



(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2008년12월26일  
(11) 등록번호 10-0875896  
(24) 등록일자 2008년12월18일

(51) Int. Cl.  
A01N 43/36 (2006.01) C07D 409/04 (2006.01)  
(21) 출원번호 10-2003-7010190  
(22) 출원일자 2003년08월01일  
심사청구일자 2007년01월31일  
번역문제출일자 2003년08월01일  
(65) 공개번호 10-2003-0074772  
(43) 공개일자 2003년09월19일  
(86) 국제출원번호 PCT/EP2002/000992  
국제출원일자 2002년01월31일  
(87) 국제공개번호 WO 2002/64588  
국제공개일자 2002년08월22일  
(30) 우선권주장  
10106457.8 2001년02월13일 독일(DE)  
(56) 선행기술조사문헌  
WO 0021958  
WO 9822438  
WO 9959968

(73) 특허권자  
바이엘 크롭사이언스 아게  
독일 40789 몬하임 알프레드-노벨-스트라세 50  
(72) 발명자  
플랜트앤드류  
영국버크셔알귀415퍼디워킹햄위너쉬메도우류1  
휘셔튀디거  
독일연방공화국50259폴하임주덴푸스펠렌23  
(뒤틀면에 계속)  
(74) 대리인  
이은선, 최규팔

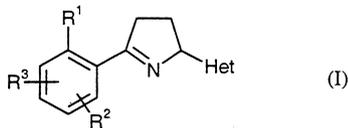
전체 청구항 수 : 총 15 항

심사관 : 류은경

(54) 2-헤테로아릴-3,4-디하이드로-2H-피롤 유도체 및살충제로서의 그의 용도

(57) 요약

본 발명은 일반식 (I)의 신규한  $\Delta^1$ -피롤린, 다수의 그의 제조방법 및 해충을 구제하기 위한 그의 용도, 및 신규한 중간체 및 그의 제조방법에 관한 것이다:



상기 식에서,

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  및 Het는 명세서에 언급된 의미를 갖는다.

(72) 발명자

**자이츠토마스**

독일연방공화국40764랑엔펠트리테르바흐10베

**에르텔렌크리스트프**

독일연방공화국42799라이홀링겐운터뷔서호프15

**투르베르크안드레아스**

독일연방공화국42781한진터스트라세86

**한제오랄프**

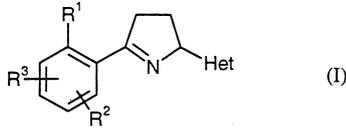
독일연방공화국40764랑엔펠트탄넨벡43

---

특허청구의 범위

청구항 1

일반식 (I)의  $\Delta^1$ -피롤린:



상기 식에서,

$R^1$ 은 불소 또는 염소를 나타내고,

$R^2$ 는 수소 또는 불소를 나타내며,

$R^3$ 는 수소를 나타내고,

Het는 각 경우에 동일하거나 상이한  $R^5$ 에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 2-피리디닐, 3-피리디닐, 2-피리미디닐, 5-피리미디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐 또는 2-피라지닐을 나타내고,

$R^5$ 는 그룹 -X-Y-Z-E를 나타내나, 단 X가 직접 결합을 나타내지 않는 경우 Y는 직접 결합을 나타내지 않으며,

X는 직접 결합, 산소, 황,  $-SO_2-$ ,  $-NR^6-$ ,  $-CO-$ ,  $-C(O)O-$ ,  $-O(C)O-$ ,  $-CH_2-$ ,  $-(CH_2)_2-$ ,  $-C=C-(E \text{ 또는 } Z)$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-(CH_2)_2O-$ ,  $-OCH_2-$ ,  $-O(CH_2)_2-$ ,  $-O-CH_2-O-$ ,  $-SCH_2-$ ,  $-S(CH_2)_2-$ ,  $-CH_2S-$  또는  $-(CH_2)_2S-$ 를 나타내고,

Y는 직접 결합을 나타내거나, 각 경우에  $W^1$  리스트중에서 선택된 동일하거나 상이한 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 1,4-페닐렌, 1,3-페닐렌, 2,6-나프틸렌, 2,7-나프틸렌, 2,4-푸릴렌, 2,4-티에닐렌, 2,5-피리디닐렌, 2,5-피리미디닐렌, 3,6-피리다지닐렌 또는 2,5-피라지닐렌을 나타내며,

Z는 직접 결합, 메틸렌 또는 에틸렌을 나타내고,

E는 수소, 불소, 염소, 브롬, 하이드록실, 시아노, 포르밀,  $-S(O)_nR^7$ ,  $-OSO_2R^7$ ,  $-NR^8R^9$ ,  $-COR^7$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-OC(O)R^7$ ,  $-CONR^{10}R^{11}$ ,  $-N(R^{12})COR^{13}$  또는  $-SO_2NR^{16}R^{17}$ 을 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노,  $C_1-C_6$ -알콕시 및  $-NR^8R^9$ 로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된  $C_1-C_{16}$ -알킬,  $C_2-C_{16}$ -알케닐,  $C_1-C_{16}$ -알콕시 또는  $C_2-C_{16}$ -알케닐옥시를 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필,  $-CF_3$ ,  $-CHF_2$ ,  $-CClF_2$ ,  $-CF_2CHFCl$ ,  $-CF_2CH_2F$ ,  $-CF_2CCl_3$ ,  $-CH_2CF_3$ ,  $-CF_2CHF_2$ ,  $-CH_2CF_2H$ ,  $-CH_2CF_2CF_3$ ,  $-CF_2CF_2H$ ,  $-CF_2CHF_2$ , 비닐, 알릴, 1-프로페닐, 부테닐,  $-CF=CHF$ ,  $-CF=CH_2$ ,  $-CF=CCl_2$ ,  $-CH=CF_2$ ,  $-CF_2CF=CF_2$ ,  $-CH=CFH$ ,  $-CH_2CF=CF_2$ ,  $-CF=CF_2$ ,  $-CF_2CH=CF_2$ , 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소프로폭시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 클로로디플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시, 메틸티오, 에틸티오, n-프로필티오, 이소프로필티오, n-부틸티오, 이소부틸티오, sec-부틸티오, t-부틸티오, 트리플루오로메틸티오, 디플루오로메틸티오, 클로로디플루오로메틸티오 및 트리플루오로에틸티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로프로필옥시, 사이클로펜틸옥시, 사이클로헥실옥시, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실메틸, 페닐, 페녹시, 벤질, 페닐에틸, 벤질옥시, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디노, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 피

페리디노, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 모르폴리노, 티오모르폴리노, 트리아지닐, 트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐을 나타내며,

$W^1$ 은 불소, 염소, 브롬, 시아노, 포르밀, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소프로폭시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시, 비닐, 알릴, 트리플루오로메틸, 트리플루오로에틸, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시,  $-OCF_2CF_2H$ ,  $-CH=CF_2$ ,  $-CH=CCl_2$ ,  $-OCF=CF_2$ ,  $-COMe$ ,  $-COEt$ ,  $-CO_2Me$ ,  $-CO_2Et$ ,  $-CO_2(t-Bu)$ ,  $-SMe$ ,  $-SOMe$ ,  $-SO_2Me$ ,  $-SCF_3$ ,  $-SOCF_3$ ,  $-SO_2CF_3$ ,  $-SCHF_2$ ,  $-SOCHF_2$ ,  $-SO_2CHF_2$ ,  $-SO_2NMe_2$ ,  $-NMe_2$ ,  $-NEt_2$ ,  $-N(n-Pr)_2$ ,  $-N(Me)COMe$ ,  $-N(Me)COEt$ ,  $-N(Me)COPr$ ,  $-N(Me)CO(t-Bu)$ , 2-피롤리도닐, 2-피페리도닐,  $-N(Me)SO_2Me$ ,  $-N(Me)SO_2Et$ ,  $-N(Me)SO_2CF_3$ ,  $-N(Et)SO_2CF_3$ ,  $-N(Me)SO_2(CF_2)_3CF_3$  또는  $-OSO_2NMe_2$ 를 나타내고,

$R^6$ 은 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 트리플루오로메틸, 트리플루오로에틸, 사이클로프로필, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실, 사이클로헥실메틸, 페닐, 벤질 또는 페닐에틸을 나타내며,

$R^7$ 은 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 펜틸, 헥실,  $-CF_3$ ,  $-CHF_2$ ,  $-CCl_3$ ,  $-CCl_2F$ , 디메틸아미노메틸, 디메틸아미노에틸, 디에틸아미노메틸, 디에틸아미노에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 페닐 또는 벤질을 나타내고,

$R^8$  및  $R^9$ 는 서로 독립적으로 수소,  $-SO_2R^7$ ,  $-COR^7$  또는  $-CO_2R^7$ 을 나타내거나, 각 경우에 불소, 염소, 브롬,  $C_1-C_4$ -알킬카보닐,  $C_1-C_4$ -알킬카보닐옥시,  $C_1-C_4$ -알킬아미노, 디- $(C_1-C_4)$ -알킬아미노,  $C_1-C_4$ -알콕시,  $C_1-C_4$ -할로게노알콕시,  $C_1-C_4$ -알킬티오 및  $C_1-C_4$ -할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된  $C_1-C_{16}$ -알킬 또는  $C_2-C_{16}$ -알케닐을 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노,  $C_1-C_4$ -알킬,  $C_1-C_4$ -할로게노알킬,  $C_1-C_4$ -알콕시,  $C_1-C_4$ -할로게노알콕시,  $C_1-C_4$ -알킬티오 및  $C_1-C_4$ -할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된  $C_3-C_8$ -사이클로알킬, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실메틸, 사이클로프로필에틸, 사이클로헥실에틸, 페닐, 벤질, 페닐에틸, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤조사졸릴, 이속사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 트리아지닐, 트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐을 나타내거나,

$R^8$  및  $R^9$ 는 또한 함께, 불소, 염소, 브롬,  $C_1-C_4$ -알콕시,  $C_1-C_4$ -할로게노알콕시,  $C_1-C_4$ -알킬티오 및  $C_1-C_4$ -할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된  $C_2-C_8$ -알케닐렌을 나타내거나, 알킬렌 부분이 불소, 염소, 시아노, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸,  $C_1-C_4$ -할로게노알킬, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소프로폭시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시,  $C_1-C_4$ -할로게노알콕시, 메틸티오, 에틸티오, n-프로필티오, 이소프로필티오, n-부틸티오, 이소부틸티오, sec-부틸티오, t-부틸티오 및  $C_1-C_4$ -할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된  $C_3-C_8$ -알킬렌을 나타내고, 여기에서, 알킬렌 사슬은 각 경우에  $-O-$ ,  $-S-$  또는  $-NR^{18}$ -에 의해 차단될 수 있으며,

$R^{10}$  및  $R^{11}$ 은 서로 독립적으로 수소,  $-SO_2CF_3$ , 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 펜틸, 헥실,  $-CF_3$ ,  $-CH_2CF_3$ ,  $-(CF_2)_3CF_3$ , 메톡시메틸, 메톡시에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나, 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 메틸, 트리플루오로메틸, 메톡시 및 트리플루오로메톡시로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 페닐 또는 벤질을 나타내거나,

R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>는 또한 함께, -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-,  
-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- 또는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-N(R<sup>18</sup>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-를 나타내고,

R<sup>12</sup> 및 R<sup>13</sup>은 서로 독립적으로 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, n-헥실, 트리플루오로메틸, 트리플루오로에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나, 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 메틸, 트리플루오로메틸, 메톡시 및 트리플루오로메톡시로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 페닐 또는 벤질을 나타내거나,

R<sup>12</sup> 및 R<sup>13</sup>은 또한 함께, 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 메틸티오, 에틸티오, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시 및 트리플루오로메틸티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>- 또는 (CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>-을 나타내며,

R<sup>16</sup> 및 R<sup>17</sup>은 서로 독립적으로 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, n-헥실, 트리플루오로메틸, 트리플루오로에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나,

R<sup>16</sup> 및 R<sup>17</sup>은 또한 함께, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- 또는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-를 나타내고,

R<sup>18</sup>은 수소 또는 -SO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>을 나타내거나, -COR<sup>7</sup> 또는 -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>을 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, 메틸아미노, 에틸아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬)아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알킬 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-알케닐을 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소프로폭시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, 메틸티오, 에틸티오, n-프로필티오, 이소프로필티오, n-부틸티오, 이소부틸티오, sec-부틸티오, t-부틸티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실메틸, 사이클로프로필에틸, 사이클로펜틸에틸, 사이클로헥실에틸, 페닐, 벤질, 페닐에틸, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤조사졸릴, 이속사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 트리아지닐, 트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐을 나타낸다.

## 청구항 2

삭제

## 청구항 3

삭제

## 청구항 4

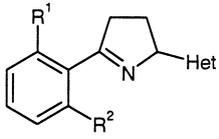
삭제

## 청구항 5

삭제

청구항 6

하기 일반식의  $\Delta^1$ -피롤린:



상기 식에서,

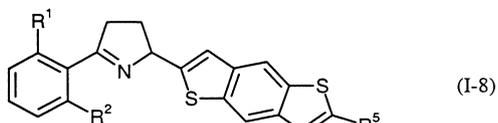
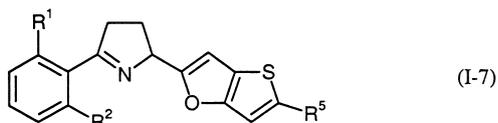
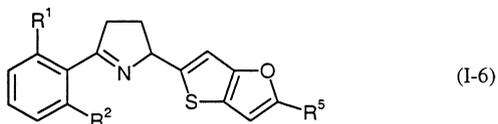
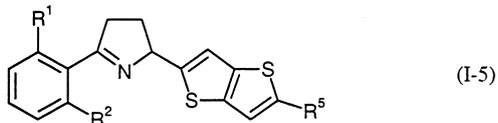
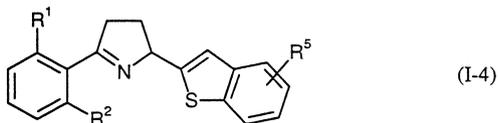
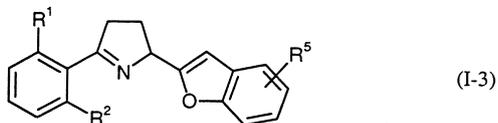
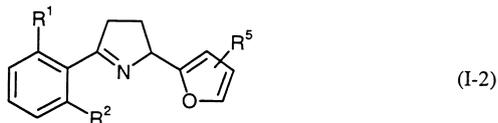
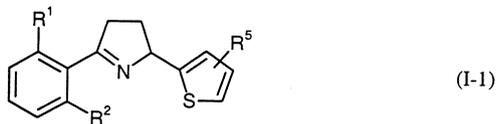
R<sup>1</sup>은 불소 또는 염소를 나타내고,

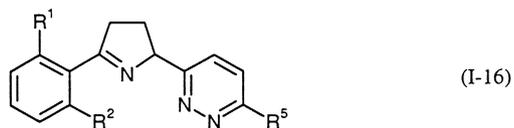
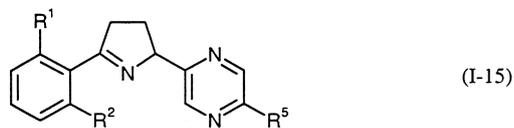
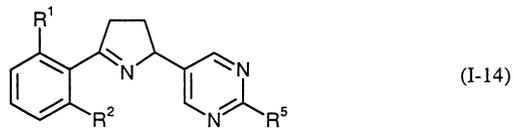
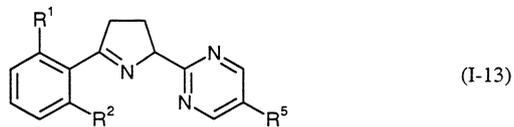
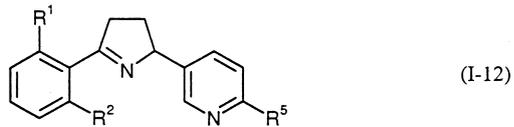
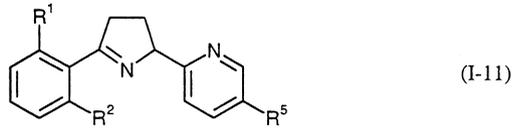
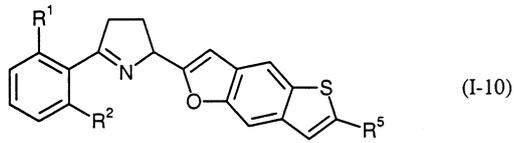
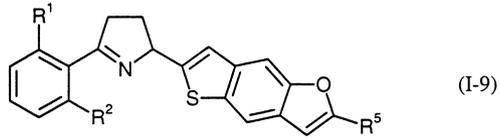
R<sup>2</sup>는 수소 또는 불소를 나타내며,

Het는 제 1 항에 언급된 의미를 갖는다.

청구항 7

일반식 (I-1) 내지 (I-16)의 화합물:





상기 식에서,

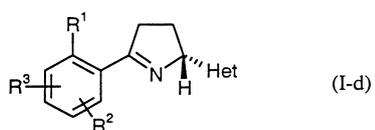
R<sup>1</sup>은 불소 또는 염소를 나타내고,

R<sup>2</sup>는 수소 또는 불소를 나타내며,

R<sup>5</sup>는 제 1 항에 언급된 의미를 갖는다.

### 청구항 8

(R)-배위를 갖는 일반식 (I-d)의 화합물:



상기 식에서,

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 및 Het는 제 1 항에 언급된 의미를 갖는다.

**청구항 9**

제 1 항에 있어서, Het가 각 경우에 동일하거나 상이한 R<sup>5</sup>에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-피리디닐 또는 3-피리디닐을 나타내는 일반식 (I)의 Δ<sup>1</sup>-피롤린.

**청구항 10**

삭제

**청구항 11**

삭제

**청구항 12**

제 1 항에 있어서, X가 직접 결합을 나타내고, Y가 1,4-페닐렌 또는 1,3-페닐렌을 나타내는 일반식 (I)의 Δ<sup>1</sup>-피롤린.

**청구항 13**

제 9 항에 있어서, X가 직접 결합을 나타내고, Y가 1,4-페닐렌 또는 1,3-페닐렌을 나타내는 일반식 (I)의 Δ<sup>1</sup>-피롤린.

**청구항 14**

A) 일반식 (II)의 아미노 케톤을 경우에 따라 희석제의 존재하에서 루이스산 (Lewis acid) 또는 양성자산 (protonic acid)으로 처리하거나,

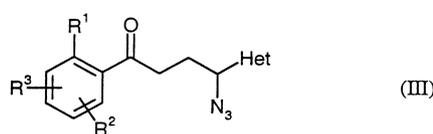
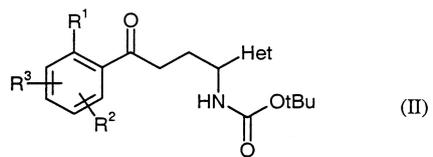
B) 일반식 (III)의 아지드를 희석제의 존재하 및 경우에 따라 촉매의 존재하에 트리알킬포스핀 또는 트리아릴포스핀 또는 트리알킬 포스파이트 또는 환원제와 반응시키거나,

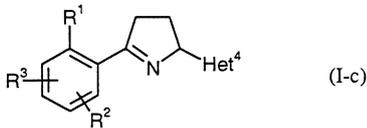
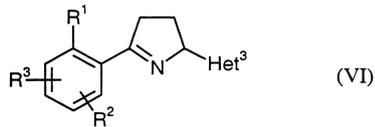
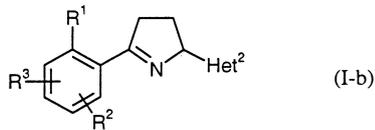
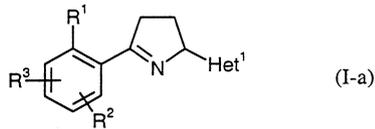
D) 일반식 (I-b)의 Δ<sup>1</sup>-피롤린을 촉매의 존재하, 이보론산 에스테르의 존재하 및 경우에 따라 산 결합제의 존재하 및 경우에 따라 희석제의 존재하에 탄뎀 반응(tandem reaction)으로 일반식 (V)의 (헤테로)사이클과 반응시키거나,

E) 일반식 (VI)의 Δ<sup>1</sup>-피롤린을 촉매의 존재하, 경우에 따라 산 결합제의 존재하 및 경우에 따라 희석제의 존재하에 일반식 (V)의 헤테로사이클과 반응시키거나,

F) 일반식 (I-b)의 Δ<sup>1</sup>-피롤린을 촉매의 존재하, 경우에 따라 산 결합제의 존재하 및 경우에 따라 희석제의 존재하에 일반식 (VII)의 보론산 유도체와 반응시키거나,

G) 일반식 (I-c)의 Δ<sup>1</sup>-피롤린을 촉매의 존재하, 경우에 따라 산 결합제의 존재하 및 경우에 따라 희석제의 존재하에 일반식 (VIII)의 유기금속 화합물과 반응시켜 일반식 (I-a)의 Δ<sup>1</sup>-피롤린을 수득함을 특징으로 하여, 제 1 항에 따른 일반식 (I)의 화합물을 제조하는 방법:





상기 식에서,

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ , E 및 Het은 제 1 항에 언급된 의미를 가지며,

Het<sup>1</sup>은 각각  $R^{5-1}$ 에 의해 일치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 2-피리디닐, 3-피리디닐, 2-피리미디닐, 5-피리미디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐 또는 2-피라지닐을 나타내며,

$R^{5-1}$ 은 그룹  $-Y^1-E$ 를 나타내고,

$Y^1$ 은 각 경우에  $W^1$  리스트중에서 선택된 동일하거나 상이한 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 1,4-페닐렌, 1,3-페닐렌, 2,4-푸릴렌, 2,4-티에닐렌, 2,5-피리디닐렌, 2,5-피리미디닐렌, 3,6-피리다지닐렌 또는 2,5-피라지닐렌을 나타내며, 여기에서  $W^1$ 은 제 1 항에 언급된 의미를 가지고,

Het<sup>2</sup>는 각각  $R^{5-2}$ 에 의해 일치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 2-피리디닐, 3-피리디닐, 2-피리미디닐, 5-피리미디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐 또는 2-피라지닐을 나타내고,

$R^{5-2}$ 는 염소, 브롬, 요오드,  $-OSO_2CF_3$  또는  $-OSO_2(CF_2)_3CF_3$ 를 나타내며,

$A^1$ 은 염소, 브롬, 요오드,  $-OSO_2CF_3$  또는  $-OSO_2(CF_2)_3CF_3$ 를 나타내고,

Het<sup>3</sup>은 각각  $A^2$ 에 의해 일치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 2-피리디닐, 3-피리디닐, 2-피리미디닐, 5-피리미디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐 또는 2-피라지닐을 나타내며,

A<sup>2</sup>는 -B(OH)<sub>2</sub>, (4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-디옥사보롤란)-2-일, (5,5-디메틸-1,3,2-디옥사보리난)-2-일, (4,4,6-트리메틸-1,3,2-디옥사보리난)-2-일 또는 1,3,2-벤조디옥사보롤-2-일을 나타내고,

Het<sup>4</sup>는 각각 R<sup>5-3</sup>에 의해 일치화된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 2-피리디닐, 3-피리디닐, 2-피리미디닐, 5-피리미디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐 또는 2-피라지닐을 나타내며,

R<sup>5-3</sup>은 브롬 또는 요오드를 나타내고,

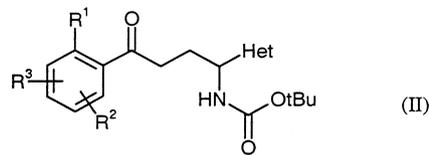
M은 ZnCl, Sn(Me)<sub>3</sub> 또는 Sn(n-Bu)<sub>3</sub>를 나타낸다.

**청구항 15**

삭제

**청구항 16**

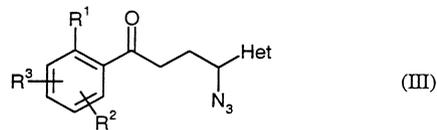
일반식 (II)의 아미노케톤:



상기 식에서, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 및 Het는 제 1 항에 언급된 의미를 갖는다.

**청구항 17**

일반식 (III)의 아지드:



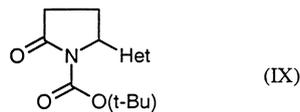
상기 식에서, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 및 Het는 제 1 항에 언급된 의미를 갖는다.

**청구항 18**

삭제

**청구항 19**

일반식 (IX)의 락탐:

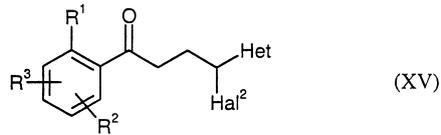


상기 식에서,

Het는 제 1 항에 언급된 의미를 갖는다.

청구항 20

일반식 (XV)의 할라이드:



상기 식에서,

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 및 Het는 제 1 항에 언급된 의미를 가지며,

Hal<sup>2</sup>는 할로젠을 나타낸다.

청구항 21

증량제 및/또는 계면활성제와 함께, 제 1 항에 따른 일반식 (I)의 화합물을 적어도 하나 함유함을 특징으로 하는 살충제(pesticide).

청구항 22

삭제

청구항 23

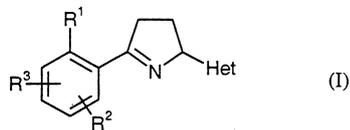
제 1 항에 따른 일반식 (I)의 화합물을 해충 및/또는 이들의 서식지에 작용시킴을 특징으로 하여 해충을 구제하는 방법.

청구항 24

제 1 항에 따른 일반식 (I)의 화합물을 증량제 및/또는 계면활성제와 혼합함을 특징으로 하여 살충제를 제조하는 방법.

**명세서**

- <1> 본 발명은 신규한 Δ<sup>1</sup>-피롤린, 다수의 그의 제조방법 및 살충제(pesticide)로서의 그의 용도에 관한 것이다.
- <2> 다수의 Δ<sup>1</sup>-피롤린이 살충성을 가지는 것으로 이미 알려졌다(참조: WO 00/ 21958호, WO 99/59968호, WO 99/59967호 및 WO 98/22438호). 이들 물질의 활성은 우수하나, 일부의 경우 불만족스럽다.
- <3> 본 발명은 하기 일반식 (I)의 Δ<sup>1</sup>-피롤린을 제공한다:



- <4>
- <5> 상기 식에서,
- <6> R<sup>1</sup>은 할로젠, 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 알콕시 또는 -S(O)<sub>n</sub>R<sup>4</sup>를 나타내고,
- <7> R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>은 서로 독립적으로 수소, 할로젠 또는 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 알콕시 또는 알콕시알킬을 나타내며,
- <8> R<sup>4</sup>는 임의로 치환된 알킬을 나타내고,
- <9> Het는 동일하거나 상이한 R<sup>5</sup>에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 헤테로아릴을 나타내며,

- <10> R<sup>5</sup>는 그룹 -X-Y-Z-E를 나타내나, 단 X가 직접 결합을 나타내지 않는 경우 Y는 직접 결합을 나타내지 않고,
- <11> X는 직접 결합, 산소, -S(O)<sub>w</sub>-, -NR<sup>6</sup>-, 카보닐, 카보닐옥시, 옥시카보닐, 옥시설폰닐(OSO<sub>2</sub>), 알킬렌, 할로게노알킬렌, 알케닐렌, 할로게노알케닐렌, 알키닐렌, 알킬렌옥시, 옥시알킬렌, 옥시알킬렌옥시, -S(O)<sub>w</sub>-알킬렌, 사이클로프로필렌 또는 옥시라닐렌을 나타내며,
- <12> Y는 직접 결합을 나타내거나, 각 경우에 임의로 치환된 페닐렌, 나프틸렌, 테트라하이드로나프틸렌 또는 헤테로사이클릴렌을 나타내고,
- <13> Z는 직접 결합 또는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-을 나타내며,
- <14> E는 수소, 할로겐, 하이드록실, 시아노, 포르밀, 니트로, 트리알킬실릴, 펜타플루오로티오, -S(O)<sub>w</sub>R<sup>7</sup>, -OSO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, -COR<sup>7</sup>, -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -OC(O)R<sup>7</sup>, -CONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, -N(R<sup>12</sup>)COR<sup>13</sup>, -C(R<sup>14</sup>)=N-OR<sup>15</sup> 또는 -SO<sub>2</sub>NR<sup>16</sup>R<sup>17</sup>을 나타내거나; 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 알키닐, 알콕시, 알케닐옥시, 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 사이클로알킬옥시, 아릴, 아릴알킬, 아릴옥시, 아릴옥시알킬, 포화 또는 불포화 헤테로사이클릴 또는 헤테로사이클릴알킬을 나타내고,
- <15> R<sup>6</sup>은 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 아릴 또는 아릴알킬을 나타내며,
- <16> R<sup>7</sup>은 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 사이클로알킬, 아릴 또는 아릴알킬을 나타내고,
- <17> R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 서로 독립적으로 수소, -SO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -COR<sup>7</sup> 또는 -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>을 나타내거나, 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 아릴, 아릴알킬 또는 포화 또는 불포화 헤테로사이클릴 또는 헤테로사이클릴알킬을 나타내거나,
- <18> R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 또한 함께, 각 경우에 임의로 치환된 알케닐렌 또는 알킬렌을 나타내며, 여기에서, 알킬렌 사슬은 각 경우에 -O-, -S- 또는 -NR<sup>18</sup>-에 의해 차단될 수 있으며,
- <19> R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 서로 독립적으로 수소 또는 -SO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>을 나타내거나, 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 아릴, 아릴알킬 또는 포화 또는 불포화 헤테로사이클릴 또는 헤테로사이클릴알킬을 나타내거나,
- <20> R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 또한 함께, 임의로 치환된 알킬렌을 나타내며, 여기에서, 알킬렌 사슬은 각 경우에 -O-, -S- 또는 -NR<sup>18</sup>-에 의해 차단될 수 있고,
- <21> R<sup>12</sup> 및 R<sup>13</sup>은 서로 독립적으로 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 아릴 또는 아릴알킬을 나타내거나,
- <22> R<sup>12</sup> 및 R<sup>13</sup>은 또한 함께, 각 경우에 임의로 치환된 알킬렌 또는 알케닐렌을 나타내며,
- <23> R<sup>14</sup> 및 R<sup>15</sup>는 서로 독립적으로 수소를 나타내거나, 각 경우에 임의로 치환된 알킬 또는 알케닐을 나타내고,
- <24> R<sup>16</sup> 및 R<sup>17</sup>은 서로 독립적으로 수소를 나타내거나, 임의로 치환된 알킬 또는 사이클로알킬을 나타내거나,
- <25> R<sup>16</sup> 및 R<sup>17</sup>은 또한 함께, 임의로 치환된 알킬렌, 알콕시알킬렌 또는 알킬티오알킬렌을 나타내며,
- <26> R<sup>18</sup>은 수소, -SO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -COR<sup>7</sup> 또는 -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>을 나타내거나; 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 아릴, 아릴알킬 또는 포화 또는 불포화 헤테로사이클릴 또는 헤테로사이클릴알킬을 나타내고,
- <27> w는 0, 1 또는 2를 나타내며,
- <28> n은 1, 2, 3 또는 4를 나타낸다.

<29> 치환체의 성질 및 수에 따라, 일반식 (I)의 화합물은 경우에 따라 기하 및/또는 광학 이성체, 레지오이성체 (regioisomer) 및/또는 구조 이성체(configuration isomer), 또는 다양한 조성의 이들 이성체 혼합물로서 존재할 수 있다. 본 발명에 의해 순수한 이성체 및 이성체 혼합물 모두가 청구된다.

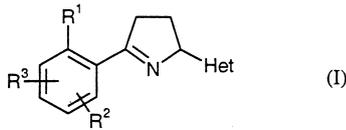
<30> 또한, 일반식 (I)의 신규한 화합물은 하기 방법중 하나에 의해 수득될 수 있음이 밝혀졌다.

<31> 일반식 (I)의  $\Delta^1$ -피롤린은

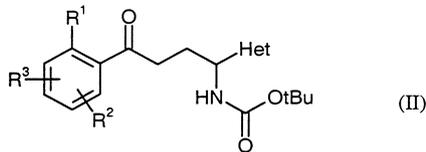
<32> A) 일반식 (II)의 아미노 케톤을 경우에 따라 희석제의 존재하에서 루이스산 (Lewis acid) 또는 양성자산 (protonic acid)으로 처리하거나,

<33> B) 일반식 (III)의 아지드를 희석제의 존재하 및 경우에 따라 촉매의 존재하에 트리알킬포스핀 또는 트리아릴포스핀 또는 트리알킬 포스파이트 또는 환원제와 반응시키거나,

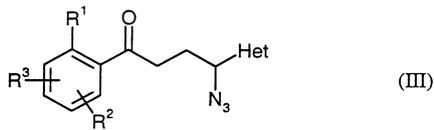
<34> C) 일반식 (IV)의 아미드를 경우에 따라 희석제의 존재하에 N-데아세틸화제와 반응시킴에 의해 제조될 수 있다:



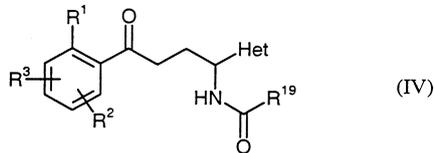
<35>



<36>



<37>



<38>

<39> 상기 식에서,

<40> R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 및 Het는 상기 언급된 의미를 가지며,

<41> R<sup>19</sup>는 알킬, 할로게노알킬, 아릴 또는 아릴알킬을 나타낸다.

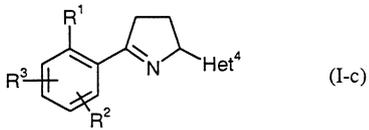
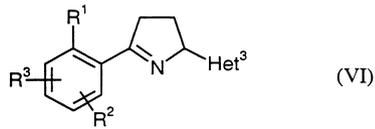
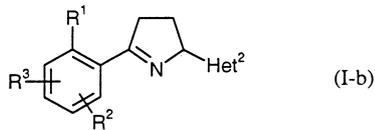
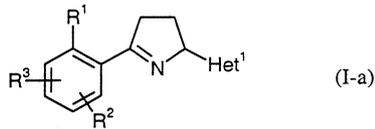
<42> 일반식 (I-a)의  $\Delta^1$ -피롤린은

<43> D) 일반식 (I-b)의  $\Delta^1$ -피롤린을 촉매의 존재하, 이보론산 에스테르의 존재하 및 경우에 따라 산 결합체의 존재하 및 경우에 따라 희석제의 존재하에 탄뎀 반응(tandem reaction)으로 일반식 (V)의 (헤테로)사이클과 반응시키거나,

<44> E) 일반식 (VI)의  $\Delta^1$ -피롤린을 촉매의 존재하, 경우에 따라 산 결합체의 존재하 및 경우에 따라 희석제의 존재하에 일반식 (V)의 헤테로사이클과 반응시키거나,

<45> F) 일반식 (I-b)의  $\Delta^1$ -피롤린을 촉매의 존재하, 경우에 따라 산 결합체의 존재하 및 경우에 따라 희석제의 존재하에 일반식 (VII)의 보론산 유도체와 반응시키거나,

<46> G) 일반식 (I-c)의  $\Delta^1$ -피롤린을 촉매의 존재하, 경우에 따라 산 결합체의 존재하 및 경우에 따라 희석제의 존재하에 일반식 (VIII)의 유기금속 화합물과 반응시킴에 의해 제조될 수 있다:



<54> 상기 식에서,

<55> Het<sup>1</sup>은 R<sup>5-1</sup>에 의해 일치환된 헤테로아릴을 나타내고,

<56> R<sup>5-1</sup>은 그룹 -Y<sup>1</sup>-E를 나타내며,

<57> Y<sup>1</sup>은 각 경우에 임의로 치환된 페닐렌 또는 헤테로사이클릴렌을 나타내고,

<58> R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 및 E는 상기 언급된 의미를 가지며,

<59> Het<sup>2</sup>는 R<sup>5-2</sup>에 의해 일치환된 헤테로아릴을 나타내고,

<60> R<sup>5-2</sup>는 염소, 브롬, 요오드, -OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 또는 -OSO<sub>2</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CF<sub>3</sub>를 나타내며,

<61> A<sup>1</sup>은 염소, 브롬, 요오드, -OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 또는 -OSO<sub>2</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CF<sub>3</sub>를 나타내고,

<62> Het<sup>3</sup>은 A<sup>2</sup>에 의해 일치환된 헤테로아릴을 나타내며,

<63> A<sup>2</sup>는 -B(OH)<sub>2</sub>, (4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-디옥사보롤란)-2-일, (5,5-디메틸-1,3,2-디옥사보리란)-2-일, (4,4,6-트리메틸-1,3,2-디옥사보리란)-2-일 또는 1,3,2-벤조디옥사보롤-2-일을 나타내고,

<64> Het<sup>4</sup>는 R<sup>5-3</sup>에 의해 일치환된 헤테로아릴을 나타내며,

<65> R<sup>5-3</sup>은 브롬 또는 요오드를 나타내고,

<66> M은 ZnCl, Sn(Me)<sub>3</sub> 또는 Sn(n-Bu)<sub>3</sub>를 나타낸다.

<67> 마지막으로, 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물이 매우 우수한 살충성을 가지며, 작물 보호 및 재료 보호 둘 다에 있어서 곤충과 같은 원치않는 해충을 구제하기 위해 사용될 수 있음이 밝혀졌다.

- <68> 일반식 (I)은 본 발명에 따른  $\Delta^1$ -피롤린의 일반 정의를 제공한다.
- <69>  $R^1$ 은 바람직하게는 할로젠, 알킬, 할로게노알킬, 알콕시, 할로게노알콕시 또는  $-S(O)_wR^4$ 를 나타낸다.
- <70>  $R^2$  및  $R^3$ 은 서로 독립적으로 바람직하게는 수소, 할로젠, 알킬, 할로게노알킬, 알콕시, 할로게노알콕시 또는 알콕시알킬을 나타낸다.
- <71>  $R^4$ 는 바람직하게는 알킬 또는 할로게노알킬을 나타낸다.
- <72> Het는 바람직하게는 1 내지 3 개의 방향족 환 및 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 포함하고, 동일하거나 상이한  $R^5$ 에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 5- 내지 14-원 헤테로아릴을 나타낸다.
- <73>  $R^5$ 는 바람직하게는 그룹  $-X-Y-Z-E$ 를 나타내나, 단 X가 직접 결합을 나타내지 않는 경우 Y는 직접 결합을 나타내지 않는다.
- <74> X는 바람직하게는 직접 결합, 산소,  $-S(O)_w-$ ,  $-NR^6-$ , 카보닐, 카보닐옥시, 옥시카보닐, 옥시설폰닐( $OSO_2$ ), 알킬렌, 할로게노알킬렌, 알케닐렌, 할로게노알케닐렌, 알키닐렌, 알킬렌옥시, 옥시알킬렌, 옥시알킬렌옥시,  $-S(O)_w$ -알킬렌, 사이클로프로필렌 또는 옥시라닐렌을 나타낸다.
- <75> Y는 바람직하게는 직접 결합을 나타내거나, 각 경우에 W<sup>1</sup> 리스트중에서 선택된 동일하거나 상이한 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 페닐렌, 나프틸렌, 테트라하이드로나프틸렌, 또는 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 가진 포화 또는 불포화 5- 내지 10-원 헤테로사이클릴렌을 나타낸다.
- <76> Z는 바람직하게는 직접 결합 또는  $-(CH_2)_n-$ 을 나타낸다.
- <77> E는 바람직하게는 수소, 할로젠, 하이드록실, 시아노, 포르밀, 니트로, 트리알킬실릴, 펜타플루오로티오,  $-S(O)_wR^7$ ,  $-OSO_2R^7$ ,  $-NR^8R^9$ ,  $-COR^7$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-OC(O)R^7$ ,  $-CONR^{10}R^{11}$ ,  $-N(R^{12})COR^{13}$ ,  $-C(R^{14})=N-OR^{15}$  또는  $-SO_2NR^{16}R^{17}$ 을 나타내거나; 각 경우에 할로젠, 시아노, 알콕시 및/또는  $-NR^8R^9$ 로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 알킬, 알케닐, 알키닐, 알콕시 또는 알케닐옥시를 나타내거나; 각 경우에 할로젠, 시아노, 니트로, 알킬, 할로게노알킬, 알케닐, 할로게노알케닐, 알콕시, 할로게노알콕시, 알킬티오 및 할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 사이클로알킬알콕시, 아릴, 아릴알킬, 아릴옥시, 아릴옥시알킬, 또는 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 가진 포화 또는 불포화 5- 내지 10-원 헤테로사이클릴 또는 헤테로사이클릴알킬을 나타낸다.
- <78> W<sup>1</sup>은 바람직하게는 할로젠, 시아노, 포르밀, 니트로, 트리알킬실릴, 알킬, 할로게노알킬, 알콕시, 할로게노알콕시, 알케닐, 할로게노알케닐, 알케닐옥시, 할로게노알케닐옥시, 알킬카보닐, 알콕시카보닐,  $-S(O)_wR^7$ ,  $-C(R^{14})=N-OR^{15}$ ,  $-SO_2NR^{16}R^{17}$ ,  $-(CH_2)_pNR^{16}R^{17}$ ,  $-(CH_2)_pN(R^{16})COR^{17}$ ,  $-(CH_2)_pN(R^{16})SO_2R^{17}$ ,  $-OSO_2R^{16}$  또는  $-OSO_2NR^{16}R^{17}$ 을 나타낸다.
- <79>  $R^6$ 은 바람직하게는 알킬 또는 할로게노알킬을 나타내거나, 각 경우에 할로젠, 알킬, 할로게노알킬, 알콕시, 할로게노알콕시, 알킬티오 및/또는 할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 아릴 또는 아릴알킬을 나타낸다.
- <80>  $R^7$ 은 바람직하게는 할로젠 및  $-NR^8R^9$ 로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 알킬을 나타내거나, 각 경우에 할로젠, 시아노, 알킬, 할로게노알킬, 알콕시, 할로게노알콕시, 알킬티오 및 할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 사이클로알킬, 아릴 또는 아릴알킬을 나타낸다.

- <81>  $R^8$  및  $R^9$ 는 서로 독립적으로 바람직하게는 수소,  $-SO_2R^7$ ,  $-COR^7$  또는  $-CO_2R^7$ 을 나타내거나, 각 경우에 할로젠, 알킬카보닐, 알킬카보닐옥시, 알킬아미노, 디알킬아미노, 알콕시, 할로게노알콕시, 알킬티오 및 할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 알킬 또는 알케닐을 나타내거나, 각 경우에 할로젠, 시아노, 알킬, 할로게노알킬, 알콕시, 할로게노알콕시, 알킬티오 및 할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 아릴, 아릴알킬, 또는 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 가진 포화 또는 불포화 5- 내지 10-원 헤테로사이클릴 또는 헤테로사이클릴알킬을 나타낸다.
- <82>  $R^8$  및  $R^9$ 는 또한 함께, 바람직하게는 할로젠, 시아노, 알콕시, 할로게노알콕시, 알킬티오 및 할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 알케닐렌을 나타내거나, 할로젠, 시아노, 알킬, 할로게노알킬, 알콕시, 할로게노알콕시, 알킬티오 및 할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 알킬렌을 나타내며, 여기에서, 알킬렌 사슬은 각 경우에  $-O-$ ,  $-S-$  또는  $-NR^{18}$ -에 의해 차단될 수 있다.
- <83>  $R^{10}$  및  $R^{11}$ 은 서로 독립적으로 바람직하게는 수소 또는  $-SO_2R^7$ 을 나타내거나; 각 경우에 할로젠, 알킬아미노, 디알킬아미노, 알콕시 및 알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 알킬 또는 알케닐을 나타내거나; 각 경우에 할로젠, 시아노, 알킬, 할로게노알킬, 알콕시, 할로게노알콕시, 알킬티오 및 할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 아릴, 아릴알킬, 또는 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 가진 포화 또는 불포화 5- 내지 10-원 헤테로사이클릴 또는 헤테로사이클릴알킬을 나타낸다.
- <84>  $R^{10}$  및  $R^{11}$ 은 또한 함께, 바람직하게는 할로젠, 시아노, 알킬, 할로게노알킬, 알콕시, 할로게노알콕시, 알킬티오 및 할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 알킬렌을 나타내며, 여기에서, 알킬렌 사슬은 각 경우에  $-O-$ ,  $-S-$  또는  $-NR^{18}$ -에 의해 차단될 수 있다.
- <85>  $R^{12}$  및  $R^{13}$ 은 서로 독립적으로 바람직하게는 수소를 나타내거나, 시아노, 알콕시 및 알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 알킬을 나타내거나, 각 경우에 할로젠, 시아노, 알킬, 할로게노알킬, 알콕시, 할로게노알콕시, 알킬티오 및 할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 아릴 또는 아릴알킬을 나타낸다.
- <86>  $R^{12}$  및  $R^{13}$ 은 또한 함께, 바람직하게는 각 경우에 할로젠, 알킬, 할로게노알킬, 알콕시, 할로게노알콕시, 알킬티오 및 할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 알킬렌 또는 알케닐렌을 나타낸다.
- <87>  $R^{14}$  및  $R^{15}$ 는 서로 독립적으로 바람직하게는 수소를 나타내거나, 알킬, 할로게노알킬, 알케닐 또는 할로게노알케닐을 나타낸다.
- <88>  $R^{16}$  및  $R^{17}$ 은 서로 독립적으로 바람직하게는 수소, 알킬 또는 할로게노알킬을 나타내거나, 할로젠 및 알킬로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 사이클로알킬을 나타낸다.
- <89>  $R^{16}$  및  $R^{17}$ 은 또한 함께, 바람직하게는 각 경우에 할로젠 및 알킬로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 알킬렌, 알콕시알킬렌 또는 알킬티오알킬렌을 나타낸다.
- <90>  $R^{18}$ 은 바람직하게는 수소,  $-SO_2R^7$ ,  $-COR^7$  또는  $-CO_2R^7$ 을 나타내거나; 각 경우에 할로젠, 시아노, 알킬아미노, 디알킬아미노, 알콕시, 할로게노알콕시, 알킬티오 및 할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 알킬 또는 알케닐을 나타내거나; 각 경우에 할로젠, 시아노, 알킬, 할로게노알킬, 알콕시, 할로게노알콕시, 알킬티오 및 할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 사이클로알킬, 사이클로알킬알킬, 아릴, 아릴알킬, 또는 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 가진

포화 또는 불포화 5- 내지 10-원 헤테로사이클릴 또는 헤테로사이클릴알킬을 나타낸다.

- <91> w는 바람직하게는 0, 1 또는 2를 나타낸다.
- <92> n은 바람직하게는 1, 2, 3 또는 4를 나타낸다.
- <93> p는 바람직하게는 0, 1 또는 2를 나타낸다.
- <94> R<sup>1</sup>은 특히 바람직하게는 할로젠, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시 또는 -S(O)<sub>w</sub>R<sup>4</sup>를 나타낸다.
- <95> R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>은 서로 독립적으로 특히 바람직하게는 수소, 할로젠, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬을 나타낸다.
- <96> R<sup>4</sup>는 특히 바람직하게는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬을 나타낸다.
- <97> Het는 특히 바람직하게는 각 경우에 동일하거나 상이한 R<sup>5</sup>에 의해 임의로 일- 내지 사치환되고, 1 내지 3 개의 방향족 환 및 0 내지 4 개의 질소 원자, 0 내지 2 개의 비인접 산소 원자 및/또는 0 내지 2 개의 비인접 황 원자를 포함한 1 내지 4 개의 헤테로원자를 포함하는 5- 내지 14-원 헤테로아릴(특히, 티에닐, 벤조티에닐, 푸릴, 벤조푸릴, 인돌릴, 티에노티에닐, 티에노푸릴, 티에노벤조티에닐, 티에노벤조푸릴, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴)을 나타낸다.
- <98> R<sup>5</sup>는 특히 바람직하게는 그룹 -X-Y-Z-E를 나타내나, 단 X가 직접 결합을 나타내지 않는 경우 Y는 직접 결합을 나타내지 않는다.
- <99> X는 특히 바람직하게는 직접 결합, 산소, -S(O)<sub>w</sub>-, -NR<sup>6</sup>-, 카보닐, 카보닐옥시, 옥시카보닐, 옥시설폰닐(OSO<sub>2</sub>), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬렌, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬렌, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐렌, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알케닐렌, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알키닐렌, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬렌옥시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-옥시알킬렌, 옥시-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬렌옥시, -S(O)<sub>w</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬렌, 사이클로프로필렌 또는 옥시라닐렌을 나타낸다.
- <100> Y는 특히 바람직하게는 직접 결합을 나타내거나, 각 경우에 W<sup>1</sup> 리스트중에서 선택된 동일하거나 상이한 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 1,4-페닐렌, 1,3-페닐렌, 1,2-페닐렌, 2,6-나프틸렌, 2,7-나프틸렌, 1,4-나프틸렌, 2,6-(1,2,3,4-테트라하이드로)나프틸렌, 2,7-(1,2,3,4-테트라하이드로)나프틸렌, 1,4-(1,2,3,4-테트라하이드로)나프틸렌 또는 5,8-(1,2,3,4-테트라하이드로)나프틸렌을 나타내거나; W<sup>1</sup> 리스트중에서 선택된 동일하거나 상이한 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 사치환되고, 0 내지 3 개의 질소 원자, 0 내지 2 개의 비인접 산소 원자 및/또는 0 내지 2 개의 비인접 황 원자를 포함한 1 내지 3 개의 헤테로원자를 포함하는 포화 또는 불포화 5- 또는 6-원 헤테로사이클릴렌(특히, 푸릴렌, 티에닐렌, 피롤릴렌, 옥사졸릴렌, 티아졸릴렌, 피리디닐렌, 피리미디닐렌, 피리다지닐렌 또는 피라지닐렌)을 나타낸다.
- <101> Z는 특히 바람직하게는 직접 결합 또는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-을 나타낸다.
- <102> E는 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 하이드록실, 시아노, 포르밀, 니트로, 트리-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬)실릴, 펜타플루오로티오, -S(O)<sub>w</sub>R<sup>7</sup>, -OSO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, -COR<sup>7</sup>, -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -OC(O)R<sup>7</sup>, -CONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, -N(R<sup>12</sup>)COR<sup>13</sup>, -C(R<sup>14</sup>)=N-OR<sup>15</sup> 또는 -SO<sub>2</sub>NR<sup>16</sup>R<sup>17</sup>을 나타내거나; 각 경우에 할로젠, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-알콕시 및 -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-알키닐, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-알콕시 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-알케닐옥시를 나타내거나; 각 경우에 할로젠, 시아노, 니트로, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알케닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-사이클로알킬옥시, 아릴, 아릴-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 아

릴옥시, 아릴옥시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 또는 0 내지 4 개의 질소 원자, 0 내지 2 개의 비인접 산소 원자 및/또는 0 내지 2 개의 비인접 황 원자를 포함한 1 내지 4 개의 헤테로원자를 포함하는 포화 또는 불포화 5- 내지 10-원 헤테로 사이클릴 또는 헤테로사이클릴-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬(특히, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디노, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 피페리디노, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 모르폴리노, 티오모르폴리노, 트리아지닐, 트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐)을 나타낸다.

<103> W<sup>1</sup>은 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, 시아노, 포르밀, 니트로, 트리-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬)실릴, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐옥시, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알케닐옥시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬카보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시카보닐, -S(O)<sub>w</sub>R<sup>7</sup>, -C(R<sup>14</sup>)=N-OR<sup>15</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>16</sup>R<sup>17</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>NR<sup>16</sup>R<sup>17</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>N(R<sup>16</sup>)COR<sup>17</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>N(R<sup>16</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>17</sup>, -OSO<sub>2</sub>R<sup>16</sup> 또는 -OSO<sub>2</sub>NR<sup>16</sup>R<sup>17</sup>을 나타낸다.

<104> R<sup>6</sup>은 특히 바람직하게는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬을 나타내거나, 각 경우에 할로젠, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 아릴 또는 아릴-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타낸다.

<105> R<sup>7</sup>은 특히 바람직하게는 할로젠 및 -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-알킬을 나타내거나, 각 경우에 할로젠, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 팔치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬, 아릴 또는 아릴-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타낸다.

<106> R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 서로 독립적으로 특히 바람직하게는 수소, -SO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -COR<sup>7</sup> 또는 -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>을 나타내거나, 각 경우에 할로젠, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬카보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬카보닐옥시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬)아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-알킬 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-알케닐을 나타내거나; 각 경우에 할로젠, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 아릴, 아릴-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 또는 0 내지 4 개의 질소 원자, 0 내지 2 개의 비인접 산소 원자 및/또는 0 내지 2 개의 비인접 황 원자를 포함한 1 내지 4 개의 헤테로원자를 포함하는 포화 또는 불포화 5- 내지 10-원 헤테로사이클릴 또는 헤테로사이클릴-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬(특히, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 트리아지닐, 트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐)을 나타낸다.

<107> R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 또한 함께, 특히 바람직하게는 할로젠, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>-알케닐렌을 나타내거나, 알킬렌 부분이 할로젠, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-알킬렌을 나타내고, 여기에서, 알킬렌 사슬은 각 경우에 -O-, -S- 또는 -NR<sup>18</sup>-에 의해 차단될 수 있다.

- <108> R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 서로 독립적으로 특히 바람직하게는 수소 또는 -SO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>을 나타내거나, 각 경우에 할로젠, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬)아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 십삼치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐을 나타내거나; 각 경우에 할로젠, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 아릴, 아릴-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 또는 0 내지 4 개의 질소 원자, 0 내지 2 개의 비인접 산소 원자 및/또는 0 내지 2 개의 비인접 황 원자를 포함한 1 내지 4 개의 헤테로원자를 포함하는 포화 또는 불포화 5- 내지 10-원 헤테로사이클릴 또는 헤테로사이클릴-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬(특히, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤조사졸릴, 이속사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 트리아지닐, 트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐)을 나타낸다.
- <109> R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 또한 함께, 특히 바람직하게는 각 경우에 알킬렌 부분이 할로젠, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알킬렌, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- 또는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-N(R<sup>18</sup>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-를 나타낸다.
- <110> R<sup>12</sup> 및 R<sup>13</sup>은 서로 독립적으로 특히 바람직하게는 수소를 나타내거나, 할로젠, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 십삼치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬을 나타내거나, 각 경우에 할로젠, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 팔치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 아릴 또는 아릴-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타낸다.
- <111> R<sup>12</sup> 및 R<sup>13</sup>은 또한 함께, 특히 바람직하게는 각 경우에 할로젠, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 팔치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-알킬렌 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-알케닐렌을 나타낸다.
- <112> R<sup>14</sup> 및 R<sup>15</sup>는 서로 독립적으로 특히 바람직하게는 수소를 나타내거나, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알케닐을 나타낸다.
- <113> R<sup>16</sup> 및 R<sup>17</sup>은 서로 독립적으로 특히 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬을 나타내거나, 불소, 염소, 브롬 및/또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 팔치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-사이클로알킬을 나타낸다.
- <114> R<sup>16</sup> 및 R<sup>17</sup>은 또한 함께, 특히 바람직하게는 각 경우에 불소, 염소, 브롬 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 구치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-알킬렌, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알콕시-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬렌 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬티오-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-알킬렌을 나타낸다.
- <115> R<sup>18</sup>은 특히 바람직하게는 수소, -SO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -COR<sup>7</sup> 또는 -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>을 나타내거나; 각 경우에 할로젠, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬)아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-알킬 또는

C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-알케닐을 나타내거나; 각 경우에 할로젠, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 아릴, 아릴-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 또는 0 내지 4 개의 질소 원자, 0 내지 2 개의 비인접 산소 원자 및/또는 0 내지 2 개의 비인접 황 원자를 포함한 1 내지 4 개의 헤테로원자를 포함하는 포화 또는 불포화 5- 내지 10-원 헤테로사이클릴 또는 헤테로사이클릴-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬(특히, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤조사졸릴, 이속사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 트리아지닐, 트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐)을 나타낸다.

- <116> w는 특히 바람직하게는 0, 1 또는 2를 나타낸다.
- <117> n은 특히 바람직하게는 1, 2 또는 3을 나타낸다.
- <118> p는 특히 바람직하게는 0, 1 또는 2를 나타낸다.
- <119> R<sup>1</sup>은 매우 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 1 내지 9 개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 갖는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, 1 내지 9 개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 갖는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시 또는 -S(O)<sub>w</sub>R<sup>4</sup>를 나타낸다.
- <120> R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>은 서로 독립적으로 매우 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 1 내지 9 개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 갖는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, 또는 1 내지 9 개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 갖는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시를 나타낸다.
- <121> R<sup>4</sup>는 매우 특히 바람직하게는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬을 나타내거나, 각 경우에 불소- 또는 염소-치환된 메틸 또는 에틸을 나타낸다.
- <122> Het는 매우 특히 바람직하게는 각 경우에 동일하거나 상이한 R<sup>5</sup>에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-인돌릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 2-피리디닐, 3-피리디닐, 2-피리미디닐, 5-피리미디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐, 2-피라지닐, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타낸다.
- <123> R<sup>5</sup>는 매우 특히 바람직하게는 그룹 -X-Y-Z-E를 나타내나, 단 X가 직접 결합을 나타내지 않는 경우 Y는 직접 결합을 나타내지 않는다.
- <124> X는 매우 특히 바람직하게는 직접 결합, 산소, -S(O)<sub>w</sub>-, -NR<sup>6</sup>-, 카보닐, 카보닐옥시, 옥시카보닐, 옥시설폰닐(OSO<sub>2</sub>), C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌, 1 내지 8 개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 갖는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬렌, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알케닐렌, 1 내지 6 개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 갖는 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알케닐렌, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알킬닐렌, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌옥시, 옥시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌, 옥시-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌옥시 또는 -S(O)<sub>w</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬렌을 나타낸다.
- <125> Y는 매우 특히 바람직하게는 직접 결합을 나타내거나, 각 경우에 W<sup>1</sup> 리스트중에서 선택된 동일하거나 상이한 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 1,4-페닐렌, 1,3-페닐렌, 1,2-페닐렌, 2,6-나프틸렌, 2,7-나프틸렌, 1,4-나프틸렌, 2,6-(1,2,3,4-테트라하이드로)나프틸렌, 2,7-(1,2,3,4-테트라하이드로)나프틸렌, 1,4-(1,2,3,4-테트라하이드로)나프틸렌, 5,8-(1,2,3,4-테트라하이드로)나프틸렌, 2,4-푸릴렌, 2,4-티에닐렌, 2,4-피롤릴렌, 2,5-옥사졸릴렌, 2,5-티아졸릴렌, 2,5-피리디닐렌, 2,6-피리디닐렌, 2,5-피리미디닐렌, 3,6-피리다지닐렌 또는 2,5-피라지닐렌을 나타낸다.
- <126> Z는 매우 특히 바람직하게는 직접 결합 또는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-을 나타낸다.

<127> E는 매우 특히 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 하이드록실, 시아노, 포르밀, 니트로, 트리메틸실릴, 디메틸-t-부틸실릴,  $-S(O)_wR^7$ ,  $-OSO_2R^7$ ,  $-NR^8R^9$ ,  $-COR^7$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-OC(O)R^7$ ,  $-CONR^{10}R^{11}$ ,  $-N(R^{12})COR^{13}$  또는  $-SO_2NR^{16}R^{17}$ 을 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시 및  $-NR^8R^9$ 로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알킬닐, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알콕시 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-알케닐옥시를 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-할로게노알케닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-사이클로알킬옥시, 페닐, 페녹시, 벤질, 페닐에틸, 벤질옥시, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디노, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 피페리디노, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 모르폴리노, 티오모르폴리노, 트리아지닐, 트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐을 나타낸다.

<128> W<sup>1</sup>은 매우 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, 시아노, 포르밀, 트리메틸실릴, 디메틸-t-부틸실릴, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알케닐 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-알케닐옥시를 나타내거나; 각 경우에 1 내지 9 개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 갖는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, 각 경우에 1 내지 8 개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 갖는 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알케닐 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알케닐옥시를 나타내거나; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬 카보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시카보닐,  $-S(O)_wR^7$ ,  $-SO_2NR^{16}R^{17}$ ,  $-(CH_2)_pNR^{16}R^{17}$ ,  $-(CH_2)_pN(R^{16})COR^{17}$ ,  $-(CH_2)_pN(R^{16})SO_2R^{17}$ ,  $-OSO_2R^{16}$  또는  $OSO_2NR^{16}R^{17}$ 을 나타낸다.

<129> R<sup>6</sup>은 매우 특히 바람직하게는 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 트리플루오로메틸 또는 트리플루오로에틸을 나타내거나, 각 경우에 불소, 염소, 브롬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오, 및 각 경우에 1 내지 9 개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 갖는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 사이클로프로필, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실, 사이클로헥실메틸, 페닐, 벤질 또는 페닐에틸을 나타낸다.

<130> R<sup>7</sup>은 매우 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬 및  $-NR^8R^9$ 로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-알킬을 나타내거나, 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 페닐 또는 벤질을 나타낸다.

<131> R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 서로 독립적으로 매우 특히 바람직하게는 수소,  $-SO_2R^7$ ,  $-COR^7$  또는  $-CO_2R^7$ 을 나타내거나, 각 경우에 불소, 염소, 브롬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬카보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬카보닐옥시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬)아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알킬 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-알케닐을 나타내거나, 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 페닐, 벤질, 페닐에틸, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 트리아지닐,

트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐을 나타낸다.

<132> R<sup>8</sup> 및 R<sup>9</sup>는 또한 함께, 매우 특히 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-알케닐렌을 나타내거나, 알킬렌 부분이 불소, 염소, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-알킬렌을 나타내고, 여기에서, 알킬렌 사슬은 각 경우에 -O-, -S- 또는 -NR<sup>18</sup>-에 의해 차단될 수 있다.

<133> R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 서로 독립적으로 매우 특히 바람직하게는 수소 또는 -SO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>을 나타내거나, 각 경우에 불소, 염소, 브롬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬)아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 구치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-알케닐을 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 페닐, 벤질, 페닐에틸, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤조사졸릴, 이속사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 트리아지닐, 트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐을 나타낸다.

<134> R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 또한 함께, 매우 특히 바람직하게는 각 경우에 알킬렌 부분이 불소, 염소, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-알킬렌, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- 또는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-N(R<sup>18</sup>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-를 나타낸다.

<135> R<sup>12</sup> 및 R<sup>13</sup>은 서로 독립적으로 매우 특히 바람직하게는 수소를 나타내거나, 불소, 염소, 브롬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 구치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬을 나타내거나, 각 경우에 불소, 염소, 브롬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 페닐, 벤질 또는 페닐에틸을 나타낸다.

<136> R<sup>12</sup> 및 R<sup>13</sup>은 또한 함께, 매우 특히 바람직하게는 각 경우에 불소, 염소, 브롬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-알킬렌 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-알케닐렌을 나타낸다.

<137> R<sup>16</sup> 및 R<sup>17</sup>은 서로 독립적으로 매우 특히 바람직하게는 수소, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬 또는 1 내지 9개의 불소, 염소 및/또는 브롬 원자를 갖는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬을 나타내거나, 불소, 염소, 브롬 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬을 나타낸다.

<138> R<sup>16</sup> 및 R<sup>17</sup>은 또한 함께, 매우 특히 바람직하게는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- 또는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-를 나타낸다.

<139> R<sup>18</sup>은 매우 특히 바람직하게는 수소 또는 -SO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>을 나타내거나, -COR<sup>7</sup> 또는 -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>을 나타내거나; 각 경우에 불

소, 염소, 브롬, 시아노, 메틸아미노, 에틸아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬)아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알킬 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-알케닐을 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-사이클로알킬, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-사이클로알킬-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬, 페닐, 벤질, 페닐에틸, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤조옥사졸릴, 이소옥사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 트리아지닐, 트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐을 나타낸다.

- <140> w는 매우 특히 바람직하게는 0, 1 또는 2를 나타낸다.
- <141> n은 매우 특히 바람직하게는 1 또는 2를 나타낸다.
- <142> p는 매우 특히 바람직하게는 0 또는 1을 나타낸다.
- <143> R<sup>1</sup>은 보다 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, 메틸, 트리플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 메틸티오 또는 트리플루오로메틸티오를 나타낸다.
- <144> R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>은 서로 독립적으로 보다 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 메틸, 트리플루오로메틸, 메톡시 또는 트리플루오로메톡시를 나타낸다.
- <145> Het는 보다 바람직하게는 각 경우에 동일하거나 상이한 R<sup>5</sup>에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 2-피리디닐, 3-피리디닐, 2-피리미디닐, 5-피리미디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐 또는 2-피라지닐을 나타낸다.
- <146> R<sup>5</sup>는 보다 바람직하게는 그룹 -X-Y-Z-E를 나타내나, 단 X가 직접 결합을 나타내지 않는 경우 Y는 직접 결합을 나타내지 않는다.
- <147> X는 보다 바람직하게는 직접 결합, 산소, 황, -SO<sub>2</sub>-, -NR<sup>6</sup>-, -CO-, -C(O)O-, -O(C)O-, -CH<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -C=C-(E 또는 Z), -C≡C-, -CH<sub>2</sub>O-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O-, -OCH<sub>2</sub>-, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -O-CH<sub>2</sub>-O-, -SCH<sub>2</sub>-, -S(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>S- 또는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S-를 나타낸다.
- <148> Y는 보다 바람직하게는 직접 결합을 나타내거나, 각 경우에 W<sup>1</sup> 리스트중에서 선택된 동일하거나 상이한 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 1,4-페닐렌, 1,3-페닐렌, 2,6-나프틸렌, 2,7-나프틸렌, 2,4-푸릴렌, 2,4-티에닐렌, 2,5-피리디닐렌, 2,5-피리미디닐렌, 3,6-피리다지닐렌 또는 2,5-피라지닐렌을 나타낸다.
- <149> Z는 보다 바람직하게는 직접 결합, 메틸렌 또는 에틸렌을 나타낸다.
- <150> E는 보다 바람직하게는 수소, 불소, 염소, 브롬, 하이드록실, 시아노, 포르밀, -S(O)<sub>w</sub>R<sup>7</sup>, -OSO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, -COR<sup>7</sup>, -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -OC(O)R<sup>7</sup>, -CONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, -N(R<sup>12</sup>)COR<sup>13</sup> 또는 -SO<sub>2</sub>NR<sup>16</sup>R<sup>17</sup>을 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알콕시 및 -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-알케닐, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알콕시 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-알케닐옥시를 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, -CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, 비닐, 알릴, 1-프로페닐, 부테닐, -CF=CHF, -CF=CH<sub>2</sub>, -CF=CCl<sub>2</sub>, -CH=CF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CF=CF<sub>2</sub>, -CH=CFH, -CH<sub>2</sub>CF=CF<sub>2</sub>, -CF=CF<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CH=CF<sub>2</sub>, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소프로폭시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 클로로디플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시, 메틸티오, 에틸티오, n-프로필티오, 이소프로필티오, n-부틸티오,

이소부틸티오, sec-부틸티오, t-부틸티오, 트리플루오로메틸티오, 디플루오로메틸티오, 클로로디플루오로메틸티오 및 트리플루오로에틸티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로프로필옥시, 사이클로펜틸옥시, 사이클로헥실옥시, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실메틸, 페닐, 페녹시, 벤질, 페닐에틸, 벤질옥시, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디노, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 피페리디노, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 모르폴리노, 티오모르폴리노, 트리아지닐, 트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐을 나타낸다.

<151>  $W^1$ 은 보다 바람직하게는 불소, 염소, 브롬, 시아노, 포르밀, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소프로폭시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시, 비닐, 알릴, 트리플루오로메틸, 트리플루오로에틸, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로에톡시,  $-OCF_2CF_2H$ ,  $-CH=CF_2$ ,  $-CH=CCl_2$ ,  $-OCF=CF_2$ ,  $-COMe$ ,  $-COEt$ ,  $-CO_2Me$ ,  $-CO_2Et$ ,  $-CO_2(t-Bu)$ ,  $-SMe$ ,  $-SOMe$ ,  $SO_2Me$ ,  $-SCF_3$ ,  $-SOCF_3$ ,  $-SO_2CF_3$ ,  $-SCHF_2$ ,  $-SOCHF_2$ ,  $-SO_2CHF_2$ ,  $-SO_2NMe_2$ ,  $-NMe_2$ ,  $-NEt_2$ ,  $-N(n-Pr)_2$ ,  $-N(Me)COMe$ ,  $-N(Me)COEt$ ,  $-N(Me)COPr$ ,  $-N(Me)CO(t-Bu)$ , 2-피롤리도닐, 2-피페리도닐,  $-N(Me)SO_2Me$ ,  $-N(Me)SO_2Et$ ,  $-N(Me)SO_2CF_3$ ,  $-N(Et)SO_2CF_3$ ,  $-N(Me)SO_2(CF_2)_3CF_3$  또는  $-OSO_2NMe_2$  를 나타낸다.

<152>  $R^6$ 은 보다 바람직하게는 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 트리플루오로메틸, 트리플루오로에틸, 사이클로프로필, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실, 사이클로헥실메틸, 페닐, 벤질 또는 페닐에틸을 나타낸다.

<153>  $R^7$ 은 보다 바람직하게는 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 펜틸, 헥실,  $-CF_3$ ,  $-CHF_2$ ,  $-CCl_3$ ,  $-CCl_2F$ , 디메틸아미노메틸, 디메틸아미노에틸, 디에틸아미노메틸, 디에틸아미노에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 페닐 또는 벤질을 나타낸다.

<154>  $R^8$  및  $R^9$ 는 서로 독립적으로 보다 바람직하게는 수소,  $-SO_2R^7$ ,  $-COR^7$  또는  $-CO_2R^7$ 을 나타내거나, 각 경우에 불소, 염소, 브롬,  $C_1-C_4$ -알킬카보닐,  $C_1-C_4$ -알킬카보닐옥시,  $C_1-C_4$ -알킬아미노, 디- $(C_1-C_4)$ -알킬아미노,  $C_1-C_4$ -알콕시,  $C_1-C_4$ -할로게노알콕시,  $C_1-C_4$ -알킬티오 및  $C_1-C_4$ -할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된  $C_1-C_{16}$ -알킬 또는  $C_2-C_{16}$ -알케닐을 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노,  $C_1-C_4$ -알킬,  $C_1-C_4$ -할로게노알킬,  $C_1-C_4$ -알콕시,  $C_1-C_4$ -할로게노알콕시,  $C_1-C_4$ -알킬티오 및  $C_1-C_4$ -할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된  $C_3-C_8$ -사이클로알킬, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실메틸, 사이클로프로필에틸, 사이클로펜틸에틸, 사이클로헥실에틸, 페닐, 벤질, 페닐에틸, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤족사졸릴, 이속사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 트리아지닐, 트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐을 나타낸다.

<155>  $R^8$  및  $R^9$ 는 또한 함께, 보다 바람직하게는 불소, 염소, 브롬,  $C_1-C_4$ -알콕시,  $C_1-C_4$ -할로게노알콕시,  $C_1-C_4$ -알킬티오 및  $C_1-C_4$ -할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된  $C_2-C_8$ -알케닐렌을 나타내거나, 알킬렌 부분이 불소, 염소, 시아노, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸,  $C_1-C_4$ -할로게노알킬, 메톡시, 에톡시, n-프로폭시, 이소프로폭시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시,  $C_1-C_4$ -할로게노알콕시, 메틸티오, 에틸티오, n-프로필티오, 이소프로필티오, n-부틸티오, 이소부틸티오, sec-부틸티오, t-부틸티오 및  $C_1-C_4$ -할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된  $C_3-C_8$ -알킬렌을 나타내고, 여기에서,

알킬렌 사슬은 각 경우에 -O-, -S- 또는 -NR<sup>18</sup>-에 의해 차단될 수 있다.

<156> R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 서로 독립적으로 보다 바람직하게는 수소, -SO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 펜틸, 헥실, -CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CF<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CF<sub>3</sub>, 메톡시메틸, 메톡시에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나, 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 메틸, 트리플루오로메틸, 메톡시 및 트리플루오로메톡시로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 페닐 또는 벤질을 나타낸다.

<157> R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 또한 함께, 보다 바람직하게는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- 또는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-N(R<sup>18</sup>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-를 나타낸다.

<158> R<sup>12</sup> 및 R<sup>13</sup>은 서로 독립적으로 보다 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, n-헥실, 트리플루오로메틸, 트리플루오로에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타내거나, 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 메틸, 트리플루오로메틸, 메톡시 및 트리플루오로메톡시로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 페닐 또는 벤질을 나타낸다.

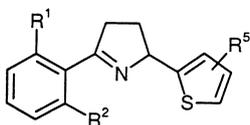
<159> R<sup>12</sup> 및 R<sup>13</sup>은 또한 함께, 보다 바람직하게는 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시, 메틸티오, 에틸티오, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시 및 트리플루오로메틸티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>- 또는 (CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>-을 나타낸다.

<160> R<sup>16</sup> 및 R<sup>17</sup>은 서로 독립적으로 보다 바람직하게는 수소, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, n-헥실, 트리플루오로메틸, 트리플루오로에틸, 사이클로프로필, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실을 나타낸다.

<161> R<sup>16</sup> 및 R<sup>17</sup>은 또한 함께, 보다 바람직하게는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- 또는 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-를 나타낸다.

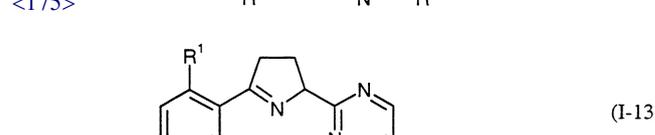
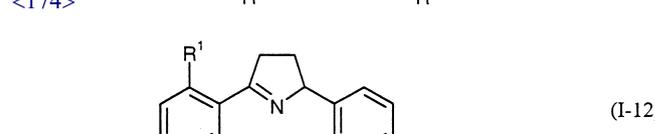
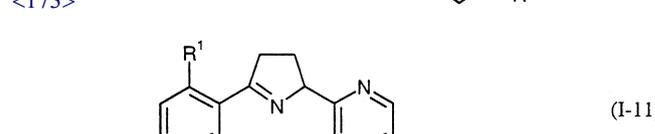
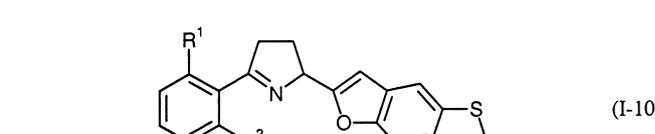
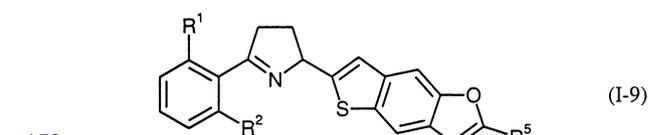
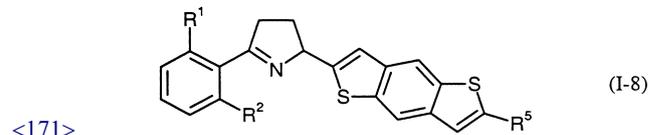
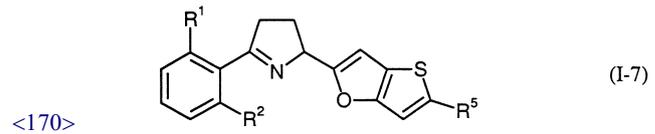
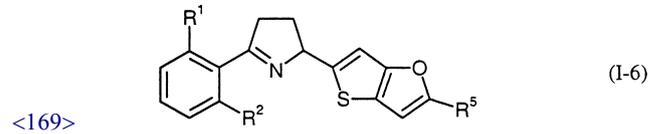
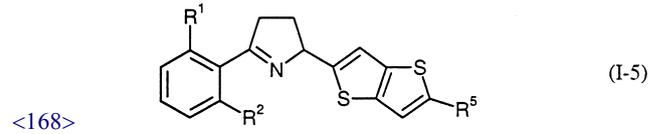
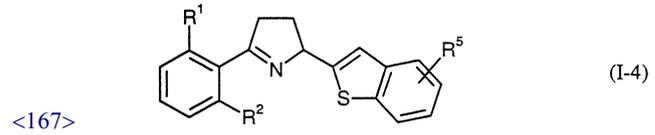
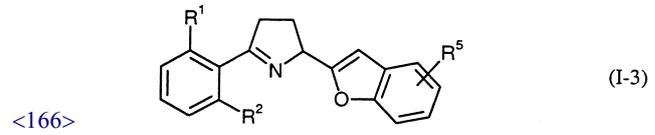
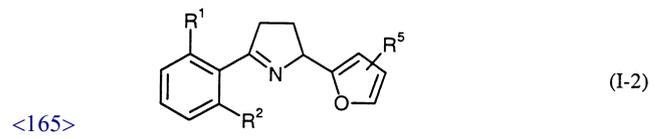
<162> R<sup>18</sup>은 보다 바람직하게는 수소 또는 -SO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>을 나타내거나, -COR<sup>7</sup> 또는 -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>을 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, 메틸아미노, 에틸아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬)아미노, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-알킬티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 또는 다치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-알킬 또는 C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-알케닐을 나타내거나; 각 경우에 불소, 염소, 브롬, 시아노, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, 메톡시, 에톡시, n-프로콕시, 이소프로콕시, n-부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알콕시, 메틸티오, 에틸티오, n-프로필티오, 이소프로필티오, n-부틸티오, 이소부틸티오, sec-부틸티오, t-부틸티오 및 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬티오로 구성된 그룹으로부터 선택된 동일하거나 상이한 치환체에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-사이클로알킬, 사이클로프로필메틸, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실메틸, 사이클로프로필에틸, 사이클로펜틸에틸, 사이클로헥실에틸, 페닐, 벤질, 페닐에틸, 테트라졸릴, 푸릴, 푸르푸릴, 벤조푸릴, 테트라하이드로푸릴, 티에닐, 테닐, 벤조티에닐, 티올라닐, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리닐, 피롤리디닐, 옥사졸릴, 벤조옥사졸릴, 이속옥사졸릴, 이미다졸릴, 피라졸릴, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 티아졸리디닐, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다질, 피라지닐, 피페리디닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 트리아지닐, 트리아졸릴, 퀴놀리닐 또는 이소퀴놀리닐을 나타낸다.

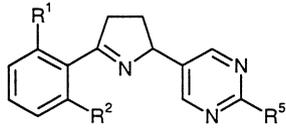
<163> 매우 특히 바람직한 것으로 또한 일반식 (I-1) 내지 (I-16)의 화합물이 제시된다.



(I-1)

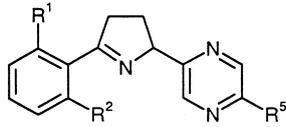
<164>





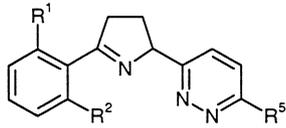
(I-14)

<177>



(I-15)

<178>



(I-16)

<179>

<180>

상기 식에서,

<181>

R<sup>1</sup>은 불소 또는 염소를 나타내고,

<182>

R<sup>2</sup>는 수소 또는 불소를 나타내며,

<183>

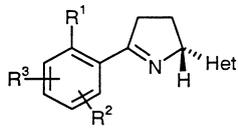
R<sup>5</sup>는 상기 언급된 의미를 갖는다.

<184>

일반식 (I-1) 내지 (I-16)의 화합물에서, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> 및 R<sup>5</sup>는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로서 상기 이미 언급된 의미를 갖는다.

<185>

매우 특히 바람직한 것으로 또한 (R)-배위를 갖는 일반식 (I-d)의 화합물이 제시된다:



(I-d)

<186>

<187>

상기 식에서,

<188>

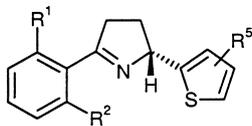
R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 및 Het는 상기 언급된 의미를 갖는다.

<189>

일반식 (I-d)의 화합물에서, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 및 Het는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로서 상기 이미 언급된 의미를 갖는다.

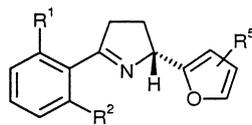
<190>

매우 특히 바람직한 것으로 또한 (R)-배위를 갖는 일반식 (I-17) 내지 (I-32)의 화합물이 제시된다



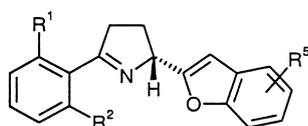
(I-17)

<191>



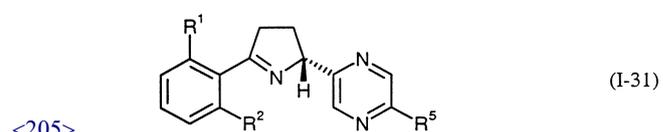
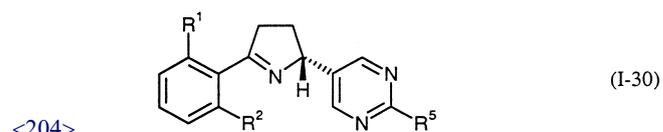
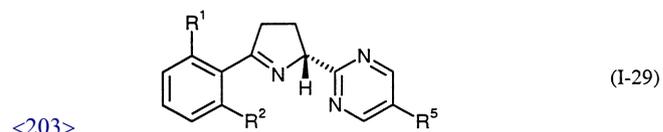
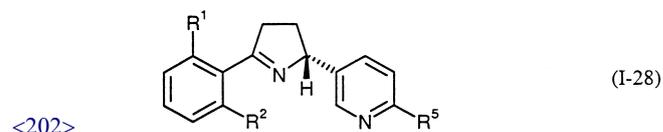
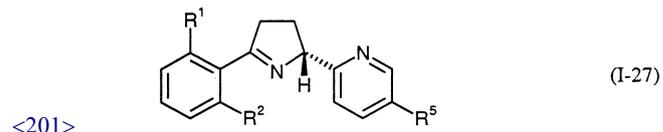
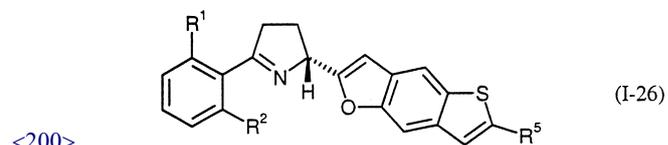
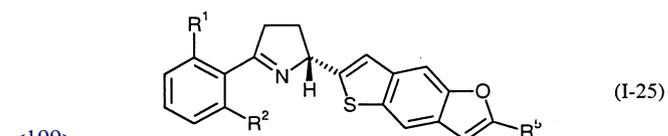
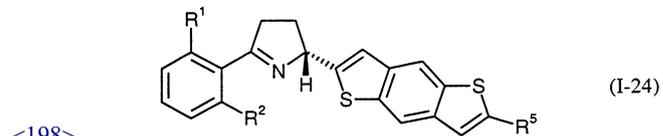
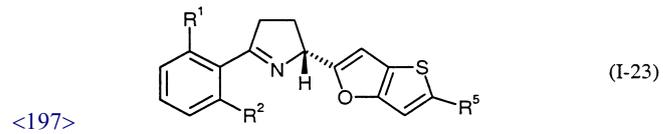
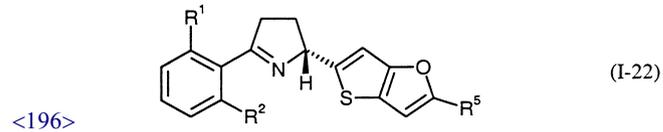
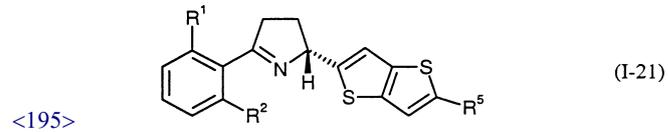
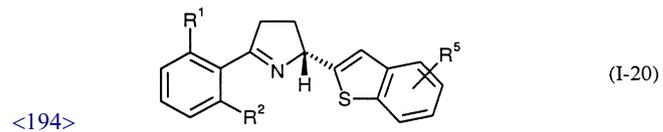
(I-18)

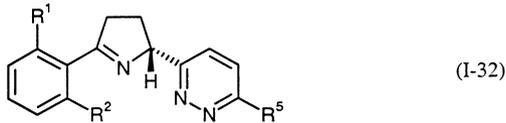
<192>



(I-19)

<193>





<206>

<207>

상기 식에서,

<208>

R<sup>1</sup>은 불소 또는 염소를 나타내고,

<209>

R<sup>2</sup>는 수소 또는 불소를 나타내며,

<210>

R<sup>5</sup>는 상기 언급된 의미를 갖는다.

<211>

일반식 (I-17) 내지 (I-32)의 화합물에서, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> 및 R<sup>5</sup>는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로서 상기 이미 언급된 의미를 갖는다.

<212>

일반식 (I-d)의 화합물은 광학적 분할을 위한 통상적인 방법에 의해, 예를 들어 상응하는 라세메이트를 키랄 정지상에서 크로마토그래피함으로써 취득된다. 이러한 방법으로, 라세미 최종 생성물 및 라세미 중간체를 두 에난티오머로 분리하는 것이 가능하다.

<213>

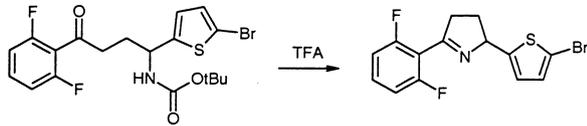
알킬과 같은 포화 탄화수소 래디칼은, 예를 들어 알콕시에서와 같이 헤테로 원자와 결합된 경우를 포함하여, 각 경우, 가능하다면 직쇄 또는 측쇄일 수 있다.

<214>

그러나, 상기 언급된 일반적이거나 바람직한 래디칼의 정의 또는 설명은 또한 원하는 대로, 즉 각각의 범위와 바람직한 범위 사이에서 서로 조합될 수 있다. 이들은 최종 생성물, 및 상응하게 전구체 및 중간체 모두에 적용된다.

<215>

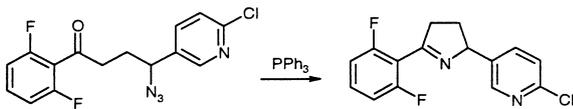
출발물질로서 t-부틸-1-(5-브로모-2-티에닐)-4-(2,6-디플루오로페닐)-4-옥소부틸카바메이트 및 트리플루오로아세트산(TFA)을 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법 (A)의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



<216>

<217>

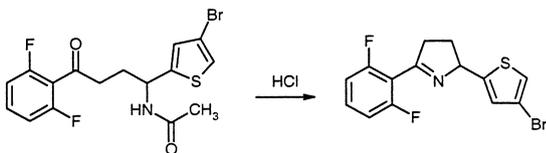
출발물질로서 4-아지도-4-(6-클로로-3-피리디닐)-1-(2,6-디플루오로페닐)-1-부탄온 및 트리페닐포스핀(PPh<sub>3</sub>)을 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법 (B)의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



<218>

<219>

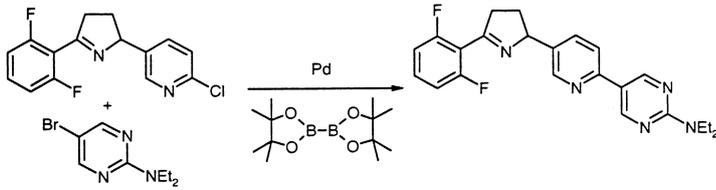
출발물질로서 N-[1-(4-브로모-2-티에닐)-4-(2,6-디플루오로페닐)-4-옥소부틸]아세트아미드 및 염산(HCl)을 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법 (C)의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



<220>

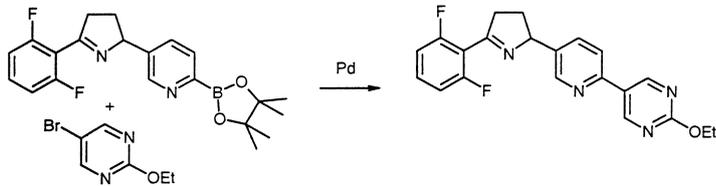
<221>

출발물질로서 2-클로로-5-[5-(2,6-디플루오로페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤-2-일]피리딘과 N-(5-브로모-2-피리미디닐)-N,N-디에틸아민 및 4,4,4',4',5,5,5', 5'-옥타메틸-2,2'-비스-1,3,2-디옥사보롤란 및 팔라듐 촉매를 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법 (D)의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



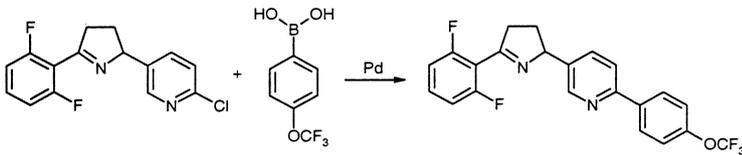
<222>

<223> 출발물질로서 2-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-디옥사보롤란-2-일)-5-[5-(2,6-디플루오로페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤-2-일]피리딘과 5-브로모-2-트리플루오로메톡시피리미딘 및 팔라듐 촉매를 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법 (E)의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



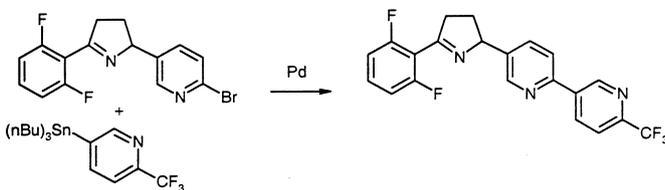
<224>

<225> 출발물질로서 2-클로로-5-[5-(2,6-디플루오로페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤-2-일]피리딘과 4-트리플루오로메톡시페닐보론산 및 팔라듐 촉매를 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법 (F)의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



<226>

<227> 출발물질로서 2-브로모-5-[5-(2,6-디플루오로페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤-2-일]피리딘과 2-트리플루오로메틸-5-(트리부틸스탄닐)피리딘 및 팔라듐 촉매를 사용하는 경우, 본 발명에 따른 방법 (G)의 과정은 다음과 같은 반응식으로 나타내어질 수 있다:



<228>

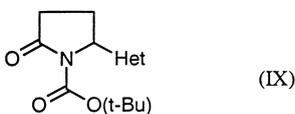
<229> **방법 및 중간체 설명**

<230> **방법 (A)**

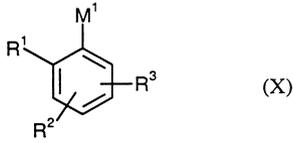
<231> 일반식 (II)는 본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는데 출발물질로 필요한 아미노케톤의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 및 Het는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다.

<232> 일반식 (II)의 아미노케톤은 신규하다. 이들은

<233> a) 일반식 (IX)의 락탐을 -70 내지 +70 °C의 온도에서, 경우에 따라 희석제(예: 테트라하이드로푸란)의 존재하에 일반식 (X)의 금속화 방향족 화합물과 반응시켜 제조할 수 있다:



<234>



<235>

<236>

상기 식에서,

<237>

Het, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>은 상기 언급된 의미를 가지며,

<238>

M<sup>1</sup>은 Li, MgCl, MgBr, MgI 또는 ZnCl을 나타낸다.

<239>

일반식 (IX)는 방법 (a)를 수행하는데 출발물질로 필요한 락탐의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, Het는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다.

<240>

일반식 (IX)의 락탐은 신규하다. 이들은

<241>

b) 일반식 (XI)의 락탐을 예를 들어 염기(예: 디메틸아미노피리딘)의 존재하 및 경우에 따라 희석제(예: 디클로로메탄)의 존재하에 디-t-부틸 디카보네이트와 반응시켜 제조할 수 있다(참조: Tetrahedron Lett. 1998, 39, 2705-2706):



<242>

상기 식에서,

<244>

Het는 상기 언급된 의미를 갖는다.

<245>

일반식 (X)는 방법 (a)를 수행하는데 출발물질로 필요한 금속화 방향족 화합물의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다. M<sup>1</sup>은 바람직하게는 Li, MgCl, MgBr, MgI 또는 ZnCl, 특히 바람직하게는 Li, MgCl, MgBr 또는 MgI, 매우 특히 바람직하게는 Li, MgCl 또는 MgBr을 나타낸다.

<246>

일반식 (X)의 금속화 방향족 화합물은 공지되었고/되었거나, 상응하는 방향족 또는 할로겐화 방향족 화합물로부터 공지된 방법(예: 리튬화 또는 그리냐드(Grignard) 반응)에 의해 제조될 수 있다.

<247>

일반식 (XI)는 방법 (b)를 수행하는데 출발물질로 필요한 락탐의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, Het는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다.

<248>

일반식 (XI)의 락탐의 일부는 공지되어 있다. 이들은 예를 들어

<249>

c) 일반식 (XII)의 알콕시락탐을

<250>

a) 양성자산(예: 황산, 아세트산) 또는 루이스산(예: 알루미늄 클로라이드)의 존재하 및 경우에 따라 희석제(예: 디클로로메탄 또는 아세토니트릴)의 존재하에 일반식 (XIII)의 헤테로방향족 화합물과 반응시키거나(참조: Tetrahedron 1976, 32, 1571),

<251>

β) 희석제(예: 테트라하이드로푸란)의 존재하에 일반식 (XIV)의 그리냐드 화합물과 반응시켜(참조: Org. Prep. Proced. Int. 1993, 25, 255.) 제조할 수 있다:



<252>

H-Het<sup>5</sup> (XIII)

<253>



- <254>
- <255> 상기 식에서,
- <256>  $R^{20}$ 은 알킬을 나타내고,
- <257>  $\text{Het}^5$ 는 1 내지 3 개의 방향족 환 및 산소 및 황으로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 포함하고, 동일하거나 상이한  $R^5$ 에 의해 일- 내지 사치환된 5- 내지 14-원 헤테로아릴을 나타내며, 여기서,  $R^5$ 는 상기 언급된 의미를 가지며,
- <258> Het는 상기 언급된 의미를 가지고,
- <259>  $\text{Hal}^1$ 은 할로젠을 나타낸다.
- <260> 일반식 (XII)는 본 발명에 따른 방법 (c)를 수행하는데 출발물질로 필요한 알콕시락탐의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서,  $R^{20}$ 은 바람직하게는  $C_1-C_6$ -알킬, 특히 바람직하게는  $C_1-C_4$ -알킬, 매우 특히 바람직하게는 메틸 또는 에틸을 나타낸다.
- <261> 일반식 (XII)의 알콕시락탐은 공지되어 있으며, 예를 들어 소듐 보로네이트에 의한 환원 또는 음극 환원에 의해 상응하는 비치환된 이미드로부터 제조할 수 있거나 양극 산화에 의해 비치환된 락탐으로부터 제조할 수 있다(참조. J. Org. Chem. 1991, 56, 1822; Synthesis 1980, 315).
- <262> 일반식 (XIII)는 방법 (a)를 수행하는데 출발물질로 필요한 헤테로방향족 화합물의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서,  $\text{Het}^5$ 는 바람직하게는 각 경우에 동일하거나 상이한  $R^5$ 에 의해 임의로 일- 내지 사치환되고, 1 내지 3 개의 방향족 환 및 0 내지 2 개의 비인접 산소 원자 및/또는 0 내지 2 개의 비인접 황원자를 포함한 1 또는 2 개의 헤테로원자를 포함하는 5- 내지 14-원 헤테로아릴(특히 티에닐, 벤조티에닐, 푸릴, 벤조푸릴, 티에노티에닐, 티에노푸릴, 티에노벤조티에닐 또는 티에노벤조푸릴)을 나타낸다.  $\text{Het}^5$ 는 특히 바람직하게는 각 경우에 동일하거나 상이한  $R^5$ 에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴 또는 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴을 나타낸다.  $\text{Het}^5$ 는 매우 특히 바람직하게는 각 경우에 동일하거나 상이한  $R^5$ 에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴 또는 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴을 나타낸다. 여기서,  $R^5$ 는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다.
- <263> 일반식 (XIII)의 헤테로방향족 화합물은 공지되었고/되었거나, 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다.
- <264> 일반식 (XIV)는 방법 (β)를 수행하는데 출발물질로 필요한 그리냐드 화합물의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, Het는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다.  $\text{Hal}^1$ 은 바람직하게는 염소, 브롬 또는 요오드를 나타낸다.
- <265> 일반식 (XIV)의 그리냐드 화합물은 공지되었고/되었거나, 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다.
- <266> 본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는데 적합한 희석제는 각 경우 통상적인 모든 불활성 유기 용매이다. 이들은 임의로 할로겐화된 지방족, 지환식 또는 방향족 탄화수소, 예를 들어 석유 에테르, 헥산, 헵탄, 사이클로헥산, 메틸사이클로헥산, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 데칼린; 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; 니트릴, 예를 들어 아세토니트릴, 프로피오니트릴, n- 또는 이소부티로니트릴 또는 벤조니

트릴; 아마이드, 예를 들어 N,N-디메틸포름아미드, N,N-디메틸아세트아미드, N-메틸포름아닐리드, N-메틸피롤리돈 또는 헥사메틸포스포릭 트리아미드; 에스테르, 예를 들어 메틸 아세테이트 또는 에틸 아세테이트; 설폭사이드, 예를 들어 디메틸 설폭사이드; 또는 설펜, 예를 들어 설펜을 사용하는 것이 바람직하다. 메틸렌 클로라이드, 클로로포름, 톨루엔, 메탄올 또는 에탄올을 사용하는 것이 특히 바람직하다.

<267> 각 경우에 통상적인 모든 루이스산 또는 양성자산이 본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는데 적합하다. Boc 그룹을 제거하는 방법은 일반적으로 공지되었다 (참조예: T. W. Greene, P. G. M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, Ed. 3, New York, Wiley & Sons, 1999, pp. 520-525). Boc 그룹을 제거하기 위해 트리플루오로아세트산, HCl 또는 HBr을 사용하는 것이 바람직하다.

<268> 본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는 경우, 반응 온도는 각 경우 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 이 방법은 -20 내지 +120 °C, 바람직하게는 -10 내지 +60 °C의 온도에서 수행된다.

<269> 본 발명에 따른 방법 (A)를 수행하는 경우, 일반식 (II)의 화합물 1 몰당 일반적으로 100 몰의 양성자산이 사용된다. 그러나, 반응 성분들을 다른 비율로 사용하는 것이 또한 가능하다. 후처리하는 통상의 방법으로 수행된다. 일반적으로, 반응 혼합물을 농축하여 적합한 용매에 용해시킨 다음, 수산화나트륨을 사용하여 pH를 12로 조정하고, 유기상을 물로 세척하고 황산나트륨상에서 건조시킨 후, 여과하고, 농축한다. 경우에 따라 잔류물로부터 여전히 존재할 수 있는 불순물을 크로마토그래피 또는 재결정과 같은 통상적인 방법으로 제거한다.

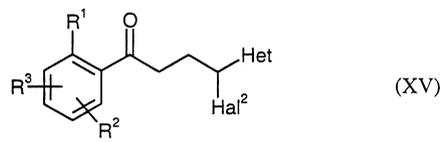
<270> 방법 (B)

<271> 일반식 (III)은 본 발명에 따른 방법 (B)를 수행하는데 출발물질로 필요한 아지드의 일반적인 정의를 제공한다.

이 일반식에서, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 및 Het는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다.

<272> 일반식 (III)의 아지드는 신규하다. 이들은

<273> d) 일반식 (XV)의 할라이드를 희석제(예: 물/아세톤 혼합물 또는 물/에탄올 혼합물)의 존재하 및 경우에 따라 촉매(예: 메틸트리옥틸암모늄 클로라이드=알리쿠아트 336, 참조. M. Es-Sayed, Phd Thesis, University of Goettingen, 1992)의 존재하에 일반식 (XVI)의 아지드와 반응시켜 제조할 수 있다:



<275> 상기 식에서,

<276> R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 및 Het는 상기 언급된 의미를 가지며,

<277> Hal<sup>2</sup>는 할로젠을 나타내고,

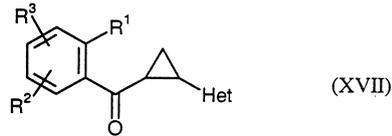
<278> Q는 양이온을 나타낸다.

<279> 일반식 (XV)는 본 발명에 따른 방법 (d)를 수행하는데 출발물질로 필요한 할라이드의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 및 Het는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다. Hal<sup>2</sup>는 바람직하게는 염소, 브롬 또는 요오드를 나타내고, 특히 바람직하게는 염소 또는 브롬을 나타내며, 매우 특히 바람직하게는 염소를 나타낸다.

<280> 일반식 (XV)의 할라이드는 신규하다. 이들은

<281> e) 일반식 (XVII)의 사이클로프로판을 경우에 따라 희석제(예: 물)의 존재하에 양성자산(예: HCl)과 반응시켜

제조할 수 있다:



<283>

<284>

상기 식에서,

<285>

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  및 Het는 상기 언급된 의미를 갖는다.

<286>

일반식 (XVI)는 본 발명에 따른 방법 (d)를 수행하는데 출발물질로 필요한 아지드의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, Q는 바람직하게는 알칼리 금속 이온, 트리알킬실릴, 테트라알킬암모늄, 테트라알킬구아니디늄 또는 폴리머-결합 트리알킬암모늄을 나타낸다. 특히 바람직한 것으로, Q는 소듐, 리튬, 트리메틸실릴, 테트라에틸암모늄, 테트라-n-부틸암모늄 또는 테트라메틸구아니디늄, 매우 특히 바람직하게는 소듐 또는 리튬을 나타낸다.

<287>

일반식 (XVI)의 아지드는 상업적으로 입수가능하고/하거나 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다(참조. Houben-Weyl; Methoden der Organischen Chemie, 4. edition, Organonitrogen Compounds I. pages 1243-1290; Editor: D. Klamann).

<288>

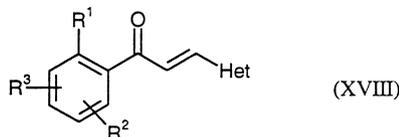
일반식 (XVII)는 본 발명에 따른 방법 (e)를 수행하는데 출발물질로 필요한 사이클로프로판의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  및 Het는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다.

<289>

일반식 (XVII)의 사이클로프로판의 일부는 공지되어 있다. 이들은 예를 들어

<290>

f) 일반식 (XVIII)의  $\alpha$ ,  $\beta$ -불포화 케톤을 염기(예: 소듐 하이드라이드)의 존재하 및 경우에 따라 희석제(예: 디메틸 설폭사이드)의 존재하에 트리알킬설폭소늄 할라이드(예: 트리메틸설폭소늄 요오다이드)와 반응시켜 제조할 수 있다(참조. Tetrahedron Asymmetry 1998, 9, 1035):



<291>

<292>

상기 식에서,

<293>

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  및 Het는 상기 언급된 의미를 갖는다.

<294>

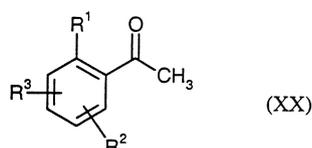
일반식 (XVIII)은 방법 (f)를 수행하는데 출발물질로 필요한  $\alpha$ ,  $\beta$ -불포화 케톤의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  및 Het는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다.

<295>

일반식 (XVIII)의  $\alpha$ ,  $\beta$ -불포화 케톤은 공지되어 있다. 이들은 예를 들어

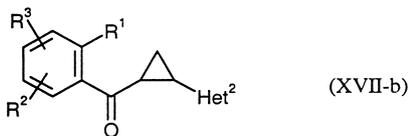
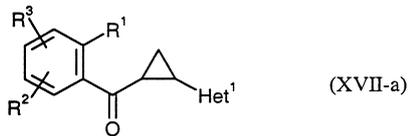
<296>

g) 일반식 (XIX)의 알데히드를 염기(예: 수산화나트륨)의 존재하 및 희석제(예: 메탄올)의 존재하에 일반식 (XX)의 아세토페논과 반응시켜 제조할 수 있다:



<298>

- <299> 상기 식에서,
- <300>  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  및 Het는 상기 언급된 의미를 갖는다.
- <301> 일반식 (XIX)는 방법 (g)를 수행하는데 출발물질로 필요한 알데히드의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, Het는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다.
- <302> 일반식 (XIX)의 알데히드는 공지되었고/되었거나 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다.
- <303> 일반식 (XX)는 방법 (g)를 수행하는데 출발물질로 필요한 아세토페논의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서,  $R^1$ ,  $R^2$  및  $R^3$ 은 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다.
- <304> 일반식 (XX)의 아세토페논은 공지되었고/되었거나 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다.
- <305> 일반식 (XVII-a)의 사이클로프로판은 또한
- <306> h) 일반식 (XVII-b)의 사이클로프로판을 촉매의 존재하, 경우에 따라 산 결합체의 존재하 및 경우에 따라 희석제의 존재하에 일반식 (VII)의 보론산 유도체와 반응시켜 제조할 수 있다:



- <307>
- <308>
- <309> 상기 식에서,
- <310> 상기 식에서,
- <311>  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $Het^1$ ,  $Het^2$ ,  $Y^1$ , E 및  $A^2$ 는 상기 언급된 의미를 갖는다.
- <312> 이 방법은 일반식 (I-b)의  $\Delta^1$ -피롤린을 반응시키는 본 발명에 따른 방법 (F)에 상응한다. 방법 (D) 및 (E)에 따른 커플링 반응은 또한 일반식 (XVII-a)의 사이클로프로판에 적용될 수 있다.
- <313> 방법 (h)에서 출발물질로 사용되는 일반식 (XVII-b)의 사이클로프로판은 일반식 (XVII)의 화합물의 서브-그룹이며 방법 (f)와 유사하게 제조될 수 있다.
- <314> 일반식 (VII)의 보론산 유도체는 아래 본 발명에 따른 방법 (F)의 설명에서 기술된다.
- <315> 방법 (h)의 경우, 아래 기술되는 방법 (F)에 대한 것과 동일한 반응 조건, 희석제, 반응 보조제 및 촉매를 사용하는 것이 가능하다.
- <316> 본 발명에 따른 방법 (B)를 수행하는 경우, 이러한 목적을 위해 통상적으로 사용되는 모든 트리알킬포스핀, 트리아릴포스핀 및 트리알킬 포스파이트를 사용하는 것이 가능하다(참조. Tetrahedron Lett. 1999, 40, 4825; Tetrahedron 1997, 53, 3693; Tetrahedron 1997, 55, 8353; J. Chem. Soc. Chem. Commun. 1982, 1224; Synthesis 1996, 123). 바람직한 것으로 유기인 화합물, 예를 들어 트리페닐포스핀, 트리-n-부틸포스핀 또는 트리메틸 포스파이트, 특히 바람직하게는 트리페닐포스핀이 제시된다.
- <317> 본 발명에 따른 방법에 따라 촉매 수소화에 의해, 예를 들어 촉매  $PtO_2$ 로 일반식 (III)의 아지드를 일반식 (I)의 화합물로 전환시키는 것이 또한 가능하다(참조. J. Am. Chem. Soc. 1954, 76, 1231).

<318> 아지도 화합물을 환원시키기 위한 다른 별도의 방법이 문헌(참조. Houben-Weyl: Methoden der Organischen Chemie, 4, Edition, Organonitrogen Compounds II, page 956-975; Editor: D. Klamann)에 기술되어 있다.

<319> 본 발명에 따른 방법 (B)를 수행하기에 적합한 희석제는 지방족 또는 방향족 탄화수소, 할로겐화 탄화수소 또는 에테르이다. 바람직한 것으로 펜탄, 헥산, 헵탄, 벤젠, 톨루엔, 테트라하이드로푸란, 디에틸 에테르, 디옥산 또는 아세토니트릴, 특히 바람직하게는 펜탄, 헥산 또는 헵탄이 제시된다.

<320> 본 발명에 따른 방법 (B)를 수행하기 위한 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 이 방법은 -10 내지 +60 °C, 바람직하게는 0 내지 +40 °C의 온도, 특히 바람직하게는 실온에서 수행된다.

<321> 본 발명에 따른 방법 (B)를 수행하는 경우, 일반식 (III)의 아지드 1 몰당 일반적으로 1 몰의 트리알킬포스핀 또는 트리알킬포스핀 또는 트리알킬 포스파이트 및 적합한 희석제가 사용된다. 그러나, 반응 성분들의 다른 비율을 선택하는 것이 또한 가능하다. 후처리는 통상의 방법으로 수행된다. 일반적으로, 반응 혼합물을 플로리실(Florisil)의 존재하에 농축한 다음 n-헥산 및 에틸 아세테이트의 혼합물을 사용하여 크로마토그래피한다.

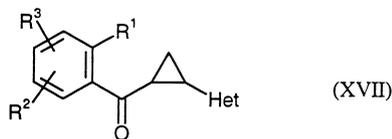
<322> 방법 (C)

<323> 일반식 (IV)는 본 발명에 따른 방법 (C)를 수행하는데 출발물질로 필요한 아미드의 일반적인 정의를 제공한다.

이 일반식에서, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> 및 Het는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다. R<sup>19</sup>는 바람직하게는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> -알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-할로게노알킬, 페닐 또는 아릴알킬, 특히 바람직하게는 메틸, 에틸, 페닐 또는 벤질, 매우 특히 바람직하게는 메틸, 페닐 또는 벤질을 나타낸다.

<324> 일반식 (IV)의 아미드는 신규하다. 이들은

<325> i) 일반식 (XVII)의 사이클로프로판을 양성자산(예: 황산)의 존재하 및 희석제의 존재하에 일반식 (XXI)의 니트릴을 반응시켜 제조할 수 있다:



<326>



<327>

<328> 상기 식에서,

<329> R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>19</sup> 및 Het는 상기 언급된 의미를 갖는다.

<330> 방법 (i)를 수행하는데 출발물질로 필요한 일반식 (XVII)의 사이클로프로판은 본 발명에 따른 방법 (B)의 설명과 관련하여 이미 기술되었다.

<331> 일반식 (XXI)는 방법 (i)를 수행하는데 출발물질로 필요한 니트릴의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, R<sup>19</sup>는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 일반식 (IV)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로 이미 언급된 의미를 갖는다.

<332> 본 발명에 따른 방법 (C)를 수행하는 경우, 양성자산(참조. J. Org. Chem. 1978, 43, 4593), 무기 염기(참조. J. Chem. Soc. 1964, 4142), 하이dra진(참조. J. Org. Chem. 1978, 43, 3711) 또는 효소에 의한 바이오트랜스포메이션(biotransformation)(참조. Appl. Microbiol, Biotechnol. 1997, 47, 650)이 일반식 (I)의 피롤린으로 전환시키는 동안 일반식 (IV)의 아미드를 N-데아세틸화하는데 사용된다. 아미드를 데아세틸화하기 위한 다른 통상의 방법이 문헌[T. W. Greene, P. G. M. Wuts, Protective Group in Organic Synthesis (Ed. 3, New York, Wiley 1999, pp. 553-555)에 기술되었다.

<333> 바람직한 N-데아세틸화제는 양성자산 또는 유기산, 특히 바람직하게는 수성 염화수소산, 수성 브롬화수소산 또

는 트리플루오로아세트산, 매우 특히 바람직하게는 수성 염화수소산; 바람직하게는 무기 염기, 특히 바람직하게는 수산화바륨 [Ba(OH)<sub>2</sub>] 및 수산화나트륨(NaOH), 및 바람직하게는 바이오트랜스포메이션, 특히 바람직하게는 아실라제의 사용에 의한 바이오트랜스포메이션이다.

<334> 바이오트랜스포메이션을 사용하여 N-데아세틸화를 수행하는 경우, 일반식 (I)의 화합물은 두 에난티오머중 하나가 과량으로 존재하는 형태로 수득된다.

<335> 본 발명에 따른 방법 (C)를 수행하는데 적합한 희석제는 물 또는 알콜 및 이들의 혼합물이다. 바람직한 것으로 물, 메탄올 또는 에탄올, 또는 이들 세 가지 희석제중 둘 또는 셋의 혼합물이 제시된다.

<336> 본 발명에 따른 방법 (C)를 수행하는 경우, 반응 온도는 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 이 방법은 20 내지 200 °C, 바람직하게는 60 내지 140 °C, 특히 바람직하게는 80 내지 120 °C의 온도에서 수행된다. N-데아세틸화를 아실라제를 사용하여 효소적으로 수행하는 경우, 반응은 일반적으로 20 내지 60 °C, 바람직하게는 20 내지 40 °C의 온도에서 수행된다.

<337> 본 발명에 따른 방법 (C)를 수행하는 경우, 일반식 (IV) 아미드의 10% 세기(w/v) 알콜 용액 1 부피부당 일반적으로 2 부피부의 양성자산이 사용된다. 그러나, 반응 성분들의 다른 비율을 선택하는 것이 또한 가능하다. 후처리하는 통상의 방법으로 수행된다. 일반적으로, 반응 혼합물을 수산화나트륨 수용액으로 중화시킨 다음 에틸 아세테이트로 추출하고 유기상을 건조, 여과 및 농축한다.

<338> 방법 (D)

<339> 제 1 반응 단계로, 일반식 (I-b)의 화합물은 팔라듐 촉매의 존재하, 경우에 따라 산 결합체의 존재하 및 경우에 따라 용매의 존재하에 이보론산 에스테르와 커플링된다. 중간체의 분리없이, 일반식 (V)의 화합물은 동일한 반응 용기에서 제 2 반응 단계로 촉매의 존재하, 경우에 따라 산 결합체의 존재하 및 경우에 따라 용매의 존재하에 커플링된다(참조예. Tetrahedron Lett. 1997, 38, 3841).

<340> 본 발명에 다른 방법 (D)는 두 가지의 다른 방법으로 수행될 수 있다. 우선 일반식 (I-b)의 화합물을 도입하거나 우선 일반식 (V)의 화합물을 도입하는 것이 가능하다. 방법 (D)는 아래 기술하는 방법 (E) 및 (F)의 탄뎀 반응을 고려시킨 것이다.

<341> 일반식 (I-b)는 본 발명에 따른 방법 (D)를 수행하는데 출발물질로 필요한  $\Delta^1$ -피롤린의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> 및 R<sup>3</sup>은 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로서 이미 언급된 의미를 갖는다. Het<sup>2</sup>는 바람직하게는 1 내지 3 개의 방향족 환 및 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 포함하고, R<sup>5-2</sup>에 의해 일치환된 5- 내지 14-원 헤테로아릴을 나타낸다. Het<sup>2</sup>는 특히 바람직하게는 1 내지 3 개의 방향족 환 및 0 내지 4 개의 질소 원자, 0 내지 2 개의 비인접 산소 원자 및/또는 0 내지 2 개의 비인접 황 원자를 포함한 1 내지 4 개의 헤테로원자를 포함하고, R<sup>5-2</sup>에 의해 일치환된 5- 내지 14-원 헤테로아릴(특히, 티에닐, 벤조티에닐, 푸릴, 벤조푸릴, 인돌릴, 티에노티에닐, 티에노푸릴, 티에노벤조티에닐, 티에노벤조푸릴, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴)을 나타낸다. Het<sup>2</sup>는 매우 특히 바람직하게는 R<sup>5-2</sup>에 의해 일치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-인돌릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 2-피리디닐, 3-피리디닐, 2-피리미디닐, 5-피리미디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐, 2-피라지닐, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타낸다. Het<sup>2</sup>는 보다 바람직하게는 R<sup>5-2</sup>에 의해 일치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 2-피리디닐, 3-피리디닐, 2-피리미디닐, 5-피리미디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐 또는 2-피라지닐을 나타낸다. R<sup>5-2</sup>는 바람직하게는 브롬, 요오드, -OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 또는 -OSO<sub>2</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CF<sub>3</sub>, 특히 바람직하게는 브롬, -OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> 또는 -OSO<sub>2</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CF<sub>3</sub>, 매우 특히 바람직하게는 브롬 또는 -OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>를 나타낸다.

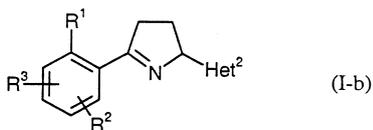
- <342> 일반식 (I-b)의  $\Delta^1$ -피롤린은 본 발명의 특허대상의 일부를 형성하며 방법 (A), (B) 및 (C)중 하나에 의해 제조될 수 있다.
- <343> 일반식 (V)는 본 발명에 따른 방법 (D)를 수행하는데 출발물질로 필요한 헤테로사이클의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, E는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로서 이미 언급된 의미를 갖는다.  $Y^1$ 은 바람직하게는 각 경우에  $W^1$  리스트중에서 선택된 동일하거나 상이한 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 페닐렌 또는 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 가진 포화 또는 불포화 5- 내지 10-원 헤테로사이클릴렌을 나타낸다.  $Y^1$ 은 특히 바람직하게는 각 경우에  $W^1$  리스트중에서 선택된 동일하거나 상이한 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 사치환된 1,4-페닐렌, 1,3-페닐렌 또는 1,2-페닐렌을 나타내거나;  $W^1$  리스트중에서 선택된 동일하거나 상이한 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 사치환되고, 0 내지 3 개의 질소 원자, 0 내지 2 개의 비인접 산소 원자 및 0 내지 2 개의 비인접 황 원자를 포함한 1 내지 3 개의 헤테로원자를 가진 포화 또는 불포화 5- 내지 6-원 헤테로사이클릴렌(특히, 푸릴렌, 티에닐렌, 피롤릴렌, 옥사졸릴렌, 티아졸릴렌, 피리디닐렌, 피리미디닐렌, 피리다지닐렌 또는 피라지닐렌)을 나타낸다.  $Y^1$ 은 매우 특히 바람직하게는 각 경우에  $W^1$  리스트중에서 선택된 동일하거나 상이한 래디칼에 의해 임의로 일- 내지 삼치환된 1,4-페닐렌, 1,3-페닐렌, 1,2-페닐렌, 2,4-푸릴렌, 2,4-티에닐렌, 2,4-피롤릴렌, 2,5-옥사졸릴렌, 2,5-티아졸릴렌, 2,5-피리디닐렌, 2,6-피리디닐렌, 2,5-피리미디닐렌, 3,6-피리다지닐렌 또는 2,5-피라지닐렌을 나타낸다.  $Y^1$ 은 보다 바람직하게는 각 경우에  $W^1$  리스트중에서 선택된 동일하거나 상이한 래디칼에 의해 임의로 일- 또는 이치환된 1,4-페닐렌, 1,3-페닐렌, 2,4-푸릴렌, 2,4-티에닐렌, 2,5-피리디닐렌, 2,5-피리미디닐렌, 3,6-피리다지닐렌 또는 2,5-피라지닐렌을 나타낸다.  $W^1$ 은 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로서 이미 언급된 의미를 갖는다.  $A^1$ 은 바람직하게는 브롬, 염소, 요오드 또는  $-OSO_2CF_3$ , 특히 바람직하게는 브롬, 염소 또는 요오드, 매우 특히 바람직하게는 브롬 또는 염소를 나타낸다.
- <344> 일반식 (V)의 헤테로사이클은 공지되었거나 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다(참조. Aust. J. Chem. 1964, 17, 794; Chem. Ber. 1992, 125, 1169; Chem. Pharm. Bull. 1995, 43, 247; Eur. J. Med. Chem. 1989, 24, 249; J. Chem. Soc. C 1971, 1889; J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 1995, 2479; J. Med. Chem. 1991, 34, 315; J. Org. Chem. 1984, 49, 2240; J. Org. Chem. 1990, 55, 69; Org. Prep. Proced. Int. 1998, 30, 433; Synthesis 1999, 1163; Tetrahedron 1999, 40, 7975; Tetrahedron Lett. 1996, 37, 4447; Tetrahedron Lett. 2000, 41, 4335).
- <345> 본 발명에 따른 방법 (D)를 수행하는데 적합한 이보론산 에스테르는 4,4,4',4',5,5,5',5'-옥타메틸-2,2'-비스-1,3,2-디옥사보롤란, 5,5,5',5'-테트라메틸-2,2'-비스-1,3,2-디옥사보리란, 4,4,4',4',6,6'-헥사메틸-2,2'-비스-1,3,2-디옥사보리란 또는 2,2'-비스-1,3,2-벤조디옥사보롤이다. 바람직한 것으로 4,4,4',4',5,5,5',5'-옥타메틸-2,2'-비스-1,3,2-디옥사보롤란, 5,5,5',5'-테트라메틸-2,2'-비스-1,3,2-디옥사보리란 또는 4,4,4',4',6,6'-헥사메틸-2,2'-비스-1,3,2-디옥사보리란, 특히 바람직한 것으로 4,4,4',4',5,5,5',5'-옥타메틸-2,2'-비스-1,3,2-디옥사보롤란 또는 5,5,5',5'-테트라메틸-2,2'-비스-1,3,2-디옥사보리란, 매우 특히 바람직한 것으로 4,4,4',4',5,5,5',5'-옥타메틸-2,2'-비스-1,3,2-디옥사보롤란이 제시된다.
- <346> 본 발명에 따른 방법 (D)를 수행하는 경우, 일반식 (I-b)의 화합물 1 몰당 일반적으로 1 몰 또는 약간 과량의 이보론산 에스테르 및 1 몰 또는 약간 과량의 일반식 (V)의 화합물, 및 3%의 팔라듐 촉매가 사용된다. 그러나, 반응 성분들을 다른 비율로 사용하는 것이 또한 가능하다. 우선 일반식 (I-b)의 화합물 또는 다르게는 일반식 (V)의 화합물을 도입하는 것이 가능하다. 후처리는 통상의 방법으로 수행된다. 일반적으로, 반응 혼합물을 물로 희석하고 에틸 아세테이트로 추출한다. 유기상을 세척, 건조, 여과 및 농축한다. 경우에 따라 잔류물로부터 여전히 존재할 수 있는 불순물을 크로마토그래피 또는 재결정과 같은 통상적인 방법을 사용하여 제거한다.

<347> 방법 (E)

<348> 일반식 (VI)는 본 발명에 따른 방법 (E)를 수행하는데 출발물질로 필요한  $\Delta^1$ -피롤린의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서,  $R^1$ ,  $R^2$  및  $R^3$ 은 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로서 이미 언급된 의미를 갖는다.  $Het^3$ 은 바람직하게는 1 내지 3 개의 방향족 환 및 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 포함하고,  $A^2$ 에 의해 일치환된 5- 내지 14-원 헤테로아릴을 나타낸다.  $Het^3$ 은 특히 바람직하게는 1 내지 3 개의 방향족 환 및 0 내지 4 개의 질소 원자, 0 내지 2 개의 비인접 산소 원자 및/또는 0 내지 2 개의 비인접 황 원자를 포함한 1 내지 4 개의 헤테로원자를 포함하고,  $A^2$ 에 의해 일치환된 5- 내지 14-원 헤테로아릴(특히, 티에닐, 벤조티에닐, 푸릴, 벤조푸릴, 인돌릴, 티에노티에닐, 티에노푸릴, 티에노벤조티에닐, 티에노벤조푸릴, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴)을 나타낸다.  $Het^3$ 은 매우 특히 바람직하게는  $A^2$ 에 의해 일치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-인돌릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 2-피리디닐, 3-피리디닐, 2-피리미디닐, 5-피리미디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐, 2-피라지닐, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타낸다.  $Het^3$ 은 보다 바람직하게는  $A^2$ 에 의해 일치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 2-피리디닐, 3-피리디닐, 2-피리미디닐, 5-피리미디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐 또는 2-피라지닐을 나타낸다.  $A^2$ 는 바람직하게는  $-B(OH)_2$ , (4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-디옥사보롤란)-2-일, (5,5-디메틸-1,3,2-디옥사보리난)-2-일, (4,4,6-트리메틸-1,3,2-디옥사보리난)-2-일 또는 1,3,2-벤조디옥사보롤-2-일, 특히 바람직하게는  $-B(OH)_2$ , (4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-디옥사보롤란)-2-일, (5,5-디메틸-1,3,2-디옥사보리난)-2-일 또는 (4,4,6-트리메틸-1,3,2-디옥사보리난)-2-일, 매우 특히 바람직하게는  $-B(OH)_2$ , (4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-디옥사보롤란)-2-일, (5,5-디메틸-1,3,2-디옥사보리난)-2-일을 나타낸다.

<349> 일반식 (VI)의  $\Delta^1$ -피롤린은

<350> k) 일반식 (I-b)의 화합물을 촉매의 존재하, 경우에 따라 산 결합체의 존재하 및 경우에 따라 희석제의 존재하에 이보론산 에스테르와 반응시켜 제조할 수 있다(참조. J. Org. Chem. 1995, 60, 7508; Tetrahedron Lett. 1997, 38, 3447):



<351>

<352> 상기 식에서,

<353>  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  및  $Het^2$ 는 상기 언급된 의미를 갖는다.

<354> 방법 (k)를 수행하는데 적합한 이보론산 에스테르는 본 발명에 따른 방법 (D)의 설명에서 상기 이미 언급되었다.

<355> 본 발명에 따른 방법 (E)를 수행하는데 출발물질로 필요한 일반식 (V)의 헤테로사이클은 방법 (D)의 설명에서 상기 이미 언급되었다.

<356> 본 발명에 따른 방법 (E)를 수행하는 경우, 일반식 (VI)의 화합물 1 몰당 일반적으로 1 몰 또는 약간 과량의 일반식 (V)의 화합물이 사용된다. 그러나, 반응 성분들을 다른 비율로 사용하는 것이 또한 가능하다. 후처리는 통상의 방법으로 수행된다. 일반적으로, 반응 혼합물을 에틸 아세테이트에 용해시키고 유기상을 물로 세척하여 황산나트륨상에서 건조시키고, 여과 및 농축한다. 경우에 따라 잔류물로부터 여전히 존재할 수 있는 불순물을 크로마토그래피 또는 재결정과 같은 통상적인 방법을 사용하여 제거한다.

<357> 방법 (F)

<358> 본 발명에 따른 방법 (F)를 수행하는데 출발물질로 필요한 일반식 (I-b)의  $\Delta^1$ -피롤린은 방법 (D)의 설명에서 이미 기술되었다.

<359> 일반식 (VII)는 본 발명에 따른 방법 (F)를 수행하는데 출발물질로 필요한 보론산 유도체의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서, E는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로서 이미 언급된 의미를 갖는다.  $Y^1$ 은 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 일반식 (V)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로서 이미 언급된 의미를 갖는다.  $A^2$ 는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 일반식 (VI)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로서 이미 언급된 의미를 갖는다.

<360> 일반식 (VII)의 화합물은 공지되었거나 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다(참조. J. Org. Chem. 1995, 60, 7508; Tetrahedron Lett. 1997, 38, 3447).

<361> 본 발명에 따른 방법 (F)를 수행하는 경우, 일반식 (I-b)의 화합물 1 몰당 일반적으로 1 몰 또는 약간 과량의 일반식 (VII)의 화합물이 사용된다. 그러나, 반응 성분들을 다른 비율로 사용하는 것이 또한 가능하다. 후 처리는 통상의 방법으로 수행된다. 일반적으로, 반응 혼합물을 에틸 아세테이트에 용해시키고 유기상을 물로 세척하여 황산나트륨상에서 건조시키고, 여과 및 농축한다. 경우에 따라 잔류물로부터 여전히 존재할 수 있는 불순물을 크로마토그래피 또는 재결정과 같은 통상적인 방법을 사용하여 제거한다.

<362> 방법 (G)

<363> 일반식 (I-c)는 본 발명에 따른 방법 (G)를 수행하는데 출발물질로 필요한  $\Delta^1$ -피롤린의 일반적인 정의를 제공한다. 이 일반식에서,  $R^1$ ,  $R^2$  및  $R^3$ 은 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로서 이미 언급된 의미를 갖는다.  $Het^4$ 은 바람직하게는 1 내지 3 개의 방향족 환 및 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 포함하고,  $R^{5-3}$ 에 의해 치환된 5- 내지 14-원 헤테로아릴을 나타낸다.  $Het^4$ 는 특히 바람직하게는 0 내지 4 개의 질소 원자, 0 내지 2 개의 비인접 산소 원자 및 /또는 0 내지 2 개의 비인접 황 원자를 포함한 1 내지 4 개의 헤테로원자를 포함하고,  $R^{5-3}$ 에 의해 일치환된 5- 내지 14-원 헤테로아릴(특히, 티에닐, 벤조티에닐, 푸릴, 벤조푸릴, 인돌릴, 티에노티에닐, 티에노푸릴, 티에노벤조티에닐, 티에노벤조푸릴, 피리디닐, 피리미디닐, 피리다지닐, 피라지닐, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴)을 나타낸다.  $Het^4$ 는 매우 특히 바람직하게는  $R^{5-3}$ 에 의해 일치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-인돌릴, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 2-피리디닐, 3-피리디닐, 2-피리미디닐, 5-피리미디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐, 2-피라지닐, 트리아졸릴 또는 테트라졸릴을 나타낸다.  $Het^4$ 는 보다 바람직하게는  $R^{5-3}$ 에 의해 일치환된 2-티에닐, 3-티에닐, 2-벤조[b]티에닐, 2-푸릴, 3-푸릴, 2-벤조[b]푸릴, 2-티에노[3,2-b]티에닐, 2-티에노[3,2-b]푸릴, 5-티에노[3,2-b]푸릴, 2-티에노[2,3-f][1]벤조티에닐, 2-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 6-티에노[2,3-f][1]벤조푸릴, 2-피리디닐, 3-피리디닐, 2-피리미디닐, 5-피리미디닐, 3-피리다지닐, 4-피리다지닐 또는 2-피라지닐을 나타낸다.  $R^{5-3}$ 은 바람직하게는 브롬 또는 요오드를 나타낸다.

<364> 일반식 (I-c)의  $\Delta^1$ -피롤린은 본 발명의 특허대상의 일부를 형성하며 방법 (A), (B) 및 (C)중 하나에 의해 제조될 수 있다.

<365> 일반식 (VIII)는 본 발명에 따른 방법 (G)를 수행하는데 출발물질로 필요한 유기금속 화합물의 일반적인 정의를

제공한다. 이 일반식에서, E는 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로서 이미 언급된 의미를 갖는다. Y<sup>1</sup>은 바람직하게, 특히 바람직하게, 매우 특히 바람직하게 및 보다 바람직하게는 일반식 (V)의 화합물의 설명과 관련하여 이들 래디칼에 대해 바람직하거나 특히 바람직한 것 등으로서 이미 언급된 의미를 갖는다. M은 바람직하게는 ZnCl, Sn(Me)<sub>3</sub> 또는 Sn(n-Bu)<sub>3</sub>를 나타낸다.

<366> 일반식 (VIII)의 유기금속 화합물의 일부는 공지되었고/되었거나 이들은 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다. 예를 들어 A<sup>1</sup>이 -OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>인 상응하는 일반식 (V)의 화합물로부터 동일계에서 일반식 (VIII)의 화합물을 제조하는 것이 가능하다(참조. Tetrahedron Lett. 1995, 36, 9085).

<367> 본 발명에 따른 방법 (G)를 수행하는 경우, 일반식 (I-c)의 화합물 1 몰당 일반적으로 1 몰 또는 약간 과량의 일반식 (VIII)의 화합물이 사용된다. 그러나, 반응 성분들을 다른 비율로 사용하는 것이 또한 가능하다. 후 처리는 통상의 방법으로 수행된다. 일반적으로, 반응 혼합물을 에틸 아세테이트에 용해시키고 유기상을 물로 세척하여 황산나트륨상에서 건조시키고, 여과 및 농축한다. 경우에 따라 잔류물로부터 여전히 존재할 수 있는 불순물을 크로마토그래피 또는 재결정과 같은 통상적인 방법을 사용하여 제거한다.

<368> 본 발명에 따른 방법 (D), (E), (F) 및 (G)를 수행하는 경우, 각 경우에 팔라듐 촉매가 사용되며, 그의 일부가 추가의 리간드를 첨가하거나 첨가하지 않고 사용될 수 있다. 사용되는 촉매는 바람직하게는 PdCl<sub>2</sub>(dppf)[dppf=1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센], Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>, PdCl<sub>2</sub>(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, PdCl<sub>2</sub>(CH<sub>3</sub>CN)<sub>2</sub>, Pd<sub>2</sub>(dba)<sub>3</sub>[dba=디벤질리덴아세톤] 또는 Pd(OAc)<sub>2</sub>, 특히 바람직하게는 PdCl<sub>2</sub>(dppf), Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>, PdCl<sub>2</sub>(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub> 또는 Pd(OAc)<sub>2</sub>, 매우 특히 바람직하게는 PdCl<sub>2</sub>(dppf) 또는 PdCl<sub>2</sub>(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>이다.

<369> 적합한 리간드는 트리아릴포스핀, 트리알킬포스핀 또는 아르신이다. 바람직한 것으로 dppf, PPh<sub>3</sub>, P(t-Bu)<sub>3</sub>, Pcy<sub>3</sub> 또는 AsPh<sub>3</sub>, 특히 바람직하게는 dppf가 제시된다.

<370> 본 발명에 따른 방법 (D), (E) 및 (F)를 수행하는데 적합한 희석제는 각 경우 통상적인 모든 불활성 유기 용매이다. 이들은 임의로 할로겐화된 지방족, 지환식 또는 방향족 탄화수소, 예를 들어 석유 에테르, 헥산, 헵탄, 사이클로헥산, 메틸사이클로헥산, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 데칼린; 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; 니트릴, 예를 들어 아세토니트릴, 프로피오니트릴, n- 또는 이소부티로니트릴 또는 벤조니트릴; 아마이드, 예를 들어 N,N-디메틸포름아미드, N,N-디메틸아세트아미드, N-메틸포름아닐리드, N-메틸피롤리돈 또는 헥사메틸포스포릭 트리아미드; 에스테르, 예를 들어 메틸 아세테이트 또는 에틸 아세테이트; 설폭사이드, 예를 들어 디메틸 설폭사이드; 또는 설피온, 예를 들어 설피올란을 사용하는 것이 바람직하다. 아세톤, 디메톡시에탄, 디옥산, 테트라하이드로푸란, 디메틸포름아미드, 디메틸아세트아미드, 디메틸 설폭사이드, 에탄올, 톨루엔, 또는 경우에 따라 물과 언급된 희석제의 혼합물이 특히 바람직하다.

<371> 본 발명에 따른 방법 (G)를 수행하는데 적합한 희석제는 각 경우 통상적인 모든 불활성 유기 용매이다. 이들은 임의로 할로겐화된 지방족, 지환식 또는 방향족 탄화수소, 예를 들어 석유 에테르, 헥산, 헵탄, 사이클로헥산, 메틸사이클로헥산, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 데칼린; 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 아니솔을 사용하는 것이 바람직하다. 디옥산, 테트라하이드로푸란 또는 톨루엔을 사용하는 것이 특히 바람직하다.

<372> 본 발명에 따른 방법 (D), (E), (F) 및 (G)를 수행하는데 적합한 산 결합제는 각 경우에 이러한 반응에 통상적인 모든 무기 및 유기 염기이다. 바람직한 것으로 알칼리 토금속 또는 알칼리 금속 하이드록사이드, 예를 들어 수산화나트륨, 수산화칼슘, 수산화칼륨, 또는 수산화암모늄, 알칼리 금속 카보네이트, 예를 들어 탄산나트륨, 탄산칼륨, 중탄산칼륨, 중탄산나트륨, 알칼리 금속 또는 알칼리 토금속 아세테이트, 예를 들어 소듐 아세테이트, 포타슘 아세테이트, 칼슘 아세테이트, 알칼리 금속 플루오라이드, 및 또한 삼급 아민, 예를 들어 트리메틸아민, 트리에틸아민, 트리부틸아민, N,N-디메틸아닐린, 피리딘, N-메틸피페리딘, N,N-디메틸아미노피리딘, 디아자비스사이클로옥탄(DABCO), 디아자비스사이클로노넨(DBN) 또는 디아자비스사이클로운데센(DBU)이 제시된다.

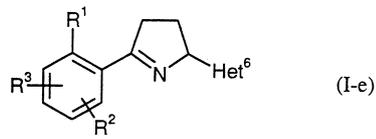
그러나, 추가의 산 결합제없이 사용하거나 산 결합제로서 동시에 작용하도록 과량의 아민 성분을 사용하는 것이 또한 가능하다. 수산화바륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 트리포타슘 포스페이트, 탄산세슘, 탄산칼륨, 탄산나트륨, 포타슘 아세테이트, 트리에틸아민, 포타슘 t-부톡사이드, 세슘 플루오라이드 또는 포타슘 플루오라이드를 사용하는 것이 특히 바람직하다.

<373> 방법 (D), (E) 및 (F)를 수행하는 경우, 반응 온도는 각 경우 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 이 반응은 0 내지 140 °C, 바람직하게는 20 내지 120 °C, 특히 바람직하게는 60 내지 100 °C의 온도에서 수행된다.

<374> 본 발명에 따른 방법 (G)를 수행하는 경우, 반응 온도는 각 경우 비교적 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 일반적으로, 이 반응은 0 내지 140 °C, 바람직하게는 20 내지 120 °C의 온도에서 수행된다.

<375> 일반식 (I-d)의 키랄 화합물

<376> 일반식 (I-d)의 키랄 화합물을 제조하기 위하여, 예를 들어 일반식 (I-e)의  $\Delta^1$ -피롤린을 광학 분할할 수 있다:



<377> 상기 식에서,

<378>  $R^1$ ,  $R^2$  및  $R^3$ 은 상기에 언급된 의미를 가지며,

<379>  $Het^6$ 는  $R^{5-4}$ 에 의해 일치화된 헤테로아릴을 나타내고,

<380>  $R^{5-4}$ 는 염소, 브롬 또는 요오드를 나타낸다.

<381> 그러나, 본 발명에 따른 일반식 (I)의 다른 화합물을 사용하는 것이 또한 가능하다. 이를 위해, 예를 들어 분취용 크로마토그래피, 바람직하게는 고성능 액체 크로마토그래피(HPLC)법이 이용된다. 이때 키랄 실리카겔 정지상이 사용된다. 일반식 (I-e)의 화합물을 두 에난티오머로 분리하기 위해서는 트리스(3,5-디메틸페닐카바메이트)-셀룰로즈-변형 실리카겔이 특히 적합한 것으로 밝혀졌다. 이러한 분리 물질은 시판되고 있다. 그러나, 다른 정지상을 사용하는 것이 또한 가능하다. 적합한 이동상은 모든 통상적인 불활성 유기 용매 및 이들의 혼합물이다. 임의로 할로겐화된 지방족, 지환식 또는 방향족 탄화수소, 예를 들어 석유 에테르, 헥산, 헵탄, 사이클로헥산; 디클로로메탄, 클로로포름; 알콜, 예를 들어 메탄올, 에탄올, 프로판올; 니트릴, 예를 들어 아세토니트릴; 에스테르, 예를 들어 메틸 아세테이트 또는 에틸 아세테이트를 사용하는 것이 바람직하다. 지방족 탄화수소, 예를 들어 헥산 또는 헵탄 및 알콜, 예를 들어 메탄올 또는 프로판올을 사용하는 것이 바람직하고, n-헵탄 및 이소프로판올 또는 이들의 혼합물을 사용하는 것이 매우 특히 바람직하다. 일반적으로, 분리는 10 내지 60 °C, 바람직하게는 10 내지 40 °C의 온도, 특히 바람직하게는 실온에서 수행된다.

<382> 일반식 (I-e)의  $\Delta^1$ -피롤린은 본 발명의 특허대상의 일부를 형성하며 방법 (A), (B) 및 (C)중 하나에 의해 제조될 수 있다. 그 후, 이 방식으로 수득된 (R)-배위 에난티오머는 방법 (D), (F) 또는 (G)를 위한 출발물질로 사용된다.

<383> 본 발명에 따른 모든 방법은 일반적으로 대기압하에 수행된다. 그러나, 각 경우 증압 또는 감압하에도 수행될 수 있다.

<384> 본 발명에 따른 활성 화합물은 농업, 임업, 저장 제품 및 재료의 보호, 및 위생 분야에서 마주치게 되는 동물 해충, 특히 곤충, 거미류 및 선충을 구제하는데 적합하고 식물 내성이 우수하며, 온혈 동물에 허용되는 수준의 독성을 갖는다. 이들은 바람직하게는 식물 보호제로도 사용될 수 있다. 이들은 정상적인 감수성 및 내성 중 및 발달의 모든 단계 또는 일부 단계에 대하여 활성적이다. 상기에서 언급한 해충에는 다음의 것들이 포함된다:

<385> 쥐며느리(*Isopoda*)목, 예를 들어 오니스쿠스 아셀루스(*Oniscus asellus*), 아르마딜리디움 불가레

(*Armadillidium vulgare*) 및 포르셀리오 스카베르(*Porcellio scaber*).

- <387> 노래기(*Diplopoda*)목, 예를 들어 블라니울루스 구톨라투스(*Blaniulus guttulatus*).
- <388> 지네(*Chilopoda*)목, 예를 들어 게오필루스 카르포파구스(*Geophilus carpophagus*) 및 스쿠티게라 종(*Scutigera spec.*).
- <389> 심필라(*Symphyla*)목, 예를 들어 스쿠티게렐라 임마쿨라타(*Scutigereilla immaculata*).
- <390> 줌(*Thysanura*)목, 예를 들어 레피스마 사카리나(*Lepisma saccharina*).
- <391> 툽토기(*Collembola*)목, 예를 들어 오니키우루스 아르마투스(*Onychiurus armatus*).
- <392> 메뚜기(*Orthoptera*)목, 예를 들어 아케타 도메스티쿠스(*Acheta domesticus*), 그릴로탈파 종(*Gryllotalpa spp.*), 로쿠스타 미그라토리아 미그라토리오이데스(*Locusta migratoria migratorioides*), 멜라노플루스 종(*Melanoplus spp.*) 및 쉬스토세르카 그레가리아(*Schistocerca gregaria*).
- <393> 바퀴(*Blattaria*)목, 예를 들어 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 류코파에아 마데라에(*Leucophaea maderae*), 블라텔라 게르마니카(*Blattella germanica*).
- <394> 짐계벌레(*Dermaptera*)목, 예를 들어 포르피쿨라 아우리쿨라리아(*Forficula auricularia*).
- <395> 흰개미(*Isoptera*)목, 예를 들어 레티쿨리테르메스 종(*Reticulitermes spp.*).
- <396> 이(*Phthiraptera*)목, 예를 들어 페디쿨루스 후마누스 코르포리스(*Pediculus humanus corporis*), 하에마토피누스 종(*Haematopinus spp.*), 리노그나투스 종(*Linognathus spp.*), 트리코텍테스 종(*Trichodectes spp.*) 및 다말리니아 종(*Damalinia spp.*).
- <397> 총채벌레(*Thysanoptera*)목, 예를 들어 헤르시노트리프스 페모랄리스(*Hercinothrips femoralis*), 트리프스 타바치(*Thrips tabaci*), 트리프스 팔미(*Thrips palmi*) 및 프랑클리니엘라 악시덴탈리스(*Frankliniella accidentalis*).
- <398> 이시아(*Heteroptera*)목, 예를 들어 유리가스테르 종(*Eurygaster spp.*), 디스테르쿠스 인테르메디우스(*Dysdercus intermedius*), 피에스마 쿠아드라타(*Piesma quadrata*), 시멕스 렉툴라리우스(*Cimex lectularius*), 로드니우스 프롤릭수스(*Rhodnius prolixus*) 및 트리아토마 종(*Triatoma spp.*).
- <399> 매미(*Homoptera*)목, 예를 들어 알레우로테스 브라시카에(*Aleurodes brassicae*), 베미시아 타바치(*Bemisia tabaci*), 트리아레우로테스 바포라리오룸(*Trialeurodes vaporariorum*), 아피스 고시피(*Aphis gossypii*), 브레비코리네 브라시카에(*Brevicoryne brassicae*), 크립토미주스 리비스(*Cryptomyzus ribis*), 아피스 파바에(*Aphis fabae*), 아피스 포미(*Aphis pomi*), 에리오소마 라니게룸(*Eriosoma lanigerum*), 히알로프테루스 아룬디니스(*Hyalopterus arundinis*), 필록세라 바스타트릭스(*Phylloxera vastatrix*), 펌피구스 종(*Pemphigus spp.*), 마크로시퓌름 아베나에(*Macrosiphum avenae*), 미주스 종(*Myzus spp.*), 포로돈 휴물리(*Phorodon humuli*), 로팔로시퓌름 파디(*Rhopalosiphum padi*), 엠포아스카 종(*Empoasca spp.*), 유셀리스 빌로바투스(*Euscelis bilobatus*), 네포테티스 신크티세프스(*Nephotettix cincticeps*), 레카니움 코르니(*Lecanium corni*), 사이세티아 올레아에(*Saissetia oleae*), 라오델팍스 스트리아텔루스(*Laodelphax striatellus*), 닐라파르바타 루겐스(*Nilaparvata lugens*), 아오니디엘라 아우란티(*Aonidiella aurantii*), 아스피디오투스 헤데라에(*Aspidiotus hederae*), 슈도코쿠스 종(*Pseudococcus spp.*) 및 프실라 종(*Psylla spp.*).
- <400> 나비(*Lepidoptera*)목, 예를 들어 펙티노포라 고시피엘라(*Pectinophora gossypiella*), 부팔루스 피니아리우스(*Bupalus piniarius*), 케이마토비아 브루마타(*Cheimatobia brumata*), 리토콜레티스 블란카르델라(*Lithocolletis blancardella*), 히포노메우타 파델라(*Hyponomeuta padella*), 플루텔라 크실로스텔라(*Plutella xylostella*), 말라코스마 네우스트리아(*Malacosoma neustria*), 유프록티스 크리소레아(*Euproctis chrysorrhoea*), 리만트리아 종(*Lymantria spp.*), 부쿨라트릭스 투르베리엘라(*Bucculatrix thurberiella*), 필로크니스티스 시트렐라(*Phyllocnistis citrella*), 아그로티스 종(*Agrotis spp.*), 욱소아 종(*Euxoa spp.*), 펠티아 종(*Feltia spp.*), 예아리아스 인슐라나(*Earias insulana*), 헬리오티스 종(*Heliothis spp.*), 마메스트라 브라시카에(*Mamestra brassicae*), 파놀리스 플람메아(*Panolis flammea*), 스포도프테라 종(*Spodoptera spp.*), 트리코플루시아 니(*Trichoplusia ni*), 카르포카프사 포모넬라(*Carpocapsa pomonella*), 피에리스 종(*Pieris spp.*), 칠로 종(*Chilo spp.*), 피라우스타 누비랄리스(*Pyrausta nubilalis*), 에페스티아 쿠에니엘라(*Ephestia*

*kuehniella*), 갈레리아 멜로넬라(*Galleria mellonella*), 티네올라 비셀리엘라(*Tineola bisselliella*), 티네아 펠리오넬라(*Tinea pellionella*), 호프만노필라 슈도스프레텔라(*Hofmannophila pseudospretella*), 카코에시아 포다나 (*Cacoecia podana*), 카푸아 레티쿨라나(*Capua reticulana*), 코리스토네우라 푸미페라나(*Choristoneura fumiferana*), 클리시아 암비구엘라(*Clysia ambiguella*), 호모나 마그나니마(*Homona magnanima*), 토르트릭스 비리다나(*Tortrix viridana*), 크나팔로세루스 종(*Cnaphalocerus spp.*) 및 오올레마 오리자에(*Oulema oryzae*).

<401> 딱정벌레(*Coleoptera*)목, 예를 들어, 아노비움 푼크타툼(*Anobium punctatum*), 리조페르타 도미니카(*Rhizopertha dominica*), 브루키디우스 오브텍투스(*Bruchidius obtectus*), 아칸토스셀리데스 오브텍투스(*Acanthoscelides obtectus*), 힐로트루페스 바줄루스(*Hylotrupes bajulus*), 아겔라스티카 알니 (*Agelastica alni*), 랩티노타르사 데셈리네아타(*Leptinotarsa decemlineata*), 파에돈 코클레아리아에(*Phaedon cochleariae*), 디아브로티카 종(*Diabrotica spp.*), 프실리오테스 크리소세팔라(*Psylliodes chrysocephala*), 에 필라크나 바리베스티스(*Epilachna varivestis*), 아토마리아 종(*Atomaria spp.*), 오리자에필루스 수리나멘시스(*Oryzaephilus surinamensis*), 안토노무스 종(*Anthonomus spp.*), 시토피루스 종(*Sitophilus spp.*), 오티오린쿠스 숄카투스(*Otiorrhynchus sulcatus*), 코스모폴리테스 소르디두스(*Cosmopolites sordidus*), 세우토린쿠스 아시밀리스(*Ceuthorrhynchus assimilis*), 히페라 포스티카(*Hypera postica*), 더메스테스 종(*Dermestes spp.*), 트로고더마 종(*Trogoderma spp.*), 안트레누스 종(*Anthrenus spp.*), 아타게누스 종(*Attagenus spp.*), 릭투스 종(*Lyctus spp.*), 멜리게테스 아에네우스(*Meligethes aeneus*), 프티누스 종(*Ptinus spp.*), 니프트우스 홀로레우쿠스(*Niptus hololeucus*), 기비움 프실로이데스(*Gibbium psylloides*), 트리볼리움 종(*Tribolium spp.*), 테네브리오 몰리토르(*Tenebrio molitor*), 아그리오테스 종(*Agriotes spp.*), 코노데루스 종(*Conoderus spp.*), 멜로론타 멜로론타(*Melolontha melolontha*), 암피말론 솔스티티알리스(*Amphimallon solstitialis*), 코스텔리트라 제알란드리카(*Costelytra zealandica*) 및 리소르호프투스 오리조필루스(*Lissorhoptus oryzophilus*).

<402> 벌(*Hymenoptera*)목, 예를 들어 디프리콘 종(*Diprion spp.*), 호플로캄파 종(*Hoplocampa spp.*), 라시우스 종(*Lasius spp.*), 모노모리움 파라오니스(*Monomorium pharaonis*) 및 베스파 종(*Vespa spp.*).

<403> 파리(*Diptera*)목, 예를 들어 아에데스 종(*Aedes spp.*), 아노펠레스 종(*Anopheles spp.*), 쿨렉스 종(*Culex spp.*), 드로스필라 멜라노가스터(*Drosophila melanogaster*), 무스카 종(*Musca spp.*), 판니아 종(*Fannia spp.*), 칼리포라 에리트르세팔라(*Calliphora erythrocephala*), 루실리아 종(*Lucilia spp.*), 크리소미아 종(*Chrysomyia spp.*), 쿠테레브라 종(*Cuterebra spp.*), 가스트로필루스 종(*Gastrophilus spp.*), 히포보스카 종(*Hyppobosca spp.*), 스톰옥시스 종(*Stomoxys spp.*), 오에스트루스 종(*Oestrus spp.*), 히포더마 종(*Hypoderma spp.*), 타바누스 종(*Tabanus spp.*), 탄니아 종(*Tannia spp.*), 비비오 호르툴라누스(*Bibio hortulanus*), 오시넬라 프리트(*Oscinella frit*), 포르비아 종(*Phorbia spp.*), 페고미아 히오스키아미(*Pegomyia hyoscyami*), 세라티티스 카피타타(*Ceratitis capitata*), 다쿠스 올레아에(*Dacus oleae*), 티풀라 팔루도사(*Tipula paludosa*), 힐레미아 종(*Hylemyia spp.*) 및 리비오미자 종(*Liriomyza spp.*).

<404> 벼룩(*Siphonaptera*)목, 예를 들어 크세노프실라 케오피스(*Xenopsylla cheopis*) 및 세라토피루스 종(*Ceratophyllus spp.*).

<405> 거미(*Arachnida*)문, 예를 들어 소르피오 마우루스(*Scorpio maurus*), 라트로텍투스 막탄스(*Latrodectus mactans*), 아카루스 시로(*Acarus siro*), 아르가스 종(*Argas spp.*), 오르니토도로스 종(*Ornithodoros spp.*), 데르마니수스 갈리나에(*Dermanyssus gallinae*), 에리오피에스 리비스(*Eriophyes ribis*), 필로콥트루타 올레이보라(*Phyllocopturta oleivora*), 부필루스 종(*Boophilus spp.*), 리피세팔루스 종(*Rhipicephalus spp.*), 암블리움마 종(*Amblyomma spp.*), 히알롬마 종(*Hyalomma spp.*), 익소데스 종(*Ixodes spp.*), 프소로프테스 종(*Psoroptes spp.*), 코리오프테스 종(*Chorioptes spp.*), 사코프테스 종(*Sarcoptes spp.*), 타소네무스 종(*Tarsonemus spp.*), 브리오비아 프라에티오사(*Bryobia praetiosa*), 파노니쿠스 종(*Panonychus spp.*), 테트라니쿠스 종(*Tetranychus spp.*), 헤미타소네무스 종(*Hemitarsonemus spp.*) 및 브레비팔푸스 종(*Brevipalpus spp.*).

<406> 식물 기생성 선충에는 예를 들어, 프라틸렌쿠스 종(*Pratylenchus spp.*), 라도폴루스 시밀리스(*Radopholus similis*), 디틸렌쿠스 디프사키(*Ditylenchus dipsaci*), 틸렌쿨루스 세미페네트란스(*Tylenchulus semipenetrans*), 헤테로데라 종(*Heterodera spp.*), 글로보데라 종(*Globodera spp.*), 멜로이도기네 종(*Meloidogyne spp.*), 아펠렌코이데스 종(*Aphelenchoides spp.*), 롱기도루스 종(*Longidorus spp.*), 크시피네마 종(*Xiphinema spp.*), 트리코도루스 종(*Trichodorus spp.*) 및 부르사펠렌쿠스 종(*Bursaphelenchus spp.*)이 포함된다.

<407> 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물은 특히 모충, 딱정벌레 유충, 거미 응애, 진드기 및 잎-손상 곤충에 대해

우수한 활성을 나타낸다.

- <408> 경우에 따라, 본 발명에 따른 화합물은 특정 농도나 적용비율에서 또한 제조제 또는 살미생물제, 예를 들어 살진균제, 항균제 및 살균제로도 사용될 수 있다. 경우에 따라, 이들은 또한 다른 활성 화합물을 합성하기 위한 중간체 또는 전구체로 사용될 수도 있다.
- <409> 본 발명에 따라, 모든 식물 및 식물 부분이 처리될 수 있다. 여기에서 식물이란 원하거나 원치않는 야생 식물 또는 작물(자연 발생 작물 포함)과 같은 모든 식물 및 식물 개체군을 의미하는 것으로 이해되어야 한다. 작물은 식물 육종가의 권한에 의해 보호될 수 있거나 보호될 수 없는 식물 품종 및 형질전환 (transgenic) 식물을 포함하여, 통상적인 식물 육종 및 최적화 방법에 의해, 생명공학적인 및 재조합 방법에 의해 또는 이들 방법을 조합하여 얻을 수 있는 식물일 수 있다. 식물 부분은 식물의 모든 지상 및 지하 부분 및 기관, 예를 들어 싹, 잎, 꽃 및 뿌리를 의미하는 것으로 이해되어야 하며, 이들의 예로 잎, 침엽(needles), 자루(stalks), 줄기(stem), 꽃, 과실체, 과일, 종자, 뿌리, 괴경 및 뿌리 줄기가 언급될 수 있다. 식물 부분은 또한 수확 물질, 및 영양 및 생식 번식 물질, 예를 들어 묘목, 괴경, 뿌리 줄기, 삼목 및 종자를 포함한다.
- <410> 본 발명에 따라 활성 화합물로 식물 및 식물 부분을 처리하는 것은 통상의 처리 방법에 의해, 예를 들어 침지, 분무, 증발, 분사, 살포, 도포에 의해서 및, 전과 물질, 특히 종자의 경우에는 또한 일 또는 다중 코팅에 의해 직접, 또는 그의 주변, 환경 또는 저장 공간에 작용시킴으로써 수행된다.
- <411> 활성 화합물은 용액제, 유제, 수화성 산제, 현탁액, 산제, 분제, 페이스트, 가용성 산제, 과립제, 현탁액-유제 농축액, 활성 화합물이 주입된 천연 및 합성물질, 및 중합물질 중의 마이크로캡셀제와 같은 통상의 제제로 전환될 수 있다.
- <412> 이들 제제는 공지된 방법으로, 예를 들어, 임의로 계면활성제, 즉 유화제 및/또는 분산제 및/또는 포움 형성제를 사용하여 활성 화합물을 증량제, 즉 액체 용매 및/또는 고형 담체와 혼합하여 제조된다.
- <413> 사용된 증량제가 물인 경우, 예를 들어 유기용매가 또한 보조 용매로 사용될 수 있다. 적합한 액체 용매는, 주로 크실렌, 톨루엔 또는 알킬나프탈렌과 같은 방향족 화합물, 클로로벤젠, 클로로에틸렌 또는 메틸렌 클로라이드와 같은 염소화 방향족 및 염소화 지방족 탄화수소, 사이클로헥산 또는 파라핀, 예를 들어, 석유 분획물, 광유 및 식물유와 같은 지방족 탄화수소, 부탄올 또는 글리콜과 같은 알콜 및 이들의 에테르 및 에스테르, 아세톤, 메틸 에틸 케톤, 메틸 이소부틸 케톤 또는 사이클로헥사논과 같은 케톤, 디메틸포름아미드 및 디메틸설폭사이드와 같은 강한 극성 용매 및 또한 물이다.
- <414> 적합한 고형 담체는, 예를 들어 암모늄염, 및 카올린, 점토, 활석, 초크, 석영, 아타펄기트, 몬트모릴로나이트 또는 규조토와 같은 분쇄된 천연 광물, 및 고분산 실리카, 알루미늄 및 실리케이트와 같은 분쇄된 합성 광물이다. 적합한 과립제용 고형 담체는, 예를 들어 방해석, 대리석, 경석, 해포석 및 백운석과 같은 분쇄 및 분류된 천연 암석, 또는 무기 및 유기 가루의 합성 과립, 및 톱밥, 코코넛 껍질, 옥수수 속대 및 담배줄기와 같은 유기물질의 과립이다. 적합한 유화제 및/또는 포움 형성제는 예를 들어 비이온성 및 음이온성 유화제, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 지방산 에스테르, 폴리옥시에틸렌 지방 알콜 에테르, 예를 들어 알킬아릴 폴리글리콜 에테르, 알킬설포네이트, 알킬설페이트, 아릴설포네이트 및 또한 단백질 가수분해물이다. 적합한 분산제는, 예를 들어 리그노설파이트 폐액 및 메틸셀룰로오즈이다.
- <415> 점착제, 예를 들어 카복시메틸셀룰로오즈, 및 아라비아고무, 폴리비닐 알콜 및 폴리비닐 아세테이트와 같은 분말, 과립 또는 라텍스 형태의 천연 및 합성 중합체, 및 또한 세팔린 및 레시틴과 같은 천연 인지질, 및 합성 인지질이 제제에 사용될 수 있다. 그외의 첨가제는 광유 및 식물유일 수 있다.
- <416> 착색제, 예를 들어 산화철, 산화티탄 및 프루시안 블루 등의 무기안료, 및 알리자린 염료, 아조 염료 및 금속 프탈로시아닌 염료 등의 유기 염료 및 철, 망간, 붕소, 구리, 코발트, 몰리브덴 및 아연의 염과 같은 미량 영양소가 사용될 수도 있다.
- <417> 제제는 일반적으로 0.1 내지 95 중량%, 바람직하게는 0.5 내지 90 중량%의 활성 화합물을 함유한다.
- <418> 본 발명에 따른 활성 화합물은 살충제, 유인제, 소독제, 살균제, 살비제, 살선충제, 살진균제, 성장-조절 물질 또는 제조제와 같은 다른 활성 화합물과의 혼합물로서 그의 상업적으로 입수가 가능한 제제 또는 이들 제제로부터 제조된 사용형으로 존재할 수 있다. 살충제는 특히, 예를 들어, 인산 에스테르, 카바메이트, 카복실레이트, 염소화 탄화수소, 페닐우레아 및 미생물에 의해 생산된 물질을 포함한다.

- <419> 혼합물에 특히 유리한 공성분으로는 예를 들어 하기의 화합물이 있다:
- <420> **살진균제:**
- <421> 알디모르프, 암프로필포스, 암프로필포스-포타슘, 안도프림, 아닐라진, 아자코나졸, 아족시스트로빈,
- <422> 메날락실, 베노다닐, 베노밀, 벤자마크릴, 벤자마크릴-이소부틸, 비알라포스, 비나프크릴, 비페닐, 비테르타놀, 블라스티시딘-S, 브로무코나졸, 부피리메이트, 부티오베이트,
- <423> 칼슘 폴리설파이드, 캅시마이신, 캅타폴, 캅탄, 카벤다짐, 카복신, 카르본, 퀴노메티오네이트, 클로벤티아존, 클로르페나졸, 클로로네브, 클로로피크린, 클로로탈로닐, 클로졸리네이트, 클로질라콘, 쿠프라네브, 시목사닐, 사이프로코나졸, 사이프로디닐, 사이프로푸람,
- <424> 데바카브, 디클로로펜, 디클로부트라졸, 디클로플루아니드, 디클로메진, 디클로란, 디에토펜카브, 디페노코나졸, 디메티리물, 디메토모르프, 디니코나졸, 디니코나졸-M, 디노캡, 디페닐아민, 디피리티온, 디탈립포스, 디티아논, 도데모르프, 도딘, 드라족솔론,
- <425> 에디펜포스, 에폭시코나졸, 에타코나졸, 에티리물, 에트리디아졸,
- <426> 파목사돈, 페나파닐, 페나리물, 펜부코나졸, 펜푸람, 페니트로판, 펜피클로닐, 펜프로피딘, 펜프로피모르프, 펜틴 아세테이트, 수산화 펜틴, 페르밤, 페림존, 플루아지남, 플루메토버, 플루오로미드, 플루퀸코나졸, 플루프리미돌, 플루실라졸, 플루설파미드, 플루톨라닐, 플루트리아폴, 폴페트, 포세틸-알루미늄, 포세틸-소듐, 프탈리드, 푸베리다졸, 푸랄락실, 푸라메트피르, 푸르카보닐, 푸르코나졸, 푸르코나졸-시스, 푸르메사이클록스,
- <427> 구아자틴,
- <428> 헥사클로로벤젠, 헥사코나졸, 하이멕사졸,
- <429> 이마잘릴, 이미벤코나졸, 이미녹타딘, 이미녹타딘 알베실레이트, 이미녹타딘 트리아세테이트, 요오도카브, 이프코나졸, 이프로벤포스(IPB), 이프로디온, 이루마마이신, 이소프로티올란, 이소발레디온,
- <430> 카수가마이신, 크레속심-메틸, 구리 제제, 예를 들어 수산화 구리, 구리 나프테네이트, 옥시염화구리, 황산구리, 산화구리, 옥신-구리 및 보르도(Bordeaux) 혼합물,
- <431> 만코피, 만코제브, 마네브, 메페림존, 메파니피림, 메프로닐, 메탈락실, 메트코나졸, 메타설포카브, 메트푸록삼, 메티람, 메토메클람, 메트설포박스, 밀디오마이신, 마이클로부타닐, 마이클로졸린,
- <432> 니켈 디메틸디티오카바메이트, 니트로탈-이소프로필, 누아리물,
- <433> 오푸라스, 옥사딕실, 옥사모카브, 옥솔린산, 옥시카복심, 옥시펜틴,
- <434> 파클로부트라졸, 페푸라조에이트, 펜코나졸, 펜시쿠론, 포스디펜, 피마리신, 피페랄린, 폴리옥신, 폴리옥소림, 프로베나졸, 프로클로라즈, 프로사이미돈, 프로파모카브, 프로파노신-소듐, 프로피코나졸, 프로피네브, 피라조포스, 피리페녹스, 피리메타닐, 피로퀼론, 피록시푸르,
- <435> 퀴코나졸, 퀴토젠(PCNB),
- <436> 황 및 황 제제,
- <437> 테부코나졸, 테클로프탈람, 테크나젠, 테트사이클라시스, 테트라코나졸, 티아벤다졸, 티사이오펜, 티플루자미드, 티오파네이트-메틸, 티람, 티옥시미드, 톨클로포스-메틸, 톨릴플루아니드, 트리아디메폰, 트리아디메놀, 트리아즈부틸, 트리아족사이드, 트리클라미드, 트리사이클라졸, 트리데모르프, 트리플루미졸, 트리포린, 트리티코나졸,
- <438> 유니코나졸,
- <439> 발리다마이신 A, 빈클로졸린, 비니코나졸,
- <440> 자릴라미드, 지네브, 지람, 및 또한
- <441> 다거(Dagger) G,
- <442> OK-8705, OK-8801,

- <443>  $\alpha$ -(1,1-디메틸에틸)- $\beta$ -(2-페녹시에틸)-1H-1,2,4-트리아졸-1-에탄올,
- <444>  $\alpha$ -(2,4-디클로로페닐)- $\beta$ -플루오로- $\beta$ -프로필-1H-1,2,4-트리아졸-1-에탄올,
- <445>  $\alpha$ -(2,4-디클로로페닐)- $\beta$ -메톡시- $\alpha$ -메틸-1H-1,2,4-트리아졸-1-에탄올,
- <446>  $\alpha$ -(5-메틸-1,3-디옥산-5-일)- $\beta$ -[[4-(트리플루오로메틸)페닐]메틸렌]-1H-1,2,4-트리아졸-1-에탄올,
- <447> (5RS,6RS)-6-하이드록시-2,2,7,7-테트라메틸-5-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)-3-옥타논,
- <448> (E)- $\alpha$ -(메톡시이미노)-N-메틸-2-페녹시-페닐아세트아미드,
- <449> 1-이소프로필 {2-메틸-1-[[[1-(4-메틸페닐)에틸]아미노]카보닐]프로필}카바메이트,
- <450> 1-(2,4-디클로로페닐)-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)에타논-0-(페닐메틸)-옥심,
- <451> 1-(2-메틸-1-나프탈레닐)-1H-피롤-2,5-디온,
- <452> 1-(3,5-디클로로페닐)-3-(2-프로페닐)-2,5-피롤리딘디온,
- <453> 1-[(디오오도메틸)설포닐]-4-메틸벤젠,
- <454> 1-[[2-(2,4-디클로로페닐)-1,3-디옥솔란-2-일]메틸]-1H-이미다졸,
- <455> 1-[[2-(4-클로로페닐)-3-페닐옥시라닐]메틸]-1H-1,2,4-트리아졸,
- <456> 1-[1-[2-[(2,4-디클로로페닐)메톡시]페닐]에테닐]-1H-이미다졸,
- <457> 1-메틸-5-노닐-2-(페닐메틸)-3-피롤리디놀,
- <458> 2',6'-디브로모-2-메틸-4'-트리플루오로메톡시-4'-트리플루오로메틸-1,3-티아졸-5-카복시아닐리드,
- <459> 2,2-디클로로-N-[1-(4-클로로페닐)에틸]-1-에틸-3-메틸사이클로프로판카복사미드,
- <460> 2,6-디클로로-5-(메틸티오)-4-피리미디닐-티오시아네이트,
- <461> 2,6-디클로로-N-(4-트리플루오로메틸벤질)-벤즈아미드,
- <462> 2,6-디클로로-N-[[4-(트리플루오로메틸)페닐]메틸]벤즈아미드,
- <463> 2-(2,3,3-트리요오도-2-프로페닐)-2H-테트라졸,
- <464> 2-[(1-메틸에틸)설포닐]-5-(트리클로로메틸)-1,3,4-티아디아졸,
- <465> 2-[[6-데옥시-4-O-(4-O-메틸- $\beta$ -D-글리코피라노실)- $\alpha$ -D-글루코피라노실]아미노]-4-메톡시-1H-피롤로[2,3-d]피리미딘-5-카보니트릴,
- <466> 2-아미노부탄,
- <467> 2-브로모-2-(브로모메틸)펜탄디니트릴,
- <468> 2-클로로-N-(2,3-디하이드로-1,1,3-트리메틸-1H-인덴-4-일)-3-피리딘카복사미드,
- <469> 2-클로로-N-(2,6-디메틸페닐)-N-(이소티오시아네이트메틸)아세트아미드,
- <470> 2-페닐페놀(OPP),
- <471> 3,4-디클로로-1-[4-(디플루오로메톡시)페닐]-1H-피롤-2,5-디온,
- <472> 3,5-디클로로-N-[시아노-[(1-메틸-2-프로피닐)옥시]메틸]벤즈아미드,
- <473> 3-(1,1-디메틸프로필)-1-옥소-1H-인덴-2-카보니트릴,
- <474> 3-[2-(4-클로로페닐)-5-에톡시-3-이속사졸리디닐]피리딘,
- <475> 4-클로로-2-시아노-N,N-디메틸-5-(4-메틸페닐)-1H-이미다졸-1-설펜아미드,
- <476> 4-메틸테트라졸로[1,5-a]퀴나졸린-5(4H)-온,
- <477> 8-(1,1-디메틸에틸)-N-에틸-N-프로필-1,4-디옥사스피로[4,5]데칸-2-메탄아민,

- <478> 8-하이드록시퀴놀린 설페이트,
- <479> 9H-크산텐-2-[(페닐아미노)카보닐]-9-카복실산 하이드라지드,
- <480> 비스-(1-메틸에틸)-3-메틸-4-[(3-메틸벤조일)옥시]-2,5-티오펜디카복실레이트,
- <481> 시스-1-(4-클로로페닐)-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)-사이클로헥탄올,
- <482> 시스-4-[3-[4-(1,1-디메틸프로필)페닐-2-메틸프로필]-2,6-디메틸모르폴린하이드로클로라이드,
- <483> 에틸 [(4-클로로페닐)아조]시아노아세테이트,
- <484> 포타슘 하이드로젠 카보네이트,
- <485> 메탄테트라티올 소듐염,
- <486> 메틸 1-(2,3-디하이드로-2,2-디메틸-1H-인덴-1-일)-1H-이미다졸-5-카복실레이트,
- <487> 메틸 N-(2,6-디메틸페닐)-N-(5-이속사졸릴카보닐)-DL-알라니네이트,
- <488> 메틸 N-(클로로아세틸)-N-(2,6-디메틸페닐)-DL-알라니네이트,
- <489> N-(2,3-디클로로-4-하이드록시페닐)-1-메틸-사이클로헥산카복사미드,
- <490> N-(2,6-디메틸페닐)-2-메톡시-N-(테트라하이드로-2-옥소-3-푸라닐)-아세트아미드,
- <491> N-(2,6-디메틸페닐)-2-메톡시-N-(테트라하이드로-2-옥소-3-티에닐)-아세트아미드,
- <492> N-(2-클로로-4-니트로페닐)-4-메틸-3-니트로벤젠설포나미드,
- <493> N-(4-사이클로헥실페닐)-1,4,5,6-테트라하이드로-2-피리미딘아민,
- <494> N-(4-헥실페닐)-1,4,5,6-테트라하이드로-2-피리미딘아민,
- <495> N-(5-클로로-2-메틸페닐)-2-메톡시-N-(2-옥소-3-옥사졸리디닐)-아세트아미드,
- <496> N-(6-메톡시피리딘-3-일)-사이클로프로판카복사미드,
- <497> N-[2,2,2-트리클로로-1-[(클로로아세틸)아미노]에틸]벤즈아미드,
- <498> N-[3-클로로-4,5-비스(2-프로피닐옥시)페닐]-N'-메톡시메탄이미드아미드,
- <499> N-포르밀-N-하이드록시-DL-알라닌 소듐염,
- <500> 0,0-디에틸 [2-(디프로필아미노)-2-옥소에틸]에틸포스포르아미도티오에이트,
- <501> 0-메틸 S-페닐 페닐프로필포스포르아미도티오에이트,
- <502> S-메틸 1,2,3-벤조티아디아졸-7-카보티오에이트,
- <503> 스피로[2H]-1-벤조피란-2,1'(3'H)-이소벤조푸란-3'-온.
- <504> **살균제:**
- <505> 브로노폴, 디클로로펜, 니트라피린, 니켈 디메틸디티오카바메이트, 카수가마이신, 옥틸리논, 푸란카복실산, 옥시테트라사이클린, 프로베나졸, 스트렙토마이신, 테클로프탈람, 황산구리 및 기타 구리 제제.
- <506> **살충제 / 살비제 / 살선충제:**
- <507> 아바멕틴, 아세페이트, 아세트아미프리드, 아크리나트린, 알라니카브, 알디카브, 알독시카브, 알파사이피메트린, 알파메트린, 아미트라즈, 아베르멕틴, AZ 60541, 아자디라크틴, 아자메티포스, 아진포스 A, 아진포스 M, 아조사이클로틴,
- <508> 바실러스 포필리아, 바실러스 스파에리쿠스, 바실러스 서브틸리스, 바실러스 투링기엔시스, 바쿨로바이러스, 뷰베리아 바시아나, 뷰베리아 테넬라, 벤디오카브, 벤푸라카브, 벤셀탑, 벤족시메이트, 베타사이플루트린, 비페나제이트, 비펜트린, 비오에타노메트린, 비오피메트린, BPMC, 브로모포스 A, 부벤카브, 부프로페진, 부타티오포스, 부토카복심, 부틸피리다벤,
- <509> 카두사포스, 카바릴, 카보푸란, 카보페노티온, 카보설판, 카담, 클로에토카브, 클로르에톡시포스, 클로르페나피

르, 클로르펜빈포스, 클로르플루아주론, 클로르메포스, 클로르피리포스, 클로르피리포스 M, 클로바포르린, 시스-레스메트린, 시스페메트린, 클로사이트린, 클로에토카브, 클로펜테진, 클로티아니딘, 시아노포스, 사이클로프로렌, 사이클로프로트린, 사이플루트린, 사이할로트린, 사이헥사틴, 사이페메트린, 사이로마진,

- <510> 델타메트린, 데메톤 M, 데메톤 S, 데메톤-S-메틸, 디아펜티우론, 디아지논, 디클로르보스, 디플루벤주론, 디메토에이트, 디메틸빈포스, 디오페놀란, 디설포톤, 도쿠사트-소듐, 도페나핀,
- <511> 에플루실라네이트, 에마벡틴, 엠펜트린, 엔도설판, 엔토모프토라 종, 에프리노벡틴, 에스펜발레레이트, 에티오펜카브, 에티온, 에토프로포스, 에토펜프록스, 에톡사졸, 에트림포스,
- <512> 펜아미포스, 펜아자퀸, 산화 펜부타딘, 페니트로티온, 페노티오카브, 페녹사크림, 페녹시카브, 펜프로파트린, 펜피라드, 펜피리트린, 펜피록시메이트, 펜발레레이트, 피프로닐, 플루아주론, 플루브로사이트리네이트, 플루사이클록수론, 플루사이트리네이트, 플루페녹수론, 플루텐진, 플루발리네이트, 포노포스, 포스메틸란, 포스티아제이트, 푸브펜프록스, 푸라티오카브,
- <513> 그라눌로시스 바이러세스,
- <514> 할로페노자이드, HCH, 헵테노포스, 헥사플루무론, 헥시티아죽스, 하이드로프렌,
- <515> 이미다클로프리드, 이사조포스, 이소펜포스, 이속사티온, 이버벡틴,
- <516> 뉴클레아 폴리헤드로시스 바이러세스,
- <517> 람다-사이할로트린, 루페누론,
- <518> 말라티온, 메카르밤, 메트알데하이드, 메타미도포스, 메타리지움 아니소플리아, 메타리지움 플라보비리데, 메티다티온, 메티오카브, 메토밀, 메톡시페노자이드, 메톨카브, 메톡사디아존, 메빈포스, 밀베벡틴, 모노크로토프스,
- <519> 날레드, 니텐피람, 니티아진, 노발루론,
- <520> 오메토에이트, 옥사밀, 옥시데메톤 M,
- <521> 파에실로마이세스 푸모소로세우스, 파라티온 A, 파라티온 M, 페메트린, 펜토에이트, 포레이트, 포살론, 포스메트, 포스파미돈, 폭심, 피리미카브, 피리미포스 A, 피리미포스 M, 프로페노포스, 프로메카브, 프로폭수르, 프로티오포스, 프로토에이트, 피메트로진, 피라클로포스, 피레스메트린, 피레트럼, 피리다벤, 피리다티온, 피리미디펜, 피리프록시펜,
- <522> 퀴날포스,
- <523> 리마비린,
- <524> 살리티온, 세부포스, 셀라벡틴, 실라플루오펜, 스피노사드, 설포텡, 설포프로포스,
- <525> 타우-플루발리네이트, 테부페노자이드, 테부펜피라드, 테부피리미포스, 테플루벤주론, 테플루트린, 테메포스, 테미빈포스, 테르부포스, 테트라클로르빈포스, 테타사이페메트린, 티아메톡삼, 티아프로닐, 티아트리포스, 티오사이클람 하이드로젠 옥살레이트, 티오디카브, 티오파녹스, 투린기엔신, 트랄로사이트린, 트랄로메트린, 트리아라텐, 트리아자메이트, 트리아조포스, 트리아주론, 트리클로페니딘, 트리클로르폰, 트리플루무론, 트리메타카브,
- <526> 바미도티온, 비닐리프롤, 벤티실리움 레카니,
- <527> YI 5302,
- <528> 제타-사이페메트린, 졸라프로포스,
- <529> (1R-시스)-[5-(페닐메틸)-3-푸라닐]-메틸-3-[(디하이드로-2-옥소-3(2H)-푸라닐리덴)-메틸]-2,2-디메틸사이클로프로판카복실레이트,
- <530> (3-페녹시페닐)-메틸-2,2,3,3-테트라메틸사이클로프로판카복실레이트,
- <531> 1-[(2-클로로-5-티아졸릴)메틸]테트라하이드로-3,5-디메틸-N-니트로-1,3,5-트리아진-2(1H)-이민,
- <532> 2-(2-클로로-6-플루오로페닐)-4-[4-(1,1-디메틸에틸)페닐]-4,5-디하이드로-옥사졸,

- <533> 2-(아세틸옥시)-3-도데실-1,4-나프탈렌디온,
- <534> 2-클로로-N-[[[4-(1-페닐에톡시)-페닐]-아미노]-카보닐]-벤즈아미드,
- <535> 2-클로로-N-[[[4-(2,2-디클로로-1,1-디플루오로에톡시)-페닐]-아미노]-카보닐]-벤즈아미드,
- <536> 3-메틸페닐 프로필카바메이트,
- <537> 4-[4-(4-에톡시페닐)-4-메틸펜틸]-1-플루오로-2-페녹시-벤젠,
- <538> 4-클로로-2-(1,1-디메틸에틸)-5-[[2-(2,6-디메틸-4-페녹시페녹시)에틸]티오]-3(2H)-피리다지논,
- <539> 4-클로로-2-(2-클로로-2-메틸프로필)-5-[(6-요오도-3-피리디닐)메톡시]-3(2H)-피리다지논,
- <540> 4-클로로-5-[(6-클로로-3-피리디닐)메톡시]-2-(3,4-디클로로페닐)-3(2H)-피리다지논,
- <541> 바실러스 투링기엔시스 스트레인 EG-2348,
- <542> 2-벤조일-1-(1,1-디메틸에틸)히드라지노벤조산,
- <543> 2,2-디메틸-3-(2,4-디클로로페닐)-2-옥소-1-옥사스피로[4.5]텍-3-엔-4-일 부타노에이트,
- <544> [3-[(6-클로로-3-피리디닐)메틸]-2-티아졸리디닐리덴]-시안아미드,
- <545> 디하이드로-2-(니트로메틸렌)-2H-1,3-티아진-3(4H)-카복살데하이드,
- <546> 에틸 [2-[[1,6-디하이드로-6-옥소-1-(페닐메틸)-4-피리다지닐]옥시]에틸]-카바메이트,
- <547> N-(3,4,4-트리플루오로-1-옥소-3-부테닐)-글리신,
- <548> N-(4-클로로페닐)-3-[4-(디플루오로메톡시)페닐]-4,5-디하이드로-4-페닐-1H-피라졸-1-카복사미드,
- <549> N-[(2-클로로-5-티아졸릴)메틸]-N'-메틸-N"-니트로-구아니딘,
- <550> N-메틸-N'-(1-메틸-2-프로페닐)-1,2-히드라진디카보티오아미드,
- <551> N-메틸-N'-2-프로페닐-1,2-히드라진디카보티오아미드,
- <552> 0,0-디에틸 [2-(디프로필아미노)-2-옥소에틸]-에틸포스포르아미도티오에이트.
- <553> 제조제와 같은 기타 공지된 활성 화합물, 비료 및 성장조절제와 혼합물이 또한 가능하다.
- <554> 살충제로 사용되는 경우, 본 발명에 따른 활성 화합물은 또한 상승제와의 혼합물로서 그의 상업적으로 입수가능한 제제 및 이들 제제로부터 제조된 사용형으로 존재할 수 있다. 상승제는 첨가되는 상승제 그 자체가 활성화될 필요없이 활성 화합물의 작용을 증가시키는 화합물이다.
- <555> 상업적으로 입수가능한 제제로부터 제조된 사용형의 활성 화합물 함량은 넓은 범위내에서 변할 수 있다. 사용형의 활성 화합물 농도는 0.0000001 내지 95 중량%, 바람직하게는 0.0001 내지 1 중량% 이다.
- <556> 화합물은 사용형에 적합한 통상적인 방법으로 사용된다.
- <557> 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.
- <558> 상기 언급된 바와 같이, 본 발명에 따라 모든 식물 및 이들 부분이 처리될 수 있다. 바람직한 구체예에서, 야생 식물종 및 식물 품종 또는 통상적인 생물학적 육종법, 예를 들어 교잡육종 또는 원형체 융합(protoplast fusion)에 의해 얻어진 식물종 및 식물 품종뿐 아니라 이들 부분이 처리된다. 또 다른 바람직한 구체예에서, 적합하다면 통상적인 방법과 함께 유전자공학적으로 얻어진 형질전환 식물(transgenic plant) 및 식물 품종(유전자 변형 유기체) 및 이들의 일부가 처리된다. 용어 "부분", "식물의 일부" 또는 "식물 부분"은 상기 설명되었다.
- <559> 특히 바람직하게는, 각 경우에 시판되거나 사용중인 식물 품종의 식물이 본 발명에 따라 처리된다. 식물 품종이라는 것은 통상적인 육종 기술, 돌연변이형성 또는 재조합 DNA 기술에 의해 얻을 수 있는 특정 성질("특성")을 갖는 식물로 이해되어야 한다. 이들은 품종(cultivar), 생리형(biotype) 또는 유전자형(genotype)일 수 있다.

- <560> 식물 종 또는 식물 품종, 이들의 장소 및 성장 조건(토양, 기후, 생장기, 영양분)에 따라, 본 발명에 따라 처리함으로써 또한 상기("상승")적 효과가 나타날 수 있다. 따라서, 예를 들어 본 발명에 따라 사용되는 물질 및 조성물의 적용비율의 감소 및/또는 활성 스펙트럼의 확대 및/또는 활성 증가, 식물 성장성 향상, 고온 또는 저온 내성 증가, 가뭄, 또는 물 또는 토양 염분에 대한 내성 증가, 개화량 증가, 수확 용이성, 성숙성 촉진, 작화량 증가, 수확 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.
- <561> 본 발명에 따라 처리되는 바람직한 형질전환 식물 또는 식물 품종(즉, 유전 공학적으로 얻어진 것)은 유전자 변형시 이들 식물에 특히 유리한 특성을 제공하는 유전자 물질을 수용하는 모든 식물을 포함한다. 이러한 특성의 예로는 식물 성장성 향상, 고온 또는 저온 내성 증가, 가뭄, 또는 물 또는 토양 염분에 대한 내성 증가, 개화량 증가, 수확 용이성, 성숙성 촉진, 작화량 증가, 수확 산물의 품질 향상 및/또는 영양가 증대, 및 수확 산물의 저장 안정성 및/또는 처리성 증대가 포함된다. 추가적으로 특히 주목할만한 상기 특성의 예로 동물 및 미생물 해충, 예를 들어 곤충, 응애, 식물병원성 진균, 박테리아 및/또는 바이러스에 대한 식물의 방어력 증가 및 또한 특정 제초 활성 화합물에 대한 식물의 내약성 증가가 있다. 형질전환 식물의 예로 중요한 작물, 예를 들어 곡물(밀, 쌀), 옥수수, 대두, 감자, 목화, 유지종자 평지 및 또한 과수 식물(사과, 배, 감귤 및 포도 과일이 열리는)이 언급될 수 있으며, 옥수수, 대두, 감자, 목화 및 유지종자 평지가 특히 주목된다. 강조되는 특성은 특히 식물에 형성된 독소, 특히 바실러스 투린기엔시스(*Bacillus thuringiensis*)로부터 얻은 유전자 물질(예를 들어 유전자 CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb 및 CryIF 및 이들 조합)에 의해 식물(이후 "Bt 식물"로 언급)에 형성된 독소로 인한 곤충에 대한 식물의 방어력 증가이다. 또한, 특히 강조되는 특성은 전신적으로 획득한 내성(SAR), 시스템인, 피토알렉시우스, 엘리시터 및 내성 유전자 및 상응하게 발현된 단백질 및 독소로 인해 진균, 박테리아 및 바이러스에 대해 식물의 방어력이 증가한 것이다. 특히 강조되는 특성은 또한 특정 제초 활성 화합물, 예를 들어 이미다졸리논, 설폰닐우레아, 글리포세이트 또는 포스포트리신(예를 들어 "PAT" 유전자)에 대한 식물의 내약성 증가다. 목적하는 해당 특성을 부여하는 유전자가 또한 상호 조합으로 형질전환 식물에 존재할 수 있다. "Bt 식물"의 예로 YIELD GARD<sup>®</sup> (예: 옥수수, 목화, 대두), KnockOut<sup>®</sup> (예: 옥수수), StarLink<sup>®</sup> (예: 옥수수), Bollgard<sup>®</sup> (예: 목화), Nucotr<sup>®</sup> (예: 목화) 및 NewLeaf<sup>®</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>®</sup> (글리포세이트 내약성, 예: 옥수수, 목화, 대두), Liberty Link<sup>®</sup> (포스포트리신 내약성, 예: 유지종자 평지), IMI<sup>®</sup> (이미다졸리논 내약성) 및 STS<sup>®</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>®</sup> 명으로 시판되고 있는 품종(예: 옥수수)이 또한 언급될 수 있다. 물론, 상기 설명은 또한 미래에 개발되고/되거나 시장화될 식물로, 상술된 특성을 지니거나 유전자 특성이 여전히 개발될 여지가 남아 있는 식물 품종에도 적용된다.
- <562> 상기 언급된 식물들이 본 발명에 따른 일반식 (I)의 화합물 또는 활성 화합물의 혼합물을 사용하여 본 발명에 따라 특히 유리한 방식으로 처리될 수 있다. 이들 활성 화합물 또는 혼합물에 대한 상기 언급된 바람직한 범위가 또한 이들 식물의 처리에도 적용된다. 본 명세서에 구체적으로 언급된 화합물 또는 혼합물로 식물을 처리하는 것이 특히 강조된다.
- <563> 본 발명에 따른 활성 화합물은 식물 해충, 위생 해충 및 저장 제품 해충 뿐만 아니라, 수의학 분야에서 동물 기생충(체외 기생충), 예를 들어, 견체 참진드기, 연체 참진드기, 움 응애, 잎 응애, 파리(쓰고 찌는), 기생성 파리 유충, 이, 털이, 조류 및 벼룩에 대해 활성적이다. 이러한 기생충에는 다음의 것들이 포함된다:
- <564> 이(*Anoplurida*)목, 예를 들어 하에마토피누스 종(*Haematopinus spp.*), 리노그나투스 종(*Linognathus spp.*), 페디쿨루스 종(*Pediculus spp.*), 프티루스 종(*Pthirus spp.*), 솔레노포테스 종(*Solenopotes spp.*).
- <565> 털이(*Mallophagida*)목 및 암블리세리나(*Amblycerina*) 및 이스크노세리나 (*Ischnocerina*) 아목, 예를 들어 트리메노폰 종(*Trimenopon spp.*), 메노폰 종 (*Menopon spp.*), 트리노톤 종(*Trinoton spp.*), 보비콜라 종(*Bovicola spp.*), 웨르넥키엘라 종(*Werneckiella spp.*), 레피켄트론 종(*Lepikentron spp.*), 다말리나 종 (*Damalina spp.*), 트리코덱테스 종(*Trichodectes spp.*), 펠리콜라 종(*Felicola spp.*).
- <566> 파리(*Diptera*)목 및 네마토세리나(*Nematocerina*) 및 브라키세리나 (*Brachyocerina*) 아목, 예를 들어 아에테스

종(*Aedes spp.*), 아노펠레스 종 (*Anopheles spp.*), 쿨렉스 종(*Culex spp.*), 시물리움 종(*Simulium spp.*), 유시물리움 종(*Eusimulium spp.*), 플레보토무스 종(*Phlebotomus spp.*), 루초미아 종(*Lutzomyia spp.*), 쿨리코이데스 종(*Culicoides spp.*), 크리소프스 종(*Crysops spp.*), 히보미트라 종(*Hybomitra spp.*), 아틸로투스 종(*Atylotus spp.*), 타바누스 종(*Tabanus spp.*), 하에마토포타 종(*Haematopota spp.*), 필리포미아 종(*Philipomyia spp.*), 브라올라 종(*Braula spp.*), 무스카 종(*Musca spp.*), 히드로테아 종(*Hydrotaea spp.*), 스토목시스 종(*Stomoxys spp.*), 하에마토포비아 종 (*Haematobia spp.*), 모델리아 종(*Morellia spp.*), 판니아 종(*Fannia spp.*), 글로스티나 종(*Glossina spp.*), 칼리포라 종(*Calliphora spp.*), 루실리아 종(*Lucilia spp.*), 크리소미아 종(*Chrysomyia spp.*), 울파르티아 종(*Wohlfahrtia spp.*), 사르코파가 종(*Sarcophaga spp.*), 오에스트루스 종(*Oestrus spp.*), 히포더마 종 (*Hypoderma spp.*), 가스테로필루스 종(*Gasterophilus spp.*), 히포보스카 종 (*Hyppobosca spp.*), 리포프테나 종(*Lipoptena spp.*), 멜로파구스 종(*Melophagus spp.*).

<567> 벼룩(*Siphonapterida*)목, 예를 들어 풀렉스 종(*Pulex spp.*), 크테노세팔리데스 종(*Ctenocephalides spp.*), 크세노프실라 종(*Xenopsylla spp.*), 세라토피루스 종(*Ceratophyllus spp.*).

<568> 이시아(*Heteropterida*) 목, 예를 들어 시멕스 종(*Cimex spp.*), 트리아토마 종(*Triatoma spp.*), 로드니우스 종(*Rhodnius spp.*), 판스트롱길루스 종 (*Panstrongylus spp.*).

<569> 바퀴(*Blattarida*) 목, 예를 들어 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 블라타 게르마니카(*Blatta germanica*) 및 수펠라 종(*Supella spp.*).

<570> 응애(*Acaria(Acarida)*) 아강 및 메타- 및 메소스티그마타(*Meta- and Mesostigmata*)목, 예를 들어 아르가스 종(*Argas spp.*), 오르니토도루스 종 (*Ornithodoros spp.*), 오토비우스 종(*Otobius spp.*), 익소테스 종(*Ixodes spp.*), 암블리움마 종(*Amblyomma spp.*), 부필루스 종(*Boophilus spp.*), 데르마센토 종 (*Dermacentor spp.*), 하에마피살리스 종(*Haemaphysalis spp.*), 히알롬마 종 (*Hyalomma spp.*), 리피세팔루스 종(*Rhipicephalus spp.*), 데르마니수스 종 (*Dermanyssus spp.*), 라일리에티아 종(*Raillietia spp.*), 뉴모니수스 종(*Pneumonyssus spp.*), 스테르노스토마 종(*Sternostoma spp.*) 및 바로아 종(*Varroa spp.*).

<571> 아크티네디다(*Actinedida*)(프로스티그마타(*Prostigmata*)) 및 아카리디다 (*Acaridida*)(아스티그마타(*Astigmata*)) 목, 예를 들어 아카라피스 종(*Acarapis spp.*), 체일레티엘라 종(*Cheyletiella spp.*), 오르니토체일레티아 종 (*Ornithocheyletia spp.*), 미오비아 종(*Myobia spp.*), 소레르가테스 종 (*Psorergates spp.*), 데모텍스 종(*Demodex spp.*), 트롬비쿨라 종(*Trombicula spp.*), 리스트로포루스 종(*Listrophorus spp.*), 아카루스 종(*Acarus spp.*), 티로파구스 종(*Tyrophagus spp.*), 칼로글리푸스 종(*Caloglyphus spp.*), 히포텍테스 종(*Hypodectes spp.*), 프테롤리쿠스 종(*Pterolichus spp.*), 소로프테스 종(*Psoroptes spp.*), 코리오프테스 종(*Chorioptes spp.*), 오토텍테스 종(*Otodectes spp.*), 사르코프테스 종(*Sarcoptes spp.*), 노토에드레스 종(*Notoedres spp.*), 크네미도코프테스 종(*Knemidocoptes spp.*), 시토디테스 종(*Cytodites spp.*) 및 라미노시오프테스 종(*Laminosioptes spp.*).

<572> 이들은 예를 들어 진드기, 예를 들자면 암블리움마 헤브라에움(*Amblyomma hebraeum*), 기생성 파리, 예를 들자면 루실리아 쿠프리나(*Lucilia cuprina*) 및 벼룩, 예를 들자면 크테노세팔리데스 펠리스(*Ctenocephalides felis*)의 발생 단계에 대해 우수한 활성을 갖는다.

<573> 본 발명에 따른 일반식 (I)의 활성 화합물은 또한 농업용 생산성 가축, 예를 들어 소, 양, 염소, 말, 돼지, 당나귀, 낙타, 물소, 토끼, 닭, 칠면조, 오리, 거위 및 벌, 기타 애완 동물, 예를 들어 개, 고양이, 새장의 새 및 어항속 물고기, 및 소위 실험용 동물, 예를 들어 햄스터, 기니아 피그, 랫트 및 마우스를 침습하는 절지동물을 구제하는데 적합하다. 이들 절지동물을 구제하면, 사망 및 산출량 감소(고기, 우유, 양모, 가축, 알, 꿀 등에 있어서)가 줄어들게 되므로, 본 발명에 따른 활성 화합물을 사용함으로써 더욱 경제적이고 간편한 동물 관리가 가능하다.

<574> 본 발명에 따른 활성 화합물은, 수의학 분야에서, 예를 들어 정제, 캡셀제, 음료, 물약, 과립제, 페이스트제, 거환제, 사료를 통한 방법, 좌약의 형태로 장내 투여에 의해, 비경구적 투여, 예를 들어 주사(근육내, 피하, 정맥내 및 복막내 등)에 의해, 삽입에 의해, 비강내 투여에 의해, 예를 들어, 침지 또는 목욕, 분무, 붓기 및 점적, 세척 및 뿌리기의 형태에 의해서나 활성 화합물을 함유하는 성형품 형태, 예를 들어, 목걸이, 귀표식(ear marks), 꼬리 표식, 다리 밴드, 굴레, 표시장치 등의 형태로 경피 사용에 의해 공지된 방식으로 사용된다.

<575> 가축, 가금류, 애완 동물 등에 사용하는 경우에, 본 발명에 따른 일반식 (I)의 활성 화합물은 본 발명에 따른 활성 화합물을 1 내지 80 중량%의 양으로 함유하는 제제(예를 들어 산제, 유제, 자유 유동 조성물)로서 직접 또

는 100 내지 10,000 배 희석하여 사용될 수 있거나, 약품옥의 형태로 사용될 수 있다.

- <576> 또한, 본 발명에 따른 활성 화합물은 산업 재료를 파괴하는 곤충에 대하여 강력한 살충 작용을 나타내는 것으로 밝혀졌다.
- <577> 다음의 곤충들이 바람직한 예로서 언급될 수 있지만, 이들로만 제한되지 않는다:
- <578> 딱정벌레(Beetles), 예를 들어 힐로트루페스 바줄루스(*Hylotrupes bajulus*), 클로로포루스 필로시스(*Chlorophorus pilosis*), 아노비움 푼크타툼(*Anobium punctatum*), 크세스토비움 루포빌로숨(*Xestobium rufovillosum*), 프틸리누스 펙티코르니스(*Ptilinus pecticornis*), 덴드로비움 페르티넥스(*Dendrobium pertinex*), 에르노비우스 몰리스(*Ernobius mollis*), 프리오비움 카르피니(*Priobium carpini*), 릭투스 브룬네우스(*Lyctus brunneus*), 릭투스 아프리카누스(*Lyctus africanus*), 릭투스 플라니콜리스(*Lyctus planicollis*), 릭투스 리네아리스(*Lyctus linearis*), 릭투스 푸베센스(*Lyctus pubescens*), 트로곡실론 아에쿠알레(*Trogoxylon aequale*), 민테스 루기콜리스(*Minthes rugicollis*), 질레보루스 종(*Xyleborus spp.*), 트립토펜드론 종(*Tryptodendron spp.*), 아파테 모나쿠스(*Apate monachus*), 보스트리쿠스 카푸킨스(*Bostrychus capucins*), 헤테로보스트리쿠스 브룬네우스(*Heterobostrychus brunnes*), 시녹실론 종(*Synoxylon spp.*), 디노테루스 미누투스(*Dinoderus minutus*).
- <579> 히메노프테론스(Hymenopterons), 예를 들어, 시렉스 주벤쿠스(*Sirex jubencus*), 우로세루스 기가스(*Urocerus gigas*), 우로세루스 기가스 타이그누스(*Urocerus gigas taignus*), 우로세루스 아우구르(*Urocerus augur*).
- <580> 흰개미(Termites), 예를 들어, 칼로테르메스 플라비콜리스(*Kaloterms flavicollis*), 크립토테르메스 브레비스(*Cryptotermes brevis*), 헤테로테르메스 인디콜라(*Heterotermes indicola*), 레티쿨리테르메스 플라비페스(*Reticulitermes flavipes*), 레티쿨리테르메스 산토넨시스(*Reticulitermes santonensis*), 레티쿨리테르메스 루시푸구스(*Reticulitermes lucifugus*), 마스토테르메스 다위니엔시스(*Mastotermes darwiniensis*), 주테르모프시스 네바덴시스(*Zootermopsis nevadensis*), 코프토테르메스 포르모사누스(*Coptotermes formosanus*).
- <581> 쉘(Bristletails), 예를 들어, 레피스마 사카리나(*Lepisma saccharina*).
- <582> 본 명세서에서 산업 재료는 무생 물질, 예를 들어, 바람직하게는 플라스틱, 접착제, 아교, 종이, 판지, 가죽, 목재, 가공 목제품, 및 코팅 조성물의 의미로 이해된다.
- <583> 곤충의 침습으로부터 보호되어야 할 재료는 특히 바람직하게는 목재 및 가공 목제품이다.
- <584> 본 발명에 따른 제제 또는 이를 포함하는 혼합물에 의해 보호될 수 있는 목재 및 가공 목제품은 예를 들어, 건축용 목재, 목재 빔(beam), 철도 침목, 교량 구성 요소, 방파제, 목재로 만들어진 비히클(vehicle), 상자, 팔레트, 컨테이너, 전신주, 목재 표지판, 목재로 만들어진 창 및 문, 합판, 칩 보드, 접합품, 또는 가옥 건축 또는 건축용 가구에 매우 일반적으로 사용되는 목제품의 의미로 이해된다.
- <585> 본 발명에 따른 활성 화합물은 그 자체로, 농축물 또는 일반적으로 통상의 제제, 예를 들어, 산제, 과립제, 용액제, 현탁제, 유제 또는 페이스트의 형태로 사용될 수 있다.
- <586> 언급된 제제는 그 자체가 공지된 방법으로, 예를 들어, 활성 화합물을 적어도 하나의 용매 또는 희석제, 유화제, 분산제 및/또는 결합제 또는 고정제, 방수제, 경우에 따라 건조제 및 UV 안정화제 및, 경우에 따라 염료 및 안료 및 다른 가공 보조제와 혼합함으로써 제조될 수 있다.
- <587> 목재 및 목공품을 보호하기 위해 사용되는 살충 조성물 또는 농축물은 본 발명에 따른 활성 화합물을 0.0001 내지 95 중량%, 특히 0.001 내지 60 중량%의 농도로 함유한다.
- <588> 사용되는 조성물 또는 농축물의 양은 곤충의 습성 및 발생도와 매질에 따라 달라진다. 최적의 사용량은 적용 시 각 경우에 일련의 시험에 의하여 결정될 수 있다. 그러나, 일반적으로, 보존되어야 할 재료를 기준으로 0.0001 내지 20 중량%, 바람직하게는 0.001 내지 10 중량%를 사용하면 충분하다.
- <589> 사용되는 용매 및/또는 희석제는 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물 및/또는 저휘발성의 오일성 또는 오일형 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물 및/또는 극성 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물 및/또는 물, 및 적합하다면 유화제 및/또는 습윤제이다.
- <590> 바람직하게 사용되는 유기 화학 용매는 35 이상의 증발 지수(evaporation number) 및 30 °C 이상, 바람직하게는 45 °C 이상의 인화점(flash point)을 갖는 오일성 또는 오일형 용매이다. 저휘발성이며 수-불용성인 오일성

및 오일형 용매로 사용되는 물질은 적합한 광유 또는 그들의 방향족 분획물, 또는 광유를 함유하는 용매 혼합물, 바람직하게는 백유(white spirit), 석유 및/또는 알킬벤젠이다.

- <591> 170 내지 220 °C의 비등 범위를 갖는 광유, 170 내지 220 °C의 비등 범위를 갖는 백유, 250 내지 350 °C의 비등 범위를 갖는 스피들 오일(spindle oil), 160 내지 280 °C의 비등 범위를 갖는 석유 및 방향족 화합물, 테레빈(terpentine) 오일 등이 유리하게 사용된다.
- <592> 바람직한 구체예에서, 180 내지 210 °C의 비등 범위를 갖는 액상 지방족 탄화수소 또는 180 내지 220 °C의 비등 범위를 갖는 방향족 및 지방족 탄화수소의 고-비점 혼합물 및/또는 스피들 오일 및/또는 모노클로로나프탈렌, 바람직하게는 α-모노클로로나프탈렌이 사용된다.
- <593> 35 이상의 증발 지수 및 30 °C 이상, 바람직하게는 45 °C 이상의 인화점을 갖는 저휘발성의 유기 오일성 또는 오일형 용매는, 용매 혼합물이 또한 35 이상의 증발 지수 및 30 °C 이상, 바람직하게는 45 °C 이상의 인화점을 갖고 살충제/살진균제 혼합물이 용매 혼합물에 용해되거나 유화될 수 있는 경우에, 중간 또는 고휘발성 유기 화학 용매에 의해 부분적으로 대체될 수 있다.
- <594> 바람직한 구체예에 따라, 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물의 일부가 지방족 극성 유기 화학 용매 또는 용매 혼합물로 대체된다. 하이드록실 및/또는 에스테르 및/또는 에테르 그룹을 함유하는 지방족 유기 화학 용매, 예를 들어, 글리콜 에테르, 에스테르 등이 바람직하게 사용된다.
- <595> 본 발명의 목적을 위해 사용되는 유기 화학 결합제는 그 자체로서 공지되어 있고, 물로 희석될 수 있고/있거나 사용된 유기 화학 용매에 용해, 분산 또는 유화될 수 있는 합성 수지 및/또는 결합 건성유, 특히 아크릴레이트 수지, 비닐 수지, 예를 들어, 폴리비닐 아세테이트, 폴리에스테르 수지, 중축합 또는 중부가 수지, 폴리우레탄 수지, 알키드 수지 또는 개질된 알키드 수지, 페놀 수지, 탄화수소 수지, 예를 들어, 인텐-쿠마론(coumarone) 수지, 실리콘 수지, 건성 식물유 및/또는 건성유 및/또는 천연 및/또는 합성 수지를 기본으로 한 물리적 건조 결합제로 구성되거나 이들을 포함하는 결합제이다.
- <596> 결합제로서 사용된 합성 수지는 유제, 분산액 또는 용액의 형태로 사용될 수 있다. 역청(bitumen) 또는 역청질 물질이 또한 10 중량% 이하의 양으로 결합제로서 사용될 수 있다. 또한, 그 자체로 공지된 염료, 안료, 방수제, 교향제( odour correctant ) 및 억제제 또는 부식 방지제 등이 사용될 수 있다.
- <597> 본 발명에 따라, 조성물 또는 농축물은 바람직하게는 유기 화학 결합제로서 적어도 하나의 알키드 수지 또는 개질된 알키드 수지 및/또는 건성 식물유를 함유한다. 45 중량% 이상, 바람직하게는 50 내지 68 중량%의 오일 함량을 갖는 알키드 수지가 본 발명에 따라 바람직하게 사용된다.
- <598> 상기 언급된 결합제의 전부 또는 일부가 고정제(혼합물) 또는 가소제(혼합물)로 대체될 수 있다. 이 첨가제들은 활성 화합물의 증발 및 또한 결정화 또는 침전을 방지하기 위해 사용된다. 이들은 바람직하게는 결합제의 0.01 내지 30%(사용된 결합제 100%를 기준으로)를 대체한다.
- <599> 가소제는 프탈산 에스테르, 예를 들어, 디부틸 프탈레이트, 디옥틸 프탈레이트 또는 벤질 부틸 프탈레이트, 인산 에스테르, 예를 들어, 트리부틸 포스페이트, 아디프산 에스테르, 예를 들어, 디-(2-에틸헥실)아디페이트, 스테아레이트, 예를 들어, 부틸 스테아레이트 또는 아밀 스테아레이트, 올레에이트, 예를 들어, 부틸 올레에이트, 글리세롤 에테르 또는 고분자량의 글리콜 에테르, 글리세롤 에스테르 및 p-톨루엔설폰산 에스테르의 화학그룹으로부터 선택된다.
- <600> 고정제는 화학적으로 폴리비닐 알킬 에테르, 예를 들어, 폴리비닐 메틸 에테르, 또는 케톤 예를 들어, 벤조페논 또는 에틸렌벤조페논을 기본으로 한다.
- <601> 가능한 용매 또는 희석제는 특히, 경우에 따라, 하나 이상의 상기 언급된 유기화학 용매 또는 희석제, 유화제 및 분산제와의 혼합물로서의 물이다.
- <602> 목재는 대규모 공업적 스케일의 주입 방법, 예를 들어, 진공, 이중 진공 또는 압축 처리에 의해 특히 효과적으로 보존된다.
- <603> 즉시 사용형(ready-to-use) 조성물은 또한 경우에 따라 다른 살충제 및, 또한 경우에 따라 또한 하나 또는 그 이상의 살진균제를 함유할 수 있다.
- <604> 가능한 추가의 혼합 파트너는 바람직하게는 WO 94/29 268에 언급되어 있는 살충제 및 살진균제이다. 이 문헌에 언급된 화합물은 본 출원의 명백한 구성요소이다.

- <605> 특히 바람직한 혼합 파트너로는 살충제, 예를 들어, 클로르피리포스, 폭심, 실라플루오핀, 알파메트린, 사이플루트린, 사이피메트린, 델타메트린, 페메트린, 이미다클로프리드, NI-25, 플루페녹수론, 헥사플루무론, 트랜스플루트린, 티아클로프리드, 메톡시페노자이드 및 트리플루무론, 및 또한 살진균제, 예를 들어, 에폭시코나졸, 헥사코나졸, 아자코나졸, 프로피코나졸, 테부코나졸, 사이프로코나졸, 메트코나졸, 이마잘릴, 디클로르플루아니드, 톨릴플루아니드, 3-요오도-2-프로피닐부틸 카바메이트, N-옥틸-이소티아졸린-3-온 및 4,5-디클로로-N-옥틸 이소티아졸린-3-온이 언급될 수 있다.
- <606> 본 발명에 따른 화합물은 동시에 염수 또는 해수와 접하고 있는 물체, 예를 들어 선박 선체, 스크린, 그물, 구조물, 정박장 및 신호송신 시스템을 오염으로부터 보호하기 위해 사용될 수 있다.
- <607> 고착성 빈모강(*Oligochaetae*), 예를 들어 세르풀리아에(*Serpulidae*), 및 갑각류 및 레다모르파(*Ledamorpha*) 군(거위 조개갯갈(*goose barnacle*))의 종, 예를 들어 각종 레파스(*Lepas*) 및 스칼펠룸(*Scalpellum*) 종, 또는 굴등형아목 (*Balanomorpha*) 군(도토리 조개갯갈)의 종, 예를 들어 발라누스(*Balanus*) 또는 폴리스페스(*Pollicipes*) 종에 의한 오염은 선박의 마찰 저항을 증가시키고, 그 결과 에너지 소비량이 높아지고 또한 견식독(dock)에 빈번히 정박함으로써 운전비용을 현격히 증가시키게 된다.
- <608> 조류, 예를 들어 엑토카르푸스 종(*Ectocarpus sp.*) 및 세라미움 종(*Ceramium sp.*)에 의한 오염 이외에도, 만각아강(*Cirripedia*) 속명(시리페드 크루스타세아 (*cirriped crustacea*))에 속하는 고착성 절갑류(*Entomostraca*) 군에 의한 오염이 특히 중요하다.
- <609> 놀랍게도, 본 발명에 따른 활성 화합물은 단독으로 또는 다른 활성 화합물과 배합시 뛰어난 방오 작용을 갖는 것으로 밝혀졌다.
- <610> 본 발명에 따른 활성 화합물을 단독으로 또는 다른 활성 화합물과 배합하여 사용함으로써, 예를 들어 비스(트리알킬주석)설펜아이드, 트리-n-부틸주석 라우레이트, 트리-n-부틸주석 클로라이드, 산화구리(I), 트리에틸주석 클로라이드, 트리-n-부틸(2-페닐-4-클로로페녹시)주석, 트리부틸주석 옥사이드, 몰리브덴 디설펜아이드, 산화안티몬, 중합 부틸 티타네이트, 페닐-(비스피리딘)-비스무스 클로라이드, 트리-n-부틸주석 플루오라이드, 망간 에틸렌비스티오카바메이트, 아연 디메틸디티오카바메이트, 아연 에틸렌비스티오카바메이트, 2-피리딘티올 1-옥사이드의 아연 염 및 구리 염, 비스디메틸디티오카바모일아연 에틸렌비스티오카바메이트, 산화아연, 구리(I) 에틸렌-비스디티오카바메이트, 구리 티오시아네이트, 구리 나프테네이트 및 트리부틸주석 할라이드에서의 중금속을 사용하지 않을 수 있거나, 이들 화합물의 농도를 상당히 감소시키는 것이 가능하다.
- <611> 필요에 따라, 즉석-사용 방오 페인트는 추가로 다른 활성 화합물, 바람직하게는 살조제, 살진균제, 제조제, 살연체동물제 또는 다른 방오 활성 화합물을 포함할 수 있다.
- <612> 본 발명에 따른 방오 조성물과 배합하기에 바람직한 적합한 성분은 다음과 같다:
- <613> 살조제, 예를 들어 2-t-부틸아미노-4-사이클로프로필아미노-6-메틸티오-1,3,5-트리아진, 디클로로펜, 디우론, 엔도탈, 펜틴 아세테이트, 이소프로투론, 메타벤즈티아주론, 옥시플루오르펜, 퀴노클라민 및 터부트린;
- <614> 살진균제, 예를 들어 벤조[b]티오펜카복실산 사이클로헥실아מיד S,S-디옥사이드, 디클로플루아니드, 플루오르-폴렛, 3-요오도-2-프로피닐 부틸카바메이트, 톨릴플루아니드 및 아졸, 예를 들어 아자코나졸, 사이프로코나졸, 에폭시코나졸, 헥사코나졸, 메트코나졸, 프로피코나졸 및 테부코나졸;
- <615> 살연체동물제, 예를 들어 펜틴 아세테이트, 메탈알데하이드, 메티오카브, 니클로사미드, 티오디카브 및 트리메타카브; 또는
- <616> 통상적인 방오 활성 화합물, 예를 들어 4,5-디클로로-2-옥틸-4-이소티아졸린 -3-온, 디요오도메틸파라트릴 설펜, 2-(N,N-디메틸티오카바모일티오)-5-니트로티아질, 2-피리딘티올 1-옥사이드의 포타슘, 구리, 소듐 및 아연 염, 피리딘-트리페닐보란, 테트라부틸디스탄옥산, 2,3,5,6-테트라클로로-4-(메틸설펜)-피리딘, 2,4,5,6-테트라클로로이소프탈로니트릴, 테트라메틸티우람 디설펜아이드 및 2,4,6-트리클로로페닐말레이미드.
- <617> 사용된 방오 조성물은 본 발명에 따른 활성 화합물을 0.001 내지 50 중량%, 특히 0.01 내지 20 중량%의 농도로 함유한다.
- <618> 추가로, 본 발명에 따른 방오 조성물은 예를 들어 문헌 [Ungerer, *Chem. Ind.* 1985, 37, 730-732] 및 [Williams, *Antifouling Marine Coatings*, Noyes, Park Ridge, 1973]에 기술된 것과 같은 통상의 성분들을 함유한다.

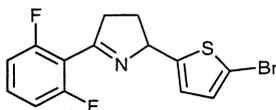
- <619> 방오 페인트는 본 발명에 따른 살조, 살진균, 살연체동물 활성 화합물 및 살충 활성 화합물 이외에, 특히 결합제를 함유한다.
- <620> 승인된 결합제의 예로 용매 시스템중의 폴리비닐 클로라이드, 용매 시스템중의 염소화 러버, 용매 시스템, 특히 수성 시스템중의 아크릴 수지, 수성 분산물 또는 유기 용매 시스템 형태의 비닐 클로라이드/비닐 아세테이트 공중합체 시스템, 부타디엔/스티렌/아크릴로니트릴 러버, 건성유, 예를 들어 아마인유, 아스팔트 및 에폭시 화합물, 타르 또는 비투멘과 배합된 개질된 경화 수지 또는 수지 에스테르, 소량의 염소 러버, 염소화 폴리프로필렌 및 비닐 수지가 있다.
- <621> 필요에 따라, 페인트는 또한 염수중에 불용성인 것이 바람직한 무기 안료, 유기 안료 또는 착색제를 포함한다. 페인트는 또한 활성 화합물이 서서히 방출되도록 콜로포늄과 같은 물질을 포함할 수 있다. 페인트는 또한 가소제, 유동성에 영향을 미치는 개질제 및 기타 통상적인 성분들을 포함할 수 있다. 본 발명에 따른 화합물 또는 상기 언급된 혼합물은 또한 자동-광택 방오 시스템에 도입될 수도 있다.
- <622> 본 발명에 따른 활성 화합물은 또한 폐쇄 공간, 예를 들어 주택, 공장 홀, 사무실, 차량 캐빈 등에 출현하는 동물 해충, 특히 곤충, 거미류 및 응애를 구제하는데 적합하다. 이들은 단독으로 또는 다른 활성 화합물 및 보조제와 배합되어 상기 해충을 구제하기 위한 가정용 살충 제품에 사용될 수 있다. 이들은 감수성 및 내성 종 및 모든 발달 단계에 대하여 활성적이다. 이러한 해충에는 다음의 것들이 포함된다:
- <623> 전갈(*Scorpionidea*)목, 예를 들어 부투스 옥키타누스(*Buthus occitanus*).
- <624> 응애(*Acarina*)목, 예를 들어 아르가스 페르시쿠스(*Argas persicus*), 아르가스 레플렉수스(*Argas reflexus*), 브리오비아 종(*Bryobia spp.*), 데르마니수스 갈리나에(*Dermanyssus gallinae*), 글리시파구스 도메스티구스(*Glyciphagus domesticus*), 오르니토도루스 모우바트(*Ornithodoros moubat*), 리피세팔루스 산퀴네우스(*Rhipicephalus sanguineus*), 트롬비쿨라 알프레드두게시(*Trombicula alfreddugesi*), 네우트롬비쿨라 아우툼날리스(*Neutrombicula autumnalis*), 데르마토파고이드스 프테로니시무스(*Dermatophagoides pteronissimus*), 데르마토파고이드스 포리나에(*Dermatophagoides forinae*).
- <625> 진정거미(*Araneae*)목, 예를 들어 아비쿨라리다에(*Aviculariidae*), 아라네이다(*Araneidae*)
- <626> 장님거미목(*Opiliones*)목, 예를 들어 슈도스코르피오네스 첼리퍼 (*Pseudoscorpiones chelifer*), 슈도스코르피오네스 체이리디움(*Pseudoscorpiones cheiridium*), 오피리오네스 팔랑기움(*Opiliones phalangium*).
- <627> 쥐며느리(*Isopoda*)목, 예를 들어 오니스쿠스 아셀루스(*Oniscus asellus*), 포르셀리오 스카베르(*Porcellio scaber*).
- <628> 노래기(*Diplopoda*)목, 예를 들어 블라니올루스 구틀라투스(*Blaniulus guttulatus*), 폴리데스무스 종(*Polydesmus spp.*).
- <629> 지네(*Chilopoda*)목, 예를 들어 게오필루스 종(*Geophilus spp.*).
- <630> 쯤(*Zygentoma*)목, 예를 들어 크테노레피스마 종(*Ctenolepisma spp.*), 레피스마 사카리나(*Lepisma saccharina*), 레피스모데스 인킬리누스(*Lepismodes inquilinus*).
- <631> 바퀴(*Blattaria*)목, 예를 들어 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*), 블라텔라 게르마니카(*Blattella germanica*), 블라텔라 아사히나이(*Blattella asahinai*), 류코파에아 마데라에(*Leucophaea maderae*), 판클로라 종(*Panchlora spp.*), 파르크블라타 종(*Parcoblatta spp.*), 페리플라네타 아우스트랄라시아 (*Periplaneta australasiae*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 페리플라네타 브룬네아(*Periplaneta brunnea*), 페리플라네타 플리기노사 (*Periplaneta fuliginosa*), 수펠라 롱기팔파(*Supella longipalpa*).
- <632> 메뚜기(*Saltatoria*)목, 예를 들어 아케타 도메스티쿠스(*Acheta domesticus*).
- <633> 짐게벌레(*Dermaptera*)목, 예를 들어 포르피쿨라 아우리쿨라리아(*Forficula auricularia*).
- <634> 흰개미(*Isoptera*)목, 예를 들어 칼로테르메스 종(*Kaloterms spp.*), 레티쿨리테르메스 종(*Reticulitermes spp.*).
- <635> 다듬이벌레(*Psocoptera*)목, 예를 들어 레피나투스 종(*Lepinatus spp.*), 리포셀리스 종(*Liposcelis spp.*).
- <636> 딱정벌레(*Coleoptera*)목, 예를 들어 안트레누스 종(*Anthrenus spp.*), 아타게누스 종(*Attagenus spp.*), 더메스

테스 종(*Dermestes spp.*), 라테티쿠스 오리자에(*Latheticus oryzae*), 네크로비아 종(*Necrobia spp.*), 프티누스 종(*Ptinus spp.*), 리조페르타 도미니카(*Rhizopertha dominica*), 시토피루스 그라나리우스 (*Sitophilus granarius*), 시토피루스 오리자에(*Sitophilus oryzae*), 시토피루스 제아마이스(*Sitophilus zeamais*), 스테고비움 파니세움(*Stegobium paniceum*).

- <637> 파리(*Diptera*)목, 예를 들어 아에테스 아에깃티(*Aedes aegypti*), 아에테스 알보픽투스(*Aedes albopictus*), 아에테스 타에니오린쿠스(*Aedes taeniorhynchus*), 아노펠레스 종(*Anopheles spp.*), 칼리포라 에리트로세팔라(*Calliphora erythrocephala*), 크리소조나 플루비알리스(*Chrysozona pluvialis*), 쿨렉스 퀸쿠에파시아투스(*Culex quinquefasciatus*), 쿨렉스 피피엔스(*Culex pipiens*), 쿨렉스 타르살리스(*Culex tarsalis*), 드로스필라 종(*Drosophila spp.*), 판니아 카니쿨라리스 (*Fannia canicularis*), 무스카 도메스티카(*Musca domestica*), 플레보토무스 종(*Phlebotomus spp.*), 사르코파가 카르나리아(*Sarcophaga carnaria*), 시물리움 종(*Simulium spp.*), 스토목시스 칼시트란스(*Stomoxys calcitrans*), 티풀라 팔루도사(*Tipula paludosa*).
- <638> 나비(*Lepidoptera*)목, 예를 들어 아크로이아 그리셀라(*Achroia grisella*), 갈레리아 멜로넬라(*Galleria mellonella*), 플로디아 인터푼크텔라(*Plodia interpunctella*), 티네아 클로아셀라(*Tinea cloacella*), 티네아 펠리오넬라(*Tinea pellionella*), 티네올라 비셀리엘라(*Tineola bisselliella*).
- <639> 벼룩(*Siphonaptera*)목, 예를 들어 크테노세팔리데스 카니스(*Ctenocephalides canis*), 크테노세팔리데스 펠리스(*Ctenocephalides felis*), 풀렉스 이리탄스(*Pulex irritans*), 툽가 페네트란스(*Tunga penetrans*), 크세노프실라 케오피스(*Xenopsylla cheopis*).
- <640> 벌(*Hymenoptera*)목, 예를 들어 캄포노투스 헤르쿨레아누스(*Camponotus herculeanus*), 라시우스 풀리기노수스(*Lasius fuliginosus*), 라시우스 니거(*Lasius niger*), 라시우스 움브라투스(*Lasius umbratus*), 모노모리움 파라오니스(*Monomorium pharaonis*), 파라베스풀라 종(*Paravespula spp.*), 테트라모리움 카에스피툼(*Tetramorium caespitum*).
- <641> 이(*Anoplura*)목, 예를 들어 페디쿨루스 푸마누스 카피티스(*Pediculus humanus capitis*), 페디쿨루스 푸마누스 코르포리스(*Pediculus humanus corporis*), 프티루스 푸비스(*Pthirus pubis*).
- <642> 이시아(*Heteroptera*)목, 예를 들어 시멕스 헤미프테루스(*Cimex hemipterus*), 시멕스 렉투라리우스(*Cimex lectularius*), 로드니우스 프롤릭수스(*Rhodnius prolixus*), 트리아토마 인페스탄스(*Triatoma infestans*).
- <643> 가정용 살충제 분야에서, 이들은 단독으로 또는 다른 적합한 활성 화합물, 예를 들어 인산 에스테르, 카바메이트, 피레트로이드, 성장 조절제 또는 기타 공지된 살충제 그룹으로부터 선택된 활성 화합물과 배합 사용된다.
- <644> 이들은 에어졸, 무압 스프레이 제품, 예를 들어 펌프 및 아토마이저 (atomizer) 스프레이, 자동 분사 시스템, 분사기(fogger), 포움, 젤, 셀룰로오스 또는 중합체로 제조된 증발 정제, 액체 증발제, 젤 및 막 증발제를 구비한 증발 제품, 추진제-작동 증발기, 무에너지 또는 수동 증발 시스템, 모스 페이퍼(moth paper), 모스 백(bag) 및 모스 겔로서, 살포용 미끼 또는 유인 장소에서 과립 또는 분제로서 사용된다.
- <645> 본 발명에 따른 물질의 제조에 및 사용예가 이후 실시예로 예시된다.

<646> **제조 실시예**

<647> **실시예 1**



- <648>
- <649> 트리플루오로아세트산(5 ml)를 먼저 5 °C에서 도입하였다. 디클로로메탄(10 ml)중 t-부틸-1-(5-브로모-2-티에닐)-4-(2,6-디플루오로페닐)-4-옥소부틸카바메이트(II-1)(1.50 g, 3.1 밀리몰)의 용액을 적가하였다. 이 혼합물을 실온으로 가온하고 이 온도에서 추가로 3 시간동안 교반하였다. 액상을 감압하에 농축시키고 잔류물을 에틸 아세테이트(50 ml)에 용해시켰다. 유기 용액을 1N 수산화나트륨 수용액(50 ml)로 세척하고 여과 및 농축시켰다.
- <650> 이로써, 2-(5-브로모-2-티에닐)-5-(2,6-디플루오로페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤 0.85 g(이론치의 75%)을 수득

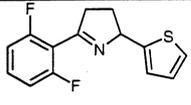
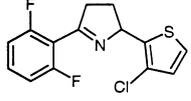
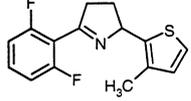
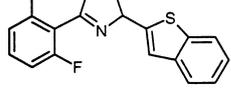
하였다.

<651> HPLC: logP(pH 2.3)=3.45(93% 순도)

NMR (CDCl<sub>3</sub>): δ= 2.05 (1H, m), 2.57 (1H, m), 3.08 (2H, m), 5.50 (1H, m), 6.76

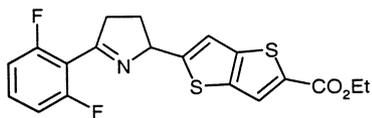
<652> (1H, d), 6.92 (1H, d), 6.97 (2H, m), 7.35 (1H, m) ppm.

<653> 하기 화합물을 실시예 1과 유사하게 수득하였다:

번호	화합물	log P (pH 2.3)	<sup>1</sup> H-NMR (δ, ppm)
2		1.95	(CDCl <sub>3</sub> ) 1.90 (1H, m), 2.55 (1H, m), 3.01 (2H, m), 5.51 (1H, m), 7.02 (2H, d), 7.22 (2H, m), 7.42 (1H, m), 7.56 (1H, m)
3		3.34	(CD <sub>3</sub> CN) 1.87 (1H, m), 2.69 (1H, m), 3.08 (2H, m), 5.57 (1H, m), 6.98 (1H, d), 7.08 (2H, m), 7.34 (1H, d), 7.48 (1H, m)
4		2.34	
5		3.11	(CDCl <sub>3</sub> ) 2.00 (1H, m), 2.63 (1H, m), 3.07 (2H, m), 5.70 (1H, m), 6.94 (2H, m), 7.19-7.37 (4H, m), 7.76 (1H, d), 7.83 (1H, d)

<654>

<655> **실시예 6**



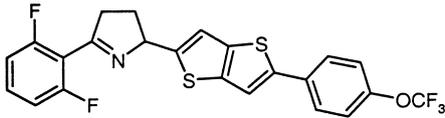
<656>

<657> 에틸 5-[1-[(t-부톡시카보닐)아미노]-4-(2,6-디플루오로페닐)-4-옥소부틸]티에노[3,2-b]티오펜-2-카복실레이트 (II-6) 1.1 g(2.16 밀리몰)을 15 ml의 디클로로메탄에 용해시키고, 0 °C에서 15 ml의 트리플루오로아세트산에 적가하였다. 이 혼합물을 0 °C에서 추가로 30 분동안 교반한 다음 100 ml의 물을 가했다. 이 혼합물을 디클로로메탄으로 3 회 추출하였다. 유기상을 모아 물로 2 회 및 진한 염화나트륨 용액으로 1 회 세척하여 황산나트륨상에서 건조시켰다. 그 후, 사이클로헥산/에틸 아세테이트(2:1)을 사용하여 혼합물을 3 g의 실리카 겔 카트리지를 통해 여과하고, 용매를 감압하에 제거하였다. 오렌지색 오일을 약 20 ml의 메틸 t-부틸 케톤으로부터 재결정화시켰다.

<658> 이로써, 약간 누르스름한 결정의 형태로 에틸 5-[5-(2,6-디플루오로페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤-2-일]티에노[3,2-b]티오펜-2-카복실레이트 0.26 g(이론치의 38%)을 수득하였다.

<659> 융점: 107 °C

<660> 실시예 7



<661>

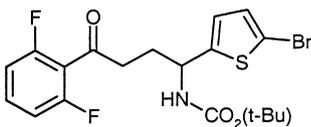
<662> t-부틸 4-(2,6-디플루오로페닐)-4-옥소-1-(5-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]티에노[3,2-b]티엔-2-일)부틸카바메이트(II-7) 350 mg(0.58 밀리몰)을 5 ml의 디클로로메탄에 용해시키고, 0 °C에서 5 ml의 트리플루오로아세트산 및 15 ml의 디클로로메탄의 용액에 적가하였다. 이 반응 혼합물을 5 분간 교반한 다음 100 ml의 빙수내에서 교반하였다. 유기상을 분리하고, 수성상을 디클로로메탄으로 1 회 추출하여 유기상을 모았다. 유기상을 물로 다시 한번 세척하고 황산나트륨 상에서 건조시킨 다음 농축하였다. 그 후, 조 생성물을 카트리지 크로마토그래피에 의해 2 회 정제하였다(1. 사이클로헥산/에틸 아세테이트 - 2. 디클로로메탄/사이클로헥산 구배).

<663> 이로써, 황색 고체의 형태로 5-(2,6-디플루오로페닐)-2-(5-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]티에노[3,2-b]티엔-2-일)-3,4-디하이드로-2H-피롤 0.077 g(이론치의 28%)을 수득하였다.

<664> 융점: 135 °C

<665> 일반식 (II)의 출발물질

<666> 실시예 (II-1)



<667>

<668> 아르곤 대기하에, 1,3-디플루오로벤젠(18.20 g, 0.16 몰)을 -65 °C에서 먼저 테트라하이드로푸란(100 ml)에 도입하였다. n-부틸리튬(100 ml, 헥산중 1.6 M, 0.16 몰)을 적가하고, 반응 혼합물을 -65 °C에서 추가로 30 분간 교반하였다. 테트라하이드로푸란(250 ml)중 t-부틸 2-(5-브로모-2-티에닐)-5-옥소-1-피롤리딘카복실레이트(IX-1)(41.50 g, 0.12 몰)를 적가한 다음, 반응 혼합물을 16 시간에 걸쳐 실온으로 가온시켰다. 반응 혼합물을 물(500 ml)내로 교반시키고 에틸 아세테이트로 추출하였다(2×400 ml). 유기상을 모아 황산나트륨상에서 건조시키고 여과 및 농축하였다.

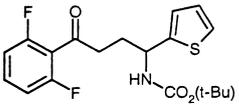
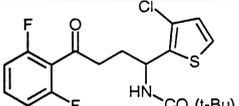
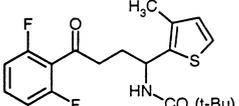
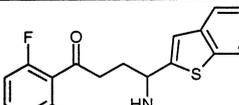
<669> 이로써, t-부틸 1-(5-브로모-2-티에닐)-4-(2,6-디플루오로페닐)-4-옥소부틸카바메이트 45.80 g(이론치의 76%)을 수득하였다.

<670> HPLC: logP(pH 2.3)=4.29(95% 순도)

NMR (CDCl<sub>3</sub>): δ = 1.42 (9H, s), 2.26 (2H, m), 2.99 (2H, m), 4.84 (2H, br), 6.72 (1H, d), 6.90 (1H, d), 6.96 (2H, m), 7.39 (1H, m) ppm.

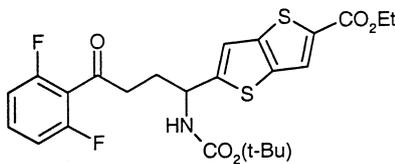
<671>

<672> 하기 화합물을 실시예 (II-1)과 유사하게 수득하였다:

번호	화합물	log P (pH 2.3)	<sup>1</sup> H-NMR (δ, ppm)
II-2		4.48	(CDCl <sub>3</sub> ) 1.42 (9H, s), 2.31 (2H, m), 2.99 (2H, m), 4.86 (1H, br), 4.98 (1H, br), 6.80-6.95 (3H, m), 7.15-7.25 (3H, m)
II-3		4.28	(CD <sub>3</sub> CN) 1.36 (9H, s), 2.15 (2H, m), 2.96 (2H, m), 4.95 (1H, m), 5.85 (1H, br), 6.90 (1H, d), 7.08 (2H, m), 7.35 (1H, d), 7.51 (1H, m)
II-4		4.27	
II-5		4.20	(CDCl <sub>3</sub> ) 1.41 (9H, s), 2.42 (2H, m), 3.07 (2H, m), 4.80 (1H, br), 5.15 (1H, br), 6.94 (2H, m), 7.39 (4H, m), 7.89 (2H, m)

<673>

<674> **실시예 (II-6)**



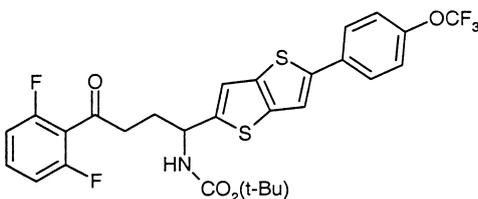
<675>

<676> 아르곤하에, 1,3-디플루오로벤젠 0.35 g(3.06 밀리몰/1.1 당량)을 20 ml의 테트라하이드로푸란에 용해시켰다. -65 °C에서, 부틸리튬 용액(헥산중 23%) 1.2 ml를 적가하였다. 반응 혼합물을 -30 °C에서 10 분간 교반하였다. 그 후, 20 ml의 테트라하이드로푸란중 t-부틸 2-[5-(에톡시카보닐)티에노[3,2-b]티엔-2-일]-5-옥소-1-피롤리딘카복실레이트(IX-6) 1.10 g(2.78 밀리몰)의 용액을 적가하고, 이 혼합물을 -20 °C에서 추가로 30 분간 교반하였다. 이 혼합물을 실온으로 가온시키고, 30 분후 차가운 물 120 ml내로 교반시키고 메틸 t-부틸 케톤으로 추출하였다. 유기상을 물 및 진한 염화나트륨 용액으로 각각 한 번씩 세척하고 황산나트륨상에서 건조시키고 농축하였다. 조 생성물을 3 g의 실리카 겔 카트리지를 통해 여과하였다(이동상 디클로로메탄).

<677> 이로써, 갈색 겔로서 에틸 5-[1-[(t-부톡시카보닐)아미노]-4-(2,6-디플루오로페닐-4-옥소부틸)티에노[3,2-b]티오펜-2-카복실레이트 1.15 g(이론치의 81%)을 수득하였다.

<678> 융점: 104 °C

<679> **실시예 (II-7)**



<680>

<681> 아르곤하에, 1,3-디플루오로벤젠 184 mg(1.62 밀리몰/1.1 당량)을 20 ml의 테트라하이드로푸란에 용해시키고,

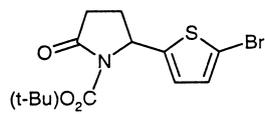
-65 °C에서 부틸리튬 용액(헥산중 23%) 0.7 ml를 적가하였다. 반응 혼합물을 -30 °C에서 10 분간 교반하였다. 그 후, 5 ml의 테트라하이드로푸란중 t-부틸 2-옥소-5-{5-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]티에노 [3,2-b]티엔-2-일}-1-피롤리딘카복실레이트(IX-7) 710 mg(1.47 밀리몰)의 용액을 적가하고, 이 혼합물을 -20 °C에서 30 분간 교반하였다. 이 혼합물을 실온으로 가온시키고, 아르곤하에 30 분후 물 60 ml로 희석하고 메틸 t-부틸 케톤으로 추출하였다. 유기상을 물 및 진한 염화나트륨 용액으로 각각 한 번씩 세척하고 황산나트륨상에서 건조시키고 농축하였다. 조 생성물을 이동상 디클로로메탄을 사용하여 3 g의 실리카 겔 카트리지를 통해 여과하였다.

<682> 이로써, 황색 고체로서 t-부틸 4-(2,6-디플루오로페닐)-4-옥소-1-{5-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]티에노[3,2-b]티엔-2-일}부틸카바메이트 0.24 g(이론치의 28%)을 수득하였다.

<683> 융점: 128-130 °C

<684> **일반식 (IX)의 출발물질**

<685> **실시예 (IX-1)**



<686> <687> 0 °C에서, 5-(5-브로모-2-티에닐)-2-피롤리디논(XI-1)(3.2-6 g, 94% 순도, 약 0.012 몰)을 먼저 디클로로메탄 (65 ml)에 도입하였다. 디-t-부틸 디카보네이트 (3.00 g, 0.014 몰) 및 4-디메틸아미노피리딘(92 mg, 0.75 밀리몰)을 연속적으로 첨가하였다. 이 혼합물을 실온에서 24 시간동안 교반한 후, 추가의 디-t-부틸 디카보네이트(0.65 g, 3.0 밀리몰) 및 4-디메틸아미노피리딘(10 mg, 0.08 밀리몰)을 가했다. 이 혼합물을 추가로 4 시간동안 교반하였다. 유기 용액을 1N 염산, 중탄산나트륨 포화 수용액, 물 및 염화나트륨 용액으로 연속적으로 세척하고 황산나트륨상에서 건조시킨 다음 여과 및 농축시켰다.

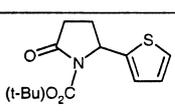
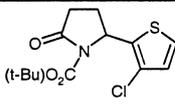
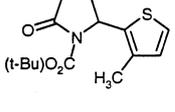
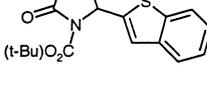
<688> 이로써, t-부틸 2-(5-브로모-2-티에닐)-5-옥소-1-피롤리딘카복실레이트 4.10 g(이론치의 95%)을 수득하였다.

<689> HPLC: logP(pH 2.3)=3.03(96% 순도)

<690> 융점: 93 °C

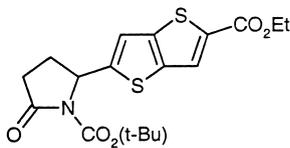
<691> NMR (CDCl<sub>3</sub>): δ = 1.43 (9H, s), 2.03-2.09 (1H, m), 2.43-2.58 (2H, m), 2.75 (1H, m) 5.37 (1H, m), 6.72 (1H, d), 6.92 (1H, d) ppm.

<692> 하기 화합물을 실시예 (IX-1)과 유사하게 수득하였다:

번호	화합물	m.p.	log P	<sup>1</sup> H-NMR (δ, ppm)
IX-2			2.39 (pH 2.3)	(CDCl <sub>3</sub> ) 1.39 (9H, s), 2.05-2.12 (1H, m), 2.48-2.58 (2H, m), 2.77 (1H, m) 5.47 (1H, m), 6.95 (2H, m), 7.23 (1H, m)
IX-3			2.77 (pH 7.5)	(CDCl <sub>3</sub> ) 1.36 (9H, s), 2.00 (1H, m), 2.47-2.60 (2H, m), 2.70-2.80 (1H, m) 5.55 (1H, m), 6.91 (1H, d), 7.21 (1H, d)
IX-4			2.65 (pH 2.3)	(CDCl <sub>3</sub> ) 1.36 (9H, s), 1.98 (1H, m), 2.48-2.59 (2H, m), 2.77 (1H, m) 5.55 (1H, m), 6.91 (1H, d), 7.21 (1H, d)
IX-5		171°C	3.03 (pH 2.3)	(CD <sub>3</sub> CN) 1.20 (9H, s), 1.93 (1H, m), 2.45-2.63 (3H, m), 5.60 (1H, m), 7.30 (1H, s) 7.42 (2H, m), 7.82 (1H, d), 7.95 (1H, d)

<693>

<694> 실시예 (IX-6)



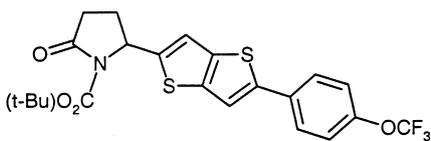
<695>

<696> 아르곤하에, 에틸 5-(5-옥소-2-피롤리디닐)티에노[3,2-b]티오펜-2-카복실레이트(XI-6) 2.00 g(6.77 밀리몰)을 디클로로메탄 40 ml에 용해시키고, 0 °C에서 디-t-부틸 디카보네이트 3.00 g(13.7 밀리몰/2 당량), 4-디메틸아미노피리딘 0.84 g(6.9 밀리몰/1.02 당량) 및 트리에틸아민 9.0 ml를 연속적으로 첨가하였다. 이 혼합물을 0 °C에서 60 분간 교반하였다. 이 혼합물을 60 ml의 디클로로메탄으로 희석하고 수성 염산(0.25 N) 100 ml로 각각 2 회, 물로 1 회 및 진한 염화나트륨 용액으로 1 회 세척하고 황산나트륨상에서 건조시킨 다음 농축하였다. 그 후, 약 40 °C에서, 조 생성물을 10 ml의 메틸 t-부틸 케톤에서 교반하고 흡인여과한 다음 건조시켰다.

<697> 이로써, 밝은 갈색 고체로서 t-부틸 2-[5-(에톡시카보닐)티에노[3,2-b]티엔-2-일]-5-옥소-1-피롤리딘카복실레이트 2.3 g(이론치의 86%)을 수득하였다.

<698> 융점: 178 °C

<699> 실시예 (IX-7)



<700>

<701> 아르곤하에, 5-[5-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]티에노[3,2-b]티엔-2-일]-2-피롤리딘(XI-7) 6.6 g(8.94 밀리몰, 52% 순도)을 120 ml의 디클로로메탄에 용해시키고, 디-t-부틸 디카보네이트 7.5 g(34.2 밀리몰/2 당량), 4-디메틸아미노피리딘 2.2 g(17.5 밀리몰/1.02 당량) 및 트리에틸아민 23 ml를 0 °C에서 연속적으로 첨가하였다. 이 혼합물을 0 °C에서 추가로 2 시간동안 교반하였다. 이 혼합물을 60 ml의 디클로로메탄으로 희석하고 수성

염산(0.25 N) 50 ml로 각각 2 회, 물로 1 회 및 진한 염화나트륨 용액으로 1 회 세척하고 황산나트륨상에서 건조시켰다. 생성된 용액을 디클로로메탄을 사용하여 실리카 겔을 통해 여과하고 용매를 제거하였다.

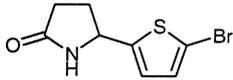
<702> 이로써, 회색 고체 형태로 t-부틸 2-옥소-5-{5-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]티에노[3,2-b]티엔-2-일}-1-피롤리딘카복실레이트 4.1 g(이론치의 95%)을 수득하였다.

<703> 용점: 164 °C

<704> **일반식 (XI)의 출발물질**

<705> **실시예 (XI-1)**

<706>



<707> 빙초산(15 ml) 및 진한 황산(5 ml)의 혼합물을 먼저 도입하고 0 °C으로 냉각시켰다. 5-에톡시-피롤리딘-2-온(3.04 g, 85% 순도, 약 0.02 몰) 및 2-브로모티오펜(13.12 g, 0.08 몰)을 연속적으로 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 천천히 가온한 다음 이 온도에서 60 시간동안 교반하였다. 혼합물을 빙수에 붓고 에틸 아세테이트로 추출하였다. 유기상을 중탄산나트륨 포화 수용액, 물 및 염화나트륨 수용액으로 연속적으로 세척하고 황산나트륨상에서 건조시킨 다음 여과 및 농축하였다.

<708> 이로써, 5-(5-브로모-2-티에닐)-2-피롤리돈 3.94 g(이론치의 75%)을 수득하였다.

<709> HPLC: logP(pH 2.3)=1.62(94% 순도)

<710> 용점: 104 °C

NMR (CDCl<sub>3</sub>): δ = 2.10 (1H, m), 2.34-2.66 (3H, m), 4.94 (1H, m), 6.01 (1H, br), 6.75 (1H, d), 6.91 (1H, d) ppm.

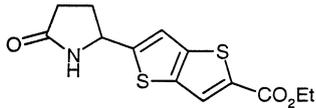
<711>

<712> 하기 화합물을 실시예 (XI-1)과 유사하게 수득하였다:

번호	화합물	m.p. (°C)	log P (pH 2.3)	<sup>1</sup> H-NMR (δ, ppm)
XI-2		111	1.03	(CDCl <sub>3</sub> ) 2.14 (1H, m), 2.36-2.63 (3H, m), 5.04 (1H, m), 6.15 (1H, br), 6.98 (2H, m), 7.26 (1H, m)
XI-3		122	1.41	(CDCl <sub>3</sub> ) 2.14 (1H, m), 2.38-2.73 (3H, m), 5.16 (1H, m), 6.00 (1H, br), 6.91 (1H, d), 7.25 (1H, d)
XI-4		104	1.33	(CDCl <sub>3</sub> ) 2.12 (1H, m), 2.44-2.60 (3H, m), 5.10 (1H, m), 6.15 (1H, br), 6.81 (1H, d), 7.25 (1H, d)
XI-5		115	1.73	(CD <sub>3</sub> CN) 2.03 (1H, m), 2.33 (2H, m), 2.66 (1H, m), 5.14 (1H, m), 6.45 (1H, br), 7.42 (3H, m), 7.83 (1H, d), 7.94 (1H, d)

<713>

<714> 실시예 (XI-6)



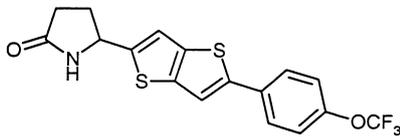
<715>

<716> 5-에톡시-2-피롤리디논 1.2 g(9.42 밀리몰)을 먼저 빙초산 15 ml 및 진한 황산 5 ml에 먼저 도입하였다. 10 ℃이하의 온도에서, 에틸 티에노[3,2-b]티오펜-2-카복실레이트 1.0 g(4.71 밀리몰)을 첨가하고, 이 혼합물을 실온에서 추가로 40 시간동안 교반하였다. 혼합물을 차가운 물 150 ml내로 교반하고 디클로로메탄 25 ml로 각각 3 회 추출하였다. 유기상을 모아 물로 2 회 및 진한 염화나트륨 용액으로 1 회 세척하고, 건조 및 농축시켰다 황색 조 생성물을 약 20 ml의 메틸 t-부틸 케톤에서 교반하였다. 잔류물을 흡인여과 및 건조시켰다.

<717> 이로써, 크림색 결정의 형태로 에틸 5-(5-옥소-2-피롤리디닐)티에노[3,2-b]티오펜-2-카복실레이트 1.0 g(이론치의 72%)을 수득하였다.

<718> 융점: 140 ℃

<719> 실시예 (XI-7)



<720>

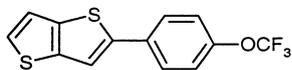
<721> 5-에톡시-2-피롤리디논 5.3 g(40.6 밀리몰)을 먼저 빙초산 80 ml 및 진한 황산 27 ml에 먼저 도입하였다. 10 ℃이하의 온도에서, 2-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]티에노[3,2-b]티오펜(XIII-1) 6.1 g(20.3 밀리몰)을 가하고, 이 혼합물을 실온에서 추가로 16 시간동안 교반하였다. 혼합물을 차가운 물 300 ml내로 교반하고 디클로로메탄 60 ml로 각각 3 회 추출하였다. 유기상을 모아 물로 2 회 및 진한 염화나트륨 용액으로 1 회 세척하고, 황산나트륨상에서 건조시킨 다음 농축하였다 그 후, 조 생성물을 약 40 ℃에서 60 ml의 메틸 t-부틸 케톤에서 교반하고, 냉각, 흡인여과 및 건조시켰다.

<722> 이로써, 밝은 회색 고체로서 5-(5-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]티에노[3,2-b]티엔-2-일)-2-피롤리디논 6.8 g (이론치의 87%)을 수득하였다.

<723> 융점: 220 ℃ (분해)

<724> 일반식 (XIII)의 출발물질

<725> 실시예 (XIII-1)



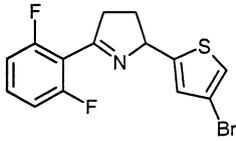
<726>

<727> 아르곤하에, 2-브로모티에노[3,2-b]티오펜 29.0 g(25.5 밀리몰)을 150 ml의 테트라하이드로푸란에 용해시키고, 4-트리플루오로메톡시페닐보론산 10.0 g(48.5 밀리몰) 및 테트라키스(트리페닐포스핀)-팔라듐(0) 0.8 g(0.7 밀리몰)을 실온에서 첨가한 다음, 이 혼합물을 1 시간동안 환류에서 가열하였다. 그 후, 추가의 4-트리플루오로메톡시페닐보론산 2.0 g 및 테트라키스(트리페닐포스핀)-팔라듐(0) 0.2 g을 첨가하고, 이 혼합물을 추가로 16 시간동안 환류에서 가열하였다. 그 후, 이 온도에서 총 100 ml의 20% 세기의 탄산나트륨 수용액을 적가하고, 혼합물을 1 시간동안 환류에서 가열하였다. 반응 혼합물을 400 ml의 물로 희석하고 메틸 t-부틸 케톤 100 ml로 각각 3 회 추출하였다. 유기상을 모아 물 및 진한 염화나트륨 용액으로 각각 1 회씩 세척하고, 황산나트륨상에서 건조시킨 다음 농축하였다. 조 생성물을 약 25 g의 실리카 겔상에서 흡수시킨후 이동상 n-헥산을 사용하여 플래쉬 크로마토그래피에 의해 정제하였다.

<728> 이로써, 백색 고체 형태로 2-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]티에노[3,2-b]티오펜 6.2 g(이론치의 81%)을 수득하였다.

<729> 융점: 162 °C

<730> **실시예 8**



<731>

<732> 4-아지도-4-(4-브로모-2-티에닐)-1-(2,6-디플루오로페닐)-1-부타논(III-1) (1.63 g, 42% 순도, 약 1.79 밀리몰)을 먼저 n-헥산(100 ml)에 도입하였다. 실온에서, 트리페닐포스핀(0.65 g, 2.50 밀리몰)을 한번에 조금씩 첨가하였다. 혼합물을 실온에서 추가로 16 시간동안 교반하였다. 플로리실(5 g)을 가하고 혼합물을 농축하여 건조시켰다. 조 생성물을 실리카 겔 크로마토그래피(이동상: 사이클로헥산/에틸 아세테이트 9:1→7:3)에 의해 정제하였다.

<733> 이로써, 2-(4-브로모-2-티에닐)-5-(2,6-디플루오로페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤 0.15 g(이론치의 37%)을 수득하였다.

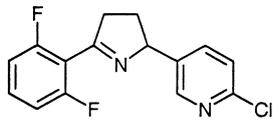
<734> HPLC: logP(pH 2.3)=3.41(100% 순도)

NMR (CD<sub>3</sub>CN): δ = 1.95 (1H, m), 2.60 (1H, m), 3.05-3.08 (2H, m), 5.47 (1H, m), 6.96 (1H, s), 7.07 (2H, m), 7.27 (1H, s), 7.44-7.47 (1H, m) ppm.

<735>

<736> 추가의 배치(0.15 g, 78% 순도)를 또한 분리하였다.

<737> **실시예 9**



<738>

<739> 4-아지도-4-(6-클로로-3-피리디닐)-1-(2,6-디플루오로페닐)-1-부타논(III-2) (1.20 g, 54.4% 순도, 1.94 밀리몰)을 먼저 n-헥산(100 ml)에 도입하였다. 실온에서, 트리페닐포스핀(0.94 g, 3.56 밀리몰)을 한번에 조금씩 첨가하였다. 혼합물을 실온에서 추가로 16 시간동안 교반하였다. 플로리실(7 g)을 가한 다음 반응 혼합물을 증발시켜 건조시켰다. 조 생성물을 실리카 겔 크로마토그래피(이동상: 사이클로헥산/에틸 아세테이트 9:1→7:3)에 의해 정제하였다.

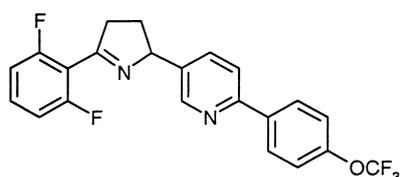
<740> 이로써, 2-(6-클로로-3-피리디닐)-5-(2,6-디플루오로페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤 0.47 g(이론치의 83%)을 수득하였다.

<741> HPLC: logP(pH 2.3)=1.93(100% 순도)

NMR (CD<sub>3</sub>CN): δ = 1.77-1.84 (1H, m), 2.60-2.66 (1H, m), 3.05-3.09 (2H, m), 5.32 (1H, m), 7.07 (2H, m), 7.38 (1H, d), 7.47 (1H, m), 7.69 (1H, dd), 8.37 (1H, d) ppm.

<742>

<743> **실시예 10**



<744>

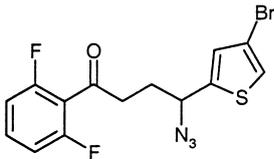
<745> 4-아지도-1-(2,6-디플루오로페닐)-4-{6-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-3-피리디닐}-1-부타논(III-3) (0.80 g, 1.73 밀리몰)을 먼저 n-헥산(100 ml)에 도입하였다. 트리페닐포스핀(0.45 g, 1.73 밀리몰)을 첨가하였다. 혼합물을 실온에서 추가로 16 시간동안 교반하였다. 플로리실(5 g)을 가하고 반응 혼합물을 농축하였다. 조 생성물을 실리카 겔 크로마토그래피(이동상: 헥산/에틸 아세테이트 9:1→4:1)에 의해 정제하였다.

<746> 이로써, 5-[5-(2,6-디플루오로페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤-2-일]-2-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]피리딘 0.42 g(이론치의 50%)을 수득하였다.

<747> HPLC: logP(pH 2.3)=3.50(86% 순도)

<748> **일반식 (III)의 출발물질**

<749> **실시예 (III-1)**



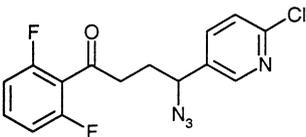
<750> 4-(4-브로모-2-티에닐)-4-클로로-1-(2,6-디플루오로페닐)-1-부타논(XV-1) (0.95 g, 84.65% 순도, 약 2.1 밀리몰)을 먼저 아세톤(4 ml)에 도입하였다. 물(100 ml)중 소듐 아지드(0.25 g, 3.75 밀리몰)의 용액 및 메틸 트리-n-옥틸암모늄 클로라이드(0.30 g, 0.74 밀리몰)를 연속적으로 가했다. 이 혼합물을 50 °C에서 추가로 16 시간동안 교반하였다. 물(30 ml)을 첨가한 다음 반응 혼합물을 에틸 아세테이트(2×50 ml)로 추출하였다. 유기상을 모아 황산나트륨상에서 건조시키고 여과 및 농축하였다. 조 생성물을 추가의 정제없이 반응시켰다.

<752> 이로써, 4-아지도-4-(4-브로모-2-티에닐)-1-(2,6-디플루오로페닐)-1-부타논 1.63 g(이론치의 85%)을 수득하였다.

<753> HPLC: logP(pH 2.3)=3.00(42% 순도)

<754>  $\tilde{\nu}_{\text{아지드}}$ : 2090  $\text{cm}^{-1}$

<755> **실시예 (III-2)**



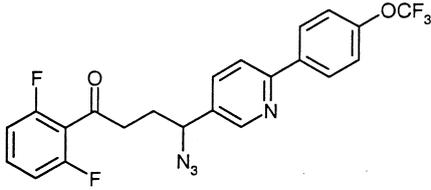
<756> 4-(6-클로로-3-피리디닐)-4-클로로-1-(2,6-디플루오로페닐)-1-부타논(XV-2) (1.30 g, 57.6% 순도, 2.27 밀리몰)을 먼저 아세톤(7.5 ml)에 도입하였다. 물(15 ml)중 소듐 아지드(0.38 g, 5.90 밀리몰)의 용액 및 메틸 트리-n-옥틸암모늄 클로라이드(0.30 g, 0.74 밀리몰)를 연속적으로 가했다. 이 혼합물을 50 °C에서 추가로 16 시간동안 교반하였다. 물(30 ml)을 첨가한 다음 반응 혼합물을 에틸 아세테이트(2×50 ml)로 추출하였다. 유기상을 모아 황산나트륨상에서 건조시키고 여과 및 농축하였다. 조 생성물을 추가의 정제없이 반응시켰다.

<758> 이로써, 4-아지도-4-(6-클로로-3-피리디닐)-1-(2,6-디플루오로페닐)-1-부타논 1.20 g(이론치의 85%)을 수득하였다.

<759> HPLC: logP(pH 2.3)=3.33(54% 순도)

<760>  $\tilde{\nu}_{\text{아지드}}$ : 2080  $\text{cm}^{-1}$

<761> 실시예 (III-3)



<762>

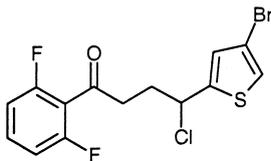
<763> 4-클로로-1-(2,6-디플루오로페닐)-4-{6-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-3-피리디닐}-1-부탄논(XV-3) (0.81 g, 1.78 밀리몰)을 먼저 아세톤(5 ml)에 도입하였다. 물(10 ml)중 소듐 아지드(0.17 g, 2.67 밀리몰)의 용액 및 메틸 트리-n-옥틸암모늄 클로라이드를 연속적으로 가했다. 이 혼합물을 50 °C에서 추가로 16 시간동안 교반하였다. 물을 첨가한 다음 반응 혼합물을 에틸 아세테이트로 2 회 추출하였다. 유기상을 모아 황산나트륨상에서 건조시키고 여과 및 농축하였다.

<764> 이로써, 4-아지도-1-(2,6-디플루오로페닐)-4-{6-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-3-피리디닐}-1-부탄논 0.80 g(이론치의 61%)을 수득하였다.

<765> HPLC: logP(pH 2.3)=4.78(63% 순도)

<766> 일반식 (XV)의 출발물질

<767> 실시예 (XV-1)



<768>

<769> 실온에서, [2-(4-브로모-2-티에닐)사이클로프로필](2,6-디플루오로페닐)메탄논(XVII-1) (1.40 g, 82% 순도, 약 3.4 밀리몰)을 진한 염산(10 ml)와 함께 72 시간동안 교반하였다. 디클로로메탄을 첨가하고, 유기상을 물로 세척한 다음 황산나트륨 상에서 건조시키고 여과 및 농축하였다. 조 생성물을 추가의 정제없이 반응시켰다.

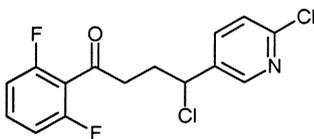
<770> 이로써, 4-(4-브로모-2-티에닐)-4-클로로-1-(2,6-디플루오로페닐)-1-부탄논 1.27 g(이론치의 83%)을 수득하였다.

<771> HPLC: logP(pH 2.3)=3.00(85% 순도)

NMR (CD<sub>3</sub>CN): δ = 2.48 (2H, m), 3.08 (2H, m), 5.36 (1H, m), 7.00-7.12 (3H, m), 7.40 (1H, s), 7.47-7.57 (1H, m) ppm.

<772>

<773> 실시예 (XV-2)



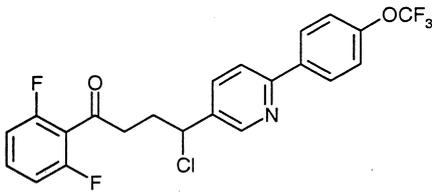
<774>

<775> 실온에서, [2-(6-클로로-3-피리디닐)사이클로프로필](2,6-디플루오로페닐)메탄논(XVII-2) (2.20 g, 7.50 밀리몰)을 진한 염산(22 ml)와 함께 60 시간동안 교반하였다. 반응 혼합물을 감압하에 농축시켰다. 조 생성물을 추가의 정제없이 반응시켰다.

<776> 이로써, 4-(6-클로로-3-피리디닐)-4-클로로-1-(2,6-디플루오로페닐)-1-부탄논 2.10 g(이론치의 49%)을 수득하였다.

<777> HPLC: logP(pH 2.3)=3.37(58% 순도)

<778> 실시예 (XV-3)



<779>

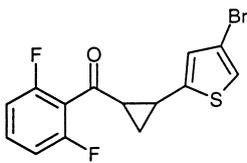
<780> 실온에서, (2,6-디플루오로페닐)(2-{6-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-3-피리디닐}사이클로프로필)메탄올(XVII-3) (0.75 g, 1.79 밀리몰)을 진한 염산(8.00 ml)와 함께 60 시간동안 교반하였다. 조 생성물을 감압하에 농축하였다.

<781> 이로써, 4-클로로-1-(2,6-디플루오로페닐)-4-{6-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-3-피리디닐}-1-부타논 0.81 g(이론치의 85%)을 수득하였다.

<782> HPLC: logP(pH 2.3)=4.88(86% 순도)

<783> 일반식 (XVII)의 출발물질

<784> 실시예 (XVII-1)



<785>

<786> 소듐 하이드라이드(0.40 g, 0.01 몰, 파라핀 오일중 60% 현탁액)를 DMSO(15 ml)에 현탁시켰다. 실온에서, 트리메틸설폭소늄 요오다이드(2.20 g, 0.01 몰)를 한번에 조금씩 가했다. 그 후, 반응 혼합물을 실온에서 0.5 시간동안 교반하였다. 실온에서, 디메틸 설폭사이드(15 ml)중 3-(4-브로모-2-티에닐)-1-(2,6-디플루오로페닐)-2-프로펜-1-온(XVIII-1)(2.30 g, 7.0 밀리몰)의 용액을 천천히 적가한 다음, 혼합물을 실온에서 추가로 16 시간동안 교반하였다. 혼합물을 빙수에 붓고 에틸 아세테이트로 2 회 추출하였다. 유기상을 모아 황산나트륨상에서 건조시키고 여과 및 농축하였다. 조 생성물을 추가의 정제없이 반응시켰다.

<787> 이로써, [2-(4-브로모-2-티에닐)사이클로프로필](2,6-디플루오로페닐)메탄올 1.86 g(이론치의 63%)을 수득하였다.

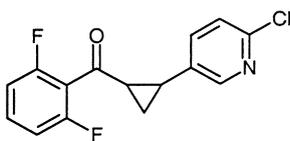
<788> HPLC: logP(pH 2.3)=4.14(82.0% 순도)

NMR (CD<sub>3</sub>CN): δ = 1.59 (1H, m), 1.87 (1H, m), 2.73 (1H, m), 2.84 (1H, m), 6.88

<789>

(1H, s), 7.08 (2H, m), 7.19 (1H, s), 7.54 (1H, m) ppm.

<790> 실시예 (XVII-2)



<791>

<792> 소듐 하이드라이드(3.19 g, 79.84 밀리몰, 파라핀 오일중 60% 현탁액)를 디메틸 설폭사이드(100 ml)에 현탁시켰다. 32 °C 또는 그 이하의 온도에서, 트리메틸설폭소늄 요오다이드(17.57 g, 79.84 밀리몰)를 한번에 조금씩 가했다. 그 후, 반응 혼합물을 실온에서 추가로 1.5 시간동안 교반하였다. DMSO(120 ml)중 3-(6-클로로-

3-피리디닐)-1-(2,6-디플루오로페닐)-2-프로펜-1-온(XVIII-2)(20.30 g, 72.59 밀리몰)의 용액을 36 °C 또는 그 이하의 온도에서 천천히 적가하였다. 그 후, 혼합물을 실온에서 추가로 16 시간동안 교반하였다. 반응 혼합물을 빙수에 붓고 침전물을 흡인여과하였다.

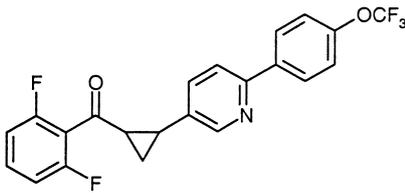
<793> 이로써, [2-(6-클로로-3-피리디닐)사이클로프로필](2,6-디플루오로페닐)메타논 22.70 g(이론치의 97%)을 수득하였다.

<794> HPLC: logP(pH 2.3)=2.92(91% 순도)

NMR (CD<sub>3</sub>CN): δ = 1.63 (1H, m), 1.91 (1H, m), 2.73 (2H, m), 7.07 (2H, m), 7.32 (2H, d), 7.50-7.55 (3H, m), 8.28 (1H, d) ppm.

<795>

<796> 실시예 (XVII-3)



<797>

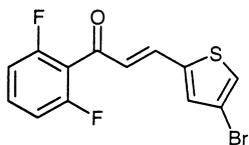
<798> 4,4,5,5-테트라메틸-2-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,3,2-이옥사보롤란(1.73 g, 6.00 밀리몰), 비스(디페닐메틸포스핀)팔라듐(II) 클로라이드(0.11 g, 0.15 밀리몰) 및 탄산나트륨 용액(7.50 ml, 2M)을 디메톡시에탄 20ml 중 [2-(6-클로로-3-피리디닐)사이클로프로필](2,6-디플루오로페닐)메타논(XVII-2)(1.47 g, 5.00 밀리몰)의 용액에 연속적으로 첨가한 다음, 반응 혼합물을 80 °C에서 16 시간동안 반응시켰다. 후처리를 위해, 물을 반응 혼합물에 첨가하고 생성된 침전물을 흡인여과하였다. 침전물을 디클로메탄에 용해시키고, 프로실 10 g을 첨가한 다음 반응 혼합물을 실리카 겔 크로마토그래피(이동상: 헥산/에틸 아세테이트 9:1, v/v)에 의해 정제하였다.

<799> 이로써, (2,6-디플루오로페닐)(2-{6-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-3-피리디닐}사이클로프로필)메타논 1.09 g(이론치의 51%)을 수득하였다.

<800> HPLC: logP(pH 2.3)=4.40(98% 순도)

<801> 일반식 (XVIII)의 출발물질

<802> 실시예 (XVIII-1)



<803>

<804> 2,6-디플루오로아세트페논(1.56 g, 0.01 몰) 및 4-브로모티오펜-2-카복스알데히드(1.91 g, 0.01 몰)를 먼저 메탄올(70 ml) 및 물(16 ml)에 도입하였다. 실온에서, 수산화나트륨 수용액(3 ml, 10% w/v)을 적가한 다음, 이 혼합물을 실온에서 추가로 16 시간동안 교반하였다. 0 °C로 냉각한 후, 침전물을 흡인여과하고 빙냉 메탄올/물(3:1) 혼합물로 세척하였다.

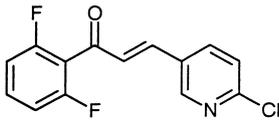
<805> 이로써, 3-(4-브로모-2-티에닐)-1-(2,6-디플루오로페닐)-2-프로펜-1-온 2.49 g(이론치의 76%)을 수득하였다.

<806> HPLC: logP(pH 2.3)=3.78(100% 순도)

NMR (CD<sub>3</sub>CN): δ = 6.89 (1H, d), 7.11 (2H, m), 7.40 (1H, s), 7.54-7.59 (3H, m) ppm.

<807>

<808> 실시예 (XVIII-2)



<809>

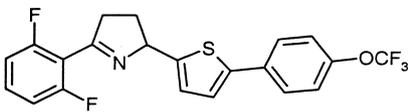
<810> 2,6-디플루오로아세토펜(15.60 g, 0.10 몰) 및 2-클로로피리딘-5-카복스알데히드(14.20 g, 0.10 몰)를 먼저 메탄올(300 ml) 및 물(100 ml)에 도입하였다. 5-8 °C에서, 수산화나트륨 수용액(30 ml, 10% w/v)을 천천히 적가하였다. 그 후, 반응 혼합물을 8 °C에서 1 시간동안 교반하였다. 침전물을 흡인여과하였다.

<811> 이로써, 3-(6-클로로-3-피리디닐)-1-(2,6-디플루오로페닐)-2-프로펜-1-온 20.30 g(이론치의 73%)을 수득하였다.

<812> HPLC: logP(pH 2.3)=2.87(98.54% 순도)

<813> NMR (CD<sub>3</sub>CN): δ = 7.09-7.20 (3H, m), 7.45-7.61 (3H, m), 8.04 (1H, dd), 8.58 (1H, d) ppm.

<814> 실시예 11



<815>

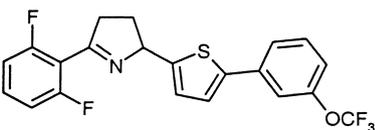
<816> 아르곤 대기하에서, 2-(5-브로모-2-티에닐)-(2,6-디플루오로페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤(실시예 1)(0.65 g, 1.90 밀리몰) 및 4-트리플루오로메톡시페닐보론산(0.50 g, 2.4 밀리몰)을 먼저 아세톤(10 ml)에 도입하였다. 물(10 ml)중 탄산칼륨(0.70 g, 5.07 밀리몰)의 용액 및 아세톤(2 ml)중 팔라듐 아세테이트(13 mg, 0.058 밀리몰)의 용액을 연속적으로 첨가하였다. 이 혼합물을 60 °C에서 4 시간 교반하고, 추가의 4-트리플루오로메톡시페닐보론산(0.25 g, 1.2 밀리몰), 물(5 ml)중 탄산칼륨(0.35 g, 2.37 밀리몰)의 용액 및 아세톤(1 ml)중 팔라듐 아세테이트(6 mg, 0.027 밀리몰)의 용액을 첨가하고, 이 혼합물을 60 °C에서 추가로 6 시간동안 교반하였다. 실온으로 냉각후, 혼합물을 여과 및 농축하였다. 여액을 에틸 아세테이트 및 물로 희석하고 상을 분리시켰다. 유기상을 황산나트륨상에서 건조시키고 여과 및 농축하였다. 조 생성물을 실리카 겔 크로마토그래피(이동상: 사이클로헥산/에틸 아세테이트 4:1)에 의해 정제하였다.

<817> 이로써, 5-(2,6-디플루오로페닐)-2-((5-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-2-티에닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤) 0.40 g(이론치의 47%)을 수득하였다.

<818> HPLC: logP(pH 2.3)=5.16(95% 순도)

<819> NMR (CD<sub>3</sub>CN): δ = 2.12 (1H, m), 2.62 (1H, m), 3.08 (1H, m), 3.14 (1H, m), 5.58 (1H, m), 6.97 (3H, m), 7.15 (1H, s), 7.20 (2H, d), 7.34 (1H, m), 7.58 (2H, d) ppm.

<820> 실시예 12



<821>

<822> 아르곤 대기하에서, 2-(5-브로모-2-티에닐)-(2,6-디플루오로페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤(실시예 1)(0.65 g, 1.90 밀리몰) 및 3-트리플루오로메톡시페닐보론산(0.50 g, 2.4 밀리몰)을 먼저 아세톤(10 ml)에 도입하였다. 물(10 ml)중 탄산칼륨(0.70 g, 5.07 밀리몰)의 용액 및 아세톤(3 ml)중 팔라듐 아세테이트(26 mg, 0.12 밀리몰)의 용액을 연속적으로 첨가하였다. 반응 혼합물을 60 °C에서 16 시간 교반하였다. 실온으로 냉각후, 혼합물을 에틸 아세테이트 및 물로 희석하고 상을 분리시켰다. 유기상을 황산나트륨상에서 건조시키고 여과 및

농축하였다. 조 생성물을 실리카 겔 크로마토그래피(이동상: 사이클로헥산/에틸 아세테이트 9:1)에 의해 정제하였다.

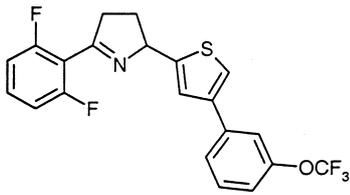
<823> 이로써, 5-(2,6-디플루오로페닐)-2-(5-[3-(트리플루오로메톡시)페닐]-2-티에닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤 0.45 g(이론치의 53%)을 수득하였다.

<824> HPLC: logP(pH 2.3)=4.84(94% 순도)

NMR (CD<sub>3</sub>CN): δ = 2.15 (1H, m), 2.65 (1H, m), 3.13 (2H, m), 5.61 (1H, m), 6.99 (3H, m), 7.11 (1H, m), 7.22 (1H, d), 7.33-7.49 (3H, m), 7.51 (1H, m) ppm.

<825>

<826> **실시예 13**



<827>

<828> 아르곤 대기하에서, 2-(4-브로모-2-티에닐)-5-(2,6-디플루오로페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤(실시예 8)(0.56 g, 1.70 밀리몰) 및 3-트리플루오로메톡시페닐보론산(0.50 g, 2.4 밀리몰)을 먼저 아세톤(10 ml)에 도입하였다. 물(10 ml)중 탄산칼륨(0.70 g, 5.07 밀리몰)의 용액 및 아세톤(3 ml)중 팔라듐 아세테이트(24 mg, 0.11 밀리몰)의 용액을 연속적으로 첨가하였다. 반응 혼합물을 60 °C에서 16 시간 교반하였다. 실온으로 냉각후, 혼합물을 에틸 아세테이트 및 물로 희석하고 상을 분리시켰다. 유기상을 황산나트륨상에서 건조시키고 여과 및 농축하였다. 조 생성물을 실리카 겔 크로마토그래피(이동상: 톨루엔/에틸 아세테이트 1:0→9:1)에 의해 정제하였다.

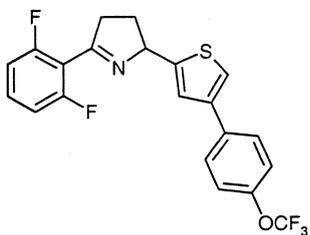
<829> 이로써, 5-(2,6-디플루오로페닐)-2-(4-[3-(트리플루오로메톡시)페닐]-2-티에닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤 0.41 g(이론치의 53%)을 수득하였다.

<830> HPLC: logP(pH 2.3)=4.08(93.6% 순도)

NMR (CD<sub>3</sub>CN): δ = 2.05 (1H, m), 2.64 (1H, m), 3.07 (2H, m), 5.54 (1H, m), 7.07 (2H, m), 7.23 (1H, d), 7.39 (1H, s), 7.51 (2H, m), 7.58 (2H, m), 7.67 (1H, d) ppm.

<831>

<832> **실시예 14**



<833>

<834> 아르곤 대기하에서, 2-(4-브로모-2-티에닐)-5-(2,6-디플루오로페닐)-3,4-디하이드로-2H-피롤(실시예 8)(0.75 g, 2.30 밀리몰) 및 4-트리플루오로메톡시페닐보론산(0.71 g, 3.45 밀리몰)을 먼저 아세톤(10 ml)에 도입하였다. 물(10 ml)중 탄산칼륨(0.75 g, 5.43 밀리몰)의 용액 및 아세톤(3 ml)중 팔라듐 아세테이트(25 mg, 0.11 밀리몰)의 용액을 연속적으로 첨가하였다. 반응 혼합물을 60 °C에서 16 시간 교반하였다. 실온으로 냉각후, 혼합물을 에틸 아세테이트 및 물로 희석하고 상을 분리시켰다. 유기상을 황산나트륨상에서 건조시키고 여과 및 농축하였다. 조 생성물을 실리카 겔 크로마토그래피(이동상: n-헥산/에틸 아세테이트 9:1)에 의해 정제하였다.

- <835> 이로써, 5-(2,6-디플루오로페닐)-2-{4-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-2-티에닐}-3,4-디하이드로-2H-피롤 0.15 g(이론치의 15%)을 수득하였다.
- <836> HPLC: logP(pH 2.3)=4.66(96.3% 순도)  
 NMR (CD<sub>3</sub>CN): δ = 2.05 (1H, m), 2.65 (1H, m), 3.07 (2H, m), 5.54 (1H, m), 7.08 (2H, m), 7.33 (2H, d), 7.37 (1H, s), 7.47 (1H, m), 7.49 (1H, s), 7.73 (2H, d) ppm.
- <837>
- <838> 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.
- <839> 산성 범위에서, 측정은 이동상으로 0.1% 수성 인산 및 아세트니트릴; 10% 아세트니트릴에서 90% 아세트니트릴로의 선형 구배를 사용하여 pH 2.3에서 실시되었다.
- <840> 중성 범위에서, 측정은 이동상으로 0.01 몰 인산 완충 수용액 및 아세트니트릴; 10% 아세트니트릴에서 90% 아세트니트릴로의 선형 구배를 사용하여 pH 7.5에서 실시되었다.
- <841> logP 값이 알려진(두개의 연속한 알카논 사이의 선형보간을 이용하여 체류 시간으로 logP 값 결정) 비측쇄 알칸-2-온(탄소원자수 3 내지 16)을 사용하여 보정을 수행하였다.
- <842> 200 내지 400 nm의 UV 스펙트럼을 사용하여 크로마토그래피 시그널의 최대치로서 램다 max 값을 결정하였다.

<843> **사용 실시예**

<844> **실시예 A**

<845> **멜로이도기네(Meloidogyne) 시험**

<846> 용 매 : 디메틸포름아미드 30 중량부

<847> 유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

<848> 1 중량부의 활성 화합물을 상기 언급된 양의 용매 및 유화제와 혼합한 후, 농축물을 목적 농도가 되도록 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

<849> 용기를 모래, 활성 화합물 용액, 멜로이도기네 인코그니타(Meloidogyne incognita) 알/유충 현탁액 및 상추 종자로 채웠다. 상추 종자가 발아하고 식물이 발육하였다. 뿌리상에 혹을 형성시켰다.

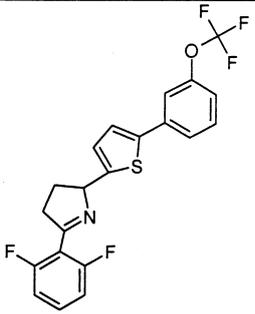
<850> 목적하는 기간이 경과한 후에, 혹 형성법을 사용하여 살선충 작용을 %로 측정하였다. 100%란 혹이 전혀 관찰되지 않았음을 의미하며; 0%란 처리 식물상의 혹 수가 비처리 대조군상의 혹 수와 같음을 의미한다.

<851> 활성 화합물 및 시험 결과를 하기 표에 나타내었다.

<852> **표 A**

<853> 식물-손상 선충

<854> 멜로이도기네(*Meloidogyne*) 시험

활성화합물	활성화합물의 농도 (ppm)	14일 후의 구제율 (%)
	20	98

<855>

<856> 실시예 B

<857> 미주스(*Myzus*) 시험

<858> 용 매 : 디메틸포름아미드 7 중량부

<859> 유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

<860> 1 중량부의 활성 화합물을 상기 언급된 양의 용매 및 유화제와 혼합한 후, 농축물을 목적 농도가 되도록 유화제를 함유하는 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

<861> 복숭아 진딧물(미주스 페르시카에(*Myzus persicae*))로 심하게 감염된 양배추잎(브라시카 올레라세아(*Brassica oleracea*))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하였다.

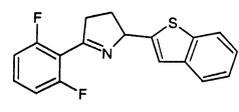
<862> 일정한 기간이 경과한 후에, 구제율을 %로 결정하였다. 100%란 모든 진딧물이 구제되었음을 의미하며; 0%란 진딧물이 전혀 구제되지 않았음을 의미한다.

<863> 활성 화합물 및 시험 결과를 하기 표에 나타내었다

<864> 표 b

<865> 식물-손상 곤충

<866> 미주스(*Myzus*) 시험

활성화합물	활성화합물의 농도 (ppm)	6일 후의 구제율 (%)
	1000	95

<867>

<868> 실시예 C

<869> 파에돈(*Phaedon*) 유충 시험

<870> 용 매 : 디메틸포름아미드 30 중량부

<871> 유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

<872> 활성 화합물 1 중량부를 상기 언급된 양의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적 농도가 되도록 유화제를 함유하는 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

<873> 양배추잎(브라시카 올레라세아(*Brassica oleracea*))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하고, 잎이 축축한 동안에 겨자 벌레(파에돈 코클레아리아에(*Phaedon cochleariae*)) 유충으로 감염시켰다.

<874> 일정한 기간이 경과한 후에, 구제율을 %로 결정하였다. 100%란 모든 겨자벌레 유충이 구제되었음을 의미하며;

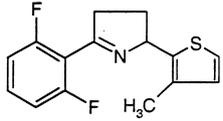
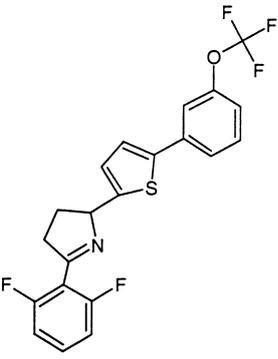
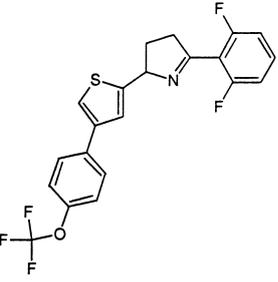
0%란 겨자 벌레 유충이 전혀 구제되지 않았음을 의미한다.

<875> 활성 화합물 및 시험 결과를 하기 표에 나타내었다

<876> 표 C

<877> 식물-손상 곤충

<878> 파에돈(Phaedon) 유충 시험

활성화합물	활성화합물의 농도 (ppm)	7일 후의 구제율 (%)
	1000	100
	1000	100
	1000	100

<879>

<880> 실시예 D

<881> 플루텔라(Plutella) 시험

<882> 용 매 : 디메틸포름아미드 30 중량부

<883> 유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

<884> 1 중량부의 활성 화합물을 상기 언급된 양의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적 농도가 되도록 유화제를 함유하는 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

<885> 양배추잎(브라시카 올레라세아(Brassica oleracea))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하고, 잎이 축축한 동안에 배추좀나방 모충(플루텔라 크실로스텔라(Plutella xylostella))으로 감염시켰다.

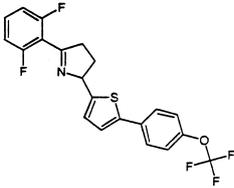
<886> 일정한 기간이 경과한 후에, 구제율을 %로 결정하였다. 100%란 모든 모충이 구제되었음을 의미하며; 0%란 모충이 전혀 구제되지 않았음을 의미한다.

<887> 활성 화합물 및 시험 결과를 하기 표에 나타내었다.

<888> 표 D

<889> 식물-손상 곤충

<890> **플루텔라(*Plutella*) 시험**

활성화합물	활성화합물의 농도 (ppm)	6일 후의 구제율 (%)
	8	90

<891>

<892> **실시예 E**

<893> **스포도프테라 프루기페르다(*Spodoptera frugiperda*) 시험**

<894> 용 매 : 디메틸포름아미드 30 중량부

<895> 유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

<896> 1 중량부의 활성 화합물을 상기 언급된 양의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적 농도가 되도록 유화제를 함유하는 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

<897> 양배추잎(브라시카 올레라세아(*Brassica oleracea*))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하고, 잎이 축축한 동안에 행털구더기(스포도프테라 프루기페르다(*Spodoptera frugiperda*)) 모충으로 감염시켰다.

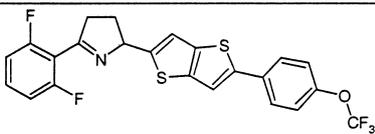
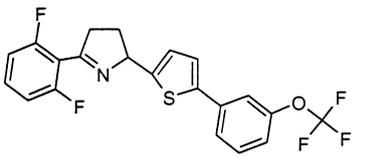
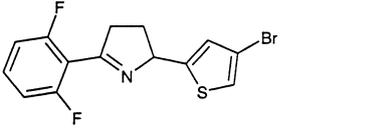
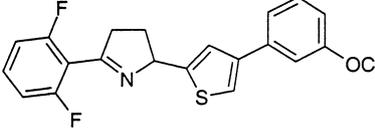
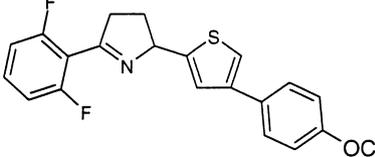
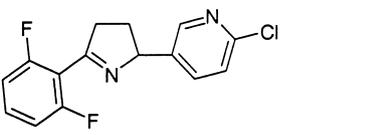
<898> 일정한 기간이 경과한 후에, 구제율을 %로 결정하였다. 100%란 모든 모충이 구제되었음을 의미하며; 0%란 모충이 전혀 구제되지 않았음을 의미한다.

<899> 활성 화합물 및 시험 결과를 하기 표에 나타내었다.

<900> **표 E**

<901> 식물-손상 곤충

<902> 스포도프테라 프루기페르다(*Spodoptera frugiperda*) 시험

활성화합물	활성화합물의 농도 (ppm)	7일 후의 구제율 (%)
	500	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	500	100

<903>

<904> 실시예 F

<905> 테트라니쿠스(*Tetranychus*) 시험(OP 내성/침지 처리)

<906> 용 매 : 디메틸포름아미드 30 중량부

<907> 유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

<908> 1 중량부의 활성 화합물을 상기 언급된 양의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 목적 농도가 되도록 유화제를 함유하는 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

<909> 모든 단계의 점박이 응애(테트라니쿠스 우르티카에(*Tetranychus urticae*))로 심하게 감염된 콩 식물(파세올루스 불가리스(*Phaseolus vulgaris*))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켰다.

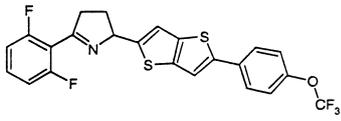
<910> 일정한 기간이 경과한 후에, 구제율을 %로 결정하였다. 100%란 모든 거미 응애가 구제되었음을 의미하며; 0%란 거미 응애가 전혀 구제되지 않았음을 의미한다.

<911> 활성 화합물 및 시험 결과를 하기 표에 나타내었다.

<912> 표 F

<913> 식물-손상 응애

<914> 테트라니쿠스(*Tetranychus*) 시험(OP 내성/침지 처리)

활성화합물	활성화합물의 농도 (ppm)	7일 후의 구제율 (%)
	500	80

<915>

<916> **실시예 G**

<917> **디아브로티카 발테아타(*Diabrotica balteata*) 시험**(토양중 유충)

<918> 임계 농도 시험/토양 곤충 - 형질전환 식물의 처리

<919> 용 매 : 디메틸포름아미드 7 중량부

<920> 유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

<921> 1 중량부의 활성 화합물을 상기 언급된 양의 용매와 혼합하고, 상기 언급된 양의 유화제를 첨가한 후, 농축물을 목적 농도가 되도록 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

<922> 활성 화합물 제제를 토양에 부었다. 이때, 제제중의 활성 화합물 농도는 실질적으로 관련이 없으며, 토양 부피 단위당 활성 화합물의 중량(ppm(mg/l))으로 제시)만이 중요한 요인이다. 토양을 0.25 l 포트에 채우고, 20 °C에서 방치하였다.

<923> 준비후 즉시, YIELD GUARD 품종(Monsanto Comp., USA의 등록상표)의 발아전 옥수수 낱알 5 개를 각 포트에 도입하였다. 이틀후, 해당 시험 곤충을 처리된 토양에 도입하였다. 7 일이 더 지난후, 발아된 옥수수 식물수를 세어 활성 화합물의 효율을 결정하였다(식물 하나 = 20%의 효율).

<924> **실시예 L**

<925> **헬리오티스 비레센스(*Heliothis virescens*) 시험**(형질전환 식물의 처리)

<926> 용 매 : 디메틸포름아미드 7 중량부

<927> 유화제 : 알킬아릴 폴리글리콜 에테르 1 중량부

<928> 1 중량부의 활성 화합물을 상기 언급된 양의 용매 및 상기 언급된 양의 유화제와 혼합한 후, 농축물을 목적 농도가 되도록 물로 희석하여 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하였다.

<929> Roundup Ready 품종(Monsanto Comp., USA의 등록상표)의 대두 새싹(글리신 맥스(*Glycine max*))을 목적 농도의 활성 화합물 제제에 침지시켜 처리하고, 잎이 축축한 동안에 담배 싹벌레 모충 헬리오티스 비레센스(*Heliothis virescens*)로 감염시켰다.

<930> 일정한 기간이 경과한 후, 구제율을 %로 결정하였다. 100%란 모든 모충이 구제되었음을 의미하며; 0%란 모충이 전혀 구제되지 않았음을 의미한다.