

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 특허공보(B1)

(51) Int. Cl.<sup>3</sup>  
C07D 285/12  
C07D 213/06  
C07D 215/12  
C07D 307/56  
A01N 43/82  
A01N 43/40

(45) 공고일자 1981년02월04일  
(11) 공고번호 특허1981-000057

(21) 출원번호	특1977-0000254	(65) 공개번호	
(22) 출원일자	1977년02월08일	(43) 공개일자	
(71) 출원인	일라이 릴리 앤드 캄파니 에베레트 에프. 스미스 미합중국 인디애나주 인디애나폴리스 이스트 맥카티 스트리트 307		
(72) 발명자	존 스탠리 워드 미합중국 인디애나주 인디애나폴리스 이스트 브룬스워크 241		
(74) 대리인	이병호		

심사관 : 윤여범

(54) N-(1,3,4-티아디아졸-2-일) 벤즈아마이드 유도체의 제조방법

요약

내용 없음.

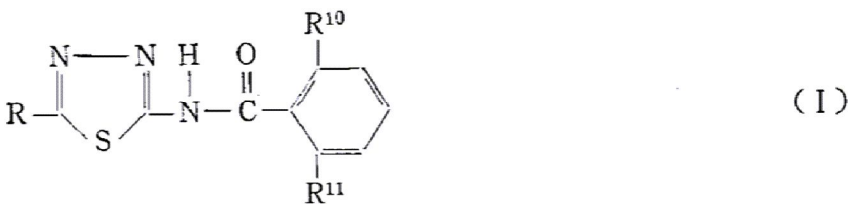
명세서

[발명의 명칭]

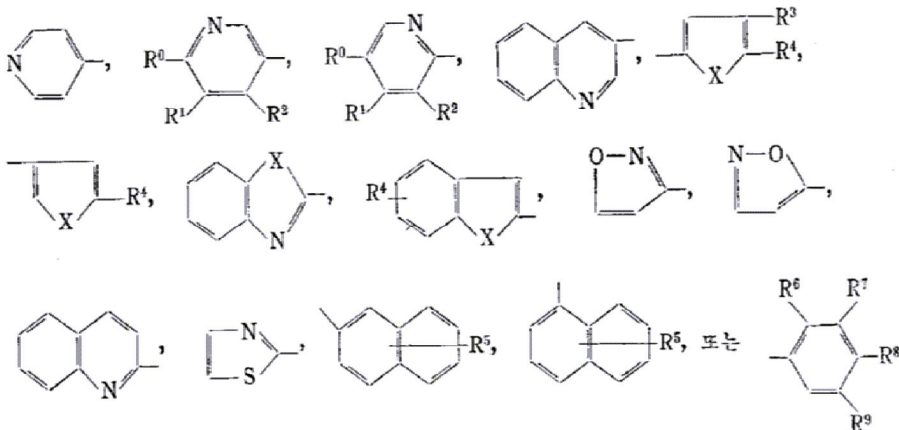
N-(1,3,4-티아디아졸-2-일) 벤즈아마이드 유도체의 제조방법

[발명의 상세한 설명]

본 발명은 살충제로 유용한 다음 구조식(1)의 N-(1,3,4-티아디아졸-2-일) 벤즈아마이드 유도체의 제조 방법에 관한 것이다.



상기 구조식에서 R은



(여기서 R<sup>0</sup>, R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup> 각각 독립적으로 수소, 염소 또는 브롬이고(단, R<sup>0</sup>, R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup> 중 적어도 하나는 염소 또는 브롬이다.)

X는 산소 또는 황이고, R<sup>3</sup> 및 R<sup>4</sup>는 각각 독립적으로 수소, 염소, 브롬 또는 메틸이고, (단 X가 산소일 경우 R<sup>3</sup>는 수소이다), R<sup>5</sup>는 수소, 염소, 브롬, 불소 또는 트리플루오로 메틸이고,

1) R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>은 수소이고, R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>중 하나는 수소이고 다른 하나는 수소, 염소, 메톡시, 브롬, 요오드, 불소, 트리플루오로메틸, 메틸, 하이드록시, 페닐, 또는 브롬, 염소 또는 불소로 치환된 페닐이거나

2) R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>은 수소이고 R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 각각 독립적으로 염소, 불소 또는 브롬이거나

3) R<sup>6</sup> 및 R<sup>8</sup>은 수소이고, R<sup>7</sup> 및 R<sup>9</sup>은 각각 독립적으로 염소, 불소, 브롬 또는 트리플루오로메틸이거나

4) R<sup>7</sup> 및 R<sup>9</sup>은 수소이고, R<sup>6</sup> 및 R<sup>8</sup>은 각각 독립적으로 염소, 불소 또는 브롬이거나,

5) R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>은 수소이고 R<sup>6</sup>은 염소, 불소 또는 브롬이거나

6) R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> 및 R<sup>9</sup>은 수소이고, R<sup>8</sup>은 니트로, 또는 시아노이다)이고

R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 각각 독립적으로 수소, 염소, 불소, 브롬, 메틸 또는 메톡시이며

단, 1) R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup> 중 하나가 메톡시면 다른 하나는 수소이고

2) a) R<sup>8</sup> 수소가 아니고 R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> 및 R<sup>9</sup>이 수소이거나 또는

b) R<sup>6</sup> 및 R<sup>8</sup>이 수소이고 R<sup>7</sup> 및 R<sup>9</sup> 하나 또는 모두가 트리플루오로메틸일 경우를 제외하고는 R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup> 중 적어도 하나는 메틸 또는 메톡시여야 하고

3) R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>이 모두 메톡시가 아닐 경우 R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>은 모두 페닐, 아세트아미도, 메톡시, 니트로, 아미노, 시아노 또는 치환된 페닐이 아니고

4) R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>이 모두 메틸 또는 메톡시가 아닐 경우 R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>중 두개는 수소이고

5) R이 피리딜, 나프틸, 푸틸 또는 티에닐일 경우 R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 모두 메톡시 또는 메틸이고

6) R이 벤조티아졸릴, 벤족사졸릴, 벤조티에닐, 벤조푸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴일 경우에 R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 모두 메톡시이다.

본 발명은 살충제로 유용한, 티아디아졸린 환의 5-위치에 페닐, 나프틸 또는 헤테로-아릴 그룹을 가지며 벤질 환의 2,6-위치에 치환체를 갖는 신규의 N-(1,3,4-티아디아졸-2-인) 벤즈아마이드 계열의 유도체를 제조하는 방법에 관한 것이다.

곤충의 박멸은 농화학 부분에서 해결되어야 하는 첫번째 선결 문제중의 하나이므로 이 분야에 연구가 계속되어 왔다. 많은 목(目)의 곤충은 여러 형태의 작물에 침입하여 식물물을 오염시켜 비위생적인 환경을 이롭게 한다. 곤충에 의한 피해는 매우 커서 이러한 해충의 박멸이 가장 중요한 문제로 등장하게 되었다.

최근에, 재래의 잔존하는 살충제의 용도가 빛을 발하지 못함으로써 새롭고 더 우수한 살충제에 대한 연구가 박차를 가하게 되었다.

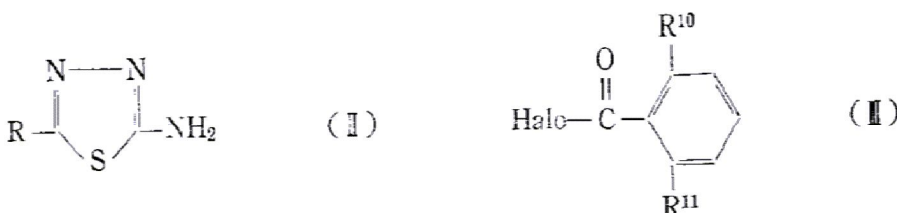
구조식(I) 화합물은 유기화학 분야에 있어서 신규의 것이다. 그러나 종래에 있었던 이러한 계통의 몇몇 화합물도 흥미있는 것이 있다. 예를 들면, 세발로의 미합중국특허 제3,726,892호에는 제초제인 1,3,4-티아디아졸-2-일 우레아에 대해 기술되어 있다.

다음 참조 문헌에는 본 발명 화합물을 제조하는데 중간물인 2-아미노-1,3,4-티아디아졸의 합성에 관해 기술되어 있다. [참조 : Rao, Indian. J. chem 8 509-13(1970)]

다음 참조 문헌에는 제초제 및 살충제로 유용한 N-벤조일-N'-페닐 우레아에 관해 기술되어 있다. [참조 : Wellinga and Mulder의 미합중국특허 제3,748,35625호]

본 발명에 따른 구조식(I)의 화합물은 다음과 같이 제조한다.

즉, 다음 구조식(II)의 2-아미노-5-R-치환된 1,3,4-티아디아졸을 다음 구조식(III)의 벤조일 할라이드로 아실화시켜 제조한다.

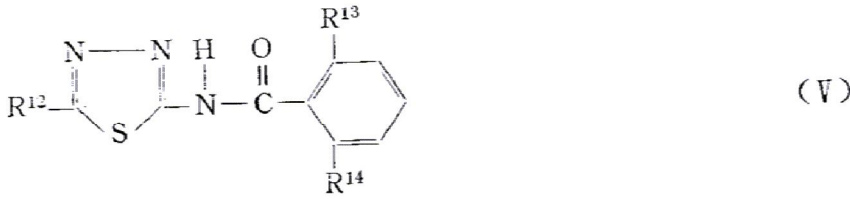


상기 구조식에서

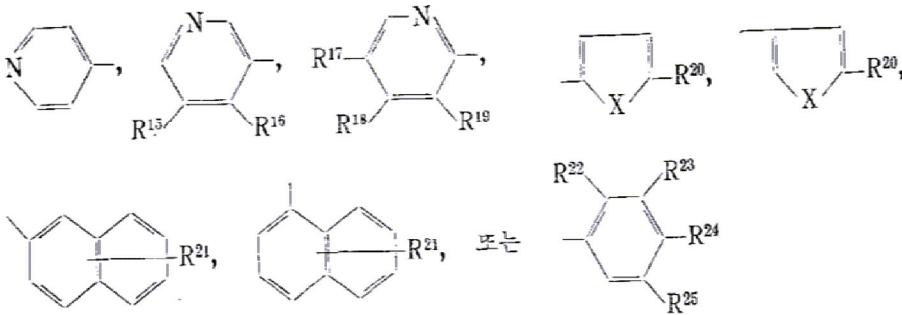
R, R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 상술한 바와 같고 Halo는 염소 또는 브롬이다.

본 명세서를 통해 모든 양은 미터법에 의해 측정된 것이며 온도는 섭씨이다. 모든 비율 및 %는 중량에 관한 것이다. 할로겐은 불소, 염소, 브롬 및 요오드를 뜻한다.

구조식(1)의 화합물에는 여러가지 특정한 형태의 화합물이 있다. 이중 특히 바람직한 구조식(1)의 화합물은 다음 구조식(V)의 화합물이다.



상기 구조식에서 R<sup>12</sup>는



(여기서 R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup> 및 R<sup>19</sup>는 각각 독립적으로 수소, 염소 또는 브롬이고 단, R<sup>15</sup> 및 R<sup>16</sup>중 적어도 하나, 또는 R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup> 및 R<sup>19</sup>중 적어도 하나는 염소 또는 브롬이고

X는 산소 또는 황이고

R<sup>20</sup>은 수소, 염소, 브롬 또는 메틸이고

R<sup>21</sup>은 수소, 염소, 브롬, 불소 또는 트리플루오로메틸이고

1) R<sup>22</sup> 및 R<sup>23</sup>은 수소이고 R<sup>24</sup> 및 R<sup>25</sup>중 하나가 수소이고 다른 하나는 수소, 염소, 브롬, 불소, 트리플루오로메틸, 메틸, 하이드록시, 페닐, 또는 브롬, 염소 또는 불소로 일치환된 페닐이거나

2) R<sup>22</sup> 및 R<sup>23</sup>가 수소이고 R<sup>24</sup> 및 R<sup>25</sup>는 독립적으로 염소, 불소 또는 브롬이거나

3) R<sup>22</sup> 및 R<sup>24</sup>는 수소이고 R<sup>23</sup> 및 R<sup>25</sup>는 염소, 불소, 브롬 또는 트리플루오로메틸이거나

4) R<sup>23</sup> 및 R<sup>25</sup>는 수소이고 R<sup>22</sup> 및 R<sup>24</sup>는 염소, 불소 또는 브롬이다)이고

R<sup>13</sup>과 R<sup>14</sup>는 각각 독립적이고 수소, 염소, 불소, 브롬, 메틸 또는 메톡시이며

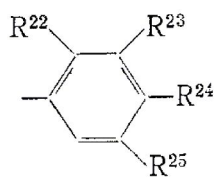
단 1) R<sup>13</sup>, 및 R<sup>14</sup>중 하나가 메톡시이면 다른 하나는 수소이고

2) a) R<sup>24</sup>가 수소가 아니고 R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup> 및 R<sup>25</sup>가 수소이거나 b) R<sup>22</sup> 및 R<sup>24</sup>가 수소이고 R<sup>23</sup> 및 R<sup>25</sup>중 하나 또는 모두가 트리플루오로메틸일 경우를 제외하고는 R<sup>13</sup>과 R<sup>14</sup>중 적어도 하나는 메틸 또는 메톡시여야 하고

3) R<sup>13</sup> 및 R<sup>14</sup>가 모두 메톡시가 아닐 경우 R<sup>24</sup> 및 R<sup>25</sup>는 모두 페닐 또는 치환된 페닐이 아니고

4) R<sup>13</sup> 및 R<sup>14</sup>가 모두 메틸 또는 메톡시가 아닐 경우 R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup> 및 R<sup>25</sup>중 2개는 수소이고

5) R<sup>13</sup>이 피리딜, 나프릴, 푸릴 또는 리에닐일 경우 R<sup>13</sup> 및 R<sup>14</sup>는 모두 메톡시이다.



더욱 바람직한 것은 R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup> 및 R<sup>25</sup>인 화합물이고, 또한 더욱 바람직한 것을 R<sup>13</sup> 및 R<sup>14</sup>가 메톡시인 화합물이다.

본 발명은 역시 많은 다른 여러가지 형태 또는 종류의 화합물을 제조할 수 있으며 역시 이 여러가지 중

류의 화합물을 사용한 살충 방법과 조성물도 함유된다. 예를 들면 다음과 같은 화합물이 바람직한 화합물이다. 아래 각 번호의 항은 서로 독립된 종류의 화합물이며 각 종류에 있어서 여러가지 치환체는 특별한 지시가 없는한 구조식(1)에서 기술한 바와 같다. 아래 항에 있어서 페닐과 같은 각각의 일반적인 용어는 언급한 그룹의 치환형태를 함유하는 것이다.

- 1) ROI 페닐인 화합물;
- 2) ROI 페닐 또는 피리딜 화합물;
- 3) ROI 피리딜, 티에닐, 푸릴, 벤조티에닐, 벤조푸릴, 벤조티아졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴인 화합물;
- 4) ROI 페닐 또는 나프릴인 화합물;
- 5) ROI 피리딜, 벤조티아졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴인 화합물;
- 6) ROI 티에닐, 푸릴, 벤족사졸릴, 벤조티아졸릴, 벤조티에닐, 벤조푸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴인 화합물;
- 7)  $R^8$  및  $R^9$  중 하나가 수소이고 다른 하나는 할로겐 또는 트리플루오로메틸인 화합물;
- 8)  $R^8$  및  $R^9$ 이 각각 독립적으로 염소, 불소 또는 브롬인 화합물;
- 9)  $R^7$  및  $R^9$ 이 각각 독립적으로 염소, 불소, 브롬 또는 트리플루오로메틸인 화합물
- 10)  $R^8$  및  $R^9$  중 하나가 수소이고 다른 하나는 할로겐, 트리플루오로메틸, 메틸 또는 메톡시인 화합물;
- 11)  $R^{10}$  및  $R^{11}$ 이 메톡시인 화합물;
- 12)  $R^{10}$  및  $R^{11}$ 이 각각 독립적으로 메틸 또는 메톡시인 화합물;
- 13)  $R^{10}$  및  $R^{11}$ 이 각각 독립적으로 염소, 불소 또는 브롬인 화합물;
- 14) ROI 페닐인 11항의 화합물;
- 15) ROI 페닐 또는 피리딜인 11항의 화합물;
- 16) ROI 피리딜, 티에닐, 푸릴, 벤조티에닐, 벤조푸릴, 벤조티아졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴인 11항의 화합물;
- 17) ROI 페닐 또는 나프틸인 11항의 화합물;
- 18) ROI 피리딜, 벤조티아졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴인 11항의 화합물;
- 19) ROI 티에닐, 푸릴, 벤족사졸릴, 벤조티아졸릴, 벤조티에닐, 벤조푸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴인 11항의 화합물;
- 20)  $R^8$  및  $R^9$  중 하나가 수소이고 다른 하나는 할로겐 또는 트리플루오로메틸인 11항의 화합물;
- 21)  $R^8$  및  $R^9$ 가 각각 독립적으로 염소, 불소 또는 브롬인 11항의 화합물;
- 22)  $R^7$  및  $R^9$ 이 각각 독립적으로 염소, 불소, 브롬 또는 트리플루오로메틸인 11항의 화합물;
- 23)  $R^8$  및  $R^9$  중 하나가 수소이고, 다른 하나는 할로겐, 트리플루오로메틸, 메틸 또는 메톡시인 11항의 화합물;
- 24) ROI 페닐인 12항의 화합물;
- 25) ROI 피리딜, 티에닐, 푸릴, 벤조티에닐, 벤조푸릴, 벤조티아졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴인 12항의 화합물;
- 27) ROI 페닐 또는 나프틸인 12항의 화합물;
- 28) ROI 피리딜, 벤조티아졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴인 12항의 화합물;
- 29) ROI 티에닐, 푸릴, 벤족사졸릴, 벤조티아졸릴, 벤조티에닐, 벤조푸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴인 12항의 화합물;
- 30)  $R^8$  및  $R^9$  중 하나가 수소이고 다른 하나는 할로겐 또는 트리플루오로메틸인 12항의 화합물;
- 31)  $R^8$  및  $R^9$ 가 각각 독립적으로 염소, 불소, 또는 브롬인 12항의 화합물;
- 32)  $R^7$  및  $R^9$ 가 각각 독립적으로 염소, 불소, 브롬 또는 트리플루오로메틸인 12항의 화합물;
- 33)  $R^8$  및  $R^9$  중 하나가 수소이고, 다른 하나는 할로겐, 트리플루오로메틸, 메틸 또는 메톡시인 12항의 화합물;
- 34) ROI 페닐인 13항의 화합물;

- 35) R<sup>10</sup>이 페닐 또는 피리딜인 13항의 화합물;
- 36) R<sup>10</sup>이 피리딜, 티에닐, 푸릴, 벤조티에닐, 벤조푸릴, 벤조티아졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴인 13항의 화합물;
- 37) R<sup>10</sup>이 페닐 또는 나프틸인 13항의 화합물;
- 38) R<sup>10</sup>이 피리딜, 벤조티아졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴인 13항의 화합물;
- 39) R<sup>10</sup>이 티에닐, 푸릴, 벤족사졸릴, 벤즈티아졸릴, 벤조티에닐, 벤조푸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴인 13항의 화합물;
- 40) R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>중 하나가 수소이고 다른 하나는 할로겐, 또는 트리플루오로메틸인 13항의 화합물;
- 41) R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>이 각각 독립적으로 염소, 불소 또는 브롬인 13항의 화합물;
- 42) R<sup>7</sup> 및 R<sup>9</sup>가 각각 독립적으로 염소, 불소, 브롬, 트리플루오로메틸인 13항의 화합물;
- 43) R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>중 하나가 수소이고, 다른 하나는 할로겐, 트리플루오로메틸, 메틸, 또는 메톡시인 13항의 화합물;

상기 구조식 화합물도 구조식(1) 화합물의 화합물이지만 다음 기술하는 화합물은 본 발명을 농화학자들에게 더욱 잘 이해시키기 위해 제시한 것이다.

- N-[5-(6-클로로-3-피리딜)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4-디클로로-3-피리딜)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4,5-디브로모-3-피리딜)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(5-브로모-2-피리딜)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4-클로로-2-피리딜)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(5-브로모-3-클로로-2-피리딜)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(3,4,5-트리클로로-2-피리딜)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(3-푸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(5-클로로-2-푸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(5-브로모-3-티에닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(5-메틸-2-티에닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(3-클로로-1-나프틸)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(2-브로모-1-나프틸)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4-플두오로-2-나프틸)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(3-트리플두오로메틸-2-나프틸)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-브로모-6-플로오로벤즈아마이드  
 N-[5-(3-브로모페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-플루오로-6-메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(3-요도페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-플루오로-6-메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(3-메틸페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-클로로-6-메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(3-하이드록시페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-브로모-6-메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(3-페닐페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(3-(3-플루오로페닐)페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4-(3-브로모페닐)페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4-(2-클로로페닐)페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(3-(4-클로로페닐)페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(3,4-디브로모페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-메톡시-6-메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(3,4-디플루오로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(3,4-디플루오로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(3,5-디브로모페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(3-클로로-5-트리플루오로메틸페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

N-[5-(3-브로모-5-플루오로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-메톡시-6-메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(2,4-디브로모페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(4-플루오로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디플루오로벤즈아마이드  
 N-[5-(2-브로모-4-플루오로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4-브로모-2-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4-트리플루오로메틸페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디클로로벤즈아마이드  
 N-[5-(2-브로모페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-메톡시-6-메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(6-클로로-1-나프틸)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(5-플루오로-2-나프틸)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(7-트리플루오로메틸-1-나프틸)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4,5,6-트리클로로-3-피리딜)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-브로모-4,6-디클로로-3-피리딜)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(3,4,5-트리브로모-2-피리딜)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-메톡시-6-메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(3-브로모-4,6-디클로로-2-피리딜)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4-메틸-2-티에닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(4-브로모-5-메틸-2-티에닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-메톡시-6-메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(4,5-디클로로-2-티에닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(2-벤조옥시졸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(2-벤조[b] 티에닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(2-벤조[b] 푸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(5-이속사졸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(2-티아졸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4-요도페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-클로로-6-메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4-요도페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디클로로벤즈아마이드  
 N-[5-(3-요도페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-브로모-6-메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(5-트리플루오로메틸-2-나프틸)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(4-클로로-1-나프틸)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-메톡시-6-메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(2-푸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(5-브로모-3-푸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-메톡시-6-메틸벤즈아마이드  
 N-[5-(6-브로모-2-벤조[b] 티에닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(4-메틸-2-벤조[b] 티에닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(5-클로로-2-벤조[b] 푸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드  
 N-[5-(7-메틸-2-벤조[b] 푸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

바람직한 구조식(I)의 화합물에는 N-[5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드, N-[5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드, N-[5-(4-플루오로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드, N-[5-(4-트리플루오로메틸페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드, N-[5-(4-플루오로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드, N-[5-(3-트리플루오로메틸페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드, N-[5-(3-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드, N-[5-(3,5-비스(트리플루오로메틸)-페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드, 및 N-[5-(4-트리플루오로메틸페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드 등이 있다.

구조식(I)의 화합물 구조식(II)의 2-아미노-5-R-치환된 1,3,4-티아디아졸을 구조식(III)의 벤조일할라이드로 아실화시켜 제조한다.

아실화 반응은 테트라하이드로푸란, 디메틸포름아마이드, 디메틸설폭사이드 또는 디에틸에틸과 같은 반응용매내에서 염기존재하에 수행한다. 바람직한 염기는 수소화 나트륨이며 피리딘, 트리에틸아민 또는 트리에탄올아민과 같은 유기염기를 사용할 수도 있지만 수산화나트륨, 탄산칼륨 또는 증탄산리튬과 같은 무기염기도 사용할 수 있다. 반응온도는  $-10^{\circ}$  내지  $25^{\circ}\text{C}$ 이다.

중가물질인 아미노티아디아졸은 잘 알려진 반응에 의해 제조한다. 일반적으로, 티오세미카바존을 산화적 폐환, 바람직하기로는 염화제2철로 폐환시키거나 또는 티오세미카바자이드를 강 산으로 탈수적 폐환시켜

제조한다. [참조 : 상기의 Rao와 cebalo가 발명한 문헌]

유기 화학자들이 잘 아는 바와같이 구조식(1)의 화합물을 제조하는데 모든 출발물질은 통상의 기술에 의해 제조할 수 있다.

다음 실시예는 본 발명 화합물의 제조에 관한 것이고 제조에는 출발물질의 제조에 관한 것이며 모든 실시예의 화합물은 핵자기공명분석, 원소분석 및 어떤 경우에는 적외선 분석 및 질량분석에 의해 확인된다.

다음 제조예는 염화 제2철에 산화적 폐환반응시켜 출발물질인 티아디아졸을 제조하는 방법에 관한 것이다.

[제조예 1]

2-아미노-5-(4-피리딜)-1,3,4-티아디아졸

9.0g의 4-피리딜알데히드, 티오세미카바존을 450ml의 에탄올에 가하고 54g의 염화 제2철 핵사하이드레이트를 가한다. 혼액을 환류온도에서 1시간 교반하고 냉각시킨후 용매를 진공하에 제거한다. 잔사를 40ml의 냉각시킨 농염산과 혼합하고 혼액을 냉장고에 철야 저장한다. 혼액을 여과한후 고체물질을 15ml씩의 농염산으로 3회 세척하고 물에 용해한다. 용액의 PH를 수산화나트륨을 가해 8.0으로 맞추고 혼액을 다시 여과한다. 고체물질을 에탄올로 세척하고 세척액을 증발, 건조시킨후 생성된 잔사를 아세톤으로 재결정시켜 1.3g의 2-아미노-5-(4-피리딜)-1,3,4-티아디아졸을 수득한다. 융점 : 234~236°

	계산치	실측치		계산치	실측치
탄 소	47.18%	47.02%	질 소	31.44%	31.39%
수 소	3.39	3.45			

다음 2가지 제조예는 메탄설폰산 또는 황산으로 탈수적 폐환반응시켜 출발물질을 제조하는 방법에 관한 것이다.

[제조예 2]

2-아미노-5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸

50g의 1-(4-클로로벤조일)티오세미카바자이드를, 교반하면서 온도를 35° 이하로 유지하며, 330g의 메탄설폰산에 서서히 가한다. 혼액을 5시간 교반한 후 1ℓ의 빙수에 가한다. 혼액의 PH를 수산화암모늄을 가해 pH7.5로 맞추고 침전된 고체물질을 여과하여 분리한후 건조시킨다. 고체물질을 에탄올 재결정시켜 33.3g의 2-아미노-5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸을 수득하며 이는 NMR 스펙트럼으로 분석하여 동일 물질임을 확인한다.

	계산치	실측치		계산치	실측치
탄 소	45.39%	45.61%	질 소	19.85%	19.70%
수 소	2.86	3.12			

[제조예 3]

2-아미노-5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸

4.78g의 1-(4-클로로벤조일)-티오세미카바자이드를 실온에서 48g의 농황산에 서서히 가한다. 가하는 동안 온도를 약 10° 로 올려준다. 혼액을 실온에서 6시간 교반한다. 반응혼액을 얼음에 붓고 PH를 수산화암모늄을 가해 염기성인 7.5로 맞추어 염기성화시킨후 여과하고 건조된 고체물질을 에탄올로 재결정시켜 2.4g의 2-아미노-5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸을 수득한다. 융점 : 221°

	계산치	실측치		계산치	실측치
탄 소	45.39%	45.28%	질 소	19.85%	20.02%
수 소	2.86	2.63			

다음 실시예들은 본 발명의 화합물을 제조하기 위한 전형적인 아미노티아디아졸의 아실화반응이다.

[실시예 1]

N-[5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디클로로벤즈아마이드

4g의 2-아미노-5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸을 실온에서 200ml의 테트라하이드로푸란에 녹인 용액에 냉각, 교반하면서 기름층의 50% 수소화나트륨 1.85g을 가한다. 냉각용 맨틀을 제거하고 반응 혼액을 15분간 교반한후 4.8g의 2,6-디클로로벤조일 클로라이드를 적가한다. 혼액을 1시간 더 교반하고 과량의 수소화나트륨을 물에 가하여 분해시킨다. 용매를 증발시키고 잔사를 물에 현탁시킨후 염산을 가해 산성화시킨다. 고체물질을 여과하여 산용액으로부터 분리시킨 후 건조시키고 에틸아세테이트로 재결정시켜 4g의 N-[5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디클로로벤즈아마이드를 얻는다. 융점 : 260° 이

상

	계산치	실측치		계산치	실측치
탄 소	46.84%	46.60%	질 소	10.92%	10.75%
수 소	2.10	1.90			

[실시에 1a]

N-[5-(3-하이드록시페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

1.9g의 2-아미노-5-(3-하이드록시페닐)-1,3,4-티아디아졸을 100ml의 피리딘에 녹이고 2.2g의 2,6-디메톡시벤조일 클로라이드를 가한다. 반응혼액을 30° 이하로 냉각하며 3시간 교반한다. 휘발성 물질을 진공하에 증발시키고 잔사를 물로 희석한 후 수용성혼액을 3시간 교반하고 고체물질을 모아 아세톤으로 재결정시켜 1.3g의 N-[5-(3-하이드록시페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드를 수득한다. 융점 : 243°

	계산치	실측치		계산치	실측치
탄 소	57.13%	57.38%	질 소	11.76%	12.01%
수 소	4.23	4.36			

다음 실시예 화합물은 일반적으로 실시예 1과 1a의 제법에 따라 제조한다. 후술한 각 실시예에서 아미노티아디아졸과 벤조일 할라이드의 치환체를 생성물의 명칭으로 부터 명확히 알 수 있다. 실시예 화합물은 처음엔 화합물명만을 언급하고 반응물의 양, 생성물의 수득량, 융점 및 원소분석 결과는 표로 만들어 제시기로 한다.

[실시에 2]

N-[5-(1-나프틸)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시 벤즈아마이드

[실시에 3]

N-[5-(2,4-디클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 4]

N-[5-(4-하이드록시페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 5]

N-[5-(3,5-디클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 6]

N-[5-(3-플루오로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 7]

N-[5-(4-피리딜)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 8]

N-[5-(4-시아노페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 9]

N-[5-[3,5-비스(트리플루오로메틸)페닐]-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 10]

N-[5-(2-플루오로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 11]

N-(5-페닐-1,3,4-티아디아졸-2-일)-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 12]

N-[5-(4-트리플루오로메틸페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 13]

N-[5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2-클로로-6-메틸벤즈아마이드

[실시에 14]

N-[5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디플루오로벤즈아마이드

[실시에 15]

N-[5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드



[실시예 16]

N-[5-(4-브로모페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디클로로벤즈아마이드

[실시예 17]

N-[5-(4-플루오로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디클로로벤즈아마이드

[실시예 18]

N-[5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 19]

N-[5-(3,4-디클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드

[실시예 20]

N-[5-(4-플루오로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드

[실시예 21]

N-[5-(4-트리플루오로메틸페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드

[실시예 22]

N-[5-(4-브로모페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드

[실시예 23]

N-[5-페닐-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드

[실시예 24]

N-[5-(4-플루오로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 25]

N-[5-(2-티에닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 26]

N-[5-(2-푸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 27]

N-[5-(4-메틸페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 28]

N-[5-(4-페닐페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 29]

N-[5-(3-트리플루오로메닐)-1,3,4-페닐티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 30]

N-[5-(3-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 31]

N-[5-(4-트리플루오로메틸페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 32]

N-(5-페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 33]

N-[5-(4-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 34]

N-[5-(3-트리플루오로메틸페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 35]

N-[5-[4-(4-브로모페닐)페닐]-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 36]

N-[5-[4-(4-클로로페닐)페닐]-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 37]

N-[5-(4-브로모페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 38]

N-[5-[4-(4-플루오로페닐)페닐]-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 39]

N-[5-(2-나프틸)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 40]

N-[5-(3,4-디클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 41]

N-[5-(3-하이드록시페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 42]

N-[5-(4-메톡시페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 43]

N-[5-(4-니트로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 44]

N-[5-(3-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드

[실시예 45]

N-[5-(2-나프틸)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드

[실시예 46]

N-[5-(3,5-비스(트리플루오로메틸)페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메틸벤즈아마이드

[실시예 47]

N-[5-(3-티에닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 48]

N-[5-(3-푸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 49]

N-[5-(5-브로모-2-푸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 50]

N-[5-(4-요도페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 51]

N-[5-(5-브로모-3-피리딜)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 52]

N-[5-(5-클로로-2-티에닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시예 53]

N-[5-(3-이속사졸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[표 a]

실시예 번호	아미노- 티아디아졸	벤조일클 로라이드	생성물	용점 °C	%C	%H	%N
2	2.3g	2.2g	2.0g	209—210	64.24	4.58	10.88
3	2.5	2.2	2.3	>260	49.56	3.17	10.30
4	2.0	2.3	1.5	>260	57.38	4.45	11.55
5	2.5	2.2	2.5	249—251	49.89	3.25	10.49
6	2.0	2.2	2.3	216—218	57.00	4.07	11.75
7	1.3	1.6	1.5	241—243	55.89	4.11	16.06
8	2.0	2.2	1.8	>260	58.82	3.85	15.09
9	3.2	2.2	2.1	236—237	48.01	2.81	9.07
10	2.0	2.2	1.6	248—249	57.12	3.74	11.77
11	3.5	4.5	3.0	232—237	51.22	2.59	11.99
12	2.3	2.4	2.3	>260	45.96	1.90	9.96
13	2.0	2.0	2.5	258—260	52.61	2.91	11.58

[표 b]

14	2.0	2.0	0.8	>260	50.97	2.57	11.86
15	2.0	2.0	1.8	247-249	59.42	4.22	11.94
16	2.4	2.4	2.8	>260	42.27	2.18	9.88
17	2.0	2.4	1.8	254-256	47.84	4.55	11.24
18	2.1	2.3	2.6	238-240	54.12	4.07	11.11
19	2.4	2.0	1.9	>260	54.35	3.66	11.16
20	2.0	2.0	1.7	231-233	62.16	4.52	12.70
21	2.3	2.0	1.9	240-242	57.19	4.04	11.30
22	2.4	2.0	0.5	250-252	52.23	3.80	11.11
23	2.7	3.0	2.8	248-250	65.72	4.77	13.28
24	2.0	2.3	1.9	249-251	57.11	3.95	11.53
25	2.0	2.4	2.6	256-259	52.06	3.92	11.74
26	2.0	2.6	1.6	233-235	54.39	4.12	12.52
27	2.6	3.1	3.1	228-230	60.63	4.77	11.66
28	2.5	2.8	2.4	236-239	66.02	4.92	10.98
29	2.7	2.9	2.8	183-185	52.59	3.43	10.49
30	2.5	2.9	1.3	213-214	54.60	4.02	11.38
31	2.4	2.2	3.0	217-220	52.56	3.97	10.37
32	1.8	2.2	2.0	253-255	60.09	4.77	11.99
33	2.1	1.9	2.3	214-216	55.40	3.63	11.61
34	2.4	2.0	1.8	>260	57.10	3.82	11.19
35	3.3	2.4	1.9	259-261	55.45	3.53	8.84
36	2.9	2.4	1.0	259-261	61.02	3.84	9.36
37	2.6	2.2	2.4	240-243	48.96	3.55	10.29
38	1.6	1.1	1.4	255-257	69.08	4.19	10.00
39	2.3	2.2	2.2	230-232	64.43	4.66	11.01
40	2.5	2.2	2.5	235-237	50.04	3.24	10.23
41	1.9	2.2	1.3	243-245	57.36	4.36	12.01
42	2.5	2.0	2.4	239-241	58.29	4.88	11.46
43	2.7	2.9	1.8	>260	53.07	3.51	14.36
44	2.1	1.9	2.0	>260	59.24	4.27	12.17
45	2.3	1.9	1.3	235-237	69.91	4.95	11.43
46	3.1	1.8	2.0	230-232	51.16	2.68	9.36
47	1.8	2.2	1.6	>260	52.13	3.82	12.06
48	1.7	2.2	2.1	255-257	54.23	4.22	12.44
49	1.5	1.3	1.7	207-209	49.72	3.10	10.18
50	1.7	1.3	2.7	180-182	43.85	3.12	8.85
51	2.6	2.2	2.6	259-261	45.89	3.21	13.02

[표 c]

52	1.0	1.1	1.5	259-260	47.46	3.36	11.14
53	0.5	0.6	0.3	228-229	50.39	3.85	16.62

실시에 1 및 1a의 방법으로, 다음의 화합물도 제조할 수 있다.

[실시에 54]

N-[5-(5-클로로-2-벤조[b] 티에닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 55]

N-[5-(2-벤조티아졸릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 56]

N-[5-(2-클로로페닐)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 57]

N-[5-(2-퀴놀릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

[실시에 58]

N-[5-(3-퀴놀릴)-1,3,4-티아디아졸-2-일]-2,6-디메톡시벤즈아마이드

구조식(1)의 화합물을 살아있는 곤충에 대해 절저히 시험하여 살충제로서의 효능범주를 결정한다. 다음 시험에는 전형적인 실험이다.

대부분의 경우 어떤 투여율도 반복하여 시험을 실시하며 이 시험의 결과를 평균한 것이다. 다음 데이터 표중의 빈칸은 그 투여율에 있어서 시험을 하지 않았음을 나타내는 것이다. 화합물은 실시예 번호와 동일하다.

[시험예 1]

멕시코산콩 딱정벌레와 남부산 구더기에 대한 시험

시험코자하는 각 화합물 10mg을 l 당 23g의 독시물(Toximul) R과 13g의 독시물 S를 함유한 무수에탄올/아세톤 1:1 혼합용매 1ml에 10mg의 화합물을 용해시켜 제제화한다. "독시물"이란 미합중국 일리노이주

노스필드에 있는 스테판 화학주식회사에 의해서 제조된 설포네이트 비이온성 물질을 혼합한 계면활성 물질의 상품명이다) 각 시료를 9m<sup>2</sup>의 물에 분산시켜 1000ppm 농도의 시험화합물 용액을 제조한다. 이 분산액은 필요에 따라 물로 희석하여 더 낮은 농도로 만든다. 분산액을 10일된 콩과식물에 골고루 분무하고 식물을 마를때까지 방치한다.

식물로부터 잎을 떼내어 잎의 절단 끝부분을 물에 적신솜으로 싸준다. 2개의 잎을 각각 100mm짜리 플라스틱 페트리 접시에 놓고, 각 접시에 두번째 또는 세번째 탈바꿈한 멕시코산 콩 딱정벌레 (*Epilachna varivestis*) 애벌레 (*Epilachna varivestis*) 5마리와 두번째 또는 세번째 탈바꿈한 남부산 구더기 유충 (*Spodoptera erdania*) 5마리를 놓는다. 각 시험에 대해 세개의 반복용 접시를 이용한다. 접시를 약 25°, 51% 상대습도에서 4일간 방치하고 먼저 살충제 효능을 측정한다. 몇개의 접시는 조건이 조정되어 있는 방에 3일간 더 방치하고 또한번 측정한다.

살충제 효율을 용매로만 처치한 대조용과 비교하여 다음과 같은 스케일로 정한다 :

0=박멸효과 없음, 대조용

1=1 내지 7마리의 유충이 죽음

2=8 내지 14마리의 유충이 죽음

3=15마리의 유충이 죽음

다음 표는 전형적인 화합물의 시험결과이다.

[표 1a]

화합물의 시험 시 번호	부어 용 ppm	멕시코산 콩 딱정벌레		남부산구더기		화합물의 시험 시 번호	부어 용 ppm	멕시코산 콩 딱정벌레		남부산구더기	
		4일	7일	4일	7일			4일	7일	4일	7일
1	1000	0	1	3	3	14	100	1	1	2	2
	100	0	0	1	1		1000	0	0	2	2
2	1000	1	2	2	2	15	100	0	0	0	0
	100	0	1	0	1		1000	2	2	3	3
3	1000	1	2	2	2	16	100	1	2	2	3
	100	1	1	1	0		50	2	3	1	2
4	1000	1	2	0	0	17	25	1	2	1	1
	100	1	2	0	0		1000	0	0	2	2
5	1000	0	0	3	3	18	100	0	0	0	0
	100	0	0	2	3		1000	0	0	3	3
6	1000			1	2	19	100	0	0	1	1
	50			1	2		100	0	0	3	3
7	1000			0	2	20	1000	2	3	3	3
	100			0	2		100	2	2	3	3
8	1000	1	2	3	3	21	50	2	2	2	2
	100	0	2	2	2		25	2	2	1	2
9	1000	2	3	2	3	22	10	1	2	0	1
	100	0	0	0	0		1000	1	1	0	3
10	1000	0	0	2	2	23	100	0	0	0	0
	100	0	0	0	0		1000	1	2	3	3
11	1000	1	1	3	3	24	100	2	2	2	3
	100	0	1	3	3		50	2	3	2	2
12	1000	1	1	3	3	25	25	2	3	1	2
	50	1	1	3	3		20	1	3	1	2
13	1000	2	2	2	3	26	10	1	2	1	1
	25	2	2	2	3		10	1	2	1	1
14	1000	1	1	2	2	27	1000	2	3	3	3
	100	1	1	2	2		100	1	2	2	2
15	1000	0	0	3	2	28	50	0	1	1	2
	100	0	0	0	0		25	0	1	0	1
16	1000	0	0	3	3	29	1000	2	2	3	3
	100	0	0	0	0		100	1	2	2	2
17	1000	0	0	3	3	30	50	1	2	1	2
	100	0	0	1	1		25	1	1	0	0
18	1000	1	2	3	3	31	1000	1	2	2	3
	100	1	2	3	3		1000	1	2	2	3

[표 1b]

	100	1	2	0	0		100	0	0	1	2
24	1000	2	3	3	3	37	1000	0	2	1	3
	100	1	2	3	3		100	1	2	3	3
	50	1	2	2	2		50	1	3	1	2
	25	0	2	1	2		25	1	2	2	2
25	1000	1	0	3	2	38	1000	0	0	3	3
	100	0	0	0	0		100	1	1	2	2
26	1000	2	2	2	2		50	0	1	2	2
	100	1	2	0	1		25	0	1	0	1
27	1000	1	3	2	2	39	1000	0	1	2	1
	100	0	2	0	0		100	1	1	1	0
28	1000	0	0	3	3	40	1000	1	1	3	3
	100	0	0	2	2		100	0	0	1	1
29	1000	2	2	3	3	41	1000	1	2	0	0
	100	2	2	2	3		100	0	0	0	0
	50	2	2	2	2	42	1000	2	0	2	0
	25	2	2	2	3		100	0	0	0	0
	10	1	2	2	2	43	1000	2	0	2	0
	5			1	2		100	0	0	0	0
	2.5			1	1	44	1000	2	0	1	0
30	1000	2	3	2	3		100	0	0	0	0
	100	2	2	2	2	45	1000	1	0	1	0
	50			1	2		100	0	0	0	0
	25			1	1	46	1000	1	2	3	3
31	1000	2	3	3	3		100	0	0	3	3
	100	2	2	3	3	47	1000	1	3	0	0
	50	3	3	3	3		100	0	0	0	0
	25	3	3			48	1000	1	1	2	2
	10	2	3				100	0	0	0	0
32	1000	2	3	3	3	49	1000	3	3	2	3
	100	0	1	0	0		100	1	2	3	3
33	1000	0	1	3	3	50	1000	3	3	3	3
	100	0	0	0	0		100	2	3	2	2
34	1000	2	2	2	2		50	3	2	1	1
	100	0	0	0	0		10	1	2	1	1
35	1000	0	0	2	3	51	1000	0	1	2	2
	100	0	0	0	0		100	0	0	0	1
36	1000	0	0	3	3	52	1000	1	1	2	3

[표 1c]

	100	0	0	1	1		100	0	2	1	1
53	1000	1		3		56	1000	1	3	2	1
	100	0		0			100	1	2	1	1
54	1000	0	2	0	1	57	1000	2		0	
55	1000	1	3	1	3	58	1000	2	3	0	2

[시험예 2]

멕시코산 콩 딱정벌레 출현시험

이 시험은 대표적 화합물이 성충 멕시코산 콩 딱정벌레가 번데기로부터 출현하는 것을 어느정도 방지할 수 있는가를 결정하기 위한 실험이다.

화합물은 상기 시험예 1에 기술한 바대로 제제화한다. 콩과식물은 시험예 1에 기술한 대로 처리하고 처리된 식물의 잎을 페트리 접시에 놓아 3번째 바꿈한 멕시코산 콩 딱정벌레 유충을 위한 숙주로 사용한다. 각 접시에 3마리의 유충을 사용한다. 새잎을 필요한대로 접시에 유충이 번데기가 될때까지 약 3내지 5일간에 걸쳐 가하고 깨끗한 페트리접시에 번데기를 놓는다. 7내지 10일간후 출현된 멕시코산 콩 딱정벌레 성충의 수를 세어 용매로만 처리한 대조용과 비교하여 출현의 억제 백분율을 결정한다. 여러개의, 유충이 담긴 접시를 다른 여러가지 시험에 이용하며 각 경우마다 모든 접시를 모아 억제 백분율을 결정한다.

[표 2]

화합물의 실시예 번호	농도 ppm	억제백분율 %	화합물의 실시예 번호	농도 ppm	억제백분율 %
15	100	100	24	100	100
	50	100		50	100
	25	100		25	100
	10	100		10	100
18	100	100	29	100	100
	50	100		50	100
	25	100		25	100
	10	100		10	100
20	100	100	30	100	100
	50	100		50	100
	25	100		25	100
	10	100		10	100
21	100	100	31	100	93
	50	48		50	50
	25	3		25	65
	10	11		10	50

[시험예 3]

멕시코산 콩 딱정벌레의 생활사 시험

이 시험은, 낮은 세번째 탈바꿈단계에 있는 유충을 사용하여 상기 시험예 1에 따라 실시한다. 유충을, 살 유충 효과를 결정하기 위해 3일후에 검사하고 유충이 번데기가 된후 출현된 성충의 수를 세어 성충의 출현 정도를 결정한다. 대조용의 것 모두는 성충이 출현한다.

[표 3]

화합물의 실시예 번호	투여율 ppm	유충억제 백분율%	성충출현 백분율%	화합물의 실시예 번호	투여율 ppm	유충억제 백분율%	성충출현 백분율%
1	1000	60	12		50	60	0
	100	70	0		25	50	0

[시험예 4]

이 시험을 두번째 탈바꿈한 유충을 사용하여 시험예 3의 방법으로 실시하고 처리후 3, 8과 21일후에 세 차례 관찰을 한다. 먼저 두번의 관찰은 유충이 번데기가 아직 되지 않은때의 살유충 효과에 관한 것이고, 21일째의 관찰은 번데기로부터 성충의 출현정도를 측정하기 위한 것이다. 각 경우 관찰결과와 대조용의 유충과 비교하여 억제백분율로 표시한다.

[표 4]

화합물의 실시예 번호	투여율 ppm	억제백분율 %			화합물의 실시예 번호	투여율 ppm	억제백분율 %		
		3일	8일	21일			3일	8일	21일
1	1000	0	20	100		1000	11	100	100
11	1000	0	0	42	18	100	22	100	100
12	1000	0	6	100		10	0	60	100
13	1000	0	100	100		1	0	0	71

[시험예 5]

검정 청파리에 대한 시험

이 시험은 검정 청파리(Phormia regina)에 대한 전형적인 화합물의 효능을 측정하기 위한 것이다.

각각의 시험화합물 4mg을 0.4ml의 아세톤에 용해시키고 이를 40g의 균질화시킨 소의 간과 혼합하여 100ppm 농도가 되어 제제화한다. 더 낮은 농도의 화합물 용액은 다른 적당한 양의 화합물을 함유한 아세톤 용액을 사용하여 제조한다.

처리된 간을 2개의 250cc들이 플라스틱컵에 나누어 놓고 각각에 2일된 청파리 유충 10마리를 넣는다. 간을 나무조각에 놓고 여러개의 조각으로 덮어준다. 용매로만 처리된 대조용 컵을 포함한 모든 컵을 유충이 번데기가 될때까지 온도와 습도가 조절된 방에 방치한다. 번데기를 모두 꺼내어 깨끗한 플라스틱 페트리 접시에 놓고 번데기로부터 성충이 출현할 때까지 놓아둔다.

컵당 번데기 수를, 페트리 접시에 놓으면서 기록한다. 접시당 출현된 성충의 수도 역시 기록한다. 성충 억제백분율은 다음 표와 같다.

[표 5]

화합물의 실험 번호	투여율 ppm	출현억제 백분율%	화합물의 실험 번호	투여율 ppm	출현억제 백분율%
15	100	0	18	1	0
	10	0		100	100
	10	15		1	0
20	1	0	29	100	20
	100	45		10	0
	10	0		1	0
21	1	0	30	100	10
	100	25		10	0
	10	0		1	0
24	1	0	31	100	25
	100	100		10	0
	10	45		1	0

[실험예 6]

더 큰 왁스 나방 유충제거 시험

이 시험은 꿀벌의 기생충인 더 큰 왁스 나방(Galleria mellonella)에 대한 어떤 화합물의 작용을 측정하기 위한 것이다.

원하는 농도의 화합물 총분량을 5ml의 아세톤에 용해시키고 25g의 어린이용オート밀, 10.6ml의 꿀, 8.0ml의 글리세린, 5.3ml의 물 및 0.5ml의 액체 비타민 보충제를 함유한 49g의 먹이와 혼합한다. 아세톤을 증발시키고 처리한 먹이를 3개의 페트리접시에 나누어 후 각각에 두번 탈바꿈한 유충 세번 탈바꿈한 유충 5마리씩을 넣어준다. 접시를 조절된 방에 7일간 방치하고 유충 억제 백분율을 대조용과 비교하여 측정한다.

[표 6]

화학물의 실험시예 번호	투여율 ppm	여제백분율 %	화학물의 실험시예 번호	투여율 ppm	여제백분율 %
15	500	100	24	100	100
	100	100		50	86
	50	100		25	13
	25	13		12.5	0
	12.5	0		500	100
18	500	0	29	100	100
	100	0		50	13
	50	0		25	0
	25	0		12.5	0
	12.5	0		500	100
20	500	100	30	100	100
	100	100		50	0
	50	0		25	0
	25	0		20	0
	12.5	0		12.5	13
21	500	100	31	10	0
	5	0		100	13
	2.5	0		50	0
30	500	0	36	25	0
	100	0		20	7
	50	0		12.5	0
	25	0		10	0
	12.5	0		5	0
31	500	100		2.5	0

[실험예 7]

멕시코산 콩 딱정벌레의 부화억제작용 시험

이 시험은, 전형적인 구조식(1)의 화합물 100ppm을 함유한 분산액으로 처리된 콩과 식물에 멕시코산 콩 딱정벌레 성충을 노출시켜 실시한다. 딱정벌레 성충을 암컷이 알을 낳 때까지 처리된 식물 위에 놓아두고 20 내지 30개의 알을 함유한 알덩어리를 모으고 부화시킨다. 실시예 36의 화합물로 처리된 식물을 먹은 딱정벌레로부터 얻은 알은 부화하지 않는다. 화합물은 이 화합물로 처리된 잎을 먹은 딱정벌레의 알을 완전히 부화하지 못하게 한다.

[실험예 8]

밭에 자라는 브로콜리의 나비목 곤충에 대한 시험

구조식(1)의 화합물을 밭에서 자라고 있는 브로콜리의 나비류 곤충에 대해 시험한다. 브로콜리를 묘판에 이식하고 이식한 후 약 4주일만에 처치를 시작한다.

다음 표에 있는 화합물을 수화제로 제제화하고 다음 표와 같은 투여율의 농도로 물에 분산시킨 후 이분액을 약 1000 l/ha의 비율로 분무한다.

화합물을 7일간의 간격으로 3회 투여하고 식물에 감염된 곤충의 수를 3회 투여 후 7일만에 센다.

화합물을 사용하여 얻은 곤충 박멸결과를 비처리된 대조용 식물에 감염된 곤충의 수와 비교하여 곤충 수효의 감소 백분율로서 표시하며 다음 표와 같다. 브로콜리는 주로 2가지종(pieris rapae와



Trichoplusiani)에 의해 감염된다. 이러한 2종에 대한 박멸정도는 다음 표와 같다.

화합물의 실시 번호	투여율 kg/ha	억제백분율 %		
		양배추벌레 피에리스 라파에	양배추자벌레 트리코플루시아니	총 나비류 곤충
9	0.14	91	72	83
	0.28	100	31	72
	0.56	100	66	86
	1.1	100	79	92
15	0.14	40	0	11
	0.28	49	52	50
	0.56	72	17	50
	1.1	91	45	72
18	0.14	49	24	39
	0.28	77	38	61
	0.56	67	45	58
	1.1	91	52	75
29	0.14	44	17	33
	0.28	77	59	66
	0.56	95	24	67
	1.1	91	59	78
31	0.14	95	72	86
	0.28	86	62	72
	0.56	95	72	86
	1.1	100	31	72

[시험예 9]

밭에 자라는 브로콜리의 양배추 벌레에 대한 시험

이 시험은 화합물을 3회 대신 2회만 투여하여 상기 8에 기술된 방법에 따라 실시된다. 이 시험에 사용되는 단 하나의 곤충은 피에리스 라파에이다.

[표 9]

화합물의 실시 번호	투여율 kg/ha	억제백분율 %	화합물의 실시 번호	투여율 kg/ha	억제백분율 %
9	0.28	97	29	1.1	97
	0.56	97		2.2	97
	1.1	100		0.28	75
15	2.2	100	31	0.56	88
	0.28	65		1.1	97
	0.56	81		2.2	97
	1.1	94		0.28	97
18	2.2	97	31	0.56	100
	0.28	66		1.1	100
	0.56	81		2.2	100

상기 시험데이터 결과와 같이, 구조식(1)의 화합물은 강력한 살충효과를 지닌다. 본 발명 화합물은 인류에게 해를 미치며 경제상으로 해가되는 여러가지 목(目)의 곤충을 억제하는데 매우 유용하다.

예를들어 본 발명에 따른 화합물은 다음과 같은 곤충을 박멸하는데 유용하다 :

안토노무스 그란디스(Anthonomus grandis), 크램부스 카리기노셀루스(Crambus caliginosellus), 오우레 마 메라노푸스(Oulema melanopus), 랩티노타르사 데셈리네아타(Leptinotarsa decemlineata), 히페라 포스티카(Hypera postica), 안트레누스 스크로푸라리아에(Anthrenus sdrophulariae), 트리보리움 콘푸숨(Tri-bolium confusum), 락티다에(Lyctide)속, 아그리오테스(Agrioties)속, 시토피루스 오리자에(Sytophilus oryzae), 노도노라 폰크티콜리스(Nodonota puncticollis)와 코노트라케루스 네루파르(Contrachelus nerup-her)와 같은 딱정벌레목; 무스카 도매스티카(Musca domestica), 스토목시스 칼시 트란스(Stomoxys calcit-rans), 하에마토비아 이리탄스(Haematobia irritans), 포르미아 레기나(Phormia regina), 히레미아 브라시카에(Hylemya brassicae)와 프시라 로사에(Psila rosae)와 같은 파리목; 라스

페이레시아 포모넬라(Laspe-yresia pomonella), 에옥소아(Euxoa)속, 프로디아 인테르폰크텔라(Plodia interpunctella), 라르트리시다에(Tartrididae)속, 헬리오티스 제아(Heliothis zea), 오스트리니아 누비라리스(Ostrinia nubilalis), 헬루라 로가타리스(Hellula rogatalis), 트리코프루시아 니(Trichoplusia ni)와 스포도프테라 프루기페르다(Spodoptera frugiperda)와 같은 나비목과 브라텔라 게르마니카(Blattella germanica)와 페리프라네타 아메리카나(Periplaneta americana)와 같은 메뚜기목.

본 발명 화합물은 해로운 곤충의 수를 감소시키는데 유용하며 본 발명의 화합물 중의 하나를 살충 유효량으로 곤충이 섭취하는 물질에 투여하여 곤충수를 줄이는 방법에 사용한다.

곤충이 섭취하려는 어떤 물질에 본 발명 화합물을 처리하여 곤충이 본 발명의 화합물을 섭취하게끔 한다. 예를들어, 식물을 섭취하는 곤충은 곤충이 먹은 식물부분, 특히 잎에 화합물을 처리하여 쉽게 박멸할 수 있고, 직물, 종이, 목제품 등을 섭취, 소모하는 곤충은 이러한 물질에 화합물을 처리하여 투여하여 쉽게 박멸할 수 있다. 또한 본 발명 화합물은 저장된 곡물 또는 씨앗을 보호하는 데도 유효하게 사용될 수 있다.

본 발명 화합물이 이러한 유용한 것들을 섭취하는 곤충의 연속적인 형성단계를 방해함이 주지할 만한 것이다. 예를들어 성충이 화합물을 섭취하면 성충에 많이 영향을 못미치지만 부화치 못하는 알을 낳는다. 곤충의 유충이 화합물을 섭취하면 이것은 다음 단계의 유충으로 변태치 않고 죽게 된다. 마지막 단계 유충이 화합물을 섭취하면 변태기로는 되나 변태기 상태로 죽는다.

구조식(1)의 화합물을 사용하면 반드시 곤충이 전멸된다고는 볼 수 없지만 몇몇 경우에는 물론 전체 곤충을 죽이기도 한다. 다른 경우에 화합물로 처리하면 곤충의 일부는 죽고 나머지는 잔존하게 된다. 소멸율은 곤충의 종류, 특히 사용된 화합물, 투여율, 곤충의 활력정도, 기후 및 그밖의 곤충학자가 아는 요인에 달려 있다. 이리하여 "곤충수효감소"란 살아있는 곤충의 수효를 감소시킨다는 의미이며 화합물로 처리된 곤충이 어떤 경우 그러나 대개 모든 경우 전멸되지는 않는다.

본 발명의 화합물에 의한 수효 감소정도는 물론 화합물의 투여율에 달려 있다. 모든 경우에 적어도 살충 유효량을 사용하여야 한다. "살충유효량"이란 화합물로 처리된 곤충에 있어 측정할 수 있을만큼의 감소를 초래하는데 충분한 량을 나타내는 것이다. 살충유효량은 일반적으로 1내지 1000ppm 정도이다.

살충제의 사용율이란 통상적으로 사용하려는 분산액에 있는 살충제의 농도를 측정할 것이다. 사용율은 잎 또는 처리하려는 물질을 분산액이 얇은 막으로 덮을 정도의 충분한 분산액을 투여하는 것이 가장 편리하기 때문에 이러한 방법으로 측정한다. 따라서 사용되는 분산액의 양은 처리하려는, 섭취할 수 있는 물질의 표면적에 달려 있으며 화합물의 양은 분산액 중의 농도에 달려 있다.

사용할 화합물을 함유한 분산액은 신규의 전형적인 살충제 조성물(본 발명 화합물의 신규이므로 신규이다)로부터 제조한다. 가장 널리 유용한 것은 적당량의 물과 소량의 농축한 살충제 조성물을 혼합하여 원하는 화합물 농도로 제조한 수용성 분산액이다. 이러한 5내지 90%의 화합물을 함유한, 농축된 물에 분산된 조성물은 통상적으로 유화농축액 또는 수화제 형태이다.

수화제는 미세한 불활성 분말과 계면활성 물질의 혼합물인 불활성 담체 중에 활성물질을 잘 혼합한 것이다. 활성물질의 농도는 통상적으로 10 내지 90%(중량비)이다. 불활성 분말에는 아타풀가이트 점토, 몬트모릴로나이트점토, 규조토 또는 정제된 실리케이트가 있다. 수화제의 약 0.5 내지 10%로 함유된 유효 계면활성제에는 설포나 리그닌, 축합된 나프탈렌 설포네이트, 나프탈렌설포네이트, 알킬벤젠설포네이트, 알킬설페이트 및 알킬페놀의 에틸렌 옥사이드 내전물과 같은 비이온성 계면활성 물질이 있다.

화합물의 전형적인 유화농축액은 액체 1당 약 50 내지 500g 즉 5 내지 50%의 화합물을, 물과 혼합되지 않은 유기용매와 유화제의 혼합액인 불활성 담체에 용해시켜 적당한 농도로 한 것이다. 유용한 유기용매에는 크실렌과 같은 방향족 및 나프탈렌성 및 올레핀성 석유(예 : 중(重) 방향족 나프타)와 같은 석유획분이 있다. 또한 로신 유도체와 가운 테르펜성 용매와 2-에톡시에탄올과 같은 복합알콜도 사용할 수 있다. 유화농축에 적합한 유화제는 수화제에 쓰인 여러 형태와 농도의 계면활성 물질이다.

필요한 경우, 화합물을 혼합석유(예 : 농화학분야에서 널리 사용되는 분무용 기름)와 같은 적당한 유기용매에 녹여 용액상태로 사용할 수도 있다.

또한 화합물을 분말제와 연무제의 형태의 조성물로서 사용할 수 있다. 분말제는 미세한 분말형태의 화합물을 함유하며 분말화 불활성 담체 중에 분산시킨 것이다. 담체에는 보통 프로필라이트, 벤토나이트, 화산분출물 또는 몬트모릴로나이트와 같은 분말화 점토가 있다. 분말제에는 보통 0.1 내지 10%의 화합물을 함유한다.

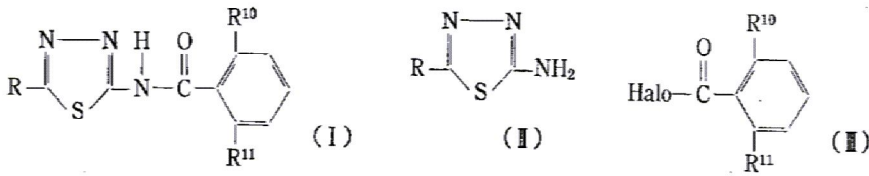
연무제 조성물은 구조식(1)의 화합물을, 압력을 발생시키는 분무용 혼합물인 불활성 담체 중에 용해 또는 분산시켜 뿜는 밸브를 통해 혼합액을 사용할 수 있는 용기에 담는 것이다. 분무용 혼합액에는 유기용매와 혼합시킬 수 있는 저비점 할로겐화 탄화수소, 또는 불활성가스 또는 가스성 탄화수소로 가압한 수용성 현탁액이 있다.

## (57) 청구의 범위

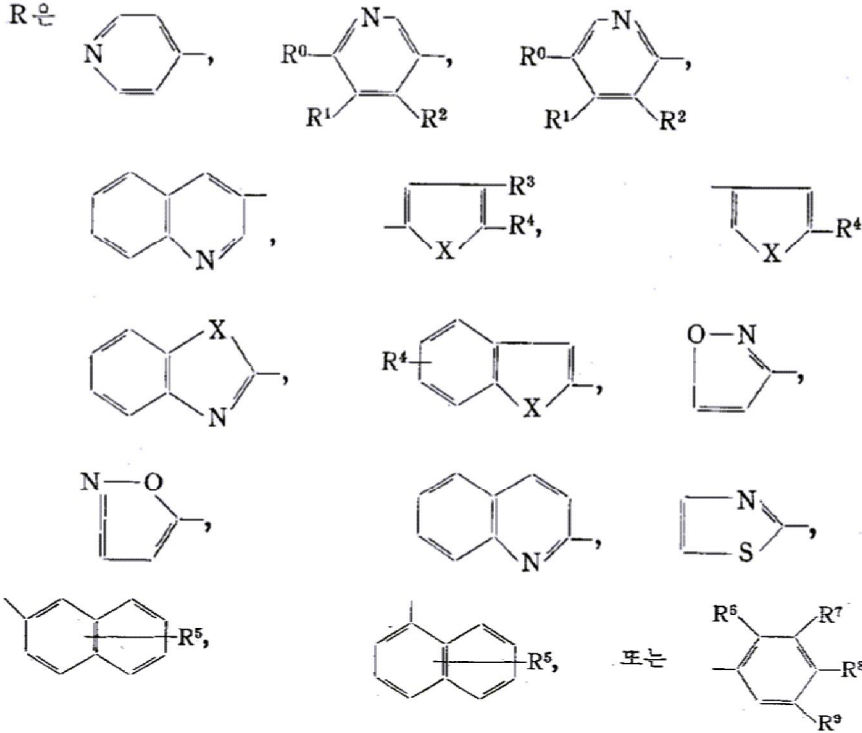
### 청구항 1

다음 구조식(II)의 2-아미노-5-R-치환된-1,3,4-타아디아졸을 다음 구조식(III)의 벤조일 할라이드로 아실

화시켜 다음 구조식(1)의 화합물을 제조하는 방법.



상기 구조식에서



(여기서 R<sup>0</sup>, R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup>는 각각 독립적으로 수소, 염소 또는 브롬이고(단 R<sup>0</sup>, R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup>중 적어도 하나는 염소 또는 브롬이다.)

X는 산소 또는 황이고,

R<sup>3</sup> 및 R<sup>4</sup>는 각각 독립적이고 수소, 염소, 브롬 또는 메틸이고, (단 X가 산소일 경우 R<sup>3</sup>는 수소이다.)

R<sup>5</sup>는 수소, 염소, 브롬, 불소 또는 트리플루오로메틸이고,

1) R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>는 수소이고, R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>중 하나는 수소이고 다른 하나는 수소, 염소, 메톡시, 브롬, 요오드, 불소, 트리플루오로메틸, 메틸, 하이드록시, 페닐, 또는 브롬, 염소 또는 불소로 치환된 페닐이거나

2) R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>는 수소이고, R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 각각 독립적으로 염소, 불소 또는 브롬이거나

3) R<sup>6</sup> 및 R<sup>8</sup>는 수소이고, R<sup>7</sup> 및 R<sup>9</sup>는 각각 독립적으로 염소, 불소, 브롬 또는 트리플루오로메틸이거나

4) R<sup>7</sup> 및 R<sup>9</sup>는 수소이고, R<sup>6</sup> 및 R<sup>8</sup>는 각각 독립적으로 염소, 불소 또는 브롬이거나,

5) R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 수소이고, R<sup>6</sup>는 염소, 불소 또는 브롬이거나

6) R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> 및 R<sup>9</sup>는 수소이고, R<sup>8</sup>는 니트로, 또는 시아노이다.)이고

R<sup>10</sup>과 R<sup>11</sup>는 각각 독립적으로 수소, 염소, 불소, 브롬, 메틸 또는 메톡시이고

단 1) R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup> 중 하나가 메톡시일 경우 다른 하나는 수소이고,

2) a) R<sup>8</sup>이 수소가 아니고 R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> 및 R<sup>9</sup>이 수소이거나,

b) R<sup>6</sup> 및 R<sup>8</sup>이 수소이고 R<sup>7</sup> 및 R<sup>9</sup> 중 하나 또는 모두가 트리플루오로메틸일 경우를 제외하고는 R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup> 중 적어도 하나는 메틸 또는 메톡시여야 하고

3) R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>이 모두 메톡시가 아닐 경우 R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>은 모두 페닐, 아세트아미도, 메톡시, 니트로, 아미노, 시아노 또는 치환된 페닐이 아니고,

- 4)  $R^{10}$  및  $R^{11}$ 이 모두 메틸 또는 메톡시가 아닐 경우  $R^7$ ,  $R^8$  및  $R^9$  중 두개는 수소이고,
- 5) R이 피리딜, 나프틸, 푸릴 또는 티에닐일 경우  $R^{10}$  및  $R^{11}$ 은 모두 메톡시 또는 메틸이고,
- 6) R이 벤조티아졸릴, 벤족사졸릴, 벤조티에닐, 벤조푸릴, 이속사졸릴, 퀴놀릴 또는 티아졸릴일 경우에  $R^{10}$  및  $R^{11}$ 은 모두 메톡시이며 Halo는 염소 또는 브롬이다.