린은, 예를 들어 화학식 XXXV의 옥사디아졸린티온과 또는 화학식 XXXIX의 상응하는 옥사디아졸류 염과 반응시켜 각각 화학식 Ia-i 및 Ib-i의 2-아릴이미노옥사디아졸을 제공할 수 있다. 이것은 임의로 염기의 존재 하에, 임의로 불활성 용매 중에서, 또는 양쪽 역할을 가정할 수 있는 작용제, 예를 들어 피리딘 중에서 성공한다.

[0269] 화학식 XXXV의 옥사디아졸린티온 및 그의 옥사디아졸류 염 (XXXIX)의 합성은, 예를 들어, 하기 방법에 의해 수행될 수 있다.



[0270]

[0271] 화학식 XXXIX의 옥사디아졸류 염은 화학식 XXXV의 상응하는 옥사디아졸린티온의 알킬화에 의해 문헌으로부터 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다. 적합한 알킬화제는 예를 들어 알킬 할라이드 (알킬 클로라이드, 알킬 브로마이드 및 알킬 아이오다이드), 알킬 트리플레이트, 알킬 메실레이트 및 디알킬 술페이트이다.

[0272] 방법 K에서 화학식 XXVIII의 화합물은 특히 제조 실시예에 언급된 조건 하에 제조될 수 있다.

[0273] 이들 모든 방법은 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물로 이어진다.

[0274] 본 발명에 따른 활성 화합물은, 우수한 식물 저항성 및 온혈 동물에 대한 유리한 독성 및 환경에 따른 우수한 허용성과 조합하여, 식물 및 식물 기관의 보호, 수확물의 증가, 수확 물질 품질의 개선, 및 농업에서, 원예에서, 축산업에서, 삼림에서, 정원에서 및 레저 시설에서, 저장품 및 물질의 보호에서, 및 위생 분야에서 대면하게 되는 동물 해충, 특히 곤충, 거미류, 연충, 선충류 및 연체동물의 방제에 적합하다. 이들은 작물 보호제로서 바람직하게 사용될 수 있다. 이들은 통상적으로 감수성 및 내성인 종에 대해 및 발생의 모든 또는 일부 단계에 대해 효과적이다. 상기 언급된 해충은 다음을 포함한다:

[0275] 이아목 (이목)으로부터, 예를 들어, 다말리니아(Damalinea) 종, 헤마토피누스(Haematopinus) 종, 리노그나투스(Linognathus) 종, 페디쿨루스(Pediculus) 종, 트리코덱테스(Trichodectes) 종.

[0276] 거미강으로부터, 예를 들어, 아카루스(Acarus) 종, 아세리아 셸도니(Aceria sheldoni), 아쿨롭스(Aculops) 종, 아쿨루스(Aculus) 종, 암블리오마(Amblyomma) 종, 암피테트라니쿠스 비엔넨시스(Amphitetranychus viennensis), 아르가스(Argas) 종, 부필루스(Boophilus) 종, 브레비팔루스(Brevipalpus) 종, 브리오비아 프라에티오사(Bryobia praetiosa), 코리오프테스(Chorioptes) 종, 더마니수스 갈리나에(Dermanyssus gallinae), 예

오테트라니쿠스(*Eotetranychus*) 종, 에피트리메루스 피리(*Epitrimerus pyri*), 유테트라니쿠스(*Eutetranychus*) 종, 에리오피에스(*Eriophyes*) 종, 할로티데우스 데스트룩토르(*Halotydeus destructor*), 헤미타르소네무스(*Hemitarsonemus*) 종, 히알로마(*Hyalomma*) 종, 익소테스(*Ixodes*) 종, 라트로렉투스 막탄스(*Latrodectus mactans*), 메타테트라니쿠스(*Metatetranychus*) 종, 누페르사(*Nuphessa*) 종, 올리고니쿠스(*Oligonychus*) 종, 오르니토도로스(*Ornithodoros*) 종, 파노니쿠스(*Panonychus*) 종, 필로코프트루타 올레이보라(*Phyllocoptruta oleivora*), 폴리파고타르소네무스 라투스(*Polyphagotarsonemus latus*), 프소로프테스(*Psoroptes*) 종, 리피세팔루스(*Rhipicephalus*) 종, 리조글리리푸스(*Rhizoglyphus*) 종, 사르코프테스(*Sarcoptes*) 종, 스콜피오 마우루스(*Scorpio maurus*), 스테노타르소네무스(*Stenotarsonemus*) 종, 타르소네무스(*Tarsonemus*) 종, 테트라니쿠스(*Tetranychus*) 종, 바사테스 리코페르시시(*Vasates lycopersici*).

[0277] 이매패강으로부터, 예를 들어, 드레이세나(*Dreissena*) 종.

[0278] 순각목으로부터, 예를 들어, 게오필루스 카르포파구스(*Geophilus carpophagus*) 및 스쿠티게라(*Scutigera*) 종.

[0279] 딱정벌레목으로부터, 예를 들어, 아칼리마 비타툼(*Acalymma vittatum*), 아칸토셀리데스 오브텍투스(*Acanthoscelides obtectus*), 아도레투스(*Adoretus*) 종, 아겔라스티카 알니(*Agelastica alni*), 아그리오테스(*Agriotes*) 종, 암피말론 솔스티탈리스(*Amphimallon solstitialis*), 아노비움 푼크타툼(*Anobium punctatum*), 아노플로포라(*Anoplophora*) 종, 안토노무스(*Anthonomus*) 종, 안트레누스(*Anthrenus*) 종, 아피온(*Apion*) 종, 아포고니아(*Apogonia*) 종, 아토마리아(*Atomaria*) 종, 아타게누스(*Attagenus*) 종, 브루키디우스 오브텍투스(*Bruchidius obtectus*), 브루쿠스(*Bruchus*) 종, 카시다(*Cassida*) 종, 세로토마 트리푸르카타(*Cerotoma trifurcata*), 세우토린쿠스(*Ceutorrhynchus*) 종, 캐톡네마(*Chaetocnema*) 종, 클레오누스 멘디쿠스(*Cleonus mendicus*), 코노데루스(*Conoderus*) 종, 코스모폴리테스(*Cosmopolites*) 종, 코스텔리트라 질란디카(*Costelytra zealandica*), 크테니세라(*Ctenicera*) 종, 쿠르쿨리오(*Curculio*) 종, 크립토린쿠스 라파티(*Cryptorhynchus lapathi*), 실린드로코프투루스(*Cylindrocopturus*) 종, 데르메스테스(*Dermestes*) 종, 디아브로티카(*Diabrotica*) 종, 디코크로시스(*Dichocrocis*) 종, 딜로보테루스(*Diloboderus*) 종, 에필라크나(*Epilachna*) 종, 에피트릭스(*Epitrix*) 종, 파우스티누스(*Faustinus*) 종, 기비움 프실로이데스(*Gibbium psyllioides*), 헬룰라 운달리스(*Hellula undalis*), 헤테로니쿠스 아라토르(*Heteronychus arator*), 헤테로닉스(*Heteronyx*) 종, 힐라모르파 엘레간스(*Hylamorphia elegans*), 힐로트루페스 바줄루스(*Hylotrupes bajulus*), 히페라 포스티카(*Hypera postica*), 히포테네무스(*Hypothenemus*) 종, 라크노스테르나 콘산구이네아(*Lachnosterna consanguinea*), 레마(*Lema*) 종, 랩티노타르사 데셈리네아타(*Leptinotarsa decemlineata*), 류콕테라(*Leucoptera*) 종, 리소로프트루스 오리조필루스(*Lissorhoptrus oryzophilus*), 릭수스(*Lixus*) 종, 루페로데스(*Luperodes*) 종, 릭투스(*Lyctus*) 종, 메가셀리스(*Megascelis*) 종, 멜라노투스(*Melanotus*) 종, 멜리게테스 아에네우스(*Meligethes aeneus*), 멜로론타(*Melolontha*) 종, 미그돌루스(*Migdolus*) 종, 모노카무스(*Monochamus*) 종, 나우팍투스 크산토그라푸스(*Naupactus xanthographus*), 닙투스 홀로레우쿠스(*Niptus hololeucus*), 오리텍스 리노세로스(*Oryctes rhinoceros*), 오리자에필루스 수리나멘시스(*Oryzaephilus surinamensis*), 오리자파구스 오리자에(*Oryzaphagus oryzae*), 오티오린쿠스(*Otiorrhynchus*) 종, 옥시세토니아 주쿤다(*Oxycetonia jucunda*), 파에돈 코클레아리아에(*Phaedon cochleariae*), 필로파가(*Phyllophaga*) 종, 필로트레타(*Phyllotreta*) 종, 포필리아 자포니카(*Popillia japonica*), 프렘노트리페스(*Premnotrypes*) 종, 프실리오데스(*Psylliodes*) 종, 프티누스(*Ptinus*) 종, 리조비우스 벤트랄리스(*Rhizobius ventralis*), 리조페르타 도미니카(*Rhizopertha dominica*), 시토피루스(*Sitophilus*) 종, 스페노포루스(*Sphenophorus*) 종, 스테르네쿠스(*Sternechus*) 종, 심필레테스(*Symphyletes*) 종, 타니메쿠스(*Tanymecus*) 종, 테네브리오 몰리토르(*Tenebrio molitor*), 트리볼리움(*Tribolium*) 종, 트로고더마(*Trogoderma*) 종, 티키우스(*Tychius*) 종, 크실로트레쿠스(*Xylotrechus*) 종, 자브루스(*Zabrus*) 종.

[0280] 톱토기목으로부터, 예를 들어, 오니키우루스 아르마투스(*Onychiurus armatus*).

[0281] 배각목으로부터, 예를 들어, 블라니울루스 구툴라투스(*Blaniulus guttulatus*).

[0282] 파리목으로부터, 예를 들어, 아에데스(*Aedes*) 종, 아그로미자(*Agromyza*) 종, 아나스트레파(*Anastrepha*) 종, 아노펠레스(*Anopheles*) 종, 아스폰딜리아(*Asphondylia*) 종, 박트로세라(*Bactrocera*) 종, 비비오 호르툴라누스(*Bibio hortulanus*), 칼리포라 에리트로세팔라(*Calliphora erythrocephala*), 세라티티스 카피타타(*Ceratitis capitata*), 키로노무스(*Chironomus*) 종, 크리소미이아(*Chrysomyia*) 종, 코클리오미이아(*Cochliomyia*) 종, 콘타리니아(*Contarinia*) 종, 코르딜로비아 안트로포파가(*Cordylobia anthropophaga*), 컬렉스(*Culex*) 종, 큐테레브라(*Cuterebra*) 종, 다쿠스 올레아에(*Dacus oleae*), 다시네우라(*Dasyneura*) 종, 델리아(*Delia*) 종, 더마토비아 호미니스(*Dermatobia hominis*), 드로소필라(*Drosophila*) 종, 에키녹네무스(*Echinocnemus*) 종, 판니아(*Fannia*)

중, 가스트로필루스(*Gastrophilus*) 중, 히드렐리아(*Hydrellia*) 중, 힐레미아(*Hylemyia*) 중, 히포보스카(*Hyppobosca*) 중, 히포더마(*Hypoderma*) 중, 리리오미자(*Liriomyza*) 중, 루실리아(*Lucilia*) 중, 무스카(*Musca*) 중, 네자라(*Nezara*) 중, 오에스트루스(*Oestrus*) 중, 오시넬라 프리트(*Oscinella frit*), 페고미아(*Pegomyia*) 중, 포르비아(*Phorbia*) 중, 프로디플로시스(*Prodiplosis*) 중, 프실라 로사에(*Psila rosae*), 라콜레티스(*Rhagoletis*) 중, 스토크시스(*Stomoxys*) 중, 타바누스(*Tabanus*) 중, 탄니아(*Tannia*) 중, 테타놉스(*Tetanops*) 중, 티풀라(*Tipula*) 중.

[0283] 북쪽강으로부터, 예를 들어, 아리온(*Arion*) 중, 비움팔라리아(*Biomphalaria*) 중, 불리누스(*Bulinus*) 중, 데로세라스(*Deroceras*) 중, 갈바(*Galba*) 중, 림나에아(*Lymnaea*) 중, 온코멜라니아(*Oncomelania*) 중, 포마세아(*Pomacea*) 중, 숙시네아(*Succinea*) 중.

[0284] 연충강으로부터, 예를 들어, 안실로스토타 두오데날레(*Ancylostoma duodenale*), 안실로스토타 세일라니쿰(*Ancylostoma ceylanicum*), 아실로스토타 브라질리엔시스(*Acylostoma braziliensis*), 안실로스토타(*Ancylostoma*) 중, 아스카리스 루브리코이데스(*Ascaris lubricoides*), 아스카리스(*Ascaris*) 중, 브루기아 말라이(*Brugia malayi*), 브루기아 티모리(*Brugia timori*), 부노스토뭉(*Bunostomum*) 중, 카베르티아(*Chabertia*) 중, 클로노르키스(*Clonorchis*) 중, 쿠페리아(*Cooperia*) 중, 디크로코엘리움(*Dicrocoelium*) 중, 디티오카울루스 필라리아(*Dictyocaulus filaria*), 디필로보트리움 라툼(*Diphyllbothrium latum*), 드라쿤쿨루스 메디넨시스(*Dracunculus medinensis*), 에키노코쿠스 그라눌로수스(*Echinococcus granulosus*), 에키노코쿠스 멀티로쿨라리스(*Echinococcus multilocularis*), 엔테로비우스 베르미쿨라리스(*Enterobius vermicularis*), 파시오라(*Faciola*) 중, 헤몬쿠스(*Haemonchus*) 중, 헤테라키스(*Heterakis*) 중, 히메놀레피스 나나(*Hymenolepis nana*), 히오스트롱굴루스(*Hyostrongylus*) 중, 로아 로아(*Loa Loa*), 네마토디루스(*Nematodirus*) 중, 오에소파고스토킴(*Oesophagostomum*) 중, 오피스토르키스(*Opisthorchis*) 중, 온코세르카 볼볼루스(*Onchocerca volvulus*), 오스테르타기아(*Ostertagia*) 중, 파라고니무스(*Paragonimus*) 중, 쉬스토소멘(*Schistosomen*) 중, 스트롱길로이데스 푸엘레보르니(*Strongyloides fuelleborni*), 스트롱길로이데스 스테르코랄리스(*Strongyloides stercoralis*), 스트로닐로이데스(*Stronyloides*) 중, 타에니아 사기나타(*Taenia saginata*), 타에니아 솔리움(*Taenia solium*), 트리키넬라 스피랄리스(*Trichinella spiralis*), 트리키넬라 나티바(*Trichinella nativa*), 트리키넬라 브리토비(*Trichinella britovi*), 트리키넬라 넬소니(*Trichinella nelsoni*), 트리키넬라 슈도프시칼리스(*Trichinella pseudopsiralis*), 트리코스트롱굴루스(*Trichostrongylus*) 중, 트리쿠리스 트리쿠리아(*Trichuris trichuria*), 부케레리아 반크로프티(*Wuchereria bancrofti*).

[0285] 또한, 원생동물문, 예컨대 에이메리아(*Eimeria*)를 방제하는 것이 가능하다.

[0286] 노린재목으로부터, 예를 들어, 아나사 트리스티스(*Anasa tristis*), 안테스티옵시스(*Antestiopsis*) 중, 블리수스(*Blissus*) 중, 칼로코리스(*Calocoris*) 중, 캄필로마 리비다(*Campylomma livida*), 카벨레리우스(*Cavelerius*) 중, 시멕스(*Cimex*) 중, 콜라리아(*Collaria*) 중, 크레온티아데스 딜루투스(*Creontiades dilutus*), 다시누스 피페리스(*Dasynus piperis*), 디켈롭스 푸르카투스(*Dichelops furcatus*), 디코노코리스 휴에티(*Diconocoris hewetti*), 디스테르쿠스(*Dysdercus*) 중, 유쉬스투스(*Euschistus*) 중, 유리가스터(*Eurygaster*) 중, 헬리오펠티스(*Heliopeltis*) 중, 호르시아스 노빌렐루스(*Horcias nobilellus*), 랩토코리사(*Leptocoris*) 중, 랩토글로수스 필로푸스(*Leptoglossus phyllopus*), 리구스(*Lygus*) 중, 마크로페스 엑스카바투스(*Macropes excavatus*), 미리다에(*Miridae*), 모날로니온 아트라툼(*Monalonion atratum*), 네자라(*Nezara*) 중, 오에발루스(*Oebalus*) 중, 펜토미다에(*Pentomidae*), 피에스마 쿼드라타(*Piesma quadrata*), 피에조도루스(*Piezodorus*) 중, 프살루스(*Psallus*) 중, 슈다시스타 페르세아(*Pseudacysta persea*), 로드니우스(*Rhodnius*) 중, 살베르젤라 싱굴라리스(*Sahlbergella singularis*), 스캅토코리스 카스타네아(*Scaptocoris castanea*), 스코티노포라(*Scotinophora*) 중, 스테파니티스 나쉬(*Stephanitis nashi*), 티브라카(*Tibraca*) 중, 트리아토마(*Triatoma*) 중.

[0287] 매미목으로부터, 예를 들어, 아시르토시폰(*Acyrtosipon*) 중, 아크로고니아(*Acrogonia*) 중, 아에네올라미아(*Aeneolamia*) 중, 아고노세나(*Agonoscena*) 중, 알레우로데스(*Aleurodes*) 중, 알레우롤로부스 바로덴시스(*Aleurolobus barodensis*), 알레우로트릭수스(*Aleurothrixus*) 중, 암라스카(*Amrasca*) 중, 아누라피스 카르두이(*Anuraphis cardui*), 아오니디엘라(*Aonidiella*) 중, 아파노스티그마 피리(*Aphanostigma piri*), 아피스(*Aphis*) 중, 아르보리디아 아피칼리스(*Arboridia apicalis*), 아스피디엘라(*Aspidiella*) 중, 아스피디오투스(*Aspidiotus*) 중, 아타누스(*Atanus*) 중, 아울라코르툼 솔라니(*Aulacorthum solani*), 베미시아(*Bemisia*) 중, 브라키카우두스 헬리크리시이(*Brachycaudus helichrysi*), 브라키콜루스(*Brachycolus*) 중, 브레비코리네 브라시카에(*Brevicoryne brassicae*), 칼리기포나 마르기나타(*Calligypona marginata*), 카르네오세팔라 풀기다(*Carnecephala fulgida*), 세라토바쿠나 라니게라(*Ceratovacuna lanigera*), 세르코피다에(*Cercopidae*), 세로플

라스테스(*Ceroplastes*) 종, 카에토시폰 프라가에폴리이(*Chaetosiphon fragaefolii*), 키오나스피스 테갈렌시스(*Chionaspis tegalensis*), 클로리타 오누키이(*Chlorita onukii*), 크로마피스 주글란디콜라(*Chromaphis juglandicola*), 크리솜팔루스 피쿠스(*Chrysomphalus ficus*), 시카둘리나 음빌라(*Cicadulina mbila*), 코코미틸루스 할리(*Coccomytilus halli*), 코쿠스(*Coccus*) 종, 크립토미주스 리비스(*Cryptomyzus ribis*), 달불루스(*Dalbulus*) 종, 디알레우로데스(*Dialeurodes*) 종, 디아포리나(*Diaphorina*) 종, 디아스피스(*Diaspis*) 종, 드로시카(*Drosicha*) 종, 디사피스(*Dysaphis*) 종, 디스미코쿠스(*Dysmicoccus*) 종, 엠포아스카(*Empoasca*) 종, 에리오소마(*Eriosoma*) 종, 에리트로네우라(*Erythroneura*) 종, 유셀리스 빌로바투스(*Euscelis bilobatus*), 페리시아(*Ferrisia*) 종, 게오코쿠스 코페아에(*Geococcus coffeae*), 히에로글리푸스(*Hieroglyphus*) 종, 호말로디스카 코아굴라타(*Homalodisca coagulata*), 히알로프테루스 아룬디니스(*Hyalopterus arundinis*), 이세리아(*Icerya*) 종, 이디오세루스(*Idiocerus*) 종, 이디오스코푸스(*Idioscopus*) 종, 라오델팍스 스트리아텔루스(*Laodelphax striatellus*), 레카니움(*Lecanium*) 종, 레피도사페스(*Lepidosaphes*) 종, 리파피스 에리시미(*Lipaphis erysimi*), 마크로시퐁(*Macrosiphum*) 종, 마하나르바(*Mahanarva*) 종, 멜라나피스 사카리(*Melanaphis sacchari*), 메트칼피엘라(*Metcalfiella*) 종, 메토폴로피움 디로둠(*Metopolophium dirhodum*), 모넬리아 코스탈리스(*Monellia costalis*), 모넬리옵시스 페카니스(*Monelliopsis pecanis*), 미주스(*Myzus*) 종, 나소노비아 리비스니그리(*Nasonovia ribisnigri*), 네포테틱스(*Nephotettix*) 종, 닐라파르바타 루겐스(*Nilaparvata lugens*), 온코메토피아(*Oncometopia*) 종, 오르테지아 프라엘롱가(*Orthezia praelonga*), 파라베미시아 미리카에(*Parabemisia myricae*), 파라트리오자(*Paratrioza*) 종, 파를라토리아(*Parlatoria*) 종, 펌피구스(*Pemphigus*) 종, 페레그리누스 마이디스(*Peregrinus maidis*), 페나코쿠스(*Phenacoccus*) 종, 플로에오미주스 파세리니이(*Phloeomyzus passerinii*), 포로돈 휴물리(*Phorodon humuli*), 필록세라(*Phylloxera*) 종, 핀나스피스 아스피디스트라에(*Pinnaspis aspidistrae*), 플라노코쿠스(*Planococcus*) 종, 프로토폴비나리아 피리포르미스(*Protopulvinaria pyriiformis*), 슈다울라카스피스 펜타고나(*Pseudaulacaspis pentagona*), 슈도코쿠스(*Pseudococcus*) 종, 프실라(*Psylla*) 종, 프테로말루스(*Pteromalus*) 종, 피릴라(*Pyrrilla*) 종, 퀴드라스피디오투스(*Quadraspidotus*) 종, 퀘사다 기가스(*Quesada gigas*), 라스트로코쿠스(*Rastrococcus*) 종, 로팔로시퐁(*Rhopalosiphum*) 종, 사이세티아(*Saissetia*) 종, 스카포이데스 티타누스(*Scaphoides titanus*), 쉬자피스 그라미눔(*Schizaphis graminum*), 셀레나스피두스 아르티쿨라투스(*Selenaspidus articulatus*), 소가타(*Sogata*) 종, 소가텔라 푸르시페라(*Sogatella furcifera*), 소가토데스(*Sogatodes*) 종, 스틱토세팔라 페스티나(*Stictocephala festina*), 테날라파라 말라이엔시스(*Tenalaphara malayensis*), 티노칼리스 카리아에폴리아에(*Tinocallis caryaefoliae*), 토마스피스(*Tomaspis*) 종, 독소프테라(*Toxoptera*) 종, 트리아레우로데스(*Trialeurodes*) 종, 트리오자(*Trioza*) 종, 티플로시바(*Typhlocyba*) 종, 우나스피스(*Unaspis*) 종, 비테우스 비티폴리이(*Viteus vitifolii*), 지기나(*Zygina*) 종.

- [0288] 막시목으로부터, 예를 들어, 아탈리아(*Athalia*) 종, 디프리온(*Diprion*) 종, 호플로캄파(*Hoplocampa*) 종, 라시우스(*Lasius*) 종, 모노모리움 파라오니스(*Monomorium pharaonis*), 베스파(*Vespa*) 종.
- [0289] 등각목으로부터, 예를 들어, 아르마딜리둠 불가레(*Armadillidium vulgare*), 오니스쿠스 아셀루스(*Oniscus asellus*) 및 포르셀리오 스카베르(*Porcellio scaber*).
- [0290] 흰개미목으로부터, 예를 들어, 아크로미르멕스(*Acromyrmex*) 종, 아타(*Atta*) 종, 코르니테르메스 쿠물란스(*Cornitermes cumulans*), 마이크로테르메스 오베시(*Microtermes obesi*), 오돈토테르메스(*Odontotermes*) 종, 레티쿨리테르메스(*Reticulitermes*) 종.
- [0291] 나비목으로부터, 예를 들어, 아크로니크타 메이저(*Acronicta major*), 아독소피에스(*Adoxophyes*) 종, 아에디아 류코멜라스(*Aedia leucomelas*), 아그로티스(*Agrotis*) 종, 알라바마(*Alabama*) 종, 아미엘로이스 트란시텔라(*Amyelois transitella*), 아나르시아(*Anarsia*) 종, 안티카르시아(*Anticarsia*) 종, 아르기로폴로세(*Argyroproce*) 종, 바라트라 브라시카에(*Barathra brassicae*), 보르보 신나라(*Borbo cinnara*), 부쿨라트릭스 투르베리엘라(*Bucculatrix thurberiella*), 부팔루스 피니아리우스(*Bupalus piniarius*), 부세올라(*Busseola*) 종, 카코에시아(*Cacoecia*) 종, 칼로프틸리아 테이보라(*Caloptilia theivora*), 카푸아 레티쿨라나(*Capua reticulana*), 카르포카프사 포모넬라(*Carpocapsa pomonella*), 카르포시나 니폰넨시스(*Carposina niponensis*), 케이마토비아 브루마타(*Cheimatobia brumata*), 킬로(*Chilo*) 종, 코리스토네우라(*Choristoneura*) 종, 클리시아 암비구엘라(*Clysia ambiguella*), 크나팔로세루스(*Cnaphalocerus*) 종, 크네파시아(*Cnephasia*) 종, 코노포모르파(*Conopomorpha*) 종, 코노트라켈루스(*Conotrachelus*) 종, 코피타르시아(*Copitarsia*) 종, 시디아(*Cydia*) 종, 달라카 녹투이데스(*Dalaca noctuides*), 디아파니아(*Diaphania*) 종, 디아트라에아 사카랄리스(*Diatraea saccharalis*), 에아리아스(*Earias*) 종, 엑디톨로파 아우란티움(*Ecdytolopha aurantium*), 엘라스모팔푸스 리그노셀루스(*Elasmopalpus lignosellus*), 엘다나 사카리나(*Eldana saccharina*), 에페스티아 쿠에니엘라(*Ephestia*

kuehniella), 에피노티아(Epinotia) 종, 에피피아스 포스트비타나(Epiphyas postvittana), 에티엘라(Etiella) 종, 올리아(Eulia) 종, 유포에실리아 암비구엘라(Eupoecilia ambiguella), 유프로크티스(Euproctis) 종, 욱소아(Euxoa) 종, 펠티아(Feltia) 종, 갈레리아 멜로넬라(Galleria mellonella), 그라실라리아(Gracillaria) 종, 그라폴리타(Grapholitha) 종, 헤딜렙타(Hedylepta) 종, 헬리코베르파(Helicoverpa) 종, 헬리오티스(Heliothis) 종, 호프만노필라 슈도스프레텔라(Hofmannophila pseudospretella), 호모에오소마(Homoeosoma) 종, 호모나(Homona) 종, 히포노메우타 파델라(Hyponomeuta padella), 칼키보리아 플라보파시아타(Kakivoria flavofasciata), 라피그마(Laphygma) 종, 라스페이레시아 몰레스타(Laspeyresia molesta), 류시노데스 오르보날리스(Leucinodes orbonalis), 류코프테라(Leucoptera) 종, 리토콜레티스(Lithocolletis) 종, 리토파네 안테나타(Lithophane antennata), 로베시아(Lobesia) 종, 록사그로티스 알비코스타(Loxagrotis albicosta), 리만트리아(Lymantria) 종, 리오네티아(Lyonetia) 종, 말라코소마 뉴스트리아(Malacosoma neustria), 마루카 테스트라리스(Maruca testulalis), 마메스트라 브라시카에(Mamestra brassicae), 모시스(Mocis) 종, 미탐나 세파라타(Mythimna separata), 님폴라(Nymphula) 종, 오이케티쿠스(Oiketicus) 종, 오리아(Oria) 종, 오르타가(Orthaga) 종, 오스트리니아(Ostrinia) 종, 오울레마 오리자에(Oulema oryzae), 파놀리스 플람메아(Panolis flammea), 파르나라(Parnara) 종, 펙티노포라(Pectinophora) 종, 페리류코프테라(Perileucoptera) 종, 프토리마에아(Phthorimaea) 종, 필록니스티스 시트렐라(Phyllocnistis citrella), 필로노릭테르(Phyllonorycter) 종, 피에리스(Pieris) 종, 플라티노타 스톨타나(Platynota stultana), 플루시아(Plusia) 종, 플루텔라 크실로스텔라(Plutella xylostella), 프라이스(Prays) 종, 프로데니아(Prodenia) 종, 프로토파르세(Protoparce) 종, 슈달레티아(Pseudaletia) 종, 슈도플루시아 인클루덴스(Pseudoplusia includens), 피라우스타 누빌라리스(Pyrausta nubilalis), 라키플루시아 누(Rachiplusia nu), 스코에노비우스(Schoenobius) 종, 시르포파가(Scirpophaga) 종, 스코티아 세게툼(Scotia segetum), 세사미아(Sesamia) 종, 스파르가노티스(Sparganothis) 종, 스포도프테라(Spodoptera) 종, 스타트모포다(Stathmopoda) 종, 스토모프테릭스 서브세시벨라(Stomopteryx subsecivella), 시난테돈(Synanthedon) 종, 테시아 솔라니보라(Tecia solanivora), 테르메시아 겐마탈리스(Thermesia gemmatilis), 티네아 펠리오넬라(Tinea pellionella), 티네올라 비셀리엘라(Tineola bisselliella), 토르트릭스(Tortrix) 종, 트리코플루시아(Trichoplusia) 종, 투타 압솔루타(Tuta absoluta), 비라콜라(Virachola) 종.

[0292] 메뚜기목으로부터, 예를 들어, 아케타 도메스티쿠스(Acheta domesticus), 블라타 오리엔탈리스(Blatta orientalis), 블라텔라 게르마니카(Blattella germanica), 디크로플루스(Dichroplus) 종, 그릴로탈파(Gryllotalpa) 종, 류코파에아 마데라에(Leucophaea maderae), 로쿠스타(Locusta) 종, 멜라노플루스(Melanoplus) 종, 페리플라네타 아메리카나(Periplaneta americana), 쉬스토세르카 그레가리아(Schistocerca gregaria).

[0293] 벼룩목으로부터, 예를 들어, 세라토피루스(Ceratophyllus) 종 및 크세놉실라 케오피스(Xenopsylla cheopis).

[0294] 흙작은지네목으로부터, 예를 들어, 스쿠티게렐라(Scutigerella) 종.

[0295] 총채벌레목으로부터, 예를 들어, 아나포트립스 옵스쿠루스(Anaphothrips obscurus), 발리오텍스 비포르미스(Baliothrips biformis), 드레파노트리스 레우테리(Drepanothrips reuteri), 엔네오텍스 플라벤스(Enneothrips flavens), 프란클리니엘라(Frankliniella) 종, 헬리오트립스(Heliothrips) 종, 헤르시노트립스 페모랄리스(Hercinothrips femoralis), 리피포르트립스 크루엔타투스(Rhipiphorothrips cruentatus), 시르토텍스(Scirtothrips) 종, 타에니오텍스 카르다모니(Taeniothrips cardamoni), 트립스(Thrips) 종.

[0296] 좀목으로부터, 예를 들어, 레피스마 사카리나(Lepisma saccharina).

[0297] 식물기생성 선충류는, 예를 들어 아펠렌코이데스(Aphelenchoides) 종, 부르사펠렌쿠스(Bursaphelenchus) 종, 디틸렌쿠스(Ditylenchus) 종, 글로보테라(Globodera) 종, 헤테로테라(Heterodera) 종, 롱기도루스(Longidorus) 종, 멜로이도기네(Meloidogyne) 종, 프라틸렌쿠스(Pratylenchus) 종, 라도폴루스 시밀리스(Radopholus similis), 트리코도루스(Trichodorus) 종, 틸렌쿨루스 세미페네트란스(Tylenchulus semipenetrans), 크시피네마(Xiphinema) 종을 포함한다.

[0298] 적절한 경우에, 본 발명에 따른 화합물은, 특정 농도 또는 적용률에서, 또한 제초제, 완화제, 성장 조절제, 또는 식물 특성을 개선하기 위한 작용제로서, 또는 살미생물제로서, 예를 들어 살진균제, 항진균제, 살박테리아제, 살바이러스제 (바이로이드에 대한 작용제 포함)로서 또는 MLO (미코플라스마-유사 유기체) 및 RLO (리케치아-유사 유기체)에 대한 작용제로서 사용될 수 있다. 적절한 경우에, 이들은 또한 다른 활성 화합물의 합성을 위해 중간체 또는 전구체로서 사용될 수 있다.

- [0299] 본 발명은 또한 본 발명에 따른 활성 화합물 중 하나 이상을 포함하는, 작물 보호 조성물 및/또는 살균제로서, 예를 들어 드렌치, 적하제 및 분무 액제로서의 제제 및 그로부터 제조된 사용 형태에 관한 것이다. 사용 형태는 추가의 작물 보호제 및/또는 살균제 및/또는 작용-개선용 아주반트, 예컨대 침투제, 예를 들어 식물성 오일, 예를 들어 평지씨 오일, 해바라기 오일, 미네랄 오일, 예를 들어 파라핀 오일, 식물성 지방산의 알킬 에스테르, 예를 들어 평지씨 오일 메틸 에스테르 또는 대두 오일 메틸 에스테르, 또는 알칸올 알콕실레이트, 및/또는 전착제, 예를 들어 알킬실록산, 및/또는 염, 예를 들어 유기 또는 무기 암모늄 또는 포스포늄 염, 예를 들어 황산암모늄 또는 인산수소이암모늄, 및/또는 체류 촉진제, 예를 들어 디옥틸 술포숙시네이트 또는 히드록시프로필 구아 중합체, 및/또는 합습제, 예를 들어 글리세롤, 및/또는 비료, 예를 들어 암모늄-, 칼륨- 또는 인-함유 비료를 임의로 포함한다.
- [0300] 통상의 제제는, 예를 들어 수용성 액체 (SL), 에멀전 농축물 (EC), 수중 에멀전 (EW), 현탁액 농축물 (SC, SE, FS, OD), 수분산성 과립 (WG), 과립 (GR) 및 캡슐 농축물 (CS)이고; 이들 및 추가의 가능한 제제 유형은, 예를 들어 세계 작물 보호 협회(Crop Life International)에 의해 문헌 [Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers - 173, prepared by the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576]에 기재되어 있다. 제제는, 본 발명에 따른 하나 이상의 활성 화합물 뿐만 아니라, 추가로 농약 활성 화합물을 임의로 포함한다.
- [0301] 이들은 바람직하게는 보조제, 예를 들어 증량제, 용매, 자발성 촉진제, 담체, 유화제, 분산제, 동결방지제, 살생물제, 증점제 및/또는 추가의 보조제, 예를 들어 아주반트를 포함하는 제제 또는 사용 형태이다. 이 문맥에서 아주반트는 그 자체로 임의의 생물학적 효과를 갖는 성분 없이 제제의 생물학적 효과를 증진시키는 성분이다. 아주반트의 예는 잎 표면에서의 체류, 전착, 부착, 또는 침투를 촉진하는 작용제이다.
- [0302] 이들 제제는 공지된 방식으로, 예를 들어 활성 성분을 보조제, 예를 들어 증량제, 용매 및/또는 고체 담체 및/또는 추가의 보조제, 예를 들어 계면활성제와 혼합함으로써 제조된다. 제제는 적합한 제조 플랜트에서 또는 다르게는 적용 전에 또는 적용 동안 제조된다.
- [0303] 사용된 보조제는 활성 성분의 제제 또는 이들 제제로부터 제조된 사용 형태 (예를 들어, 즉시-사용 작물 보호 조성물, 예컨대 분무 액제 또는 종자 드레싱 제품)에 특수한 특성, 예컨대 특정의 물리적, 기술적 및/또는 생물학적 특성을 부여하기에 적합한 성분일 수 있다.
- [0304] 적합한 증량제는, 예를 들어 물, 극성 및 비극성 유기 화학 액체, 예를 들어 방향족 및 비-방향족 탄화수소 (예컨대 파라핀, 알킬벤젠, 알킬나프탈렌, 클로로벤젠), 알콜 및 폴리올 (이는 또한 적절한 경우에 치환되고/거나, 에테르화되고/거나 에스테르화될 수 있음), 케톤 (예컨대 아세톤, 시클로헥사논), 에스테르 (지방 및 오일 포함) 및 (폴리)에테르의 부류로부터의 극성 및 비극성 유기 화학 액체, 비치환 및 치환된 아민, 아마이드, 락탐 (예컨대 N-알킬피롤리돈) 및 락톤, 술폰 및 술폰사이드 (예컨대 디메틸 술폰사이드)이다.
- [0305] 사용되는 증량제가 물인 경우에, 예를 들어 유기 용매를 보조 용매로서 사용하는 것이 또한 가능하다. 유용한 액체 용매는 본질적으로 방향족 탄화수소, 예컨대 크실렌, 톨루엔 또는 알킬나프탈렌, 염소화 방향족 및 염소화 지방족 탄화수소, 예컨대 클로로벤젠, 클로로에틸렌 또는 메틸렌 클로라이드, 지방족 탄화수소, 예컨대 시클로헥산 또는 파라핀, 예를 들어 미네랄 오일 분획, 미네랄 및 식물성 오일, 알콜, 예컨대 부탄올 또는 글리콜 및 그의 에테르 및 에스테르, 케톤, 예컨대 아세톤, 메틸 에틸 케톤, 메틸 이소부틸 케톤 또는 시클로헥사논, 강한 극성 용매, 예컨대 디메틸포름아미드 및 디메틸 술폰사이드, 및 또한 물이다.
- [0306] 원칙적으로, 모든 적합한 용매를 사용하는 것이 가능하다. 적합한 용매의 예는 방향족 탄화수소, 예컨대 크실렌, 톨루엔 또는 알킬나프탈렌, 염소화 방향족 또는 지방족 탄화수소, 예컨대 클로로벤젠, 클로로에틸렌 또는 메틸렌 클로라이드, 지방족 탄화수소, 예컨대 시클로헥산, 파라핀, 석유 분획, 미네랄 오일 및 식물성 오일, 알콜, 예컨대 메탄올, 에탄올, 이소프로판올, 부탄올 또는 글리콜 및 그의 에테르 및 에스테르, 케톤, 예컨대 아세톤, 메틸 에틸 케톤, 메틸 이소부틸 케톤 또는 시클로헥사논, 강한 극성 용매, 예컨대 디메틸 술폰사이드, 및 또한 물이다.
- [0307] 원칙적으로, 모든 적합한 담체를 사용하는 것이 가능하다. 유용한 담체는 특히, 예를 들어 암모늄 염 및 분쇄된 천연 광물, 예컨대 카올린, 점토, 활석, 백악, 석영, 아타풀자이트, 몬모틸로나이트 또는 규조토, 및 분쇄된 합성 물질, 예컨대 미분된 실리카, 알루미늄 및 천연 또는 합성 실리카이트, 수지, 왁스 및/또는 고체 비료를 포함한다. 이러한 담체의 혼합물이 또한 사용될 수 있다. 과립에 유용한 담체는, 예를 들어 파쇄 및 분획화

천연 암석, 예컨대 방해석, 대리석, 부석, 세피올라이트, 돌로마이트, 및 무기 및 유기 곡물분의 합성 과립, 및 또한 유기 물질, 예컨대 톱밥, 종이, 코코넛 껍질, 옥수수 속대 및 담배 대의 과립을 포함한다.

- [0308] 액화된 기체상 증량제 또는 용매가 또한 사용될 수 있다. 특히, 적합한 증량제 또는 담체는 주위 온도에서 및 대기압 하에 기체상인 것들, 예를 들어 에어로졸 추진제 기체, 예컨대 할로탄화수소, 및 또한 부탄, 프로판, 질소 및 이산화탄소이다.
- [0309] 이온성 또는 비이온성 특성을 갖는 유화제 및/또는 거품 형성제, 분산제 또는 습윤제, 또는 이들 계면활성제의 혼합물의 예는 폴리아크릴산의 염, 리그노설폰산의 염, 페놀설폰산 또는 나프탈렌설폰산의 염, 에틸렌 옥시드와 지방 알콜 또는 지방산 또는 지방 아민, 치환된 페놀 (바람직하게는, 알킬페놀 또는 아릴페놀)과의 중축합물, 술포숙신산 에스테르의 염, 타우린 유도체 (바람직하게는, 알킬 타우레이트), 폴리에톡실화 알콜 또는 페놀의 인산 에스테르, 폴리올의 지방산 에스테르, 및 술페이트, 술포네이트 및 포스페이트를 함유하는 화합물의 유도체, 예를 들어 알킬아릴 폴리글리콜 에테르, 알킬 술포네이트, 알킬술페이트, 아릴술포네이트, 단백질 가수분해물, 리그노설파이트 페액 및 메틸셀룰로스는이다. 계면활성제의 존재는 활성 성분 중 하나 및/또는 불활성 담체 중 하나가 수불용성인 경우에 및 적용이 물 중에서 수행되는 경우에 유리하다.
- [0310] 제제 및 그로부터 유래된 사용 형태에 존재할 수 있는 추가의 보조제는 염료, 예컨대 무기 안료, 예를 들어 산화철, 산화티타늄 및 프러시안 블루(Prussian Blue), 및 유기 염료, 예컨대 알리자린 염료, 아조 염료 및 금속 프탈로시아닌 염료, 및 영양소 및 미량 영양소, 예컨대 철, 망가니즈, 붕소, 구리, 코발트, 몰리브데넘 및 아연의 염을 포함한다.
- [0311] 추가의 성분은 화학적 및/또는 물리적 안정성을 개선하는 안정화제, 예컨대 저온 안정화제, 보존제, 항산화제, 광 안정화제 또는 기타 작용제일 수 있다. 거품 형성제 또는 소포제가 또한 존재할 수 있다.
- [0312] 점착제, 예컨대 분말, 과립 또는 라텍스 형태의 카르복시메틸셀룰로스 및 천연 및 합성 중합체, 예컨대 아라비아 검, 폴리비닐 알콜 및 폴리비닐 아세테이트, 또는 다르게는 천연 인지질, 예컨대 세팔린 및 레시틴, 및 합성 인지질은 또한 제제 및 그로부터 유래된 사용 형태에서 추가의 보조제로서 존재할 수 있다. 추가의 보조제는 미네랄 및 식물성 오일일 수 있다.
- [0313] 임의로, 추가의 보조제는 제제 및 그로부터 유래된 사용 형태로 존재할 수 있다. 이러한 첨가제의 예는 향료, 보호 콜로이드, 결합제, 점착제, 증점제, 요변성제, 침투제, 체류 촉진제, 안정화제, 격리제, 착화제, 함습제, 전착제를 포함한다. 일반적으로, 활성 화합물은 제제화 목적을 위해 통상적으로 사용되는 임의의 고체 또는 액체 첨가제와 조합될 수 있다.
- [0314] 유용한 체류 촉진제는 동적 표면 장력을 감소시키는 그러한 모든 물질, 예를 들어 디옥틸 술포숙시네이트, 또는 점탄성을 증가시키는 그러한 모든 물질, 예컨대 히드록시프로필구아 중합체를 포함한다.
- [0315] 본 발명의 문맥에서 유용한 침투제는 식물 내로의 활성 농약 성분의 침투를 개선하는데 전형적으로 사용되는 모든 그러한 물질이다. 침투제는 이 문맥에서 (일반적으로 수성) 적용 액제로부터 및/또는 분무 코팅제로부터 식물의 각피 내로 침투하여 이에 의해 각피에서 활성 성분의 이동성을 증가시키는 그의 능력에 의해 규정된다. 문헌 [Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152]에 기재되어 있는 방법은 이러한 특성을 결정하기 위해 사용될 수 있다. 그 예는 알콜 알콕실레이트, 예컨대 코코넛 지방 에톡실레이트 (10) 또는 이소트리데실 에톡실레이트 (12), 지방산 에스테르, 예를 들어 팽지씨 오일 메틸 에스테르 또는 대두 오일 메틸 에스테르, 지방 아민 알콕실레이트, 예를 들어 탈로우아민 에톡실레이트 (15), 또는 암모늄 및/또는 포스포늄 염, 예를 들어 황산암모늄 또는 인산수소이암모늄을 포함한다.
- [0316] 제제는 제제의 중량을 기준으로 하여, 바람직하게는 0.00000001 중량% 내지 98 중량%의 활성 성분 또는 보다 바람직하게는 0.01 중량% 내지 95 중량%의 활성 성분, 보다 바람직하게는 0.5 중량% 내지 90 중량%의 활성 성분을 포함한다.
- [0317] 제제로부터 제조된 사용 형태 (작물 보호 조성물)의 활성 성분 함량은 넓은 한도 내에서 다양할 수 있다. 사용 형태의 활성 성분 농도는 사용 형태의 중량을 기준으로 하여, 전형적으로 0.00000001 중량% 내지 95 중량%의 활성 성분, 바람직하게는 0.00001 중량% 내지 1 중량%일 수 있다. 적용은 사용 형태에 적절한 통상의 방식으로 달성된다.
- [0318] 본 발명에 따른 활성 화합물은 그대로 또는 그의 제제로, 예를 들어 하나 이상의 적합한 살진균제, 살박테리아제, 살응애제, 살선충제, 살곤충제, 살미생물제, 비료, 유인제, 식물장강제, 멸균제, 상승작용제, 완화제, 신호

화학물질 및/또는 식물 성장 조절제와의 혼합물로 사용되어, 이에 따라, 예를 들어, 작용 스펙트럼을 확장하거나, 작용 지속시간을 연장하거나, 작용률을 증가시키거나, 반발을 방지하거나, 또는 내성 발생을 방지할 수 있다. 또한, 식물 생장은 비생물 인자, 예를 들어 고온 또는 저온, 가뭄 또는 상승된 수분 함량 또는 토양 염도에 대한 저항성을 증진시키는 그러한 조합에 의해 개선될 수 있다. 또한, 개화능 및 결실능의 개선, 발아 능력 및 뿌리 발생의 최적화, 수확의 용이성 및 수율의 개선, 성숙에 대한 영향, 수확된 생산물 품질 및/또는 영양가의 개선, 저장 수명의 연장 및/또는 수확된 생산물 가공성의 개선이 가능하다. 일반적으로, 본 발명에 따른 활성 화합물과 합하고 파트너와 혼합함으로써, 상승작용 효과가 수득되며, 즉, 해당 혼합물의 효능은 개별 성분의 효능보다 더 크다. 일반적으로, 프리믹스, 탱크 믹스 또는 레디 믹스에서, 및 또한 종자 적용에서 조합물을 사용하는 것이 가능하다.

- [0319] 특히 바람직한 혼합 파트너는, 예를 들어 다음과 같다:
- [0320] 살곤충제/살응애제/살선충제
- [0321] 일반 명칭에 따라 본원에서 확인된 활성 화합물은 공지되어 있고, 예를 들어, 살곤충제 편람 ([*"The Pesticide Manual"* 14th Ed., British Crop Protection Council 2006])에 기재되어 있거나, 또는 인터넷 (예를 들어, <http://www.alanwood.net/pesticides>)에서 찾아볼 수 있다.
- [0322] (1) 아세틸콜린에스테라제 (AChE) 억제제, 예컨대, 예를 들어,
- [0323] 카르바메이트, 예를 들어 알라니카르브, 알디카르브, 벤디오카르브, 벤푸라카르브, 부토카르복심, 부톡시카르복심, 카르바릴, 카르보푸란, 카르보솔판, 에티오펜카르브, 페노부카르브, 포르메타네이트, 푸라티오카르브, 이소프로카르브, 메티오카르브, 메토밀, 메톨카르브, 옥사밀, 피리미카르브, 프로폭수르, 티오디카르브, 티오파녹스, 트리아자메이트, 트리메타카르브, XMC 및 크실틸카르브; 또는
- [0324] 유기포스페이트, 예를 들어 아세페이트, 아자메티포스, 아진포스-에틸, 아진포스-메틸, 카두사포스, 클로르에톡시포스, 클로르펜빈포스, 클로르메포스, 클로로피리포스, 클로로피리포스-메틸, 쿠마포스, 시아노포스, 데메톤-S-메틸, 디아지논, 디클로르보스/DDVP, 디크로토포스, 디메토에이트, 디메틸빈포스, 디술포톤, EPN, 에티온, 에토프로포스, 팜푸르, 페나미포스, 페니트로티온, 펜티온, 포스티아제이트, 헵테노포스, 이미시아포스, 이소펜포스, 이소프로필 0-(메톡시아미노티오포스포릴)살리실레이트, 이속사티온, 말라티온, 메카르밤, 메타미도포스, 메티다티온, 메빈포스, 모노크로토포스, 날레드, 오메토에이트, 옥시데메톤-메틸, 파라티온, 파라티온-메틸, 펜토에이트, 포레이트, 포살론, 포스메트, 포스파미돈, 폭심, 피리미포스-메틸, 프로페노포스, 프로페탐포스, 프로티오포스, 피라클로포스, 피리다펜티온, 퀴날포스, 술포렘, 테부피람포스, 테메포스, 테르부포스, 테트라클로르빈포스, 티오메톤, 트리아조포스, 트리클로르폰 및 바미도티온.
- [0325] (2) GABA-게이팅 클로라이드 채널 길항제, 예컨대, 예를 들어,
- [0326] 시클로디엔 유기염소, 예를 들어 클로르단 및 엔도술판; 또는
- [0327] 페닐피라졸 (피프롤), 예를 들어 에티프롤 및 피프로닐.
- [0328] (3) 나트륨 채널 조절제/전압-의존성 나트륨 채널 차단제, 예컨대, 예를 들어,
- [0329] 피레트로이드, 예를 들어 아크리나트린, 알레트린, d-시스-트랜스 알레트린, d-트랜스 알레트린, 비펜트린, 비오알레트린, 비오알레트린 S-시클로헥테닐 이성질체, 비오레스메트린, 시클로프로트린, 시플루트린, 베타-시플루트린, 시할로트린, 람다-시할로트린, 감마-시할로트린, 시페르메트린, 알파-시페르메트린, 베타-시페르메트린, 세타-시페르메트린, 제타-시페르메트린, 시페노트린 [(1R)-트랜스 이성질체], 델타메트린, 엠펜트린 [(EZ)-(1R) 이성질체), 에스펜발레레이트, 에토펜프로스, 펜프로파트린, 펜발레레이트, 플루시트리네이트, 플루메트린, 타우-플루발리네이트, 할펜프로스, 이미프로트린, 카데트린, 페르메트린, 페노트린 [(1R)-트랜스 이성질체], 프랄레트린, 피레트린 (피레트럼), 레스메트린, 실라플루오펜, 테플루트린, 테트라메트린, 테트라메트린 [(1R) 이성질체], 트랄로메트린 및 트랜스플루트린; 또는
- [0330] DDT; 또는 메톡시클로르.
- [0331] (4) 니코틴성 아세틸콜린 수용체 (nAChR) 효능제, 예컨대, 예를 들어,
- [0332] 네오니코티노이드, 예를 들어 아세타미프리드, 클로티아니딘, 디노테푸란, 이미다클로프리드, 니텐피람, 티아클로프리드 및 티아메톡삼; 또는

- [0333] 니코틴.
- [0334] (5) 니코틴성 아세틸콜린 수용체 (nAChR) 알로스테릭 활성화제, 예컨대, 예를 들어,
- [0335] 스피노신, 예를 들어 스피네토람 및 스피노사드.
- [0336] (6) 클로라이드 채널 활성화제, 예컨대, 예를 들어,
- [0337] 아베르멕틴/밀베마이신, 예를 들어 아바멕틴, 에마멕틴 벤조에이트, 레피멕틴 및 밀베멕틴.
- [0338] (7) 유충 호르몬 모방제, 예컨대, 예를 들어,
- [0339] 유충 호르몬 유사체, 예를 들어 히드로프렌, 키노프렌 및 메토프렌; 또는
- [0340] 페녹시카르브; 또는 피리프록시펜.
- [0341] (8) 미지의 또는 비특이적 작용 메카니즘을 갖는 활성 화합물, 예컨대, 예를 들어,
- [0342] 알킬 할라이드, 예를 들어 메틸 브로마이드 및 다른 알킬 할라이드; 또는
- [0343] 클로로피크린; 또는 술폰릴 플루오라이드; 또는 보락스; 또는 토주석.
- [0344] (9) 선택적 항섭식제, 예를 들어 피메트로진; 또는 플로니카미드.
- [0345] (10) 응애 성장 억제제, 예를 들어 클로펜테진, 헥시티아족스 및 디플로비다진; 또는
- [0346] 예톡사졸.
- [0347] (11) 곤충 소화관 막의 미생물 파괴제, 예를 들어 바실루스 투링기엔시스(*Bacillus thuringiensis*) 아종 이스라엘렌시스(*israelensis*), 바실루스 스파에리쿠스(*Bacillus sphaericus*), 바실루스 투링기엔시스 아종 아이자와이(*aizawai*), 바실루스 투링기엔시스 아종 쿠르스타키(*kurstaki*), 바실루스 투링기엔시스 아종 테네브리오니(*tenebrionis*), 및 BT 식물 단백질: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
- [0348] (12) 산화성 인산화 억제제, ATP 교란제, 예컨대, 예를 들어, 디아펜티우론; 또는
- [0349] 유기주석 화합물, 예를 들어 아조시클로틴, 시헥사틴 및 펜부타틴 옥시드; 또는
- [0350] 프로파르기트; 또는 테트라디폰.
- [0351] (13) H 양성자 구배를 중단시킴으로써 작용하는 산화성 인산화 탈커플링제, 예컨대, 예를 들어, 클로르페나피르, DNOC 및 술폴루라미드.
- [0352] (14) 니코틴성 아세틸콜린 수용체 길항제, 예컨대, 예를 들어, 벤솔탑, 카르탑 히드로클로라이드, 티오시클람 및 티오솔탑-소듐.
- [0353] (15) 제0형 키틴 생합성 억제제, 예컨대, 예를 들어, 비스트리플루론, 클로르플루아주론, 디플루벤주론, 플루시클록수론, 플루페녹수론, 헥사플루무론, 루페누론, 노발루론, 노비플루무론, 테플루벤주론 및 트리플루무론.
- [0354] (16) 제1형 키틴 생합성 억제제, 예컨대, 예를 들어, 부프로페진.
- [0355] (17) 탈피 교란제, 쌍시류, 예컨대, 예를 들어, 시로마진.
- [0356] (18) 엑디손 수용체 효능제, 예컨대, 예를 들어, 크로마페노지드, 할로페노지드, 메톡시페노지드 및 테부페노지드.
- [0357] (19) 옥토판민성 효능제, 예컨대, 예를 들어, 아미트라즈.
- [0358] (20) 복합체-III 전자 수송 억제제, 예컨대, 예를 들어, 히드라메틸논; 또는 아세퀴노실; 또는 플루아크리피림.
- [0359] (21) 복합체-I 전자 수송 억제제, 예를 들어
- [0360] METI 살충제, 예를 들어 페나자퀸, 펜피록시메이트, 피리미디펜, 피리다벤, 테부펜피라드 및 톨펜피라드; 또는
- [0361] 로테논 (데리스(Derris)).
- [0362] (22) 전압-의존성 나트륨 채널 차단제, 예를 들어 인독사카르브; 또는 메타플루미존.

- [0363] (23) 아세틸-CoA 카르복실라제의 억제제, 예컨대, 예를 들어,
- [0364] 테트론산 및 테트라산 유도체, 예를 들어 스피로디클로펜, 스피로메시펜 및 스피로테트라마트.
- [0365] (24) 복합체-IV 전자 수송 억제제, 예컨대, 예를 들어,
- [0366] 포스핀, 예를 들어 알루미늄 포스피드, 칼슘 포스피드, 포스핀 및 아연 포스피드; 또는
- [0367] 시아나이드.
- [0368] (25) 복합체-II 전자 수송 억제제, 예컨대, 예를 들어, 시에노피라펜.
- [0369] (28) 리아노딘 수용체 이펙터, 예컨대, 예를 들어,
- [0370] 디아미드, 예를 들어 클로란트라닐리프롤 및 플루벤디아미드.
- [0371] 미지의 작용 메카니즘을 갖는 추가의 활성 화합물, 예컨대, 예를 들어, 아미도플루메트, 아자디라크틴, 벤클로티아즈, 벤족시메이트, 비페나제이트, 브로모프로필레이트, 키노메티오네이트, 크리올라이트, 시안트라닐리프롤 (시아지피르), 시플루메토펜, 디코폴, 디플로비다진, 플루엔술폰, 플루페네립, 플루피프롤, 플루오피람, 푸페노지드, 이미다클로티즈, 이프로디온, 메페르플루트린, 피리달릴, 피리플루퀴나존, 테트라메틸플루트린 및 아이오도메탄; 및 추가로 바실루스 피르무스(*Bacillus firmus*) 기재의 제제 (특히 균주 CNCM I-1582, 예를 들어 VOTiVO™, 바이오넴(BioNem)), 및 하기 공지된 활성 화합물:
- [0372] 3-브로모-N-{2-브로모-4-클로로-6-[(1-시클로프로필에틸)카르바모일]페닐}-1-(3-클로로피리딘-2-일)-1H-피라졸-5-카르복스아미드 (W02005/077934로부터 공지됨), 4-[[[(6-브로모피리드-3-일)메틸](2-플루오로에틸)아미노]푸란-2(5H)-온 (W02007/115644로부터 공지됨), 4-[[[(6-플루오로피리드-3-일)메틸](2,2-디플루오로에틸)아미노]푸란-2(5H)-온 (W02007/115644로부터 공지됨), 4-[[[(2-클로로-1,3-티아졸-5-일)메틸](2-플루오로에틸)아미노]푸란-2(5H)-온 (W02007/115644로부터 공지됨), 4-[[[(6-클로로피리드-3-일)메틸](2-플루오로에틸)아미노]푸란-2(5H)-온 (W02007/115644로부터 공지됨), 플루피라디푸론, 4-[[[(6-클로로-5-플루오로피리드-3-일)메틸](메틸)아미노]푸란-2(5H)-온 (W02007/115643으로부터 공지됨), 4-[[[(5,6-디클로로피리드-3-일)메틸](2-플루오로에틸)아미노]푸란-2(5H)-온 (W02007/115646으로부터 공지됨), 4-[[[(6-클로로-5-플루오로피리드-3-일)메틸](시클로프로필)아미노]푸란-2(5H)-온 (W02007/115643으로부터 공지됨), 4-[[[(6-클로로피리드-3-일)메틸](시클로프로필)아미노]푸란-2(5H)-온 (EP-A-0 539 588로부터 공지됨), 4-[[[(6-클로로피리드-3-일)메틸](메틸)아미노]푸란-2(5H)-온 (EP-A-0 539 588로부터 공지됨), {[1-(6-클로로피리딘-3-일)에틸](메틸)옥시도- λ^4 -숄파닐리덴}시아나미드 (W02007/149134로부터 공지됨) 및 그의 부분입체이성질체 {[1(R)-1-(6-클로로피리딘-3-일)에틸](메틸)옥시도- λ^4 -숄파닐리덴}시아나미드 (A) 및 {[1(S)-1-(6-클로로피리딘-3-일)에틸](메틸)옥시도- λ^4 -숄파닐리덴}시아나미드 (B) (마찬가지로 W02007/149134로부터 공지됨) 및 숄폭사플로르 및 그의 부분입체이성질체 [(R)-메틸(옥시도){1(R)-1-[6-(트리플루오로메틸)피리딘-3-일]에틸}- λ^4 -숄파닐리덴}시아나미드 (A1) 및 [(S)-메틸(옥시도){1(S)-1-[6-(트리플루오로메틸)피리딘-3-일]에틸}- λ^4 -숄파닐리덴}시아나미드 (A2) (부분입체이성질체 군 A로 표시됨) (WO 2010/074747, WO 2010/074751로부터 공지됨), [(R)-메틸(옥시도){1(S)-1-[6-(트리플루오로메틸)피리딘-3-일]에틸}- λ^4 -숄파닐리덴}시아나미드 (B1) 및 [(S)-메틸(옥시도){1(R)-1-[6-(트리플루오로메틸)피리딘-3-일]에틸}- λ^4 -숄파닐리덴}시아나미드 (B2) (부분입체이성질체 군 B로 표시됨) (마찬가지로 WO 2010/074747, WO 2010/074751로부터 공지됨) 및 11-(4-클로로-2,6-디메틸페닐)-12-히드록시-1,4-디옥사-9-아자디스피로[4.2.4.2]테트라데스-11-엔-10-온 (W02006/089633으로부터 공지됨), 3-(4'-플루오로-2,4-디메틸비페닐-3-일)-4-히드록시-8-옥사-1-아자스피로[4.5]데스-3-엔-2-온 (W02008/067911로부터 공지됨), 1-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)숄피닐]페닐}-3-(트리플루오로메틸)-1H-1,2,4-트리아졸-5-아민 (W02006/043635로부터 공지됨), [(3S,4aR,12R,12aS,12bS)-3-[(시클로프로필카르보닐)옥시]-6,12-디히드록시-4,12b-디메틸-11-옥소-9-(피리딘-3-일)-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-데카히드로-2H,11H-벤조[f]피라노[4,3-b]크로멘-4-일]메틸 시클로프로판카르복실레이트 (W02008/066153으로부터 공지됨), 2-시아노-3-(디플루오로메톡시)-N,N-디메틸벤젠술폰아미드 (W02006/056433으로부터 공지됨), 2-시아노-3-(디플루오로메톡시)-N-메틸벤젠술폰아미드 (W02006/100288로부터 공지됨), 2-시아노-3-(디플루오로메톡시)-N-에틸벤젠술폰아미드 (W02005/035486으로부터 공지됨), 4-(디플루오로메톡시)-N-에틸-N-메틸-1,2-벤조티아졸-3-아민 1,1-디옥시드 (W02007/057407로부터 공지됨), N-[1-(2,3-디메틸페닐)-2-(3,5-디메틸페닐)에틸]-4,5-디히드로-1,3-티아졸-2-아민 (W02008/104503으로부터 공지됨), {1'-[(2E)-3-(4-클로로페닐)프로프-2-엔-1-일]-5-

플루오로소피로[인돌-3,4'-피페리딘]-1(2H)-일](2-클로로피리딘-4-일)메타논 (W02003/106457로부터 공지됨), 3-(2,5-디메틸페닐)-4-히드록시-8-메톡시-1,8-디아자스피로[4.5]데스-3-엔-2-온 (W02009/049851로부터 공지됨), 3-(2,5-디메틸페닐)-8-메톡시-2-옥소-1,8-디아자스피로[4.5]데스-3-엔-4-일 에틸 카르보네이트 (W02009/049851로부터 공지됨), 4-(부트-2-인-1-일옥시)-6-(3,5-디메틸피페리딘-1-일)-5-플루오로피리미딘 (W02004/099160으로부터 공지됨), (2,2,3,3,4,4,5,5-옥타플루오로헨틸)(3,3,3-트리플루오로프로필)말로노니트릴 (W02005/063094로부터 공지됨), (2,2,3,3,4,4,5,5-옥타플루오로헨틸)(3,3,4,4,4-펜타플루오로부틸)말로노니트릴 (W02005/063094로부터 공지됨), 8-[2-(시클로프로필메톡시)-4-(트리플루오로메틸)페녹시]-3-[6-(트리플루오로메틸)피리다진-3-일]-3-아자비시클로[3.2.1]옥탄 (W02007/040280으로부터 공지됨), 플로메토칸, PF1364 (CAS 등록 번호 1204776-60-2) (JP2010/018586으로부터 공지됨), 5-[5-(3,5-디클로로페닐)-5-(트리플루오로메틸)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)벤조니트릴 (W02007/075459로부터 공지됨), 5-[5-(2-클로로피리딘-4-일)-5-(트리플루오로메틸)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)벤조니트릴 (W02007/075459로부터 공지됨), 4-[5-(3,5-디클로로페닐)-5-(트리플루오로메틸)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-2-메틸-N-{2-옥소-2-[(2,2,2-트리플루오로에틸)아미노]에틸}벤즈아미드 (W02005/085216으로부터 공지됨), 4-[[6-(3-클로로피리딘-3-일)메틸](시클로프로필)아미노]-1,3-옥사졸-2(5H)-온, 4-[[6-(3-클로로피리딘-3-일)메틸](2,2-디플루오로에틸)아미노]-1,3-옥사졸-2(5H)-온, 4-[[6-(3-클로로피리딘-3-일)메틸](에틸)아미노]-1,3-옥사졸-2(5H)-온, 4-[[6-(3-클로로피리딘-3-일)메틸](메틸)아미노]-1,3-옥사졸-2(5H)-온 (모두 W02010/005692로부터 공지됨), NNI-0711 (W02002/096882로부터 공지됨), 1-아세틸-N-[4-(1,1,1,3,3,3-헥사플루오로-2-메톡시프로판-2-일)-3-이소부틸페닐]-N-이소부틸-3,5-디메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드 (W02002/096882로부터 공지됨), 메틸 2-[2-((3-브로모-1-(3-클로로피리딘-2-일)-1H-피라졸-5-일)카르보닐)아미노]-5-클로로-3-메틸벤조일]-2-메틸히드라진카르복실레이트 (W02005/085216으로부터 공지됨), 메틸 2-[2-((3-브로모-1-(3-클로로피리딘-2-일)-1H-피라졸-5-일)카르보닐)아미노]-5-시아노-3-메틸벤조일]-2-메틸히드라진카르복실레이트 (W02005/085216으로부터 공지됨), 메틸 2-[2-((3-브로모-1-(3-클로로피리딘-2-일)-1H-피라졸-5-일)카르보닐)아미노]-5-시아노-3-메틸벤조일]-2-메틸히드라진카르복실레이트 (W02005/085216으로부터 공지됨), 메틸 2-[3,5-디브로모-2-((3-브로모-1-(3-클로로피리딘-2-일)-1H-피라졸-5-일)카르보닐)아미노]벤조일]-1,2-디에틸히드라진카르복실레이트 (W02005/085216으로부터 공지됨), 메틸 2-[3,5-디브로모-2-((3-브로모-1-(3-클로로피리딘-2-일)-1H-피라졸-5-일)카르보닐)아미노]벤조일]-2-메틸히드라진카르복실레이트 (W02005/085216으로부터 공지됨), (5RS,7RS;5SR,7SR)-1-(6-클로로-3-피리딜메틸)-1,2,3,5,6,7-헥사히드로-7-메틸-8-니트로-5-프로폭시이미다조[1,2-a]피리딘 (W02007/101369로부터 공지됨), 2-{6-[2-(5-플루오로피리딘-3-일)-1,3-티아졸-5-일]피리딘-2-일}피리미딘 (W02010/006713으로부터 공지됨), 2-{6-[2-(피리딘-3-일)-1,3-티아졸-5-일]피리딘-2-일}피리미딘 (W02010/006713으로부터 공지됨), 1-(3-클로로피리딘-2-일)-N-[4-시아노-2-메틸-6-(메틸카르바모일)페닐]-3-[[5-(트리플루오로메틸)-1H-테트라졸-1-일]메틸]-1H-피라졸-5-카르복사미드 (W02010/069502로부터 공지됨), 1-(3-클로로피리딘-2-일)-N-[4-시아노-2-메틸-6-(메틸카르바모일)페닐]-3-[[5-(트리플루오로메틸)-2H-테트라졸-2-일]메틸]-1H-피라졸-5-카르복사미드 (W02010/069502로부터 공지됨), N-[2-(tert-부틸카르바모일)-4-시아노-6-메틸페닐]-1-(3-클로로피리딘-2-일)-3-[[5-(트리플루오로메틸)-1H-테트라졸-1-일]메틸]-1H-피라졸-5-카르복사미드 (W02010/069502로부터 공지됨), N-[2-(tert-부틸카르바모일)-4-시아노-6-메틸페닐]-1-(3-클로로피리딘-2-일)-3-[[5-(트리플루오로메틸)-2H-테트라졸-2-일]메틸]-1H-피라졸-5-카르복사미드 (W02010/069502로부터 공지됨), (1E)-N-[(6-클로로피리딘-3-일)메틸]-N'-시아노-N-(2,2-디플루오로에틸)에탄아미드 (W02008/009360으로부터 공지됨), N-[2-(5-아미노-1,3,4-티아디아졸-2-일)-4-클로로-6-메틸페닐]-3-브로모-1-(3-클로로피리딘-2-일)-1H-피라졸-5-카르복사미드 (CN102057925로부터 공지됨) 및 메틸 2-[3,5-디브로모-2-((3-브로모-1-(3-클로로피리딘-2-일)-1H-피라졸-5-일)카르보닐)아미노]벤조일]-2-에틸-1-메틸히드라진카르복실레이트 (W02011/049233로부터 공지됨).

[0373] 살진균제

[0374] (1) 에르고스테롤 생합성의 억제제, 예컨대, 예를 들어, (1.1) 알디모르프 (1704-28-5), (1.2) 아자코나졸 (60207-31-0), (1.3) 비테르타놀 (55179-31-2), (1.4) 브로무코나졸 (116255-48-2), (1.5) 시프로코나졸 (113096-99-4), (1.6) 디클로부트라졸 (75736-33-3), (1.7) 디페노코나졸 (119446-68-3), (1.8) 디니코나졸 (83657-24-3), (1.9) 디니코나졸-M (83657-18-5), (1.10) 도데모르프 (1593-77-7), (1.11) 도데모르프 아세테이트 (31717-87-0), (1.12) 에폭시코나졸 (106325-08-0), (1.13) 에타코나졸 (60207-93-4), (1.14) 페나리몰 (60168-88-9), (1.15) 펜부코나졸 (114369-43-6), (1.16) 펜헥사미드 (126833-17-8), (1.17) 펜프로피딘

(67306-00-7), (1.18) 펜프로피모르프 (67306-03-0), (1.19) 플루퀸코나졸 (136426-54-5), (1.20) 플루르프리미돌 (56425-91-3), (1.21) 플루실라졸 (85509-19-9), (1.22) 플루트리아폴 (76674-21-0), (1.23) 푸르코나졸 (112839-33-5), (1.24) 푸르코나졸-시스 (112839-32-4), (1.25) 헥사코나졸 (79983-71-4), (1.26) 이마잘릴 (60534-80-7), (1.27) 이마잘릴 술페이트 (58594-72-2), (1.28) 이미벤코나졸 (86598-92-7), (1.29) 이프코나졸 (125225-28-7), (1.30) 메트코나졸 (125116-23-6), (1.31) 미클로부타닐 (88671-89-0), (1.32) 나프티핀 (65472-88-0), (1.33) 누아리몰 (63284-71-9), (1.34) 옥스포코나졸 (174212-12-5), (1.35) 파클로부트라졸 (76738-62-0), (1.36) 페푸라조에이트 (101903-30-4), (1.37) 펜코나졸 (66246-88-6), (1.38) 피페랄린 (3478-94-2), (1.39) 프로클로라즈 (67747-09-5), (1.40) 프로피코나졸 (60207-90-1), (1.41) 프로티오코나졸 (178928-70-6), (1.42) 피리부티카르브 (88678-67-5), (1.43) 피리페녹스 (88283-41-4), (1.44) 퀸코나졸 (103970-75-8), (1.45) 시메코나졸 (149508-90-7), (1.46) 스피록사민 (118134-30-8), (1.47) 테부코나졸 (107534-96-3), (1.48) 테르비나핀 (91161-71-6), (1.49) 테트라코나졸 (112281-77-3), (1.50) 트리아디메폰 (43121-43-3), (1.51) 트리아디메놀 (89482-17-7), (1.52) 트리데모르프 (81412-43-3), (1.53) 트리플루미졸 (68694-11-1), (1.54) 트리포린 (26644-46-2), (1.55) 트리티코나졸 (131983-72-7), (1.56) 유니코나졸 (83657-22-1), (1.57) 유니코나졸-p (83657-17-4), (1.58) 비니코나졸 (77174-66-4), (1.59) 보리코나졸 (137234-62-9), (1.60) 1-(4-클로로페닐)-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)시클로헥탄올 (129586-32-9), (1.61) 메틸 1-(2,2-디메틸-2,3-디히드로-1H-인덴-1-일)-1H-이미다졸-5-카르복실레이트 (110323-95-0), (1.62) N'-{5-(디플루오로메틸)-2-메틸-4-[3-(트리메틸실릴)프로폭시]페닐}-N-에틸-N-메틸이미도포름아미드, (1.63) N-에틸-N-메틸-N'-{2-메틸-5-(트리플루오로메틸)-4-[3-(트리메틸실릴)프로폭시]페닐}이미도포름아미드 및 (1.64) O-[1-(4-메톡시페녹시)-3,3-디메틸부탄-2-일] 1H-이미다졸-1-카르보티오에이트 (111226-71-2).

[0375]

(2) 호흡 억제제 (호흡 연쇄 억제제), 예컨대, 예를 들어, (2.1) 빅사펜 (581809-46-3), (2.2) 보스칼리드 (188425-85-6), (2.3) 카르복신 (5234-68-4), (2.4) 디플루메토림 (130339-07-0), (2.5) 펜푸람 (24691-80-3), (2.6) 플루오피람 (658066-35-4), (2.7) 플루톨라닐 (66332-96-5), (2.8) 플룩사피록사드 (907204-31-3), (2.9) 푸라메트피르 (123572-88-3), (2.10) 푸르메시클록스 (60568-05-0), (2.11) 신-에피머 라세미체 1RS,4SR,9RS 및 안티-에피머 라세미체 1RS,4SR,9SR의 이소피라잠 혼합물 (881685-58-1), (2.12) 이소피라잠 (안티-에피머 라세미체), (2.13) 이소피라잠 (안티-에피머 거울상 이성질체 1R,4S,9S), (2.14) 이소피라잠 (안티-에피머 거울상 이성질체 1S,4R,9R), (2.15) 이소피라잠 (신-에피머 라세미체 1RS,4SR,9RS), (2.16) 이소피라잠 (신-에피머 거울상 이성질체 1R,4S,9R), (2.17) 이소피라잠 (신-에피머 거울상 이성질체 1S,4R,9S), (2.18) 메프로닐 (55814-41-0), (2.19) 옥시카르복신 (5259-88-1), (2.20) 펜플루펜 (494793-67-8), (2.21) 펜티오피라드 (183675-82-3), (2.22) 세탁산 (874967-67-6), (2.23) 티플루자미드 (130000-40-7), (2.24) 1-메틸-N-[2-(1,1,2,2-테트라플루오로에톡시)페닐]-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (2.25) 3-(디플루오로메틸)-1-메틸-N-[2-(1,1,2,2-테트라플루오로에톡시)페닐]-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (2.26) 3-(디플루오로메틸)-N-[4-플루오로-2-(1,1,2,3,3,3-헥사플루오로프로폭시)페닐]-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (2.27) N-[1-(2,4-디클로로페닐)-1-메톡시프로판-2-일]-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드 (1092400-95-7), (2.28) 5,8-디플루오로-N-[2-(2-플루오로-4-{[4-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]옥시}페닐)에틸]퀴나졸린-4-아민 (1210070-84-0) (WO2010025451로부터 공지됨), (2.29) N-[9-(디클로로메틸렌)-1,2,3,4-테트라히드로-1,4-메타노나프탈렌-5-일]-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(디클로로메틸렌)-1,2,3,4-테트라히드로-1,4-메타노나프탈렌-5-일]-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드 및 (2.31) N-[(1R,4S)-9-(디클로로메틸렌)-1,2,3,4-테트라히드로-1,4-메타노나프탈렌-5-일]-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드.

[0376]

(3) 호흡 연쇄의 복합체 III에 대해 작용하는 호흡 억제제 (호흡 연쇄 억제제), 예컨대, 예를 들어, (3.1) 아메톡트라딘 (865318-97-4), (3.2) 아미술브롬 (348635-87-0), (3.3) 아족시스트로빈 (131860-33-8), (3.4) 시아조파미드 (120116-88-3), (3.5) 쿠메톡시스트로빈 (850881-30-0), (3.6) 쿠목시스트로빈 (850881-70-8), (3.5) 디목시스트로빈 (141600-52-4), (3.6) 에네스트로부린 (238410-11-2) (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.9) 파목사돈 (131807-57-3) (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.10) 페나미돈 (161326-34-7) (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.11) 페녹시스트로빈 (918162-02-4), (3.12) 플루옥사스트로빈 (361377-29-9) (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.13) 크레속심-메틸 (143390-89-0) (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.14) 메토미노스트로빈 (133408-50-1) (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.15) 오리사스트로빈 (189892-69-1) (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.16) 피록시스트로빈 (117428-22-5) (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.17) 피라클로스트로빈 (175013-18-0) (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.18) 피라메토스트로빈 (915410-70-7) (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.19) 피라옥시스트로빈 (862588-11-2) (WO 2004/058723으로부터 공

지됨), (3.20) 피리벤카르브 (799247-52-2) (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.21) 트리클로피리카르브 (902760-40-1), (3.22) 트리플록시스트로빈 (141517-21-7) (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.23) (2E)-2-(2-{[6-(3-클로로-2-메틸페녹시)-5-플루오로피리미딘-4-일]옥시}페닐)-2-(메톡시이미노)-N-메틸에탄아미드 (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.24) (2E)-2-(메톡시이미노)-N-메틸-2-(2-{[(1E)-1-[3-(트리플루오로메틸)페닐]에틸리덴]아미노}옥시]메틸}페닐)에탄아미드 (WO 2004/058723으로부터 공지됨), (3.25) (2E)-2-(메톡시이미노)-N-메틸-2-{2-[(E)-({1-[3-(트리플루오로메틸)페닐]에톡시}이미노)메틸}페닐]에탄아미드 (158169-73-4), (3.26) (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-{[(E)-1-플루오로-2-페닐에테닐]옥시}페닐)에틸리덴]아미노}옥시]메틸}페닐}-2-(메톡시이미노)-N-메틸에탄아미드 (326896-28-0), (3.27) (2E)-2-{2-[(2E,3E)-4-(2,6-디클로로페닐)부트-3-엔-2-일리덴]아미노}옥시]메틸}페닐}-2-(메톡시이미노)-N-메틸에탄아미드, (3.28) 2-클로로-N-(1,1,3-트리메틸-2,3-디히드로-1H-인덴-4-일)피리딘-3-카르복사아미드 (119899-14-8), (3.29) 5-메톡시-2-메틸-4-(2-{[(1E)-1-[3-(트리플루오로메틸)페닐]에틸리덴]아미노}옥시]메틸}페닐)-2,4-디히드로-3H-1,2,4-트리아졸-3-온, (3.30) 메틸 (2E)-2-{2-[(시클로프로필[(4-메톡시페닐)이미노]메틸}술폰닐)메틸}페닐}-3-메톡시프로프-2-에노에이트 (149601-03-6), (3.31) N-(3-에틸-3,5,5-트리메틸시클로헥실)-3-(포르밀아미노)-2-히드록시벤즈아미드 (226551-21-9), (3.32) 2-{2-[(2,5-디메틸페녹시)메틸}페닐}-2-메톡시-N-메틸아세트아미드 (173662-97-0) 및 (3.33) (2R)-2-{2-[(2,5-디메틸페녹시)메틸}페닐}-2-메톡시-N-메틸아세트아미드 (394657-24-0).

[0377] (4) 유사분열 및 세포 분열의 억제제, 예컨대, 예를 들어, (4.1) 베노밀 (17804-35-2), (4.2) 카르벤다짐 (10605-21-7), (4.3) 클로르페나졸 (3574-96-7), (4.4) 디에토펜카르브 (87130-20-9), (4.5) 에타복삼 (162650-77-3), (4.6) 플루오피콜리드 (239110-15-7), (4.7) 푸베리다졸 (3878-19-1), (4.8) 펜시쿠론 (66063-05-6), (4.9) 티아벤다졸 (148-79-8), (4.10) 티오파네이트-메틸 (23564-05-8), (4.11) 티오파네이트 (23564-06-9), (4.12) 족사미드 (156052-68-5), (4.13) 5-클로로-7-(4-메틸피페리딘-1-일)-6-(2,4,6-트리플루오로페닐)[1,2,4]트리아졸로[1,5-a]피리미딘 (214706-53-3) 및 (4.14) 3-클로로-5-(6-클로로피리딘-3-일)-6-메틸-4-(2,4,6-트리플루오로페닐)피리다진 (1002756-87-7).

[0378] (5) 다중부위 활성을 갖는 화합물, 예컨대, 예를 들어, (5.1) 보르도 혼합물 (8011-63-0), (5.2) 캡타폴 (2425-06-1), (5.3) 캡탄 (133-06-2) (WO 02/12172로부터 공지됨), (5.4) 클로로탈로닐 (1897-45-6), (5.5) 구리 제제, 예컨대 수산화구리 (20427-59-2), (5.6) 나프텐산구리 (1338-02-9), (5.7) 산화구리 (1317-39-1), (5.8) 옥시염화구리 (1332-40-7), (5.9) 황산구리 (7758-98-7), (5.10) 디클로플루아니드 (1085-98-9), (5.11) 디티아논 (3347-22-6), (5.12) 도딘 (2439-10-3), (5.13) 도딘 유리 염기, (5.14) 페르밤 (14484-64-1), (5.15) 플루오로폴페트 (719-96-0), (5.16) 폴페트 (133-07-3), (5.17) 구아자틴 (108173-90-6), (5.18) 구아자틴 아세테이트, (5.19) 이미녹타딘 (13516-27-3), (5.20) 이미녹타딘 알베실레이트 (169202-06-6), (5.21) 이미녹타딘 트리아세테이트 (57520-17-9), (5.22) 만코페 (53988-93-5), (5.23) 만코제브 (8018-01-7), (5.24) 마네브 (12427-38-2), (5.25) 메티람 (9006-42-2), (5.26) 아연 메티람 (9006-42-2), (5.27) 구리-옥신 (10380-28-6), (5.28) 프로파미딘 (104-32-5), (5.29) 프로피네브 (12071-83-9), (5.30) 황 및 황 제제, 예컨대, 예를 들어, 칼슘 폴리술피드 (7704-34-9), (5.31) 티람 (137-26-8), (5.32) 툴릴플루아니드 (731-27-1), (5.33) 지네브 (12122-67-7) 및 (5.34) 지람 (137-30-4).

[0379] (6) 내성 유도제, 예컨대, 예를 들어, (6.1) 아시벤졸라르-S-메틸 (135158-54-2), (6.2) 이소티아닐 (224049-04-1), (6.3) 프로베나졸 (27605-76-1) 및 (6.4) 티아디닐 (223580-51-6).

[0380] (7) 아미노산 및 단백질 생합성의 억제제, 예컨대, 예를 들어, (7.1) 안도프림 (23951-85-1), (7.2) 블라스티시딘-S (2079-00-7), (7.3) 시프로디닐 (121552-61-2), (7.4) 카수가마이신 (6980-18-3), (7.5) 카수가마이신 히드로클로라이드 수화물 (19408-46-9), (7.6) 메파니피람 (110235-47-7), (7.7) 피리메타닐 (53112-28-0) 및 (7.8) 3-(5-플루오로-3,3,4,4-테트라메틸-3,4-디히드로이소퀴놀린-1-일)퀴놀린 (861647-32-7) (WO2005070917로부터 공지됨).

[0381] (8) ATP 생산 억제제, 예컨대, 예를 들어, (8.1) 펜틴 아세테이트 (900-95-8), (8.2) 펜틴 클로라이드 (639-58-7), (8.3) 펜틴 히드록시드 (76-87-9) 및 (8.4) 실티오팜 (175217-20-6).

[0382] (9) 세포벽 합성의 억제제, 예컨대, 예를 들어, (9.1) 벤티아발리카르브 (177406-68-7), (9.2) 디메토모르프 (110488-70-5), (9.3) 플루모르프 (211867-47-9), (9.4) 이프로발리카르브 (140923-17-7), (9.5) 만디프로파미드 (374726-62-2), (9.6) 폴리옥신 (11113-80-7), (9.7) 폴리옥소림 (22976-86-9), (9.8) 발리다마이신 A (37248-47-8) 및 (9.9) 발리페날레이트 (283159-94-4; 283159-90-0).

[0383] (10) 지질 및 막 합성의 억제제, 예컨대, 예를 들어, (10.1) 비페닐 (92-52-4), (10.2) 클로로네브 (2675-77-

6), (10.3) 디클로란 (99-30-9), (10.4) 에디펜포스 (17109-49-8), (10.5) 에트리디아졸 (2593-15-9), (10.6) 아이오도카르브 (55406-53-6), (10.7) 이프로벤포스 (26087-47-8), (10.8) 이소프로티올란 (50512-35-1), (10.9) 프로파모카르브 (25606-41-1), (10.10) 프로파모카르브 히드로클로라이드 (25606-41-1), (10.11) 프로티오카르브 (19622-08-3), (10.12) 피라조포스 (13457-18-6), (10.13) 퀴토젠 (82-68-8), (10.14) 테크나젠 (117-18-0) 및 (10.15) 톨클로포스-메틸 (57018-04-9).

[0384] (11) 멜라닌 생합성 억제제, 예컨대, 예를 들어, (11.1) 카르프로파미드 (104030-54-8), (11.2) 디클로시메트 (139920-32-4), (11.3) 페녹사닐 (115852-48-7), (11.4) 프탈리드 (27355-22-2), (11.5) 피로퀼론 (57369-32-1), (11.6) 트리시클라졸 (41814-78-2) 및 (11.7) 2,2,2-트리플루오로에틸 {3-메틸-1-[(4-메틸벤조일)아미노]부탄-2-일}카르바메이트 (851524-22-6) (W02005042474로부터 공지됨).

[0385] (12) 핵산 합성의 억제제, 예컨대, 예를 들어, (12.1) 베날락실 (71626-11-4), (12.2) 베날락실-M (키랄락실) (98243-83-5), (12.3) 부피리메이트 (41483-43-6), (12.4) 클로질라콘 (67932-85-8), (12.5) 디메티리몰 (5221-53-4), (12.6) 에티리몰 (23947-60-6), (12.7) 푸랄락실 (57646-30-7), (12.8) 히멕사졸 (10004-44-1), (12.9) 메탈락실 (57837-19-1), (12.10) 메탈락실-M (메페녹삼) (70630-17-0), (12.11) 오프레이스 (58810-48-3), (12.12) 옥사디실 (77732-09-3) 및 (12.13) 옥솔린산 (14698-29-4).

[0386] (13) 신호 전달 억제제, 예컨대, 예를 들어, (13.1) 클로질리네이트 (84332-86-5), (13.2) 펜피클로닐 (74738-17-3), (13.3) 플루디옥소닐 (131341-86-1), (13.4) 이프로디온 (36734-19-7), (13.5) 프로시미돈 (32809-16-8), (13.6) 퀴녹시펜 (124495-18-7) 및 (13.7) 빈클로졸린 (50471-44-8).

[0387] (14) 탈커플링제, 예컨대, 예를 들어, (14.1) 비나파크릴 (485-31-4), (14.2) 디노캡 (131-72-6), (14.3) 페립존 (89269-64-7), (14.4) 플루아지남 (79622-59-6) 및 (14.5) 맵틸디노캡 (131-72-6).

[0388] (15) 추가의 화합물, 예컨대, 예를 들어, (15.1) 벤티아졸 (21564-17-0), (15.2) 베크사진 (163269-30-5), (15.3) 카프시마이신 (70694-08-5), (15.4) 카르본 (99-49-0), (15.5) 키노메티오네이트 (2439-01-2), (15.6) 피리오페논 (클라자페논) (688046-61-9), (15.7) 쿠프라네브 (11096-18-7), (15.8) 시플루페나미드 (180409-60-3), (15.9) 시목사닐 (57966-95-7), (15.10) 시프로술파미드 (221667-31-8), (15.11) 다조메트 (533-74-4), (15.12) 데바카르브 (62732-91-6), (15.13) 디클로로펜 (97-23-4), (15.14) 디클로메진 (62865-36-5), (15.15) 디펜조퀴트 (49866-87-7), (15.16) 디펜조퀴트 메틸술페이트 (43222-48-6), (15.17) 디페닐아민 (122-39-4), (15.18) 에코메이트(EcoMate), (15.19) 펜피라자민 (473798-59-3), (15.20) 플루메토베르 (154025-04-4), (15.21) 플루오로미드 (41205-21-4), (15.22) 플루술파미드 (106917-52-6), (15.23) 플루티아닐 (304900-25-2), (15.24) 포세틸-알루미늄 (39148-24-8), (15.25) 포세틸-칼슘, (15.26) 포세틸-소듐 (39148-16-8), (15.27) 핵사클로로벤젠 (118-74-1), (15.28) 이루마마이신 (81604-73-1), (15.29) 메타술포카르브 (66952-49-6), (15.30) 메틸 이소티오시아네이트 (556-61-6), (15.31) 메트라페논 (220899-03-6), (15.32) 밀디오마이신 (67527-71-3), (15.33) 나타마이신 (7681-93-8), (15.34) 니켈 디메틸디티오카르바메이트 (15521-65-0), (15.35) 니트로탈-이소프로필 (10552-74-6), (15.36) 옥틸리논 (26530-20-1), (15.37) 옥사모카르브 (917242-12-7), (15.38) 옥시펜티인 (34407-87-9), (15.39) 펜타클로로페놀 및 그의 염 (87-86-5), (15.40) 페노트린, (15.41) 인산 및 그의 염 (13598-36-2), (15.42) 프로파모카르브-포세틸레이트, (15.43) 프로파노신-소듐 (88498-02-6), (15.44) 프로키나지드 (189278-12-4), (15.45) 피리모르프 (868390-90-3), (15.45e) (2E)-3-(4-tert-부틸페닐)-3-(2-클로로피리딘-4-일)-1-(모르폴린-4-일)프로프-2-엔-1-온 (1231776-28-5), (15.45z) (2Z)-3-(4-tert-부틸페닐)-3-(2-클로로피리딘-4-일)-1-(모르폴린-4-일)프로프-2-엔-1-온 (1231776-29-6), (15.46) 피롤니트린 (1018-71-9) (EP-A 1 559 320으로부터 공지됨), (15.47) 테부플로퀼 (376645-78-2), (15.48) 테클로프탈람 (76280-91-6), (15.49) 톨니파니드 (304911-98-6), (15.50) 트리아족시드 (72459-58-6), (15.51) 트리클라미드 (70193-21-4), (15.52) 차릴라미드 (84527-51-5), (15.53) (3S,6S,7R,8R)-8-벤질-3-[(3-[(이소부틸옥시)메톡시]-4-메톡시피리딘-2-일}카르보닐)아미노]-6-메틸-4,9-디옥소-1,5-디옥소난-7-일 2-메틸프로파노에이트 (517875-34-2) (W02003035617로부터 공지됨), (15.54) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-디플루오로페닐)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-일)-2-[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에타논 (1003319-79-6), (15.55) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-디플루오로페닐)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-일)-2-[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에타논 (1003319-80-9), (15.56) 1-(4-{4-[5-(2,6-디플루오로페닐)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-일)-2-[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에타논 (1003318-67-9), (15.57) 1-(4-메톡시페녹시)-3,3-디메틸부탄-2-일 1H-이미다졸-1-카르복실레이트 (111227-17-9), (15.58) 2,3,5,6-테트라클로로-4-(메틸술포닐)피리딘 (13108-52-6), (15.59) 2,3-디부틸-6-클로로티에노[2,3-d]피리미딘-4(3H)-온 (221451-58-7), (15.60) 2,6-디메틸-

1H, 5H-[1,4]디티이노[2,3-c:5,6-c']디피롤-1,3,5,7(2H,6H)-테트론, (15.61) 2-[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]-1-(4-{4-[(5R)-5-페닐-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-일)에타논 (1003316-53-7), (15.62) 2-[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]-1-(4-{4-[(5S)-5-페닐-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-일)에타논 (1003316-54-8), (15.63) 2-[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]-1-{4-[4-(5-페닐-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일)-1,3-티아졸-2-일]피페리딘-1-일}에타논 (1003316-51-5), (15.64) 2-부톡시-6-아이오도-3-프로필-4H-크로멘-4-온, (15.65) 2-클로로-5-[2-클로로-1-(2,6-디플루오로-4-메톡시페닐)-4-메틸-1H-이미다졸-5-일]피리딘, (15.66) 2-페닐페놀 및 그의 염 (90-43-7), (15.67) 3-(4,4,5-트리플루오로-3,3-디메틸-3,4-디히드로이소퀴놀린-1-일)퀴놀린 (861647-85-0) (W02005070917로부터 공지됨), (15.68) 3,4,5-트리클로로피리딘-2,6-디카르보닐트릴 (17824-85-0), (15.69) 3-[5-(4-클로로페닐)-2,3-디메틸-1,2-옥사졸리딘-3-일]피리딘, (15.70) 3-클로로-5-(4-클로로페닐)-4-(2,6-디플루오로페닐)-6-메틸피리다진, (15.71) 4-(4-클로로페닐)-5-(2,6-디플루오로페닐)-3,6-디메틸피리다진, (15.72) 5-아미노-1,3,4-티아디아졸-2-티올, (15.73) 5-클로로-N'-페닐-N'-(프로프-2-인-1-일)티오펜-2-술포노히드라지드 (134-31-6), (15.74) 5-플루오로-2-[(4-플루오로벤질)옥시]피리미딘-4-아민 (1174376-11-4) (W02009094442로부터 공지됨), (15.75) 5-플루오로-2-[(4-메틸벤질)옥시]피리미딘-4-아민 (1174376-25-0) (W02009094442로부터 공지됨), (15.76) 5-메틸-6-옥틸[1,2,4]트리아졸로[1,5-a]피리미딘-7-아민, (15.77) 에틸-(2Z)-3-아미노-2-시아노-3-페닐프로프-2-에노에이트, (15.78) N'-(4-{3-(4-클로로벤질)-1,2,4-티아디아졸-5-일}옥시)-2,5-디메틸페닐)-N-에틸-N-메틸이미도포름아미드, (15.79) N-(4-클로로벤질)-3-[3-메톡시-4-(프로프-2-인-1-일옥시)페닐]프로판아미드, (15.80) N-[(4-클로로페닐)(시아노)메틸]-3-[3-메톡시-4-(프로프-2-인-1-일옥시)페닐]프로판아미드, (15.81) N-[(5-브로모-3-클로로피리딘-2-일)메틸]-2,4-디클로로피리딘-3-카르복스아미드, (15.82) N-[1-(5-브로모-3-클로로피리딘-2-일)에틸]-2,4-디클로로피리딘-3-카르복스아미드, (15.83) N-[1-(5-브로모-3-클로로피리딘-2-일)에틸]-2-플루오로-4-아이오도피리딘-3-카르복스아미드, (15.84) N-{(E)-[(시클로프로필메톡시)이미노][6-(디플루오로메톡시)-2,3-디플루오로페닐]메틸}-2-페닐아세트아미드 (221201-92-9), (15.85) N-{(Z)-[(시클로프로필메톡시)이미노][6-(디플루오로메톡시)-2,3-디플루오로페닐]메틸}-2-페닐아세트아미드 (221201-92-9), (15.86) N'-{4-[(3-tert-부틸-4-시아노-1,2-티아졸-5-일)옥시]-2-클로로-5-메틸페닐}-N-에틸-N-메틸이미도포름아미드, (15.87) N-메틸-2-(1-{[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸}피페리딘-4-일)-N-(1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-1-일)-1,3-티아졸-4-카르복스아미드 (922514-49-6), (15.88) N-메틸-2-(1-{[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸}피페리딘-4-일)-N-[(1R)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-1-일]-1,3-티아졸-4-카르복스아미드 (922514-07-6), (15.89) N-메틸-2-(1-{[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸}피페리딘-4-일)-N-[(1S)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-1-일]-1,3-티아졸-4-카르복스아미드 (922514-48-5), (15.90) 켄탈-6-[(1-{(1-메틸-1H-테트라졸-5-일)(페닐)메틸리덴}아미노)옥시)메틸]피리딘-2-일}카르바메이트, (15.91) 페나진-1-카르복실산, (15.92) 퀴놀린-8-올 (134-31-6), (15.93) 퀴놀린-8-올 술페이트 (2:1) (134-31-6) 및 tert-부틸 6-[(1-{(1-메틸-1H-테트라졸-5-일)(페닐)메틸리덴}아미노)옥시)메틸]피리딘-2-일}카르바메이트.

[0389]

(16) 추가의 화합물, 예컨대, 예를 들어, (16.1) 1-메틸-3-(트리플루오로메틸)-N-[2'-(트리플루오로메틸)비페닐-2-일]-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.2) N-(4'-클로로비페닐-2-일)-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.3) N-(2',4'-디클로로비페닐-2-일)-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.4) 3-(디플루오로메틸)-1-메틸-N-[4'-(트리플루오로메틸)비페닐-2-일]-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.5) N-(2',5'-디플루오로비페닐-2-일)-1-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.6) 3-(디플루오로메틸)-1-메틸-N-[4'-(프로프-1-인-1-일)비페닐-2-일]-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.7) 5-플루오로-1,3-디메틸-N-[4'-(프로프-1-인-1-일)비페닐-2-일]-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.8) 2-클로로-N-[4'-(프로프-1-인-1-일)비페닐-2-일]피리딘-3-카르복스아미드, (16.9) 3-(디플루오로메틸)-N-[4'-(3,3-디메틸부트-1-인-1-일)비페닐-2-일]-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.10) N-[4'-(3,3-디메틸부트-1-인-1-일)비페닐-2-일]-5-플루오로-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.11) 3-(디플루오로메틸)-N-(4'-에티닐비페닐-2-일)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.12) N-(4'-에티닐비페닐-2-일)-5-플루오로-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.13) 2-클로로-N-(4'-에티닐비페닐-2-일)피리딘-3-카르복스아미드, (16.14) 2-클로로-N-[4'-(3,3-디메틸부트-1-인-1-일)비페닐-2-일]피리딘-3-카르복스아미드 (EP-A 1 559 320으로부터 공지됨), (16.15) 4-(디플루오로메틸)-2-메틸-N-[4'-(트리플루오로메틸)비페닐-2-일]-1,3-티아졸-5-카르복스아미드, (16.16) 5-플루오로-N-[4'-(3-히드록시-3-메틸부트-1-인-1-일)비페닐-2-일]-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.17) 2-클로로-N-[4'-(3-히드록시-3-메틸부트-1-인-1-일)비페닐-2-일]피리딘-3-카르복스아미드,

(16.18) 3-(디플루오로메틸)-N-[4'-(3-메톡시-3-메틸부트-1-인-1-일)비페닐-2-일]-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.19) 5-플루오로-N-[4'-(3-메톡시-3-메틸부트-1-인-1-일)비페닐-2-일]-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복스아미드, (16.20) 2-클로로-N-[4'-(3-메톡시-3-메틸부트-1-인-1-일)비페닐-2-일]피리딘-3-카르복스아미드, (16.21) (5-브로모-2-메톡시-4-메틸피리딘-3-일)(2,3,4-트리메톡시-6-메틸페닐)메탄올, (16.22) N-[2-(4-{[3-(4-클로로페닐)프로프-2-인-1-일]옥시}-3-메톡시페닐)에틸]-N2-(메틸술포닐)발린아미드 (220706-93-4), (16.23) 4-옥소-4-[(2-페닐에틸)아미노]부탄산 및 (16.24) 부트-3-인-1-일 {6-[(Z)-(1-메틸-1H-테트라졸-5-일)(페닐)메틸렌]아미노}옥시)메틸]피리딘-2-일}카르바메이트.

- [0390] 부류 (1) 내지 (16)에 언급된 모든 혼합 파트너는, 이들이 이들의 관능기를 기준으로 하여 가능한 경우에, 임의로 적합한 염기 또는 산과 염을 형성한다.
- [0391] 다른 공지된 활성 화합물, 예컨대 제초제, 비료, 성장 조절제, 완화제, 신호화합물질, 또는 다르게는 식물 성질을 개선하는 작용제와의 혼합물이 또한 가능하다.
- [0392] 살균제로서 사용되는 경우에, 본 발명에 따른 활성 화합물은 또한 상승작용제와의 혼합물로서, 그의 상업적으로 입수가능한 제제로 및 이러한 제제로부터 제조된 사용 형태로 존재할 수 있다. 상승작용제는 활성 화합물의 작용을 증진시키는 화합물이며, 첨가된 상승작용제가 그 자체로 활성일 어떠한 필요도 없다.
- [0393] 살균제로서 사용되는 경우에, 본 발명에 따른 활성 화합물은 또한, 식물의 환경에서, 식물 부분의 표면 상에서 또는 식물 조직에서 사용 후에 활성 화합물의 분해를 감소시키는 억제제와의 혼합물로서, 그의 상업적으로 입수가능한 제제로 및 이러한 제제로부터 제조된 사용 형태로 존재할 수 있다.
- [0394] 본 발명에 따르면, 모든 식물 및 식물 부분을 처리하는 것이 가능하다. 식물은 본원에서 모든 식물 및 식물 군집, 예컨대 목작물 및 목작물하지 않는 야생 식물 또는 작물 식물 (자연 발생 작물 식물 포함)을 의미하는 것으로 이해된다. 작물 식물은 통상의 육종 및 최적화 방법에 의해 또는 생명공학 및 유전-공학 방법, 또는 이들 방법의 조합에 의해 얻어질 수 있는 식물, 예를 들어 트랜스제닉 식물 및 예를 들어 식물 육종가 관리에 의해 보호가능하고 보호가능하지 않은 식물 재배품종일 수 있다. 식물 부분은 식물의 모든 지상부 및 지하부 및 기관, 예컨대 싹, 잎, 꽃 및 뿌리를 의미하는 것으로 이해될 것이고, 그 예는 잎, 가지, 줄기, 몸체, 꽃, 과실체, 과실 및 종자, 및 또한 뿌리, 괴경 및 근경을 포함한다. 식물 부분은 또한 수확된 물질 및 영양 및 생식 번식 물질, 예를 들어 묘목, 괴경, 근경, 자른 가지 및 종자를 포함한다.
- [0395] 활성 화합물을 사용하는 식물 및 식물 부분의 본 발명에 따른 처리는 직접적으로, 또는 통상의 처리 방법에 의해, 예를 들어 침지, 분무, 증발, 연무, 스캐터링, 페인팅, 주사에 의해 화합물을 주변, 서식지 또는 저장 공간에 작용하도록 함으로써, 및 번식 재료의 경우에, 특히 종자의 경우에는 또한 하나 이상의 외피를 적용함으로써 수행된다.
- [0396] 상기 이미 언급된 바와 같이, 본 발명에 따라 모든 식물 및 그의 부분을 처리하는 것이 가능하다. 바람직한 실시양태에서, 야생 식물 종 및 식물 재배품종, 또는 통상의 생물학적 육종 방법, 예컨대 교배 또는 원형질체 융합에 의해 얻어진 것들, 및 또한 그의 부분이 처리된다. 추가 바람직한 실시양태에서, 적절한 경우에 통상의 방법과 조합된 유전 공학 방법에 의해 수득된 트랜스제닉 식물 및 식물 재배품종 (유전자 변형 유기체) 및 그의 부분이 처리된다. 용어 "부분" 또는 "식물의 부분" 또는 "식물 부분"은 상기에 설명되어 있다.
- [0397] 보다 바람직하게는, 상업적으로 입수가능하거나 또는 사용 중인 식물 재배품종의 식물은 본 발명에 따라 처리된다. 식물 재배품종은 새로운 특성 ("형질")을 가지며 통상의 육종에 의해, 돌연변이유발에 의해 또는 재조합 DNA 기술에 의해 얻어진 식물을 의미하는 것으로 이해된다. 이들은 재배품종, 생물형 및 유전자형일 수 있다.
- [0398] 식물 종 또는 식물 재배품종, 그의 위치 및 성장 조건 (토양, 기후, 식생 주기, 식이)에 따라, 본 발명에 따른 처리는 또한 초상가적 ("상승작용적") 효과를 생성할 수 있다. 예를 들어, 가능성은 감소된 적용률 및/또는 활성 스펙트럼의 확장 및/또는 본 발명에 따라 사용가능한 화합물 및 조성물의 활성에서의 증가, 보다 우수한 식물 성장, 고온 또는 저온에 대한 증가된 저항성, 가뭄 또는 수분 수준 또는 토양 염도에 대한 증가된 저항성, 증진된 개화능, 보다 용이한 수확, 가속화된 숙성, 보다 높은 수율, 수확된 생산물의 보다 높은 품질 및/또는 보다 높은 영양가, 수확된 생산물의 증가된 저장 수명 및/또는 가공성을 포함하고, 이는 통상적으로 예상되는 효과를 능가한다.
- [0399] 본 발명에 따라 처리하려는 바람직한 트랜스제닉 식물 또는 식물 재배품종 (유전 공학에 의해 수득된 것들)은 유전자 변형을 통해 이들 식물에 특정한 유리하고 유용한 형질을 부여하는 유전 물질을 수용한 모든 식물을 포함한다. 이러한 특성의 예는 보다 우수한 식물 성장, 고온 또는 저온에 대한 증가된 저항성, 가뭄 또는 수분

수준 또는 토양 염도에 대한 증가된 저항성, 증진된 개화능, 보다 용이한 수확, 가속화된 숙성, 보다 높은 수율, 수확된 생산물의 보다 높은 품질 및/또는 보다 높은 영양가, 수확된 산물의 보다 장기 저장 수명 및/또는 가공성이다. 추가로 및 특히 강조되는 이러한 특성의 예는 동물 및 미생물 해충에 대한, 예컨대 곤충, 응애, 식물병원성 진균, 박테리아 및/또는 바이러스에 대한 식물의 개선된 방어, 및 또한 특정의 제초 활성 성분에 대한 식물의 증가된 저항성이다. 언급될 수 있는 트랜스제닉 식물의 예는 중요한 작물 식물, 예컨대 곡류 (밀, 벼), 옥수수, 대두, 감자, 사탕무, 토마토, 완두콩 및 다른 유형의 채소, 목화, 담배, 유지종자 평지, 및 또한 과실 식물 (사과, 배, 감귤류 및 포도의 과실 포함)이며, 옥수수, 대두, 감자, 목화, 담배 및 유지종자 평지가 특히 강조된다. 특히 강조되는 형질은 식물에서 형성되는 독소, 특히 바실루스 투링기엔시스(*Bacillus thuringiensis*)로부터의 유전 물질에 의해 (예를 들어, 유전자 CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb 및 CryIF, 및 또한 이들의 조합에 의해) 식물에서 형성되는 것들에 의한, 곤충류, 거미류, 선충류, 민달팽이 및 달팽이에 대한 식물의 증가된 방어이다 (이하에서 "Bt 식물"로 지칭됨). 또한 특히 강조되는 형질은 전신 획득 저항성 (SAR), 시스템인, 피토알렉신, 유도인자, 및 또한 내성 유전자 및 상응하게 발현되는 단백질 및 독소에 의한, 진균, 박테리아 및 바이러스에 대한 식물의 개선된 방어이다. 추가로 특히 강조되는 형질은 특정의 활성 제초 성분, 예를 들어 이미다졸리논, 술폰일우레아, 글리포세이트 또는 포스포노트리신에 대한 식물의 증가된 저항성이다 (예를 들어, "PAT" 유전자). 목적하는 해당 형질을 부여하는 유전자는 또한 트랜스제닉 식물에서 서로 조합되어 존재할 수 있다. "Bt 식물"의 예는 옥수수 변종, 목화 변종, 대두 변종 및 감자 변종을 포함하며, 이들은 상표명 일드 가드(YIELD GARD)® (예를 들어, 옥수수, 목화, 대두), 녹아웃(KnockOut)® (예를 들어, 옥수수), 스타링크(StarLink)® (예를 들어, 옥수수), 볼가드(Bollgard)® (목화), 누코튼(Nucotn)® (목화) 및 뉴리프(NewLeaf)® (감자) 하에 판매된다. 제초제-저항성 식물의 예는 옥수수 변종, 목화 변종 및 대두 변종을 포함하며, 이들은 상표명 라운드업 레디(Roundup Ready)® (글리포세이트에 대한 저항성, 예를 들어 옥수수, 목화, 대두), 리버티 링크(Liberty Link)® (포스포노트리신에 대한 저항성, 예를 들어 유지종자 평지), IMI® (이미다졸리논에 대한 저항성) 및 STS® (술폰일우레아에 대한 저항성, 예를 들어 옥수수) 하에 판매된다. 언급될 수 있는 제초제-내성 식물 (제초제 저항성을 위해 통상의 방식으로 육종된 식물)은 명칭 클리어필드(Clearfield)® (예를 들어, 옥수수) 하에 판매되는 변종을 포함한다. 물론, 이들 언급은 또한 이들 유전 형질 또는 아직 개발 중이고 미래에 개발 및/또는 시판될 유전 형질을 갖는 식물 재배품종에도 적용된다.

- [0400] 열거된 식물은 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물 및/또는 활성 성분 혼합물로 특히 유리한 방식으로 본 발명에 따라 처리될 수 있다. 활성 성분 또는 혼합물에 대해 상기 언급된 바람직한 범위가 또한 이들 식물의 처리에 적용된다. 본 명세서에서 구체적으로 언급된 화합물 또는 혼합물을 사용한 식물의 처리가 특히 강조된다.
- [0401] 본 발명에 따른 활성 화합물은 식물, 위생 및 저장 제품 해충에 대해서 작용할 뿐만 아니라, 또한 수의학 분야에서 동물 기생충 (체외기생충 및 체내기생충), 예컨대 참진드기, 연진드기, 움진드기, 앞응애, 파리 (무는 형 및 핥는 형), 기생 파리 유충, 이, 머릿니, 깃털 이 및 벼룩에 대해서도 작용한다. 이들 기생충은 다음을 포함한다:
- [0402] 이목으로부터, 예를 들어, 헤마토피누스(*Haematopinus*) 종, 리노그나투스(*Linognathus*) 종, 페디쿨루스(*Pediculus*) 종, 프티루스(*Phtirus*) 종 및 솔레노포테스(*Solenopotes*) 종.
- [0403] 털이목 및 아목 암블리세리나(*Amblycerina*) 및 이쉬노세리나(*Ischnocerina*)로부터, 예를 들어, 트리메노폰(*Trimenopon*) 종, 메노폰(*Menopon*) 종, 트리노톤(*Trinoton*) 종, 보비콜라(*Bovicola*) 종, 베르넥키엘라(*Werneckiella*) 종, 레피켄트론(*Lepikentron*) 종, 다말리나(*Damalina*) 종, 트리코덱테스(*Trichodectes*) 종 및 펠리콜라(*Felicola*) 종.
- [0404] 파리목 및 아목 네마토세리나(*Nematocera*) 및 브라키세리나(*Brachycera*)로부터, 예를 들어, 아에데스(*Aedes*) 종, 아노펠레스(*Anopheles*) 종, 쿨렉스(*Culex*) 종, 시물리움(*Simulium*) 종, 유시물리움(*Eusimulium*) 종, 플레보토무스(*Phlebotomus*) 종, 루트조미아(*Lutzomyia*) 종, 쿨리코이데스(*Culicoides*) 종, 크리슘스(*Chrysops*) 종, 히보미트라(*Hybomitra*) 종, 아틸로투스(*Atylotus*) 종, 타바누스(*Tabanus*) 종, 헤마토포타(*Haematopota*) 종, 필리포미아(*Philipomyia*) 종, 브라울라(*Braula*) 종, 무스카(*Musca*) 종, 히드로타에아(*Hydrotaea*) 종, 스토크시스(*Stomoxys*) 종, 헤마토비아(*Haematobia*) 종, 모델리아(*Morellia*) 종, 판니아(*Fannia*) 종, 글로시나(*Glossina*) 종, 칼리포라(*Calliphora*) 종, 루실리아(*Lucilia*) 종, 크리소미아(*Chrysomya*) 종, 볼파르티아(*Wohlfahrtia*) 종, 사르코파가(*Sarcophaga*) 종, 오에스트루스(*Oestrus*) 종, 히포더마(*Hypoderma*) 종, 가스테로필루스(*Gasterophilus*) 종, 히포보스카(*Hippobosca*) 종, 리포프테나(*Lipoptena*)

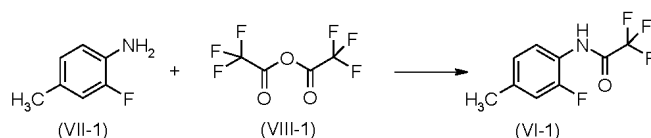
종 및 멜로파구스(Melophagus) 종.

- [0405] 벼룩목으로부터, 예를 들어, 풀렉스(Pulex) 종, 크테노세팔리데스(Ctenocephalides) 종, 크세놉실라(Xenopsylla) 종 및 세라토피루스(Ceratophyllus) 종.
- [0406] 노린재목으로부터, 예를 들어, 시멕스(Cimex) 종, 트리아토마(Triatoma) 종, 로드니우스(Rhodnius) 종 및 판스트롱길루스(Panstrongylus) 종.
- [0407] 바퀴목으로부터, 예를 들어, 블라타 오리엔탈리스(Blatta orientalis), 페리플라네타 아메리카나(Periplaneta americana), 블라텔라 게르마니카(Blattella germanica) 및 수펠라(Supella) 종.
- [0408] 응애 아강 (응애목) 및 후기문아목 및 중기문아목으로부터, 예를 들어, 아르가스(Argas) 종, 오르니토도루스(Ornithodorus) 종, 오토비우스(Otobius) 종, 익소테스(Ixodes) 종, 암블리오마(Amblyomma) 종, 부필루스(Boophilus) 종, 더마센토르(Dermacentor) 종, 헤모피살리스(Haemophysalis) 종, 히알로마(Hyalomma) 종, 리피세팔루스(Rhipicephalus) 종, 더마니수스(Dermanyssus) 종, 라일리예티아(Raillietia) 종, 뉴모니수스(Pneumonyssus) 종, 스테르노스토마(Sternostoma) 종 및 바로아(Varroa) 종.
- [0409] 진기문진드기목 (진기문아목) 및 무기문진드기목 (무기문아목)으로부터, 예를 들어, 아카라피스(Acarapis) 종, 케일레티엘라(Cheyletiella) 종, 오르니토케일레티아(Ornithocheyletia) 종, 미오비아(Myobia) 종, 프소레르가테스(Psorergates) 종, 데모텍스(Demodex) 종, 트롬비쿨라(Trombicula) 종, 리스트로포루스(Listrophorus) 종, 아카루스(Acarus) 종, 티로파구스(Tyrophagus) 종, 칼로글리푸스(Caloglyphus) 종, 히포텍테스(Hypodectes) 종, 프테롤리쿠스(Pterolichus) 종, 프소로프테스(Psoroptes) 종, 코리오프테스(Chorioptes) 종, 옥토텍테스(Otodectes) 종, 사르코프테스(Sarcoptes) 종, 노토에드레스(Notoedres) 종, 크네미도코프테스(Knemidocoptes) 종, 시토티테스(Cytodites) 종 및 라미노시오프테스(Laminosioptes) 종.
- [0410] 본 발명에 따른 화학식 I의 활성 화합물은 또한 농업용 가축, 예를 들어 소, 양, 염소, 말, 돼지, 당나귀, 낙타, 버팔로, 토끼, 닭, 칠면조, 오리, 거위, 꿀벌, 다른 가축, 예컨대, 예를 들어, 개, 고양이, 사육조, 관상어, 및 실험 동물, 예를 들어 햄스터, 기니 피그, 래트 및 마우스를 공격하는 절지동물을 방제하는데 적합하다. 이들 절지동물의 방제는 사망 사례 및 감소된 생산성 (고기, 우유, 울, 가죽, 알, 꿀 등의 감소된 생산성)을 감소시키는 것을 의미하고, 이에 따라 보다 경제적이고 보다 용이한 축산업이 본 발명에 따른 활성 화합물의 사용에 따라 가능하다.
- [0411] 본 발명에 따른 활성 화합물은 수의학 분야 및 축산업에서, 예를 들어 정제, 캡슐, 물약, 드렌치, 과립, 페이스트, 볼루스, 사료를 통한 방법 및 좌제의 형태로 경장 투여에 의해, 비경구 투여에 의해, 예컨대 예를 들어 주사 (근육내, 피하, 정맥내, 복강내 등)에 의해, 임플란트, 비강 투여에 의해, 예를 들어 침지 또는 배성, 분무, 주입, 스팟팅-온, 세척, 파우더링의 형태로 및 또한 활성 화합물을 함유하는 성형품, 예컨대 칼라, 귀 표식, 꼬리 표식, 사지 밴드, 고삐, 표시 장치 등의 도움을 받는 피부 사용에 의해 공지된 방식으로 사용된다.
- [0412] 가축, 가금류, 애완동물 등에 사용하는 경우에, 화학식 I의 활성 화합물은 활성 화합물을 1 내지 80 중량%의 양으로 포함하는 제제 (예를 들어, 분말, 에멀전, 유동제)로서 직접 또는 100 내지 10,000배 희석 후에 사용될 수 있거나, 또는 이들은 화합물질조로서 사용될 수 있다.
- [0413] 본 발명에 따른 화합물이 산업 물질을 파괴하는 곤충에 대해 강한 살곤충 작용을 갖는다는 것이 또한 밝혀진 바 있다.
- [0414] 바람직하지만 비제한적 예는 하기 곤충을 포함한다:
- [0415] 딱정벌레류, 예컨대 힐로트루페스 바줄루스(Hylotrupes bajulus), 클로로포루스 필로시스(Chlorophorus pilosis), 아노비움 폰크타툼(Anobium punctatum), 크세스토비움 루포빌로숨(Xestobium rufovillosum), 프틸리누스 펙티코르니스(Ptilinus pecticornis), 덴드로비움 페르티넥스(Dendrobium pertinex), 에르노비우스 몰리스(Ernobius mollis), 프리오비움 카르피니(Priobium carpini), 릭투스 브룬네우스(Lyctus brunneus), 릭투스 아프리카누스(Lyctus africanus), 릭투스 플라니콜리스(Lyctus planicollis), 릭투스 리네아리스(Lyctus linearis), 릭투스 푸베스센스(Lyctus pubescens), 트로고실론 아에쿠알레(Trogoxylon aequale), 민테스 루기콜리스(Minthes rugicollis), 크실레보루스(Xyleborus) 종, 트립토텐드론(Tryptodendron) 종, 아파테 모나쿠스(Apate monachus), 보스트리쿠스 카푸신스(Bostrychus capucins), 헤테로보스트리쿠스 브룬네우스(Heterobostrychus brunneus), 시녹실론(Sinoxylon) 종, 디노테루스 미누투스(Dinoderus minutus);
- [0416] 집게벌레류, 예컨대 시렉스 주벤쿠스(Sirex juvencus), 우로세루스 기가스(Urocetus gigas), 우로세루스 기가스

타이그누스(*Urocera gigas taignus*), 우로세루스 아우구르(*Urocera augur*);

- [0417] 흰개미류, 예컨대 칼로테르메스 플라비콜리스(*Kaloterme flavicollis*), 크립토테르메스 브레비스(*Cryptoterme brevis*), 헤테로테르메스 인디콜라(*Heteroterme indicola*), 레티쿨리테르메스 플라비페스(*Reticuliterme flavipes*), 레티쿨리테르메스 산토넨시스(*Reticuliterme santonensis*), 레티쿨리테르메스 루시푸구스(*Reticuliterme lucifugus*), 마스토테르메스 다르위니엔시스(*Mastoterme darwiniensis*), 주테르몹시스 네바덴시스(*Zootermopsis nevadensis*), 코프토테르메스 포르모사누스(*Coptoterme formosanus*);
- [0418] 좀류, 예컨대 레피스마 사카리나(*Lepisma saccharina*).
- [0419] 본 발명과 관련하여 산업 물질은 무생물 물질, 예컨대 바람직하게는 플라스틱, 접착제, 사이즈, 종이 및 판지, 가죽, 목재 및 가공된 목재 제품 및 코팅 조성물을 의미하는 것으로 이해된다.
- [0420] 즉시-사용 조성물은 임의로 또한 기타 살곤충제 및 임의로 하나 이상의 살진균제를 포함할 수 있다.
- [0421] 더욱이, 본 발명에 따른 화합물은 해수 또는 기수와 접촉하는 물체, 특히 선체, 스크린, 그물, 건축물, 계선구 및 신호전달 시스템을 오손에 대해 보호하는데 사용될 수 있다.
- [0422] 또한, 본 발명에 따른 화합물은 오손방지 조성물로서, 단독으로 또는 다른 활성 화합물과 조합하여 사용될 수 있다.
- [0423] 활성 화합물은 또한 가정 분야에서, 위생 분야에서 및 저장 제품의 보호에서, 밀폐 공간, 예를 들어 집, 공장 홀, 사무실, 자동차 실내 등에서 발견되는 동물 해충, 특히 곤충, 거미류 및 응애를 방제하는데 적합하다. 이들은 가정 살곤충제 제품에서 단독으로 또는 다른 활성 화합물 및 보조제와 조합하여 이들 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 이들은 감수성 및 내성 종에 대해서 및 모든 발생 단계에 대해서 효과적이다. 이들 해충은 하기를 포함한다:
- [0424] 전갈목으로부터, 예를 들어, 부투스 옥시타누스(*Buthus occitanus*).
- [0425] 응애목으로부터, 예를 들어, 아르가스 페르시쿠스(*Argas persicus*), 아르가스 레플렉수스(*Argas reflexus*), 브리오비아(*Bryobia*) 종, 더마니수스 갈리나에(*Dermanyssus gallinae*), 글리시파구스 도메스티쿠스(*Glyciphagus domesticus*), 오르니토도루스 모우바트(*Ornithodoros moubat*), 리피세팔루스 산구이네우스(*Rhipicephalus sanguineus*), 트롬비쿨라 알프레드두게시(*Trombicula alfreddugesi*), 뉴트롬비쿨라 아우툼날리스(*Neutrombicula autumnalis*), 더마토파고이데스 프테로니시무스(*Dermatophagoides pteronissimus*), 더마토파고이데스 포리나에(*Dermatophagoides forinae*).
- [0426] 거미목으로부터, 예를 들어, 아비쿨라리아다에(*Aviculariidae*), 아라네이다에(*Araneidae*).
- [0427] 통거미목으로부터, 예를 들어, 슈도스콜피오네스 켈리페르(*Pseudoscorpiones chelifer*), 슈도스콜피오네스 케일리디움(*Pseudoscorpiones cheiridium*), 오피리오네스 팔랑기움(*Opiliones phalangium*).
- [0428] 등각목으로부터, 예를 들어, 오니스쿠스 아셀루스(*Oniscus asellus*), 포르셀리오 스카베르(*Porcellio scaber*).
- [0429] 배각목으로부터, 예를 들어, 블라니울루스 구툴라투스(*Blaniulus guttulatus*), 폴리데스무스(*Polydesmus*) 종.
- [0430] 순각목으로부터, 예를 들어, 게오피루스(*Geophilus*) 종.
- [0431] 좀목으로부터, 예를 들어, 크테노레피스마(*Ctenolepisma*) 종, 레피스마 사카리나(*Lepisma saccharina*), 레피스 모데스 인퀼리누스(*Lepismodes inquilinus*).
- [0432] 바퀴목으로부터, 예를 들어, 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*), 블라텔라 게르마니카(*Blattella germanica*), 블라텔라 아사히나이(*Blattella asahinai*), 류코파에아 마데라에(*Leucophaea maderae*), 판클로라(*Panchlora*) 종, 파르코블라타(*Parcoblatta*) 종, 페리플라네타 아우스트랄라시아에(*Periplaneta australasiae*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 페리플라네타 브룬네아(*Periplaneta brunnea*), 페리플라네타 풀리기노사(*Periplaneta fuliginosa*), 수펠라 롱기팔파(*Supella longipalpa*).
- [0433] 메뚜기목으로부터, 예를 들어, 아케타 도메스티쿠스(*Acheta domesticus*).
- [0434] 집게벌레목으로부터, 예를 들어, 포르피쿨라 아우리쿨라리아(*Forficula auricularia*).
- [0435] 흰개미목으로부터, 예를 들어, 칼로테르메스(*Kaloterme*) 종, 레티쿨리테르메스(*Reticuliterme*) 종.

- [0436] 다듬이벌레목으로부터, 예를 들어, 레피나투스(*Lepinatus*) 종, 리포셀리스(*Liposcelis*) 종.
- [0437] 딱정벌레목으로부터, 예를 들어, 안트레누스(*Anthrenus*) 종, 아타게누스(*Attagenus*) 종, 데르메스테스(*Dermestes*) 종, 라테티쿠스 오리자에(*Latheticus oryzae*), 네크로비아(*Necrobia*) 종, 프티누스(*Ptinus*) 종, 리조페르타 도미니카(*Rhizopertha dominica*), 시토피루스 그라나리우스(*Sitophilus granarius*), 시토피루스 오리자에(*Sitophilus oryzae*), 시토피루스 제아마이스(*Sitophilus zeamais*), 스테고비움 파니세움(*Stegobium paniceum*).
- [0438] 파리목으로부터, 예를 들어, 아에데스 아에집티(*Aedes aegypti*), 아에데스 알보픽투스(*Aedes albopictus*), 아에데스 타에니오린쿠스(*Aedes taeniorhynchus*), 아노펠레스(*Anopheles*) 종, 칼리포라 에리트로세팔라(*Calliphora erythrocephala*), 크리소조나 플루비알리스(*Chrysozona pluvialis*), 쿨렉스 퀸퀘파시아투스(*Culex quinquefasciatus*), 쿨렉스 피피엔스(*Culex pipiens*), 쿨렉스 타르살리스(*Culex tarsalis*), 드로소필라(*Drosophila*) 종, 판니아 카니쿨라리스(*Fannia canicularis*), 무스카 도메스티카(*Musca domestica*), 플레보토무스(*Phlebotomus*) 종, 사르코파가 카르나리아(*Sarcophaga carnaria*), 시물리움(*Simulium*) 종, 스토크시스 칼시트란스(*Stomoxys calcitrans*), 티풀라 팔루도사(*Tipula paludosa*).
- [0439] 인시목으로부터, 예를 들어, 아크로이아 그리셀라(*Achroia grisella*), 갈레리아 멜로넬라(*Galleria mellonella*), 플로디아 인테르푼크텔라(*Plodia interpunctella*), 티네아 클로아셀라(*Tinea cloacella*), 티네아 펠리오넬라(*Tinea pellionella*), 티네올라 비셀리엘라(*Tineola bisselliella*).
- [0440] 벼룩목으로부터, 예를 들어, 크테노세팔리데스 카니스(*Ctenocephalides canis*), 크테노세팔리데스 펠리스(*Ctenocephalides felis*), 풀렉스 이리탄스(*Pulex irritans*), 퉁가 페네트란스(*Tunga penetrans*), 크세놉실라 케오피스(*Xenopsylla cheopis*).
- [0441] 막시목으로부터, 예를 들어, 캄포노투스 헤르쿨레아누스(*Camponotus herculeanus*), 라시우스 폴리기노수스(*Lasius fuliginosus*), 라시우스 니거(*Lasius niger*), 라시우스 움브라투스(*Lasius umbratus*), 모노모리움 파라오니스(*Monomorium pharaonis*), 파라베스풀라(*Paravespula*) 종, 테트라모리움 카에스피툼(*Tetramorium caespitum*).
- [0442] 이아목으로부터, 예를 들어, 페디쿨루스 휴마누스 카피티스(*Pediculus humanus capitis*), 페디쿨루스 휴마누스 코르포리스(*Pediculus humanus corporis*), 펌피구스(*Pemphigus*) 종, 필로에라 바스타트릭스(*Phylloera vastatrix*), 프티루스 푸비스(*Phthirus pubis*).
- [0443] 노린재목으로부터, 예를 들어, 시멕스 헤미프테루스(*Cimex hemipterus*), 시멕스 렉툴라리우스(*Cimex lectularius*), 로디누스 프롤릭수스(*Rhodinus prolixus*), 트리아토마 인페스탄스(*Triatoma infestans*).
- [0444] 가정 살곤충제의 분야에서, 이들은 단독으로, 또는 다른 적합한 활성 화합물, 예컨대 인산 에스테르, 카르바메이트, 피레트로이드, 네오니코티노이드, 성장 조절제, 또는 살곤충제의 다른 공지된 부류로부터의 활성 화합물과 조합하여 사용된다.
- [0445] 이들은 에어로졸, 무압력 분무 제품, 예를 들어 펌프 및 아토마이저 스프레이, 자동 연무 시스템, 연무기, 폼, 겔, 셀룰로스 또는 플라스틱으로 제조된 증발기 타블렛을 갖는 증발기 제품, 액체 증발기, 겔 및 막 증발기, 프로펠러-구동 증발기, 무에너지 또는 수동 증발 시스템, 방충 페이퍼, 방충 백 및 방충 겔에서, 과일 또는 분진으로서, 확산용 위한 미끼 또는 미끼집에서 사용된다.
- [0446] 방법 및 중간체의 예시
- [0447] 하기 제조 및 사용 실시예는 본 발명을 제한하지 않으면서 예시한다.
- [0448] 제조 실시예 1: 2,2,2-트리플루오로-N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐)-N,N-디메틸에탄아미드(Ib-01)
- [0449] 단계 1: 2,2,2-트리플루오로-N-(2-플루오로-4-메틸페닐)아세트아미드 (VI-1)

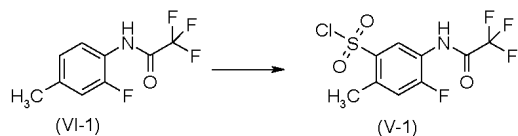


[0450]

[0451] 0℃에서, 2-플루오로-4-메틸아닐린 27.5 g을 처음에 디클로로메탄 300 ml에 충전시키고, 트리에틸아민 26.7 g을 첨가하고, 이어서 트리플루오로아세트산 무수물 50.8 g을 적가하였다. 혼합물을 0℃에서 추가 2시간 동안 교반하고, 이어서 회전 증발에 의해 농축시켰다. 잔류물을 물에 녹이고, 에틸 아세테이트로 2회 추출하였다. 합한 유기 상을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 용매를 감압 하에 제거하였다. 이와 같이 하여 트리플루오로아세트아미드 (VI-1) 49.0 g (이론치의 100%)을 수득하였다.

[0452] $\log P(\text{HCOOH})$: 2.40

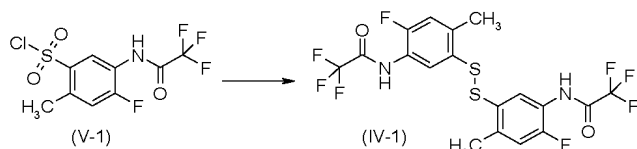
[0453] 단계 2: 4-플루오로-2-메틸-5-[(트리플루오로아세틸)아미노]벤젠설폰일 클로라이드 (V-1)



[0454]

[0455] 클로로설폰산 258 g을 처음에 충전시키고, 2,2,2-트리플루오로-N-(2-플루오로-4-메틸페닐)아세트아미드 (VI-1) 49 g을 실온에서 조금씩 첨가하였다. 혼합물을 실온에서 추가 16시간 동안 교반하였다. 교반하면서, 혼합물을 얼음에 첨가하고, 에틸 아세테이트로 2회 추출하였다. 합한 유기 상을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 용매를 감압 하에 제거하였다. 이와 같이 하여 클로로설폰 (V-1) 70.8 g을 수득하였다. 조 생성물을 즉시 추가로 반응시켰다.

[0456] 단계 3: N,N'-[디설파디일비스(6-플루오로-4-메틸벤젠-3,1-디일)]비스(2,2,2-트리플루오로아세트아미드) (IV-1)

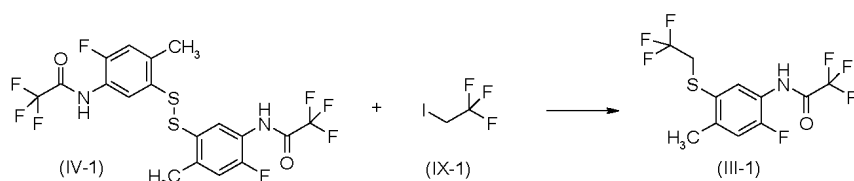


[0457]

[0458] 아이오딘화나트륨 298.8 g을 트리플루오로아세트산 1000 ml 중에 용해시키고, 4-플루오로-2-메틸-5-[(트리플루오로아세틸)아미노]벤젠설폰일 클로라이드 (V-1) 70.8 g을 실온에서 첨가하였다. 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반하고, 이어서 용매를 감압 하에 제거하였다. 잔류물을 물로 연화처리하고, 흡인 하에 여과하였다. 이와 같이 하여 디설피드 (IV-1) 62.3 g (이론치의 86%)을 고체로서 수득하였다.

[0459] $\log P(\text{HCOOH})$: 4.41

[0460] 단계 4: 2,2,2-트리플루오로-N-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)설파닐]페닐}아세트아미드 (III-1)

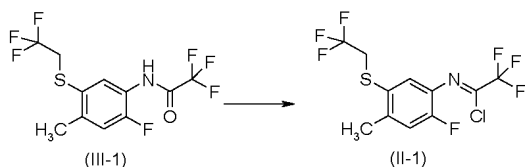


[0461]

[0462] N,N'-[디설파디일비스(6-플루오로-4-메틸벤젠-3,1-디일)]비스(2,2,2-트리플루오로아세트아미드) (IV-1) 3.4 g을 N,N-디메틸포름아미드 150 ml 중에 용해시키고, 탄산칼륨 1.86 g, 1,1,1-트리플루오로아이오도에탄 (XVI-1) 3.11 g, 롱갈리트(Rongalite) 2.39 g 및 몇 방울의 물을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 대부분의 N,N-디메틸포름아미드를 감압 하에 증류시켰다. 잔류물을 물에 녹이고, 에틸 아세테이트로 2회 추출하였다. 합한 유기 상을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 이어서 용매를 감압 하에 제거하였다. 이와 같이 하여 티오에테르 (III-1) 4.48 g (이론치의 90%)을 수득하였다.

[0463] $\log P(\text{HCOOH})$: 3.31

[0464] 단계 5: 2,2,2-트리플루오로-N-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)설파닐]페닐}에탄이미도일 클로라이드 (II-1)



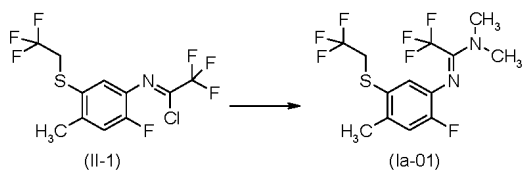
[0465]

[0466]

아세트니트릴 20 ml 중 2,2,2-트리플루오로-N'-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}아세트아미드 (III-1) 1 g, 트리에틸아민 1.51 g 및 디페닐 클로로포스페이트 4.01 g을 환류 하에 16시간 동안 가열하였다. 냉각시킨 후, 에틸 아세테이트를 첨가하고, 침전된 고체를 여과하고, 폐기하였다. 여과물을 실리카 겔 상에 흡수시키고, 시클로헥산/에틸 아세테이트 (98/2)를 사용하여 크로마토그래피하였다. 용매를 제거하여 이미도일 클로라이드 (II-1) 1 g을 수득하였다.

[0467]

단계 6: 2,2,2-트리플루오로-N'-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-N,N-디메틸에탄이미드아미드 (Ia-01)



[0468]

[0469]

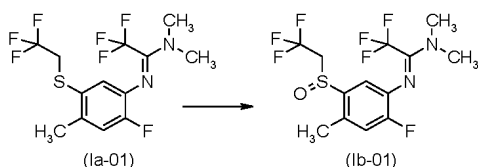
디메틸아민 (THF 중 2 M) 0.77 g을 처음에 아세트니트릴 40 ml에 충전시키고, 아세트니트릴 10 ml 중 용해된 2,2,2-트리플루오로-N'-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}에탄이미도일 클로라이드 (II-1) 1 g을 실온에서 적가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반하고, 이어서 용매를 감압 하에 제거하였다. 잔류물을 물에 녹이고, 에틸 아세테이트로 2회 추출하였다. 합한 유기 상을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 이어서 용매를 감압 하에 제거하였다. 이와 같이 하여 아미딘 (Ia-01) 0.36 g (이론치의 35%)을 수득하였다.

[0470]

logP(HCOOH): 4.48

[0471]

단계 7: 2,2,2-트리플루오로-N'-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-N,N-디메틸에탄이미드아미드 (Ib-01)



[0472]

[0473]

2,2,2-트리플루오로-N'-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-N,N-디메틸에탄이미드아미드 (Ia-01) 0.36 g을 디클로로메탄 30 ml 중에 용해시키고, 메타-클로로퍼벤조산 0.21 g을 실온에서 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 추가 16시간 동안 교반하고, 이어서 탄산나트륨 용액을 사용하여 알칼리로 만들었다. 과량의 메타-클로로퍼벤조산을 티오황산나트륨을 사용하여 감소시켰다. 상 분리 후, 용매를 감압 하에 제거하였다. 잔류물을 시클로헥산/아세톤 (9/1)으로 크로마토그래피하였다. 이와 같이 하여 아미딘 (Ib-01) 0.31 g (이론치의 79%)을 수득하였다.

[0474]

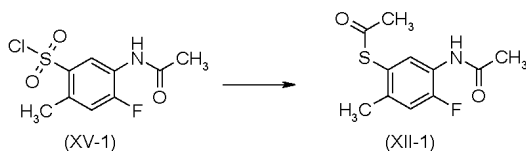
logP(HCOOH): 3.15

[0475]

제조 실시예 2: 5-아미노-4-플루오로-2-메틸벤젠티올 (XI-1)

[0476]

단계 1: S-(5-아세트아미도-4-플루오로-2-메틸페닐) 에탄티오에이트 (XII-1)

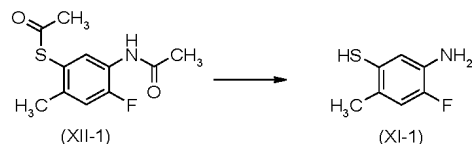


[0477]

[0478] 5-아세트아미도-4-플루오로-2-메틸벤젠설포닐 클로라이드 (XV-1) 99.3 g을 빙초산 700 ml 중에 현탁시키고, 아이오딘 0.9 g 및 적색 인 38.7 g을 첨가하고, 혼합물을 환류 하에 5시간 동안 교반하였다. 냉각시킨 후, 고체를 여과하고, 여과물을 회전 증발에 의해 농축시켰다. 잔류물을 물로 연화처리하고, 흡인 하에 여과하였다. 이와 같이 하여 티오에이트 (XII-1) 57.6 g (이론치의 67%)을 고체로서 수득하였다.

[0479] $\log P(\text{HCOOH})$: 1.78

[0480] 단계 2: 5-아미노-4-플루오로-2-메틸벤젠티올 (XI-1)



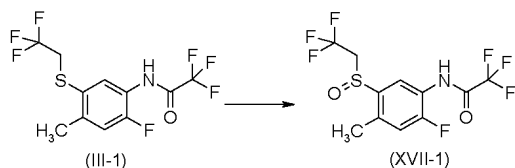
[0481]

[0482] S-(5-아세트아미도-4-플루오로-2-메틸페닐) 에탄티오에이트 (XII-1) 57.4 g을 물 750 ml 및 수산화칼륨 96.6 g에 용해시켰다. 반응 혼합물을 16시간 동안 환류 하에 비등시켰다. 냉각시킨 후, 용액을 염산을 사용하여 pH 2-3으로 조정하고, 침전된 고체를 흡인 하에 여과하였다. 이와 같이 하여 티올 (XI-1) 35.8 g (이론치의 94%)을 고체로서 수득하였다.

[0483] $\log P(\text{HCOOH})$: 3.70

[0484] III에서 XVII로의 키랄 산화

[0485] 실시예 1: 2,2,2-트리플루오로-N-{4-플루오로-2-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)설피닐]페닐}아세트아미드의 합성



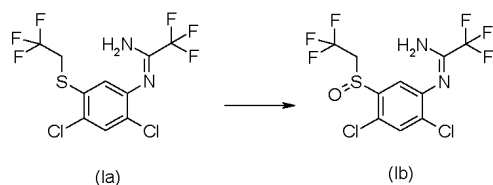
[0486]

[0487] 3구 플라스크에서, 2,2,2-트리플루오로-N-{4-플루오로-2-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)설피닐]페닐}아세트아미드 500 mg (1.49 mmol)을 클로로포름 5 g 중에 용해시키고, 15°C로 냉각시켰다. 바나듐 아세틸아세토네이트 15.82 mg (0.06 mmol) 및 (S)(2,4-디-tert-부틸-6-[(E)-[(1-히드록시-3,3-디메틸부탄-2-일)이미노]메틸]페놀 29.84 mg (0.089 mmol), 클로로포름 1 g의 용액을 이 혼합물에 첨가하였다. 5분 후, 30% 농도 H_2O_2 225.5 mg (1.79 mmol) 및 완충제 용액 pH 7 ($\text{KH}_2\text{PO}_4/\text{Na}_2\text{HPO}_4$) 300 mg의 용액을 20분에 걸쳐 계량하였다. 반응 진행을 HPLC에 의해 모니터링하였다. 2시간의 반응 시간 후, 티오설파이트 용액 100 mg을 첨가하고, 대부분의 클로로포름을 감압 하에 증발시켰다. 시클로헥산 5 g을 잔류물에 첨가하고, 침전된 고체를 여과하였다.

[0488] 이와 같이 하여 1-{2,4-디메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)설피닐]페닐}-3-(트리플루오로메틸)-1H-1,2,4-트리아졸 (HPLC에 의해 91.24% 순도)을 베이지색 고체로서 수득하였다. 거울상이성질체 과잉물은 25.90:74.10의 비로 키랄 상 상의 HPLC (다이셀 키라셀(Daiceil Chiracel) OJ-RH 150)에 의해 결정되었다.

[0489] Ia에서 Ib로의 키랄 산화

[0490] 실시예 1: N'-(2,4-디클로로-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)설피닐]페닐)-2,2,2-트리플루오로에탄아미드아미드의 합성



[0491]

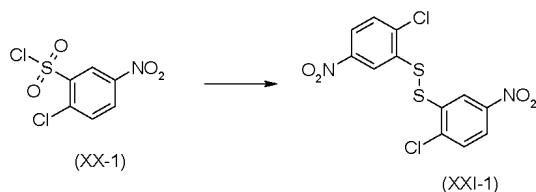
[0492] 3구 플라스크에서, N'-(2,4-디클로로-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)설피닐]페닐)-2,2,2-트리플루오로에탄아미드 1 g (2.69 mmol)을 클로로포름 10 ml 중에 용해시키고, 15°C로 냉각시켰다. 클로로포름 2 ml 중 바나듐

아세틸아세토네이트 29 mg (0.10 mmol) 및 (S)-(2,4-디-tert-부틸-6-((E)-[(1-히드록시-3,3-디메틸부탄-2-일)이미노]메틸)페놀 54 mg (0.16 mmol)의 용액을 혼합물에 첨가하였다. 30% 농도 H₂O₂ 367 mg (3.23 mmol) 및 완충제 용액 pH 7 (KH₂PO₄/Na₂HPO₄) 750 mg의 용액을 4시간에 걸쳐 계량하였다. 반응 진행을 TLC에 의해 모니터링하였다. 2시간의 반응 시간 후, 티오술포이트 용액 (1M) 128 mg을 첨가하고, 혼합물을 밤새 교반하였다. 상을 분리하고, 대부분의 클로로포름 (약 3 ml는 제외함)을 감압 하에 증발시켰다. 시클로헥산을 잔류물에 첨가하고, 침전된 고체를 여과하였다.

[0493] 이와 같이 하여 N'-{(2,4-디클로로-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐)-2,2,2-트리플루오로에탄이미드아미드 (HPLC에 의한 순도 >99%) 980 mg을 고체로서 수득하였다. 거울상이성질체 과잉률은 89.63:10.37의 비로 키랄 상 상의 HPLC (다이셀 키라셀 OD-RH 150)에 의해 결정되었다.

[0494] 제조 실시예 3: N'-{4-클로로-3-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로에탄이미드아미드 (Ib-108)

[0495] 단계 1: 1,1'-디술폰디일비스(2-클로로-5-니트로벤젠)



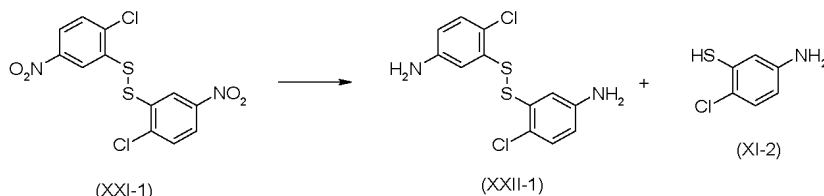
[0496]

[0497] 격렬한 교반 하에, 클로로술폰산 236.1 g (1.02 mol)을 2-클로로-5-니트로벤젠술폰닐 클로라이드 52.0 g (203.1 mmol)에 첨가하고, 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. 40% 농도 수성 중아황산나트륨 용액을 첨가한 후, 형성된 고체를 흡인 하에 여과하고, 물로 세척하고, 점토 디스크 상에서 밤새 건조시켰다. 이와 같이 하여 표제 화합물 36.1 g (100% 순도, 이론치의 94%)을 회갈색 고체로서 수득하였다.

logP(HCOOH): 5.03; logP(중성): 5.01; ¹H-NMR (D₆-DMSO, 400 MHz) δ ppm 8.40(d,2H), 8.18-8.16(m,2H), 7.91(d,2H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 376 (2Cl) [M]⁺

[0498]

[0499] 단계 2: 3,3'-디술폰디일비스(4-클로로아닐린)



[0500]

[0501] 1,1'-디술폰디일비스(2-클로로-5-니트로벤젠) 8.00 g (21.2 mmol)을 THF 150 ml 중에 용해시키고, 라니 니켈 1.6 g을 첨가하고, 혼합물을 수소 분위기 (20 bar) 하에 50℃에서 72시간 동안 교반하였다. THF를 사용하여, 반응 혼합물을 규조토를 통해 여과하고, 여과물을 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 1,1'-디술폰디일비스(2-클로로-5-니트로벤젠) 및 5-아미노-2-클로로벤젠티올의 혼합물 6.64 g (90% 순도, 이론치의 189%)을 수득하였으며, 이를 추가의 정제 없이 알킬화시켰다.

[0502] 1,1'-디술폰디일비스(2-클로로-5-니트로벤젠):

logP(HCOOH): 3.31; logP(중성): 3.35; ¹H-NMR (D₆-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.10(d,2H), 6.73(d,2H), 6.47-6.44(m,2H), 5.51(넓음, 4H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 316 (2Cl) [M]⁺

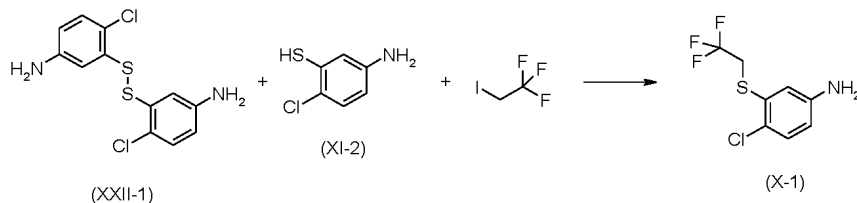
[0503]

[0504] 5-아미노-2-클로로벤젠티올:

logP(HCOOH): 1.64; logP(중성): 측정가능하지 않음; ¹H-NMR (D₆-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.01(d,1H), 6.54(d,1H), 6.35-6.32(m,1H), 5.28(넓음, 3H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 159 (1Cl) [M]⁺

[0505]

[0506] 단계 3: 4-클로로-3-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린



[0507]

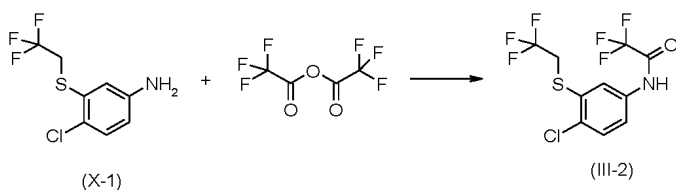
[0508] 디술팜디일비스(2-클로로-5-니트로벤젠) 및 5-아미노-2-클로로벤젠티올의 혼합물 6.40 g (약 20 mmol)을 처음에 N,N-디메틸포름아미드 100 ml에 충전시키고, 이아티온산나트륨 7.02 g (40.3 mmol), 탄산칼륨 5.58 g (40.3 mmol) 및 롱칼리트 5.49 g (40.3 mmol)을 첨가하고, 혼합물을 0°C로 냉각시켰다. 1,1,1-트리플루오로-2-아이오도에탄 9.32 g을 0°C에서 적가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. 대부분의 용매를 감압 하에 제거하고, 물을 잔류물에 첨가하고, 혼합물을 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 상을 물 및 포화 수성 염화나트륨 용액으로 연속적으로 세척하고, 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이동상 시클로헥산/에틸 아세테이트를 사용하여 MPLC에 의해 실리카 겔 상의 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물 4.70 g (98% 순도, 이론치의 47%)을 황색 액체로서 수득하였다.

$\log P(\text{HCOOH})$: 2.64; $\log P$ (중성): 2.69; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$, 400 MHz) δ ppm 7.09(d, 1H), 6.78(d, 1H),

6.49-6.46(m, 1H), 5.37(넓은, 2H), 3.90(q, 2H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 241 (1Cl) [$\text{M}]^+$

[0509]

[0510] 단계 4: N-{4-클로로-3-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로아세트아미드



[0511]

[0512] 4-클로로-3-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 1.00 g (4.14 mmol)을 처음에 디클로로메탄 14 ml에 충전시키고, 트리ethyl아민 0.50 g (4.97 mmol)을 0°C에서 첨가하였다. 트리플루오로아세트산 무수물 0.96 g (4.55 mmol)을 0°C에서 적가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 밤새 교반하고, 이어서 물 및 포화 수성 염화나트륨 용액으로 세척하고, 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이동상 시클로헥산/에틸 아세테이트를 사용하여 MPLC에 의해 실리카 겔 상의 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물 1.00 g (99% 순도, 이론치의 71%)을 무색 고체로서 수득하였다.

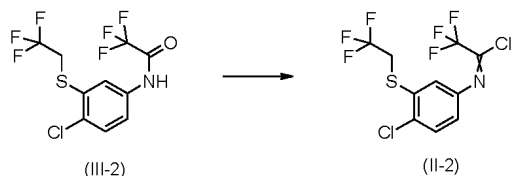
$\log P(\text{HCOOH})$: 3.46; $\log P$ (중성): 3.41; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$, 400 MHz) δ ppm 11.43(s, 1H), 7.91(d, 1H),

7.63-7.69(m, 1H), 7.56-7.58(m, 1H), 4.05(q, 2H); $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) δ ppm 7.85(넓은, 1H),

7.82(d, 1H), 7.52-7.45(m, 2H), 3.53(q, 2H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 337 (1Cl) [$\text{M}]^+$

[0513]

[0514] 단계 5: N-{4-클로로-3-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로에탄이미도일 클로라이드

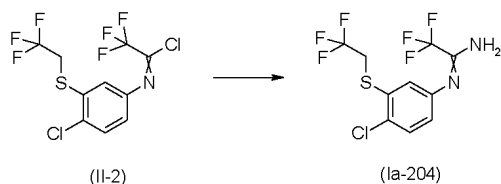


[0515]

[0516] N-{4-클로로-3-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로아세트아미드 880 mg (2.61 mmol)을 처음에 아세트니트릴 17 ml에 충전시키고, 트리ethyl아민 1.32 g (13.03 mmol) 및 디페닐 클로로포스페이트 3.50 g (13.03 mmol)을 실온에서 첨가하고, 혼합물을 환류 하에 밤새 가열하였다. 냉각시킨 후, 에틸 아세테이트를 첨가하고, 혼합물을 여과하고, 농축시켰다. 잔류물을 이동상 시클로헥산/에틸 아세테이트를 사용하는 MPLC에 의해 실리카 겔 상의 칼럼 크로마토그래피에 의한 정제에 직접 적용하였다. 이와 같이 하여 표제 화합물 640 mg (93% 순도, 이론치의 64%)을 황색 오일로서 수득하였다.

logP(HCOOH): 4.77; logP(중성): 4.73; ¹H-NMR (CDCl₃, 400 MHz) δ ppm 7.51(d,1H), 7.24(d,1H), 7.02-7.00(m,1H), 3.51(q,2H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 355 (2Cl) [M]⁺

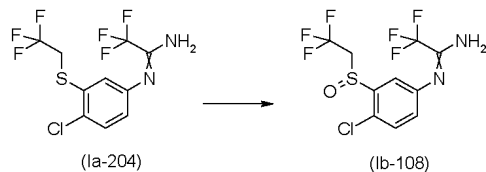
단계 6: N'-{4-클로로-3-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로에탄이미드아미드 (Ia-204)



N-{4-클로로-3-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로에탄이미도일 클로라이드 210 mg (0.59 mmol)을 처음에 아세토니트릴 5 ml에 충전시키고, 아세토니트릴 5 ml 중 25% 농도 수성 암모니아 용액 241 mg (3.54 mmol)의 용액을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 밤새 교반하고, 이어서 농축시켰다. 잔류물을 물 및 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 상을 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이동상 시클로헥산/에틸 아세테이트를 사용하여 MPLC에 의해 실리카 겔 상의 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물 120 mg (100% 순도, 이론치의 60%)을 황색 오일로서 수득하였다.

logP(HCOOH): 3.10; logP(중성): 3.10; ¹H-NMR (D₆-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.42(d,1H), 7.26(넓은, 2H), 7.05(d,1H), 6.75-6.72(m,1H), 4.13(q,2H)

단계 7: N'-{4-클로로-3-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로에탄이미드아미드 (Ib-108)

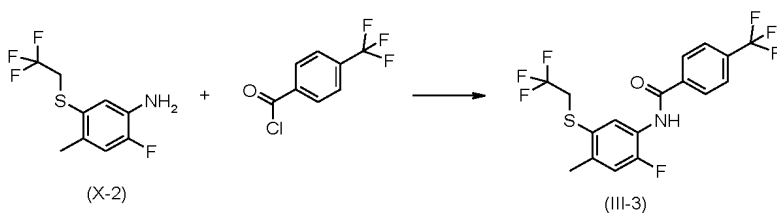


N'-{4-클로로-3-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로에탄이미드아미드 90 mg (0.27 mmol)을 디클로로메탄 6 ml 중에 용해시키고, 메타-클로로퍼벤조산 68 mg (0.29 mmol)을 0℃에서 첨가하였다. 0℃에서 2시간 동안 교반한 후, 추가 23 mg (0.13 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 밤새 교반하고, 이어서 디클로로메탄으로 희석하고, 40% 농도 중아황산나트륨 용액 및 포화 수성 중탄산나트륨으로 연속적으로 세척하였다. 유기 상을 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이동상 시클로헥산/에틸 아세테이트를 사용하여 MPLC에 의해 실리카 겔 상의 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물 90 mg (95% 순도, 이론치의 91%)을 베이지색 고체로서 수득하였다.

logP(HCOOH): 2.25; logP(중성): 2.21; ¹H-NMR (D₆-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.57(d,1H), 7.42(넓은, 2H), 7.30(d,1H), 7.10-7.07(m,1H), 4.22-4.04(m,2H)

제조 실시예 4: N'-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐}-N-메틸-4-(트리플루오로메틸)벤젠카르복스이미드아미드 (Ia-250)

단계 1: N-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐}-4-(트리플루오로메틸)벤즈아미드



2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 1.00 g (4.18 mmol)을 처음에 디클로로메탄 25 ml에 충전시키고, 트리에틸아민 0.47 g (4.60 mmol)을 첨가하고, 혼합물을 0℃로 냉각시켰다. 디클로로메탄 25 ml 중 4-(트리플루오로메틸)벤조일 클로라이드 0.96 g (4.60 mmol)을 0℃에서 적가하였다. 반응 혼합물을 실온

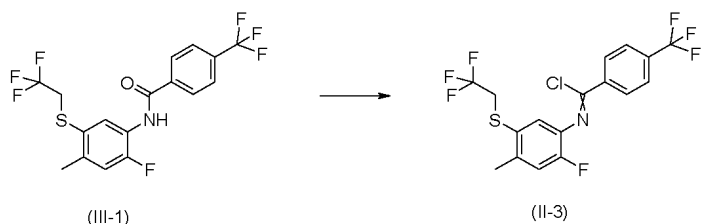
에서 밤새 교반하였다. 4-(트리플루오로메틸)벤조일 클로라이드 0.17 g (0.84 mmol)을 첨가하고, 혼합물을 실온에서 추가 3시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 디클로로메탄으로 희석하고, 반포화 수성 염화암모늄 용액 및 포화 수성 염화나트륨 용액으로 연속적으로 세척하고, 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 잔류물을 석유 에테르로 연화처리하고, 흡인 하에 여과하고, 건조시켰다. 이와 같이 하여 표제 화합물 1.69 g (95% 순도, 이론치의 93%)을 무색 고체로서 수득하였다.

logP(HCOOH): 4.20; logP(중성): 4.17; ¹H-NMR (D₆-DMSO, 400 MHz) δ ppm 10.40(s,1H), 8.17(d,2H), 7.93(d,2H), 7.82(d,1H), 7.31(d,1H), 3.89(q,2H), 2.42(s,3H); ¹H-NMR (CD₃CN, 400 MHz) δ ppm 8.70(넓은, 1H), 8.12(d,1H), 8.08(d,2H), 7.84(d,2H), 7.17(d,1H), 3.57(q,2H), 2.46(s,3H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 411 [M]⁺

[0530]

[0531]

단계 2: N-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-4-(트리플루오로메틸)벤젠카르복시미도일 클로라이드



[0532]

[0533]

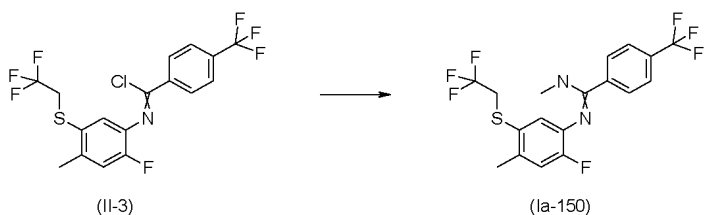
N-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-4-(트리플루오로메틸)벤즈아미드 1.00 g (2.43 mmol)을 처음에 디클로로메탄 20 ml에 충전시키고, 오염화인 0.51 g (2.43 mmol)을 첨가하고, 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. 오염화인 추가 0.51 g (2.43 mmol)을 첨가하고, 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. 오염화인 추가 0.51 g (2.43 mmol)을 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 3시간 동안 교반하고, 이어서 실리카 겔을 통해 여과하고, 농축시켰다. 이와 같이 하여 표제 화합물 0.91 g (74% 순도, 이론치의 65%)을 황색 오일로서 수득하였으며, 이를 직접 추가로 반응시켰다.

¹H-NMR (CD₃CN, 400 MHz) δ ppm 8.32(d,2H), 7.86(d,2H), 7.32(d,1H), 7.21(d,1H), 3.58(q,2H), 2.47(s,3H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 429 (1Cl) [M]⁺

[0534]

[0535]

단계 3: N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐)-N-메틸-4-(트리플루오로메틸)벤젠카르복시미드아미드



[0536]

[0537]

메틸아민 (THF 중 2M) 150 mg (4.65 mmol)을 처음에 아세토니트릴 25 ml에 충전시키고, 아세토니트릴 25 ml 중 N-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-4-(트리플루오로메틸)벤젠카르복시미도일 클로라이드 400 mg (0.93 mmol)을 0°C에서 첨가하고, 혼합물을 실온에서 밤새 교반하고, 이어서 농축시켰다. 잔류물을 이동상 시클로헥산/에틸 아세테이트를 사용하여 MPLC에 의해 실리카 겔 상의 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하였다. 이와 같이 하여 표제 화합물 220 mg (99% 순도, 이론치의 56%)을 황색 고체로서 수득하였다.

logP(HCOOH): 1.96; logP(중성): 4.08; ¹H-NMR (D₆-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.64(d,2H), 7.46(d,1H), 7.39(d,2H), 6.88(d,1H), 7.76(d,1H), 3.53(q,2H), 2.89(d,3H), 2.20(s,3H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 424 [M]⁺

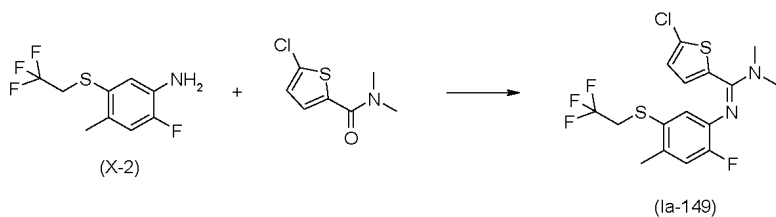
[0538]

[0539]

제조 실시예 5: 5-클로로-N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐)-N,N-디메틸티오펜-2-카르복시미드아미드 (Ia-149)

[0540]

단계 1: 5-클로로-N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐)-N,N-디메틸티오펜-2-카르복시미드아미드



[0541]

[0542]

포스포릴 클로라이드 743 mg (4.85 mmol)을 2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 200 mg (0.84 mmol) 및 5-클로로-N,N-디메틸티오펜-2-카르복스아미드 206 mg (1.09 mmol)에 첨가하고, 혼합물을 환류 하에 밤새 가열하였다. 냉각시킨 후, 반응 혼합물을 물에 붓고, 탄산칼륨을 사용하여 알칼리로 만들고, 디클로로메탄으로 추출하였다. 합한 유기 상을 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이동상 시클로헥산/에틸을 사용하여 MPLC에 의해 실리카 겔 상의 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물 165 mg (92% 순도, 이론치의 44%)을 적갈색 오일로서 수득하였다.

$\log P(\text{HCOOH})$: 2.11; $\log P(\text{중성})$: 4.89; $^1\text{H-NMR}$ (D₆-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.00(d, 1H), 7.93(d, 1H), 6.87-6.84(m, 2H), 3.68(q, 2H), 2.97(넓음, 6H), 2.23(s, 3H)

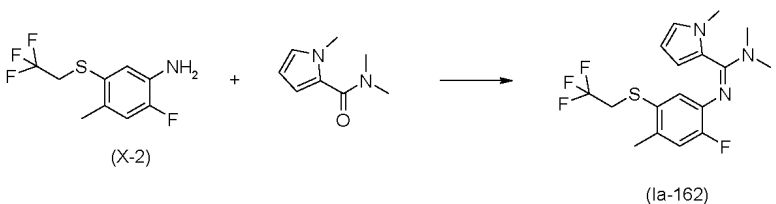
[0543]

[0544]

제조 실시예 6: N'-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐}-N,N,1-트리메틸-1H-피롤-2-카르복스이미드아미드 (Ia-162)

[0545]

단계 1: N'-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐}-N,N,1-트리메틸-1H-피롤-2-카르복스이미드아미드



[0546]

[0547]

포스포릴 클로라이드 743 mg (4.85 mmol)을 2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 200 mg (0.84 mmol) 및 N,N,1-트리메틸-1H-피롤-2-카르복스아미드 165 mg (1.09 mmol)에 첨가하고, 혼합물을 환류 하에 밤새 가열하였다. 냉각시킨 후, 반응 혼합물을 물에 붓고, 탄산칼륨을 사용하여 알칼리로 만들고, 디클로로메탄으로 추출하였다. 합한 유기 상을 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이동상 시클로헥산/에틸 아세테이트를 사용하여 MPLC에 의해 실리카 겔 상의 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물 177 mg (99% 순도, 이론치의 56%)을 황색 오일로서 수득하였다.

$\log P(\text{HCOOH})$: 1.67; $\log P(\text{중성})$: 4.11; $^1\text{H-NMR}$ (D₆-DMSO, 400 MHz) δ ppm 6.88(d, 1H), 6.70-6.68(m, 1H), 6.64(d, 1H), 5.91-5.89(m, 2H), 3.59(q, 2H), 3.39(s, 3H), 3.05(넓음, 3H), 2.77(넓음, 3H), 2.21(s, 3H)

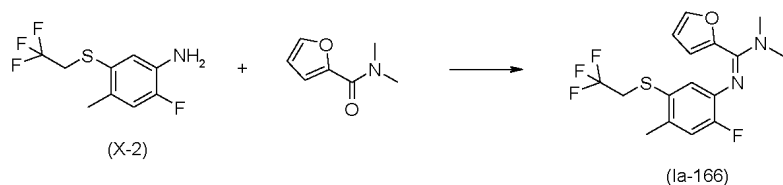
[0548]

[0549]

제조 실시예 7: N'-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐}-N,N-디메틸푸란-2-카르복스이미드아미드 (Ia-166)

[0550]

단계 1: N'-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐}-N,N-디메틸푸란-2-카르복스이미드아미드



[0551]

[0552]

포스포릴 클로라이드 743 mg (4.85 mmol)을 2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 200 mg (0.84 mmol) 및 N,N-디메틸-2-푸란아미드 139 mg (1.09 mmol)에 첨가하고, 혼합물을 환류 하에 밤새 가열하였다. 냉각시킨 후, 반응 혼합물을 물에 붓고, 탄산칼륨을 사용하여 알칼리로 만들고, 디클로로메탄으로 추출

하였다. 합한 유기 상을 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이동 상 시클로헥산/에틸 아세테이트를 사용하여 MPLC에 의해 실리카 겔 상의 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물 64 mg (98% 순도, 이론치의 21%)을 황색 오일로서 수득하였다.

logP(HCOOH): 1.57; logP(중성): 3.94; ¹H-NMR (D₆-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.69-7.67(m, 1H), 6.91(d, 1H), 6.76(d, 1H), 6.43-6.40(m, 1H), 6.25(d, 1H), 3.69(q, 2H), 2.94(s, 6H), 2.24(s, 3H)

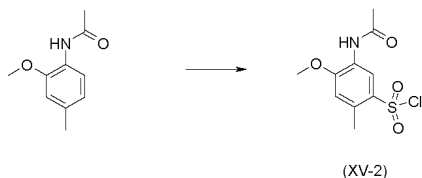
[0553]

[0554]

제조 실시예 8: 2-메톡시-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린

[0555]

단계 1: 5-아세트아미도-4-메톡시-2-메틸벤젠술폰닐 클로라이드



[0556]

[0557]

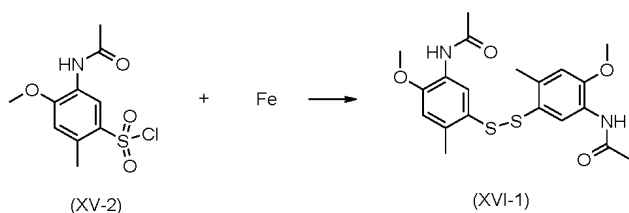
조금씩, N-(2-메톡시-4-메틸페닐)아세트아미드 [CAS-RN 89345-81-3] 19.5 g (108.8 mmol)을 클로로술폰산 150 g (1287 mmol)에 첨가하고, 혼합물을 80℃에서 추가 4시간 동안 교반하였다. 냉각시킨 후, 혼합물을 빙수에 첨가하고, 수득된 고체를 흡인 하에 여과하여 생성물 25.4 g (이론치의 84.1%, ¹H-NMR에 따라 순도 100%)을 수득하였다.

[0558]

¹H-NMR(D₆-DMSO) δ ppm: 9.04(s, 1H), 8.14(s, 1H), 6.80(s, 1H), 3.80(s, 3H), 2.48(s, 3H), 2.04(s, 3H)

[0559]

단계 2: N,N'-[디술폰디일비스(6-메톡시-4-메틸벤젠-3,1-디일)]디아세트아미드



[0560]

[0561]

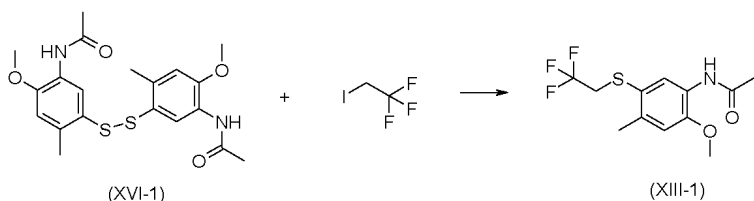
에탄올 400 ml 및 진한 염산 36.7 g 중 5-아세트아미도-4-메톡시-2-메틸벤젠술폰닐 클로라이드 25.3 g (91.1 mmol) 및 철 분말 14.6 g (261.4 mmol)을 환류 하에 12시간 동안 가열하였다. 감압 하에 용매를 제거한 후, 잔류물을 물로 연화처리하고, 흡인 하에 여과하여 조 생성물 9.4 g (이론치의 49.1%, LC/MS에 따라 순도 86.4%)을 밝은 갈색 고체로서 수득하였다.

[0562]

logP(HCOOH): 2.73

[0563]

단계 3: N-{2-메톡시-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}아세트아미드



[0564]

[0565]

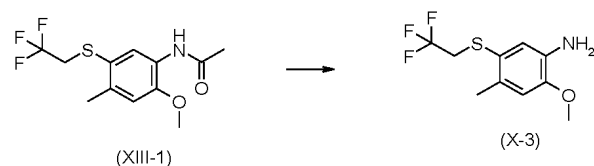
N,N'-[디술폰디일비스(6-메톡시-4-메틸벤젠-3,1-디일)]디아세트아미드 9.4 g (22.35 mmol)을 처음에 디메틸포름아미드 60 ml에 충전시키고, 이아티온산나트륨 6.5 g, 탄산칼륨 15.9 g 및 이인산나트륨 5.45 g 및 물 40 ml를 첨가하고, 이어서 혼합물을 60℃에서 3시간 동안 교반하였다. 냉각시킨 후, 1,1,1-트리플루오로-2-아이오도에탄 12.5 g (59.54 mmol)을 첨가하고, 혼합물을 75℃에서 추가 12시간 동안 교반하였다. 감압 하에 용매를 제거한 후, 남아있는 잔류물을 진한 염산을 사용하여 산성화시키고, 형성된 침전물을 흡인 하에 여과하였다. 이와 같이 하여 생성물 5.3 g (이론치의 80.8%, ¹H-NMR에 따라 순도 > 95%)을 수득하였다.

¹H-NMR(D6-DMSO) δ ppm : 9.15(s,1H), 8.14(s,1H), 6.98(s,1H), 3.83(s,3H), 3.69-3.61(q,2H), 2.40(s,3H), 2.06(s,3H)

[0566]

[0567] 단계 4: 2-메톡시-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린

[0568]



[0569]

5 몰 염산 125 ml 중 N-{2-메톡시-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}아세트아미드 5.3 g (22.35 mmol)을 환류 하에 18시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 수성 수산화나트륨 용액을 사용하여 알칼리로 만들고, 디클로로메탄으로 추출하였다. 유기 상을 분리하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 암오렌지색 오일 3.6 g (이론치의 79.3%, LC/MS에 따라 순도 96.8%)을 수득하였다.

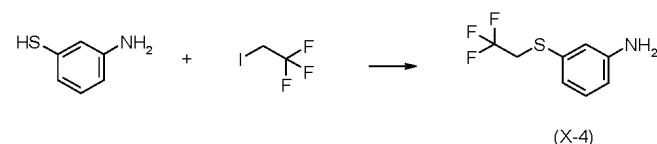
[0570]

¹H-NMR(D6-DMSO) δ ppm: 6.83(s,1H), 6.72(s,1H), 4.64(넓은, 2H), 3.75(s,3H), 3.64-3.56(q,2H), 2.30(s,3H)

[0571]

제조 실시예 9: 3-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린

[0572]



[0573]

3-아미노벤젠티올 6.5 g (51.92 mmol)을 처음에 아세트니트릴 200 ml에 충전시키고, 탄산칼륨 13.7 g, 고체 수산화나트륨 1.6 g, 디메틸 술폭시드 1 ml 및 1,1,1-트리플루오로-2-아이오도에탄 13 g (61.93 mmol)을 첨가하고, 혼합물을 45℃에서 18시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 물 250 ml로 희석하고, 디클로로메탄으로 추출하였다. 유기 상을 분리하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 생성물 9.5 g을 갈색 오일로서 수득하였다 (이론치의 88.3%, LC/MS에 따라 순도 97.9%).

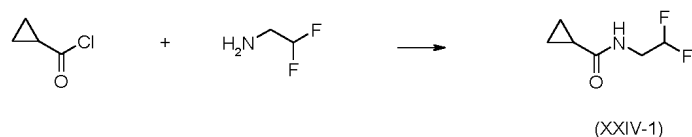
[0574]

¹H-NMR(D6-DMSO) δ ppm: 7.00-6.97(m,1H), 6.61(m,1H), 6.59(m,1H), 6.47-6.45(m,1H), 5.19(넓은, 2H), 3.88-3.80(q,2H)
logP(HCOOH): 2.01

[0575]

제조 실시예 10: N-(2,2-디플루오로에틸)시클로프로판카르복스아미드 (XXIV-1)

[0576]



[0577]

시클로프로판카르보닐 클로라이드 14.4 g (137.75 mmol)을 무수 테트라히드로푸란 300 ml 중에 용해시켰다. 트리에틸아민 1 g을 첨가한 후, 무수 테트라히드로푸란 50 ml 중 2,2-디플루오로에탄아민 16.8 g (207.24 mmol)의 용액을 적가하였다. 첨가 종료 후, 혼합물을 실온에서 추가 18시간 동안 교반하고, 후속적으로 40℃에서 추가 1시간 동안 교반하였다. 혼합물을 물 200 ml로 희석하고, 디클로로메탄으로 추출하였다. 합한 유기 상을 분리하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 생성물 18.9 g (이론치의 92%, ¹H-NMR에 따라 순도 100%)을 백색 고체로서 수득하였다.

[0578]

¹H-NMR(D6-DMSO) δ ppm: 8.46(t,1H), 5.99(tt,1H), 3.54-3.43(m,2H), 1.65-1.59(m,1H), 0.70-0.60(m,4H)

[0579] 제조 실시예 11: 1-플루오로시클로프로판카르복사미드 (XXIV-2)

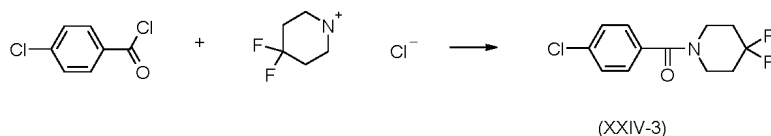


[0580]

[0581] 조금씩, 1-플루오로시클로프로판카르보닐 클로라이드 [CAS-RN 149961-53-5] 600 mg (4.9 mmol)을 수산화암모늄 (물 중 NH₃의 28-30 중량% 농도 용액) 15 g에 첨가하고, 혼합물을 실온에서 추가 18시간 동안 교반하였다. 생성된 침전물을 흡인 하에 여과하여 생성물 470 mg (이론치의 93.1%, ¹H-NMR에 따라 순도 100%)을 백색 고체로서 수득하였다.

[0582] ¹H-NMR(D₆-DMSO) δ ppm : 7.80(넓음, 1H), 7.58(넓음, 1H), 1.29-1.12(m, 4H)

[0583] 제조 실시예 12: (4-클로로페닐)(4,4-디플루오로피페리딘-1-일)메탄 (XXIV-3)

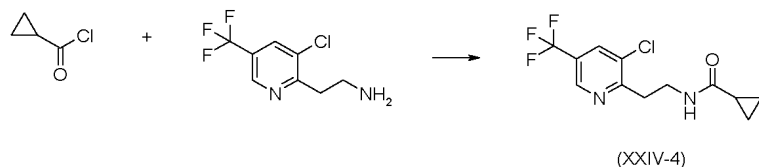


[0584]

[0585] 4,4-디플루오로피페리딘 클로라이드 470 mg (2.98 mmol)을 처음에 무수 톨루엔 35 ml에 충전시켰다. 트리에틸아민 1.4 g을 첨가한 후, 4-클로로벤조일 클로라이드 690 mg (3.94 mmol)을 조금씩 첨가하고, 혼합물을 100℃에서 추가 18시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 물 250 ml로 희석하고, 유기 상을 분리하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 생성물 480 mg (이론치의 62%, LC/MS에 따라 순도 88%)을 오렌지색 오일로서 수득하였다.

[0586] ¹H-NMR(D₆-DMSO) δ ppm : 7.54-7.49(m, 4H), 3.70(m, 2H), 3.39(m, 2H), 2.03(m, 4H)

[0587] 제조 실시예 13: N-{2-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]에틸}시클로프로판카르복사미드 (XXIV-4)



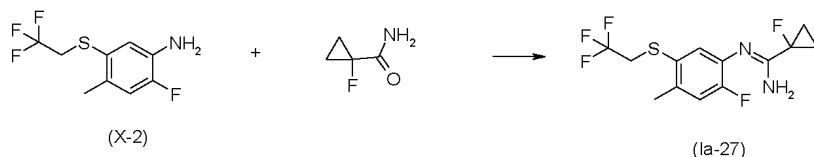
[0588]

[0589] 2-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]에탄아민 550 mg (2.11 mmol)을 처음에 무수 디클로로메탄 20 ml에 충전시켰다. 트리에틸아민 1 g을 첨가한 후, 무수 디클로로메탄 5 ml 중 용해된 시클로프로판카르보닐 클로라이드 270 mg (2.58 mmol)을 적가하고, 이어서 혼합물을 50℃에서 추가 12시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 물 50 ml로 희석하고, 유기 상을 분리하고, 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 생성물 450 mg (이론치의 73%, LC/MS에 따라 순도 87.1%)을 오렌지색 고체로서 수득하였다.

[0590] ¹H-NMR(D₆-DMSO) δ ppm: 8.89(d, 1H), 8.41(d, 1H), 8.17(t, 1H), 3.53-3.48(m, 2H), 3.11(t, 2H), 1.51-1.46(m, 1H), 0.63-0.59(m, 4H)

[0591] 제조 실시예 14: 1-플루오로-N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술피닐]페닐)시클로프로판카르복사미드 (Ib-19)

[0592] 단계 1: 1-플루오로-N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술피닐]페닐)시클로프로판카르복사미드 (Ia-27)



[0593]

[0594] 포스포릴 클로라이드 1.4 g (9.13 mmol)을 2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 400 mg (1.67 mmol) 및 1-플루오로시클로프로판카르복사미드 470 mg (4.56 mmol)에 첨가하고, 혼합물을 95℃에서 18시간 동안 교반하였다. 회전 증발 후 남아있는 잔류물을 물과 함께 교반하고, 고체 탄산칼륨을 사용하여 알칼리로 만들고, 디클로로메탄으로 추출하였다. 합한 유기 상을 분리하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 생성물 380 mg (이론치의 70.1%, LC/MS에 따라 순도 88.8%)을 잔류물로서 수득하였다.

[0595] logP(HCOOH): 1.2

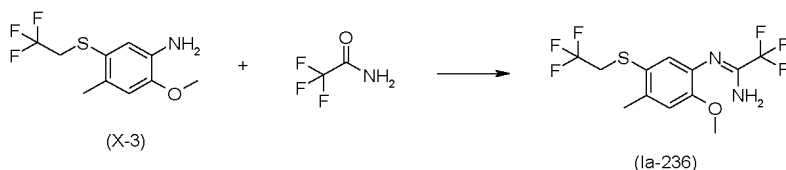
[0596] 단계 2: 1-플루오로-N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐)시클로프로판카르복사미드아미드 (Ib-19)



[0597]

[0598] 0-4℃에서, 1-플루오로-N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐)시클로프로판카르복사미드아미드 (Ia-27) 310 mg (0.96 mmol)을 처음에 트리클로로메탄 30 ml에 충전시켰다. 완충제 용액 pH 7 (KH₂PO₄/Na₂HPO₄) 335 mg 및 벤질트리에틸암모늄 클로라이드 65 mg을 첨가한 후, m-클로로퍼벤조산 230 mg (70% 농도, 1.03 mmol)을 조금씩 0-4℃에서 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 24시간 동안 교반하였다. 33% 농도 수성 중아황산나트륨 용액을 첨가하고, 이어서 혼합물을 디클로로메탄으로 2회 추출하였다. 합한 유기 상을 물로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하였다. 감압 하에 용매를 제거한 후, 잔류물을 물/아세트니트릴과 함께 RP(C-18) 상의 MPLC를 사용하는 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하였다. 이와 같이 하여 생성물 42 mg (이론치의 12.9%, LC/MS에 따라 순도 98.1%)을 수득하였다.

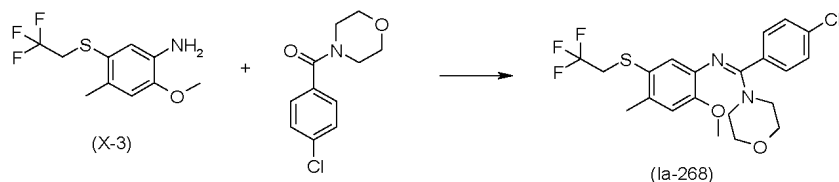
[0599] 제조 실시예 15: 2,2,2-트리플루오로-N'-(2-메톡시-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐)에탄아미드아미드 (Ia-236)



[0600]

[0601] 포스포릴 클로라이드 2.5 g (16.3 mmol)을 2-메톡시-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 300 mg (1.19 mmol) 및 트리플루오로아세트아미드 400 mg (3.54 mmol)에 첨가하고, 혼합물을 95℃에서 18시간 동안 교반하였다. 회전 증발 후 남아있는 잔류물을 물과 함께 교반하고, 고체 탄산칼륨을 사용하여 알칼리로 만들고, 디클로로메탄으로 추출하였다. 합한 유기 상을 분리하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 생성물 61.3 mg (이론치 14.1%, ¹H-NMR에 따라 순도 > 95%)을 잔류물로서 수득하였다.

[0602] 제조 실시예 16: N-[(4-클로로페닐)(모르폴린-4-일)메틸렌]-2-메톡시-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 (Ia-268)



[0603]

[0604]

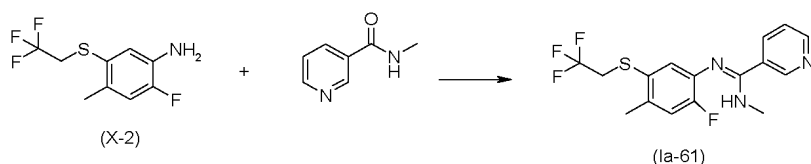
포스포릴 클로라이드 2.5 g (16.3 mmol)을 2-메톡시-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 300 mg (1.19 mmol) 및 (4-클로로페닐)(모르폴린-4-일)메탄은 360 mg (1.60 mmol)에 첨가하고, 혼합물을 95℃에서 18 시간 동안 교반하였다. 회전 증발 후 남아있는 잔류물을 물과 함께 교반하고, 고체 탄산칼륨을 사용하여 알칼리로 만들고, 디클로로메탄으로 추출하였다. 합한 유기 상을 분리하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 생성물 247 mg (이론치의 40.9%, LC/MS에 따라 순도 90.9%)을 잔류물로서 수득하였다.

[0605]

제조 실시예 17: N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐)-N-메틸피리딘-3-카르복스이미드아미드 (Ib-28)

[0606]

단계 1: N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐)-N-메틸피리딘-3-카르복스이미드아미드 (Ia-61)



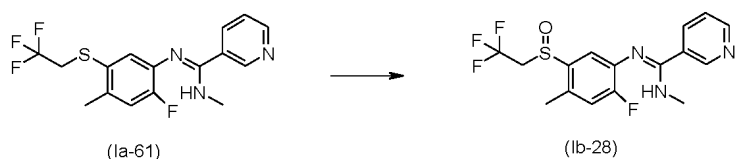
[0607]

[0608]

포스포릴 클로라이드 1.5 g (9.78 mmol)을 2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 400 mg (1.67 mmol) 및 N-메틸니코틴아미드 450 mg (3.31 mmol)에 첨가하고, 혼합물을 95℃에서 18시간 동안 교반하였다. 회전 증발 후 남아있는 잔류물을 물과 함께 교반하고, 고체 탄산칼륨을 사용하여 알칼리로 만들고, 디클로로메탄으로 추출하였다. 합한 유기 상을 분리하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 생성물 550 mg (이론치의 92.1%, LC/MS에 따라 순도 92.9%)을 잔류물로서 수득하였다.

[0609]

단계 2: N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐)-N-메틸피리딘-3-카르복스이미드아미드 (Ib-28)



[0610]

[0611]

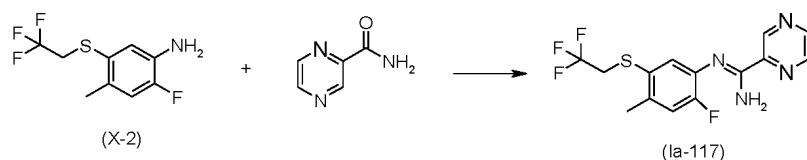
0-4℃에서, N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)숯닐]페닐)-N-메틸피리딘-3-카르복스이미드아미드 (Ia-61) 460 mg (1.29 mmol)을 처음에 트리클로로메탄 40 ml에 충전시켰다. 완충제 용액 pH 7 (KH₂PO₄/Na₂HPO₄) 460 mg 및 벤질트리에틸암모늄 클로라이드 90 mg을 첨가한 후, m-클로로페넨조산 320 mg (70%, 0.261 mmol)을 조금씩 0-4℃에서 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 24시간 동안 교반하였다. 33% 농도 수성 중아황산나트륨 용액을 첨가하고, 이어서 혼합물을 디클로로메탄으로 2회 추출하였다. 합한 유기 상을 물로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하였다. 감압 하에 용매를 제거한 후, 잔류물을 물/아세트니트릴과 함께 RP(C-18) 상의 MPLC를 사용하는 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하였다. 이와 같이 하여 생성물 145 mg (이론치의 30.2%, HPLC에 따라 순도 98.7%)을 수득하였다.

[0612]

제조 실시예 18: N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)숯닐]페닐)피라진-2-카르복스이미드아미드 (Ib-62)

[0613]

단계 1: N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)숯닐]페닐)피라진-2-카르복스이미드아미드 (Ia-117)



[0614]

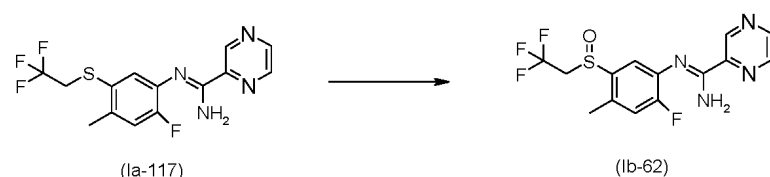
[0615] 포스포릴 클로라이드 2 g (13.04 mmol)을 2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 300 mg (1.25 mmol) 및 피라진카르복스아미드 190 mg (1.54 mmol)에 첨가하고, 혼합물을 95℃에서 18시간 동안 교반하였다. 회전 증발 후 남아있는 잔류물을 물과 함께 교반하고, 고체 탄산칼륨을 사용하여 알칼리로 만들고, 디클로로메탄으로 추출하였다. 합한 유기 상을 분리하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 생성물 365 mg (이론치 84.5%, LC/MS에 따라 순도 91.2%)을 잔류물로서 수득하였다.

[0616]

logP(HCOOH): 1.24

[0617]

단계 2: N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐)피라진-2-카르복스이미드아미드 (Ib-62)



[0618]

[0619] 0-4℃에서, N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐)피라진-2-카르복스이미드아미드 (Ia-117) 305 mg (0.89 mmol)을 처음에 트리클로로메탄 30 ml에 충전시켰다. 완충제 용액 pH 7 (KH₂PO₄/Na₂HPO₄) 320 mg 및 벤질트리에틸암모늄 클로라이드 60 mg을 첨가한 후, m-클로로퍼벤조산 225 mg (70%, 1.04 mmol)을 조금씩 0-4℃에서 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 24시간 동안 교반하였다. 33% 농도 수성 비술팜이트 용액을 첨가하고, 이어서 혼합물을 디클로로메탄으로 2회 추출하였다. 합한 유기 상을 물로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하였다. 감압 하에 용매를 제거한 후, 잔류물을 RP(C-18) 물질 상에 흡수시켰다. 물/아세트니트릴과 함께 RP(C-18) 상의 MPLC를 사용하는 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 생성물 55 mg (이론치의 17.2%, LC/MS에 따라 순도 100%)을 밝은 베이지색 고체로서 수득하였다.

[0620]

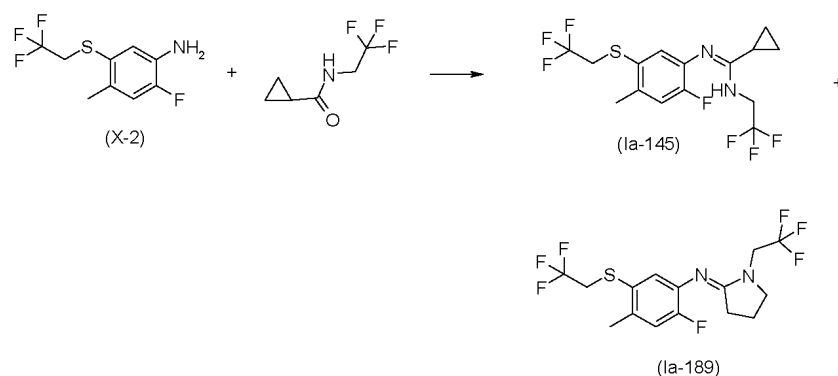
logP(HCOOH): 0.84 logP(중성): 1.77

[0621]

제조 실시예 19: 2-플루오로-4-메틸-N-[1-(2,2,2-트리플루오로에틸)피롤리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 (Ib-115)

[0622]

단계 1: N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐)-N-(2,2,2-트리플루오로에틸)시클로프로판카르복스이미드아미드 (Ia-145) 및 2-플루오로-4-메틸-N-[1-(2,2,2-트리플루오로에틸)피롤리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 (Ia-189)

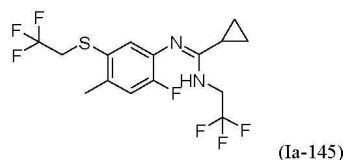


[0623]

[0624] 포스포릴 클로라이드 1.5 g (9.78 mmol)을 2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 300 mg (1.25 mmol) 및 N-(2,2,2-트리플루오로에틸)시클로프로판카르복스아미드 430 mg (2.57 mmol)에 첨가하고, 혼합물을 95℃에서 18시간 동안 교반하였다. 회전 증발 후 남아있는 잔류물을 물과 함께 교반하고, 고체 탄산

칼럼을 사용하여 알칼리로 만들고, 디클로로메탄으로 추출하였다. 합한 유기 상을 분리하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 상기 기재된 이성질체의 약 3:1 혼합물로서의 조 생성물 630 mg을 잔류물로서 수득하였다.

[0625] 물/아세트니트릴로 RP(C-18) 상의 MPLC를 사용하는 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 (N'-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]페닐)-N-(2,2,2-트리플루오로에틸)시클로프로판카르복시미드아미드 (Ia-145) 239.8 mg (이론치의 49.2%, ¹H-NMR에 따라 순도 80%)



[0626]

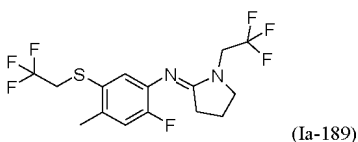
¹³C-NMR(D6-DMSO) δ ppm: 161.0, 153.5, 137.0, 133.9, 128.1, 127.2, 117.5, 41.0, 35.6, 19.6, 11.6, 6.2

[0627]

logP(HCOOH): 1.99 logP(중성): 4.12

[0628]

및 2-플루오로-4-메틸-N-[1-(2,2,2-트리플루오로에틸)피롤리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 (Ia-189) 72.4 mg (이론치의 14.9%, HPLC에 따라 순도 100%)



[0629]

¹H-NMR(D6-DMSO) δ ppm: 7.09-7.01(m,2H), 4.28-4.21(q,2H), 3.89-3.81(q,2H), 3.51-3.47(t,2H), 2.36-2.30(t,2H), 2.32(s,3H), 1.98-1.90(m,2H).

logP(HCOOH): 2.32 logP(중성): 4.37

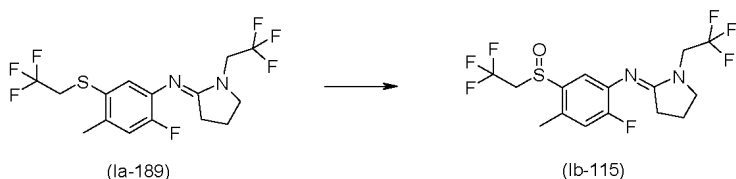
[0630]

[0631]

을 수득하였다.

[0632]

단계 2: 2-플루오로-4-메틸-N-[1-(2,2,2-트리플루오로에틸)피롤리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 (Ib-115)



[0633]

[0634]

0-4℃에서, 2-플루오로-4-메틸-N-[1-(2,2,2-트리플루오로에틸)피롤리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린 (Ia-189) 900 mg (2.32 mmol)을 처음에 트리클로로메탄 40 ml에 충전시켰다. 완충제 용액 pH 7 (KH₂PO₄/Na₂HPO₄) 850 mg 및 벤질트리에틸암모늄 클로라이드 160 mg을 첨가한 후, m-클로로퍼벤조산 600 mg (77%, 2.68 mmol)을 조금씩 0-4℃에서 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 24시간 동안 교반하였다. 33% 농도 수성 중아황산나트륨 용액을 첨가하고, 이어서 혼합물을 디클로로메탄으로 2회 추출하였다. 합한 유기 상을 물로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하였다. 감압 하에 용매를 제거한 후, 잔류물을 물/아세트니트릴과 함께 RP(C-18) 상의 MPLC를 사용하는 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하였다. 이와 같이 하여 생성물 70 mg (이론치의 7.5%, LC/MS에 따라 순도 95.2%)을 수득하였다.

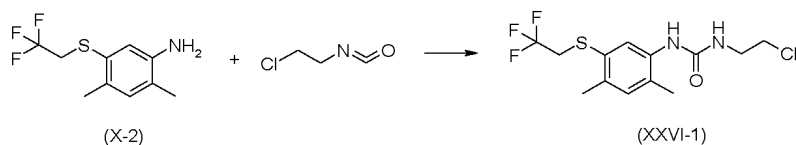
¹³C-NMR(D6-DMSO) δ ppm: 164.2, 155.6, 138.3, 136.0, 129.8, 125.1, 124.2, 119.9, 117.9, 56.8, 49.5, 44.4, 27.0, 19.5, 16.4

[0635]

[0636]

제조 실시예 20: 2,4-디메틸-N-[1,3-옥사졸리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린

[0637] 단계 1: 1-(2-클로로에틸)-3-{2,4-디메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}우레아



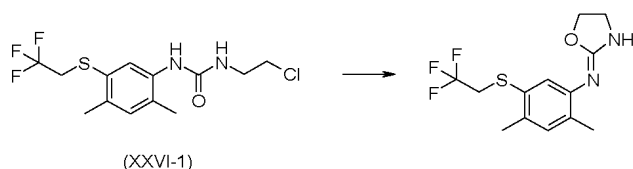
[0638]

[0639] 조금씩, 2,4-디메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린 1.45 g (6.16 mmol)을 tert-부틸 메틸 에테르 50 ml 및 촉매량의 1,8-디아자비시클로[5.4.0]운데스-7-엔 (DBU) 중 2-클로로에틸 이소시아네이트 700 mg (6.63 mmol)의 용액에 첨가하고, 후속적으로 실온에서 추가 18시간 동안 교반하였다. 감압 하에, 거의 모든 용매를 혼합물로부터 제거하고, 생성된 백색 고체를 흡인 하에 여과하였다. 이와 같이 하여 생성물 2.00 g (이론치의 88.5%, LC/MS에 따라 순도 94.4%)을 수득하였다.

¹H-NMR(D₆-DMSO) δ ppm: 8.01(s,1H), 7.83(s,1H), 7.04(s,1H), 6.83(t,1H), 3.77-3.69(q,2H), 3.68-3.65(m,2H), 3.45-3.40(m,2H), 2.30(s,3H), 2.14(s,3H).

[0640]

[0641] 단계 2: 2,4-디메틸-N-[1,3-옥사졸리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린



[0642]

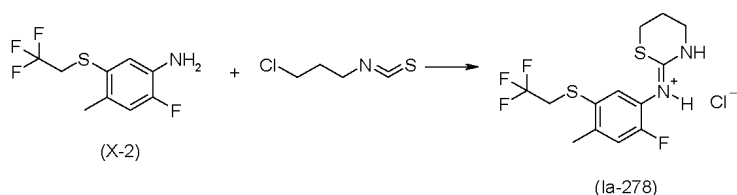
[0643] 물 15 ml 및 프로피오니트릴 20 ml의 혼합물 중 1-(2-클로로에틸)-3-{2,4-디메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}우레아 900 mg (2.64 mmol)을 탄산칼륨 4 g과 함께 환류 하에 18시간 동안 가열하였다. 감압 하에, 혼합물을 용매로부터 유리시키고, 남아있는 고체의 슬러리를 묽은 염산으로 산성화시켰다. 이어서, 혼합물을 18시간 동안 정치되도록 하고, 이어서 베이지색 침전물을 흡인 하에 여과하였다. 이와 같이 하여 조 생성물 560 mg을 수득하였다. 바이오타지 이솔레라 원(Biotage Isolera One) 및 이동상으로서 에틸 아세테이트 / 시클로헥산 2:1 v/v를 사용하는 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 생성물 130 mg (이론치의 16.2%, LC/MS에 따라 순도 81.5%)을 수득하였다.

[0644] logP(HCOOH): 1.36

[0645]

[0646] 제조 실시예 21: 2-플루오로-4-메틸-N-[1,3-티아지난-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린 (Ia-279)

[0647] 단계 1: 2-플루오로-4-메틸-N-[(1,3-티아지난-2-일리덴)-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린] 클로라이드 (Ia-278)



[0647]

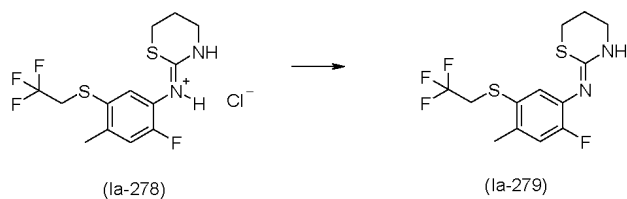
[0648] 조금씩, 2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린 1.61 g (6.72 mmol)을 tert-부틸 메틸 에테르 30 ml 및 촉매량의 1,8-디아자비시클로[5.4.0]운데스-7-엔 (DBU) 중 3-클로로프로필 이소시아네이트 1 g (7.37 mmol)의 용액에 첨가하고, 후속적으로 실온에서 추가로 18시간 동안 교반하였다. 감압 하에, 혼합물을 용매로부터 유리시켰다. 남아있는 잔류물은 밝은 베이지색 오일이고, 이를 천천히 결정화시켰다. 이와 같이 하여 생성물 2.3 g (이론치 91.3%, LC/MS에 따라 순도 95%)을 수득하였다.

¹³C-NMR(D₆-DMSO) δ ppm: 166.0 (꺾음), 156.1, 142.1, 131.7, 129.4, 126.1, 120.6, 118.6, 41.3, 34.9, 26.6, 20.6

[0649] logP(HCOOH): 1.34

[0649]

[0650] 단계 2: 2-플루오로-4-메틸-N-[1,3-티아지난-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술파닐]아닐린 (Ia-279)

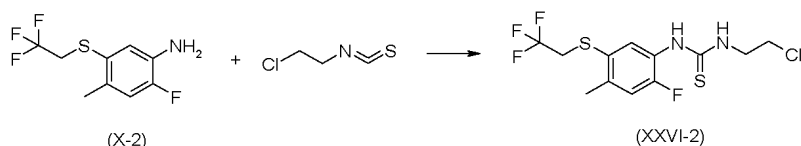


[0651]

[0652] 2-플루오로-4-메틸-N-[1,3-티아지난-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술파닐]아닐린 클로라이드 (Ia-278) 2.2 g (5.87 mmol)을 물 50 ml 중에 용해시키고, 수산화암모늄 (물 중 NH₃의 28-30 중량% 용액)을 사용하여 알칼리로 만들었다. 혼합물을 디클로로메탄으로 반복 추출하였다. 합한 유기 상을 분리하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 생성물 1.56 g의 잔류물 (이론치의 68.3%, 1H-NMR에 따라 순도 100%)을 빛나는 호박색 결정으로서 수득하였다.

[0653] 제조 실시예 22: 2-플루오로-4-메틸-N-[1,3-티아졸리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술파닐]아닐린

[0654] 단계 1: 1-(2-클로로에틸)-3-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술파닐]페닐}티오우레아

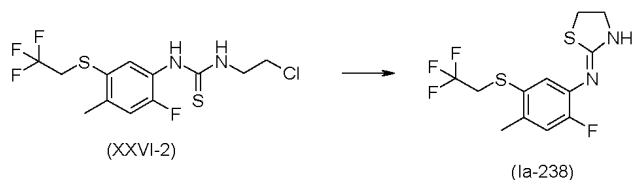


[0655]

[0656] 조금씩, 2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술파닐]아닐린 1.9 g (7.94 mmol)을 tert-부틸 메틸 에테르 50 ml 및 촉매량의 1,8-디아자비시클로[5.4.0]운데스-7-엔 (DBU) 중 2-클로로에틸 이소티오시아네이트 1 g (8.22 mmol)의 용액에 첨가하고, 이어서 실온에서 추가 18시간 동안 교반하였다. 감압 하에, 거의 모든 용매를 혼합물로부터 유리시키고, 생성된 백색 고체를 흡인 하에 여과하였다. 이와 같이 하여 생성물 2.88 g (이론치의 97.1%, 1H-NMR에 따라 순도 100%)을 수득하였다.

[0657] 1H-NMR(D6-DMSO) δ ppm: 7.68-7.67(m,1H), 7.43-7.40(m,1H), 4.03-3.93(m,4H), 3.61(t,2H), 2.41(s,3H).

[0658] 단계 2: 2-플루오로-4-메틸-N-[1,3-티아졸리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술파닐]아닐린 (Ia-238)



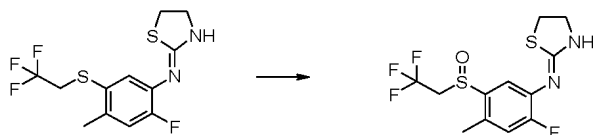
[0659]

[0660] 물 3 ml 및 프로피오니트릴 100 ml의 혼합물 중 1-(2-클로로에틸)-3-{2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술파닐]페닐}우레아 2.75 g (7.62 mmol)을, 탄산칼륨 2 g, 탄산세슘 3.5 g, 수산화나트륨 0.1 g 및 아이오딘화칼륨 0.1 g과 함께 환류 하에 48시간 동안 가열하였다. 감압 하에, 혼합물을 용매로부터 유리시키고, 남아있는 고체의 슬러리를 묽은 염산으로 중화시켰다. 혼합물을 디클로로메탄으로 반복 추출하였다. 합한 유기 상을 분리하고, 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 이와 같이 하여 갈색 오일 2.38 g을 조 생성물로서 수득하였다. 50 g 스냅 카트리지를 사용하는 바이오타지 이솔레라 원 및 이동상로서 에틸 아세테이트 / 시클로헥산 1:1 v/v를 사용하는 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 생성물 590 mg (이론치의 23.9%, LC/MS에 따른 순도 92.9%)을 수득하였다.

13C-NMR(D6-DMSO) δ ppm: 163.3, 153.7, 134.8, 126.9(넓음), 126.9, 126.0, 117.0, 45.0(넓음), 35.5, 29.8, 19.4

[0661]

[0662] 단계 3: 2-플루오로-4-메틸-N-[1,3-티아졸리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술피닐]아닐린



[0663]

[0664] 0-4℃에서, 2-플루오로-4-메틸-N-[1,3-티아졸리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술피닐]아닐린 (Ia-238) 99 mg (0.305 mmol)을 처음에 트리클로로메탄 10 ml에 충전시켰다. 완충제 용액 pH 7 (KH₂PO₄/Na₂HPO₄) 120 mg 및 벤질트리에틸암모늄 클로라이드 20 mg을 첨가한 후, m-클로로퍼벤조산 80 mg (70%, 0.357 mmol)을 조금씩 0-4℃에서 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 24시간 동안 교반하였다. 33% 농도 수성 중아황산나트륨 용액을 첨가하고, 이어서 혼합물을 디클로로메탄으로 2회 추출하였다. 합한 유기 상을 물로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하였다. 감압 하에 용매를 제거한 후, 잔류물을 물/아세트니트릴과 함께 RP(C-18) 상의 MPLC를 사용하는 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하였다. 이와 같이 하여 생성물 15 mg (이론치의 14.4%, LC/MS에 따라 순도 100%)을 수득하였다.

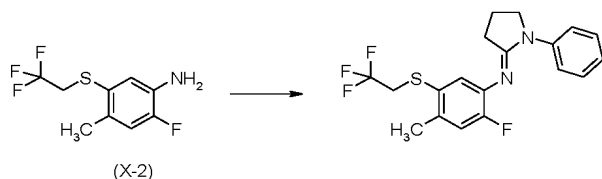
¹³C-NMR(D₆-DMSO) δ ppm: 165.3, 157.5, 137.2, 131.5, 125.6, 120.6, 119.5, 58.5, 46.4, 31.3

logP(HCOOH): 0.80

[0665]

[0666] 제조 실시예 23: 2-플루오로-4-메틸-N-[(2E)-1-페닐피롤리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술피닐]아닐린 (Ib-55)

[0667] 단계 1: 2-플루오로-4-메틸-N-[(2E)-1-페닐피롤리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술피닐]아닐린



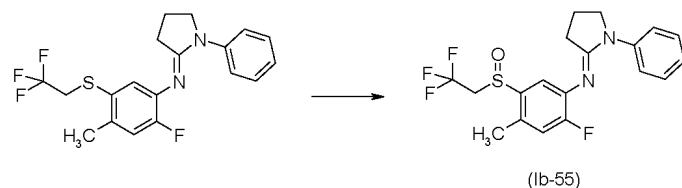
[0668]

[0669] 2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술피닐]아닐린 150 mg (0.63 mmol) 및 N-페닐-2-피롤리디논 202 mg (1.25 mmol)을 처음에 충전시켰다. 포스포릴 클로라이드 0.29 ml (3.14 mmol)를 천천히 적가하고, 반응 혼합물을 100℃에서 2시간 동안 교반하였다. 냉각시킨 후, 혼합물을 빙수에 붓고, pH를 수성 수산화나트륨 용액을 사용하여 8-9로 조정하고, 혼합물을 에틸 아세테이트로 3회 추출하였다. 합한 유기 상을 포화 염화나트륨 용액으로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 잔류물을 아세트니트릴에 녹이고, RP(C-18) 상에 흡수시키고, 물/아세트니트릴을 사용하여 RP(C-18) 상의 MPLC에 의해 정제하였다. 2개 분획을 분리하였다: 표제 화합물 89 mg (98% 순도, 이론치의 37%) 및 65 mg (98% 순도, 이론치의 27%).

logP(HCOOH): 1.83; logP(중성): 4.92; ¹H-NMR (D₆-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.85(d,2H), 7.36(dd,2H), 7.12-7.09(m,3H), 3.92-3.84(m,4H), DMSO 피크 하의 2H, 2.33(s,3H), 2.05-1.97(m,2H)

[0670]

[0671] 단계 2: 2-플루오로-4-메틸-N-[(2E)-1-페닐피롤리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술피닐]아닐린 (Ib-55)



[0672]

[0673] 0-4℃에서, 2-플루오로-4-메틸-N-[(2E)-1-페닐피롤리딘-2-일리덴]-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술피닐]아닐린 89 g (0.23 mmol)을 처음에 디클로로메탄 3 ml에 충전시키고, 메타-클로로퍼벤조산 (70%) 69 mg (0.28 mmol)을 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 추가 2시간 동안 교반하였다. 이어서, 33% 농도 티오황산나트륨 용액 (피옥시드 시험을 수행함) 및 포화 중탄산나트륨 용액을 첨가하고, 혼합물을 디클로로메탄으로 2회 추출하였다. 합

한 유기 상을 포화 탄산나트륨 용액으로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 용매를 감압 하에 제거하였다. 잔류물은 표제 화합물 98 mg (94% 순도, 이론치의 99%)을 갈색 오일로서 포함하였다.

$\log P(\text{HCOOH})$: 1.27; $\log P(\text{중성})$: 3.47; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$, 400 MHz) δ ppm 7.86(d,2H), 7.37(m,3H), 7.22(d,1H), 7.09(dd,1H), 4.14-4.02(m,2H), 3.73(dd,2H), 2.67-2.57(m,2H), 2.33(s,3H), 2.07-1.99(m,2H)

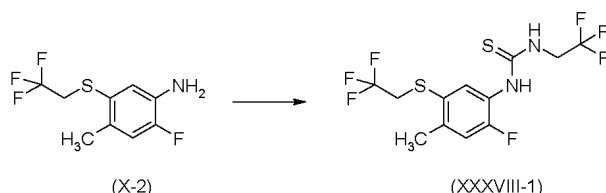
[0674]

[0675]

제조 실시예 24: 2-({2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}이미노)-3-(2,2,2-트리플루오로에틸)-1,3-티아졸리딘-4-온 (Ib-71)

[0676]

단계 1.a: JP 2011-42611 (실시예 250)로부터 공지된 1-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐)-3-(2,2,2-트리플루오로에틸)티오우레아



[0677]

[0678]

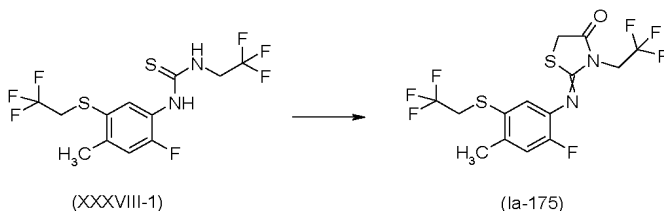
2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린 1.00 g (4.18 mmol)을 처음에 디클로로메탄 5 ml에 충전시키고, 트리에틸아민 0.006 ml (0.042 mmol)을 첨가하였다. 1,1,1-트리플루오로-2-이소티오시아네이트에탄 0.59 g (4.18 mmol)을 첨가한 후, 반응 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. 용매를 감압 하에 제거하고, 잔류물을 약간의 톨루엔으로 연화처리하고, 불용성 분획을 흡인 하에 여과하고, 건조시켰다. 이와 같이 하여 표제 화합물 0.31 g (100% 순도, 이론치의 20%)을 백색 고체로서 수득하였다. 감압 하에, 여과물을 용매로부터 유리시켰다. 잔류물 1.30 g은 순도 77%의 표제 화합물을 포함하였다.

$\log P(\text{HCOOH})$: 3.32; $\log P(\text{중성})$: 3.24; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$, 400 MHz) δ ppm 9.62(bs,1H), 8.34(bs,1H), 7.76(d,1H), 7.26(d,1H), 4.46-4.40(m,2H), 3.87(q,2H), 2.38(s,3H)

[0679]

[0680]

단계 2.a: 2-({2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}이미노)-3-(2,2,2-트리플루오로에틸)-1,3-티아졸리딘-4-온 (Ia-175)



[0681]

[0682]

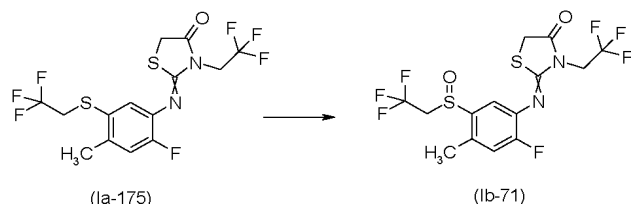
1-(2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐)-3-(2,2,2-트리플루오로에틸)티오우레아 75 mg (97% 순도, 0.19 mmol) 및 브로모아세트산 27 mg (0.19 mmol)을 처음에 톨루엔 2 ml에 충전시키고, 혼합물을 환류에서 6시간 동안 교반하였다. 냉각 후에, 포화 염화나트륨 용액을 반응 혼합물에 첨가하고, 유기 상을 분리하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 잔류물을 RP(C-18) 물질에 적용하고, 물/아세트니트릴을 사용하여 RP(C-18) 상의 MPLC에 의해 정제하였다. 표제 화합물 18 mg (100% 순도, 이론치의 23%)을 백색 고체로서 단리시켰다.

$\log P(\text{HCOOH})$: 4.09; $\log P(\text{중성})$: 3.99; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$, 400 MHz) δ ppm 7.27(d,1H), 7.21(d,1H), 4.58(q,2H), 4.24(s,2H), 3.87(q,2H), 2.39(s,3H)

[0683]

[0684]

단계 3.a: 2-({2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}이미노)-3-(2,2,2-트리플루오로에틸)-1,3-티아졸리딘-4-온 (Ib-71)



[0685]

[0686]

0-4℃에서, 2-({2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}이미노)-3-(2,2,2-트리플루오로에틸)-1,3-티아졸리딘-4-온 136 g (0.32 mmol)을 처음에 디클로로메탄 3 ml에 충전시키고, 메타-클로로퍼벤조산 (70%) 84 mg (0.32 mmol)을 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 추가 2시간 동안 교반하였다. 이어서, 33% 농도 티오황산나트륨 용액 (퍼옥시드 시험을 수행함) 및 포화 중탄산나트륨 용액을 첨가하고, 혼합물을 디클로로메탄으로 2회 추출하였다. 합한 유기 상을 포화 탄산나트륨 용액으로 추출하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 용매를 감압 하에 제거하였다. 잔류물은 표제 화합물 136 mg (100% 순도, 이론치의 96%)을 담색상 오일로서 수득하고, 이는 시간에 따라 결정화되어 백색 고체를 제공하였다.

[0687]

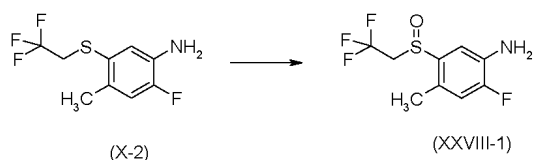
$\log P(\text{HCOOH})$: 2.93; $\log P$ (중성): 2.87; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$, 400 MHz) δ ppm 7.51(d,1H), 7.38(d,1H), 4.62-4.57(m,2H), 4.26-4.14(m,3H), 4.04-3.94(m,1H), 2.36(s,3H)

[0688]

대안적으로, 합성은 하기에 따라 수행될 수 있다:

[0689]

단계 1.b: 2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린



[0690]

[0691]

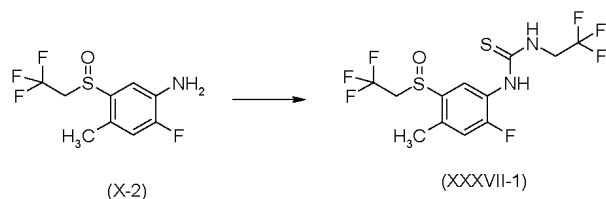
0-4℃에서, 2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린 5.00 g (0.21 mmol)을 처음에 디클로로메탄 100 ml에 충전시키고, 메타-클로로퍼벤조산 6.18 g (0.25 mmol)을 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 2시간 동안 교반하였다. 이어서, 33% 농도 티오황산나트륨 용액 (퍼옥시드 시험을 수행함)을 첨가하고, 혼합물을 디클로로메탄으로 2회 추출하였다. 합한 유기 상을 포화 탄산나트륨 용액으로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 용매를 감압 하에 제거하였다. 잔류물은 표제 화합물 5.10 g (90% 순도, 이론치의 86%)을 갈색 오일로서 포함하였다.

[0692]

$\log P(\text{HCOOH})$: 1.77; $\log P$ (중성): 1.72; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$, 400 MHz) δ ppm 7.26(d,1H), 7.02(d,1H), 5.45(bs,2H), 4.08-3.95(m,1H), 3.88-3.75(m,1H), 2.19(s,3H)

[0693]

단계 2.b: 1-({2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-3-(2,2,2-트리플루오로에틸)티오우레아



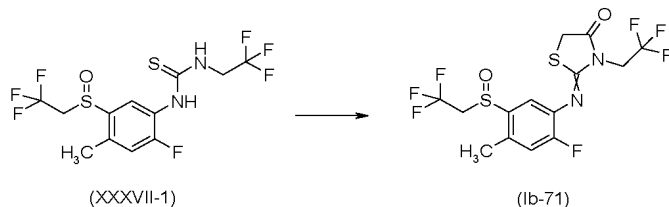
[0694]

[0695]

2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린 (90% 순도) 1.00 g (3.53 mmol)을 처음에 디클로로메탄 5 ml에 충전시키고, 트리에틸아민 0.005 ml (0.035 mmol)를 첨가하였다. 1,1,1-트리플루오로-2-이소티오시아네이트에탄 0.50 g (3.53 mmol)을 첨가한 후, 반응 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. 불용성 분획을 흡인 하에 여과하고, 건조시켰다. 이와 같이 하여 표제 화합물 0.60 g (100% 순도, 이론치의 43%)을 백색 고체로서 수득하였다. 감압 하에, 여과물을 용매로부터 유리시켰다. 잔류물 0.81 g은 순도 54%의 표제 화합물을 포함하였다.

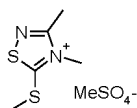
logP(HCOOH): 2.34; logP(중성): 2.30; ¹H-NMR (D₆-DMSO, 400 MHz) δ ppm 9.75(bs, 1H), 8.50(bs, 1H), 8.12(bd, 1H), 7.36(d, 1H), 4.52-4.40(m, 1H), 4.21-4.15(m, 1H), 4.05-3.95(m, 1H), 2.36(s, 3H)

단계 3.c: 2-({2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술피닐]페닐}이미노)-3-(2,2,2-트리플루오로에틸)-1,3-티아졸리딘-4-온 (Ib-71)



1-({2-플루오로-4-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술피닐]페닐}티오우레아) 200 mg (0.51 mmol) 및 브로모아세트산 70 mg (0.51 mmol)을 처음에 톨루엔 2 ml에 충전시키고, 혼합물을 환류 하에 6 시간 동안 교반하였다. 포화 염화나트륨 용액을 반응 혼합물에 첨가하고, 유기 상을 분리하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 용매로부터 감압 하에 유리시켰다. 잔류물을 RP(C-18) 물질에 적용하고, 물/아세트니트릴을 사용하여 RP(C-18) 상의 MPLC에 의해 정제하였다. 표제 화합물 63 mg (97% 순도, 이론치의 28%)을 백색 고체로서 단리시켰다.

제조 실시예 25: 3,4-디메틸-5-(메틸술팜닐)-1,2,4-티아디아졸-4-이온 메틸술팜에이트의 합성

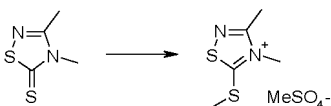


단계 1: 3,4-디메틸-1,2,4-티아디아졸-5(4H)-온



0°C에서, 오황화인 6.13 g (27.6 mmol)을 크실렌 중 3,4-디메틸-1,2,4-티아디아졸-5(4H)-온 (조 물질, 문헌 [J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 1983, 4, 687-691]에 따라 제조됨) 1.80 g (13.80 mmol)의 용액에 첨가하고, 이어서 혼합물을 100°C에서 4시간 동안 가열하였다. 수성 후처리 및 크로마토그래피 정제 후에, 표제 화합물 0.60 g (이론치의 30%)을 수득하였다.

단계 2: 3,4-디메틸-5-(메틸술팜닐)-1,2,4-티아디아졸-4-이온 메틸술팜에이트

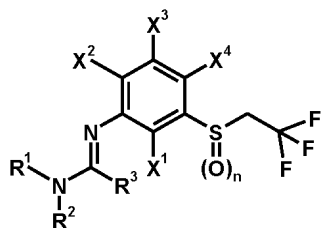


교반하면서, 디메틸 술팜에이트 0.62 g (4.52 mmol)을 아세트니트릴 중 3,4-디메틸-1,2,4-티아디아졸-5(4H)-티온 0.60 g (4.10 mmol)의 용액에 첨가하고, 혼합물을 환류 하에 5시간 동안 교반하였다. 냉각시킨 후, 용매를 감압 하에 제거하고, 수득된 잔류물 (1.50 g)을 추가의 조 물질과 반응시켰다.

제조 실시예 26: N-(3,4-디메틸-1,2,4-티아디아졸-5(4H)-일리덴)-2,4-디메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술피닐]아닐린 (Ib-173)

단계 1: N-(3,4-디메틸-1,2,4-티아디아졸-5(4H)-일리덴)-2,4-디메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술팜닐]아닐린

[0710] 상기 기재된 제조 방법을 사용하여 화학식 I의 화합물 - 예를 들어, 하기 화학식 I의 화합물을 수득할 수 있다:



[0711]

실시예	n	R ¹	R ²	R ³	X ₁	X ²	X ³	X ⁴	log P
Ia-01	0	CH ₃	CH ₃	CF ₃	H	F	H	CH ₃	4.48 ^[a] ; 4.5 ^[b]
Ia-02	0	프로필	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	4.45 ^[a] ; 4.43 ^[b]
Ia-03	0	H	H	CHF ₂	H	F	H	CH ₃	2.2 ^[c]
Ia-04	0	피리딘-2-일메틸	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	3.68 ^[a]
Ia-05	0	프로판-2-일	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	4.51 ^[a] ; 4.52 ^[b]
Ia-06	0	H	H	PD-F-헵틸	H	F	H	CH ₃	
Ia-07	0	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	3.36 ^[a] ; 3.4 ^[b]
Ia-08	0	피리딘-2-일메틸	피리딘-2-일메틸	CF ₃	H	F	H	CH ₃	
Ia-09	0	CH ₃	H	CF ₃	H	CH ₃	H	F	3.72 ^[a] ; 3.69 ^[b]
Ia-10	0	CH ₃	CH ₃	DD-F-헥실	H	F	H	CH ₃	
Ia-11	0	메틸술포닐	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	3.05 ^[a]
Ia-12	0	CH ₃	H	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	3.95 ^[a] ; 4.01 ^[b]
Ia-13	0	CH ₃	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	3.7 ^[a] ; 3.71 ^[b]
Ia-14	0	H	H	CF ₃	H	Cl	H	Cl	
Ia-15	0	CH ₃	H	CF ₃	H	Cl	H	Cl	4.2 ^[a] ; 4.2 ^[b]
Ia-16	0	(트리플루오로메틸)술포닐	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	
Ia-17	0	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	F	3.16 ^[a] ; 3.14 ^[b]
Ia-18	0	에틸	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	4.12 ^[a] ; 4.12 ^[b]
Ia-19	0	CH ₃	H	CF ₃	H	H	H	CF ₃	
Ia-20	0	CH ₃	H	CF ₃	H	Cl	H	CH ₃	
Ia-21	0	H	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	3.13 ^[a] ; 3.17 ^[a] , 3.12 ^[b]
Ia-22	0	H	H	DD-F-헥실	H	F	H	CH ₃	
Ia-23	0	CH ₃	CH ₃	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	4.87 ^[a] ; 4.87 ^[b]
Ia-24	0	CH ₃	CH ₃	CF ₃	H	CH ₃	H	F	4.53 ^[a] ; 4.47 ^[b]
Ia-25	0	H	H	CF ₃	H	H	H	CF ₃	
Ia-26	0	Cpr	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	4.03 ^[a] ; 4.02 ^[b]
Ib-01	1	CH ₃	CH ₃	CF ₃	H	F	H	CH ₃	

[0712]

실시예	n	R ¹	R ²	R ³	X ₁	X ²	X ³	X ⁴	log P
Ib-02	1	에틸	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	
Ib-03	1	프로판-2-일		H	C F ₃	H	F	H	CH ₃
Ib-04	1	CH ₃	H	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	3.15 ^[a] ;3.09 ^[b]
Ib-05	1	CH ₃	H	CF ₃	H	CH ₃	H	F	2.86 ^[a] ;2.79 ^[b]
Ib-06	1	프로필	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	3.24 ^[a] ;3.17 ^[b]
Ib-07	1	CH ₃	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	2.64 ^[a] ;2.61 ^[b]
Ib-08	1	Cpr	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	2.68 ^[a] ;2.67 ^[b]
Ib-09	1	CH ₃	CH ₃	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	3.23 ^[a] ;3.19 ^[b]
Ib-10	1	CH ₃	H	CF ₃	H	H	H	CF ₃	2.52 ^[a] ;2.49 ^[b]
Ib-11	1	H	H	CF ₃	H	F	H	CH ₃	2.77 ^[a] ;2.71 ^[b]
Ib-12	1	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	3.36 ^[a] ;3.3 ^[b]
Ib-13	1	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	F	
Ib-14	1	H	H	CF ₃	H	Cl	H	Cl	2.05 ^[a] ;2.02 ^[b]
Ib-15	1	CH ₃	CH ₃	CF ₃	H	CH ₃	H	F	2.17 ^[a] ;2.14 ^[b]
Ib-16	1	H	H	CF ₃	H	H	H	CF ₃	2.2 ^[a] ;2.19 ^[b]

[0713]

[0714]

약어:

[0715]

PD-F-헵틸 = 펜타데카플루오로헵틸; DD-F-헥실 = 1,1,2,2,3,3,4,4,5,5,6,6-도데카플루오로헥실; CHF₂ = 디플루오로메틸; Cpr = 시클로프로필; Cl = 염소; F = 플루오린.

[0716]

logP 값은 하기 방법에 의해 역상 칼럼 (C 18)을 사용하여 HPLC (고성능 액체 크로마토그래피)에 의해 EEC 디렉티브(Directive) 79/831 아넥스(Annex) V.A8에 의해 결정하였다.

[0717]

^[a] 산성 범위에서의 LC-MS 결정은 pH 2.7에서 이동상으로서 0.1% 수성 포름산 및 아세트오니트릴 (0.1% 포름산을 함유함)을 사용하여; 선형 구배 10% 아세트오니트릴에서 95% 아세트오니트릴로 수행하였다. 또한, logP(HCOOH)로서 지칭된다.

[0718]

^[b] 중성 범위에서의 LC-MS 결정은 pH 7.8에서 이동상으로서 0.001 몰 수성 중탄산암모늄 용액 및 아세트오니트릴을 사용하여; 선형 구배 10% 아세트오니트릴에서 95% 아세트오니트릴로 수행하였다. 또한, logP(중성)으로서 지칭된다.

[0719]

^[c] 산성 범위에서의 결정은 pH 2.3에서 이동상으로서 0.1% 수성 인산 및 아세트오니트릴을 사용하여; 선형 구배 10% 아세트오니트릴에서 95% 아세트오니트릴로 수행하였다.

[0720]

보정은 공지된 logP 값 (logP 값은 2개의 연속하는 알카논 사이의 선형 내삽을 사용하여 체류 시간에 의해 결정됨)을 갖는 비분지형 알칸-2-온 (3 내지 16개의 탄소 원자를 가짐)을 사용하여 수행하였다.

[0721]

람다-최대값은 크로마토그래피 신호의 최대에서 200 nm 내지 400 nm의 UV 스펙트럼을 사용하여 결정하였다.

[0722]

선택된 실시예의 NMR 데이터

[0723]

선택된 실시예의 NMR 데이터는 통상의 형식으로 (δ 값, 수소 원자의 개수, 다중선 분할) 또는 NMR 피크 목록으로서 열거된다.

[0724]

NMR 피크 열거 방법:

[0725]

선택된 실시예에 대한 ¹H NMR 데이터가 ¹H NMR 피크 목록의 형태로 언급되는 경우에, 첫째로 δ 값 (ppm) 및 이어지는 신호 강도는 각각의 신호 피크에 대해 열거되며, 공간에 의해 분리된다. 상이한 신호 피크에 대한 δ 값 - 신호 강도 숫자 쌍은 세미콜론에 의해 서로로부터 분리되어 열거된다.

[0726]

한 실시예에 대한 피크 목록은 따라서 하기 형식을 취한다:

[0727]

δ_1 강도₁; δ_2 강도₂;.....; δ_i 강도_i;.....; δ_n 강도_n

[0728] NMR 스펙트럼이 기록된 용매는 실시예 번호 뒤 및 NMR 피크 목록 또는 통상의 NMR 해석 목록 앞에 꺾쇠 괄호 내에 열거된다.

실시예 번호	¹ H-NMR 데이터
Ia-01	¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.12(d,1H), 7.07(d,1H), 3.84-3.92(m,2H), 2.98(넓음, 6H), 2.33(s,3H)
Ia-02	¹ H-NMR (CDCl ₃): 7.03-7.09(m,1H), 6.91-6.93(m,1H), 5.29(넓음, 1H), 3.28-3.38(m,4H), 2.42(s,3H), 1.69(넓음, 2H), 1.01(넓음, 2H), 0.83-0.88(m,1H)
Ia-03	¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.11-7.14(m,1H), 7.06-7.04(m,1H), 6.92-6.98(넓음, 2H), 6.30(tt,1H), 3.83-3.91(q,2H), 2.34(s,3H)
Ia-05	[CDCl ₃] 7.26 45.31;7.09 0.35;7.03 0.72;6.93 0.95;6.91 0.85;5.09 0.50;4.13 0.50;3.30 1.93;3.28 1.82;2.42 16.00;1.57 44.22;1.43 0.36;1.33 0.54;1.29 4.62;1.28 4.60;1.26 1.33;1.25 1.06;1.25 1.27;1.23 0.74;1.08 0.47;0.01 0.72;0.00 24.21;-0.01 0.77
Ia-07	¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.10(s,1H), 6.98(넓음, 2H), 6.85(s,1H), 3.87(q,2H), 2.30(s,3H), 1.98(s,3H)
Ia-09	[DMSO-D ₆] 7.09 3.30;7.07 3.26;6.87 0.35;6.85 0.33;4.06 0.56;4.04 1.74;4.02 1.77;4.00 0.62;3.92 0.37;3.86 1.00;3.35 143.04;3.34 312.18;2.79 0.68;2.78 0.62;2.74 0.37;2.73 0.35;2.68 0.56;2.67 0.68;2.67 0.49;2.54 0.38;2.53 0.96;2.51 54.21;2.50 72.95;2.34 0.46;2.33 0.64;2.33 0.79;2.33 0.64;2.32 0.46;2.07 1.95;2.04 0.35;2.01 16.00;1.99 8.08;1.36 0.69;1.24 0.46;1.19 2.26;1.17 4.49;1.16 2.17;0.88 0.50;0.86 0.36;0.00 9.11
Ia-12	[DMSO-D ₆] 7.01 4.28;4.03 0.82;4.02 0.83;3.79 0.35;3.37 0.42;3.34 331.71;3.33 0.37;3.32 2.34;2.79 0.50;2.62 0.35;2.61 0.48;2.61 0.35;2.52 0.66;2.52 0.84;2.52 0.90;2.51 23.83;2.51 51.40;2.50 70.93;2.50 51.33;2.50 23.51;2.44 0.53;2.39 0.35;2.39 0.53;2.38 0.38;2.36 0.58;2.33 0.49;2.31 0.74;2.28 16.00;2.19 0.55;1.99 3.80;1.97 7.19;1.19 0.93;1.17 1.84;1.16 0.90;0.01 0.74;0.00 23.54;-0.01 0.71
Ia-13	[CDCl ₃] 7.26 51.97;7.09 0.34;7.04 0.43;6.93 0.64;6.92 0.56;3.73 0.51;3.72 0.51;3.49 0.37;3.30 1.06;3.29 1.10;3.29 0.94;3.28 0.80;3.01 1.54;2.42 16.00;2.36 0.92;1.57 10.32;1.26 0.76;1.25 1.28;1.23 0.63;0.01 0.86;0.00 28.20;-0.01 0.93
Ia-14	¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.67(s,1H), 7.15(s,1H), 4.16(q,2H)
Ia-15	¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.30(넓음, 1H), 7.61(s,1H), 7.20(s,1H), 4.14(q,2H), 2.62(넓음, 3H)
Ia-17	¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.15(d,1H), 7.10(넓음, 2H), 6.92(d,1H), 3.90(q,2H), 2.01(s,3H)
Ia-18	[CDCl ₃] 7.26 18.05;7.26 0.39;7.25 0.35;7.24 0.34;7.04 0.64;6.94 0.46;6.93 1.00;6.92 0.76;6.91 0.76;6.84 0.35;6.82 0.33;5.26 0.47;3.45 1.08;3.41 0.41;3.39 0.32;3.30 1.56;3.28 1.39;2.47 0.74;2.42 16.00;1.58 15.92;1.29 1.95;1.26 0.51;1.25 0.43;1.25 0.48;1.09 0.37;0.00 9.63;-0.01 0.33
Ia-19	¹ H-NMR (CDCl ₃): 7.58 (d,1H), 7.13 (s,1H), 6.85 (d,1H), 5.31 (넓음, 1H), 3.45 (q,2H), 2.93 (넓음, 3H)

[0729]

실시예 번호	¹ H-NMR 데이터
Ia-21	¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.17(d,1H), 7.09(d,1H), 3.91(q,2H), 2.34(s,3H)
Ia-23	¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.02(s,1H), 6.79(s,1H), 3.83(q,2H), 2.87(넓음, 6H), 2.28(s,3H), 1.96(s,3H)
Ia-24	¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.09(d,1H), 6.86(넓음, 1H), 3.89(q,2H), 2.90(넓음, 3H), 2.00(s,3H)
Ia-25	¹ H-NMR (CDCl ₃): 7.72 (d,1H), 7.24 (m,1H), 6.96-6.99 (m,1H), 4.98 (넓음, 2H), 3.48(q,2H)
Ia-26	[CDCl ₃] 7.26 29.38;6.94 1.54;6.92 1.55;3.73 0.38;3.72 0.38;3.49 0.34;3.33 0.70;3.32 0.83;2.47 0.43;2.42 16.00;1.57 6.79;1.26 0.58;1.25 1.07;1.23 0.54;0.48 0.53;0.43 0.39;0.01 0.45;0.00 15.80;-0.01 0.53

[0730]

실시예 번호	1H-NMR 데이터
Ib-01	1H-NMR(D6-DMSO): 7.29(d,1H), 7.23(d,1H), 4.02-4.14(m,2H), 3.01(넓음, 6H), 2.31(s,3H)
Ib-02	1H-NMR(D6-DMSO): 8.30(넓음, 1H), 7.29(d,1H), 7.22(d,1H), 4.08-4.14(m,2H), 3.99(넓음, 2H), 2.31(s,3H), 1.11(넓음, 3H)
Ib-03	1H-NMR(D6-DMSO): 8.02(넓음, 1H), 7.28(d,1H), 7.21(d,1H), 4.08-4.14(m,2H), 3.96-4.00(m,1H), 2.31(s,3H), 1.12-1.17(넓음, 6H)
Ib-04	1H-NMR(D6-DMSO): 8.01(넓음, 1H), 7.00-7.20(m,2H), 3.70-4.10(m,2H), 2.80(넓음, 3H), 2.27(s,3H), 2.07(s,3H)
Ib-05	[DMSO-D ₆] 7.76 0.68;7.75 0.68;7.48 0.42;7.46 0.41;7.27 5.26;7.26 5.26;7.09 0.34;7.02 0.49;4.32 0.34;4.30 0.38;4.27 0.47;4.26 0.80;4.24 1.46;4.22 2.04;4.20 1.69;4.18 0.75;3.35 821.56;3.34 2.15;3.33 2.32;3.17 0.58;3.16 0.56;2.81 0.80;2.73 0.36;2.62 0.57;2.62 1.01;2.62 1.31;2.61 0.98;2.61 0.52;2.54 1.16;2.52 3.60;2.52 4.50;2.52 5.20;2.51 63.77;2.51 130.55;2.50 175.10;2.50 122.46;2.50 53.43;2.48 0.53;2.39 0.67;2.39 1.11;2.39 1.41;2.38 1.11;2.38 0.73;2.37 6.18;2.33 0.38;2.31 0.37;2.27 4.25;2.11 16.00;2.09 5.30;2.08 1.22;2.02 0.44;1.91 0.99;1.23 0.51;1.14 1.46;0.01 0.51;0.00 12.92
Ib-06	1H-NMR(D6-DMSO): 7.28(d,1H), 7.22(d,1H), 4.10-4.14(m,1H), 3.90-4.09(m,1H), 3.10-3.30(넓음, 2H), 2.31(s,3H), 1.51-1.56(넓음, 2H), 0.84-0.91(넓음, 3H)
Ib-07	1H-NMR(D6-DMSO): 7.30(d,1H), 7.22(d,1H), 3.99-4.15(m,2H), 2.66-2.73(넓음, 3H), 2.31(s,3H)
Ib-08	[DMSO-D ₆] 8.43 0.75;7.39 0.32;7.22 1.80;7.20 1.79;4.37 0.45;4.13 0.35;4.11 0.82;4.09 0.84;4.07 0.47;4.05 0.32;4.03 0.53;4.02 0.49;3.45 0.50;3.44 0.51;3.44 0.56;3.43 0.58;3.43 0.36;3.42 0.38;3.40 0.48;3.40 0.57;3.39 1.02;3.38 1.14;3.35 1478.79;3.33 18.72;2.62 0.34;2.62 0.79;2.62 1.07;2.61 0.78;2.61

[0731]

실시예 번호	1H-NMR 데이터
	0.36;2.54 0.67;2.52 1.59;2.52 2.06;2.52 2.16;2.51 57.91;2.51 127.88;2.50 173.56;2.50 123.42;2.50 53.41;2.39 0.33;2.39 0.75;2.39 1.04;2.38 0.74;2.38 0.33;2.31 16.00;2.08 2.40;1.99 1.93;1.23 0.45;1.19 0.50;1.17 1.09;1.16 0.49;1.07 0.79;1.05 1.55;1.04 0.73;0.42 0.41;0.41 0.44;0.01 0.39;0.00 13.49;0.01 0.41
Ib-09	1H-NMR(D6-DMSO): 7.12(s,1H), 7.03(s,1H), 4.03-4.07(m,2H), 2.91(넓음, 6H), 2.27(s,3H), 2.07(s,3H)
Ib-10	1H-NMR (CDCl ₃): 7.63-7.71 (m,2H), 7.07 (d,1H), 5.63 (넓음, 1H), 3.25-3.58 (m,2H), 2.94 (d,3H)
Ib-11	1H-NMR(D6-DMSO): 7.37(d,1H), 7.28(d,1H), 4.03-4.10(m,2H), 2.34(s,3H)
Ib-12	1H-NMR(D6-DMSO): 7.19(s,1H), 7.17(s,1H), 3.96-4.04(m,2H), 2.30(s,3H), 2.07(s,3H)
Ib-13	1H-NMR(D6-DMSO): 7.31(d,1H), 7.10(d,1H), 4.23-4.29(m,1H), 4.13-4.18(m,1H), 2.10(s,3H)
Ib-14	1H-NMR(D6-DMSO): 7.87(s,1H), 7.54(넓음, 2H), 7.33(s,1H), 4.10-4.18(m,2H)
Ib-15	1H-NMR(D6-DMSO): 7.27(d,1H), 6.98(d,1H), 4.23(m,2H), 2.94(넓음, 6H), 2.09(s,3H)

[0732]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-27		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.11-7.08(m,1H), 7.04-7.02(m,1H), 6.68(넓은, 2H), 3.89-3.81(q,2H), 2.33(s,3H), 1.37-1.30(m,4H)
Ia-28		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.87(s,1H), 7.60-7.27(넓은, 2H), 7.10(s,1H), 4.15(q,2H)
Ia-29		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.10-7.07(m,1H), 7.00-6.98(m,1H), 6.60(넓은, 2H), 5.03(m,1H), 3.88-3.80(q,2H), 2.32(s,3H), 2.05-1.98(m,1H), 1.72-1.63(m,1H)

[0733]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-30		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.37(s,1H), 7.26(넓은, 2H), 6.99(s,1H), 4.00-3.92(q,2H), 2.32(s,3H)
Ia-31		$\log P(\text{HCOOH})=4.73$, $\log P(\text{중성})=4.67$
Ia-32		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.82(s,1H), 7.12(s,1H), 4.14(q,2H), 3.00(s,6H)
Ia-33		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.06-7.03(m,1H), 6.94-6.92(m,1H), 6.37(넓은, 2H), 4.93-4.76(m,1H), 3.86-3.78(q,2H), 2.31(s,3H), 2.09-2.05(m,1H), 1.42-1.24(m,2H)
Ia-34		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.03(s,1H), 6.76(s,1H), 5.99(넓은, 2H), 3.86-3.78(q,2H), 2.29(s,3H), 1.91(s,3H), 1.59-1.55(m,2H), 1.29-1.26(m,2H)
Ia-35		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.48(d,1H), 7.20(d,1H), 4.05(q,2H), 3.01(s,6H)
Ia-36		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.29(m,1H), 6.94(m,1H), 6.32(넓은, 2H), 3.97-3.89(q,2H), 2.29(s,3H), 1.60(m,2H), 1.28(m,2H)
Ia-37		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.22(넓은, 1H), 7.82(s,1H), 7.16(s,1H), 4.13(q,2H), 2.65(bs,3H)
Ia-38		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.37(s,1H), 7.32(넓은, 2H), 7.00(s,1H), 4.01-3.93(q,2H), 2.31(s,3H)

[0734]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-39		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.01(m,2H), 3.84(q,2H), 3.38-3.32(m,2H), 2.88(s,3H), 2.30(s,3H), 2.25(t,2H), 1.88(q,2H)
Ia-40		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 9.12-9.11(m,1H), 8.68-8.67(m,1H), 8.32-8.28(m,1H), 7.50-7.47(m,1H), 7.17-7.12(m,2H), 6.79(넓음, 2H), 3.93-3.85(q,2H), 2.36(s,3H)
Ia-41		$\log P(\text{HCOOH}) = 4.62$
Ia-42		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 9.32(m,1H), 9.00-8.98(m,1H), 8.27-8.26(m,1H), 7.19-7.16(m,2H), 7.05-6.98(넓음, 2H), 3.93-3.85(q,2H), 2.37(s,3H)
Ia-43		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.32(bs,1H), 7.58(d,1H), 7.22-7.20(m,1H), 4.05(q,2H), 2.80-2.60(넓음, 3H) - 주요 이성질체의 피크
Ia-44		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.42-7.35(m,2H), 7.28-7.24(m,2H), 7.08-7.06(m,1H), 6.88-6.83(m,2H), 3.65-3.57(q,2H), 2.86-2.85(d,3H), 2.21(s,3H)
Ia-45		$\log P(\text{HCOOH}) = 4.82$, $\log P(\text{중성}) = 4.71$
Ia-46		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.94(m,1H), 8.37-8.34(m,1H), 7.63-7.61(m,1H), 7.17-7.12(m,2H), 6.86(넓음, 2H), 3.92-3.84(q,2H), 2.36(s,3H)
Ia-47		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.35(넓음, 2H), 7.17-7.15(m,1H), 7.06-7.04(m,1H), 3.92-3.85(q,2H), 2.35(s,3H)

[0735]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-48		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.34(m,1H), 6.99(s,1H), 6.84(넓은, 2H), 6.31(t,1H), 3.99-3.91(q,2H), 2.30(s,3H)
Ia-49		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.63-8.64(m,1H), 8.34-8.32(m,1H), 7.98-7.94(m,1H), 7.59-7.55(m,1H), 7.36(s,1H), 7.02(s,1H), 6.60(넓은, 2H), 4.05-3.98(q,2H), 2.05(s,3H)
Ia-50		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.51-6.74(m,6H), 3.64-3.56(q,2H), 2.98(s,3H), 2.89(s,3H), 2.18(s,3H)
Ia-51		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.10(d,1H), 7.04(d,1H), 3.86(q,2H), 3.40-3.36(m,4H), 2.32(s,3H), 1.15-1.11(m,6H)
Ia-52		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.32(bs,1H), 7.49-7.44(m,1H), 7.32-7.21(m,1H), 4.04(q,2H), 2.70(bs,3H)
Ia-53		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.29(s,1H), 6.90(s,1H), 4.04-3.98(q,2H), 2.92(넓은, 6H), 1.98(s,3H)
Ia-54		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.86(넓은, 1H), 7.13-7.05(넓은, 2H), 4.77(넓은, 2H), 4.60(넓은, 2H), 4.40(넓은, 1H), 3.85(넓은, 2H), 2.33(s,3H)
Ia-55		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.08-7.04(m,2H), 6.23(tt,1H), 3.87-3.77(m,4H), 3.48-3.46(t,2H), 2.31(s,3H), 2.32-2.29(t,2H); 1.94-1.90(m,2H)
Ia-56		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.37(s,1H), 7.27(넓은, 2H), 7.03(s,1H), 4.03-3.95(q,2H), 2.31(s,3H)

[0736]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-57		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.62(s,1H), 7.17(s,1H), 4.17-4.12(m,2H), 3.00(s,6H)
Ia-58		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.10-7.07(m,1H), 7.00-6.98(m,1H), 6.42(넓은, 2H), 3.88-3.80(q,2H), 2.32(s,3H), 1.57(m, 2H), 1.29(m,2H)
Ia-59		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.46-8.44(m,1H), 8.32-8.31(m,1H), 7.60-7.58(m,1H), 7.33-7.30(m,1H), 6.83-6.80(m,2H), 3.69-3.61(q,2H), 3.01(s,3H), 2.93(s,3H), 2.17(s,3H)
Ia-60		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.37-7.32(m,3H), 7.19-7.17(m,2H), 6.88-6.85(m,1H), 6.80-6.78(m,1H), 3.64-3.56(q,2H), 2.86-2.85(d,3H), 2.21(s,3H)
Ia-61		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.47-8.46(m,1H), 8.36(m,1H), 7.57-7.55(m,1H), 7.51-7.48(m,1H), 7.30-7.27(m,1H), 6.89-6.83(m,2H), 3.70-3.62(q,2H), 2.89-2.88(d,3H), 2.20(s,3H)
Ia-62		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.54(s,1H), 7.02(넓은, 1H), 4.11(q,2H), 3.28(t,2H), 2.96(s,3H), 2.08(t,2H), 1.77-1.71(m,2H), 1.62-1.56(m,2H)
Ia-63		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.65-8.64(m,1H), 8.31-8.29(m, 1H), 7.98-7.94(m,1H), 7.59-7.56(m,1H), 7.17-7.14(m,2H), 6.80(넓은, 2H), 3.93-3.85(q,2H), 2.36(s,3H)
Ia-64		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.46-8.45(m,1H), 8.37(s,1H), 7.57-7.55(m,1H), 7.49-7.48(넓은, 1H), 7.30-7.27(m,1H), 7.13(s,1H), 6.78(s,1H), 3.73-3.65(q,2H), 2.90-2.88(d,3H), 2.17(s,3H)
Ia-65		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.10(s,1H), 6.98(넓은, 2H), 6.83(s,1H), 3.89-3.81(q,2H), 2.31(s,3H), 1.98(s,3H)
Ia-66		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.14(m,1H), 8.67-8.66(m,1H), 8.33-8.30(m,1H), 7.50-7.46(m,1H), 7.10(s,1H), 6.91(s,1H), 6.41(넓은, 2H), 3.89-3.81(q,2H), 2.33(s,3H), 2.04(s,3H)

[0737]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-67		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.09-7.06(m,1H), 6.94-6.92(m,1H), 6.53(넓은, 2H), 3.86-3.78(m,2H), 2.67(m,1H), 2.33(s,3H), 1.96-1.90(m,1H), 1.76-1.70(m,1H)
Ia-68		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.53(s,1H), 7.10(s,1H), 4.11(q,2H), 3.39(t,2H), 2.90(s,3H), 2.26(t,2H), 1.90(q,2H)
Ia-69		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.33(넓은, 1H), 7.50-7.24(m,4H), 6.88-6.85(m,1H), 6.76-6.73(m,1H), 3.49-3.45(q,2H), 2.89-2.88(d,3H), 2.18(s,3H)
Ia-70		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.36(s,1H), 7.22(넓은, 2H), 6.92(s,1H), 4.07-3.99(q,2H), 1.98(s,3H)
Ia-71		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.35-7.32(m,2H), 7.19-7.16(m,2H), 7.09(s,1H), 6.70(s,1H), 3.68-3.60(q,2H), 2.90(넓은, 6H), 2.15(s,3H)
Ia-72		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.55-8.54(m,1H), 8.04-7.96(m,2H), 7.72(m,1H), 7.60-7.57(m,1H), 7.37(m,1H), 6.93-6.90(m,1H), 3.63(q,2H), 2.83-2.81(d,3H), 2.24(s,3H)
Ia-73		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.69-8.68(m,2H), 7.90-7.89(m,2H), 7.17-7.11(m,2H), 6.85(넓은, 2H), 3.93-3.85(q,2H), 2.36(s,3H)
Ia-74		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.27(s,1H), 6.84(s,1H), 6.21(넓은, 2H), 4.04-3.94(q,2H), 1.93(s,3H), 1.30-1.15(m,4H)
Ia-75		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.09-7.06(m,1H), 6.94-6.92(m,1H), 6.65(넓은, 2H), 3.85-3.77(q,2H), 2.68-2.62(m,1H), 2.33(s,3H), 2.17-2.14(m,1H), 1.91-1.87(m,1H)

[0738]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-76		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.36(m,1H), 7.15(넓음, 2H), 6.95(s,1H), 4.08-4.00(q,2H), 1.99(s,3H)
Ia-77		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.33(d,1H), 6.99(d,1H), 6.64-6.61(m,1H), 4.15-4.07(m,2H), 2.92(s,6H)
Ia-78		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.85(d,2H), 7.36(dd,2H), 7.12-7.09(m,3H), 3.92-3.84(m,4H), DMSO 피크 하의 2H, 2.33(s,3H), 2.05-1.97(m,2H)
Ia-79		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.05-7.01(m,2H), 6.10(넓음, 2H), 3.88-3.80(q,2H), 2.32(s,3H), 2.31(s,3H), 2.30(s,3H), 1.74(m,1H), 1.17(m,2H)
Ia-80		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.49-8.48(m,2H), 7.51-7.49(m,1H), 7.15-7.14(m,2H), 6.87-6.85(m,2H), 3.69-3.61(q,2H), 2.88-2.87(d,3H), 2.20(s,3H)
Ia-81		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.95-8.96(m,1H), 8.36-8.39(m,1H), 7.61-7.63(m,1H), 7.10(s,1H), 6.91(s,1H), 6.49(넓음, 2H), 3.81-3.89(q,2H), 2.32(s,3H), 2.03(s,3H)
Ia-82		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.09-7.06(m,1H), 7.01-6.99(m,1H), 6.19(넓음, 2H), 3.95(s,2H), 3.88-3.80(q,2H), 3.33(s,3H), 2.32(s,3H)
Ia-83		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.64-8.63(m,1H), 8.30-8.28(m,1H), 7.98-7.93(m,1H), 7.58-7.55(m,1H), 7.33-7.29(m,1H), 7.13-7.11(m,1H), 7.02(s,1H), 6.84-6.82(m,1H), 6.64(넓음, 2H), 4.04-3.96(q,2H)
Ia-84		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.40-7.17(m,4H), 6.87-6.84(m,1H), 6.77-6.75(m,1H), 3.59-3.46(m,2H), 3.14(넓음, 3H), 2.71(넓음, 3H), 2.17(s,3H)

[0739]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-85		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.33(넓은, 1H), 7.11-7.06(m, 2H), 3.83(q, 2H), 2.33(s, 3H), 1.34(넓은, 3H), 0.76(넓은, 2H), 0.57(넓은, 2H)
Ia-86		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 9.27-9.25(m, 1H), 8.58-8.56(m, 1H), 8.03-8.01(m, 1H), 7.18-7.14(m, 2H), 7.01(넓은, 2H), 3.93-3.85(q, 2H), 2.37(s, 3H)
Ia-87		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.00(넓은, 1H), 7.28(s, 1H), 6.95(넓은, 1H), 4.09-4.01(q, 2H), 2.68-2.67(넓은, 3H), 2.00(s, 3H)
Ia-88		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.53(s, 1H), 7.102(s, 1H), 4.12(q, 2H), 3.39(dd, 2H), 2.90(s, 3H), 2.26(dd, 2H), 1.90(m, 2H)
Ia-89		$\log P(\text{HCOOH})=5.15$, $\log P(\text{중성})=5.15$
Ia-90		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.03(d, 1H), 6.93(d, 1H), 3.84(q, 2H), 3.25(t, 2H), 2.94(s, 3H), 2.30(s, 3H), 2.10(t, 2H), 1.76-1.70(m, 2H), 1.60-1.54(m, 2H)
Ia-91		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.44-8.43(m, 1H), 8.32(m, 1H), 7.51-7.48(m, 1H), 7.28-7.21(m, 2H), 6.89(s, 1H), 6.41(넓은, 1H), 3.47-3.39(q, 2H), 2.88(넓은, 3H), 2.17(s, 3H), 2.07(s, 3H)
Ia-92		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.04-7.01(m, 1H), 6.93-6.91(m, 1H), 6.12(넓은, 2H), 3.86-3.78(q, 2H), 2.31(s, 3H), 1.52(m, 1H), 0.88-0.84(m, 2H), 0.72-0.71(m, 2H)
Ia-93		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.10-7.07(m, 2H), 3.87-3.79(q, 2H), 3.11(넓은, 6H), 2.34(s, 3H), 1.69-1.68(m, 1H), 0.68-0.66(m, 2H), 0.33(m, 2H)

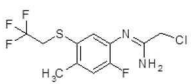
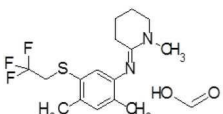
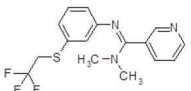
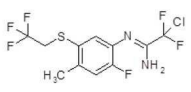
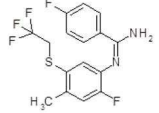
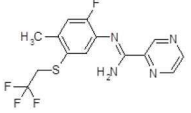
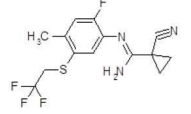
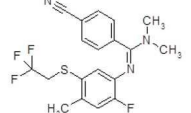
[0740]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-94		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.10-7.07(m,1H), 6.98-6.96(m,1H), 6.15(넓은, 2H), 3.88-3.81(q,2H), 3.12-3.08(m,1H), 2.33(s,3H), 2.37-1.71(m,6H)
Ia-95		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.69-8.67(m,2H), 7.92-7.91(m,2H), 7.11(s,1H), 6.90(s,1H), 6.47(넓은, 2H), 3.89-3.81(q,2H), 2.32(s,3H), 2.02(s,3H)
Ia-96		$\log P(\text{HCOOH})=4.37$, $\log P(\text{중성})=4.37$
Ia-97		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.20(bs,1H), 7.48(d,1H), 7.32-7.17(m,1H), 3.98(q,2H), 2.90-2.50(넓은, 3H)
Ia-98		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.64-8.63(m,1H), 8.35-8.33(m,1H), 7.98-7.93(m,1H), 7.58-7.54(m,1H), 7.11(s,1H), 6.94(s,1H), 6.41(넓은, 2H), 3.89-3.82(q,2H), 2.33(s,3H), 2.03(s,3H)
Ia-99		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.09-7.02(m,2H), 6.22(넓은, 2H), 4.40-4.36(t,1H), 3.97-3.92(m,1H), 3.88-3.80(q,2H), 3.76-3.72(m,1H), 2.33(s,3H), 2.23-2.16(m,1H), 2.06-1.98(m,1H), 1.89-1.77(m,2H)
Ia-100		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.25-7.21(m,1H), 7.07-7.05(m,1H), 6.83(m,1H), 6.65-6.63(m,1H), 6.18(넓은, 2H), 4.00-3.92(q,2H), 1.55(m,2H), 1.26(m,2H)
Ia-101		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.69-8.67(m,2H), 7.91-7.89(m,2H), 7.32-7.29(m,1H), 7.12-7.10(m,1H), 6.98(s,1H), 6.79-6.77(m,1H), 6.65(넓은, 2H), 4.04-3.96(q,2H)
Ia-102		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.24(s,1H), 6.79(s,1H), 5.95(넓은, 2H), 4.00-3.92(q,2H), 1.93(s,3H), 1.51(넓은, 1H), 0.89-0.86(m,2H), 0.73-0.70(m,2H)

[0741]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-103		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.54(bs,1H), 7.02(bs,1H), 4.11(q,2H), 3.33(dd,2H), 2.96(s,3H), 2.08(dd,2H), 1.74(m,2H), 1.58(m,2H)
Ia-104		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.12(s,1H), 8.67-8.66(m,1H), 8.31-8.29(m,1H), 7.50-7.46(m,1H), 7.32-7.28(m,1H), 7.12-7.10(m,1H), 6.99(s,1H), 6.80-6.78(m,1H), 6.66-6.59(넓은, 2H), 4.04-3.96(q, 2H)
Ia-105		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.33(bs,1H), 7.20(bs,1H), 3.92(q,2H), 3.66(bs,2H), 3.34(m,2H), 3.13(bs,3H), 2.33(bs,3H), 2.16(bs,3H), 2.02-1.95(m,2H)
Ia-106		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.05(m,1H), 6.88(m,1H), 3.75(q,2H), 2.98(s,3H), 2.87(s,3H), 2.33(s,3H), 1.83(m,2H), 0.95-0.93(m,7H)
Ia-107		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.94-8.93(m,1H), 8.41-8.34(m,2H), 7.82-7.80(m,1H), 7.63-7.61(m,1H), 7.32-7.28(m,1H), 6.99(s,1H), 6.68-6.65(넓은, 2H), 4.00(q,2H)
Ia-108		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.15-7.09(m,2H), 3.89-3.81(q,2H), 2.61(m,1H), 2.33(s,3H), 1.45(m,1H), 0.84-0.80(m,3H), 0.69-0.61(m,4H), 0.50(m,2H)
Ia-109		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.48(d,1H), 7.15(d,1H), 4.00(q,2H), 2.98(s,6H)
Ia-110		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.18(d,1H), 7.04-6.97(m,2H), 3.83(q,2H), 3.15(m,2H), 2.31(s,3H), 1.35(m,1H), 0.99(t,3H), 0.79-0.77(m,2H), 0.60-0.57(m,2H)
Ia-111		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.40(넓은, 2H), 7.18-7.15(m,1H), 7.07-7.05(m,1H), 3.93-3.85(q,2H), 2.35(s,3H)

[0742]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-112		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.14-7.12(m,1H), 7.06-7.04(m,1H), 6.75(넓음, 2H), 4.18(s,2H), 3.90-3.82(q,2H), 2.34(s,3H)
Ia-113		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.15(s,1H), 7.33(bs,1H), 7.21(d,1H), 3.94(q,2H), 3.49(넓음, 2H), 3.19(넓음, 3H), 2.34(s,3H), 2.24-2.06(m,5H), 1.78(넓음, 2H), 1.61(넓음, 2H)
Ia-114		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.44-8.42(m,1H), 8.31-8.30(m,1H), 7.60-7.58(m,1H), 7.32-7.29(m,1H), 6.96-6.92(m,1H), 6.79-6.77(m,1H), 6.60-6.59(m,1H), 6.41-6.38(m,1H), 3.79-3.71(q,2H), 3.00(넓음, 3H); 2.92(넓음, 3H)
Ia-115		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.36-7.28(넓음, 2H), 7.17-7.15(m,1H), 7.09-7.06(s,1H), 3.94-3.86(q,2H), 2.34(s,3H)
Ia-116		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.04-8.01(m,2H), 7.29-7.25(m,2H), 7.14-7.09(m,2H), 6.61(넓음, 2H), 3.87(q,2H), 2.36(s,3H)
Ia-117		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.45-9.44(m,1H), 8.83-8.82(m,1H), 8.72-8.71(m,1H), 7.20-7.16(m,2H), 6.98-6.92(넓음, 2H), 3.93-3.85(q, 2H), 2.37(s,3H)
Ia-118		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.11-7.08(m,1H), 7.01-6.99(m,1H), 6.26(넓음, 2H), 3.90-3.82(q,2H), 2.32(s,3H), 1.66-1.56(m,4H)
Ia-119		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.77-7.75(m,2H), 7.36-7.34(m,2H), 6.83(d,1H), 6.74(d,1H), 3.57(q,2H), 3.10(넓음, 3H), 2.73(넓음, 3H), 2.17(s,3H)

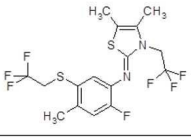
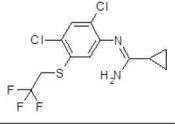
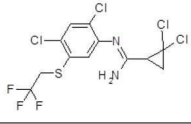
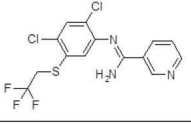
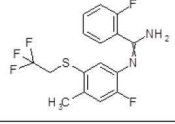
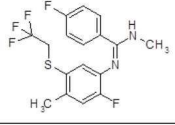
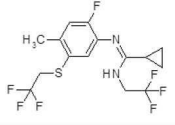
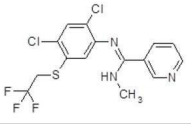
[0743]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-120		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.35-7.29(m,1H), 7.12-7.07(m,1H), 7.02-7.01(m,1H), 7.00-6.93(m,1H), 6.84-6.78(m,2H), 3.60(q,2H), 3.07(넓은, 3H), 2.73(넓은, 3H), 2.17(s,3H)
Ia-121		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.76(s,1H), 7.48-7.33(넓은, 2H), 7.13(s,1H), 4.20-4.12(m,2H)
Ia-122		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.09(s,1H), 6.90(넓은, 2H), 6.84(s,1H), 3.90-3.82(q,2H), 2.31(s,3H), 1.99(s, 3H)
Ia-123		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.56(s,1H), 7.04(s,1H), 6.53(넓은, 2H), 4.13-4.05(q,2H), 1.62-1.59(m,2H), 1.31-1.28(m,2H)
Ia-124		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.78(s,1H), 7.57-7.33(넓은, 1H), 7.12(s,1H), 4.19-4.11(2H)
Ia-125		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.63(s,1H), 7.09(s,1H), 7.02-6.97(넓은, 2H), 6.34(t,1H), 4.16-4.09(q,2H)
Ia-126		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.40-7.39(m,1H), 7.33-7.27(m,1H), 7.16-7.11(m,1H), 7.02-6.97(m,2H), 6.87-6.82(t,2H), 3.64-3.56(q,2H), 2.87-2.86(m,3H), 2.21(s,3H)
Ia-127		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.10(s,1H), 7.05(넓은, 2H), 6.84(s,1H), 3.90-3.82(q,2H), 2.31(s,3H), 1.96(s,3H)

[0744]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-128		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.19-7.16(m,2H), 7.13-7.08(m,2H), 6.82(d,1H), 6.72(d,1H), 3.58(q,2H), 3.01(넓음, 3H), 2.72(넓음, 3H), 2.17(s,3H)
Ia-129		logP(HCOOH)=4.2, logP(중성)=4.2
Ia-130		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.33(m,1H), 9.01-9.00(m,1H), 8.28-8.27(m,1H), 7.66(s,1H), 7.21(s,1H), 7.12-7.00(넓음, 2H), 4.16-4.08(q,2H)
Ia-131		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.77-7.75(m,2H), 7.36-7.34(m,2H), 6.83(d,1H), 6.74(d,1H), 3.58(q,2H), 3.10(넓음, 3H), 2.70(넓음, 3H), 2.17(s,3H)
Ia-132		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.11-7.10(m,1H), 7.07-7.01(m,1H), 6.49(넓음, 2H), 3.88-3.83(q,2H), 3.65(s,2H), 2.33(s,3H)
Ia-133		¹ H-NMR(D6-DMSO, 400 MHz): 7.58(d,1H), 7.18(d,1H), 4.06(q,2H), 3.01(s,6H)
Ia-134		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.66-8.65(m,1H), 8.32-8.30(m,1H), 8.00-7.95(m,1H), 7.64(s,1H), 7.60-7.57(m,1H), 7.20(s,1H), 6.95(넓음, 2H), 4.16-4.08(m,2H)
Ia-135		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.95(넓음, 1H), 8.38-8.32(m,1H), 7.64(m,2H), 7.19(s,1H), 6.94(넓음, 2H), 4.15-4.08(q,2H)
Ia-136		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.47-8.45(m,1H), 8.35(s,1H), 7.56-7.54(m,1H), 7.39-7.38(m,1H), 7.31-7.27(m,1H), 7.15(s,1H), 6.54(넓음, 1H), 3.71-3.64(q,2H), 2.89-2.88(d,3H), 2.08(s,3H),

[0745]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-138		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.20-7.16(m,2H), 4.79(q,2H), 3.83(q,2H), 2.35(s,3H), 2.10(s,3H), 2.03(s,3H)
Ia-139		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.52(s,1H), 6.98(s,1H), 6.24-6.15(넓은음, 2H), 4.11-4.03(q,2H), 1.51(m,1H), 0.92-0.88(m,2H), 0.76-0.71(m,2H)
Ia-140		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.58(s,1H), 6.95(s,1H), 6.70(넓은음, 2H), 4.07-4.00(m,2H), 2.17-2.14(m,1H), 1.95-1.93(m,1H)
Ia-141		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 9.13(m,1H), 8.69(m,1H), 8.32(m,1H), 7.64(s,1H), 7.49(m,1H), 7.18(s,1H), 6.89(넓은음, 2H), 4.16-4.08(넓은음, 2H)
Ia-143		$\log\text{P(HCOOH)}=1.37$, $\log\text{P(중성)}=3.25$
Ia-144		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.34-7.33(m,1H), 7.23-7.20(m,2H), 7.12-7.07(m,2H), 6.85(d,1H), 6.77(d,1H), 3.58(q,2H), 2.86-2.85(m,3H), 2.21(s,3H)
Ia-145		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.09-7.07(m,1H), 6.99-6.98(m,1H), 6.72(넓은음, 1H), 3.85-3.79(m,4H), 2.33(s,3H), 1.41(넓은음, 1H), 0.85-0.83(m,2H), 0.68-0.65(m,2H)
Ia-146		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.50-8.49(m,1H), 8.41(s,1H), 7.71(넓은음, 1H), 7.50-7.58(m,1H), 7.52-7.48(m,1H), 7.34-7.30(m,1H), 6.95(넓은음, 1H), 3.96-3.88(q,2H), 2.92-2.90(d,3H)

[0746]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-147		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.36-7.30(m,1H), 7.17-7.08(m,3H), 6.83(d,1H), 6.73(d,1H), 3.55(q,2H), 3.13(넓음, 3H), 2.76(넓음, 3H), 2.17(s,3H)
Ia-148		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.46-8.45(m,1H), 8.03(s,1H), 7.64-7.63(q,1H), 6.90-6.94(m,2H), 3.72-3.64(q,2H), 2.89(d,3H), 2.22(s,3H)
Ia-149		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.00(m,1H), 6.94-6.91(d,1H), 6.86-6.84(m,2H), 3.68(q,2H), 2.97(s,6H), 2.23(s,3H)
Ia-150		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.24-8.23(m,1H), 7.76(넓음, 1H), 7.66-7.63(m,1H), 7.45-7.43(m,1H), 6.90-6.87(m,2H), 6.03-5.97(m,1H), 5.32-5.28(m,1H), 5.16-5.13(m,1H), 4.02(넓음, 2H), 3.72-3.64(q,2H), 2.22(s,3H)
Ia-151		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.90(m,1H), 8.67(m,2H), 7.89-7.88(m,1H), 7.67-7.66(m,1H), 7.46-7.45(m,1H), 7.22-7.19(m,1H), 3.89-3.73(m,4H), 2.30(s,3H), 1.38-1.35(t,3H)
Ia-152		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.25-8.20(m,2H), 7.73(넓음, 1H), 7.66-7.61(m,1H), 7.48-7.46(m,1H), 6.94(넓음, 1H), 3.97-3.89(q,2H), 2.91-2.90(d,3H)
Ia-153		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.58(t,1H), 7.60(m,1H), 7.10(m,1H), 4.10-3.87(m,4H), 1.38(m,1H), 0.88(m,2H), 0.71(m,2H)
Ia-155		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.96(bs,1H), 7.48(d,1H), 7.33(bs,2H), 6.51(d,1H), 3.90-3.70(m,2H)

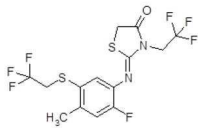
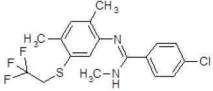
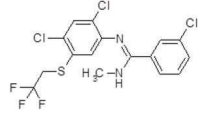
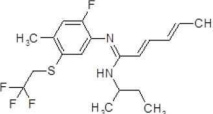
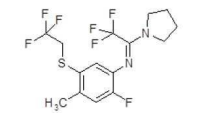
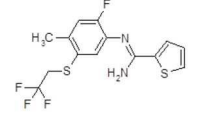
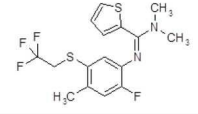
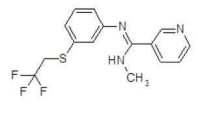
[0747]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-156		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.54(s,1H), 6.98(s,1H), 6.10(넓음, 2H), 4.10-4.02(q,2H), 2.14(m,1H), 1.84-1.15(m,10H)
Ia-158		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.21-8.18(m,1H), 7.65-7.58(m,2H), 7.43-7.41(m,1H), 6.90-6.87(m,2H), 3.73-3.66(q,2H), 2.22(s,3H), 2.92(m,1H), 0.74-0.67(m,2H), 0.60-0.56(m,2H)
Ia-159		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.84(m,1H), 8.21-8.19(m,1H), 8.02-8.00(m,1H), 7.61-7.59(m,1H), 7.29-7.26(m,2H), 3.76-3.69(q,2H), 2.84(넓음, 3H), 2.30(s,3H)
Ia-160		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.57(m,1H), 7.96-7.94(m,1H), 7.86-7.84(m,1H), 6.91-6.88(m,2H), 3.65-3.57(q,2H), 3.15(넓음, 3H), 2.80(넓음, 3H), 2.18(s,3H)
Ia-161		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.08-7.05(m,1H), 6.98(m,1H), 6.20(넓음, 2H), 3.87-3.79(q,2H), 2.33(s,3H), 2.30(m,1H), 1.84-1.52(m,8H)
Ia-162		¹ H-NMR(D6-DMSO): 6.88(d,1H), 6.70-6.69(m,1H), 6.63(d,1H), 5.91-5.89(m,2H), 3.58(q,2H), 3.39(s,3H), 3.05(넓음, 3H), 2.77(넓음, 3H), 2.21(s,3H)
Ia-163		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.05-6.99(m,2H), 6.24(넓음, 1H), 3.86-3.78(q,2H), 2.65-2.64(d,3H), 2.31(s,3H), 1.35(m,1H), 0.79-0.75(m,2H), 0.62-0.57(m,2H)

[0748]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-165		$\log P(\text{HCOOH})=1.68$, $\log P(\text{중성})=3.49$
Ia-166		$^1\text{H-NMR}(\text{D6-DMSO})$: 7.68(m,1H), 6.91(d,1H), 6.75(d,1H), 6.42-6.41(m,1H), 6.25-6.24(m,1H), 3.69(q,2H), 2.94(s,6H), 2.24(s,3H)
Ia-167		$^1\text{H-NMR}(\text{D6-DMSO})$: 8.42-8.40(m,1H), 8.29(m,1H), 7.59-7.56(m,1H), 7.30-7.27(m,1H), 6.83(s,1H) 2.04(s,3H), 6.42(s,1H), 2.13(s,3H), 3.51-3.43(q,2H), 2.92(넓은, 6H)
Ia-168		$^1\text{H-NMR}(\text{D6-DMSO})$: 8.35-8.33(m,1H), 7.76(m,1H), 7.54-7.52(m,1H), 7.25(m,1H), 7.07(m,2H), 3.74(q,2H), 3.07(d,3H), 2.27(s,3H)
Ia-169		$^1\text{H-NMR}(\text{D6-DMSO})$: 7.05-7.02(m,1H), 6.93-6.91(m,1H), 5.90(넓은, 2H), 3.85-3.77(q,2H), 2.3(s,3H), 2.16-2.10(m,1H), 1.83-1.15(m,10H)
Ia-171		$^1\text{H-NMR}(\text{D6-DMSO})$: 8.73(넓은, 1H), 7.32-7.25(넓은, 5H), 7.08-7.05(m,1H), 6.96-6.94(m,1H), 4.48(넓은, 2H) 3.78(q,2H), 2.32(s,3H)
Ia-172		$^1\text{H-NMR}(\text{D6-DMSO})$: 8.70(m,2H), 7.90-7.87(m,2H), 7.64(m,1H), 7.18(s,1H), 6.94(넓은, 2H), 4.15-4.08(q,2H)
Ia-173		$^1\text{H-NMR}(\text{D6-DMSO})$: 7.60(s,1H), 7.06(s,1H), 6.63-6.54(넓은, 2H), 4.14-4.07(q,2H), 3.67(s,2H)

[0749]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-175		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.27(d,1H), 7.21(d,1H), 4.58(q,2H), 4.24(s,2H), 3.87(q,2H), 2.39(s,3H)
Ia-176		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.31-7.29(m,2H), 7.14-7.08(m,3H), 6.89(s,1H), 6.36(s,1H), 3.41-3.33(q,2H), 2.85(넓은음, 3H), 2.18(s,3H), 2.07(s,3H)
Ia-177		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.59-7.58(m,1H), 7.43(s,1H), 7.40-7.27(m,3H), 7.08-7.06(m,1H), 6.88(s,1H), 3.90-3.82(q,2H), 2.88-2.87(d,3H)
Ia-178		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.73(m,1H), 7.03-6.93(m,3H), 6.19-5.87(m,3H), 3.80-3.71(m,3H), 2.32(s,3H), 1.80-1.78(d,3H), 1.48(m,2H), 1.03-1.02(d,3H), 0.81(t,3H)
Ia-180		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.07-7.04(m,2H), 3.80(q,2H), 3.18(넓은음, 4H), 2.33(s,3H), 1.84(넓은음, 4H)
Ia-181		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.76(m,1H), 7.65-7.64(m,1H), 7.15-7.08(m,3H), 6.68(넓은음, 2H), 3.92-3.84(q,2H), 2.35(s,3H)
Ia-182		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.59-7.56(m,1H), 6.98-6.95(m,2H), 6.87(d,1H), 6.77(d,1H), 3.63(q,2H), 2.96(s,6H), 2.20(s,3H)
Ia-183		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.46-8.45(m,1H), 8.36(s,1H), 7.57-7.55(m,1H), 7.33-7.27(m,2H), 7.01-6.97(m,1H), 6.84-6.82(m,1H), 6.64(s,1H), 6.44-6.42(m,1H), 3.79-3.71(q,2H), 2.87-2.86(d,3H)

[0750]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-184		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.48(넓음, 1H), 7.11-7.01(m, 2H), 4.90(넓음, 1H), 3.79(q, 2H), 3.50(넓음, 2H), 3.18(넓음, 2H), 2.34(s, 3H)
Ia-185		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.25-7.21(m, 1H), 6.96-6.90(m, 2H), 6.84-6.81(m, 2H), 6.60(d, 1H), 3.73(s, 3H), 3.50-3.37(m, 2H), 3.10(넓음, 3H), 2.69(넓음, 3H), 2.17(s, 3H)
Ia-186		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.06-7.02(m, 2H), 6.84-6.80(m, 3H), 6.70(d, 1H), 3.68(s, 3H), 3.54(q, 2H), 2.91(넓음, 6H), 2.17(s, 3H)
Ia-187		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.14(s, 1H), 7.00(s, 1H), 3.92(s, 2H), 3.82(q, 2H), 2.71(중첩, 1H), 2.33(s, 3H), 2.06(s, 3H), 1.00-0.90(m, 4H)
Ia-188		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.28-7.25(m, 2H), 6.32(t, 1H), 4.21-4.12(m, 4H), 3.87(q, 2H), 2.38(s, 3H)
Ia-189		¹ H-NMR(D6-DMSO) 7.09-7.01(m, 2H), 4.24(q, 2H), 3.85(q, 2H), 3.49(t, 2H), 2.33(t, 3H), 2.32(s, 3H), 1.98-1.90(m, 2H)
Ia-190		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.49(m, 1H), 8.81(m, 1H), 8.71(m, 1H), 7.13(s, 1H), 6.98(s, 1H), 6.53(넓음, 2H), 3.86(q, 2H), 2.33(s, 3H), 2.06(s, 3H)

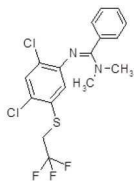
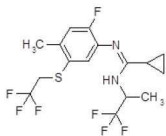
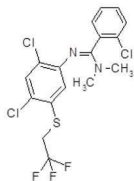
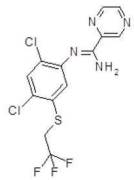
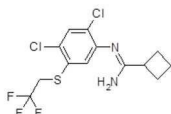
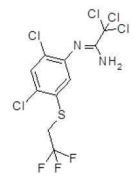
[0751]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-191		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.15(d,2H), 7.72(d,2H), 7.14(d,2H), 3.95-3.85(m,2x2H), 2.54(m,2H), 2.34(s,3H), 2.04(m,2H)
Ia-192		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.67(d,1H), 7.36(d,1H), 4.59(q,2H), 4.27(s,2H), 4.06(q,2H)
Ia-193		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.30-7.25(m,3H), 7.13-7.11(m,2H), 6.81-6.78(m,1H), 6.73-6.71(m,1H), 3.54(q,2H), 3.08(넓은, 3H), 2.75(넓은, 3H), 2.16(s,3H)
Ia-194		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.51(d,1H), 7.19(d,1H), 6.85(dd,1H), 4.57(q,2H), 4.21(s,2H), 4.12(q,2H)
Ia-195		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.27(d,1H), 7.09(d,1H), 6.79(dd,1H), 4.57(q,2H), 4.18(s,2H), 3.94(q,2H), 2.35(s,3H)
Ia-196		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.76(s,1H), 7.35(s,1H), 4.13(q,2H), 4.02(s,2H), 2.71(좁은, 1H), 1.02-0.94(m,4H)
Ia-197		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.25-7.20(m,2H), 3.98(s,2H), 3.87(q,2H), 2.74-2.60(m,1H), 2.40(s,3H), 1.00-0.87(m,4H)
Ia-198		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.30(넓은, 1H), 7.85(s,1H), 7.75(s,1H), 4.21(q,2H), 2.87(s,3H), 1.20(m,2H), 1.05(m,2H)

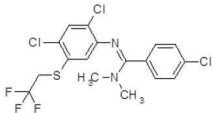
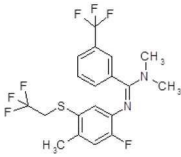
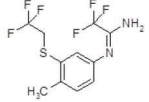
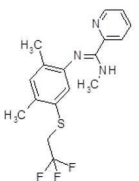
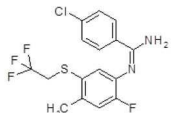
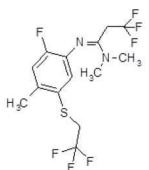
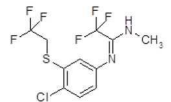
[0752]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-199		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.47-8.46(m,1H), 8.37-8.36(m,1H), 7.66-7.63(m,1H), 7.37(s,1H), 7.35-7.31(m,1H), 6.92(s,1H), 3.92(q,2H), 3.08(넓음, 3H), 2.85(넓음, 3H)
Ia-200		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.87(s,1H), 8.38(m,1H), 7.04-7.02(m,1H), 6.94(s,1H), 6.33(넓음, 1H), 3.79(q,2H), 3.63-3.58(m,2H), 3.23(t,2H), 2.31(s,3H), 1.34(m,1H), 0.76-0.72(m,2H), 0.60-0.55(m,2H)
Ia-201		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.10-7.05(m,2H), 5.14-5.06(m,1H), 3.89-3.81(q,2H), 3.51-3.49(m,2H), 2.32(s,3H), 2.30-2.28(m,2H), 1.98-1.89(m,2H), 1.38-1.36(넓음, 3H)
Ia-202		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.59(s,1H), 7.05(s,1H), 4.10(q,2H), 3.70(s,2H), 3.08(넓음, 6H)
Ia-203		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.66(d,1H) 7.55-7.41(m,4H), 6.87-6.83(m,2H), 3.56(q,2H), 2.89(d,3H), 2.19(s,3H)
Ia-204		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.42(d,1H), 7.26(넓음, 2H), 7.05(d,1H), 6.75-6.72(m,1H), 4.13(q,2H)

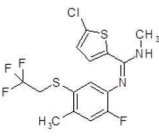
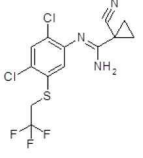
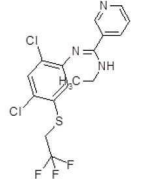
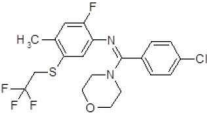
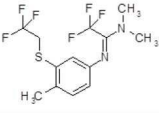
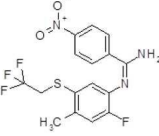
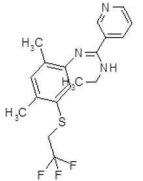
[0753]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-205		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.35(s,1H), 7.31-7.27(m,3H), 7.18-7.16(m,2H), 6.81(s,1H), 3.82(q,2H), 3.10(넓은, 3H), 2.82(d,3H)
Ia-206		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.09-7.06(m,1H), 7.01-6.99(m,1H), 6.47-6.44(m,1H), 3.85(q,2H), 2.65-2.59(m,2H), 2.33(s,3H), 1.41(m,1H), 1.27(d,3H), 0.96-0.61(m,4H)
Ia-207		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.45-6.76(m,6H), 3.86(q,2H), 3.17(넓은, 3H), 2.73(넓은, 3H)
Ia-208		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.45(s,1H), 8.84(m,1H), 8.74-8.73(m,1H), 7.66(s,1H), 7.23(s,1H), 7.03(넓은, 2H), 4.12(q,2H)
Ia-209		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.61(넓은, 1H), 7.11(넓은, 1H), 6.20(넓은, 2H), 4.10(q,2H), 3.14(m,1H), 2.32-1.78(m,6H)
Ia-210		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.65(s,1H), 7.15(넓은, 2H), 7.10(s,1H), 4.15(q,2H)

[0754]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-211		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.39-7.35(m,3H), 7.21-7.19(m,2H), 6.85(s,1H), 3.86(q,2H), 3.07(넓음, 3H), 2.79(넓음, 3H)
Ia-212		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.63(d,1H), 7.54-7.46(m,2H), 7.42(d,1H), 6.83-6.78(m,2H), 3.56(q,2H), 3.11(넓음, 3H), 2.76(넓음, 3H), 2.16(s,3H)
Ia-213		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.20(d,1H), 7.10(넓음, 2H), 6.96(d,1H), 6.69-6.67(m,1H), 3.97(q,2H), 2.31(s,3H)
Ia-214		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.56-8.55(m,1H), 7.69-7.68(m,2H), 7.38-7.22(m,3H), 6.93(s,1H), 3.48(넓음, 2H), 2.77(넓음, 3H), 2.22(s,3H), 2.06(s,3H)
Ia-215		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.99(d,2H), 7.51(d,2H), 7.14-7.09(m,2H), 6.65(넓음, 2H), 3.87(q,2H), 2.35(s,3H)
Ia-216		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.10-7.07(m,1H), 6.94-6.92(m,1H), 3.83(q,2H), 3.52(q,2H), 3.04(넓음, 6H), 2.32(s,3H)
Ia-217		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.05(넓음, 1H), 7.32(d,1H), 7.03(넓음, 1H), 6.65(넓음, 1H), 4.09(q,2H), 2.70(넓음, 3H)

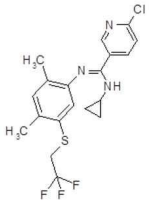
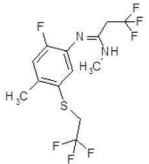
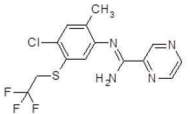
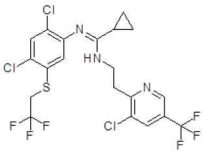
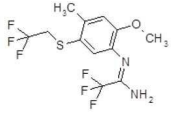
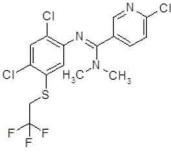
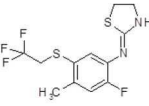
[0755]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-218		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.57(d,1H), 7.49(넓음, 1H), 7.17(d,1H), 7.05-6.99(m,2H), 3.
Ia-219		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.58(s,1H), 7.07(s,1H), 6.40(넓음, 2H), 3.93(q,2H), 1.75-1.61(m,4H)
Ia-220		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.49-8.47(m,1H), 8.39(m,1H), 7.65(t,1H), 7.59-7.57(m,1H), 7.42(s,1H), 7.37-7.29(m,1H), 6.90(s,1H), 3.90(q,2H), 3.43-3.38(m,2H), 1.23(t,3H)
Ia-221		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.36-7.34(m,2H), 7.20-7.18(m,2H), 6.87-6.84(m,1H), 6.82-6.80(m,1H), 3.66-3.58(m,8H), 3.30(넓음, 2H), 2.19(s,3H)
Ia-222		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.10(d,1H), 6.89(넓음, 1H), 6.55(d,1H), 3.93(q,2H), 2.87(넓음, 6H), 2.29(s,3H)
Ia-223		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.30(d,2H), 8.21(d,2H), 7.17-7.13(m,2H), 6.89(넓음, 2H), 3.89(q,2H), 2.37(s,3H)
Ia-224		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.43-8.42(m,1H), 8.31(m,1H), 7.52-7.50(m,1H), 7.27-7.20(m,2H), 6.89(s,1H), 6.39(s,1H), 3.45-3.33(m,4H), 2.17(s,3H), 2.07(s,3H), 1.22(t,3H)

[0756]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-225		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.07-7.04(m,1H), 6.95-6.94(m,1H), 5.95(넓은, 2H), 3.82(q,2H), 2.32(s,3H), 1.14(d,6H)
Ia-226		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.90(넓은, 1H), 7.09(d,1H), 6.89(넓은, 1H), 6.58(넓은, 1H), 4.03(q,2H) 2.76(넓은, 3H), 2.29(s,3H)
Ia-227		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.15(m,1H), 7.68-7.65(m,1H), 7.42-7.40(m,1H), 6.86(s,1H), 6.45(s,1H), 3.52(q,2H), 2.92(넓은, 6H), 2.16(s,3H), 2.04(s,3H)
Ia-228		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.05-6.95(m,2H), 6.26(넓은, 1H), 3.80(q,2H), 3.09-3.01(m,2H), 2.32(s,3H), 2.22-0.60(m,15H)
Ia-229		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.32-8.27(m,1H), 7.82(넓은, 1H), 7.65(m,1H), 7.48-7.46(m,2H), 7.02(넓은, 1H), 3.97(q,2H), 2.83(m,1H), 0.69-0.61(m,4H)
Ia-230		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.40-7.23(m,4H), 6.89-6.86(m,1H), 6.81-6.79(m,1H), 3.65-3.49(m,8H), 3.02-3.00(m,2H), 2.18(s,3H)
Ia-231		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.32-7.30(m,2H), 7.14-7.12(m,2H), 6.83(s,1H), 6.39(s,1H), 3.44(q,2H), 2.89(넓은, 6H), 2.15(s,3H), 2.04(s,3H)

[0757]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-232		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.14(m,1H), 7.55-7.53(m,1H), 7.38-7.37(m,2H), 6.91(s,1H), 6.47(s,1H), 3.50(q,2H), 2.87(m,1H), 2.19(s,3H), 2.08(s,3H), 0.71(m,2H), 0.58(m,2H)
Ia-233		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.26(넓은, 1H), 7.09-7.06(m,1H), 6.97-6.95(m,1H), 3.84(q,2H), 3.14(q,2H), 2.77(d,3H), 2.32(s,3H)
Ia-234		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.50-9.49(m,1H), 8.83-8.82(m,1H), 8.72(s,1H), 7.37(s,1H), 7.07(s,1H), 6.75(넓은, 2H), 4.03(q,2H), 2.08(s,3H)
Ia-235		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.88(s,1H), 8.39(m,1H), 7.54(s,1H), 7.05(s,1H), 6.53(넓은, 1H), 4.07(q,2H), 3.64-3.59(m,2H), 3.27(t,2H), 1.35-1.30(m,1H), 0.79-0.76(m,2H), 0.60-0.59(m,2H)
Ia-236		¹ H-NMR(D6-DMSO): 6.96-6.92(m,4H), 3.75(q,2H), 3.73(s,3H), 2.39(s,3H)
Ia-237		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.23-8.22(m,1H), 7.73-7.70(m,1H), 7.49-7.47(m,1H), 7.42(s,1H), 6.95(s,1H), 3.94(q,2H), 3.10(넓은, 3H), 2.83(넓은, 3H)
Ia-238		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.78(넓은, 1H), 7.12-7.07(m,2H), 3.83-3.75(m,2H), 3.55(넓은, 2H), 3.29(t,2H), 2.33(s,3H)

[0758]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-239		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.46-8.45(m,2H), 7.19(넓음, 1H), 7.11(m,2H), 6.90(s,1H), 6.42(넓음, 1H), 3.44(q,2H), 2.87(넓음, 3H), 2.17(s,3H), 2.07(s,3H)
Ia-240		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.28-7.22(m,3H), 7.10-7.08(m,2H), 6.81(s,1H), 6.37(s,1H), 3.36(q,2H), 2.90(넓음, 6H), 2.13(s,3H), 2.05(s,3H)
Ia-241		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.01(s,1H), 6.89(t,1H), 6.63(s,1H), 4.10-4.02(m,2H), 3.77(q,2H), 2.50(m,1H), 2.29(s,3H), 1.92(s,3H), 1.67-1.63(m,6H), 1.36-1.35(m,2H)
Ia-242		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.65(d,2H), 7.38(d,2H), 6.84(d,1H), 6.73(d,1H), 3.53(q,2H), 3.11(넓음, 3H), 2.73(넓음, 3H), 2.17(s,3H)
Ia-243		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.65(s,1H), 7.20(s,1H), 7.03-7.01(m,1H), 4.36(t,2H), 3.80(q,2H), 3.50(넓음, 2H), 2.31(s,3H)
Ia-244		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.04(s,1H), 7.95(s,1H), 6.63(s,1H), 4.32(q,2H), 1.88(s,2H), 1.41-1.34(m,1H), 0.83-0.67(m,4H)

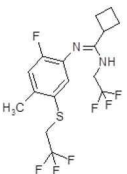
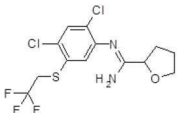
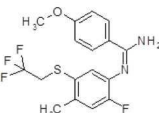
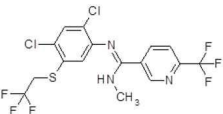
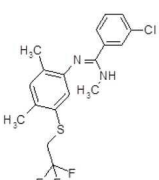
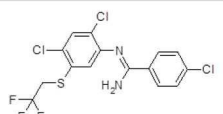
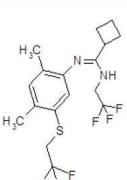
[0759]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-245		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.68-7.60(m,2H), 7.54-7.49(m,1H), 7.40(d,1H), 6.85(d,1H), 6.66(d,1H), 3.55-3.43(m,2H), 3.12(넓은, 3H), 2.63(넓은, 3H), 2.17(s,3H)
Ia-247		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.09-7.04(m,2H), 6.40-6.39(m,1H), 4.60-4.55(m,1H), 3.84(q,2H), 3.49-2.04(m,6H), 1.37-1.36(m,1H), 0.86-0.83(m,2H), 0.65-0.61(m,2H)
Ia-248		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.56-8.55(m,1H), 7.79-7.75(m,2H), 7.47(s,1H), 7.42-7.39(m,2H), 6.86(s,1H), 3.89(q,2H), 2.81(d,3H)
Ia-249		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.74-7.72(m,1H), 7.50-7.48(m,1H), 6.61(s,1H), 4.08(q,2H), 2.44(s,3H), 1.91(s,3H), 1.46-1.40(m,1H), 0.82-0.68(m,4H)
Ia-250		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.64(d,2H), 7.46(d,1H), 7.39(d,2H), 6.88(d,1H), 7.76(d,1H), 3.53(q,2H), 2.89(d,3H), 2.20(s,3H)
Ia-251		logP(HCOOH)=2.23
Ia-252		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.29-7.27(m,2H), 7.10-7.08(m,2H), 6.59(m,2H), 3.60(s,3H), 3.46(q,2H), 2.87(넓은, 6H), 2.22(s,3H)

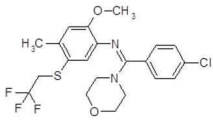
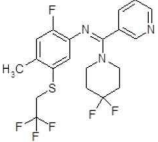
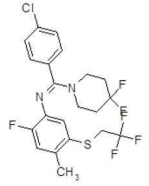
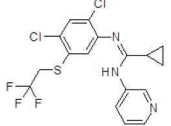
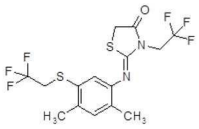
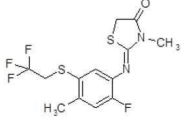
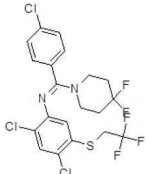
[0760]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-253		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.59(s,1H), 7.14(s,1H), 6.85(넓은, 1H), 6.20(tt,1H), 4.11(q,2H), 3.57-3.47(m,2H), 1.34(m,1H), 0.86-0.82(m,2H), 0.69-0.64(m,2H)
Ia-254		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.58(s,1H), 7.27(넓은, 1H), 6.96(s,1H), 4.14-4.02(m,4H), 2.46-2.44(m,1H), 1.67-1.63(m,6H), 1.39-1.38(m,2H)
Ia-255		¹ H-NMR(D6-DMSO): 6.87(s,1H), 6.81(s,1H), 5.98(넓은, 2H), 3.72(q,2H), 3.69(s,3H), 2.37(s,3H), 1.57-1.54(m,2H), 1.27-1.24(m,2H)
Ia-256		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.58(s,1H), 7.23(넓은, 1H), 7.04(s,1H), 6.23(tt,1H), 4.12(q,2H), 3.62-3.52(m,2H), 2.45-2.41(m,1H), 1.68-1.60(m,6H), 1.39-1.37(m,2H)
Ia-257		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.00(s,1H), 6.79(넓은, 1H), 6.68(s,1H), 6.16(tt,1H), 3.78(q,2H), 3.57(m,2H), 2.49(m,1H), 2.28(s,3H), 1.93(s,3H), 1.68-1.61(m,6H), 1.35-1.34(m,2H)
Ia-258		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.56(s,1H), 7.05(s,1H), 6.32(넓은, 2H), 4.09(q,2H), 3.98-3.96(m,2H), 3.33(s,3H)
Ia-259		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.55(s,1H), 7.34(넓은, 1H), 6.99(s,1H), 4.14-4.02(m,4H), 3.26-3.17(m,1H), 2.12-1.56(m,6H)
Ia-260		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.30-9.29(m,1H), 8.97-8.96(m,1H), 8.26-8.25(m,1H), 7.01(s,1H), 6.96(s,1H), 6.60(넓은, 2H), 3.75(q,2H), 3.73(s,3H), 2.42(s,3H)

[0761]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-261		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.22(t,1H), 7.06-7.03(m,1H), 6.90-6.88(m,1H), 4.10-4.01(m,2H), 3.82(q,2H), 3.20-3.16(m,1H), 2.32(s,3H), 2.11-2.06(m,2H), 1.79-1.59(m,4H)
Ia-262		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.56(s,1H), 7.06(s,1H), 6.26(넓은음, 2H), 4.39(m,1H), 4.09(q,2H), 3.98-3.92(m,1H), 3.77-3.75(m,1H), 2.17-2.08(m,2H), 1.92-1.86(m,2H)
Ia-263		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.94(d,2H), 7.13-7.07(m,2H), 6.97(d,2H), 6.44(넓은음, 2H), 3.86(q,2H), 3.81(s,3H), 2.35(s,3H)
Ia-264		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.59(s,1H), 7.88-7.82(m,3H), 7.48(s,1H), 6.91(s,1H), 3.87(q,2H), 2.93(d,3H)
Ia-265		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.34-7.01(m,5H), 6.89(s,1H), 6.41(s,1H), 3.39(q,2H), 2.86(넓은음, 3H), 2.18(s,3H), 2.07(s,3H)
Ia-266		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.03-7.99(m,2H), 7.62(s,1H), 7.53-7.51(m,2H), 7.15(s,1H), 6.75(넓은음, 2H), 4.13(q,2H)
Ia-267		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.02(t,1H), 6.98(s,1H), 6.63(s,1H), 4.11-4.02(m,2H), 3.78(q,2H), 3.14(m,1H), 2.28(s,3H), 2.12-2.04(m,2H), 1.91(s,3H), 1.75-1.59(m,4H)

[0762]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-268		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.30-7.28(m,2H), 7.14-7.11(m,2H), 6.64-6.62(m,2H), 3.63(m,6H), 3.59(s,3H), 3.48(q,2H), 3.34-3.29(중첩, 2H), 2.23(s,3H)
Ia-269		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.48-8.46(m,1H), 8.40-8.39(m,1H), 7.67-7.65(m,1H), 7.33-7.30(m,1H), 6.90-6.83(m,2H), 3.66(q,2H), 3.59-3.49(m,4H), 2.18(s,3H), 2.15-2.06(m,4H)
Ia-270		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.37-7.35(m,2H), 7.25-7.23(m,2H), 6.87-6.82(m,2H), 3.61(q,2H), 3.47(m,4H), 2.19(s,3H), 2.03(m,4H)
Ia-271		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.14(m,1H), 8.02(m,1H), 7.86-7.83(m,2H), 7.23-7.22(m,1H), 7.15-7.14(m,1H), 4.26-4.18(m,2H), 1.52(m,1H), 1.28(m,2H), 0.85-0.83(m,2H)
Ia-272		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.17(s,1H), 7.00(s,1H), 4.59(q,2H), 4.18(s,2H), 3.81(q,2H), 2.33(s,3H), 2.04(s,3H)
Ia-273		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.26-7.23(m,2H), 4.09(s,2H), 3.87(q,2H), 3.17(s,3H), 2.37(s,3H)
Ia-274		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.44(m,1H), 7.39-7.37(m,2H), 7.28-7.26(m,2H), 6.92(s,1H), 3.90-3.83(q,2H), 3.60(m,4H), 2.06(m,4H)

[0763]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ia-275		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.47(s,1H), 7.20(s,1H), 4.60(q,2H), 4.25(s,2H), 3.94(q,2H), 2.35(s,3H)
Ia-276		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.24-7.19(m,2H), 6.72(s,1H), 4.93(q,2H), 3.86(q,2H), 2.36(s,3H), 1.52-1.44(m,4H)
Ia-277		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.24-7.19(m,2H), 3.86(q,2H), 3.44(s,3H), 2.36(s,6H)
Ia-278		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.65-7.64(m,1H), 7.42-7.40(m,1H), 4.02-3.96(q,2H), 3.45(t,2H), 3.41(넓은음, 1H), 3.27(t,2H), 2.41(s,3H), 2.09-2.05(m,2H)
Ia-279		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.55(넓은음, 1H), 7.05(s,1H), 7.02(s,1H), 3.83-3.75(q,2H), 3.26-3.23(m,2H), 2.97-2.94(m,2H), 2.31(s,3H), 1.96-1.90(m,2H).

[0764]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-17		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.87(s,1H), 7.54(넓은음, 2H), 7.33(s,1H), 4.18-4.10(m,2H)
Ib-18		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.10(s,1H), 7.80-7.30(넓은음, 1H), 7.29(s,1H), 4.16-4.05(m,2H)
Ib-19		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.29-7.27(m,1H), 7.18-7.15(m,1H), 6.74(넓은음, 2H), 4.06-3.98(m,2H), 2.30(s,3H), 1.39-1.29(m,4H)

[0765]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-20		$^1\text{H-NMR}(\text{D}_6\text{-DMSO})$: 7.27(d,1H), 7.14(d,1H), 4.09-3.98(m,2H), 3.34-3.33(m,2H), 2.90(s,3H), 2.38-2.22(m,5H), 1.93-1.88(m,2H)
Ib-21		$\log P(\text{HCOOH})=3.32$, $\log P(\text{중성})=3.32$
Ib-22		$^1\text{H-NMR}(\text{D}_6\text{-DMSO})$: 7.27-7.24(m,1H), 7.19-7.16(m,1H), 6.57(넓은, 2H), 4.05-3.97(m,2H), 2.31(s,3H), 1.57(m,2H), 1.31-1.28(m,2H)
Ib-23		$^1\text{H-NMR}(\text{D}_6\text{-DMSO})$: 7.28(d,1H), 7.21(d,1H), 4.14-3.98(m,2H), 3.48-3.43(m,2H), 2.97(s,3H), 2.31(s,3H), 1.15(t,3H)
Ib-24		$^1\text{H-NMR}(\text{D}_6\text{-DMSO})$: 8.41(넓은, 1H), 8.04(s,1H), 7.27(s,1H), 4.25-4.02(m,2H), 2.66(넓은, 3H)
Ib-25		$^1\text{H-NMR}(\text{D}_6\text{-DMSO})$: 8.03(s,1H), 7.22(s,1H), 4.23-4.05(m,2H), 3.03(넓은, 3H) 및 DMSO 피크 하의 3H
Ib-26		$^1\text{H-NMR}(\text{D}_6\text{-DMSO})$: 7.83(s,1H), 7.25(s,1H), 4.16-4.12(m,1H), 4.27-4.21(m,1H), 3.04(s,6H)
Ib-27		$^1\text{H-NMR}(\text{D}_6\text{-DMSO})$: 7.41(m,1H), 7.23(m,1H), 6.53(넓은, 2H), 4.06-3.97(m,2H), 2.29(s,3H), 1.62-1.59(m,2H), 1.32-1.29(m,2H)
Ib-28		$^1\text{H-NMR}(\text{D}_6\text{-DMSO})$: 8.50-8.49(m,1H), 8.38(넓은, 1H), 7.66-7.60(m,2H), 7.34-7.31(m,1H), 7.16-7.14(m,1H), 6.96-6.93(m,1H), 3.97-3.88(m,1H), 3.76-3.70(m,1H), 2.91-2.90(d,3H), 2.20(s,3H)

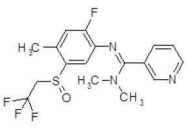
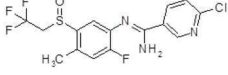
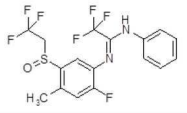
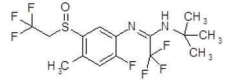
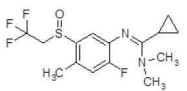
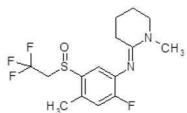
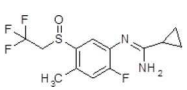
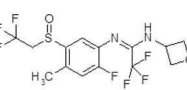
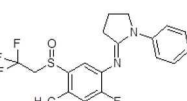
[0766]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-29		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.40(s, 1H), 7.28(d, 1H), 7.21(d, 1H), 4.15-4.06(m, 1H), 4.00-3.94(m, 1H), 3.08(s, 2H), 2.31(s, 3H), 1.09(s, 1H), 0.46-0.44(m, 2H), 0.22(s, 2H)
Ib-30		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.12(d, 2H), 7.73(d, 2H), 7.41(d, 1H), 7.26(d, 1H), 4.15-4.05(m, 2H), 3.96(t, 2H), 2.69-2.50(m, 4H), 2.34(s, 3H), 2.09-2.02(m, 2H)
Ib-31		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.50(s, 1H), 7.40(2H), 7.28(s, 1H), 4.10-4.02(q, 2H), 2.32(s, 3H)
Ib-32		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.68(d, 1H), 7.32(d, 1H), 4.28-4.10(m, 2H), 3.05(s, 6H)
Ib-33		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.33-7.31(m, 1H), 7.19-7.16(m, 1H), 6.26(tt, 1H), 4.12-3.98(m, 2H), 3.87-3.78(dt, 2H), 3.52-3.48(m, 2H), 2.35(m, 2H), 2.30(s, 3H), 1.98-1.90(m, 2H)
Ib-34		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.27(d, 1H), 7.21(d, 1H), 4.15-3.98(m, 2H), 3.45-3.40(m, 4H), 2.30(s, 3H), 1.18-1.14(m, 6H)
Ib-35		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.51(s, 1H), 7.45(2H), 7.29(s, 1H), 4.11-4.01(m, 2H), 2.32(s, 3H)
Ib-36		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.48(s, 1H), 7.30(d, 1H), 7.21(d, 1H), 4.15-3.95(m, 2H), 2.31(s, 3H), 1.33-1.24(m, 3H), 0.77(s, 2H), 0.57(s, 2H)
Ib-37		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.52(1H), 7.37-7.35(m, 2H), 7.22-7.20(m, 2H), 7.06-7.04(m, 1H), 6.97-6.95(m, 1H), 3.92-3.83(m, 1H), 3.64-3.58(m, 1H), 2.89-2.88(d, 3H), 2.20(s, 3H)

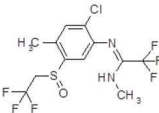
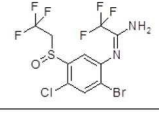
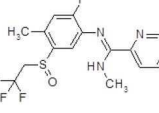
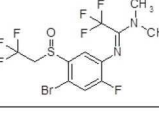
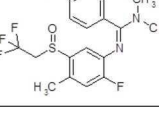
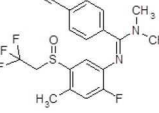
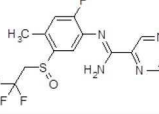
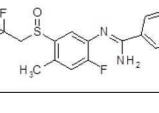
[0767]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-38		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.50(넓은, 2H), 7.34-7.32(m, 1H), 7.28-7.25(m, 1H), 4.21-4.02(m, 2H), 2.34(s, 3H)
Ib-39		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.26-7.25(m, 1H), 7.13-7.11(m, 1H), 6.45(넓은, 1H), 4.05-3.96(m, 2H), 2.29(s, 3H), 2.21-2.18(m, 1H), 1.87-1.84(m, 1H), 0.81-0.80(m, 2H), 0.66-0.54(m, 4H), 0.44(m, 2H)
Ib-40		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.34-7.32(m, 1H), 7.29-7.26(m, 1H), 7.23(넓은, 2H), 4.13-4.01(m, 2H), 2.34(s, 3H)
Ib-41		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.48(bs, 1H), 7.68(d, 1H), 7.32(d, 1H), 4.28-4.05(m, 2H), 2.72(bs, 3H)
Ib-42		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.55(넓은, 2H), 7.35-7.33(m, 1H), 7.29-7.26(m, 1H), 4.12-4.01(m, 2H), 2.34(s, 3H)
Ib-43		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.22-8.20(m, 1H), 7.44-7.41(m, 1H), 6.49(tt, 1H), 4.21-3.93(m, 2H), 2.36(s, 3H)
Ib-44		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.87(s, 1H), 7.54(넓은, 2H), 7.33(s, 1H), 4.18-4.10(m, 2H)
Ib-45		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.66-8.65(m, 1H), 8.33-8.31(m, 1H), 8.00-7.95(m, 1H), 7.60-7.57(m, 1H), 7.46-7.44(m, 1H), 7.27-7.24(m, 1H), 6.95(넓은, 2H), 4.11-4.03(q, 2H), 2.35(s, 3H)
Ib-46		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.28-7.26(m, 1H), 7.15-7.12(m, 1H), 6.30(넓은, 1H), 4.02(m, 2H), 3.19(m, 2H), 2.29(s, 3H), 1.90(m, 1H), 1.08(t, 3H), 0.85-0.81(m, 2H), 0.64-0.62(m, 2H)

[0768]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-47		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.48-8.46(m,1H), 8.32(넓음, 1H), 7.65(넓음, 1H), 7.36-7.33(m,1H), 7.07-7.05(m,1H), 6.93-6.90(m,1H), 3.92-3.83(m,1H), 3.68-3.61(m,1H), 3.13(넓음, 3H), 2.81(넓음, 3H), 2.16(s,3H)
Ib-48		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.96-8.95(m,1H), 8.38-8.35(m,1H), 7.65-7.63(m,1H), 7.43-7.41(m,1H), 7.27-7.24(m,1H), 7.00(넓음, 2H), 4.10-4.02(q,2H), 2.35(s,3H)
Ib-49		logP(HCOOH)=3.22, logP(중성)=3.12
Ib-50		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.40(s,1H), 7.25-7.19(m,2H), 4.11-4.08(m,1H), 4.00-3.97(m,1H), 2.30(s,3H), 1.42(s,9H)
Ib-51		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.24-7.22(m,1H), 7.11-7.08(m,1H), 4.11-3.92(m,2H), 3.08(s,6H), 2.30(s,3H), 1.66(m,1H), 0.68-0.63(m,2H), 0.32-0.30(m,1H), 0.23-0.21(m,1H)
Ib-52		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.20(d,1H), 7.13(d,1H), 4.09-3.97(m,2H), 3.32(s,3H), 3.28(t,2H), 2.22(s,3H), 2.20-2.05(m,2H), 1.78-1.72(m,2H), 1.62-1.56(m,2H)
Ib-53		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.15-7.12(m,1H), 6.94-6.92(m,1H), 4.06-3.88(m,2H), 2.32(s,3H), 1.55(m,1H), 0.88-0.84(m,2H), 0.74(m,2H)
Ib-54		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.97(넓음, 1H), 7.30-7.22(m,2H), 4.77(넓음, 2H), 4.59(넓음, 3H), 4.19-4.07(m,1H), 3.97(넓음, 1H), 2.32(s,3H)
Ib-55		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.86(d,2H), 7.37(m,3H), 7.22(d,1H), 7.09(dd,1H), 4.14-4.02(m,2H), 3.73(dd,2H), 2.67-2.57(m,2H), 2.33(s,3H), 2.07-1.99(m,2H)

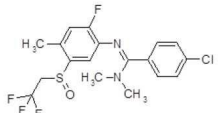
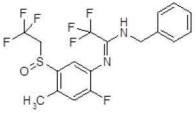
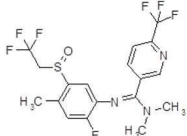
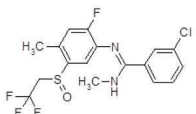
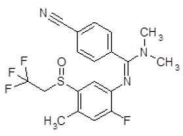
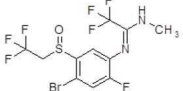
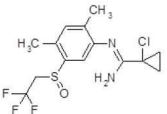
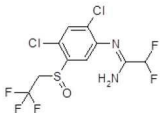
[0769]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-56		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 2.30(s,3H), 2.62(넓음, 3H), 4.17-3.95(m,2H), 7.28(넓음, 1H), 7.44(s,1H), 8.22(넓음, 1H)
Ib-57		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.32(s,1H), 7.40-7.36(넓음, 1H), 7.29(s,1H), 4.19-4.14(m,2H)
Ib-58		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.56-8.55(m,1H), 7.77-7.73(m,1H), 7.69(넓음, 1H), 7.41-7.38(m,2H), 7.10-7.08(m,1H), 7.02-6.99(m,1H), 3.97-3.91(m,1H), 3.73-3.67(m,1H), 2.84-2.83(d,3H), 2.23(s,3H)
Ib-59		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.78(d,1H), 7.32(d,1H), 4.20-4.06(m,2H), 3.05(s,3H)
Ib-60		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.29-7.12(m,4H), 6.97(d,1H), 6.93(d,1H), 3.88-3.79(m,1H), 3.62-3.50(m,1H), 3.11(넓음, 3H), 2.79-2.77(넓음, 3H), 2.17(s,3H)
Ib-61		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.81-7.79(m,2H), 7.46(넓음, 1H), 7.29(넓음, 1H), 6.98(d,1H), 6.94(d,1H), 3.88-3.79(m,1H), 3.63-3.52(m,1H), 3.14(넓음, 3H), 2.76(넓음, 3H), 2.16(s,3H)
Ib-62		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 9.46-9.45(m,1H), 8.84(m,1H), 8.74-8.73(m,1H), 7.48-7.46(m,1H), 7.29-7.26(m,1H), 7.12(넓음, 2H), 4.12-4.04(m,2H), 2.36(s,3H)
Ib-63		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 9.13(s,1H), 8.70-8.69(m,1H), 8.32-8.30(m,1H), 7.52-7.49(m,1H), 7.43-7.41(m,1H), 7.26-7.23(m,1H), 6.94(넓음, 2H), 4.11-4.03(m,2H), 2.35(s,3H)

[0770]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-64		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.84(m,1H), 7.35(m,1H), 6.85(넓은, 2H), 4.16-4.08(m,2H), 1.65(m,2H), 1.37(m,2H)
Ib-65		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.34(m,1H), 9.01-9.00(m,1H), 8.28-8.27(m,1H), 7.47-7.45(m,1H), 7.29-7.25(m,1H), 7.16(넓은, 2H), 4.12-4.01(m,2H), 2.36(s,3H)
Ib-66		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.38-7.33(m,1H), 7.15-7.10(m,1H), 7.03(넓은, 2H), 6.98-6.92(m,2H), 3.89-3.82(m,1H), 3.61-3.55(m,1H), 3.12(넓은, 3H), 2.83(넓은, 3H), 2.17(s,3H)
Ib-67		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.56-7.54(m,1H), 7.36-7.30(m,1H), 7.19-6.95(m,5H), 3.94-3.85(m,1H), 3.70-3.64(m,1H), 2.89-2.88(m,3H), 2.21(s,3H)
Ib-68		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.99(s,1H), 7.63(넓은, 2H), 7.32(s,1H), 4.18-4.06(m,2H)
Ib-69		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.35(m,1H), 9.03-9.02(m,1H), 8.32-8.28(m,1H), 7.87(s,1H), 7.41(s,1H), 7.08(넓은, 2H), 4.19-4.11(m,2H)
Ib-71		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.51(d,1H), 7.38(d,1H), 4.62-4.57(m,2H), 4.26-4.14(m,3H), 4.04-3.94(m,1H), 2.36(s,3H)
Ib-72		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.29-7.27(m,1H), 7.21-7.18(m,1H), 6.42(넓은, 2H), 4.07-3.99(m,2H), 2.32(s,3H), 1.68-1.59(m,4H)

[0771]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-73		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.3-6.93(m,6H), 3.88-3.79(m,1H), 3.58-3.47(m,1H), 3.10(넓음, 3H), 2.78(넓음, 3H), 2.17(s,3H)
Ib-74		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.87(넓음, 1H), 7.33-7.16(m,7H), 4.47(넓음, 2H), 4.12-4.06(m,1H), 3.90(넓음, 1H), 2.30(s,3H)
Ib-75		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.49(m,1H), 8.09(m,1H), 7.90-7.88(m,1H), 7.03-6.96(m,2H), 3.90-3.84(m,1H), 3.56-3.50(m,1H), 3.17(넓음, 3H), 2.80(넓음, 3H), 2.17(s,3H)
Ib-76		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.57-7.56(q,1H), 7.40-7.38(m,1H), 7.31-7.27(m, 2H), 7.13-7.08(m,2H), 6.98-6.95(m,1H), 3.92-3.83(m,1H), 3.70-3.63(m,1H), 2.89-2.87(d,3H), 2.21(s,3H)
Ib-77		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.81-7.79(m,2H), 7.46(넓음, 1H), 7.29(넓음, 1H), 6.98(d,1H), 6.94(d,1H), 3.88-3.79(m,1H), 3.63-3.52(m,1H), 3.14(넓음, 3H), 2.75(넓음, 3H), 2.16(2.3H)
Ib-78		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.49(넓음, 1H), 7.78(d,1H), 7.33(d,1H), 4.24-4.02(m,2H), 2.73(넓음, 3H)
Ib-79		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.11(s,1H), 7.08(s,1H), 6.19(넓음, 2H), 4.00-3.92(m,2H), 2.27(s,3H), 2.00(s,3H), 1.58(m,2H), 1.30-1.29(m,2H)
Ib-80		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.8(s,1H), 7.30(s,1H), 7.15(넓음, 2H), 6.40(t,1H), 4.18-4.10(m,2H)

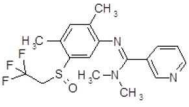
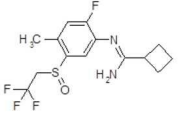
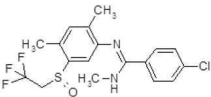
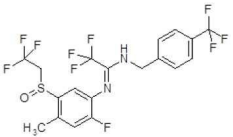
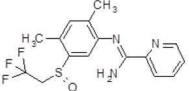
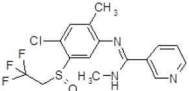
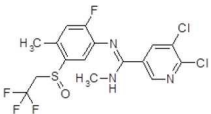
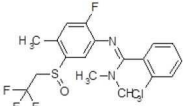
[0772]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-81		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.61-7.60(m,1H), 7.04-6.97(m,4H), 3.92-3.86(m,1H), 3.65-3.52(m,1H), 3.02(s,6H), 2.20(s,3H)
Ib-82		¹ H-NMR(D6-DMSO): 6.96-6.91(m,2H), 6.70(넓음, 1H), 5.90(넓음, 2H), 3.83-3.74(m,2H), 3.18(s,6H), 2.21(넓음, 6H)
Ib-83		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.78(s,1H), 7.26(m,1H), 7.01(넓음, 1H), 4.22-4.01(m,4H), 1.40-1.38(m,1H), 0.96-0.86(m,2H), 0.78-0.71(m,2H)
Ib-84		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.50-8.48(m,1H), 8.38(m,1H), 7.65-7.59(m,2H), 7.33-7.30(m,1H), 7.15-7.13(m,1H), 6.95-6.92(m,1H), 3.97-3.88(m,1H), 3.79-3.70(m,1H), 3.44-3.37(m,2H), 2.20(s,3H), 1.22(t,3H)
Ib-85		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.52-7.51(m,1H), 7.3(넓음, 2H), 7.18(s,1H), 4.16-4.02(m,2H), 2.10(s,3H)
Ib-86		logP(HCOOH)=3.04, logP(중성)=3.05
Ib-87		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.35-6.92(m,6H), 3.85-3.79(m,1H), 3.58-3.51(m,1H), 3.16(넓음, 3H), 2.79(넓음, 3H), 2.16(s,3H)
Ib-88		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.22(m,1H), 7.80(m,1H), 7.66(m,1H), 7.48-7.46(m,1H), 7.20-7.21(m,1H), 7.01-6.98(m,1H), 4.05-3.93(m,1H), 3.80(m,1H), 2.93(m,1H), 2.22(s,3H), 0.73(m,2H), 0.59(m,2H)

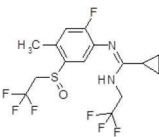
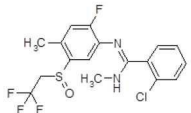
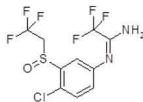
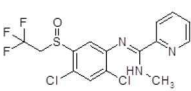
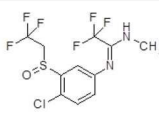
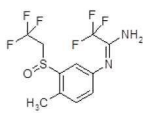
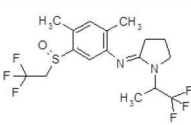
[0773]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-89		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.28-8.27(m,1H), 7.90(넓음, 1H), 7.67-7.64(m,2H), 7.50-7.48(m,1H), 7.03(s,1H), 4.17-4.05(m,1H), 3.89-3.80(m,1H), 2.92-2.91(d,3H)
Ib-90		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.09(넓음, 1H), 7.44(s,1H), 7.12(넓음, 1H), 4.18-4.05(m,2H), 2.68-2.63(넓음, 3H), 2.11(s,3H)
Ib-91		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.01(넓음, 1H), 7.38(d,1H), 7.24(d,1H), 4.58-4.57(m,2H), 4.35(넓음, 3H), 4.16-4.09(m,1H), 3.93(넓음, 1H), 2.32(s,3H)
Ib-92		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.60(s,1H), 7.84-7.81(m,3H), 7.13-7.11(m,1H), 7.02-6.99(m,1H), 3.97-3.88(m,1H), 3.67-3.61(m,1H), 2.94-2.93(d,3H), 2.21(s,3H)
Ib-93		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.46-8.45(m,1H), 8.32(넓음, 1H), 7.58-7.56(m,1H), 7.37-7.29(m,2H), 6.99(s,1H), 6.66(s,1H), 3.74-3.68(m,2H), 2.91-2.90(d,3H), 2.17(s,3H), 2.15(s,3H)
Ib-94		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.98-8.97(m,1H), 8.40-8.37(m,1H), 7.71-7.68(m,1H), 7.40-7.38(m,1H), 7.26-7.24(m,1H), 4.06-3.96(m,2H), 2.33(s,3H), 2.16(s,3H)
Ib-95		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.53-8.51(m,1H), 8.41(m,1H), 7.85(q,1H), 7.63(s,1H), 7.62-7.59(m,1H), 7.36-7.33(m,1H), 7.00(s,1H), 4.12-4.00(m,1H), 3.86-3.75(m,1H), 2.93-2.92(d,3H)
Ib-96		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.29(d,1H), 7.21(d,1H), 4.15-3.99(m,2H), 3.41(넓음, 4H), 2.31(s,3H), 1.86(넓음, 4H)
Ib-97		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.52-8.50(m,1H), 7.65-7.64(q,1H), 7.19-7.12(m,3H), 6.97-6.95(m,1H), 3.96-3.87(m,1H), 3.74-3.68(m,1H), 2.90-2.89(d,3H), 2.20(s,3H)

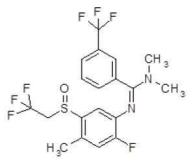
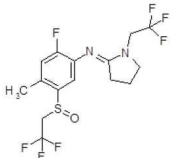
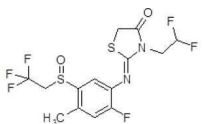
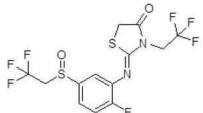
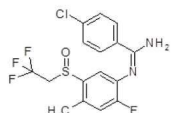
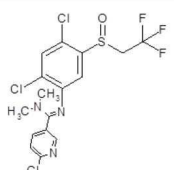
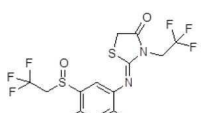
[0774]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-98		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.44-8.43(m, 1H), 8.32-8.29(m, 1H), 7.60(m, 1H), 7.35-7.31(m, 1H), 6.94(s, 1H), 6.66(s, 1H), 3.70-3.64(m, 1H), 3.30-3.24(m, 1H), 2.96(넓은, 6H), 2.14(s, 3H), 2.13(s, 3H)
Ib-99		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.30-7.25(m, 1H), 7.09(m, 1H), 6.65(넓은, 2H), 4.07-4.02(m, 2H), 2.97-2.93(m, 1H), 2.33(s, 3H), 2.22-1.71(m, 6H)
Ib-100		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.35-7.15(m, 4H), 6.98-6.96(m, 2H), 6.61(s, 1H), 3.69-3.63(m, 1H), 3.22-3.17(m, 1H), 2.88(넓은, 3H), 2.17(s, 3H), 2.16(s, 3H)
Ib-101		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.98(넓은, 1H), 7.72-7.70(m, 2H), 7.52-7.51(넓은, 1H), 7.21-7.19(m, 3H), 4.56(넓은, 2H), 4.13-4.06(m, 1H), 3.93-3.90(m, 1H), 2.28(s, 3H)
Ib-102		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.66-8.64(m, 1H), 8.37-8.32(m, 1H), 7.99-7.95(m, 1H), 7.59-7.56(m, 1H), 7.27(s, 1H), 7.19(s, 1H), 6.60(넓은, 2H), 4.05-3.97(m, 2H), 2.31(s, 3H), 2.13(s, 3H)
Ib-103		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.50-8.49(m, 1H), 8.36(s, 1H), 7.58-7.57(m, 2H), 7.34-7.30(m, 2H), 6.68(넓은, 1H), 3.91-3.82(m, 1H), 3.59-3.53(m, 1H), 2.92-2.91(d, 3H), 2.20(s, 3H)
Ib-104		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.16-8.14(m, 2H), 7.78-7.77(넓은, 1H), 7.23-7.21(m, 1H), 7.03-7.00(m, 1H), 4.02-3.93(m, 1H), 3.84-3.77(m, 1H), 2.91-2.90(d, 3H), 2.23(s, 3H)
Ib-105		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.46-6.94(m, 6H), 3.85-3.74(m, 1H), 3.54-3.48(m, 1H), 3.17(넓은, 3H), 2.74(넓은, 3H), 2.15(s, 3H)

[0775]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-106		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.29-7.27(m,1H), 7.20-7.17(m,1H), 6.84(넓음, 1H), 4.11-3.64(m,4H), 2.30(s,3H), 1.44-1.41(m,1H), 0.91-0.84(m,2H), 0.72-0.69(m,2H)
Ib-107		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.52-6.95(m,7H), 3.82-3.72(m,2H), 2.91-2.90(d,3H), 2.18(s,3H)
Ib-108		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.57(d,1H), 7.42(넓음, 2H), 7.30(d,1H), 7.10-7.07(m,1H), 4.22-4.04(m,2H)
Ib-109		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.57-8.55(m,1H), 7.91(넓음, 1H), 7.82-7.77(m,1H), 7.66(s,1H), 7.44-7.41(m,2H), 6.96(s,1H), 4.10-4.01(m,1H), 3.87-3.78(m,1H), 2.84-2.83(d,3H)
Ib-110		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.14(넓음, 1H), 7.48(d,1H), 7.22(d,1H), 7.03-7.00(m,1H), 4.25-4.01(m,2H), 3.67(넓음, 3H)
Ib-111		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.31-7.29(m,2H), 7.25(넓음, 2H), 6.98-6.95(m,1H), 4.09-4.00(m,2H), 2.33(s,3H)
Ib-112		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.09(m,2H), 5.17-5.13(m,1H), 4.03-3.93(m,2H), 3.51-3.45(m,1H), 3.32-3.30(m,1H), 2.43-2.07(m,2H), 2.27(s,3H), 2.06(s,3H), 1.95-1.88(m,2H), 1.40-1.38(d,3H)
Ib-113		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.70-7.61(m,2H), 7.57(s,1H), 7.53-7.44(m,2H), 7.12(d,1H), 7.65(d,1H), 3.87-3.77(m,1H), 3.66-3.54(m,1H), 2.90(d,3H), 2.19(s,3H)

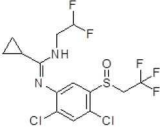
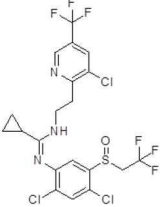
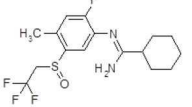
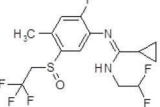
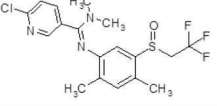
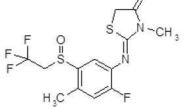
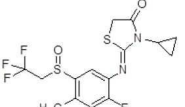
[0776]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-114		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.65(d,2H), 7.54(t,1H), 7.39(넓음, 1H), 7.04(넓음, 1H), 6.92(d,1H), 3.83-3.70(m,2H), 3.14(넓음, 3H), 3.28(넓음, 3H), 2.16(s,3H)
Ib-115		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.31-7.29(m,1H), 7.20-7.17(m,1H), 4.27(q,2H), 4.12-4.00(m,2H), 3.52(t,2H), 2.47-2.25(m,2H), 2.31(s,3H), 2.00-1.92(m,2H)
Ib-116		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.57(d,1H), 7.37(d,1H), 6.33(tt,1H), 4.25-4.13(m,5H), 4.01-3.89(m,2H), 2.36(s,3H)
Ib-117		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.62-7.56(m,2H), 7.50-7.48(m,1H), 4.60(q,2H), 4.27-4.00(m,4H)
Ib-118		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.00(d,2H), 7.53(d,2H), 7.39(d,1H), 7.23(d,1H), 6.80(넓음, 2H), 4.06(q,2H), 2.34(s,3H)
Ib-119		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.23(넓음, 1H), 7.73-7.72(넓음, 1H), 7.62(s,1H), 7.52-7.50(m,1H), 6.97(s,1H), 4.14-4.02(m,1H), 3.82-3.70(m,1H), 3.00(넓음, 6H)
Ib-120		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.86(d,1H), 7.53(d,1H), 4.60(q,2H), 4.36-4.24(m,3H), 4.17-4.06(m,1H)

[0777]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-121		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.81(d,1H), 7.56(dd,1H), 7.47(d,1H), 4.61(q,2H), 4.31-4.07(m,4H)
Ib-122		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.96(s,1H), 7.51(s,1H), 4.36-4.24(m,1H), 4.14-4.00(m,3H), 2.75-2.70(m,1H), 1.02-0.92(m,4H)
Ib-123		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.50-8.49(m,1H), 8.36(m,1H), 7.67-7.64(m,1H), 7.60(s,1H), 7.39-7.36(m,1H), 6.96(s,1H), 4.05-3.96(m,1H), 3.78-3.66(m,1H), 3.05(넓은음, 6H)
Ib-124		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.69(넓은음, 2H), 7.54(넓은음, 1H), 7.27(넓은음, 1H), 6.97-6.14(m,2H), 3.84-3.70(m,1H), 3.43-3.30(m,1H), 3.15(넓은음, 3H), 2.77(넓은음, 3H), 2.16(s,3H)
Ib-125		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.02(넓은음, 1H), 7.22-7.17(m,2H), 6.89(넓은음, 1H), 4.12-4.06(m,1H), 3.92(넓은음, 1H), 2.76(넓은음, 3H), 2.30(s,3H)
Ib-126		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.27(m,3H), 7.12(넓은음, 2H), 6.92(s,1H), 6.62(s,1H), 3.50(m,2H), 2.93(넓은음, 6H), 2.16(s,3H), 2.13(s,3H)
Ib-127		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.57(s,1H), 7.34-7.30(m,3H), 7.16(m,2H), 6.86(s,1H), 3.97-3.85(m,1H), 3.61-3.49(m,1H), 3.05(넓은음, 6H)
Ib-128		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.86(s,1H), 7.44(d,1H), 7.13(d,1H), 4.10-3.98(m,2H), 3.05(bs,3H), 2.95(bs,3H), 2.30(s,3H)

[0778]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-129		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.78(s,1H), 7.34(s,1H), 6.95(넓음, 1H), 6.21(tt,1H), 4.22-4.07(m,2H), 3.59-3.52(m,2H), 1.37(m,1H), 0.90-0.87(m,2H), 0.73-0.71(m,2H)
Ib-130		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.88(s,1H), 8.39(m,1H), 7.73(s,1H), 7.27(s,1H), 6.66(m,1H), 4.21-4.05(m,2H), 3.68-3.59(m,2H), 2.50(m,2H), 1.34(m,1H), 0.82-0.81(m,2H), 0.68-0.66(m,2H)
Ib-131		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.73-7.72(m,1H), 7.45(m,1H), 4.19-3.97(m,2H), 2.40(s,3H), 1.93-1.19(m,10H)
Ib-132		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.35-7.33(m,1H), 7.19-7.16(m,1H), 6.75(넓음, 1H), 6.15(tt,1H), 4.11-3.96(m,2H), 3.60-3.50(m,2H), 2.31(s,3H), 1.40(넓음, 1H), 0.90-0.82(m,2H), 0.73-0.67(m,2H)
Ib-133		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.15(넓음, 1H), 7.70(넓음, 1H), 7.48-7.46(m,1H), 6.96(s,1H), 6.63(s,1H), 3.77-3.71(m,1H), 3.35-3.26(m,1H), 2.96(넓음, 6H), 2.15(s,3H), 2.13(s,3H)
Ib-134		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.53(d,1H), 7.36(d,1H), 4.22-4.10(m,3H), 4.04-3.92(m,1H), 3.19(s,3H), 2.35(s,3H)
Ib-135		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.50(d,1H), 7.35(d,1H), 4.28-4.12(m,1H), 4.02-3.91(m,3H), 2.75-2.55(m,1H), 2.35(s,3H), 1.01-0.88(m,4H) - 주요 이성질체의 피크-

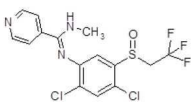
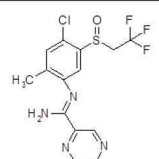
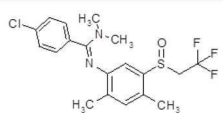
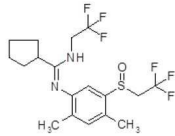
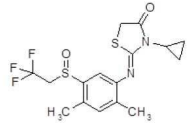
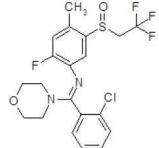
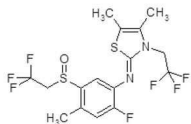
[0779]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-136		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.15(넓은, 1H), 7.60-7.44(m,3H), 7.01(s,1H), 6.70(s,1H), 3.79(m,2H), 2.90(m,1H), 2.19(s,3H), 2.16(s,3H), 0.72(m,2H), 0.58(m,2H)
Ib-137		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.90-7.86(m,1H), 7.65-7.63(m,1H), 6.66(s,1H), 4.30-4.16(m,2H), 1.95(d,2H), 1.41(m,1H), 0.81-0.70(m,4H)
Ib-138		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.90(s,1H), 7.41(s,1H), 6.41(넓은, 2H), 4.10-3.97(m,2H), 2.04(s,3H), 1.64-1.58(m,2H), 1.32-1.29(m,2H)
Ib-139		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.44(d,1H), 7.37(d,1H), 7.08(dd,1H), 4.58(q,2H), 4.23-4.11(m,3H), 4.00-3.88(m,1H), 2.35(s,3H)
Ib-140		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.77(넓은, 1H), 7.64(s,1H), 7.43-7.41(m,1H), 7.34-7.30(m,2H), 7.09-7.07(m,1H), 6.97(s,1H), 4.08-3.96(m,1H), 3.81-3.70(m,1H), 2.90(d,3H)
Ib-141		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.34(s,1H), 7.26(s,1H), 4.61(q,2H), 4.20(s,2H), 4.19-4.07(m,1H), 3.91-3.79(m,1H), 2.31(s,3H), 2.14(s,3H)
Ib-142		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.13(t,1H), 7.07(s,1H), 6.92(s,1H), 4.15-3.88(m,4H), 3.16-3.12(m,1H), 2.26(s,3H), 2.17-2.05(m,2H), 2.00(s,3H), 1.80-1.60(m,4H)
Ib-143		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.40-7.38(m,2H), 7.29(넓은, 2H), 7.10-7.08(m,1H), 6.98-6.95(m,1H), 3.94-3.82(m,1H), 3.61-3.48(m,1H), 3.31(넓은, 4H), 2.18(s,3H), 2.06(넓은, 4H)

[0780]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-144		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.62(넓음, 1H), 7.99(넓음, 1H), 7.91-7.87(m,2H), 7.67(s,1H), 6.98(s,1H), 4.15-4.03(m,1H), 3.79-3.68(m,1H), 2.96-2.95(d,3H)
Ib-145		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.68(d,2H), 7.63(d,1H), 7.42(d,2H), 7.02-7.96(m,2H), 3.90-3.79(m,1H), 3.52-3.40(m,1H), 2.91(d,3H), 2.20(s,3H)
Ib-146		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.66(d,1H), 7.45(d,1H), 7.21(dd,1H), 4.59(q,2H), 4.30-4.21(m,3H), 4.14-4.04(m,1H)
Ib-147		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.47-7.20(m,4H), 6.94(s,1H), 6.80-6.76(m,1H), 3.64-3.51(m,1H), 3.19(넓음, 3H), 3.06-2.97(m,1H), 2.74(넓음, 3H), 2.21(d,3H), 2.13(s,3H)
Ib-148		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.70-7.43(m,5H), 7.00-6.95(m,2H), 3.90-3.70(m,1H), 3.47-3.24(m,1H), 2.89(d,3H), 2.16(s,3H)
Ib-149		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.73-7.72(넓음, 1H), 7.63(s,1H), 7.40-7.38(m,2H), 7.22-7.20(m,2H), 6.89(s,1H), 4.05-3.96(m,1H), 3.73-3.66(m,1H), 2.91-2.90(d,3H)
Ib-150		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.52-8.51(m,1H), 8.40(m,1H), 7.85(t,1H), 7.63(s,1H), 7.61-7.58(m,1H), 7.35-7.32(m,1H), 6.97(s,1H), 4.11-4.00(m,1H), 3.83-3.76(m,1H), 3.43(m,2H), 1.25(t,3H)
Ib-151		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.33(넓음, 1H), 7.98(넓음, 1H), 7.72(넓음, 1H), 7.66(s,1H), 7.50-7.48(m,1H), 7.13(넓음, 1H), 4.16-4.07(m,1H), 3.96-3.88(m,1H), 2.77(넓음, 1H), 0.66-0.62(m,4H)

[0781]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-152		¹ H-NMR(D6-DMSO): 8.55-8.53(m,2H), 7.85-7.84(m,1H), 7.64(s,1H), 7.19-7.18(m,2H), 6.97(s,1H), 4.09-4.00(m,1H), 3.83-3.74(m,1H), 2.92-2.90(d,3H)
Ib-153		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.50(s,1H), 8.84-8.83(m,1H), 8.74-8.73(m,1H), 7.51(s,1H), 7.30(s,1H), 6.95(넓은, 2H), 4.16-4.02(m,2H), 2.18(s,3H)
Ib-154		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.36-7.34(m,2H), 7.15(넓은, 2H), 6.93(s,1H), 6.60(s,1H), 3.67-3.60(m,1H), 3.21-3.14(m,1H), 2.94(넓은, 6H), 2.14(s,6H)
Ib-155		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.09(s,1H), 6.99(t,1H), 6.93(s,1H), 4.13-3.84(m,4H), 2.49(m,1H), 2.26(s,3H), 2.00(s,3H), 1.68-1.67(넓은, 6H), 1.38-1.37(넓은, 2H)
Ib-156		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.32(s,1H), 7.24(s,1H), 4.14-4.05(m,1H), 3.94(s,2H), 3.91-3.82(m,1H), 2.73(좁은, 1H), 2.31(s,3H), 2.15(s,3H), 1.02-0.90(m,4H)
Ib-157		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.45-6.96(m,6H), 3.86-3.47(m,8H), 3.03(m,2H), 2.16(s,3H)
Ib-158		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.54(d,1H), 7.27(d,1H), 4.82(q,2H), 4.17-4.07(m,1H), 4.02-3.93(m,1H), 2.32(s,3H), 2.12(s, 3H), 2.05(s,3H)

[0782]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-159		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.34(s,1H), 7.24(s,1H), 4.14-4.05(m,3H), 3.87-3.81(m,1H), 3.20(s,3H), 2.31(s,3H), 2.15(s,3H)
Ib-160		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.10-7.09(m,2H), 6.25-6.23(m,1H), 5.10-5.00(m,1H), 4.03-3.87(m,2H), 2.26(s,3H), 2.05(s,3H), 1.36-1.33(m,1H), 1.29-1.28(d,3H), 1.01-0.96(m,1H), 0.82-0.76(m,1H), 0.68-0.61(m,2H)
Ib-161		$\log\text{P(HCOOH)}=1.28$, $\log\text{P(중성)}=2.95$
Ib-162		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.91-7.89(m,2H), 7.72-7.70(m,1H), 7.57-7.53(m,1H), 6.94-6.84(m,2H), 3.84-3.72(m,1H), 3.69(s,3H), 3.44-3.32(m,1H), 2.95(넓은, 6H), 2.17(s,3H)
Ib-163		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.87(m,1H), 8.38(m,1H), 7.28-7.26(m,1H), 7.14-7.12(m,1H), 6.45(m,1H), 4.10-3.93(m,2H), 3.63-3.60(m,2H), 3.25(t,2H), 2.29(s,3H), 1.36(m,1H), 0.78-0.75(m,2H), 0.63-0.61(m,2H)
Ib-165		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 8.30(s,1H), 7.89-7.88(m,1H), 6.69(s,1H), 4.43-4.29(m,2H), 1.94-1.91(d,2H), 1.39(m,1H), 0.81-0.74(m,4H)
Ib-166		$^1\text{H-NMR(D6-DMSO)}$: 7.35(넓은, 1H), 7.17-7.13(m,2H), 4.12-3.98(m,4H), 3.21-3.16(m,1H), 2.30(s,3H), 2.16-2.09(m,2H), 1.84-1.61(m,4H)

[0783]

실시예 번호	구조	분석 데이터
Ib-167		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.74(s,1H), 7.50(넓음, 1H), 7.12(s,1H), 4.24-4.07(m,4H), 3.23-3.14(m,1H), 2.18-1.59(m,6H)
Ib-168		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.51(d,1H), 7.38(d,1H), 4.62-4.57(m,2H), 4.26-4.14(m,3H), 4.04-3.94(m,1H), 2.36(s,3H)
Ib-169		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.31-7.29(m,1H), 7.20-7.17(m,1H), 5.14-5.10(m,1H), 4.12-4.01(m,2H), 3.55-3.49(m,2H), 2.47-2.28(m,2H), 2.30(s,3H), 1.96-1.92(m,2H), 1.39-1.38(d,3H)
Ib-170		¹ H-NMR(D6-DMSO): 9.51(d,1H), 8.83-8.82(d,1H), 8.73(s,1H), 7.30(s,1H), 7.21(s,1H), 6.75(넓음, 2H), 4.06-3.97(m,2H), 2.32(s,3H), 2.15(s,3H)
Ib-171		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.51(d,1H), 7.38(d,1H), 4.62-4.57(m,2H), 4.26-4.14(m,3H), 4.04-3.94(m,1H), 2.36(s,3H)
Ib-172		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.55(d,1H), 7.31(d,1H), 6.76(s,1H), 4.96(q,2H), 4.18-3.95(m,2H), 2.33(s,3H), 1.52-1.45(m,4H)
Ib-173		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.37(s,1H), 7.22(s,1H), 4.12-4.06(m,1H), 3.89-3.82(m,2H), 3.47(s,3H), 2.37(s,3H), 2.29(s,3H), 2.20(s,3H)
Ib-174		¹ H-NMR(D6-DMSO): 7.55(d,1H), 7.53(d,1H), 4.19-4.13(m,1H), 4.00-3.93(m,1H), 3.45(s,3H), 2.38(s,3H), 2.33(s,3H)

[0784]

[0785]

예리한 신호의 강도는 NMR 스펙트럼의 인쇄된 예에서의 신호의 높이 (cm)와 상관관계가 있으며, 신호 강도의 진성 비를 나타낸다. 넓은 신호의 경우에, 여러 피크, 또는 신호 및 그의 상대 강도의 중간이 스펙트럼에서 가장 강한 신호와 비교하여 제시될 수 있다.

[0786]

¹H NMR 피크의 목록은 통상의 ¹H NMR 출력물과 유사하며, 따라서 일반적으로 통상의 NMR 해석에서 열거된 모든 피크를 함유한다.

[0787]

또한, 통상의 ¹H NMR 출력물과 같이, 이들은 용매 신호, 마찬가지로 본 발명의 대상의 부분을 형성하는 표적 화합물의 입체이성질체의 신호 및/또는 불순물의 피크를 제시할 수 있다.

[0788]

용매 및/또는 물의 델타 범위 내 화합물 신호의 보고에서, 본 발명의 ¹H NMR의 목록은 통상의 용매 피크, 예를 들어 DMSO-d₆ 중 DMSO의 피크 및 물의 피크를 제시하며, 이는 일반적으로 평균적으로 높은 강도를 갖는다.

[0789]

표적 화합물의 입체이성질체의 피크 및/또는 불순물의 피크는 일반적으로 표적 화합물 (예를 들어 > 90% 순도를 가짐)의 피크보다 평균적으로 더 낮은 강도를 갖는다.

[0790]

이러한 입체이성질체 및/또는 불순물은 특정한 제조 방법에서 통상적일 수 있다. 따라서, 그의 피크는 이 경우에 "부산물-지문"을 참조하여 본 발명의 제조 방법의 재현을 확인하는데 도움이 될 수 있다.

[0791]

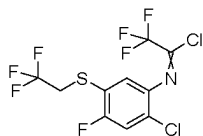
공지 방법 (Mestrec, ACD-시뮬레이션, 그러나 또한 실험으로 평가된 예상치 포함)으로 표적 화합물의 피크를 계산하는 전문가라면 필요한 경우에 임의로 추가의 강도 필터를 사용하여 표적 화합물의 피크를 단리시킬 수

있다. 이 단리는 통상의 ^1H NMR 해석으로 선택한 관련 피크와 유사할 것이다.

[0792] 쿼마 이후 두자리수로 어림한 δ -값의 결과로서, 동일한 δ -값을 갖는 신호가 존재하는 경우에, 첨가 후 이들의 강도는 이 δ -값 영역에서 또한 전통적 NMR의 출력물에서 관찰된 동일한 이미지를 제공한다.

[0793] 상기 기재된 제조 방법은 화학식 II의 화합물, 예를 들어 화학식 II의 하기 화합물을 수득하는데 사용될 수 있다:

[0794] N-{2-클로로-4-플루오로-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로에탄이미도일 클로라이드 (II-4)

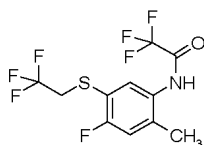


[0795]

[0796] GC-MS: EI 질량 (m/z): 373 (2Cl) $[\text{M}]^+$

[0797] 상기 기재된 제조 방법은 화학식 III의 화합물, 예를 들어 하기 화학식 III의 화합물을 수득하는데 사용될 수 있다:

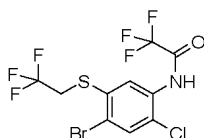
[0798] 2,2,2-트리플루오로-N-{4-플루오로-2-메틸-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}아세트아미드 (III-4)



$\log\text{P}(\text{HCOOH})$: 3.16; $\log\text{P}$ (중성): 3.1; ^1H -NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.05(s,1H), 7.59(d,1H), 7.31(d,1H), 3.96(q,2H), 2.17(s,3H)

[0799]

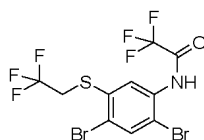
[0800] N-{4-브로모-2-클로로-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로아세트아미드 (III-5)



$\log\text{P}(\text{HCOOH})$: 3.78; ^1H -NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 4.17-4.24(m,2H), 7.79(s,1H), 8.01(s,1H), 11.45(s,1H)

[0801]

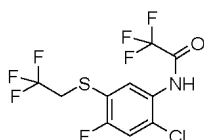
[0802] N-{2,4-디브로모-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로아세트아미드 (III-6)



$\log\text{P}(\text{HCOOH})$: 3.81; ^1H -NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.21(s,1H), 7.90(s,1H), 7.56(s,1H), 3.99(q,2H)

[0803]

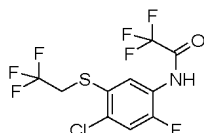
[0804] N-{2-클로로-4-플루오로-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로아세트아미드 (III-7)



logP(HCOOH): 3.33; logP(중성): 3.11; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.39(s, 1H), 7.85(d, 1H), 7.76(d, 1H), 4.08(q, 2H)

[0805]

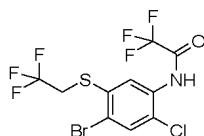
[0806] N-{4-클로로-2-플루오로-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로아세트아미드 (III-8)



logP(HCOOH): 3.34; logP(중성): 3.14; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.47(bs, 1H), 7.85(d, 1H), 7.76(d, 1H), 4.09(q, 2H)

[0807]

[0808] N-{4-브로모-2-클로로-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로아세트아미드 (III-9)

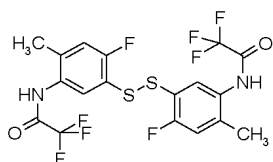


logP(HCOOH): 3.46; logP(중성): 3.11; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.46(s, 1H), 7.87(d, 1H), 7.82(d, 1H), 4.11(q, 2H)

[0809]

[0810] 상기 기재된 제조 방법은 화학식 IV의 화합물, 예를 들어 하기 화학식 IV의 화합물을 수득하는데 사용될 수 있다:

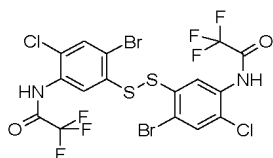
[0811] N,N'-[디술폰디일비스(4-플루오로-6-메틸벤젠-3,1-디일)]비스(2,2,2-트리플루오로아세트아미드) (IV-2)



logP(HCOOH): 4.0; logP(중성): 3.92; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.04(s, 2H), 7.62(d, 2H), 7.32(d, 2H), 2.19(s, 6H)

[0812]

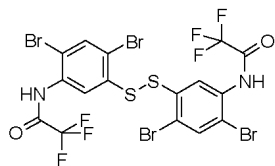
[0813] N,N'-[디술폰디일비스(4-브로모-6-클로로벤젠-3,1-디일)]비스(2,2,2-트리플루오로아세트아미드) (IV-3)



logP(HCOOH): 5.42

[0814]

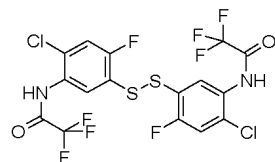
[0815] N,N'-[디설파디일비스(4,6-디브로모벤젠-3,1-디일)]비스(2,2,2-트리플루오로아세트아미드) (IV-4)



logP(HCOOH): 5.62; logP(중성): 4.49; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.38(s,2H), 8.18(s,2H), 7.77(d,2H)

[0816]

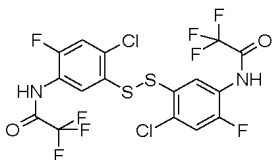
[0817] N,N'-[디설파디일비스(6-클로로-4-플루오로벤젠-3,1-디일)]비스(2,2,2-트리플루오로아세트아미드) (IV-5)



logP(HCOOH): 4.45; logP(중성): 3.81; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.37(s,2H), 7.88(d,2H), 7.80(d,2H)

[0818]

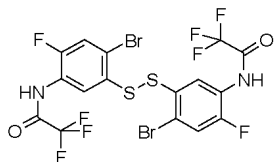
[0819] N,N'-[디설파디일비스(4-클로로-6-플루오로벤젠-3,1-디일)]비스(2,2,2-트리플루오로아세트아미드) (IV-6)



logP(HCOOH): 4.60; logP(중성): 3.82; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.44(s,2H), 7.95(d,2H), 7.83(d,2H)

[0820]

[0821] N,N'-[디설파디일비스(4-브로모-6-플루오로벤젠-3,1-디일)]비스(2,2,2-트리플루오로아세트아미드) (IV-7)

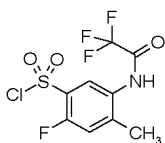


logP(HCOOH): 4.76; logP(중성): 4.02; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.44(s,2H), 7.95-7.89 (m,4H)

[0822]

[0823] 상기 기재된 제조 방법은 화학식 V의 화합물, 예를 들어 하기 화학식 V의 화합물을 수득하는데 사용될 수 있다:

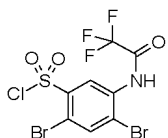
[0824] 2-플루오로-4-메틸-5-[(트리플루오로아세틸)아미노]벤젠설폰닐 클로라이드 (V-2)



¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 10.98 (s,1H), 7.48 (d,1H), 7.12 (d,1H), 2.15 (s,3H)

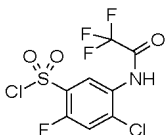
[0825]

[0826] 2,4-디브로모-5-[(트리플루오로아세틸)아미노]벤젠술폰닐 클로라이드 (V-3)



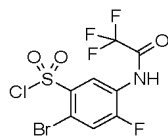
[0827] ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 9.20(bs, 1H), 8.56(s, 1H), 8.36(s, 1H)

[0828] 4-클로로-2-플루오로-5-[(트리플루오로아세틸)아미노]벤젠술폰닐 클로라이드 (V-4)



[0829] ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.30(s, 1H), 7.72-7.67(m, 1H), 7.59-7.55(d, 1H)

[0830] 2-브로모-4-플루오로-5-[(트리플루오로아세틸)아미노]벤젠술폰닐 클로라이드 (V-5)



[0831] ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 9.38(bs, 1H), 8.00-7.97(m, 1H), 7.68(d, 1H)

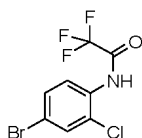
[0832] 상기 기재된 제조 방법은 화학식 VI의 화합물, 예를 들어 하기 화학식 VI의 화합물을 수득하는데 사용될 수 있다:

[0833] 2,2,2-트리플루오로-N-(4-플루오로-2-메틸페닐)아세트아미드 (VI-2)



[0834] logP(HCOOH): 2.2; logP(중성): 2.19; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 10.97(s, 1H), 7.28-7.30(m, 1H), 7.19-7.21(m, 1H), 7.08-7.11(m, 1H), 2.18 (s, 3H)

[0835] N-(4-브로모-2-클로로페닐)-2,2,2-트리플루오로아세트아미드 (VI-3)



[0836] logP(HCOOH): 3.01; logP(중성): 2.81; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.35 (s, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.65 (dd, 1H), 7.45 (d, 1H)

[0837] N-(2,4-디브로모페닐)-2,2,2-트리플루오로아세트아미드 (VI-4)



[0838] logP(HCOOH): 3.10; logP(중성): 2.89; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.36(s, 1H), 8.04(d, 1H), 7.69(dd, 1H), 7.43(d, 1H)

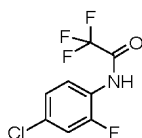
[0839] N-(2-클로로-4-플루오로페닐)-2,2,2-트리플루오로아세트아미드 (VI-5)



logP(HCOOH): 2.46; logP(중성): 2.31; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.29(s, 1H), 7.64(dd, 1H), 7.53(dd, 1H), 7.35-7.30(m, 1H)

[0840]

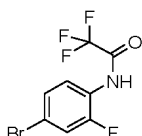
[0841] N-(4-클로로-2-플루오로페닐)-2,2,2-트리플루오로아세트아미드 (VI-6)



logP(HCOOH): 2.53; logP(중성): 2.40; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.29(s, 1H), 7.62(dd, 1H), 7.55(dd, 1H), 7.37(dd, 1H)

[0842]

[0843] N-(4-브로모-2-플루오로페닐)-2,2,2-트리플루오로아세트아미드 (VI-7)

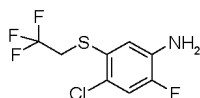


logP(HCOOH): 2.73; logP(중성): 2.51; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 11.36(s, 1H), 7.74(d, 1H), 7.52-7.46(m, 2H)

[0844]

[0845] 상기 기재된 제조 방법은 화학식 X의 화합물, 예를 들어 하기 화학식 X의 화합물을 수득하는데 사용될 수 있다:

[0846] 4-클로로-2-플루오로-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린 (X-6)



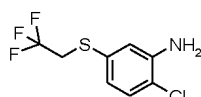
[0847]

[0848] 디옥산 150 ml 중 N-{4-클로로-2-플루오로-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]페닐}-2,2,2-트리플루오로아세트아미드 11.0 g (30.9 mmol)을 물 100 ml 중 황산 (96% 농도) 10.3 ml (186 mmol)의 용액에 조심스럽게 첨가하였다. 이어서, 반응 혼합물을 환류 하에 밤새 가열하였다. 냉각 후, 용액을 포화 중탄산나트륨 용액 및 약간의 탄산나트륨을 사용하여 pH 7로 조정하고, 에틸 아세테이트로 3회 추출하였다. 합한 유기 상을 포화 염화나트륨 용액으로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 잔류물은 표제 화합물 8.27 g (96% 순도, 이론치의 99%)을 흑색 오일/고체 혼합물로서 포함하였다.

logP(HCOOH): 3.02; logP(중성): 3.00; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.27(d, 1H), 7.04(d, 1H), 5.46(bs, 2H), 3.85(q, 2H)

[0849]

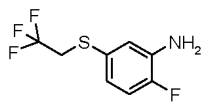
[0850] 2-클로로-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린 (X-7)



logP(HCOOH): 3.00; logP(중성): 2.95; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.16(d, 1H), 6.89(d, 1H), 6.68-6.65(m, 1H), 5.48(넓은, 2H), 3.89(q, 2H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 241 (1Cl) [M]⁺

[0851]

[0852] 2-플루오로-5-[(2,2,2-트리플루오로에틸)술폰닐]아닐린 (X-8)

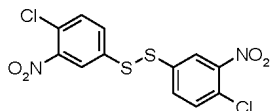


logP(HCOOH): 2.57; logP(중성): 2.53; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.01-6.97(m, 1H), 6.92-6.89(m, 1H), 6.69-6.64(m, 1H), 5.31(넓음, 2H), 3.82(q, 2H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 225 [M]⁺

[0853]

[0854] 상기 기재된 제조 방법은 화학식 XXI의 화합물, 예를 들어 하기 화학식 XXI의 화합물을 수득하는데 사용될 수 있다:

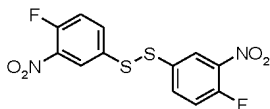
[0855] 1,1'-디술폰디일비스(4-클로로-3-니트로벤젠) (XXI-2)



logP(HCOOH): 4.58; logP(중성): 4.58; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 8.29(d, 2H), 7.89-7.86(m, 2H), 7.81(d, 2H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 376 (2Cl) [M]⁺

[0856]

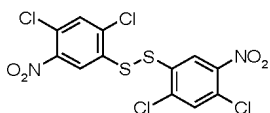
[0857] 1,1'-디술폰디일비스(4-플루오로-3-니트로벤젠) (XXI-3)



logP(HCOOH): 3.83; logP(중성): 3.79; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 8.32-8.29(m, 2H), 8.03-7.97(m, 2H), 7.69-7.63(m, 2H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 344 [M]⁺

[0858]

[0859] 1,1'-디술폰디일비스(2,4-디클로로-5-니트로벤젠) (XXI-4)

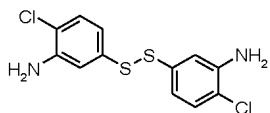


logP(HCOOH): 5.69; logP(중성): 5.64; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 8.33(s, 2H), 8.21(s, 2H)

[0860]

[0861] 상기 기재된 제조 방법은 화학식 XXII의 화합물, 예를 들어 하기 화학식 XXII의 화합물을 수득하는데 사용될 수 있다:

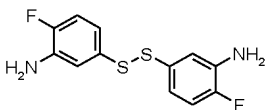
[0862] 3,3'-디술폰디일비스(6-클로로아닐린) (XXII-2)



logP(HCOOH): 3.84; logP(중성): 3.83; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.18(d, 2H), 6.94(d, 2H), 6.65-6.62(m, 2H), 5.59(넓음, 4H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 316 (2Cl) [M]⁺

[0863]

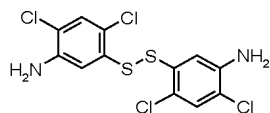
[0864] 3,3'-디술폰디일비스(6-플루오로아닐린) (XXII-3)



logP(HCOOH): 2.98; logP(중성): 2.97; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.02-6.95(m, 2H), 6.95-6.82(m, 2H), 6.62-6.57(m, 2H), 5.40(넓음, 4H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 284 [M]⁺

[0865]

[0866] 3,3'-디술판디일비스(4,6-디클로로아닐린) (XXII-4)

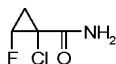


logP(HCOOH): 5.14; logP(중성): 4.95; ¹H-NMR (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7.41(s,2H), 6.95(s,2H), 5.78(넓음,4H); GC-MS: EI 질량 (m/z): 386 (4Cl) [M]⁺

[0867]

[0868] 상기 기재된 제조 방법은 화학식 XXIV의 화합물, 예를 들어 화학식 XXIV의 하기 화합물을 수득하는데 사용될 수 있다:

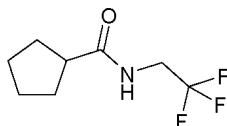
[0869] 1-클로로-2-플루오로시클로프로판카르복스아미드 (XXIV-1)



¹H-NMR(D6-DMSO) δ ppm : 7.84(넓음,1H), 7.75(넓음,1H), 5.05-4.86(m,1H), 1.89-1.81(m,1H), 1.69-1.60(m,1H)

[0870]

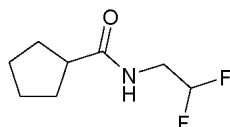
[0871] N-(2,2,2-트리플루오로에틸)시클로펜탄카르복스아미드 (XXIV-2)



¹H-NMR(D6-DMSO) δ ppm: 8.43(넓음,1H), 3.92-3.83(m,2H), 3.08-3.07(m,1H), 2.67-2.59(m,1H), 1.79-1.49(m,7H)

[0872]

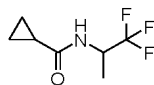
[0873] N-(2,2-디플루오로에틸)시클로펜탄카르복스아미드 (XXIV-3)



¹H-NMR(D6-DMSO) δ ppm: 8.18(t,1H), 5.97(tt,1H), 3.50-3.40(m,2H), 3.08-3.06(m,1H), 2.64-2.57(m,1H), 1.78-1.45(m,7H)

[0874]

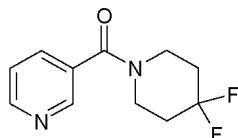
[0875] N-(1,1,1-트리플루오로프로판-2-일)시클로프로판카르복스아미드 (XXIV-4)



¹H-NMR(D6-DMSO) δ ppm: 8.62-8.60(d,1H), 4.62-4.55(m,1H), 1.63-1.59(m,1H), 1.24-1.23(d,3H), 0.72-0.70(m,4H)

[0876]

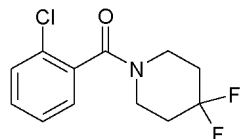
[0877] (3-피리딜)(4,4-디플루오로피페리딘-1-일)메탄 (XXIV-5)



¹H-NMR(D6-DMSO) δ ppm: 8.67-8.66(m,2H), 7.90-7.87(m,1H), 7.51-7.48(m,1H), 3.73(m,2H), 3.42(m,2H), 2.06(m,4H)

[0878]

[0879] (2-클로로페닐)(4,4-디플루오로피페리딘-1-일)메탄론 (XXIV-6)



¹H-NMR(D6-DMSO) δ ppm: 7.56-7.53(m,1H), 7.49-7.41(m,3H), 3.90-3.84(m,1H), 3.70-3.64(m,1H), 3.34-3.22(m,2H), 2.15-1.90(m,4H)

[0880]

[0881] 사용 실시예

[0882] 파에돈(Phaedon) 시험 (PHAECO 분무 처리)

[0883] 용매: 아세톤 78.0 중량부

[0884] 디메틸포름아미드 1.5 중량부

[0885] 유화제: 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 0.5 중량부

[0886] 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하기 위해, 활성 화합물 1 중량부를 명시된 양의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 유화제-함유수를 사용하여 목적하는 농도로 희석하였다. 배추 잎 (브라시카 페키넨시스(*Brassica pekinensis*))의 엽반에 목적하는 농도의 활성 화합물 제제를 분무하고, 건조시킨 후에, 겨자 딱정벌레 (파에돈 코클레아리아에)의 유충을 살게 하였다.

[0887] 7일 후에, 효과 (%)를 결정하였다. 100%는 모든 딱정벌레 유충이 사멸되었음을 의미하고; 0%는 어떠한 딱정벌레 유충도 전혀 사멸되지 않았음을 의미한다.

[0888] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예로부터의 하기 화합물은 500 g/ha의 적용률에서 100%의 효능을 나타내었다: Ia-02, Ia-04, Ia-05, Ia-13, Ia-14, Ia-15, Ia-18, Ia-19, Ib-02, Ib-10, Ib-11, Ib-14, Ib-16

[0889] 테트라니쿠스(Tetranychus) 시험, OP-내성 (TETRUR 분무 처리)

[0890] 용매: 아세톤 78.0 중량부

[0891] 디메틸포름아미드 1.5 중량부

[0892] 유화제: 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 0.5 중량부

[0893] 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하기 위해, 활성 화합물 1 중량부를 명시된 양의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 유화제-함유수를 사용하여 목적하는 농도로 희석하였다. 모든 단계의 온실 적색 잎응애 (테트라니쿠스 우르티카에(*Tetranychus urticae*))에 의해 감염된 콩 잎 (파세올루스 불가리스(*Phaseolus vulgaris*))의 엽반에 목적하는 농도의 활성 화합물 제제를 분무하였다.

[0894] 6일 후에, 효과 (%)를 결정하였다. 100%는 여기서 모든 잎응애가 사멸되었음을 의미하고; 0%는 어떠한 잎응애도 전혀 사멸되지 않았음을 의미한다.

[0895] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 500 g/ha의 적용률에서 80%의 효능을 나타내었다: Ia-09, Ia-17, Ib-04, Ib-05

[0896] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 500 g/ha의 적용률에서 100%의 효능을 나타내었다: Ia-02, Ia-03, Ia-05, Ia-07, Ia-12, Ia-13, Ia-15, Ia-18, Ia-23, Ia-26, Ib-02, Ib-03, Ib-06, Ib-07, Ib-08, Ib-09, Ib-12, Ib-13, Ib-15

[0897] 멜로이도기네 인코그니타(Meloidogyne incognita) 시험 (MELGIN)

[0898] 용매: 아세톤 80.0 중량부

[0899] 적합한 활성 화합물 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물을 명시된 양의 용매와 혼합하고, 농축물은 목적하는 농도까지 물로 희석하였다.

[0900] 용기는 모래, 활성 화합물의 용액, 멜로이도기네 인코그니타 알/유충 현탁액 및 상추 종자로 채웠다. 상추 종자가 발아하고, 식물이 발달한다. 뿌리에, 혹이 형성된다.

- [0901] 14일 후에, 살선충 효능 (%)을 흑의 형성에 의해 결정하였다. 100%는 어떠한 흑도 발견되지 않았음을 의미하고; 0%는 처리된 식물 상의 흑의 수가 미처리 대조군에 상응하는 것을 의미한다.
- [0902] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예로부터의 하기 화합물은 20 ppm의 적용률에서 90%의 효능을 나타내었다: Ia-07
- [0903] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예로부터의 하기 화합물은 20 ppm의 적용률에서 100%의 효능을 나타내었다: Ib-02
- [0904] 루실리아 쿠프리나(*Lucilia cuprina*) (48h)
- [0905] 용매: 디메틸 술폭시드
- [0906] 활성 화합물 10 mg을 디메틸 술폭시드 0.5 ml 중에 용해시켰다. 적합한 제제를 제조하기 위해, 활성 화합물 용액을 각각의 경우에 물을 사용하여 목적하는 농도로 희석하였다. 약 20마리의 루실리아 쿠프리나 유충을 말고 기 약 1 cm³ 및 시험하려는 활성 화합물의 제제 0.5 ml를 함유하는 시험 튜브에 도입하였다. 48시간 후에, 활성 화합물 제제의 효능은 유충 사멸률 %로 결정되었다.
- [0907] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 100 ppm의 적용률에서 100%의 효과를 나타내었다: Ia-21, Ib-11
- [0908] 부필루스 마이크로플루스(*Boophilus microplus*) 시험 (BOOPMI 주사)
- [0909] 용매: 디메틸 술폭시드
- [0910] 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하기 위해, 활성 화합물 10 mg을 용매 0.5 ml와 혼합하고, 농축물을 용매를 사용하여 목적하는 농도로 희석하였다. 활성 화합물의 용액을 복부 (부필루스 마이크로플루스) 내에 주사하고, 동물을 접시 내로 옮기고, 기후조절실에서 유지하였다. 활성을 수정란을 낳는 것에 의해 평가하였다.
- [0911] 7일 후에, 효과 (%)를 결정하였다. 100%는 어떠한 진드기도 전혀 수정란을 낳지 않았음을 의미한다.
- [0912] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예로부터의 하기 화합물은 20 µg / 동물의 적용률에서 80%의 효능을 나타내었다: Ia-04
- [0913] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 20 µg / 동물의 적용률에서 100%의 효능을 나타내었다: Ia-01, Ia-21, Ia-22, Ib-01, Ib-10, Ib-11, Ib-14, Ib-16
- [0914] 달리 나타내지 않는 한, 실시예에서의 시험 용액을 다음과 같이 제조하였다:
- [0915] 활성 화합물 1 중량부를 명시된 양의 용매 및 유화제 혼합물 (용매로서의 디메틸포름아미드 3 중량부 및 유화제로서의 폴리옥시에틸렌 알킬 페닐 에테르 1 중량부)과 혼합하고, 용액을 물을 사용하여 목적하는 농도로 희석하였다.
- [0916] 잎응애 시험 (테트라니쿠스 우르티카에)
- [0917] 50 내지 100마리 성체 잎응애를 6 cm의 직경을 갖는 포트에서 성장하는 2-엽기의 신장 콩 식물의 잎 상에 배치시켰다.
- [0918] 1일 후에, 페인트 분무 건을 사용하여, 식물을 충분한 양의 활성 화합물 제제를 목적하는 농도로 분무하고, 온실에 위치시켰다. 7일 후에, 살응애 효과를 결정하였다. 100%는 모든 잎응애가 사멸되었음을 의미하고; 0%는 어떠한 잎응애도 사멸되지 않았음을 의미한다.
- [0919] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 100 ppm의 활성 화합물 농도에서 100%의 효능을 나타내었다:
- [0920] Ia-21, Ia-01, Ib-11, Ib-01, Ia-06, Ia-14, Ia-15, Ib-14, Ia-20, Ia-25, Ia-19, Ib-16 및 Ib-10
- [0921] 조롱박 잎 딱정벌레 시험 (올라코포라 페모랄리스(*Aulacophora femoralis*))
- [0922] 오이 잎을 적절한 농도의 시험 용액 내에 침지시키고, 이어서 공기-건조시켰다. 이어서, 잎을 멸균 토양 및 제 2 유충 단계의 5마리 올라코포라 페모랄리스 유충으로 채워진 플라스틱 디쉬에 삽입하였다. 디쉬를 25℃에서 기후조절실에 위치시켰다.

- [0923] 7일 후에, 효과 (%)를 결정하였다. 100%는 모든 딱정벌레 유충이 사멸되었음을 의미하고; 0%는 어떠한 딱정벌레 유충도 전혀 사멸되지 않았음을 의미한다.
- [0924] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 500 ppm의 활성 화합물 농도에서 100%의 효능을 나타내었다:
- [0925] Ia-21, Ib-11, Ib-01, Ib-14, Ib-16 및 Ib-10
- [0926] 부필루스 마이크로플루스 - 침지 시험 (BOOPMI 침지)
- [0927] 시험 동물: 소 진드기 (부필루스 마이크로플루스) 파크허스트(Parkhurst) 균주, SP-내성
- [0928] 용매: 디메틸 술폭시드
- [0929] 활성 화합물 10 mg을 디메틸 술폭시드 0.5 ml 중에 용해시켰다. 적합한 제제를 제조하기 위해, 활성 화합물 용액은 각각의 경우에 물을 사용하여 목적하는 농도로 희석하였다.
- [0930] 이 활성 화합물 제제를 튜브에 피펫팅하였다. 8-10마리의 성체 충혈된 암컷 소 진드기 (부필루스 마이크로플루스)를 홀이 있는 추가의 튜브 내로 옮겼다. 튜브를 활성 성분 제제 내로 함침시키고, 모든 진드기를 완전히 젖게 하였다. 액체가 소진된 후에, 진드기를 플라스틱 디쉬 내의 필터 디스크 상에 이동시키고, 기후조절실에 저장하였다.
- [0931] 활성을 7일 후에 수정란을 낳는 것에 의해 평가하였다. 수정이 외부로부터 가시적이지 않은 알은 약 42일 후의 유충 부화까지 기후-제어 캐비닛에 저장하였다. 100%의 효능은 어떠한 진드기도 전혀 수정란을 낳지 않았음을 의미하고; 0%는 모든 알이 수정되었음을 의미한다.
- [0932] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 100 ppm의 적용률에서 100%의 효능을 나타내었다: Ia-189, Ib-115, Ib-33
- [0933] 부필루스 마이크로플루스 - 주사 시험 (BOOPMI 주사)
- [0934] 용매: 디메틸 술폭시드
- [0935] 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하기 위해, 활성 화합물 10 mg을 용매 0.5 ml 중에 용해시키고, 농축물을 용매를 사용하여 목적하는 농도로 희석하였다.
- [0936] 활성 화합물 용액 1 μ l를 5마리의 충혈된 성체 암컷 소 진드기 (부필루스 마이크로플루스)의 복부 내로 주사하였다. 동물을 디쉬 내로 옮기고, 기후-제어실에서 유지하였다.
- [0937] 활성을 7일 후에 수정란을 낳는 것에 의해 평가하였다. 수정이 외부로부터 가시적이지 않은 알은 약 42일 후의 유충 부화까지 기후-제어 캐비닛에 저장하였다. 100%의 효능은 어떠한 진드기도 전혀 수정란을 낳지 않았음을 의미하고; 0%는 모든 알이 수정되었음을 의미한다.
- [0938] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 20 μ g / 동물의 적용률에서 100%의 효능을 나타내었다: Ia-01, Ia-115, Ia-116, Ia-118, Ia-120, Ia-13, Ia-189, Ia-206, Ia-21, Ia-22, Ia-27, Ia-34, Ia-39, Ia-44, Ia-50, Ia-66, Ia-80, Ib-01, Ib-02, Ib-03, Ib-07, Ib-10, Ib-108, Ib-11, Ib-115, Ib-12, Ib-14, Ib-14, Ib-16, Ib-17, Ib-18, Ib-19, Ib-20, Ib-33, Ib-35, Ib-38, Ib-40, Ib-47, Ib-48, Ib-58, Ib-59, Ib-68, Ib-85
- [0939] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 20 μ g / 동물의 적용률에서 90%의 효능을 나타내었다: Ib-44
- [0940] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 20 μ g / 동물의 적용률에서 80%의 효능을 나타내었다: Ia-04, Ib-24, Ib-89
- [0941] 쿠페리아 쿠르티세이(Cooperia curticei) 시험 (COOPCU)
- [0942] 용매: 디메틸 술폭시드
- [0943] 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하기 위해, 활성 화합물 10 mg을 디메틸 술폭시드 0.5 ml와 혼합하고, 농축물을 "링거액"을 사용하여 목적하는 농도로 희석하였다.
- [0944] 목적하는 농도의 활성 화합물 제제를 함유하는 용기에 약 40마리의 선충류 유충 (쿠페리아 쿠르티세이)이 살게

하였다.

- [0945] 5일 후에, 사멸 (%)을 결정하였다. 100%는 모든 유충이 사멸되었음을 의미하고; 0%는 어떠한 유충도 사멸되지 않았음을 의미한다.
- [0946] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 100 ppm의 적용률에서 100%의 효능을 나타내었다: Ia-220
- [0947] 루실리아 쿠프리나(*Lucilia cuprina*) 시험 (LUCICU)
- [0948] 용매: 디메틸 술폭시드
- [0949] 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하기 위해, 활성 화합물 10 mg을 디메틸 술폭시드 0.5 ml와 혼합하고, 농축물을 물을 사용하여 목적하는 농도로 희석하였다.
- [0950] 약 20마리의 호주 양 검정 파리 (루실리아 쿠프리나)의 L1 유충을 다진 말고기 및 목적하는 농도의 활성 화합물 제제를 함유하는 시험 용기로 옮겼다.
- [0951] 2일 후에, 사멸 (%)을 결정하였다. 100%는 모든 유충이 사멸되었음을 의미하고; 0%는 어떠한 유충도 전혀 사멸되지 않았음을 의미한다.
- [0952] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 100 ppm의 적용률에서 100%의 효능을 나타내었다: Ia-21, Ib-11
- [0953] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 100 ppm의 적용률에서 90%의 효능을 나타내었다: Ia-13
- [0954] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 100 ppm의 적용률에서 80%의 효능을 나타내었다: Ib-02
- [0955] 미주스 페르시카에(*Myzus persicae*) - 분무 시험 (MYZUPE)
- [0956] 용매: 아세톤 78 중량부
- [0957] 디메틸포름아미드 1.5 중량부
- [0958] 유화제: 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 0.5 중량부
- [0959] 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하기 위해, 활성 화합물 1 중량부를 명시된 양의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 유화제-함유수를 사용하여 목적하는 농도로 희석하였다.
- [0960] 복숭아 혹 진딧물 (미주스 페르시카에)의 모든 단계에 의해 감염된 배추 (브라시카 페키넨시스)의 엽반에 목적하는 농도의 활성 화합물 제제를 분무하였다.
- [0961] 6일 후에, 효과 (%)를 결정하였다. 100%는 여기서 모든 진딧물이 사멸되었음을 의미하고; 0%는 어떠한 진딧물도 전혀 사멸되지 않았음을 의미한다.
- [0962] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 500g/ha의 적용률에서 100%의 효과를 나타내었다: Ia-206, Ia-228, Ib-44
- [0963] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 500g/ha의 적용률에서 90%의 효과를 나타내었다: Ia-34, Ia-116, Ib-123
- [0964] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 100g/ha의 적용률에서 80%의 효과를 보여준다: Ib-42
- [0965] 파에돈 코클레아리아에 - 분무 시험 (PHAECO)
- [0966] 용매: 아세톤 78.0 중량부
- [0967] 디메틸포름아미드 1.5 중량부
- [0968] 유화제: 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 0.5 중량부
- [0969] 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하기 위해, 활성 화합물 1 중량부를 명시된 양의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 유화제-함유수를 사용하여 목적하는 농도로 희석하였다.
- [0970] 배추 (브라시카 페키넨시스)의 엽반에 목적하는 농도의 활성 성분 제제를 분무하고, 건조시킨 후에, 겨자 딱정벌레 (파에돈 코클레아리아에)의 유충을 살게 하였다.

- [0971] 7일 후에, 효과 (%)를 결정하였다. 100%는 모든 딱정벌레 유충이 사멸되었음을 의미하고; 0%는 어떠한 딱정벌레 유충도 전혀 사멸되지 않았음을 의미한다.
- [0972] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 500g/ha의 적용률에서 100%의 효과를 나타내었다: Ia-02, Ia-04, Ia-05, Ia-13, Ia-14, Ia-15, Ia-18, Ia-19, Ia-27, Ia-28, Ia-29, Ia-31, Ia-35, Ia-36, Ia-38, Ia-45, Ia-78, Ia-79, Ia-115, Ia-118, Ia-121, Ia-135, Ia-139, Ia-149, Ia-162, Ia-191, Ia-202, Ia-209, Ia-229, Ib-02, Ib-10, Ib-11, Ib-14, Ib-16, Ib-17, Ib-20, Ib-20, Ib-27, Ib-39, Ib-43, Ib-44, Ib-56, Ib-57, Ib-68, Ib-78, Ib-83, Ib-101, Ib-110, Ib-111, Ib-115
- [0973] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 500g/ha의 적용률에서 83%의 효과를 나타내었다: Ia-33, Ia-92, Ia-130, Ia-134, Ia-171, Ia-204, Ia-207, Ia-210, Ib-18, Ib-30, Ib-108, Ib-137, Ib-143
- [0974] 테트라니쿠스 우르티카에 - 분무 시험, OP-내성 (TETRUR)
- [0975] 용매: 아세톤 78.0 중량부
- [0976] 디메틸포름아미드 1.5 중량부
- [0977] 유화제: 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 0.5 중량부
- [0978] 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하기 위해, 활성 화합물 1 중량부를 명시된 양의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 유화제-함유수를 사용하여 목적하는 농도로 희석하였다.
- [0979] 온실 적색 잎응애 (테트라니쿠스 우르티카에)의 모든 단계에 의해 감염된 콩 잎 (파세올루스 불가리스)의 엽반에 목적하는 농도의 활성 화합물 제제를 분무하였다.
- [0980] 6일 후에, 효과 (%)를 결정하였다. 100%는 모든 잎응애가 사멸되었음을 의미하고; 0%는 어떠한 잎응애도 전혀 사멸되지 않았음을 의미한다.
- [0981] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 500 g/ha의 적용률에서 100%의 효능을 나타내었다: Ia-01, Ia-02, Ia-03, Ia-04, Ia-05, Ia-06, Ia-07, Ia-08, Ia-11, Ia-12, Ia-13, Ia-14, Ia-15, Ia-16, Ia-18, Ia-19, Ia-20, Ia-21, Ia-22, Ia-23, Ia-25, Ia-26, Ia-27, Ia-28, Ia-29, Ia-30, Ia-31, Ia-32, Ia-33, Ia-34, Ia-35, Ia-36, Ia-37, Ia-38, Ia-39, Ia-40, Ia-41, Ia-42, Ia-43, Ia-44, Ia-46, Ia-47, Ia-48, Ia-49, Ia-50, Ia-51, Ia-52, Ia-53, Ia-54, Ia-55, Ia-56, Ia-57, Ia-60, Ia-61, Ia-64, Ia-65, Ia-66, Ia-67, Ia-69, Ia-70, Ia-71, Ia-72, Ia-73, Ia-74, Ia-75, Ia-76, Ia-77, Ia-78, Ia-79, Ia-80, Ia-81, Ia-82, Ia-83, Ia-84, Ia-85, Ia-86, Ia-87, Ia-89, Ia-93, Ia-94, Ia-95, Ia-96, Ia-97, Ia-98, Ia-99, Ia-100, Ia-115, Ia-116, Ia-119, Ia-120, Ia-121, Ia-122, Ia-123, Ia-124, Ia-125, Ia-126, Ia-127, Ia-129, Ia-130, Ia-131, Ia-132, Ia-133, Ia-134, Ia-135, Ia-136, Ia-138, Ia-139, Ia-140, Ia-141, Ia-141, Ia-143, Ia-144, Ia-145, Ia-146, Ia-147, Ia-148, Ia-150, Ia-151, Ia-152, Ia-153, Ia-156, Ia-158, Ia-161, Ia-162, Ia-163, Ia-165, Ia-166, Ia-187, Ia-188, Ia-189, Ia-191, Ia-193, Ia-194, Ia-195, Ia-197, Ia-201, Ia-202, Ia-203, Ia-205, Ia-206, Ia-207, Ia-208, Ia-209, Ia-210, Ia-211, Ia-213, Ia-214, Ia-217, Ia-221, Ia-222, Ia-224, Ia-225, Ia-226, Ia-227, Ia-230, Ia-233, Ia-234, Ia-236, Ia-238, Ia-239, Ia-242, Ia-247, Ia-249, Ia-272, Ia-275, Ia-276, Ib-02, Ib-03, Ib-06, Ib-07, Ib-08, Ib-09, Ib-10, Ib-11, Ib-12, Ib-13, Ib-14, Ib-15, Ib-16, Ib-17, Ib-19, Ib-20, Ib-21, Ib-22, Ib-24, Ib-25, Ib-26, Ib-27, Ib-28, Ib-29, Ib-30, Ib-31, Ib-32, Ib-33, Ib-34, Ib-35, Ib-36, Ib-37, Ib-38, Ib-39, Ib-40, Ib-42, Ib-43, Ib-45, Ib-46, Ib-47, Ib-48, Ib-49, Ib-50, Ib-51, Ib-52, Ib-53, Ib-56, Ib-57, Ib-58, Ib-59, Ib-61, Ib-62, Ib-63, Ib-64, Ib-65, Ib-68, Ib-69, Ib-71, Ib-72, Ib-75, Ib-76, Ib-78, Ib-79, Ib-80, Ib-81, Ib-82, Ib-83, Ib-84, Ib-85, Ib-86, Ib-87, Ib-88, Ib-89, Ib-90, Ib-92, Ib-93, Ib-94, Ib-95, Ib-97, Ib-98, Ib-99, Ib-100, Ib-108, Ib-109, Ib-110, Ib-112, Ib-113, Ib-114, Ib-115, Ib-117, Ib-118, Ib-119, Ib-120, Ib-121, Ib-123, Ib-125, Ib-126, Ib-127, Ib-129, Ib-130, Ib-131, Ib-132, Ib-135, Ib-137, Ib-138, Ib-139, Ib-140, Ib-141, Ib-148, Ib-151, Ib-160, Ib-169, Ib-174
- [0982] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 500 g/ha의 적용률에서 90%의 효능을 나타내었다: Ia-59, Ia-62, Ia-63, Ia-68, Ia-83, Ia-88, Ia-91, Ia-92, Ia-101, Ia-102, Ia-103, Ia-104, Ia-105, Ia-106, Ia-107, Ia-117, Ia-118, Ia-128, Ia-149, Ia-155, Ia-159, Ia-160, Ia-167, Ia-168, Ia-169, Ia-171, Ia-172, Ia-173, Ia-175, Ia-176, Ia-177, Ia-178, Ia-180, Ia-190, Ia-192, Ia-196, Ia-204, Ia-205, Ia-212, Ia-215, Ia-216, Ia-218, Ia-219, Ia-220, Ia-223, Ia-228, Ia-229, Ia-231, Ia-232, Ia-235, Ia-237, Ia-

240, Ia-241, Ia-243, Ia-244, Ia-245, Ia-248, Ia-250, Ia-251, Ia-252, Ia-253, Ia-254, Ia-255, Ia-256, Ia-257, Ia-258, Ia-259, Ia-260, Ia-261, Ia-262, Ia-263, Ia-264, Ia-265, Ia-266, Ia-267, Ia-268, Ia-269, Ia-270, Ia-278, Ib-01, Ib-23, Ib-41, Ib-54, Ib-60, Ib-66, Ib-67, Ib-73, Ib-74, Ib-77, Ib-91, Ib-96, Ib-101, Ib-102, Ib-103, Ib-104, Ib-111, Ib-116, Ib-122, Ib-124, Ib-128, Ib-133, Ib-134, Ib-136, Ib-142, Ib-143, Ib-144, Ib-145, Ib-146, Ib-147, Ib-149, Ib-150, Ib-152, Ib-153, Ib-154, Ib-155, Ib-156, Ib-157, Ib-158, Ib-166, Ib-167, Ib-172

- [0983] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 500 g/ha의 적용률에서 80%의 효능을 나타내었다: Ia-09, Ia-17, Ia-45, Ia-90, Ia-108, Ia-109, Ib-04, Ib-05, Ib-18
- [0984] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 100g/ha의 적용률에서 100%의 효능을 나타내었다: Ia-58
- [0985] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 100g/ha의 적용률에서 90%의 효능을 나타내었다: Ia-181
- [0986] 테트라니쿠스 우르티카에 - 분무 시험, OP-내성 (TETRUR)
- [0987] 용매: 디메틸포름아미드 7 중량부
- [0988] 유화제: 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 2 중량부
- [0989] 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하기 위해, 활성 화합물 1 중량부를 명시된 양의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 유화제-함유수를 사용하여 목적하는 농도로 희석하였다. 암모늄 염 또는/및 침투제의 첨가가 필요한 경우에, 이들을 제제의 용액에 1000 ppm의 농도로 첨가하였다.
- [0990] 온실 적색 잎응애 (테트라니쿠스 우르티카에)의 모든 단계에 의해 심하게 감염된 콩 식물 (파세올루스 불가리스)에 목적하는 농도의 활성 화합물 제제를 분무함으로써 처리하였다.
- [0991] 7일 후에, 효과 (%)를 결정하였다. 100%는 모든 잎응애가 사멸되었음을 의미하고; 0%는 어떠한 잎응애도 전혀 사멸되지 않았음을 의미한다.
- [0992] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 100 ppm의 적용률에서 90%의 효능을 나타내었다: Ib-44
- [0993] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 20 ppm의 적용률에서 100%의 효능을 나타내었다: Ib-168
- [0994] 이 시험에서, 예를 들어, 제조 실시예의 하기 화합물은 20 ppm의 적용률에서 80%의 효능을 나타내었다: Ib-159