

(19)대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.<sup>7</sup> (11) 공개번호 10-2005-0056205  
C07D 277/56 (43) 공개일자 2005년06월14일

(21) 출원번호 10-2005-7003786  
(22) 출원일자 2005년03월04일  
번역문 제출일자 2005년03월04일  
(86) 국제출원번호 PCT/EP2003/010758 (87) 국제공개번호 WO 2004/035555  
국제출원출원일자 2003년09월26일 국제공개일자 2004년04월29일

(30) 우선권주장 102 46 959.8 2002년10월09일 독일(DE)

(71) 출원인 바이엘 크롭사이언스 아게  
독일 40789 몬하임 알프레드-노벨-스트라세 50

(72) 발명자 둔켈 랄프  
독일 40789 몬하임 크리스테르 스트라세 22  
엘베 한스-루드빅  
독일 42329 부퍼탈 다스너켈 59  
리크 하이코  
프랑스 에프-69110 스테 포이 레스 리옹 튀 클라우드 모 네 9  
바헨도르프-노이만 울리케  
독일 56566 노이비트 오버레르 마르켄베크 85  
쿠크 카를-하인쯔  
독일 40764 랑엔펠트 파스토르-뢰-스트라세 30 아

(74) 대리인 최규팔  
이은선

심사청구 : 없음

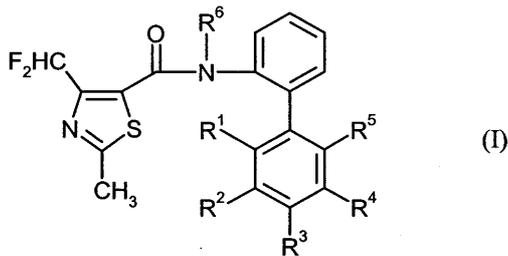
(54) 티아졸릴 비페닐 아마이드

명세서

본 발명은 신규한 티아졸릴비페닐아미드, 다수의 그의 제조방법 및 작물 보호 및 재료 보호시에 유해 미생물을 구제하기 위한 그의 용도에 관한 것이다.

다수의 카복시아닐리드가 살진균성을 가지고 있음은 이미 알려져 있다(참조: EP 0 545 099). 여기에 개시된 화합물의 활성은 우수하나, 저 적용비율에서 종종 만족스럽지 않은 경우가 있다.

본 발명에 따라 하기 일반식 (I)의 신규한 티아졸릴비페닐아미드가 제공된다:



상기 식에서,

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>는 서로 독립적으로 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬설포닐 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 5개의 할로젠 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬티오 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설포닐을 나타내거나,

R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup> 또는 R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>는 함께, 임의로 할로젠- 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬-치환된 알케닐렌을 나타내고,

R<sup>6</sup>은 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬설피닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설피닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설피닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설포닐, 할로-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나, -COR<sup>7</sup>, -CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> 또는 -CH<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>을 나타내며,

R<sup>7</sup>은 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로알콕시, 할로-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나, 4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-2-일을 나타내고,

R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 서로 독립적으로 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-할로알킬, 할로-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나,

R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 할로젠 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환되고 5 내지 8개의 환 원자를 가지며 산소, 황 및 NR<sup>12</sup>로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2개의 추가의 비인접 헤테로 원자를 함유할 수 있는 포화 헤테로사이클을 형성하며,

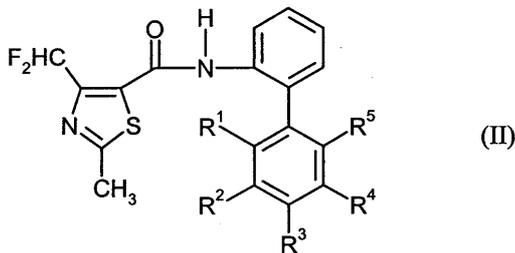
R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 서로 독립적으로 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-할로알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나,

R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 할로젠 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환되고 5 내지 8개의 환 원자를 가지며 산소, 황 및 NR<sup>12</sup>로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2개의 추가의 비인접 헤테로 원자를 함유할 수 있는 포화 헤테로사이클을 형성하고,

R<sup>12</sup>는 수소 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬을 나타낸다.

또한, 본 발명에 따라 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드는

(A) 하기 일반식 (II)의 티아졸릴비페닐아미드를 염기의 존재하 및 희석제의 존재하에서 하기 일반식 (III)의 할라이드와 반응시킴으로써 수득됨이 밝혀졌다:



상기 식에서,

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>은 상기 정의된 바와 같고,

X는 염소, 브롬 또는 요오드를 나타낸다.

마지막으로, 일반식 (I)의 신규 티아졸릴비페닐아미드는 매우 우수한 살미생물 성질을 나타내며, 작물 보호 및 재료 보호 둘 다에서 원치 않는 미생물을 구제하기 위해 사용될 수 있음이 밝혀졌다.

놀랍게도, 본 발명에 따른 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드는 구조적으로 가장 유사하고 작용 성향이 동일한 선행 활성 화합물 보다 훨씬 더 뛰어난 살진균 활성을 나타낸다.

일반식 (I)은 본 발명에 따른 티아졸릴비페닐아미드의 일반 정의를 제공한다. 상기 및 이후 일반식에 언급된 치환체의 바람직한 정의가 하기 주어진다. 이들은 또한 전구체 및 중간체에도 적용된다.

$R^1, R^2, R^3, R^4$  및  $R^5$ 는 서로 독립적으로 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸, 메톡시, 에톡시, 메틸티오, 에틸티오, n- 또는 이소프로필티오, 사이클로프로필, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로에틸, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로클로로메톡시, 트리플루오로에톡시, 디플루오로메틸티오, 디플루오로클로로메틸티오 또는 트리플루오로메틸티오를 나타내거나,

$R^1$  및  $R^2$  또는  $R^2$  및  $R^3$ 는 함께, 바람직하게는 임의로 불소-, 염소-, 브롬- 또는 메틸-치환된 부타디엔디일을 나타내고,

$R^6$ 은 바람직하게는  $C_1-C_6$ -알킬,  $C_1-C_4$ -알킬설피닐,  $C_1-C_4$ -알킬설포닐,  $C_1-C_3$ -알콕시- $C_1-C_3$ -알킬 또는  $C_3-C_6$ -사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는  $C_1-C_4$ -할로알킬,  $C_1-C_4$ -할로알킬설피닐,  $C_1-C_4$ -할로알킬설포닐,  $C_1-C_4$ -할로알킬설피닐,  $C_1-C_4$ -할로알킬설포닐, 할로- $C_1-C_3$ -알콕시- $C_1-C_3$ -알킬 또는  $C_3-C_6$ -할로사이클로알킬을 나타내거나,  $-COR^7$ ,  $-CONR^8R^9$  또는  $-CH_2NR^{10}R^{11}$ 을 나타내며,

$R^7$ 은 바람직하게는 수소,  $C_1-C_6$ -알킬,  $C_1-C_4$ -알콕시,  $C_1-C_3$ -알콕시- $C_1-C_3$ -알킬 또는  $C_3-C_6$ -사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는  $C_1-C_4$ -할로알킬,  $C_1-C_4$ -할로알콕시, 할로- $C_1-C_3$ -알콕시- $C_1-C_3$ -알킬 또는  $C_3-C_6$ -할로사이클로알킬을 나타내거나, 4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-2-일을 나타내고,

$R^8$  및  $R^9$ 는 서로 독립적으로 바람직하게는 수소,  $C_1-C_6$ -알킬,  $C_1-C_3$ -알콕시- $C_1-C_3$ -알킬 또는  $C_3-C_6$ -사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는  $C_1-C_4$ -할로알킬, 할로- $C_1-C_3$ -알콕시- $C_1-C_3$ -알킬 또는  $C_3-C_6$ -할로사이클로알킬을 나타내거나,

$R^8$  및  $R^9$ 는 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 바람직하게는 할로젠 및  $C_1-C_4$ -알킬로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환되고 5 내지 8개의 환 원자를 가지며 산소, 황 및  $NR^{12}$ 로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2개의 추가의 비인접 헤테로 원자를 함유할 수 있는 포화 헤테로사이클을 형성하며,

$R^{10}$  및  $R^{11}$ 은 서로 독립적으로 바람직하게는 수소,  $C_1-C_6$ -알킬 또는  $C_3-C_6$ -사이클로알킬을 나타내거나, 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는  $C_1-C_4$ -할로알킬 또는  $C_3-C_6$ -할로사이클로알킬을 나타내거나,

$R^{10}$  및  $R^{11}$ 은 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 바람직하게는 할로젠 및  $C_1-C_4$ -알킬로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환되고 5 내지 8개의 환 원자를 가지며 산소, 황 및  $NR^{12}$ 로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2개의 추가의 비인접 헤테로 원자를 함유할 수 있는 포화 헤테로사이클을 형성하며,

$R^{12}$ 는 바람직하게는 수소 또는  $C_1-C_4$ -알킬을 나타낸다.

$R^1, R^2, R^3, R^4$  및  $R^5$ 는 서로 독립적으로 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 시아노, 메틸, 메톡시, 메틸티오, 트리플루오로메틸, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메틸티오 또는 트리플루오로메틸티오를 나타내고,

$R^6$ 은 특히 바람직하게는 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸, 펜틸, 헥실, 메틸설피닐, 에틸설피닐, n- 또는 이소프로필설피닐, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸설피닐, 메틸설포닐, 에틸설포닐, n- 또는 이소프로필설포닐, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸설포닐, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 에톡시메틸, 에톡시에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로에틸, 디플루오로메틸설피닐, 디플루오로클로로메틸설피닐, 트리플루오로메틸설피닐, 트리플루오로메틸설포닐, 트리플루오로메톡시메틸,  $-COR^7$ ,  $-CONR^8R^9$  또는  $-CH_2NR^{10}R^{11}$ 을 나타내며,

$R^7$ 은 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, t-부틸, 메톡시, 에톡시, t-부톡시, 사이클로프로필, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시 또는 4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-2-일을 나타내고,

R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 서로 독립적으로 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 에톡시메틸, 에톡시에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로에틸 또는 트리플루오로메톡시메틸을 나타내거나,

R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬 및 메틸로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 모르폴린, 티오모르폴린 및 피페라진으로 구성된 그룹중에서 선택된 포화 헤테로사이클을 형성하며, 여기에서, 피페라진은 R<sup>12</sup>에 의해 제 2의 질소 원자상에서 치환될 수 있으며,

R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 서로 독립적으로 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 에톡시메틸, 에톡시에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로에틸 또는 트리플루오로메톡시메틸을 나타내고,

R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬 및 메틸로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 모르폴린, 티오모르폴린 및 피페라진으로 구성된 그룹중에서 선택된 포화 헤테로사이클을 형성하며, 여기에서, 피페라진은 R<sup>12</sup>에 의해 제 2의 질소 원자상에서 치환될 수 있으며,

R<sup>12</sup>는 특히 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, 또는 n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸을 나타낸다.

각 경우에 래디칼 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>중 네개가 수소를 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드가 매우 특히 바람직하다.

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>가 각각 수소를 나타내고,

R<sup>3</sup>이 상기 정의된 바와 같은 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드가 매우 특히 바람직하다.

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>가 각각 수소를 나타내고,

R<sup>3</sup>이 불소, 염소, 브롬, 메틸, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시 또는 트리플루오로메틸티오를 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드가 매우 특히 바람직하다.

R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>가 각각 수소를 나타내고,

R<sup>1</sup> 및 R<sup>3</sup>이 서로 독립적으로 상기 정의된 바와 같은 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드가 매우 특히 바람직하다.

R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>가 각각 수소를 나타내고,

R<sup>1</sup> 및 R<sup>3</sup>이 서로 독립적으로 불소, 염소, 브롬, 메틸 또는 트리플루오로메틸을 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드가 매우 특히 바람직하다.

R<sup>1</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>가 각각 수소를 나타내고,

R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>이 서로 독립적으로 상기 정의된 바와 같은 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드가 매우 특히 바람직하다.

R<sup>1</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>가 각각 수소를 나타내고,

R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>이 서로 독립적으로 불소, 염소, 브롬, 메틸 또는 트리플루오로메틸을 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드가 매우 특히 바람직하다.

R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup> 및 R<sup>5</sup>가 각각 수소를 나타내고,

R<sup>2</sup> 및 R<sup>4</sup>가 서로 독립적으로 상기 정의된 바와 같은 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드가 매우 특히 바람직하다.

R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup> 및 R<sup>5</sup>가 각각 수소를 나타내고,

R<sup>2</sup> 및 R<sup>4</sup>가 서로 독립적으로 불소, 염소, 브롬, 메틸 또는 트리플루오로메틸을 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드가 매우 특히 바람직하다.

R<sup>6</sup>이 -COR<sup>7</sup>을 나타내고,

R<sup>7</sup>이 4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-2-일을 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드가 매우 특히 바람직하다.

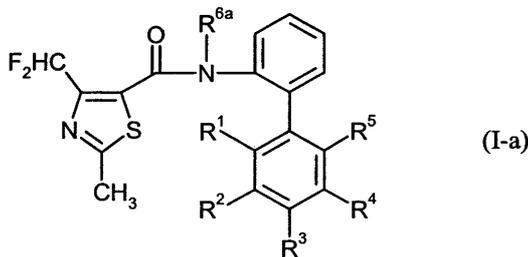
R<sup>6</sup>이 -COR<sup>7</sup>을 나타내고,

R<sup>7</sup>이 메틸, 에틸, 사이클로프로필 또는 트리플루오로메틸, 특히 메틸을 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드가 매우 특히 바람직하다.

R<sup>6</sup>이 -CHO를 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드가 매우 특히 바람직하다.

R<sup>6</sup>이 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸, 메틸설퍼닐, 메틸설포닐, 메톡시메틸, 에톡시에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로메틸설퍼닐, 트리플루오로메틸설퍼닐, 트리플루오로메틸설포닐, 트리플루오로메톡시메틸, 특히 메틸, 이소프로필 또는 사이클로프로필을 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드가 매우 특히 바람직하다.

바람직한 그룹은 하기 일반식 (I-a)의 티아졸릴비페닐아미드이다:



상기 식에서,

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>는 서로 독립적으로 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬설포닐 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 5개의 할로젠 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬티오 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설포닐을 나타내거나,

R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup> 또는 R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>은 함께, 임의로 할로젠- 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬-치환된 알케닐렌을 나타내고,

R<sup>6a</sup>는 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설퍼닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설포닐, 할로-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나, -COR<sup>7a</sup>, -CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> 또는 -CH<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>을 나타내며,

R<sup>7a</sup>는 수소 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나, 4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-2-일을 나타내고,

R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 서로 독립적으로 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-할로알킬, 할로-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나,

R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 할로젠 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환되고 5 내지 8개의 환 원자를 가지며 산소, 황 및 NR<sup>12</sup>로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2개의 추가의 비인접 헤테로 원자를 함유할 수 있는 포화 헤테로사이클을 형성하며,

R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 서로 독립적으로 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-할로알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나,

R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 할로젠 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환되고 5 내지 8개의 환 원자를 가지며 산소, 황 및 NR<sup>12</sup>로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2개의 추가의 비인접 헤테로 원자를 함유할 수 있는 포화 헤테로사이클을 형성하고,

R<sup>12</sup>는 수소 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬을 나타낸다.

일반식 (I-a)는 본 발명에 따른 티아졸릴비페닐아미드의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식에 언급된 치환체의 바람직한 정의가 하기에 주어진다.

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> 및 R<sup>12</sup>는 서로 독립적으로 바람직하게, 특히 바람직하게 및 매우 특히 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 각각 상기 바람직하거나, 특히 바람직하거나, 매우 특히 바람직한 것으로 언급된 의미를 갖는다.

R<sup>6a</sup>는 바람직하게는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬설피닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설피닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설피닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설포닐, 할로-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나, -COR<sup>7a</sup>, -CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> 또는 -CH<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>을 나타내며,

R<sup>7a</sup>는 바람직하게는 수소 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나, 4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-2-일을 나타낸다.

R<sup>6a</sup>는 특히 바람직하게는 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, n-, 이소, sec- 또는 t-부틸, 펜틸, 헥실, 메틸설피닐, 에틸설피닐, n- 또는 이소프로필설피닐, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸설피닐, 메틸설포닐, 에틸설포닐, n- 또는 이소프로필설포닐, n-, 이소, sec- 또는 t-부틸설포닐, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 에톡시메틸, 에톡시에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로에틸, 디플루오로클로로메틸설피닐, 디플루오로클로로메틸설포닐, 트리플루오로메틸설피닐, 트리플루오로메틸설포닐 또는 트리플루오로메톡시메틸을 나타내거나, -COR<sup>7a</sup>, -CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> 또는 -CH<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>을 나타내며,

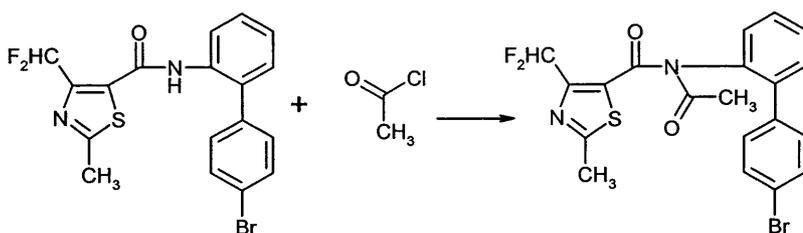
R<sup>7a</sup>는 특히 바람직하게는 수소, 사이클로프로필 또는 4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-2-일을 나타낸다.

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>가 모두 수소는 아닌 일반식 (I-a)의 티아졸릴비페닐아미드가 바람직하다.

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>가 상기 언급된 의미를 가지나, 할로젠은 아닌 일반식 (I-a)의 티아졸릴비페닐아미드가 바람직하다.

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>가 모두 수소는 아니고 또한 서로 독립적으로 할로젠을 나타내지 않는 일반식 (I-a)의 티아졸릴비페닐아미드가 바람직하다.

N-(4'-브로모-1,1'-비페닐-2-일)-4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-5-카복사미드 및 아세트릴 클로라이드를 출발물질로 사용하는 경우에, 본 발명에 따른 방법 (A)의 과정은 하기 반응식으로 나타내어질 수 있다:



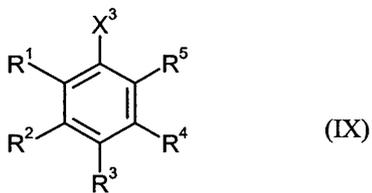
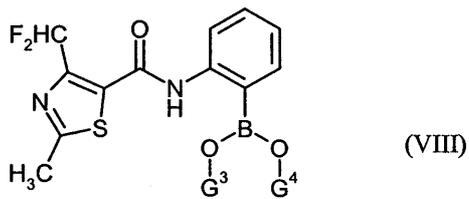
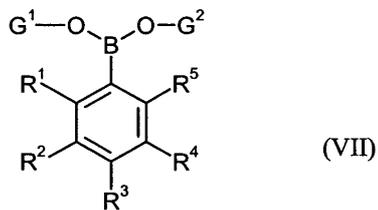
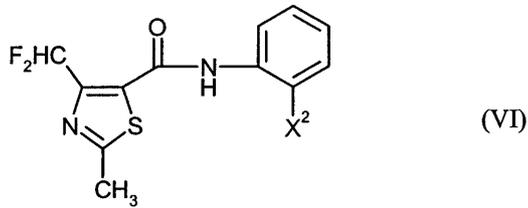
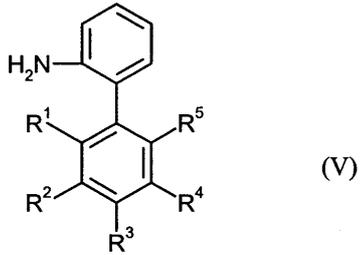
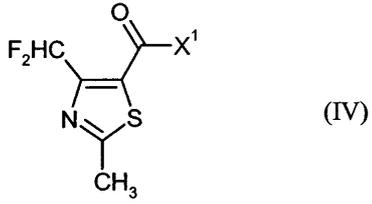
일반식 (II)는 본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는데 출발물질로 필요한 티아졸릴비페닐아미드의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식에서, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>는 바람직하게, 특히 바람직하게 및 매우 특히 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 각각 상기 바람직하거나, 특히 바람직하거나, 매우 특히 바람직한 것으로 언급된 의미를 갖는다.

일반식 (II)의 티아졸릴비페닐아미드는 DE-A 102 04 391에 기재되었다. 이들은

(a) 하기 일반식 (IV)의 디플루오로메틸티아졸릴카보닐 할라이드를, 경우에 따라 산 결합제(예: 트리에틸아민)의 존재하 및 경우에 따라 희석제(예: 테트라하이드로푸란)의 존재하에서 하기 아닐린 유도체와 반응시키거나,

(b) 하기 일반식 (VI)의 디플루오로메틸티아졸릴카복스할로아닐리드를 촉매(예: 1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센팔라듐(II) 클로라이드)의 존재하, 경우에 따라 산 결합제(예: 포타슘 아세테이트)의 존재하 및 경우에 따라 희석제(예: 디메틸설폭사이드)의 존재하에서 하기 일반식 (VII)의 보론산 유도체와 반응시키거나,

(c) 하기 일반식 (VIII)의 티아졸릴비페닐아미드 보론산 유도체를 축매(예: 1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센팔라듐(II) 클로라이드)의 존재하, 경우에 따라 산 결합제(예: 포타슘 아세테이트)의 존재하 및 경우에 따라 희석제(예: 디메틸설폭사이드)의 존재하에서 하기 일반식 (IX)의 할로벤젠 유도체와 반응시킴으로써 제조될 수 있다:



상기 식에서,

X<sup>1</sup>은 할로젠을 나타내며,

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>는 상기 정의된 바와 같고,

X<sup>2</sup>는 브롬 또는 요오드를 나타내며,

$G^1$  및  $G^2$ 는 각각 수소를 나타내거나, 함께, 테트라메틸렌을 나타내고,

$X^3$ 는 브롬, 요오드 또는 트리플루오로메틸설포닐옥시를 나타낸다.

일반식 (IV)는 본 발명에 따른 방법 (a)를 수행하는데 출발물질로 필요한 디플루오로메틸티아졸릴카보닐 할라이드의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식 (IV)에서,  $X^1$ 은 바람직하게는 염소를 나타낸다.

일반식 (IV)의 디플루오로메틸티아졸릴카보닐 할라이드는 공지되었고/되었거나, 공지된 방법으로 제조될 수 있다(참조예: EP 0 276 177).

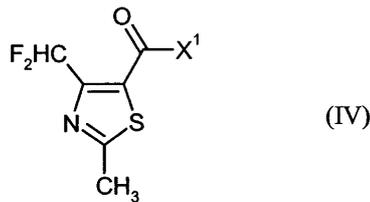
일반식 (V)는 본 발명에 따른 방법 (a)를 수행하는데 출발물질로 또한 필요한 아닐린의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식 (V)에서,  $R^1, R^2, R^3, R^4$  및  $R^5$ 는 바람직하게, 특히 바람직하게 및 매우 특히 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 각각 상기 바람직하거나, 특히 바람직하거나, 매우 특히 바람직한 것으로 언급된 의미를 갖는다.

일반식 (V)의 아닐린 유도체는 공지되었고/되었거나, 공지된 방법으로 제조될 수 있다(참조예: Bull. Korean Chem. Soc. 2000, 21, 165-166 ; Chem. Pharm. Bull. 1992, 40, 240-4; JP 09132567).

일반식 (VI)는 본 발명에 따른 방법 (b)를 수행하는데 출발물질로 필요한 디플루오로메틸티아졸릴카복스할로 아닐린의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식 (VI)에서,  $X^2$ 는 바람직하게는 브롬 또는 요오드를 나타낸다.

일반식 (VI)의 디플루오로메틸티아졸릴카복스할로 아닐린은

(d) 하기 일반식 (IV)의 디플루오로메틸티아졸릴카보닐 할라이드를 2-브로모아닐린 또는 2-요오도아닐린과 반응시켜 제조할 수 있다:



상기 식에서,

$X^1$ 은 할로젠을 나타낸다.

본 발명에 따른 방법 (d)를 수행하는데 출발물질로 필요한 일반식 (IV)의 디플루오로메틸티아졸릴카보닐 할라이드는 본 발명에 따른 방법 (a)와 관련하여 상기에 기술되었다.

본 발명에 따른 방법 (d)를 수행하는데 출발물질로 필요한 화합물 2-브로모아닐린 또는 2-요오도아닐린은 합성을 위해 공지된 시약이다.

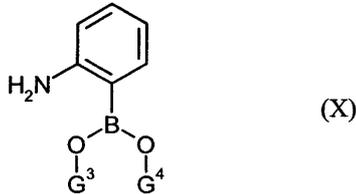
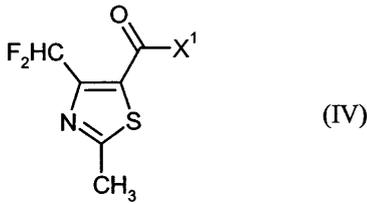
일반식 (VII)은 본 발명에 따른 방법 (b)를 수행하는데 출발물질로 필요한 보론산의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식 (VII)에서,  $R^1, R^2, R^3, R^4$  및  $R^5$ 는 바람직하게, 특히 바람직하게 및 매우 특히 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 각각 상기 바람직하거나, 특히 바람직하거나, 매우 특히 바람직한 것으로 언급된 의미를 갖는다.  $G^1$  및  $G^2$ 는 바람직하게는 각각 수소를 나타내거나, 함께, 테트라메틸에틸렌을 나타낸다.

일반식 (VII)의 보론산 유도체는 합성을 위해 공지된 시약이다. 이는 또한 반응 직전에 할로벤젠 유도체 및 보론산 에스테르로부터 직접 제조하여 후처리없이 추가로 반응시키는 것이 가능하다(참조: 제조 실시예).

일반식 (VIII)은 본 발명에 따른 방법 (c)를 수행하는데 출발물질로 필요한 티아졸릴비페닐아미드 보론산 유도체의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식 (VIII)에서,  $G^3$  및  $G^4$ 는 바람직하게는 각각 수소를 나타내거나, 함께, 테트라메틸에틸렌을 나타낸다.

일반식 (VIII)의 티아졸릴비페닐아미드 보론산 유도체는

(e) 하기 일반식 (IV)의 디플루오로메틸티아졸릴카보닐 할라이드를, 경우에 따라 산 결함체의 존재 및 경우에 따라 희석체의 존재하에서 하기 일반식 (X)의 아닐린보론산 유도체와 반응시킴으로써 제조될 수 있다:



상기 식에서,

X<sup>1</sup>은 할로젠을 나타내고,

G<sup>3</sup> 및 G<sup>4</sup>는 각각 상기 정의된 바와 같다.

본 발명에 따른 방법 (e)를 수행하는데 출발물질로 필요한 일반식 (IV)의 디플루오로메틸티아졸릴카보닐 할라이드는 본 발명에 따른 방법 (a)와 관련하여 상기에 기술되었다.

일반식 (X)는 본 발명에 따른 방법 (e)를 수행하는데 출발물질로 또한 필요한 아닐린보론산 유도체의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식 (X)에서, G<sup>3</sup> 및 G<sup>4</sup>는 바람직하게는 각각 수소를 나타내거나, 함께, 테트라메틸에틸렌을 나타낸다.

본 발명에 따른 방법 (e)를 수행하는데 출발물질로 필요한 일반식 (X)의 아닐린보론산 유도체는 합성을 위해 공지된 시약이다.

일반식 (IX)은 본 발명에 따른 방법 (c)를 수행하는데 출발물질로 필요한 할로벤젠 유도체의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식 (IX)에서, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>는 바람직하게, 특히 바람직하게 및 매우 특히 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 각각 상기 바람직하거나, 특히 바람직하거나, 매우 특히 바람직한 것으로 언급된 의미를 가진다. X<sup>3</sup>는 바람직하게는 브롬, 요오드 또는 트리플루오로메틸설포닐옥시를 나타낸다.

일반식 (III)은 본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는데 출발물질로 또한 필요한 할라이드의 일반 정의를 제공한다. 이 일반식에서, R<sup>6</sup>은 바람직하게, 특히 바람직하게 및 매우 특히 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이 래디칼에 대해 각각 상기 바람직하거나, 특히 바람직하거나, 매우 특히 바람직한 것으로 언급된 의미를 가진다. X는 바람직하게는 염소 또는 브롬을 나타낸다.

일반식 (III)의 할라이드는 합성을 위해 공지된 시약이다.

본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는데 적합한 희석제는 모든 불활성 유기 용매이다. 이들에는 바람직하게는 지방족, 지환식 또는 방향족 탄화수소, 예를 들어, 석유 에테르, 헥산, 헵탄, 사이클로헥산, 메틸사이클로헥산, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 데칼린; 할로젠화 탄화수소, 예를 들어, 클로로벤젠, 디클로로벤젠, 디클로로메탄, 클로로포름, 사염화탄소, 디클로로에탄 또는 트리클로로에탄; 에테르, 예를 들어, 디에틸 에테르, 디이소프로필 에테르, 메틸 t-부틸 에테르, 메틸 t-아밀 에테르, 디옥산, 테트라하이드로푸란, 1,2-디메톡시에탄, 1,2-디에톡시에탄 또는 아니솔; 아마이드, 예를 들어, N,N-디메틸포름아미드, N,N-디메틸아세트아미드, N-메틸포름아닐리드, N-메틸피롤리돈 또는 헥사메틸포스포릭 트리아미드가 포함된다.

본 발명에 따른 방법 (A)는 경우에 따라 적합한 산 수용체의 존재하에 수행된다. 적합한 산 수용체는 통상의 모든 무기 또는 유기 염기이다. 이들에는 바람직하게 알칼리 토금속 또는 알칼리 금속 하이드라이드, 하이드록사이드, 아마이드, 알콕사이드, 아세테이트, 카보네이트 또는 바이카보네이트, 예를 들어, 수소화나트륨, 소듐 아마이드, 소듐 메톡사이드, 소듐 에톡사이드, 포타슘 t-부톡사이드, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화암모늄, 소듐 아세테이트, 포타슘 아세테이트, 칼슘 아세테이트, 암모늄 아세테이트, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 중탄산칼륨, 중탄산나트륨, 탄산세슘 및 또한 삼급 아민, 예를 들어, 트리메틸아민, 트리에틸아민, 트리부틸아민, N,N-디메틸아닐린, N,N-디메틸벤질아민, 피리딘, N-메틸피페리딘, N-메틸모르폴린, N,N-디메틸아미노피리딘, 디아자비사이클로옥탄(DABCO), 디아자비사이클로노넨(DBN) 또는 디아자비사이클로운데센(DBU)이 포함된다.

본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는 경우, 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 이 방법은 0 내지 150 °C, 바람직하게는 20 내지 110 °C 의 온도에서 수행된다.

일반식 (I)의 화합물을 제조하는 본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는 경우, 일반식 (II)의 티아졸릴비페닐아미드 1 몰당 일반적으로 0.2 내지 5 몰, 바람직하게는 0.5 내지 2 몰의 일반식 (III)의 할라이드가 사용된다.

본 발명에 따른 방법 (a), (d) 및 (e)를 수행하는데 적합한 희석제는 모든 불활성 유기 용매이다. 이들에는 바람직하게는 지방족, 지환식 또는 방향족 탄화수소, 예를 들어, 석유 에테르, 헥산, 헵탄, 사이클로헥산, 메틸사이클로헥산, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 데칼린; 할로겐화 탄화수소, 예를 들어, 클로로벤젠, 디클로로벤젠, 디클로로메탄, 클로로포름, 사염화탄소, 디클로로에탄 또는 트리클로로에탄; 에테르, 예를 들어, 디에틸 에테르, 디이소프로필 에테르, 메틸 t-부틸 에테르, 메틸 t-아밀 에테르, 디옥산, 테트라하이드로푸란, 1,2-디메톡시에탄, 1,2-디에톡시에탄 또는 아니솔; 아미드, 예를 들어 N,N-디메틸포름아미드, N,N-디메틸아세트아미드, N-메틸포름아닐리드, N-메틸피롤리돈 또는 헥사메틸포스포릭 트리 아미드가 포함된다.

본 발명에 따른 방법 (a), (d) 및 (e)는 경우에 따라 적합한 산 수용체의 존재하에 수행된다. 적합한 산 수용체는 통상의 모든 무기 또는 유기 염기이다. 이들에는 바람직하게 알칼리 토금속 또는 알칼리 금속 하이드라이드, 하이드록사이드, 아미드, 알콕사이드, 아세테이트, 카보네이트 또는 바이카보네이트, 예를 들어 수산화나트륨, 소듐 아미드, 소듐 메톡사이드, 소듐 에톡사이드, 포타슘 t-부톡사이드, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화암모늄, 소듐 아세테이트, 포타슘 아세테이트, 칼슘 아세테이트, 암모늄 아세테이트, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 중탄산칼륨, 중탄산나트륨, 탄산세슘 및 또한 삼급 아민, 예를 들어 트리메틸아민, 트리에틸아민, 트리부틸아민, N,N-디메틸아닐린, N,N-디메틸벤질아민, 피리딘, N-메틸피페리딘, N-메틸모르폴린, N,N-디메틸아미노피리딘, 디아자비사이클로옥탄(DABCO), 디아자비사이클로노넨(DBN) 또는 디아자 비사이클로운데센(DBU)이 포함된다.

본 발명에 따른 방법 (a), (d) 및 (e)를 수행하는 경우, 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 이들 방법은 0 내지 150 °C, 바람직하게는 20 내지 110 °C 의 온도에서 수행된다.

일반식 (II)의 화합물을 제조하는 본 발명에 따른 방법 (a)를 수행하는 경우, 일반식 (IV)의 디플루오로메틸티아졸릴카보닐 할라이드 1 몰당 일반적으로 0.2 내지 5 몰, 바람직하게는 0.5 내지 2 몰의 일반식 (V)의 아닐린 유도체가 사용된다.

일반식 (V)의 화합물을 제조하는 본 발명에 따른 방법 (d)를 수행하는 경우, 일반식 (IV)의 디플루오로메틸티아졸릴카보닐 할라이드 1 몰당 일반적으로 0.2 내지 5 몰, 바람직하게는 0.5 내지 2 몰의 2-브로모아닐린 또는 2-요오도아닐린이 사용된다.

일반식 (VIII)의 화합물을 제조하는 본 발명에 따른 방법 (e)를 수행하는 경우, 일반식 (IV)의 디플루오로메틸티아졸릴카보닐 할라이드 1 몰당 일반적으로 0.2 내지 5 몰, 바람직하게는 0.5 내지 2 몰의 일반식 (X)의 아닐린 보론산 유도체가 사용된다.

본 발명에 따른 방법 (b) 및 (c)를 수행하는데 적합한 희석제는 모든 불활성 유기 용매이다. 이들에는 바람직하게는 지방족, 지환식 또는 방향족 탄화수소, 예를 들어 석유 에테르, 헥산, 헵탄, 사이클로헥산, 메틸사이클로헥산, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 데칼린; 에테르, 예를 들어 디에틸 에테르, 디이소프로필 에테르, 메틸 t-부틸 에테르, 메틸 t-아밀 에테르, 디옥산, 테트라하이드로푸란, 1,2-디메톡시에탄, 1,2-디에톡시에탄 또는 아니솔; 니트릴, 예를 들어 아세트니트릴, 프로피오니트릴, n- 또는 i-부티로니트릴 또는 벤조니트릴; 아미드, 예를 들어 N,N-디메틸포름아미드, N,N-디메틸아세트아미드, N-메틸포름아닐리드, N-메틸피롤리돈 또는 헥사메틸포스포릭 트리 아미드; 에스테르, 예를 들어 메틸 아세테이트 또는 에틸 아세테이트; 설폰사이드, 예를 들어 디메틸 설폰사이드; 또는 설펜, 예를 들어 설펜란, 알콜, 예를 들어 메탄올, 에탄올, n- 또는 i-프로판올, n-, i-, sec 또는 t-부탄올, 에탄디올, 프로판-1,2-디올, 에톡시에탄올, 메톡시에탄올, 디에틸렌 글리콜 모노메틸 에테르, 디에틸렌 글리콜 모노에틸 에테르, 이들과 물의 혼합물 또는 순수한 물이 포함된다.

본 발명에 따른 방법 방법 (b) 및 (c)를 수행하는 경우, 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 이들 방법은 0 내지 150 °C, 바람직하게는 20 내지 110 °C 의 온도에서 수행된다.

본 발명에 따른 방법 방법 (b) 및 (c)는 경우에 따라 적합한 산 수용체의 존재하에 수행된다. 적합한 산 수용체는 통상의 모든 무기 또는 유기 염기이다. 이들에는 바람직하게 알칼리 토금속 또는 알칼리 금속 하이드라이드, 하이드록사이드, 아미드, 알콕사이드, 아세테이트, 플루오라이드, 포스페이트, 카보네이트 또는 바이카보네이트, 예를 들어 수산화나트륨, 소듐 아미드, 리튬 디이소프로필아미드, 소듐 메톡사이드, 소듐 에톡사이드, 포타슘 t-부톡사이드, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 소듐 아세테이트, 인산나트륨, 인산칼륨, 불화칼륨, 불화세슘, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 중탄산칼륨, 중탄산나트륨, 탄산세슘 및 또한 삼급 아민, 예를 들어 트리메틸아민, 트리에틸아민, 트리부틸아민, N,N-디메틸아닐린, N,N-디메틸벤질아민, 피리딘, N-메틸피페리딘, N-메틸모르폴린, N,N-디메틸아미노피리딘, 디아자비사이클로옥탄(DABCO), 디아자비사이클로노넨(DBN) 또는 디아자비사이클로운데센(DBU)이 포함된다.

본 발명에 따른 방법 방법 (b) 및 (c)는 촉매, 예를 들어 팔라듐 염 또는 착물의 존재하에 수행된다. 이들은 바람직하게는 염화팔라듐, 팔라듐 아세테이트, 테트라키스(트리페닐포스핀)팔라듐, 비스(트리페닐포스핀)팔라듐 디클로라이드 또는 1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센팔라듐(II) 클로라이드이다.

반응물에 팔라듐 염 및 착 리간드, 예를 들어 트리에틸포스핀, 트리-t-부틸포스핀, 트리아이클로헥실포스핀, 2-(디사이클로헥실포스핀)비페닐, 2-(디-t-부틸포스핀)비페닐, 2-(디사이클로헥실포스핀)-2'-(N,N-디메틸아미노)비페닐, 트리페닐포스핀, 트리스(o-톨릴)포스핀, 소듐-3-(디페닐포스피노)벤젠설포네이트, 트리스-2-(메톡시페닐)포스핀, 2,2'-비스-(디페닐포스핀)-1,1'-비나프틸, 1,4-비스-(디페닐포스핀)부탄, 1,2-비스-(디페닐포스핀)에탄, 1,4-비스-(디사이클로헥실포스핀)부탄, 1,2-비스-(디사이클로헥실포스핀)에탄, 2-(디사이클로헥실포스핀)-2'-(N,N-디메틸아미노)비페닐, 비스(페닐포스피노)페로센 또는 트리스-(2,4-t-부틸페닐)포스파이트를 별도로 가하여 반응 혼합물에서 팔라듐 착물을 생성시키는 것이 또한 가능하다.

일반식 (II)의 화합물을 제조하는 본 발명에 따른 방법 (b)를 수행하는 경우, 일반식 (VI)의 디플루오로메틸티아졸릴카복스할로 아닐리드 1 몰당 일반적으로 1 내지 15 몰, 바람직하게는 2 내지 8 몰의 일반식 (VII)의 보론산 유도체가 사용된다.

일반식 (II)의 화합물을 제조하는 본 발명에 따른 방법 (c)를 수행하는 경우, 일반식 (VIII)의 티아졸릴비페닐아미드 보론산 유도체 1 몰당 일반적으로 1 내지 15 몰, 바람직하게는 2 내지 8 몰의 일반식 (IX)의 할로벤젠 유도체가 사용된다.

본 발명에 따른 방법 (A), (a), (b), (c) 및 (d)는 일반적으로 대기압하에 수행된다. 그러나, 각 경우 승압 또는 감압하에 - 일반적으로 0.1 내지 10 바하에서도 수행될 수 있다.

본 발명에 따른 화합물은 강력한 살미생물 활성을 나타내며, 작물 보호 및 재료 보호시 원치않는 미생물, 예를 들어 진균 및 박테리아를 구제하기 위해 사용될 수 있다.

살진균제는 작물 보호에 있어서 플라스모디오포로마이세테스 (*Plasmodiophoromycetes*), 오오마이세테스 (*Oomycetes*), 키트리디오마이세테스 (*Chytridiomycetes*), 지고마이세테스 (*Zygomycetes*), 아스코마이세테스 (*Ascomycetes*), 바시디오마이세테스 (*Basidiomycetes*) 및 듀테로마이세테스 (*Deuteromycetes*)를 구제하기 위해 사용될 수 있다.

살균제는 작물 보호에 있어서 슈도모노아다세아 (*Pseudomonadaceae*), 리조비아세아 (*Rhizobiaceae*), 엔테로박테리아세아 (*Enterobacteriaceae*), 코리네박테리아세아 (*Corynebacteriaceae*) 및 스트렙토마이세타세아 (*Streptomycetaceae*)를 구제하기 위해 사용될 수 있다.

상기 속명의 진균 및 박테리아 질병을 야기하는 몇가지 병원균의 예를 하기에 언급하지만, 이에 한정되지는 않는다:

크산토모나스 (*Xanthomonas*)종, 예를 들어 크산토모나스 캄페스트리스 피브이. 오리자에 (*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*);

슈도모나스 (*Pseudomonas*)종, 예를 들어 슈도모나스 시링가에 피브이. 라크리만스 (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*);

에르위니아 (*Erwinia*)종, 예를 들어 에르위니아 아밀로보라 (*Erwinia amylovora*);

피티움 (*Pythium*)종, 예를 들어 피티움 울티뮴 (*Pythium ultimum*);

피토프토라 (*Phytophthora*)종, 예를 들어 피토프토라 인페스탄스 (*Phytophthora infestans*);

슈도페로노스포라 (*Pseudoperonospora*)종, 예를 들어 슈도페로노스포라 후물리 (*Pseudoperonospora humuli*) 또는 슈도페로노스포라 쿠벤시스 (*Pseudoperonospora cubensis*);

플라스모파라 (*Plasmopara*)종, 예를 들어 플라스모파라 비티콜라 (*Plasmopara viticola*);

브레미아 (*Bremia*)종, 예를 들어 브레미아 락투카에 (*Bremia lactucae*)

페로노스포라 (*Peronospora*)종, 예를 들어 페로노스포라 피시 (*Peronospora pisi*) 또는 페로노스포라 브라시카에 (*Peronospora brassicae*);

에리시페 (*Erysiphe*)종, 예를 들어 에리시페 그라미니스 (*Erysiphe graminis*);

스파에로테카 (*Sphaerotheca*)종, 예를 들어 스파에로테카 풀리기니아 (*Sphaerotheca fuliginea*);

포도스파에라 (*Podosphaera*)종, 예를 들어 포도스파에라 류코트리차 (*Podosphaera leucotricha*);

벤투리아 (*Venturia*)종, 예를 들어 벤투리아 이내쿠알리스 (*Venturia inaequalis*);

피레노포라 (*Pyrenophora*)종, 예를 들어 피레노포라 테레스 (*Pyrenophora teres*) 또는 피레노포라 그라미니아 (*Pyrenophora graminea*) (분생자 형태: 드레쉬슬레라 (*Drechslera*), 동형: 헬민토스포리움 (*Helminthosporium*));

코클리오볼루스 (*Cochliobolus*)종, 예를 들어 코클리오볼루스 사티부스 (*Cochliobolus sativus*) (분생자 형태: 드레쉬슬레라, 동형: 헬민토스포리움);

우로마이세스 (*Uromyces*)종, 예를 들어 우로마이세스 아펜디쿨라투스 (*Uromyces appendiculatus*);

푸키니아 (*Puccinia*)종, 예를 들어 푸키니아 레콘디타 (*Puccinia recondita*);

스클레로티니아 (*Sclerotinia*)종, 예를 들어 스킴레로티니아 스킴레로티오룸 (*Sclerotinia sclerotiorum*);

틸레티아(*Tilletia*)종, 예를 들어 틸레티아 카리에스(*Tilletia caries*);

우스틸라고(*Ustilago*)종, 예를 들어 우스틸라고 누다(*Ustilago nuda*) 또는 우스틸라고 아베나에(*Ustilago avenae*);

펠리쿨라리아(*Pellicularia*)종, 예를 들어 펠리쿨라리아 사사키이 (*Pellicularia sasakii*);

피리쿨라리아(*Pyricularia*)종, 예를 들어 피리쿨라리아 오리자에 (*Pyricularia oryzae*);

푸사리움(*Fusarium*)종, 예를 들어 푸사리움 쿨모룸(*Fusarium culmorum*);

보트리티스(*Botrytis*)종, 예를 들어 보트리티스 시네레아(*Botrytis cinerea*);

셉토리아(*Septoria*)종, 예를 들어 셉토리아 노도룸(*Septoria nodorum*);

렙토스페리아(*Leptosphaeria*)종, 예를 들어 렙토스페리아 노도룸 (*Leptosphaeria nodorum*);

세르코스포라(*Cercospora*)종, 예를 들어 세르코스포라 카네센스(*Cercospora canescens*);

알테르나리아(*Alternaria*)종, 예를 들어 알테르나리아 브라시카에 (*Alternaria brassica*) 및

슈도세르코스포렐라(*Pseudocercospora*)종, 예를 들어 슈도세르코스포렐라 헤르포트리코이데스 (*Pseudocercospora herpotrichoides*).

본 발명에 따른 활성 화합물은 또한 식물에서 매우 강력한 강화 작용을 나타낸다. 따라서, 이들은 원치않는 미생물에 의한 침습에 대해 식물의 내부 방어력을 부여하기 위해 사용될 수 있다.

여기에서, 식물 강화(저항성-유도) 화합물이란 처리 식물에 원치않는 미생물을 접종하였을 때 식물에 이들 미생물에 대해 상당한 저항성이 생기도록 식물의 방어 시스템을 유도할 수 있는 물질을 의미하는 것으로 이해되어야 한다.

이 경우, 원치않는 미생물이란 식물병원성 진균, 박테리아 및 바이러스를 의미하는 것으로 이해되어야 한다. 따라서, 본 발명에 따른 물질은 식물을 처리 후 특정 기간동안 상기 언급된 병원균에 의한 감염으로부터 보호하기 위해 사용될 수 있다. 식물을 활성 화합물로 처리한 후로부터 보호 기간은 일반적으로 1 내지 10일, 바람직하게는 1 내지 7일간이다.

식물 질병을 구제하는데 필요한 농도에서 식물이 활성 화합물에 대해 내약성을 갖기 때문에 식물의 지상부, 번식 줄기 및 종자, 및 토양 처리가 가능하다.

본 발명에 따른 활성 화합물은 포도나무 질병과 과수 및 채소 경작시 나타나는 질병, 예를 들어 벤틀리아(*Venturia*), 보트리티스(*Botrytis*), 스크렐로티니아 (*Sclerotinia*), 리조토니아(*Rhizoctonia*), 운시눌라(*Uncinula*), 스파에로테카(*Sphaerotheca*), 포도스파에라(*Podospaera*), 알테르나리아(*Alternaria*) 및 콜레토티리움(*Colletotrichum*) 종을 구제하는데 특히 우수한 결과를 나타낼 수 있다. 벼 질병, 예를 들어 피리쿨라리아(*Pyricularia*) 및 펠리쿨라리아(*Pellicularia*) 종도 마찬가지로 우수하게 구제될 수 있다.

본 발명에 따른 활성 화합물은 또한 작물 수확량을 증산시키기 위해 사용될 수 있다. 또한, 이들은 저독성이며, 식물에 대해 우수한 상용성을 나타낸다.

경우에 따라, 본 발명에 따른 활성 화합물은 또한, 특정 농도 및 적용 비율에서 제초제로서, 식물 성장을 조절하거나, 동물 해충을 구제하기 위해 사용될 수 있다. 경우에 따라, 이들은 또한 다른 활성 화합물을 합성하기 위한 중간체 또는 전구체로도 사용될 수 있다.

본 발명에 따라, 모든 식물 및 식물의 일부가 처리될 수 있다. 여기에서 식물이란 원하거나 원치않는 야생 식물 또는 작물(자연 발생 작물 포함)과 같은 모든 식물 및 식물 개체군을 의미한다. 작물은 식물 육종가의 보증으로 보호될 수 있거나 보호될 수 없는 식물 품종 및 형질전환(transgenic) 식물을 포함하여, 통상적인 식물 육종 및 최적화 방법에 의해, 생명공학 및 유전자공학 방법에 의해 또는 이들 방법을 조합하여 얻을 수 있는 식물일 수 있다. 식물의 일부는 식물의 모든 지상 및 지하 부분 및 기관, 예를 들어 싹, 잎, 꽃 및 뿌리를 의미하는 것으로 이해되어야 하며, 이들의 예로 잎, 침엽(needles), 줄기(stem), 자루(trunk), 꽃, 과실체, 과일, 종자, 뿌리, 괴경 및 뿌리 줄기가 언급될 수 있다. 식물의 일부는 또한 수확 식물 및 영양 및 생식 번식 물질, 예를 들어 묘목, 괴경, 뿌리 줄기, 삼목 및 종자를 포함한다.

본 발명에 따라 활성 화합물로 식물 및 식물의 일부를 처리하는 것은 통상의 처리 방법에 의해, 예를 들어 침지, 분무, 증발, 분사, 살포, 도포, 주입에 의해서 및, 전과 물질, 특히 종자의 경우에는 또한 일 또는 다중 코팅을 적용하여 직접, 또는 화합물을 환경, 서식지 또는 저장 공간에 작용시킴으로써 수행된다.

본 발명에 따른 화합물은 재료를 보호하는데 있어 공업용 물질이 원치 않는 미생물에 의해 침습 및 파괴되는 것으로부터 보호하는데 사용될 수 있다.

본 명세서에서 공업용 물질은 산업적 용도로 제조된 무생 물질을 의미하는 것으로 이해되어야 한다. 예를 들어, 미생물에 의한 변화 또는 파괴로부터 본 발명에 따른 활성 화합물에 의해 보호받고자 하는 공업용 물질은 접착제, 사이즈(size), 종이, 합판, 직물, 가죽, 목재, 페인트, 플라스틱 제품, 냉각 윤활제 및 미생물에 의해 침습되거나 파괴될 수 있는 기타 물질일 수 있다. 보호되는 물질의 범위내에 포함되는 것으로는 또한 미생물의 증식에 의해 불리하게 영향 받을 수 있는 생산 설비의 일부, 예를 들어 냉각수 회로가 언급될 수 있다. 본 발명의 범주내에서 언급될 수 있는 공업용 물질은 바람직하게는 접착제, 사이즈, 종이, 합판, 가죽, 목재, 페인트, 냉각 윤활제 및 열전달 유체, 특히 바람직하게는 목재이다.

공업용 물질을 분해 또는 변화시킬 수 있는 미생물로는 예를 들어, 박테리아, 진균, 이스트, 조류(algae) 및 변형(slime) 유기체가 언급될 수 있다. 본 발명에 따른 활성 화합물은 바람직하게는 진균, 특히 사상균, 목재 변색 및 목재 파괴 진균(바시디오마이세테스) 및 변형 유기체 및 조류에 작용한다.

하기 속의 미생물이 예로 언급될 수 있다:

알터나리아(*Alternaria*), 예를 들어 알터나리아 테누이스(*Alternaria tenuis*)

아스퍼길루스(*Aspergillus*), 예를 들어 아스퍼길루스 니거(*Aspergillus niger*)

캐토미움(*Chaetomium*), 예를 들어 캐토미움 글로보숨(*Chaetomium globosum*),

코니오포라(*Coniophora*), 예를 들어 코니오포라 푸에타나(*Coniophora puetana*),

렌티누스(*Lentinus*), 예를 들어 렌티누스 티그리누스(*Lentinus tigrinus*),

페니실리움(*Penicillium*), 예를 들어 페니실리움 글라우쿰(*Penicillium glaucum*),

폴리포루스(*Polyporus*), 예를 들어, 폴리포루스 버시컬러(*Polyporus versicolor*),

아우레오바시디움(*Aureobasidium*), 예를 들어 아우레오바시디움 풀루란스 (*Aureobasidium pullulans*),

스클레오포마(*Sclerophoma*), 예를 들어 스킨레오포마 피타이오피라 (*Sclerophoma pityophila*),

트리코더마(*Trichoderma*), 예를 들어 트리코더마 비리데(*Trichoderma viride*),

에스케리키아(*Escherichia*), 예를 들어 에스케리키아 콜리(*Escherichia coli*),

슈도모나스(*Pseudomonas*), 예를 들어 슈도모나스 아에루기노사(*Pseudomonas aeruginosa*) 및

스타필로코쿠스(*Staphylococcus*), 예를 들어 스타필로코쿠스 아우레우스 (*Staphylococcus aureus*).

활성 화합물은 그의 특별한 물리적 및/또는 화학적 성질에 따라 용액제, 유제, 현탁제, 산제, 폼제, 페이스트, 과립제, 에어로졸, 및 중합물질 및 중작용 코팅 조성물중의 극미세 캡셀제와 같은 통상의 제제 및 ULV 냉무제 및 온무제로 전환시킬 수 있다.

이들 제제는 공지된 방법으로, 예를 들어, 임의로 계면활성제, 즉 유화제 및/또는 분산제 및/또는 폼 형성제를 사용하여 활성 화합물을 증량제, 즉 액상 용매, 가압 액화가스 및/또는 고형 담체와 혼합하여 제조한다. 사용된 증량제가 물인 경우에는, 유기용매가 또한 보조 용매로 사용될 수 있다. 적합한 액상 용매는, 주로 크실렌, 톨루엔 또는 알킬나프탈렌과 같은 방향족 화합물; 클로로벤젠, 클로로에틸렌 또는 메틸렌 클로라이드와 같은 염소화 방향족 또는 염소화 지방족 탄화수소; 사이클로헥산 또는 파라핀, 예를 들어, 석유 분획과 같은 지방족 탄화수소; 부탄올 또는 클리콜과 같은 알콜 및 그들의 에테르 및 에스테르; 아세톤, 메틸 에틸 케톤, 메틸 이소부틸 케톤 또는 사이클로헥사논과 같은 케톤; 디메틸포름아미드 또는 디메틸설폭사이드와 같은 강한 극성 용매, 또는 물이다. 액화가스 증량제 또는 담체란 표준 온도 및 대기압하에서 가스 상태인 액체를 의미하며, 예를 들어 할로젠화 탄화수소 또는 부탄, 프로판, 질소 및 이산화탄소와 같은 에어로졸 추진제이다. 적합한 고형 담체는 예를 들어 카올린, 점토, 활석, 백악, 석영, 아타펄리트, 몬모릴로나이트 또는 규조토와 같은 분쇄된 천연 광물, 및 미분 실리카, 알루미늄 및 실리케이트와 같은 분쇄된 합성 광물이다. 적합한 과립제용 고형 담체는 예를 들어 방해석, 대리석, 경석, 해포석 및 백운석과 같은 분쇄 및 분류된 천연 암석, 또는 무기 및 유기가루의 합성과립, 및 톱밥, 코코넛 껍질, 옥수수 속대 및 담배줄기와 같은 유기물질의 과립이다. 적합한 유화제 및/또는 폼 형성제는 예를 들어 비이온성 및 음이온성 유화제, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 지방산 에스테르, 알킬아릴 폴리글리콜 에테르와 같은 폴리옥시에틸렌 지방 알콜 에테르, 알킬설포네이트, 알킬설페이트, 아릴설포네이트 또는 단백질 가수분해물이다. 적합한 분산제는 예를 들어 리그노설파이트 폐액 및 메틸셀룰로오즈이다.

접착제, 예를 들어 카복시메틸셀룰로오즈, 및 아라비아고무, 폴리비닐 알콜 및 폴리비닐 아세테이트와 같은 분말, 과립 또는 라텍스 형태의 천연 및 합성 중합체, 또는 세팔린 및 레시틴과 같은 천연 인지질 및 합성 인지질이 제제에 사용될 수 있다. 그외의 가능한 첨가제는 광유 및 식물유이다.

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

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

본 발명에 따른 활성 화합물은 그 자체로, 또는 그의 제제중에서 활성 스펙트럼을 넓히거나 내성이 생기는 것을 방지하기 위하여 공지된 살진균제, 살균제, 살비제, 살선충제 또는 살충제와의 혼합물로서 사용될 수 있다. 많은 경우, 상승 효과가 얻어지며, 즉 혼합물의 활성은 개별 성분들의 활성보다 크다.

적합한 혼합 성분에는 예를 들어 다음과 같은 화합물이 있다:

**살진균제:**

2-페닐페놀, 8-하이드록시퀴놀린 설페이트,

아시벤졸라-S-메틸, 알디모르프, 아미도플루메트, 암프로필포스, 암프로필포스-포타슘, 안도프림, 아닐라진, 아자코나졸, 아족시스트로빈,

베날락실, 베노다닐, 베노밀, 벤티아발리카브-이소프로필, 벤자마크릴, 벤자마크릴-이소부틸, 빌라나포스, 비나파크릴, 비페닐, 비터탄올, 블라스티시딘-S, 브로무코나졸, 부피리메이트, 부티오베이트, 부틸아민,

칼슘 폴리설파이드, 캅시마이신, 캅타폴, 캅탄, 카벤다짐, 카복신, 카프로파미드, 카르본, 퀴노메티오네이트, 클로벤티아존, 클로르페나졸, 클로로네브, 클로로탈로닐, 클로졸리네이트, 클로질라곤, 사이아조파미드, 사이플루페나미드, 사이복사닐, 사이프로코나졸, 사이프로디닐, 사이프로푸람,

Dagger G, 데바카브, 디클로플루아니드, 디클론, 디클로로펜, 디클로사이메트, 디클로메진, 디클로란, 디에토펜카브, 디페노코나졸, 디플루메토림, 디메티리몰, 디메토모르프, 디목시스트로빈, 디니코나졸, 디니코나졸-M, 디노갑, 디페닐아민, 디피리티온, 디탈립포스, 디티아논, 도단, 드라족솔론,

에디펜포스, 에폭시코나졸, 에타복삼, 에티리몰, 에트리디아졸,

파목사돈, 페나미돈, 페나파닐, 페나리몰, 펜부코나졸, 펜푸람, 펜헥사미드, 페니트로판, 페녹사닐, 펜피클로닐, 펜프로피딘, 펜프로피모르프, 페르밤, 플루아지남, 플루벤지민, 플루디옥소닐, 플루메토버, 플루모르프, 플루오로미드, 플루옥사스트로빈, 플루퀸코나졸, 플루프리미돌, 플루실라졸, 플루설파미드, 플루톨라닐, 플루트리아폴, 폴렛, 포세틸-알루미늄, 포세틸-소듐, 푸베리다졸, 푸랄락실, 푸라메트피르, 푸르카바닐, 푸르메사이클록스,

구아자틴,

헥사클로로벤젠, 헥사코나졸, 하이멕사졸,

이마잘릴, 이미벤코나졸, 이미녹타딘 트리아세테이트, 이미녹타딘 트리스(알베실레이트), 요오도카브, 이프로코나졸, 이프로벤포스, 이프로디온, 이프로발리카브, 이루마마이신, 이소프로티올란, 이소발레디온,

카수가마이신, 크레속심-메틸,

만코제브, 마네브, 메페림존, 메파니피림, 메프로닐, 메탈락실, 메탈락실-M, 메트코나졸, 메타설포카브, 메트푸록삼, 메티람, 메토미노스트로빈, 메트설포박스, 밀디오마이신, 마이클로부타닐, 마이클로졸린,

나타마이신, 니코비펜, 니트로탈-이소프로필, 노비플루무론, 누아리몰,

오프라스, 오리사스트로빈, 옥사덕실, 옥솔린산, 옥스포코나졸, 옥시카복신, 옥시펜티인,

파클로부트라졸, 페푸라조에이트, 펜코나졸, 펜시쿠론, 포스디펜, 프탈리드, 피콕시스트로빈, 피페랄린, 폴리옥신, 폴리옥소림, 프로베나졸, 프로클로라즈, 프로사이미돈, 프로파모카브, 프로파노신-소듐, 프로피코나졸, 프로피네브, 프로퀴나지드, 프로티오코나졸, 피라클로스트로빈, 피라조포스, 피리페녹스, 피리메타닐, 피로퀼론, 피록시푸르, 피롤니트린,

퀸코나졸, 퀴녹시펜, 퀸토젠,

시메코나졸, 스피록사민, 황,

테부코나졸, 테클로프탈람, 테크나젠, 테트사이클라시스, 테트라코나졸, 티아벤다졸, 티사이오펜, 티플루자미드, 티오파네이트-메틸, 티람, 티옥시미드, 톨클로포스-메틸, 톨릴플루아니드, 트리아디메폰, 트리아디메몰, 트리아즈부틸, 트리아족사이드, 트리아이클라미드, 트리아이클라졸, 트리데모르프, 트리플록시스트로빈, 트리플루미졸, 트리포린, 트리티코나졸,

유니코나졸,

발리다마이신 A, 빈클로졸린,

지네브, 지람, 족사미드,

(2S)-N-[2-[4-[[3-(4-클로로페닐)-2-프로피닐]옥시]-3-메톡시페닐]에틸]-3-메틸-2-[(메틸설포닐)아미노]부탄아미드,

1-(1-나프탈레닐)-1H-피롤-2,5-디온,

2,3,5,6-테트라클로로-4-(메틸설포닐)피리딘,

2-아미노-4-메틸-N-페닐-5-티아졸카복사미드,

2-클로로-N-(2,3-디하이드로-1,1,3-트리메틸-1H-인덴-4-일)-3-피리딘카복사미드,

3,4,5-트리클로로-2,6-피리딘디카보니트릴,

액티노베이트,

시스-1-(4-클로로페닐)-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)사이클로헥탄올,

메틸 (2,3-디하이드로-2,2-디메틸-1H-인덴-1-일)-1H-이미다졸-5-카복실레이트,

탄산일칼륨,

N-(6-메톡시-3-피리디닐)사이클로프로판카복사미드,

N-부틸-8-(1,1-디메틸에틸)-1-옥사스포로[4.5]데칸-3-아민,

소듐 테트라티오카보네이트, 및

구리 염 및 제제, 예를 들어 보르도(Bordeaux) 혼합물, 수산화 구리, 구리 나프테네이트, 옥시염화구리, 황산구리, 쿠프라네브, 산화구리, 만코피, 옥신-구리.

**살균제:**

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

**살충제 / 살비제 / 살선충제:**

아바멕틴, ABG-9008, 아세페이트, 아세퀴노실, 아세트아미프리드, 아세토프롤, 아크리나트린, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, 알라니카브, 알디카브, 알독시카브, 알레트린, 알레트린 1R-이성체, 알파 사이피메트린(알파메트린), 아마도플루메트, 아미노카브, 아미트라즈, 아버멕틴, AZ 60541, 아자디라크틴, 아자메티포스, 아진포스 메틸, 아진포스 에틸, 아조사이클로틴,

바실러스 포필리아에, 바실러스 스파에리쿠스, 바실러스 서브틸리스, 바실러스 투링기엔시스, 바실러스 투링기엔시스 스트레인 EG-2348, 바실러스 투링기엔시스 스트레인 GC-91, 바실러스 투링기엔시스 스트레인 NCTC-11821, 바쿨로바이러세스, 뷰베리아 바시아나, 뷰베리아 테넬라, 벤클로티아즈, 벤디오카브, 벤푸라카브, 벤셀탑, 벤족시메이트, 베타-사이플루트린, 베타-사이피메트린, 비페나제이트, 비펜트린, 비나프크릴, 비오알레트린, 비오알레트린-S-사이클로펜틸-이성체, 비오에타노메트린, 비오피메트린, 비오레스메트린, 비스트리플루론, BPMC, 브로펜프록스, 브로모포스-에틸, 브로모프로필레이트, 브롬펜빈포스(-메틸), BTG-504, BTG-505, 부펜카브, 부프로페진, 부타티오포스, 부토카복심, 부톡시카복심, 부틸피리다벤,

카두사포스, 캄페클로르, 카바릴, 카보푸란, 카보페노티온, 카보셀판, 카탐, CGA-50439, 퀴노메티오네이트, 클로르단, 클로르디메포름, 클로에토카브, 클로르에톡시포스, 클로르페나피르, 클로르펜빈포스, 클로르플루아주론, 클로르메포스, 클로로벤질레이트, 클로로피크린, 클로르프록시펜, 클로르피리포스-메틸, 클로르피리포스(-에틸), 클로바프트린, 크로마페노자이드, 시스-사이피메트린, 시스-레스메트린, 시스-피메트린, 클로사이트린, 클로에토카브, 클로펜테진, 클로티아니딘, 클로티아조벤, 코들레몬, 쿠마포스, 시아노펜포스, 시아노포스, 사이클로프렌, 사이클로프로트린, 시디아포모넬라, 사이플루트린, 사이할로트린, 사이헥사틴, 사이피메트린, 사이페노트린(1R-트랜스 이성체), 사이로마진,

DDT, 델타메트린, 데메톤-S-메틸, 데메톤-S-메틸설포, 디아펜티우론, 디알리포스, 디아지논, 디클로펜티온, 디클로르보스, 디코폴, 디크로토포스, 디시클라닐, 디플루벤주론, 디메플루트린, 디메토에이트, 디메틸빈포스, 디노부톤, 디노캡, 디노테푸란, 디오페놀란, 디설포톤, 도쿠사트-소듐, 도페나파인, DOWCO-439,

에플루실라네이트, 에마멕틴, 에마멕틴-벤조에이트, 엠펜트린(1R-이성체), 엔도실판, 엔토모프로타 중(spp.), EPN, 에스펜발레레이트, 에티오펜카브, 에티프롤, 에티온, 에토프로포스, 에토펜프록스, 에톡사졸, 에트림포스,

팜푸르, 펜아미포스, 펜아자린, 산화 펜부타딘, 펜플루트린, 페니트로티온, 페노부카브, 페노티오카브, 페녹사크림, 페녹시카브, 펜프로파트린, 펜피라드, 펜피리트린, 펜피록시메이트, 펜셀포티온, 펜티온, 펜트리과닐, 펜발레레이트, 피프로닐, 플로니카미드, 플루아크리피림, 플루아주론, 플루벤지민, 플루브로사이트리네이트, 플루사이클록수론, 플루사이트리네이트, 플루페네림, 플루페녹수론, 플루펜프록스, 플루메트린, 플루피라조포스, 플루텐진(플루펜진), 플루발리네이트, 포노포스, 포르메타네이트, 포르모티온, 포스메틸란, 포스티아제이트, 푸브펜프록스(플루프록시펜), 푸라티오카브,

감마-HCH, 고시플루레, 글란들루레, 그라놀로시스 바이러스,

할펜프록스, 할로페노지드, HCH, HCN-801, 헵테노포스, 헥사플루무론, 헥시티아족스, 하이드라메틸논, 하이드로프렌,

IKA-2002, 이미다클로프리트, 이미프로트린, 인독사카브, 요오도펜포스, 이프로벤포스, 이사조포스, 이소펜포스, 이소프로카브, 이속사티온, 이버멕틴,

자포닐루레,

카데트린,

뉴클레아 폴리헤드로시스 바이러세스, 키노프렌,

람다 사이할로트린, 린단, 루페누론,

말라티온, 메카르밤, 메셀펜포스, 메트알데하이드, 메탐-소듐, 메타크리포스, 메트아미도포스, 메타리지움 아니소플리아에, 메타리지움 플라보비리데, 메티다티온, 메티오카브, 메토밀, 메토프렌, 메톡시클로르, 메톡시페노지드, 메토플루트린, 메톨카브, 메톡사디아존, 메빈포스, 밀베멕틴, 밀베마이신, MKI-245, MON-45700, 모노크로토프스, 목시택틴, MTI-800,

날레드, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, 니클로사미드, 니코틴, 니텐피람, 니티아진, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, 노발우론, 노비플루무론,

OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, 오메토에이트, 옥사밀, 옥시테메톤-메틸,

파에실로마이세스 푸모소로세우스, 파라티온-메틸, 파라티온(-에틸), 퍼메트린(시스-, 트랜스-), 페트롤류, PH-6045, 페노트린(1R-트랜스 이성체), 펜토에이트, 포레이트, 포살론, 포스메트, 포스파미돈, 포스포카브, 폭심, 피페로닐 부톡사이드, 피리미카브, 피리미포스-메틸, 피리미포스-에틸, 포타슘 올레에이트, 프랄레트린, 프로페노포스, 프로플루트린, 프로메카브, 프로파포스, 프로파기트, 프로페탐포스, 프로폭수르, 프로티오포스, 프로토에이트, 프로트리펜부트, 피메트로진, 피라클로포스, 피레스메트린, 피레트럼, 피리다벤, 피리달릴, 피리다퀘티온, 피리다티온, 피리미디펜, 피리프록시펜,

퀴날포스,

레스메트린, RH-5849, 리바비린, RU-12457, RU-15525,

S-421, S-1833, 살리티온, 세부포스, SI-0009, 실라플루오펜, 스피노사드, 스피로디클로펜, 스피로메시펜, 설플루라미드, 설포텡, 설프로포스, SZI-121,

타우-플루발리네이트, 테부페노지드, 테부펜피라드, 테부피리미포스, 테플루벤주론, 테플루트린, 테메포스, 테미빈포스, 테르밤, 테부포스, 테트라클로르빈포스, 테트라디폰, 테트라메트린, 테트라메트린(1R-이성체), 테트라설, 테타-사이피메트린, 티아클로프리트, 티아메톡삼, 티아프로닐, 티아트리포스, 티오시클람 하이드로젠 옥살레이트, 티오디카브, 티오파녹스, 티오메론, 티오선태-소듐, 투링기엔신, 톨펜피라드, 트랄로사이트린, 트랄로메트린, 트랜스플루트린, 트리아라텐, 트리아자메이트, 트리아조포스, 트리아주론, 트리클로페니딘, 트리클로르폰, 트리플루무론, 트리메타카브,

바미도티온, 바닐리프롤, 버부틴, 버티실리움 레카니,

WL-108477, WL-40027,

YI-5201, YI-5301, YI-5302,

XMC, 자일릴카브,

ZA-3274, 제타-사이피메트린, 졸라프로포스, ZXI-8901,

화합물 3-메틸 페닐 프로필카바메이트(추마사이드 Z),

화합물 3-(5-클로로-3-피리디닐)-8-(2,2,2-트리플루오로에틸)-8-아자비사이클로[3.2.1]옥탄-3-카보니트릴(CAS Reg. No. 185982-80-3) 및 대응 3-엔도-이성체 (CAS Reg. No. 185984-60-5)(참조: WO-96/37494, WO-98/25923),

및 살충 활성 식물 추출물, 선충, 진균 또는 바이러스를 함유하는 제제.

제초제와 같은 기타 공지된 활성 성분, 비료, 성장조절제, 약해완화제 및/또는 신호물질과의 혼합물이 또한 가능하다.

또한, 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물은 매우 우수한 항균 활성을 나타낸다. 이들은 특히 피부사상균, 이스트, 사상균 및 이상균, 예를 들어 칸디다(*Candida*) 중, 예컨대 칸디다 알비칸스(*Candida albicans*), 칸디다 글라브라타(*Candida glabrata*), 에피더모피톤(*Epidermophyton*) 중, 예컨대 에피더모피톤 플로코숨(*Epidermophyton floccosum*), 아스퍼길루스(*Aspergillus*) 중, 예컨대 아스퍼길루스 니거(*Aspergillus nigr*) 및 아스퍼길루스 푸미가투스(*Aspergillus fumigatus*), 트리코피톤(*Trichophyton*) 중, 예컨대 트리코피톤 멘타그로파이테스(*Trichophyton mentagrophytes*), 마이크로스포론(*Microsporon*) 중, 예컨대 마이크로스포론 카니스(*Microsporon canis*) 및 아우도우이니(*audouinii*)에 대해 매우 광범한 항균 활성 스펙트럼을 나타낸다. 이들 진균 목록은 적용될 수 있는 진균 스펙트럼을 어떤 식으로도 한정하지 않으며 단지 설명하기 위해 나열되었다.

활성 화합물은 그 자체로, 그의 제제 형태로, 또는 즉석 사용형 용액, 현탁제, 수화성 산제, 페이스트, 가용성 산제, 분제 및 과립제와 같이 이들로부터 제조된 사용형으로 사용될 수 있다. 이는 통상의 방법, 예를 들어 관수, 분무, 연무, 산포, 살포, 포밍(foaming), 뿌리기 등에 의해 적용된다. 또한, 활성 화합물을 극소용적 방법에 의해 적용하거나, 활성 화합물 제제 또는 활성 화합물 자체를 토양에 주입할 수 있다. 식물의 종자 처리가 또한 가능하다.

본 발명에 따른 활성 화합물을 살진균제로 사용하는 경우, 적용 비율은 적용 형태에 따라 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 식물의 일부를 처리하는 경우, 활성 화합물의 적용 비율은 일반적으로 0.1 내지 10,000 g/ha, 바람직하게는 10 내지 1,000 g/ha이다. 종자 드레싱의 경우, 활성 화합물의 적용 비율은 일반적으로 종자 1 kg 당 0.001 내지 50 g, 바람직하게는 0.01 내지 10 g 이다. 토양을 처리하는 경우, 활성 화합물의 적용 비율은 일반적으로 0.1 내지 10,000 g/ha, 바람직하게는 1 내지 5,000 g/ha 이다.

공업용 물질을 보호하기 위해 사용된 조성물은 활성 화합물을 일반적으로 1 내지 95 중량%, 바람직하게는 10 내지 75 중량%의 양으로 함유한다.

본 발명에 따른 활성 화합물의 사용 농도는 구제될 미생물 타입 및 발생빈도 및 보호하고자 하는 물질의 구성에 따라 달라진다. 최적의 비율은 일련의 시험에 의해 결정될 수 있다. 일반적으로, 사용 농도는 보호될 물질을 기준으로 0.001 내지 5 중량%, 바람직하게는 0.05 내지 1.0 중량%이다.

필요에 따라, 활성 스펙트럼을 넓히거나, 예를 들어 곤충에 대한 추가적인 보호와 같이 특정 효과를 얻도록 다른 항균 활성 화합물, 살진균제, 살균제, 제초제, 살충제 또는 그밖의 다른 활성 화합물을 첨가하여 물질 보호시 본 발명에 따라 사용되는 활성 화합물, 또는 이들로부터 제조될 수 있는 조성물, 농축물 또는 매우 일반적인 제제의 활성 및 활성 스펙트럼을 증가시킬 수 있다. 이들 혼합물은 본 발명에 따른 화합물보다 더 넓은 활성 스펙트럼을 가질 수 있다.

살충제로 사용되는 경우, 본 발명에 따른 활성 화합물은 또한 상승제와의 혼합물로서 그의 상업적으로 입수가 가능한 제제 및 이들 제제로부터 제조된 사용형에 존재할 수 있다. 상승제는 첨가되는 상승제 그 자체가 활성화될 필요없이 활성 화합물의 활성을 증가시키는 화합물이다.

살충제로 사용되는 경우, 본 발명에 따른 활성 성분은 또한 식물 주위 영역, 식물 부분 표면 또는 식물 조직에 적용 후 활성 성분이 파괴되는 것을 감소시키는 억제제와의 혼합물로서 그의 상업적으로 입수가 가능한 제제 및 이들 제제로부터 제조된 사용형에 존재할 수 있다.

상업적으로 입수가 가능한 제제로부터 제조된 사용형의 활성 성분 함량은 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 사용형의 활성 화합물 농도는 활성 성분 0.0000001 내지 95 중량%, 바람직하게는 0.0001 내지 1 중량%일 수 있다.

이들은 사용형에 적합한 통상적인 방법으로 적용된다.

위생 해충 및 저장 제품 해충에 사용되는 경우, 활성 화합물은 목재 및 점토에 대해 뛰어난 잔류 활성을 나타낼 뿐만 아니라 석회 기질상의 알칼리에 대해 우수한 안정성을 나타낸다.

상기 언급된 바와 같이, 본 발명에 따라 모든 식물 및 이들 부분의 처리가 가능하다. 바람직한 구체예로, 야생 식물 종 및 식물 품종, 통상적인 생물학적 육종법, 예를 들어 교잡육종 또는 원형체 융합(protoplast fusion)에 의해 얻어진 식물종 및 식물 품종뿐 아니라 이들의 일부가 처리된다. 또 다른 바람직한 구체예로, 적합하다면 통상적인 방법과 함께 유전자공학적 으로 얻어진 형질전환 식물(transgenic plant) 및 식물 품종(유전자 변형 유가제) 및 이들의 일부가 처리된다. 용어 "부분", "식물의 일부" 또는 "식물 부분"은 상기 설명되어 있다.

특히 바람직하게는, 각 경우에 상업적으로 입수가 가능한 식물 품종 및 사용중인 식물 품종의 식물이 본 발명에 따라 처리된다. 식물 품종이라는 것은 통상적인 육종 기술, 돌연변이형성 또는 재조합 DNA 기술에 의해 얻어지는 새로운 성질("특성")을 갖는 식물로 이해되어야 한다. 이들은 품종(cultivar), 변종(variety), 생리형(biotype) 또는 유전자형(genotype)일 수 있다.

식물 종 또는 식물 품종, 이들의 장소 및 성장 조건(토양, 기후, 생장기, 영양분)에 따라, 본 발명에 따라 처리함으로써 또한 상가("상승")적 효과가 나타날 수 있다. 따라서, 예를 들어 본 발명에 따라 사용되는 물질 및 제제의 적용비율의 감소 및/또는 활성 스펙트럼의 확대 및/또는 활성 증가, 식물 성장성 향상, 고온 또는 저온 내성 증가, 가뭄, 또는 물 또는 토양 염분에 대한 내성 증가, 개화량 증가, 수확 용이성, 성숙성 촉진, 작화량 증가, 수확 산물의 품질 향상 및/또는 영양가 증대, 및 수확 산물의 저장 안정성 및/또는 처리성 향상과 같은 효과가 실제 기대되는 것 이상으로 나타날 수 있다.

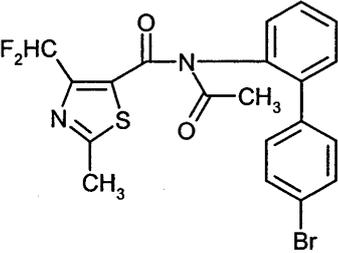
바람직하게는 본 발명에 따라 처리되는 형질전환 식물 또는 식물 품종(즉, 유전자공학적으로 얻어진 것)은 유전자 변형시 이들 식물에 특히 유리하고 유용한 성질("특성")을 부여하는 유전자 물질을 수용하는 모든 식물을 포함한다. 이러한 성질의 예로는 식물 성장성 향상, 고온 또는 저온 내성 증가, 가뭄, 또는 물 또는 토양 염분에 대한 내성 증가, 개화량 증가, 수확 용이성, 성숙성 촉진, 작화량 증가, 수확 산물의 품질 향상 및/또는 영양가 증대, 및 수확 산물의 저장 안정성 및/또는 처리성 증대가 포함된다. 추가적으로 특히 중요한 상기 특성의 예로 동물 및 미생물 해충, 예를 들어 곤충, 응애, 식물병원성 진균, 박테리아 및/또는 바이러스에 대한 식물의 방어력 증가 및 또한 특정 제조 활성 화합물에 대한 식물의 내약성 증가가 있다. 형질전환 식물의 예로 중요한 작물, 예를 들어 곡물(밀, 쌀), 옥수수, 대두, 감자, 목화, 담배, 유지종자 평지 및 또한 과수 식물(사과, 배, 감귤 및 포도 과일이 열리는)이 언급될 수 있으며, 옥수수, 대두, 감자, 목화, 담배 및 유지종자 평지가 특히 주목된다. 강조되는 특성은 특히 식물에 형성된 독소, 특히 바실러스 투링기엔시스(*Bacillus thuringiensis*)로부터 얻은 유전자 물질(예를 들어 유전자 CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb 및 CryIF 및 이들 조합)에 의해 식물(이후 "Bt 식물"로 언급)에 형성된 독소로 인한 곤충, 거미류, 선충, 민달팽이 및 달팽이에 대한 식물의 방어력 증가이다. 또한, 특히 강조되는 특성은 전신적으로 획득한 내성(SAR), 시스테민, 피토크알렉신, 엘리트 및 내성 유전자 및 상응하게 발현된 단백질 및 독소로 인해 진균, 박테리아 및 바이러스에 대해 식물의 방어력이 증가한 것이다. 특히 강조되는 특성은 또한 특정 제조 활성 화합물, 예를 들어 이미다졸리논, 설폰닐우레아, 글리포세이트 또는 포스포노트리신(예를 들어 "PAT" 유전자)에 대한 식물의 내약성 증가다. 목적하는 해당 특성을 부여하는 유전자가 또한 형질전환 식물에 상호 조합으로 존재할 수 있다. "Bt 식물"의 예로 YIELD GARD<sup>R</sup>(예: 옥수수, 목화, 대두), KnockOut<sup>R</sup>(예: 옥수수), StarLink<sup>R</sup>(예: 옥수수), Bollgard<sup>R</sup>(예: 목화), Nucotr<sup>R</sup>(예: 목화) 및 NewLeaf<sup>R</sup>(예: 감자) 상품명으로 시판되고 있는 옥수수 품종, 목화 품종, 대두 품종 및 감자 품종이 언급될 수 있다. 제초제-내약성 식물의 예로 Roundup Ready<sup>R</sup>(글리포세이트 내약성, 예: 옥수수, 목화, 대두), Liberty Link<sup>R</sup>(포스포노트리신 내약성, 예: 유지종자 평지), IMI<sup>R</sup>(이미다졸리논 내약성) 및 STS<sup>R</sup>(설폰닐우레아 내약성, 예: 옥수수) 상품명으로 시판되고 있는 옥수수 품종, 목화 품종 및 대두 품종이 언급될 수 있다. 제초제-내약성 식물(제초제 내약성을 위해 통상적인 방법으로 육종된 식물)의 예로 Clearfield<sup>R</sup> 명으로 시판되고 있는 품종(예: 옥수수)이 또한 언급될 수 있다. 물론, 상기 설명은 또한 미래에 개발되고/되거나 시장화될 식물로, 상술된 특성을 지니거나 앞으로 유전자 특성이 개발될 식물 품종에도 적용된다.

본 발명에 따라, 열거된 식물들이 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물 또는 활성 화합물의 혼합물을 사용하여 특히 유리하게 처리될 수 있다. 이들 활성 화합물 또는 혼합물에 대해 상기 언급된 바람직한 범위가 또한 이들 식물의 처리에도 적용된다. 본 명세서에서 구체적으로 언급된 화합물 또는 혼합물로 식물을 처리하는 것이 특히 강조된다.

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

**제조 실시예**

**실시예 1**

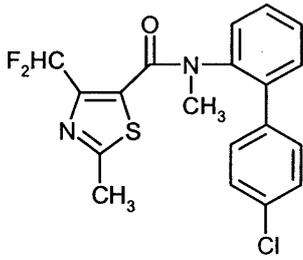


N-(4'-브로모-1,1'-비페닐-2-일)-4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-5-카복사미드(0.3 g, 0.7 mmol)를 우선 테트라하이드로푸란(20 ml)에 도입하고, 수소화나트륨(60%, 34 mg, 0.85 mmol)을 가하였다. 실온에서 15 분후, 아세틸 클로라이드(50 μl, 0.7 mmol)를 가하고, 혼합물을 50 °C에서 5 시간동안 교반하였다.

후처리로서, 혼합물을 중탄산나트륨 포화 용액으로 세척하여 에틸 아세테이트로 추출한 후, 추출물을 황산나트륨으로 건조시킨 다음, 감압하에 농축시켰다.

logP (pH 2.3) = 3.61인 N-아세틸-N-(4'-브로모-1,1'-비페닐-2-일)-4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-5-카복사미드 0.31 g(이론치의 95%)을 수득하였다.

**실시예 2**



N-(4'-클로로-1,1'-비페닐-2-일)-4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-5-카복사미드(0.3 g, 0.8 mmol)를 우선 테트라하이드로푸란에 도입하고, 수소화나트륨(60%, 23 mg, 10 mmol)을 가하였다. 실온에서 15 분후, 메틸 요오다이드(100  $\mu$ l, 1.6 mmol)를 가하고, 혼합물을 16 시간동안 환류하에 가열하였다.

후처리로서, 혼합물을 중탄산나트륨 용액으로 세척하여 에틸 아세테이트로 추출한 후, 추출물을 황산나트륨으로 건조시킨 다음, 농축시켰다.

logP (pH 2.3) = 3.34인 N-(4'-클로로-1,1'-비페닐-2-일)-4-(디플루오로메틸)-N,2-디메틸-1,3-티아졸-5-카복사미드 0.25 g(이론치의 80%)을 수득하였다.

하기 표 1에 수록된 일반식 (I)의 화합물이 실시예 1 및 2와 유사하게, 그리고 방법 (A)의 일반 설명에 따라 수득되었다.

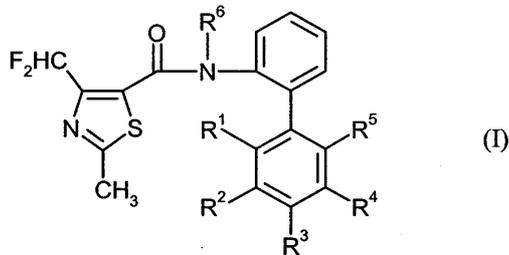
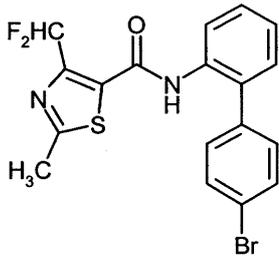


표 1

실시예	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	logP
3	H	CH <sub>3</sub>	Cl	H	H		4.24
4	H	Cl	H	Cl	H		4.28
5	H	H	Cl	H	H		3.94
6	H	H	Br	H	H	-CH <sub>3</sub>	3.44
7	H	H	F	H	H	-CH <sub>3</sub>	2.99
8	H	H	F	H	H	-COCH <sub>3</sub>	3.16
9	H	H	Cl	H	H	-COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3.34

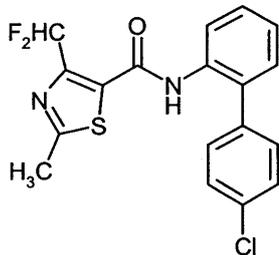
일반식 (II)의 출발물질의 제조



-10 내지 -20 °C에서, 테트라하이드로푸란 1.0 ℓ중의 4'-브로모-1,1'-비페닐-2-아민 23.2 g(0.09 mol) 및 트리에틸아민 26.0 ml(0.19 mol)에 테트라하이드로푸란 200 ml 중의 2-메틸-4-(디플루오로메틸)-1,3-티아졸-5-카보닐 클로라이드 21.8 g(0.10 mol) 용액을 천천히 가하였다. 반응 용액을 0 °C에서 2 시간동안 교반하였다. 후처리로서, 혼합물을 농축한 후, 사이클로헥산/에틸 아세테이트를 사용하여 실리카겔상에서 크로마토그래피하였다.

logP (pH 2.3) = 3.34이고 융점 151 °C인 N-(4'-브로모-1,1'-비페닐-2-일)-2-메틸-4-(디플루오로메틸)-1,3-티아졸-5-카복사미드 27.8 g(이론치의 70%)을 수득하였다.

**실시예 (II-2)**



-10 내지 -20 °C에서, 테트라하이드로푸란 2.0 ℓ중의 4'-브로모-1,1'-비페닐-2-아민 65.1 g(0.32 mol) 및 트리에틸아민 74.0 ml(0.53 mol)에 테트라하이드로푸란 500 ml 중의 2-메틸-4-(디플루오로메틸)-1,3-티아졸-5-카보닐 클로라이드 56.3 g(0.27 mol) 용액을 천천히 가하였다. 반응 용액을 0 °C에서 2 시간동안 교반하였다. 후처리로서, 혼합물을 농축한 후, 사이클로헥산/에틸 아세테이트를 사용하여 실리카겔상에서 크로마토그래피하였다.

logP (pH 2.3) = 3.26이고 융점 144 °C인 N-(4'-클로로-1,1'-비페닐-2-일)-2-메틸-4-(디플루오로메틸)-1,3-티아졸-5-카복사미드 43.88 g(이론치의 44.5%)을 수득하였다.

상기 제조 실시예 및 표에 주어진 logP 값은 역상 칼럼(C 18)을 사용하여 HPLC(고성능 액체 크로마토그래피)에 의해 EEC Directive 79/831 Annex V.A8 에 따라 측정되었다. 온도: 43 °C.

0.1% 수성 인산 및 아세트니트릴을 이동상으로 사용하여 10% 아세트니트릴 → 90% 아세트니트릴로 선형 구배하여 pH 2.3의 산성 범위에서의 측정을 실시하였다.

logP 값이 알려진(두개의 연속한 알카는 사이의 선형보간을 이용하여 체류 시간으로 logP 값 측정) 비측쇄 알칸-2-온(탄소원자수 3 내지 16)을 사용하여 보정을 수행하였다.

200 내지 400 nm의 UV 스펙트럼을 사용하여 크로마토그래피 시그널의 최대치로서 램다 max 값을 결정하였다.

**사용 실시예**

**실시예 A**

스파에로테카 시험(오이)/보호성

용 매 : 아세톤 24.5 중량부

디메틸아세트아미드 24.5 중량부

유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1.0 중량부

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

보호 활성을 시험하기 위해, 어린 식물에 활성 화합물 제제를 지정된 적용 비율로 분무하였다. 분무 코팅물을 건조시킨 후, 식물에 스파에로테카 풀리기네아(*Sphaerotheca fuliginea*)의 수성 포자 현탁액을 접종하였다. 그후, 식물을 약 23 °C 및 약 70% 상대 대기습도의 온실에 놓아 두었다.

접종 7 일 후에 평가를 실시하였다. 0 %란 대조군에 상응하는 유효도를 의미하고, 유효도가 100 %란 감염이 전혀 관찰되지 않았음을 의미한다.

활성 화합물, 적용 비율 및 시험 결과를 하기 표에 나타내었다.

**표 A:**

스파에로테카 시험(오이)/보호성

실시에	활성 화합물	활성 화합물의 적용비율(g/ha)	유효도 (%)
4		100	100
6		100	100
1		100	100
2		100	95

**실시에 B**

벤틀리아 시험(사과)/보호성

용 매 : 아세톤 24.5 중량부

디메틸아세트아미드 24.5 중량부

유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1.0 중량부

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

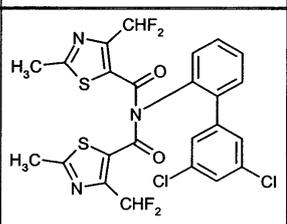
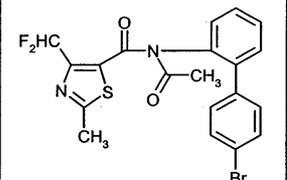
보호 활성을 시험하기 위해, 어린 식물에 활성 화합물의 제제를 지정된 적용 비율로 분무하였다. 분무 코팅물을 건조시킨 후, 식물을 사과 더듬이병 원인균인 벤틀리아 이내쿠알리스(*Venturia inaequalis*)의 수성 분생자 현탁액으로 접종하고, 약 20 °C 및 100% 상대 대기습도의 배양실에 하루동안 놓아 두었다.

그후, 식물을 약 21 °C 및 약 90% 상대 대기습도의 온실에 놓아 두었다.

접종 10 일 후에 평가를 실시하였다. 0 %란 대조군에 상응하는 유효도를 의미하고, 유효도가 100 %란 감염이 전혀 관찰되지 않았음을 의미한다.

**표 B:**

벤틀리아 시험(사과)/보호성

실시에	활성 화합물	활성 화합물의 적용비율(g/ha)	유효도 (%)
4		100	99
1		100	100

**실시에 C**

보트리티스 시험(콩)/보호성

용 매 : 아세톤 24.5 중량부

디메틸아세트아미드 24.5 중량부

유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1.0 중량부

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

보호 활성을 시험하기 위해, 어린 식물에 활성 화합물의 제제를 지정된 적용 비율로 분무하였다. 분무 코팅물을 건조시킨 후, 보트리티스 시네레아로 콜론화된 작은 아가 조각 2개를 각 잎위에 놓았다. 접종 식물을 약 20 °C 및 100% 상대 대기습도의 암실에 놓아 두었다.

접종 이틀후, 잎의 병변 면적의 크기를 평가하였다. 0%란 대조군에 상응하는 유효도를 의미하고, 유효도 100%란 감염이 전혀 관찰되지 않았음을 의미한다.

**표 C**

보트리티스 시험(콩)/보호성

실시예	활성 화합물	활성 화합물의 적용비율(g/ha)	유효도 (%)
4		500	94
1		500	98

**실시예 D**

알터나리아(토마토)/보호성

용 매: N,N-디메틸포름아미드 49 중량부

유화제: 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

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

보호 활성을 시험하기 위해, 어린 토마토 식물에 활성 화합물 제제를 지정된 적용 비율로 분무하였다. 처리하고 하루 후, 식물에 알터나리아 솔라니 (*Alternaria solani*)의 수성 포자 현탁액을 접종한 후, 100% 상대 대기습도에서 24 시간동안 놓아 두었다. 이어서, 식물을 20 °C의 온도 및 약 96% 상대 대기습도에 놓아 두었다.

접종 7 일 후에 평가를 실시하였다. 0 %란 대조군에 상응하는 유효도를 의미하고, 유효도가 100 %란 감염이 전혀 관찰되지 않았음을 의미한다.

활성 화합물, 적용 비율 및 시험 결과를 하기 표에 나타내었다.

**표 D:**

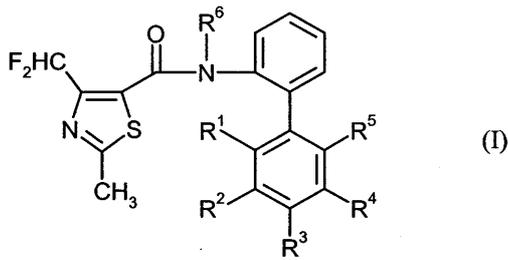
알터나리아 시험(토마토)/보호성

실시예	활성 화합물	활성 화합물의 적용비율(g/ha)	유효도 (%)
4		750	95

**(57) 청구의 범위**

**청구항 1.**

일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드:



상기 식에서,

$R^1, R^2, R^3, R^4$  및  $R^5$ 는 서로 독립적으로 수소, 할로젠, 시아노, 니트로,  $C_1-C_6$ -알킬,  $C_2-C_6$ -알케닐,  $C_1-C_4$ -알콕시,  $C_1-C_4$ -알킬티오,  $C_1-C_4$ -알킬설포닐 또는  $C_3-C_6$ -사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 5개의 할로젠 원자를 가지는  $C_1-C_4$ -할로알킬,  $C_1-C_4$ -할로알콕시,  $C_1-C_4$ -할로알킬티오 또는  $C_1-C_4$ -할로알킬설포닐을 나타내거나,

$R^1$  및  $R^2$  또는  $R^2$  및  $R^3$ 는 함께, 임의로 할로젠- 또는  $C_1-C_6$ -알킬-치환된 알케닐렌을 나타내고,

$R^6$ 은  $C_1-C_8$ -알킬,  $C_1-C_6$ -알킬설피닐,  $C_1-C_6$ -알킬설포닐,  $C_1-C_4$ -알콕시- $C_1-C_4$ -알킬 또는  $C_3-C_8$ -사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는  $C_1-C_6$ -할로알킬,  $C_1-C_4$ -할로알킬설피닐,  $C_1-C_4$ -할로알킬설피닐,  $C_1-C_4$ -할로알킬설포닐, 할로- $C_1-C_4$ -알콕시- $C_1-C_4$ -알킬 또는  $C_3-C_8$ -할로사이클로알킬을 나타내거나,  $-COR^7$ ,  $-CONR^8R^9$  또는  $-CH_2NR^{10}R^{11}$ 을 나타내며,

$R^7$ 은 수소,  $C_1-C_8$ -알킬,  $C_1-C_8$ -알콕시,  $C_1-C_4$ -알콕시- $C_1-C_4$ -알킬 또는  $C_3-C_8$ -사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는  $C_1-C_6$ -할로알킬,  $C_1-C_6$ -할로알콕시, 할로- $C_1-C_4$ -알콕시- $C_1-C_4$ -알킬 또는  $C_3-C_8$ -할로사이클로알킬을 나타내거나, 4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-2-일을 나타내고,

$R^8$  및  $R^9$ 는 서로 독립적으로 수소,  $C_1-C_8$ -알킬,  $C_1-C_4$ -알콕시- $C_1-C_4$ -알킬 또는  $C_3-C_8$ -사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는  $C_1-C_8$ -할로알킬, 할로- $C_1-C_4$ -알콕시- $C_1-C_4$ -알킬 또는  $C_3-C_8$ -할로사이클로알킬을 나타내거나,

$R^8$  및  $R^9$ 는 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 할로젠 및  $C_1-C_4$ -알킬로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환되고 5 내지 8개의 환 원자를 가지며 산소, 황 및  $NR^{12}$ 로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2개의 추가의 비인접 헤테로 원자를 함유할 수 있는 포화 헤테로사이클을 형성하며,

$R^{10}$  및  $R^{11}$ 은 서로 독립적으로 수소,  $C_1-C_8$ -알킬 또는  $C_3-C_8$ -사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는  $C_1-C_8$ -할로알킬 또는  $C_3-C_8$ -할로사이클로알킬을 나타내거나,

$R^{10}$  및  $R^{11}$ 은 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 할로젠 및  $C_1-C_4$ -알킬로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환되고 5 내지 8개의 환 원자를 가지며 산소, 황 및  $NR^{12}$ 로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2개의 추가의 비인접 헤테로 원자를 함유할 수 있는 포화 헤테로사이클을 형성하고,

$R^{12}$ 는 수소 또는  $C_1-C_6$ -알킬을 나타낸다.

## 청구항 2.

제 1 항에 있어서,

$R^1, R^2, R^3, R^4$  및  $R^5$ 는 서로 독립적으로 수소, 불소, 염소, 브롬, 시아노, 니트로, 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, n-, 이소, sec- 또는 t-부틸, 메톡시, 에톡시, 메틸티오, 에틸티오, n- 또는 이소프로필티오, 사이클로프로필, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로에틸, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로클로로메톡시, 트리플루오로에톡시, 디플루오로메틸티오, 디플루오로클로로메틸티오 또는 트리플루오로메틸티오를 나타내거나,

$R^1$  및  $R^2$  또는  $R^2$  및  $R^3$ 는 함께, 임의로 불소-, 염소-, 브롬- 또는 메틸-치환된 부타디엔디일을 나타내고,

R<sup>6</sup>은 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬설피닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설피닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설포닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬설포닐, 할로-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나, -COR<sup>7</sup>, -CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> 또는 -CH<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>을 나타내며,

R<sup>7</sup>은 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알콕시, 할로-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나, 4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-2-일을 나타내고,

R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>은 서로 독립적으로 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 각 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬, 할로-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나,

R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>은 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 할로젠 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환되고 5 내지 8개의 환 원자를 가지며 산소, 황 및 NR<sup>12</sup>로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2개의 추가의 비인접 헤테로 원자를 함유할 수 있는 포화 헤테로사이클을 형성하며,

R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 서로 독립적으로 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬을 나타내거나, 경우에 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 가지는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-할로사이클로알킬을 나타내거나,

R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 할로젠 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환되고 5 내지 8개의 환 원자를 가지며 산소, 황 및 NR<sup>12</sup>로 구성된 그룹중에서 선택된 1 또는 2개의 추가의 비인접 헤테로 원자를 함유할 수 있는 포화 헤테로사이클을 형성하며,

R<sup>12</sup>는 수소 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드.

### 청구항 3.

제 1 항에 있어서,

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>는 서로 독립적으로 수소, 불소, 염소, 브롬, 시아노, 메틸, 메톡시, 메틸티오, 트리플루오로메틸, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메틸티오 또는 트리플루오로메틸티오를 나타내고,

R<sup>6</sup>은 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸, 펜틸, 헥실, 메틸설피닐, 에틸설피닐, n- 또는 이소프로필설피닐, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸설피닐, 메틸설포닐, 에틸설포닐, n- 또는 이소프로필설포닐, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸설포닐, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 에톡시메틸, 에톡시에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로메틸설피닐, 디플루오로메틸설포닐, 디플루오로클로로메틸설포닐, 트리플루오로메틸설포닐, 트리플루오로메톡시메틸, -COR<sup>7</sup>, -CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> 또는 -CH<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>을 나타내며,

R<sup>7</sup>은 수소, 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, t-부틸, 메톡시, 에톡시, t-부톡시, 사이클로프로필, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시 또는 4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-2-일을 나타내고,

R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>은 서로 독립적으로 수소, 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 에톡시메틸, 에톡시에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로에틸 또는 트리플루오로메톡시메틸을 나타내거나,

R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>은 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 불소, 염소, 브롬 및 메틸로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 모르폴린, 티오모르폴린 및 피페라진으로 구성된 그룹중에서 선택된 포화 헤테로사이클을 형성하며, 여기에서, 피페라진은 R<sup>12</sup>에 의해 제 2의 질소 원자상에서 치환될 수 있으며,

R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 서로 독립적으로 수소, 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 에톡시메틸, 에톡시에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로에틸 또는 트리플루오로메톡시메틸을 나타내고,

$R^{10}$  및  $R^{11}$ 은 이들이 결합된 질소 원자와 함께, 불소, 염소, 브롬 및 메틸로 구성된 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 모르폴린, 티오모르폴린 및 피페라진으로 구성된 그룹중에서 선택된 포화 헤테로사이클을 형성하며, 여기에서, 피페라진은  $R^{12}$ 에 의해 제 2의 질소 원자상에서 치환될 수 있으며,

$R^{12}$ 는 수소, 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, 또는 n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸을 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드.

#### 청구항 4.

제 1 항에 있어서,

각 경우에 래디칼  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  및  $R^5$ 중 네개가 수소를 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드.

#### 청구항 5.

제 1 항에 있어서,

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$  및  $R^5$ 가 각각 수소를 나타내고,

$R^3$ 은 제 1 항 내지 3 항중 어느 한항에 정의된 바와 같은 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드.

#### 청구항 6.

제 1 항에 있어서,

$R^2$ ,  $R^4$  및  $R^5$ 가 각각 수소를 나타내고,

$R^1$  및  $R^3$ 은 서로 독립적으로 제 1 항 내지 3 항중 어느 한항에 정의된 바와 같은 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드.

#### 청구항 7.

제 1 항에 있어서,

$R^1$ ,  $R^4$  및  $R^5$ 가 각각 수소를 나타내고,

$R^2$  및  $R^3$ 은 서로 독립적으로 제 1 항 내지 3 항중 어느 한항에 정의된 바와 같은 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드.

#### 청구항 8.

제 1 항에 있어서,

$R^1$ ,  $R^3$  및  $R^5$ 가 각각 수소를 나타내고,

$R^2$  및  $R^4$ 는 서로 독립적으로 제 1 항 내지 3 항중 어느 한항에 정의된 바와 같은 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드.

#### 청구항 9.

제 1 항에 있어서,

$R^6$ 이  $-COR^7$ 을 나타내고,

R<sup>7</sup>은 4-(디플루오로메틸)-2-메틸-1,3-티아졸-2-일을 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드.

**청구항 10.**

제 1 항에 있어서,

R<sup>6</sup>이 -COR<sup>7</sup>을 나타내고,

R<sup>7</sup>은 메틸, 에틸, 사이클로프로필 또는 트리플루오로메틸, 특히 메틸을 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드.

**청구항 11.**

제 1 항에 있어서,

R<sup>6</sup>이 -CHO를 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드.

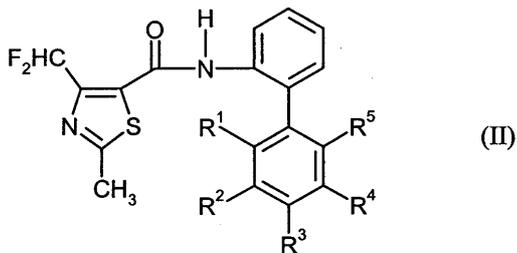
**청구항 12.**

제 1 항에 있어서,

R<sup>6</sup>은 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, n-, 이소-, sec- 또는 t-부틸, 메틸설퍼닐, 메틸설포닐, 메톡시메틸, 에톡시에틸, 사이클로프로필, 사이클로헥틸, 사이클로헥실, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 트리플루오로메틸설퍼닐, 트리플루오로메틸설퍼닐, 트리플루오로메틸설포닐, 트리플루오로메톡시메틸, 특히 메틸, 이소프로필 또는 사이클로프로필을 나타내는 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드.

**청구항 13.**

(A) 일반식 (II)의 티아졸릴비페닐아미드를 염기의 존재하 및 희석제의 존재하에서 일반식 (III)의 할라이드와 반응시킴을 특징으로 하여 제 1 항에 청구된 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드를 제조하는 방법:



상기 식에서,

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>은 제 1 항에 정의된 바와 같고,

X는 염소, 브롬 또는 요오드를 나타낸다.

**청구항 14.**

증량제 및/또는 계면활성제와 함께, 적어도 하나의 제 1 항에 청구된 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드를 함유함을 특징으로 하는, 원치않는 미생물을 구제하기 위한 조성물.

청구항 15.

원치않는 미생물을 구제하기 위한 제 1 항에 청구된 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드의 용도.

청구항 16.

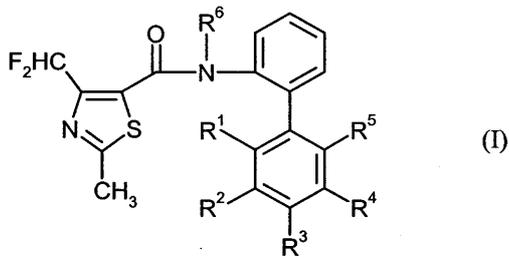
제 1 항에 따른 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드를 미생물 및/또는 이들의 서식지에 적용시킴을 특징으로 하여 원치않는 미생물을 구제하는 방법.

청구항 17.

제 1 항에 청구된 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드를 증량제 및/또는 계면활성제와 혼합함을 특징으로 하여 원치않는 미생물을 구제하기 위한 조성물을 제조하는 방법.

요약

본 발명은 신규한 하기 일반식 (I)의 티아졸릴비페닐아미드, 다수의 그의 제조방법 및 원치않는 미생물을 구제하기 위한 그의 용도에 관한 것이다:



상기 식에서,

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>는 명세서에 정의된 바와 같다.