



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2021년12월24일
(11) 등록번호 10-2343280
(24) 등록일자 2021년12월21일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
C07D 215/54 (2006.01) A01N 43/42 (2006.01)
(52) CPC특허분류
C07D 215/54 (2013.01)
A01N 43/42 (2013.01)
(21) 출원번호 10-2018-7028109
(22) 출원일자(국제) 2017년03월07일
심사청구일자 2020년02월03일
(85) 번역문제출일자 2018년09월28일
(65) 공개번호 10-2018-0116410
(43) 공개일자 2018년10월24일
(86) 국제출원번호 PCT/EP2017/055273
(87) 국제공개번호 WO 2017/153380
국제공개일자 2017년09월14일
(30) 우선권주장
16159707.5 2016년03월10일
유럽특허청(EPO)(EP)
17154212.9 2017년02월01일
유럽특허청(EPO)(EP)
(56) 선행기술조사문헌
KR1020070047778 A

(73) 특허권자
신젠타 파티서페이션즈 아게
스위스 바젤 로젠탈슈트라세 67 (우: 4058)
(72) 발명자
바이스, 마티아스
스위스 4332 슈타인 샤프하우저슈트라세 신젠타
코포레이션 프로텍션 아게
부 합단, 파한
스위스 4332 슈타인 샤프하우저슈트라세 신젠타
코포레이션 프로텍션 아게
쿠아란타, 로라
스위스 4332 슈타인 샤프하우저슈트라세 신젠타
코포레이션 프로텍션 아게
(74) 대리인
특허법인 남앤남

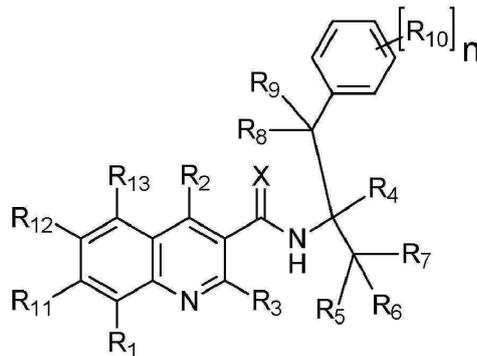
전체 청구항 수 : 총 18 항

심사관 : 허정오

(54) 발명의 명칭 살미생물 퀴놀린 (티오)카르복스아미드 유도체

(57) 요약

[화학식 I]



치환체들이 제1항에 정의된 바와 같은 화학식 I의 화합물. 더욱이, 본 발명은 화학식 I의 화합물을 포함하는 농약 조성물, 이러한 조성물의 제조, 및 농업 또는 원예에서 식물, 수확된 식용 작물, 종자 또는 무생물 재료(non-living material)에 식물병원성 미생물, 특히 진균이 침입하는 것을 퇴치, 예방 또는 방제하기 위한 화합물 또는 조성물의 용도에 관한 것이다.

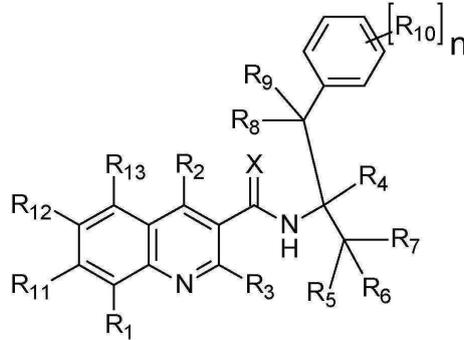
명세서

청구범위

청구항 1

화학식 I의 화합물, 및 이의 염 및/또는 N-옥사이드로서,

[화학식 I]



상기 식에서,

X는 O 또는 S이고;

R₁은 수소, 할로겐, 메틸, 메톡시 또는 시아노이고;

R₂ 및 R₃은 각각 독립적으로 수소, 할로겐 또는 메틸이고;

R₄는 수소, 시아노, C₁-C₄ 알킬, 또는 C₃-C₄ 사이클로알킬이고, 여기서, 알킬 및 사이클로알킬은 할로겐, 시아노, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 알콕시 및 C₁-C₃ 알킬티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고;

R₅ 및 R₆은 각각 독립적으로 수소, 할로겐, C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 알콕시 및 C₁-C₄ 알킬티오로부터 선택되거나;

R₅와 R₆은 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, C=O, C=NOR_c, C₃-C₅ 사이클로알킬 또는 C₂-C₅ 알케닐을 나타내고, 여기서, 사이클로알킬 및 알케닐은 할로겐, 시아노, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 알콕시 및 C₁-C₃ 알킬티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고;

R₇은 수소, C₁-C₅ 알킬, C₃-C₅ 사이클로알킬, C₂-C₅ 알케닐, C₃-C₅ 사이클로알케닐, 또는 C₂-C₅ 알킬닐이고, 여기서, 알킬, 사이클로알킬, 알케닐, 알킬닐, 사이클로알케닐은 할로겐, 시아노, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 알콕시, 하이드록실 및 C₁-C₃ 알킬티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 4개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고;

R₈ 및 R₉는 각각 독립적으로 수소, 할로겐, C₁-C₄ 알킬 및 C₁-C₄ 알콕시로부터 선택되거나;

R₈과 R₉는 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, C₃-C₅ 사이클로알킬을 나타내고, 여기서, 사이클로알킬은 할로겐, 시아노, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 알콕시 및 C₁-C₃ 알킬티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고;

각각의 R₁₀은 독립적으로 할로겐, 니트로, 시아노, 포르밀, C₁-C₅ 알킬, C₂-C₅ 알케닐, C₂-C₅ 알킬닐, C₃-C₆ 사이클로알킬, C₁-C₅ 알콕시, C₃-C₅ 알케닐옥시, C₃-C₅ 알킬닐옥시, C₁-C₅ 알킬티오, -C(=NOR_c)C₁-C₅ 알킬, 또는 C₁-C₅ 알킬카르보닐을 나타내고, 여기서, 알킬, 사이클로알킬, 알케닐, 알킬닐, 알콕시, 알케닐옥시, 알킬닐옥시 및 알킬티오는 할로겐, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 알콕시, 시아노 및 C₁-C₃ 알킬티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 5개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고;

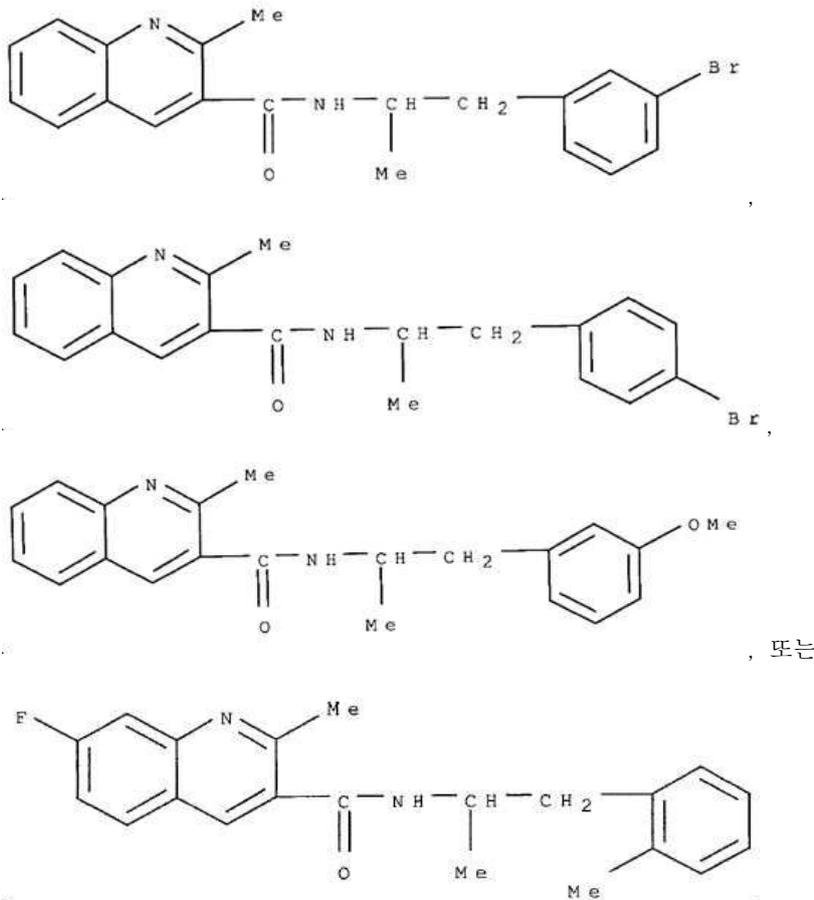
n은 0, 1, 2, 3, 4 또는 5이고;

각각의 R_c는 독립적으로 수소, C₁-C₄ 알킬, C₂-C₄ 알케닐, C₃-C₄ 알키닐, C₃-C₄ 사이클로알킬(C₁-C₂)알킬 및 C₃-C₄ 사이클로알킬로부터 선택되고, 여기서, 알킬, 사이클로알킬, 알케닐 및 알키닐 기는 할로겐 및 시아노로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고;

R₁₁은 수소, 할로겐, 메틸, 메톡시 또는 시아노이고;

R₁₂ 및 R₁₃은 각각 독립적으로 수소, 할로겐, 메틸, 메톡시 또는 하이드록실로부터 선택되며;

단, 상기 화합물은 하기 화합물들 중 하나는 아닌, 화학식 I의 화합물:



청구항 2

제1항에 있어서, R₁은 수소, 플루오로, 클로로, 메틸, 또는 시아노인, 화합물.

청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, R₂ 및 R₃은 각각 독립적으로 수소 또는 메틸인, 화합물.

청구항 4

제1항 또는 제2항에 있어서, R₄는 수소, 시아노, C₁-C₃ 알킬, 또는 사이클로프로필이고, 여기서, 알킬 및 사이클로알킬은 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 메톡시 및 메틸티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있는, 화합물.

청구항 5

제1항 또는 제2항에 있어서, R₅ 및 R₆은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, C₁-C₂ 알킬, C₁-C₂ 알콕시 및 C₁-C₂ 알

킬티오로부터 선택되거나; R₅와 R₆은 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, C=O 또는 사이클로프로필을 나타내고, 여기서, 사이클로프로필은 플루오로, 메틸 및 시아노로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있는, 화합물.

청구항 6

제1항 또는 제2항에 있어서, R₇은 C₁-C₄ 알킬, C₃-C₄ 사이클로알킬, C₂-C₄ 알케닐, 또는 C₂-C₃ 알키닐이고, 여기서, 알킬, 사이클로알킬, 알케닐, 알키닐은 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 하이드록실 및 메틸티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있는, 화합물.

청구항 7

제1항 또는 제2항에 있어서, R₈ 및 R₉는 각각 독립적으로 수소, 플루오로, C₁-C₂ 알킬 및 C₁-C₂ 알콕시로부터 선택되거나; R₈과 R₉는 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 사이클로프로필을 나타내고, 여기서, 사이클로프로필은 플루오로, 시아노, 및 메틸로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있는, 화합물.

청구항 8

제1항 또는 제2항에 있어서, 각각의 R₁₀은 독립적으로 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알킬, C₂-C₃ 알케닐, C₂-C₃ 알키닐, 사이클로프로필, 메톡시, 알릴옥시, 프로파르길옥시, 또는 C₁-C₂ 알킬티오를 나타내고, 여기서, 알킬, 사이클로프로필, 알케닐, 알키닐, 메톡시, 알릴옥시, 프로파르길옥시 및 알킬티오는 플루오로, 클로로, 메틸, 및 시아노로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고;

n은 0, 1, 2 또는 3인, 화합물.

청구항 9

제1항 또는 제2항에 있어서, R₁₁은 수소, 플루오로, 클로로, 메틸 또는 시아노이고; R₁₂ 및 R₁₃은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, 메틸 및 하이드록실로부터 선택되는, 화합물.

청구항 10

제1항에 있어서, X는 O 또는 S이고; R₁은 수소, 플루오로, 클로로, 메틸, 또는 시아노이고; R₂ 및 R₃은 각각 독립적으로 수소 또는 메틸이고; R₄는 수소, 시아노, C₁-C₃ 알킬, 또는 사이클로프로필이고, 여기서, 알킬 및 사이클로알킬은 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 메톡시, 및 메틸티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; R₅ 및 R₆은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, C₁-C₂ 알킬, C₁-C₂ 알콕시 및 C₁-C₂ 알킬티오로부터 선택되거나; R₅와 R₆은 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, C=O 또는 사이클로프로필을 나타내고, 여기서, 사이클로프로필은 플루오로, 메틸 및 시아노로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; R₇은 C₁-C₄ 알킬, C₃-C₄ 사이클로알킬, C₂-C₄ 알케닐, 또는 C₂-C₃ 알키닐이고, 여기서, 알킬, 사이클로알킬, 알케닐, 알키닐은 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 하이드록실 및 메틸티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; R₈ 및 R₉는 각각 독립적으로 수소, 플루오로, C₁-C₂ 알킬 및 C₁-C₂ 알콕시로부터 선택되거나; R₈과 R₉는 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 사이클로프로필을 나타내고, 여기서, 사이클로프로필은 플루오로, 시아노, 및 메틸로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; 각각의 R₁₀은 독립적으로 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알킬, C₂-C₃ 알케닐, C₂-C₃ 알키닐, 사이클로프로필, 메톡시, 알릴옥시, 프로파르길옥시, 또는 C₁-C₂ 알킬티오를 나타내고, 여기서, 알킬, 사이클로프로필, 알케닐, 알키닐, 메톡시, 알릴옥시, 프로파르길옥시 및 알킬티오는 플루오로, 클로로, 메틸, 및 시아노로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; n은 0, 1, 2 또는 3이고; R₁₁은 수소, 플루오로, 클로로, 메틸 또는 시아노이고; R₁₂ 및 R₁₃은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, 메틸 및 하이드록실로부터 선택되는, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드.

청구항 11

제1항에 있어서, X는 0 또는 S이고; R₁은 수소, 플루오로, 메틸, 또는 시아노이고; R₂는 수소이고, R₃은 수소 또는 메틸이거나; R₂는 수소 또는 메틸이고, R₃은 수소이고; R₄는 수소, 시아노, 메틸 또는 에틸이고, 여기서, 메틸 및 에틸은 플루오로 및 메톡시로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; R₅ 및 R₆은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, 메틸, 메톡시 및 메틸티오로부터 선택되거나; R₅와 R₆은 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 사이클로프로필을 나타내고; R₇은 C₁-C₄ 알킬, C₃-C₄ 사이클로알킬, 또는 C₂-C₄ 알케닐이고, 여기서, 알킬, 사이클로알킬 및 알케닐은 플루오로, 클로로, 하이드록실, 시아노 및 메틸로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; R₈ 및 R₉는 각각 독립적으로 수소, 플루오로 및 메틸로부터 선택되거나; R₈과 R₉는 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 사이클로프로필을 나타내고; 각각의 R₁₀은 독립적으로 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 사이클로프로필, 메톡시 또는 메틸티오를 나타내고, 여기서, 메틸, 사이클로프로필, 메톡시 및 메틸티오는 플루오로 및 클로로로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; n은 0, 1 또는 2이고; R₁₁은 수소, 플루오로, 메틸 또는 클로로이고; R₁₂ 및 R₁₃은 각각 독립적으로 수소, 플루오로 및 메틸로부터 선택되는, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드.

청구항 12

제1항에 있어서, X는 0 또는 S이고; R₁은 수소 또는 플루오로이고; R₂ 및 R₃은 둘 모두 수소이고; R₄는 메틸 또는 에틸이고, 여기서, 메틸 및 에틸은 1 내지 3개의 플루오로 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; R₅ 및 R₆은 각각 독립적으로 수소 및 플루오로로부터 선택되고; R₇은 메틸, 에틸, n-프로필, 이소-프로필, sec-부틸, tert-부틸, C₃-C₄ 사이클로알킬, 또는 C₂-C₄ 알케닐이고, 여기서, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소-프로필, sec-부틸, tert-부틸, 사이클로알킬 및 알케닐은 플루오로, 클로로 및 메틸로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; R₈ 및 R₉는 각각 독립적으로 수소 또는 플루오로로부터 선택되고; 각각의 R₁₀은 독립적으로 플루오로, 클로로, 시아노 또는 메틸을 나타내고, 여기서, 메틸, 사이클로프로필, 메톡시 및 메틸티오는 1 내지 3개의 플루오로 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; n은 0, 1 또는 2이고; R₁₁은 수소 또는 플루오로이고; R₁₂ 및 R₁₃은 둘 모두 수소인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드.

청구항 13

제1항, 제2항, 제10항, 제11항 또는 제12항 중 어느 한 항에 있어서, X는 0인, 화합물.

청구항 14

제1항에 있어서, 하기로부터 선택되는, 화합물:

N-[1-벤질-1-메틸-2-(1-메틸사이클로프로필)에틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-47),

N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-61),

N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-클로로-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-60),

N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-39),

N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-102),

N-(1-5 벤질-1,3-디메틸-부틸)-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-48),

N-(1-벤질-1,3-디메틸-부트-3-에닐)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-35),

N-(1-벤질-1,3-디메틸-부트-3-에닐)-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-55),

8-플루오로-N-[1-[(3-플루오로페닐)메틸]-1,3-디메틸-부틸]퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-26),

8-플루오로-N-[3,3,3-트리플루오로-1-[(3-플루오로페닐)메틸]-1-메틸-프로필]퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물

E-99),

N-(1-벤질-3,3-디플루오로-1-메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-50),

N-(1-벤질-3-플루오로-1,3-디메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-56),

N-(1-벤질-1,3,3-트리메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-34),

N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-6),

N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-8-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-20),

N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-8-클로로-퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-14), 및

N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)퀴놀린-3-카르복스아미드 (화합물 E-13).

청구항 15

제1항, 제2항, 제10항, 제11항, 제12항 또는 제14항 중 어느 한 항에 정의된 화학식 I의 화합물의 살진균 유효량을 포함하는 조성물.

청구항 16

제15항에 있어서, 상기 조성물은 적어도 하나의 추가의 활성 성분 및/또는 희석제를 추가로 포함하는, 조성물.

청구항 17

식물병원성 질병을 퇴치, 예방 또는 방제하는 방법으로서,

제1항, 제2항, 제10항, 제11항, 제12항 또는 제14항 중 어느 한 항에 정의된 화학식 I의 화합물의 살진균 유효량을 식물병원체에, 식물병원체의 서식지(locus)에, 또는 식물병원체에 의한 공격을 받기 쉬운 식물에, 또는 이의 번식 재료에 적용하는 단계를 포함하는, 방법.

청구항 18

식물병원성 질병을 퇴치, 예방 또는 방제하는 방법으로서,

제1항, 제2항, 제10항, 제11항, 제12항 또는 제14항 중 어느 한 항에 정의된 화학식 I의 화합물의 살진균 유효량을 포함하는 조성물을 식물병원체에, 식물병원체의 서식지(locus)에, 또는 식물병원체에 의한 공격을 받기 쉬운 식물에, 또는 이의 번식 재료에 적용하는 단계를 포함하는, 방법.

발명의 설명

기술 분야

[0001] 본 발명은 살미생물 활성, 특히 살진균 활성을 갖는, 예를 들어 활성 성분으로서의, 살미생물 퀴놀린 (티오)카르복스아미드 유도체에 관한 것이다. 본 발명은 또한 이러한 퀴놀린 (티오)카르복스아미드 유도체의 제조, 이러한 퀴놀린 (티오)카르복스아미드 유도체의 제조에 있어서 유용한 중간체, 이러한 중간체의 제조, 퀴놀린 (티오)카르복스아미드 유도체들 중 적어도 하나를 포함하는 농약 조성물, 이러한 조성물의 제조, 및 농업 또는 원예에서 식물, 수확된 식용 작물, 종자 또는 무생물 재료(non-living material)에 식물병원성 미생물, 특히 진균이 침입하는 것을 방제 또는 예방하기 위한 퀴놀린 (티오)카르복스아미드 유도체 또는 조성물의 용도에 관한 것이다.

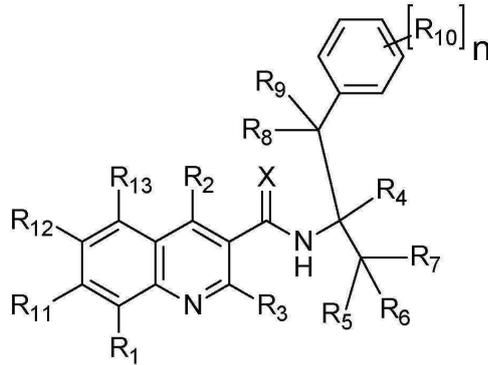
배경 기술

[0002] 소정의 살진균 퀴놀린 (티오)카르복스아미드 화합물들이 W004039783에 기재되어 있다.

[0003] 이제는 소정의 신규한 퀴놀린 (티오)카르복스아미드 유도체가 유리한 살진균 특성을 갖는다는 것이 놀랍게도 밝혀졌다.

발명의 내용

[0004] 따라서, 본 발명은, 화학식 I의 화합물, 또는 이의 염 및/또는 N-옥사이드를 제공하며,
 [0005] [화학식 I]

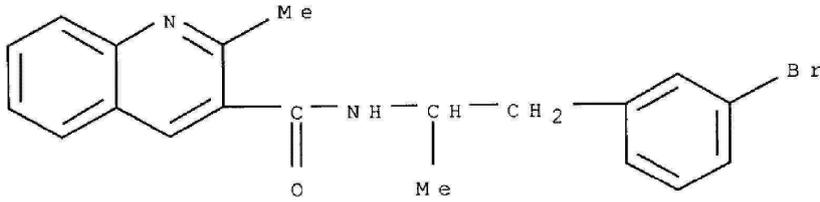


[0006] .
 [0007] 상기 식에서,
 [0008] X는 O 또는 S이고;
 [0009] R₁은 수소, 할로젠, 메틸, 메톡시 또는 시아노이고;
 [0010] R₂ 및 R₃은 각각 독립적으로 수소, 할로젠 또는 메틸이고;
 [0011] R₄는 수소, 시아노, C₁-C₄ 알킬, 또는 C₃-C₄ 사이클로알킬(여기서, 알킬 및 사이클로알킬은 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 알콕시 및 C₁-C₃ 알킬티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)이고;
 [0012] R₅ 및 R₆은 각각 독립적으로 수소, 할로젠, C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 알콕시 및 C₁-C₄ 알킬티오로부터 선택되거나;
 [0013] R₅와 R₆은 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, C=O, C=NOR_c, C₃-C₅ 사이클로알킬 또는 C₂-C₅ 알케닐(여기서, 사이클로알킬 및 알케닐은 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 알콕시 및 C₁-C₃ 알킬티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)을 나타내고;
 [0014] R₇은 수소, C₁-C₅ 알킬, C₃-C₅ 사이클로알킬, C₂-C₅ 알케닐, C₃-C₅ 사이클로알케닐, 또는 C₂-C₅ 알키닐(여기서, 알킬, 사이클로알킬, 알케닐, 알키닐, 사이클로알케닐은 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 알콕시, 하이드록실 및 C₁-C₃ 알킬티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 4개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)이고;
 [0015] R₈ 및 R₉는 각각 독립적으로 수소, 할로젠, C₁-C₄ 알킬 및 C₁-C₄ 알콕시로부터 선택되거나;
 [0016] R₈과 R₉는 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, C₃-C₅ 사이클로알킬(여기서, 사이클로알킬은 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 알콕시 및 C₁-C₃ 알킬티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)을 나타내고;
 [0017] 각각의 R₁₀은 독립적으로 할로젠, 니트로, 시아노, 포르밀, C₁-C₅ 알킬, C₂-C₅ 알케닐, C₂-C₅ 알키닐, C₃-C₆ 사이클로알킬, C₁-C₅ 알콕시, C₃-C₅ 알케닐옥시, C₃-C₅ 알키닐옥시, C₁-C₅ 알킬티오, -C(=NOR_c)C₁-C₅ 알킬, 또는 C₁-C₅ 알킬카르보닐(여기서, 알킬, 사이클로알킬, 알케닐, 알키닐, 알콕시, 알케닐옥시, 알키닐옥시 및 알킬티오는 할로젠, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 알콕시, 시아노 및 C₁-C₃ 알킬티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 5개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)을 나타내고;
 [0018] n은 0, 1, 2, 3, 4 또는 5이고;
 [0019] 각각의 R_c는 독립적으로 수소, C₁-C₄ 알킬, C₂-C₄ 알케닐, C₃-C₄ 알키닐, C₃-C₄ 사이클로알킬(C₁-C₂)알킬 및 C₃-C₄ 사이클로알킬(여기서, 알킬, 사이클로알킬, 알케닐 및 알키닐 기는 할로젠 및 시아노로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)로부터 선택되고;

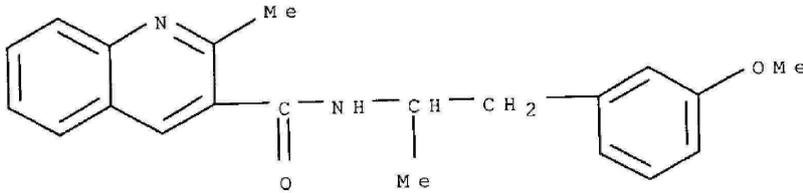
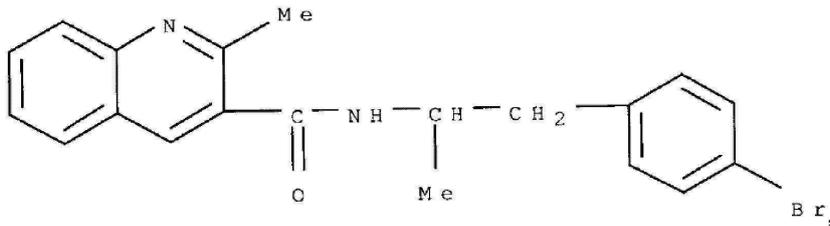
[0020] R₁₁은 수소, 할로젠, 메틸, 메톡시 또는 시아노이고;

[0021] R₁₂ 및 R₁₃은 각각 독립적으로 수소, 할로젠, 메틸, 메톡시 또는 하이드록실로부터 선택되며;

[0022] 단, 상기 화합물은 하기 화합물들 중 하나는 아니다:



[0023]



[0024]

[0025] 제2 양태에서, 본 발명은 화학식 I의 화합물을 포함하는 농약 조성물을 제공한다.

[0026] 화학식 I의 화합물은 식물병원성 미생물을 방제하는 데 사용될 수 있다. 따라서, 식물병원체를 방제하기 위하여, 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물, 또는 화학식 I의 화합물을 포함하는 조성물이 식물병원체에, 또는 식물병원체의 서식지(locus)에, 특히 식물병원체에 의한 공격을 받기 쉬운 식물에 직접 적용될 수 있다.

[0027] 따라서, 제3 양태에서, 본 발명은 식물병원체를 방제하기 위한, 본 명세서에 기재된 바와 같은 화학식 I의 화합물, 또는 화학식 I의 화합물을 포함하는 조성물의 용도를 제공한다.

[0028] 추가의 양태에서, 본 발명은 식물병원체를 방제하는 방법을 제공하며, 본 방법은 본 명세서에 기재된 바와 같은 화학식 I의 화합물, 또는 화학식 I의 화합물을 포함하는 조성물을 상기 식물병원체에, 또는 상기 식물병원체의 서식지에, 특히 식물병원체에 의한 공격을 받기 쉬운 식물에 적용하는 단계를 포함한다.

[0029] 화학식 I의 화합물은 식물병원성 진균을 방제하는 데 특히 효과적이다.

[0030] 따라서, 또 다른 추가의 양태에서, 본 발명은 식물병원성 진균을 방제하기 위한, 본 명세서에 기재된 바와 같은 화학식 I의 화합물, 또는 화학식 I의 화합물을 포함하는 조성물의 용도를 제공한다.

[0031] 추가의 양태에서, 본 발명은 식물병원성 진균을 방제하는 방법을 제공하며, 본 방법은 본 명세서에 기재된 바와 같은 화학식 I의 화합물, 또는 화학식 I의 화합물을 포함하는 조성물을 상기 식물병원성 진균에, 또는 상기 식물병원성 진균의 서식지에, 특히 식물병원성 진균에 의한 공격을 받기 쉬운 식물에 적용하는 단계를 포함한다.

[0032] 치환체들이 선택적으로 치환된 것으로 지시되어 있는 경우, 이는, 이들이 하나 이상의 동일하거나 상이한 치환체, 예를 들어 1 내지 3개의 치환체를 가질 수 있거나 가질 수 없음을 의미한다. 통상적으로, 3개 이하의 이러한 선택적인 치환체가 동시에 존재한다. 기가 치환된 것으로 지시되어 있는 경우, 예를 들어 알킬의 경우, 이는 다른 기의 일부인 기들을 포함하며, 예를 들어 알킬티오에서의 알킬을 포함한다.

[0033] 용어 "할로젠"은 불소, 염소, 브롬 또는 요오드, 바람직하게는 불소, 염소 또는 브롬을 지칭한다.

[0034] (단독으로의 또는 더 큰 기, 예컨대 알콕시-, 알킬티오-의 일부로서의) 알킬 치환체는 직쇄형 또는 분지형일 수

있다. 단독으로의 또는 또 다른 치환체의 일부로서의 알킬은, 언급된 탄소 원자의 개수에 따라, 예를 들어 메틸, 에틸, n-프로필, n-부틸, n-펜틸, n-헥실 및 이들의 이성체, 예를 들어 이소-프로필, 이소-부틸, sec-부틸, tert-부틸 또는 이소-아밀이다.

- [0035] (단독으로의 또는 더 큰 기, 예를 들어 알케닐옥시의 일부로서의) 알케닐 치환체는 직쇄 또는 분지쇄의 형태일 수 있고, 적절한 경우 알케닐 모이어티(moiety)는 (E)- 또는 (Z)-배치 중 어느 하나일 수 있다. 예는 비닐 및 알릴이다. 알케닐 기는 바람직하게는 C₂-C₆, 더 바람직하게는 C₂-C₄, 가장 바람직하게는 C₂-C₃ 알케닐 기이다.
- [0036] (단독으로의 또는 더 큰 기, 예를 들어 알킬닐옥시의 일부로서의) 알킬닐 치환체는 직쇄 또는 분지쇄의 형태일 수 있다. 예는 에틸닐 및 프로파르길이다. 알킬닐 기는 바람직하게는 C₂-C₆, 더 바람직하게는 C₂-C₄, 가장 바람직하게는 C₂-C₃ 알킬닐 기이다.
- [0037] 사이클로알킬 치환체는 포화 또는 부분 불포화, 바람직하게는 완전 포화될 수 있으며, 예를 들어 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸 또는 사이클로헥실이다.
- [0038] (단독으로의 또는 더 큰 기, 예를 들어 할로알킬옥시의 일부로서의) 할로알킬 기는 하나 이상의 동일하거나 상이한 할로겐 원자를 함유할 수 있고, 예를 들어 CH₂Cl, CHCl₂, CCl₃, CH₂F, CHF₂, CF₃, CF₃CH₂, CH₃CF₂, CF₃CF₂ 또는 CCl₃CCl₂를 나타낼 수 있다.
- [0039] (단독으로의 또는 더 큰 기, 예를 들어 할로알케닐옥시의 일부로서의) 할로알케닐 기는, 개별적으로, 하나 이상의 동일하거나 상이한 할로겐 원자로 치환된 알케닐 기이고, 예를 들어 2,2-디플루오로비닐 또는 1,2-디클로로-2-플루오로-비닐이다.
- [0040] (단독으로의 또는 더 큰 기, 예를 들어 할로알킬닐옥시의 일부로서의) 할로알킬닐 기는, 개별적으로, 하나 이상의 동일하거나 상이한 할로겐 원자로 치환된 알킬닐 기이고, 예를 들어 1-클로로-프로프-2-이닐이다.
- [0041] 알콕시는 라디칼 -OR을 의미하며, 여기서 R은 알킬이며, 이때 알킬은, 예를 들어 상기에 정의된 바와 같다. 알콕시 기는 메톡시, 에톡시, 1-메틸에톡시, 프로폭시, 부톡시, 1-메틸프로폭시 및 2-메틸프로폭시를 포함하지만 이로 한정되지 않는다.
- [0042] 시아노는 -CN 기를 의미한다.
- [0043] 아미노는 -NH₂ 기를 의미한다.
- [0044] 하이드록실 또는 하이드록시는 -OH 기를 나타낸다.
- [0045] (단독으로의, 또는, 예를 들어 아릴옥시, 아릴-알킬과 같은 더 큰 기의 일부로서의) 아릴 기는 방향족 고리 시스템이며, 이는 모노사이클릭, 바이사이클릭 또는 트리사이클릭 형태일 수 있다. 이러한 고리의 예에는 페닐, 나프틸, 안트라세닐, 인데닐 또는 페난트레닐이 포함된다. 바람직한 아릴 기는 페닐 및 나프틸이며, 페닐이 가장 바람직하다. 아릴 모이어티가 치환되는 것으로 되어 있는 경우, 아릴 모이어티는 바람직하게는 1 내지 4개의 치환체에 의해, 가장 바람직하게는 1 내지 3개의 치환체에 의해 치환된다.
- [0046] (단독으로의, 또는, 예를 들어 헤테로아릴옥시, 헤테로아릴-알킬과 같은 더 큰 기의 일부로서의) 헤테로아릴 기는, 적어도 하나의 헤테로원자를 함유하고 단일 고리 또는 2개 이상의 융합된 고리로 이루어진 방향족 고리 시스템이다. 바람직하게는, 단일 고리는 최대 3개의 헤테로원자를 함유할 것이고, 바이사이클릭 시스템은 최대 4개의 헤테로원자를 함유할 것이며, 이때 헤테로원자는 바람직하게는 질소, 산소 및 황으로부터 선택될 것이다. 모노사이클릭 기의 예에는 피리딜, 피리다지닐, 피리미디닐, 피라지닐, 피롤릴, 피라졸릴, 이미다졸릴, 트리아졸릴(예를 들어, [1,2,4] 트리아졸릴), 푸라닐, 티오펜릴, 옥사졸릴, 이소옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 티아졸릴, 이소티아졸릴 및 티아디아졸릴이 포함된다. 바이사이클릭 기의 예에는 푸리닐, 퀴놀리닐, 신놀리닐, 퀴녹살리닐, 인돌릴, 인다졸릴, 벤즈이미다졸릴, 벤조티오펜릴 및 벤조티아졸릴이 포함된다. 모노사이클릭 헤테로아릴 기가 바람직하며, 피리딜이 가장 바람직하다. 헤테로아릴 모이어티가 치환되는 것으로 되어 있는 경우, 헤테로아릴 모이어티는 바람직하게는 1 내지 4개의 치환체에 의해, 가장 바람직하게는 1 내지 3개의 치환체에 의해 치환된다.
- [0047] (단독으로의, 또는, 헤테로사이클릴-알킬과 같은 더 큰 기의 부분으로서의) 헤테로사이클릴 기 또는 헤테로사이클릭 고리는 O, S 및 N으로부터 선택되는 하나 이상의(바람직하게는 1개, 2개 또는 3개의) 헤테로원자를 포함하는 최대 10개의 원자를 함유하는 비방향족 고리 구조이다. 모노사이클릭 기의 예에는 옥세타닐, 4,5-디하이드로-이

소옥사졸릴, 티에타닐, 피롤리디닐, 테트라하이드로푸라닐, [1,3]디옥솔라닐, 피페리디닐, 피페라지닐, [1,4]디옥사닐, 이미다졸리디닐, [1,3,5]옥사디아지나닐, 헥사하이드로-피리미디닐, [1,3,5]트리아지나닐 및 모르폴리닐 또는 이들의 산화된 버전, 예컨대 1-옥소-티에타닐 및 1,1-디옥소-티에타닐이 포함된다. 바이사이클릭 기의 예에는 2,3-디하이드로-벤조푸라닐, 벤조[1,4]디옥솔라닐, 벤조[1,3]디옥솔라닐, 크로메닐, 및 2,3-디하이드로-벤조[1,4]디옥시닐이 포함된다. 헤테로사이클릴 모이어티가 치환되는 것으로 되어 있는 경우, 헤테로사이클릴 모이어티는 바람직하게는 1 내지 4개의 치환체에 의해, 가장 바람직하게는 1 내지 3개의 치환체에 의해 치환된다.

- [0048] 화학식 I의 화합물 내의 하나 이상의 가능한 비대칭 탄소 원자의 존재는 화합물이 광학 이성체 형태, 즉 거울상 이성체 또는 부분입체 이성체 형태로 발생될 수 있음을 의미한다. 또한, 단일 결합 주위에서의 제한된 회전의 결과로서 회전장애 이성체가 발생될 수 있다. 화학식 I은 모든 이러한 가능한 이성체 형태 및 이들의 혼합물을 포함하는 것으로 의도된다. 본 발명은 화학식 I의 화합물에 대한 모든 이러한 가능한 이성체 형태 및 이들의 혼합물을 포함한다. 마찬가지로, 화학식 I은 모든 가능한 호변이성체를 포함하는 것으로 의도된다. 본 발명은 화학식 I의 화합물에 대한 모든 가능한 호변이성체 형태를 포함한다.
- [0049] 각각의 경우에, 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물은 유리 형태로, N-옥사이드로서 산화된 형태로, 또는 염 형태, 예를 들어 약물제배학적으로 유용한 염 형태로 존재한다.
- [0050] N-옥사이드는 3차 아민의 산화된 형태이거나 질소 함유 헤테로방향족 화합물의 산화된 형태이다. 이들은, 예를 들어 서적 "Heterocyclic N-oxides"(A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991)에 기재되어 있다.
- [0051] X, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, n 및 R_c의 바람직한 값은, 이들의 임의의 조합으로, 하기에 기재된 바와 같다:
- [0052] 바람직하게는, X는 O이다.
- [0053] 바람직하게는, R₁은 수소, 플루오로, 클로로, 메틸, 또는 시아노이다.
- [0054] 더 바람직하게는, R₁은 수소, 플루오로, 메틸, 또는 시아노이다.
- [0055] 가장 바람직하게는, R₁은 수소 또는 플루오로이다.
- [0056] 바람직하게는, R₂ 및 R₃은 각각 독립적으로 수소 또는 메틸이다.
- [0057] 더 바람직하게는, R₂는 수소이고, R₃은 수소 또는 메틸이거나; R₂는 수소 또는 메틸이고, R₃은 수소이다.
- [0058] 가장 바람직하게는, R₂ 및 R₃은 둘 모두 수소이다.
- [0059] 바람직하게는, R₄는 수소, 시아노, C₁-C₃ 알킬, 또는 사이클로프로필(여기서, 알킬 및 사이클로알킬은 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 메톡시 및 메틸티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)이다.
- [0060] 더 바람직하게는, R₄는 수소, 시아노, 메틸 또는 에틸(여기서, 메틸 및 에틸은 플루오로 및 메톡시로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)이다.
- [0061] 가장 바람직하게는, R₄는 메틸 또는 에틸(여기서, 메틸 및 에틸은 1 내지 3개의 플루오로 치환체 또는 메톡시로 선택적으로 치환될 수 있음)이다.
- [0062] 바람직하게는, R₅ 및 R₆은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, C₁-C₂ 알킬, C₁-C₂ 알콕시 및 C₁-C₂ 알킬티오로부터 선택되거나; R₅와 R₆은 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, C=O 또는 사이클로프로필(여기서, 사이클로프로필은 플루오로, 메틸 및 시아노로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)을 나타낸다.
- [0063] 더 바람직하게는, R₅ 및 R₆은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, 메틸, 메톡시 및 메틸티오로부터 선택되거나; R₅와 R₆은 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 사이클로프로필을 나타낸다.

- [0064] 가장 바람직하게는, R_5 및 R_6 은 각각 독립적으로 수소 및 플루오로로부터 선택된다.
- [0065] 바람직하게는, R_7 은 C_1-C_4 알킬, C_3-C_4 사이클로알킬, C_2-C_4 알케닐, 또는 C_2-C_3 알키닐(여기서, 알킬, 사이클로알킬, 알케닐, 알키닐은 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 하이드록실 및 메틸티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)이다.
- [0066] 더 바람직하게는, R_7 은 C_1-C_4 알킬, C_3-C_4 사이클로알킬, 또는 C_2-C_4 알케닐(여기서, 알킬, 사이클로알킬 및 알케닐은 플루오로, 클로로, 하이드록실, 시아노 및 메틸로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)이다.
- [0067] 가장 바람직하게는, R_7 은 메틸, 에틸, n-프로필, 이소-프로필, sec-부틸, tert-부틸, C_3-C_4 사이클로알킬, 또는 C_2-C_4 알케닐(여기서, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소-프로필, sec-부틸, tert-부틸, 사이클로알킬 및 알케닐은 플루오로, 클로로 및 메틸로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)이다.
- [0068] 바람직하게는, R_8 및 R_9 는 각각 독립적으로 수소, 플루오로, C_1-C_2 알킬 및 C_1-C_2 알콕시로부터 선택되거나; R_8 과 R_9 는 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 사이클로프로필(여기서, 사이클로프로필은 플루오로, 시아노, 및 메틸로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)을 나타낸다.
- [0069] 더 바람직하게는, R_8 및 R_9 는 각각 독립적으로 수소, 플루오로 및 메틸로부터 선택되거나; R_8 과 R_9 는 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 사이클로프로필을 나타낸다.
- [0070] 가장 바람직하게는, R_8 및 R_9 는 각각 독립적으로 수소 또는 플루오로로부터 선택된다.
- [0071] 바람직하게는, 각각의 R_{10} 은 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알킬, C_2-C_3 알케닐, C_2-C_3 알키닐, 사이클로프로필, 메톡시, 알릴옥시, 프로파르길옥시, 또는 C_1-C_2 알킬티오(여기서, 알킬, 사이클로프로필, 알케닐, 알키닐, 메톡시, 알릴옥시, 프로파르길옥시 및 알킬티오는 플루오로, 클로로, 메틸, 및 시아노로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)를 나타내고;
- [0072] n은 0, 1, 2 또는 3이다.
- [0073] 더 바람직하게는, 각각의 R_{10} 은 독립적으로 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 사이클로프로필, 메톡시 또는 메틸티오(여기서, 메틸, 사이클로프로필, 메톡시 및 메틸티오는 플루오로 및 클로로로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)를 나타내고; n은 0, 1 또는 2이다.
- [0074] 가장 바람직하게는, 각각의 R_{10} 은 독립적으로 플루오로, 클로로, 시아노 또는 메틸(여기서, 메틸, 사이클로프로필, 메톡시 및 메틸티오는 1 내지 3개의 플루오로 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)를 나타내고; n은 0, 1 또는 2이다.
- [0075] 바람직하게는, 각각의 R_c 는 독립적으로 수소, 메틸, 에틸, 알릴, 프로파르길, 및 사이클로프로필메틸(여기서, 메틸, 에틸, 알릴, 프로파르길, 및 사이클로프로필메틸 기는 플루오로 및 클로로로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)로부터 선택된다.
- [0076] 가장 바람직하게는, 각각의 R_c 는 독립적으로 메틸, 에틸, 알릴, 프로파르길, 및 사이클로프로필메틸(여기서, 메틸, 에틸, 알릴, 프로파르길, 및 사이클로프로필메틸 기는 플루오로 및 클로로로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)로부터 선택된다.
- [0077] 바람직하게는, R_{11} 은 수소, 플루오로, 클로로, 메틸 또는 시아노이다.
- [0078] 더 바람직하게는, R_{11} 은 수소, 플루오로, 메틸 또는 클로로이다.
- [0079] 가장 바람직하게는, R_{11} 은 수소 또는 플루오로이다.
- [0080] 바람직하게는, R_{12} 및 R_{13} 은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, 메틸 및 하이드록실로부터 선택된다.
- [0081] 더 바람직하게는, R_{12} 및 R_{13} 은 각각 독립적으로 수소, 플루오로 및 메틸로부터 선택된다.

- [0082] 가장 바람직하게는, R_{12} 및 R_{13} 은 둘 모두 수소이다.
- [0083] 본 발명에 따른 구현예가 하기에 기재된 바와 같이 제공된다.
- [0084] 구현예 1은 상기에 정의된 바와 같은 화학식 I의 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0085] 구현예 2는, 구현예 1에 있어서, R_1 은 수소, 플루오로, 클로로, 메틸, 또는 시아노인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0086] 구현예 3은, 구현예 1 또는 구현예 2에 있어서, R_2 및 R_3 은 각각 독립적으로 수소 또는 메틸인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0087] 구현예 4는, 구현예 1, 구현예 2 또는 구현예 3 중 어느 하나에 있어서, R_4 는 수소, 시아노, C_1-C_3 알킬, 또는 사이클로프로필(여기서, 알킬 및 사이클로알킬은 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 메톡시 및 메틸티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0088] 구현예 5는, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3 또는 구현예 4 중 어느 하나에 있어서, R_5 및 R_6 은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, C_1-C_2 알킬, C_1-C_2 알콕시 및 C_1-C_2 알킬티오로부터 선택되거나; R_5 와 R_6 은 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, C=O 또는 사이클로프로필(여기서, 사이클로프로필은 플루오로, 메틸 및 시아노로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)을 나타내는, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0089] 구현예 6은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4 또는 구현예 5 중 어느 하나에 있어서, R_7 은 C_1-C_4 알킬, C_3-C_4 사이클로알킬, C_2-C_4 알케닐, 또는 C_2-C_3 알키닐(여기서, 알킬, 사이클로알킬, 알케닐, 알키닐은 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 하이드록실 및 메틸티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0090] 구현예 7은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5 또는 구현예 6 중 어느 하나에 있어서, R_8 및 R_9 는 각각 독립적으로 수소, 플루오로, C_1-C_2 알킬 및 C_1-C_2 알콕시로부터 선택되거나; R_8 과 R_9 는 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 사이클로프로필(여기서, 사이클로프로필은 플루오로, 시아노, 및 메틸로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)을 나타내는, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0091] 구현예 8은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6 또는 구현예 7 중 어느 하나에 있어서, 각각의 R_{10} 은 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알킬, C_2-C_3 알케닐, C_2-C_3 알키닐, 사이클로프로필, 메톡시, 알릴옥시, 프로파르길옥시, 또는 C_1-C_2 알킬티오(여기서, 알킬, 사이클로프로필, 알케닐, 알키닐, 메톡시, 알릴옥시, 프로파르길옥시 및 알킬티오는 플루오로, 클로로, 메틸, 및 시아노로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)를 나타내고;
- [0092] n 은 0, 1, 2 또는 3인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0093] 구현예 9는, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7 또는 구현예 8 중 어느 하나에 있어서, 각각의 R_c 는 독립적으로 수소, 메틸, 에틸, 알릴, 프로파르길, 및 사이클로프로필메틸(여기서, 메틸, 에틸, 알릴, 프로파르길, 및 사이클로프로필메틸 기는 플루오로 및 클로로로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)로부터 선택되는, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0094] 구현예 10은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8 또는 구현예 9 중 어느 하나에 있어서, R_1 은 수소, 플루오로, 메틸, 또는 시아노인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0095] 구현예 11은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9 또는 구현예 10 중 어느 하나에 있어서, R_2 는 수소이고, R_3 은 수소 또는 메틸이거나; R_2 는 수소 또는 메틸이고, R_3

은 수소인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.

- [0096] 구현예 12는, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10 또는 구현예 11 중 어느 하나에 있어서, R₄는 수소, 시아노, 메틸 또는 에틸(여기서, 메틸 및 에틸은 플루오로 및 메톡시로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0097] 구현예 13은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11 또는 구현예 12 중 어느 하나에 있어서, R₅ 및 R₆은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, 메틸, 메톡시 및 메틸티오로부터 선택되거나; R₅와 R₆은 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 사이클로프로필을 나타내는, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0098] 구현예 14는, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12 또는 구현예 13 중 어느 하나에 있어서, R₇은 C₁-C₄ 알킬, C₃-C₄ 사이클로알킬, 또는 C₂-C₄ 알케닐(여기서, 알킬, 사이클로알킬 및 알케닐은 플루오로, 클로로, 하이드록실, 시아노 및 메틸로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0099] 구현예 15는, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13 또는 구현예 14 중 어느 하나에 있어서, R₈ 및 R₉는 각각 독립적으로 수소, 플루오로 및 메틸로부터 선택되거나; R₈과 R₉는 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 사이클로프로필을 나타내는, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0100] 구현예 16은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14 또는 구현예 15 중 어느 하나에 있어서, 각각의 R₁₀은 독립적으로 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 사이클로프로필, 메톡시 또는 메틸티오(여기서, 메틸, 사이클로프로필, 메톡시 및 메틸티오는 플루오로 및 클로로로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)를 나타내고; n은 0, 1 또는 2인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0101] 구현예 17은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15 또는 구현예 16 중 어느 하나에 있어서, 각각의 R_c는 독립적으로 메틸, 에틸, 알릴, 프로파르길, 및 사이클로프로필메틸(여기서, 메틸, 에틸, 알릴, 프로파르길, 및 사이클로프로필메틸 기는 플루오로 및 클로로로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)로부터 선택되는, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0102] 구현예 18은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15, 구현예 16 또는 구현예 17 중 어느 하나에 있어서, R₁은 수소 또는 플루오로인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0103] 구현예 19는, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15, 구현예 16, 구현예 17 또는 구현예 18 중 어느 하나에 있어서, R₂ 및 R₃은 둘 모두 수소인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0104] 구현예 20은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15, 구현예 16, 구현예 17, 구현예 18 또는 구현예 19 중 어느 하나에 있어서, R₄는 메틸 또는 에틸(여기서, 메틸 및 에틸은 1 내지 3개의 플루오로 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0105] 구현예 21은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15, 구현예 16, 구현예 17, 구현예 18, 구현예 19 또는 구현예 20 중 어느 하나에 있어서, R₅ 및 R₆은 각각 독립적으로 수소 및 플루오로로부터 선택되는, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.
- [0106] 구현예 22는, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9,

구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15, 구현예 16, 구현예 17, 구현예 18, 구현예 19, 구현예 20 또는 구현예 21 중 어느 하나에 있어서, R₇은 메틸, 에틸, n-프로필, 이소-프로필, sec-부틸, tert-부틸, C₃-C₄ 사이클로알킬, 또는 C₂-C₄ 알케닐(여기서, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소-프로필, sec-부틸, tert-부틸, 사이클로알킬 및 알케닐은 플루오로, 클로로 및 메틸로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.

[0107] 구현예 23은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15, 구현예 16, 구현예 17, 구현예 18, 구현예 19, 구현예 20, 구현예 21 또는 구현예 22 중 어느 하나에 있어서, R₈ 및 R₉는 각각 독립적으로 수소 또는 플루오로로부터 선택되는, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.

[0108] 구현예 24는, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15, 구현예 16, 구현예 17, 구현예 18, 구현예 19, 구현예 20, 구현예 21, 구현예 22 또는 구현예 23 중 어느 하나에 있어서, 각각의 R₁₀은 독립적으로 플루오로, 클로로, 시아노 또는 메틸(여기서, 메틸, 사이클로프로필, 메톡시 및 메틸티오는 1 내지 3개의 플루오로 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)을 나타내고; n은 0, 1 또는 2인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.

[0109] 구현예 25는, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15, 구현예 16, 구현예 17, 구현예 18, 구현예 19, 구현예 20, 구현예 21, 구현예 22, 구현예 23 또는 구현예 24 중 어느 하나에 있어서, R₁₁은 수소, 플루오로, 클로로, 메틸 또는 시아노인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다. 구현예 26은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15, 구현예 16, 구현예 17, 구현예 18, 구현예 19, 구현예 20, 구현예 21, 구현예 22, 구현예 23, 구현예 24 또는 구현예 25 중 어느 하나에 있어서, R₁₂ 및 R₁₃은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, 메틸 및 하이드록실로부터 선택되는, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.

[0110] 구현예 27은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15, 구현예 16, 구현예 17, 구현예 18, 구현예 19, 구현예 20, 구현예 21, 구현예 22, 구현예 23, 구현예 24, 구현예 25 또는 구현예 26 중 어느 하나에 있어서, R₁₁은 수소, 플루오로, 메틸 또는 클로로인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.

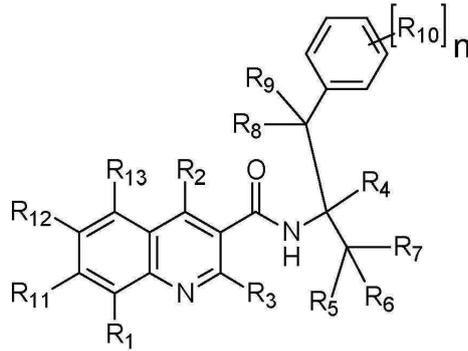
[0111] 구현예 28은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15, 구현예 16, 구현예 17, 구현예 18, 구현예 19, 구현예 20, 구현예 21, 구현예 22, 구현예 23, 구현예 24, 구현예 25, 구현예 26 또는 구현예 27 중 어느 하나에 있어서, R₁₂ 및 R₁₃은 각각 독립적으로 수소, 플루오로 및 메틸로부터 선택되는, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.

[0112] 구현예 29는, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15, 구현예 16, 구현예 17, 구현예 18, 구현예 19, 구현예 20, 구현예 21, 구현예 22, 구현예 23, 구현예 24, 구현예 25, 구현예 26, 구현예 27 또는 구현예 28 중 어느 하나에 있어서, R₁₁은 수소 또는 플루오로인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.

[0113] 구현예 30은, 구현예 1, 구현예 2, 구현예 3, 구현예 4, 구현예 5, 구현예 6, 구현예 7, 구현예 8, 구현예 9, 구현예 10, 구현예 11, 구현예 12, 구현예 13, 구현예 14, 구현예 15, 구현예 16, 구현예 17, 구현예 18, 구현예 19, 구현예 20, 구현예 21, 구현예 22, 구현예 23, 구현예 24, 구현예 25, 구현예 26, 구현예 27, 구현예 28 또는 구현예 29 중 어느 하나에 있어서, R₁₂ 및 R₁₃은 둘 모두 수소인, 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드를 제공한다.

[0114] 본 발명에 따른 화합물들의 한 군은 화학식 I'의 화합물들이다:

[0115] [화학식 I']

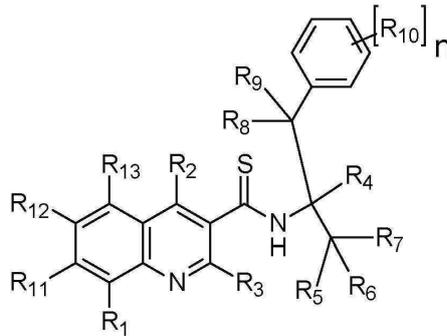


[0116]

[0117] 상기 식에서, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, n 및 R_c는 화학식 I의 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드에 대해 정의된 바와 같다. R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, n 및 R_c의 바람직한 정의는 화학식 I의 화합물에 대해 정의된 바와 같다.

[0118] 본 발명에 따른 화합물들의 한 군은 화학식 I''의 화합물들이다:

[0119] [화학식 I'']



[0120]

[0121] 상기 식에서, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, n 및 R_c는 화학식 I의 화합물, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드에 대해 정의된 바와 같다. R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, n 및 R_c의 바람직한 정의는 화학식 I의 화합물에 대해 정의된 바와 같다.

[0122] 본 발명에 따른 화합물들의 바람직한 군은 화학식 I의 화합물인 화학식 I-1의 화합물들, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드이며, 화학식 I에서 X는 O 또는 S이고; R₁은 수소, 플루오로, 클로로, 메틸, 또는 시아노이고; R₂ 및 R₃은 각각 독립적으로 수소 또는 메틸이고; R₄는 수소, 시아노, C₁-C₃ 알킬, 또는 사이클로프로필(여기서, 알킬 및 사이클로알킬은 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 메톡시, 및 메틸티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)이고; R₅ 및 R₆은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, C₁-C₂ 알킬, C₁-C₂ 알콕시 및 C₁-C₂ 알킬티오로부터 선택되거나; R₅와 R₆은 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, C=O 또는 사이클로프로필(여기서, 사이클로프로필은 플루오로, 메틸 및 시아노로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)을 나타내고; R₇은 C₁-C₄ 알킬, C₃-C₄ 사이클로알킬, C₂-C₄ 알케닐, 또는 C₂-C₃ 알키닐(여기서, 알킬, 사이클로알킬, 알케닐, 알키닐은 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 하이드록실 및 메틸티오로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)이고; R₈ 및 R₉는 각각 독립적으로 수소, 플루오로, C₁-C₂ 알킬 및 C₁-C₂ 알콕시로부터 선택되거나; R₈과 R₉는 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 사이클로프로필(여기서, 사이클로프로필은 플루오로, 시아노, 및 메틸로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)을 나타내고; 각각의 R₁₀은 독립적으로 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알킬, C₂-C₃ 알케닐, C₂-C₃ 알키닐, 사이클로프로필, 메톡시, 알릴옥시, 프로파르길옥시, 또는 C₁-C₂ 알킬티오(여기서, 알킬, 사이클로프로필, 알케닐, 알키닐, 메톡시, 알릴옥시, 프로파르길옥시 및 알킬티오는 플루오로, 클로로, 메틸, 및 시아노로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)를 나타

내고; n은 0, 1, 2 또는 3이고; R₁₁은 수소, 플루오로, 클로로, 메틸 또는 시아노이고; R₁₂ 및 R₁₃은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, 메틸 및 하이드록실로부터 선택된다.

[0123] 이 구현예에 따른 화합물들의 한 군은 화학식 I-1의 화합물인 화학식 I-1a의 화합물들이며, 화학식 I-1에서 X는 O이다.

[0124] 이 구현예에 따른 화합물들의 또 다른 군은 화학식 I-1의 화합물인 화학식 I-1b의 화합물들이며, 화학식 I-1에서 X는 S이다.

[0125] 본 발명에 따른 화합물들의 추가의 바람직한 군은 화학식 I의 화합물인 화학식 I-2의 화합물들, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드이며, 화학식 I에서 X는 O 또는 S이고; R₁은 수소, 플루오로, 메틸, 또는 시아노이고; R₂는 수소이고, R₃은 수소 또는 메틸이거나; R₂는 수소 또는 메틸이고, R₃은 수소이고; R₄는 수소, 시아노, 메틸 또는 에틸(여기서, 메틸 및 에틸은 플루오로 및 메톡시로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)이고; R₅ 및 R₆은 각각 독립적으로 수소, 플루오로, 메틸, 메톡시 및 메틸티오로부터 선택되거나; R₅와 R₆은 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 사이클로프로필을 나타내고; R₇은 C₁-C₄ 알킬, C₃-C₄ 사이클로알킬, 또는 C₂-C₄ 알케닐(여기서, 알킬, 사이클로알킬 및 알케닐은 플루오로, 클로로, 하이드록실, 시아노 및 메틸로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)이고; R₈ 및 R₉는 각각 독립적으로 수소, 플루오로 및 메틸로부터 선택되거나; R₈과 R₉는 이들이 부착되어 있는 탄소 원자와 함께, 사이클로프로필을 나타내고; 각각의 R₁₀은 독립적으로 플루오로, 클로로, 시아노, 메틸, 사이클로프로필, 메톡시 또는 메틸티오(여기서, 메틸, 사이클로프로필, 메톡시 및 메틸티오는 플루오로 및 클로로로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)를 나타내고; n은 0, 1 또는 2이고; R₁₁은 수소, 플루오로, 메틸 또는 클로로이고; R₁₂ 및 R₁₃은 각각 독립적으로 수소, 플루오로 및 메틸로부터 선택된다.

[0126] 이 구현예에 따른 화합물들의 한 군은 화학식 I-2의 화합물인 화학식 I-2a의 화합물들이며, 화학식 I-2에서 X는 O이다.

[0127] 이 구현예에 따른 화합물들의 또 다른 군은 화학식 I-2의 화합물인 화학식 I-2b의 화합물들이며, 화학식 I-2에서 X는 S이다.

[0128] 본 발명에 따른 화합물들의 추가의 바람직한 군은 화학식 I의 화합물인 화학식 I-3의 화합물들, 또는 이의 염 또는 N-옥사이드이며, 화학식 I에서 X는 O 또는 S이고; R₁은 수소 또는 플루오로이고; R₂ 및 R₃은 둘 모두 수소이고; R₄는 메틸 또는 에틸(여기서, 메틸 및 에틸은 1 내지 3개의 플루오로 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)이고; R₅ 및 R₆은 각각 독립적으로 수소 및 플루오로로부터 선택되고; R₇은 메틸, 에틸, n-프로필, 이소-프로필, sec-부틸, tert-부틸, C₃-C₄ 사이클로알킬, 또는 C₂-C₄ 알케닐(여기서, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소-프로필, sec-부틸, tert-부틸, 사이클로알킬 및 알케닐은 플루오로, 클로로 및 메틸로부터 독립적으로 선택되는 1 내지 3개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)이고; R₈ 및 R₉는 각각 독립적으로 수소 또는 플루오로로부터 선택되고; 각각의 R₁₀은 독립적으로 플루오로, 클로로, 시아노 또는 메틸(여기서, 메틸, 사이클로프로필, 메톡시 및 메틸티오는 1 내지 3개의 플루오로 치환체로 선택적으로 치환될 수 있음)을 나타내고; n은 0, 1 또는 2이고; R₁₁은 수소 또는 플루오로이고; R₁₂ 및 R₁₃은 둘 모두 수소이다.

[0129] 이 구현예에 따른 화합물들의 한 군은 화학식 I-3의 화합물인 화학식 I-3a의 화합물들이며, 화학식 I-3에서 X는 O이다.

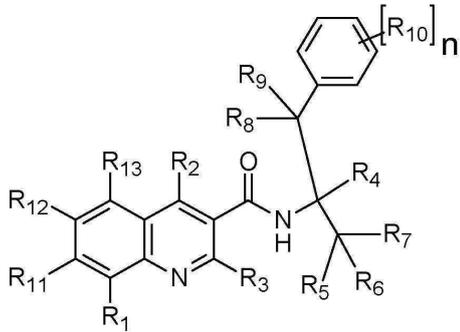
[0130] 이 구현예에 따른 화합물들의 또 다른 군은 화학식 I-3의 화합물인 화학식 I-3b의 화합물들이며, 화학식 I-3에서 X는 S이다.

[0131] 본 발명에 따른 화합물은 다수의 이득을 가질 수 있으며, 이러한 이득에는 특히, 진균에 의해 야기되는 질병에 대해 식물을 보호하기 위한 유리한 수준의 생물학적 활성 또는 농약 활성 성분으로서 사용하기에 월등한 특성(예를 들어, 더 큰 생물학적 활성, 유리한 활성 스펙트럼, 증가된 안전성 프로파일, 개선된 물리-화학적 특성, 또는 증가된 생분해성)이 포함된다.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

[0132] 화학식 I의 화합물의 구체적인 예가 하기 표 A1 내지 표 A13에 예시되어 있다: 표 A1은 248개의 화학식 I-a의 화합물을 제공한다:

[0133] [화학식 I-a]



[0134] .
 [0135] 상기 식에서, R₁, R₂ 및 R₃은 모두 H이고, R₁₁, R₁₂, R₁₃은 모두 H이고,

[0136] R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀ 및 n(R₁₀ 및 n이 존재하는 경우)의 값은 하기 표 Z에 정의된 바와 같다:

[0137] [표 Z]

항목	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	R ₈	R ₉	R ₁₀
1	H	H	H	CH ₃	H	H	-
2	H	H	H	CH ₂ CH ₃	H	H	-
3	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	-
4	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	H	-
5	H	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	-
6	H	H	H	CH=CH ₂	H	H	-
7	H	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	-
8	H	H	H	C(Cl)=CH ₂	H	H	-
9	H	H	H	C(CH ₃)=CF ₂	H	H	-
10	H	H	H	C(F)=CH ₂	H	H	-

[0138]

항목	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	R ₈	R ₉	R ₁₀
11	H	H	H	C(CH ₃) ₃	H	H	-
12	H	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	-
13	H	H	H	C(OH)(CH ₃) ₂	H	H	-
14	H	H	H	C(CN)(CH ₃) ₂	H	H	-
15	H	H	H	C(SCH ₃)(CH ₃) ₂	H	H	-
16	H	H	H	CF ₃	H	H	-
17	H	H	H	CHF ₂	H	H	-
18	H	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	-
19	H	H	H	CF ₂ Cl	H	H	-
20	H	H	H	CH=CF ₂	H	H	-
21	H	H	H	CH=C(CH ₃)H	H	H	-
22	H	H	H	CH=C(CH ₃) ₂	H	H	-
23	H	H	H	사이클로프로필	H	H	-
24	H	H	H	1-메틸사이클로프로필	H	H	-
25	H	H	H	1-플루오로사이클로프로필	H	H	-
26	H	H	H	1-시아노사이클로프로필	H	H	-
27	H	H	H	1-메틸디오사이클로프로필	H	H	-
28	H	H	H	사이클로부틸	H	H	-
29	H	H	H	1-플루오로사이클로부틸	H	H	-
30	H	H	H	3,3-디플루오로사이클로부틸	H	H	-
31	CH ₃	H	H	CH ₃	H	H	-
32	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₃	H	H	-
33	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	-
34	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	H	-
35	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	-
36	CH ₃	H	H	CH=CH ₂	H	H	-
37	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	-
38	CH ₃	H	H	C(Cl)=CH ₂	H	H	-
39	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CF ₂	H	H	-
40	CH ₃	H	H	C(F)=CH ₂	H	H	-
41	CH ₃	H	H	C(CH ₃) ₃	H	H	-
42	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	-
43	CH ₃	H	H	C(OH)(CH ₃) ₂	H	H	-
44	CH ₃	H	H	C(CN)(CH ₃) ₂	H	H	-
45	CH ₃	H	H	C(SCH ₃)(CH ₃) ₂	H	H	-
46	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	-
47	CH ₃	H	H	CHF ₂	H	H	-

[0139]

항목	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	R ₈	R ₉	R ₁₀
48	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	-
49	CH ₃	H	H	CF ₂ Cl	H	H	-
50	CH ₃	H	H	CH=CF ₂	H	H	-
51	CH ₃	H	H	CH=C(CH ₃)H	H	H	-
52	CH ₃	H	H	CH=C(CH ₃) ₂	H	H	-
53	CH ₃	H	H	사이클로프로필	H	H	-
54	CH ₃	H	H	1-메틸사이클로프로필	H	H	-
55	CH ₃	H	H	1-플루오로사이클로프로필	H	H	-
56	CH ₃	H	H	1-시아노사이클로프로필	H	H	-
57	CH ₃	H	H	1-메틸디오사이클로프로필	H	H	-
58	CH ₃	H	H	사이클로부틸	H	H	-
59	CH ₃	H	H	1-플루오로사이클로부틸	H	H	-
60	CH ₃	H	H	3,3-디플루오로사이클로부틸	H	H	-
61	H	CH ₃	H	CH ₃	H	H	-
62	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	-
63	H	사이클로프로필		CH ₃	H	H	-
64	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	-
65	H	사이클로프로필		CH ₂ CH ₃	H	H	-
66	CH ₃	H	H	H	H	H	-
67	CH ₃	H	H	F	H	H	-
68	CH ₃	H	H	Cl	H	H	-
69	CH ₂ CH ₃	H	H	H	H	H	-
70	CH ₂ CH ₃	H	H	F	H	H	-
71	CH ₂ CH ₃	H	H	Cl	H	H	-
72	CH ₂ CH ₃	H	H	CH ₃	H	H	-
73	CH ₂ CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₃	H	H	-
74	CH ₂ CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	-
75	CH ₂ CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	-
76	CH ₂ CH ₃	H	H	CH=CH ₂	H	H	-
77	CH ₂ CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	-
78	CH ₂ CH ₃	H	H	C(CH ₃) ₃	H	H	-
79	CH ₂ CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	-
80	CH ₂ CH ₃	H	H	C(CN)(CH ₃) ₂	H	H	-
81	CH ₂ CH ₃	H	H	C(SCH ₃)(CH ₃) ₂	H	H	-
82	CH ₂ CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	-
83	CH ₂ CH ₃	H	H	CHF ₂	H	H	-

[0140]

항목	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	R ₈	R ₉	R ₁₀
84	CH ₂ CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	-
85	CH ₂ CH ₃	H	H	사이클로프로필	H	H	-
86	CH ₂ CH ₃	H	H	1-메틸사이클로프로필	H	H	-
87	CH ₂ CH ₃	H	H	1-플루오로사이클로프로필	H	H	-
88	CH ₂ CH ₃	H	H	1-시아노사이클로프로필	H	H	-
89	CH ₂ CH ₃	H	H	1-메틸티오사이클로프로필	H	H	-
90	CH ₂ CH ₃	H	H	사이클로부틸	H	H	-
91	CH ₂ CH ₃	H	H	1-플루오로사이클로부틸	H	H	-
92	CH ₂ CH ₃	H	H	3,3-디플루오로사이클로부틸	H	H	-
93	CN	H	H	CH ₃	H	H	-
94	CN	H	H	CH ₂ CH ₃	H	H	-
95	CN	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	-
96	CN	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	-
97	CN	H	H	C(CH ₃) ₃	H	H	-
98	CN	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	-
99	CN	H	H	CF ₃	H	H	-
100	CH ₂ OCH ₃	H	H	CH ₃	H	H	-
101	CH ₂ OCH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	H	-
102	CH ₂ OCH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	-
103	CH ₂ OCH ₃	H	H	CH=CH ₂	H	H	-
104	CH ₂ OCH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	-
105	CH ₂ OCH ₃	H	H	C(CH ₃) ₃	H	H	-
106	CH ₂ OCH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	-
107	CH ₂ OCH ₃	H	H	CF ₃	H	H	-
108	CH ₂ OCH ₃	H	H	CHF ₂	H	H	-
109	CH ₂ OCH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	-
110	CH ₂ OCH ₃	H	H	CF ₂ Cl	H	H	-
111	CH ₂ OCH ₃	H	H	CH=CF ₂	H	H	-
112	CH ₂ OCH ₃	H	H	사이클로프로필	H	H	-
113	CH ₂ OCH ₃	H	H	1-메틸사이클로프로필	H	H	-
114	CH ₂ OCH ₃	H	H	1-플루오로사이클로프로필	H	H	-
115	CH ₂ OCH ₃	H	H	1-시아노사이클로프로필	H	H	-
116	CH ₃	F	F	H	H	H	-
117	CH ₃	F	F	F	H	H	-
118	CH ₃	F	F	CH ₃	H	H	-
119	CH ₃	F	F	CH ₂ CH ₃	H	H	-

[0141]

항목	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	R ₈	R ₉	R ₁₀
120	CH ₃	F	F	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	-
121	CH ₃	F	F	CH(CH ₃) ₂	H	H	-
122	CH ₃	F	F	C(CH ₃) ₃	H	H	-
123	CH ₃	F	F	사이클로프로필	H	H	-
124	CH ₃	F	F	1-메틸사이클로프로필	H	H	-
125	CH ₃	F	F	사이클로부틸	H	H	-
126	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	H	-
127	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F	H	H	-
128	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	-
129	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	-
130	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H	-
131	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	H	-
132	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	-
133	CH ₃	CH ₃	CH ₃	사이클로프로필	H	H	-
134	CH ₃	사이클로프로필		H	H	H	-
135	CH ₃	사이클로프로필		F	H	H	-
136	CH ₃	사이클로프로필		Cl	H	H	-
137	CH ₃	사이클로프로필		CH ₃	H	H	-
138	CH ₃	사이클로프로필		CH ₂ CH ₃	H	H	-
139	CH ₃	사이클로프로필		CH(CH ₃) ₂	H	H	-
140	CH ₃	사이클로프로필		CH=CH ₂	H	H	-
141	CH ₃	사이클로프로필		C(CH ₃)=CH ₂	H	H	-
142	CH ₃	사이클로프로필		사이클로프로필	H	H	-
143	CH ₂ CH ₃	F	F	H	H	H	-
144	CH ₂ CH ₃	F	F	F	H	H	-
145	CH ₂ CH ₃	F	F	CH ₃	H	H	-
146	CH ₂ CH ₃	F	F	CH ₂ CH ₃	H	H	-
147	CH ₂ CH ₃	F	F	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	-
148	CH ₂ CH ₃	F	F	CH(CH ₃) ₂	H	H	-
149	CH ₂ CH ₃	F	F	C(CH ₃) ₃	H	H	-
150	CH ₂ CH ₃	F	F	사이클로프로필	H	H	-
151	CH ₂ CH ₃	F	F	1-메틸사이클로프로필	H	H	-
152	CH ₂ CH ₃	F	F	사이클로부틸	H	H	-
153	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	H	-
154	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	F	H	H	-
155	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	H	H	-

[0142]

항목	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	R ₈	R ₉	R ₁₀
156	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	-
157	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	-
158	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H	-
159	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	H	-
160	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	-
161	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	사이클로프로필	H	H	-
162	CH ₂ CH ₃	사이클로프로필		H	H	H	-
163	CH ₂ CH ₃	사이클로프로필		F	H	H	-
164	CH ₂ CH ₃	사이클로프로필		Cl	H	H	-
165	CH ₂ CH ₃	사이클로프로필		CH ₃	H	H	-
166	CH ₂ CH ₃	사이클로프로필		CH ₂ CH ₃	H	H	-
167	CH ₂ CH ₃	사이클로프로필		CH(CH ₃) ₂	H	H	-
168	CH ₂ CH ₃	사이클로프로필		CH=CH ₂	H	H	-
169	CH ₂ CH ₃	사이클로프로필		C(CH ₃)=CH ₂	H	H	-
170	CH ₂ CH ₃	사이클로프로필		사이클로프로필	H	H	-
171	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	2-F
172	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	3-F
173	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	4-F
174	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	2-Cl
175	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	3-Cl
176	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	4-Cl
177	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	2-CH ₃
178	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	3-CH ₃
179	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	4-CH ₃
180	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	2-CN
181	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	3-CN
182	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	4-CN
183	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	2-SCH ₃
184	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	3-SCH ₃
185	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	H	H	4-SCH ₃
186	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	F	F	-
187	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	-
188	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂	사이클로프로필		-
189	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	2-F
190	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	3-F
191	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	4-F

[0143]

항목	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	R ₈	R ₉	R ₁₀
192	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	2-Cl
193	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	3-Cl
194	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	4-Cl
195	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	2-CH ₃
196	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	3-CH ₃
197	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	4-CH ₃
198	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	2-CN
199	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	3-CN
200	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	4-CN
201	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	2-SCH ₃
202	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	3-SCH ₃
203	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	4-SCH ₃
204	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	2-F
205	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	3-F
206	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	4-F
207	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	2-Cl
208	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	3-Cl
209	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	4-Cl
210	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	2-CH ₃
211	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	3-CH ₃
212	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	4-CH ₃
213	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	2-CN
214	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	3-CN
215	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	4-CN
216	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	2-SCH ₃
217	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	3-SCH ₃
218	CH ₃	H	H	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	4-SCH ₃
219	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	2-F
220	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	3-F
221	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	4-F
222	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	2-Cl
223	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	3-Cl
224	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	4-Cl
225	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	2-CH ₃
226	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	3-CH ₃
227	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	4-CH ₃

[0144]

항목	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	R ₈	R ₉	R ₁₀
228	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	2-CN
229	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	3-CN
230	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	4-CN
231	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	2-SCH ₃
232	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	3-SCH ₃
233	CH ₃	H	H	CF(CH ₃) ₂	H	H	4-SCH ₃
234	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	2-F
235	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	3-F
236	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	4-F
237	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	2-Cl
238	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	3-Cl
239	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	4-Cl
240	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	2-CH ₃
241	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	3-CH ₃
242	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	4-CH ₃
243	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	2-CN
244	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	3-CN
245	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	4-CN
246	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	2-SCH ₃
247	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	3-SCH ₃
248	CH ₃	H	H	CF ₂ CH ₃	H	H	4-SCH ₃

[0145]

[0146]

표 A2는, R₁₁, R₁₂, R₁₃이 모두 H이고, R₁이 플루오로이고, R₂ 및 R₃이 H이고, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀의 값이 상기 표 Z에 정의된 바와 같은, 248개의 화학식 I-a의 화합물을 제공한다.

[0147]

표 A3은, R₁₁, R₁₂, R₁₃이 모두 H이고, R₁이 클로로이고, R₂ 및 R₃이 H이고, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀의 값이 상기 표 Z에 정의된 바와 같은, 248개의 화학식 I-a의 화합물을 제공한다.

[0148]

표 A4는, R₁₁, R₁₂, R₁₃이 모두 H이고, R₁이 브로모이고, R₂ 및 R₃이 H이고, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀의 값이 상기 표 Z에 정의된 바와 같은, 248개의 화학식 I-a의 화합물을 제공한다.

[0149]

표 A5는, R₁₁, R₁₂, R₁₃이 모두 H이고, R₁이 메틸이고, R₂ 및 R₃이 H이고, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀의 값이 상기 표 Z에 정의된 바와 같은, 248개의 화학식 I-a의 화합물을 제공한다.

[0150]

표 A6은, R₁₁, R₁₂, R₁₃이 모두 H이고, R₁이 시아노이고, R₂ 및 R₃이 H이고, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀의 값이 상기 표 Z에 정의된 바와 같은, 248개의 화학식 I-a의 화합물을 제공한다.

[0151]

표 A7은, R₁₁이 플루오로이고, R₁이 H이고, R₂ 및 R₃이 H이고, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀의 값이 상기 표 Z에 정의된 바와 같은, 248개의 화학식 I-a의 화합물을 제공한다.

[0152]

표 A8은, R₁₁, R₁₂, R₁₃이 모두 H이고, R₂가 메틸이고, R₁ 및 R₃이 H이고, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀의 값이 상기 표 Z에 정의된 바와 같은, 248개의 화학식 I-a의 화합물을 제공한다.

[0153]

표 A9는, R₁₁, R₁₂, R₁₃이 모두 H이고, R₃이 메틸이고, R₁ 및 R₂가 H이고, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀의 값이 상기 표 Z에 정의된 바와 같은, 248개의 화학식 I-a의 화합물을 제공한다.

[0154]

표 A10은, R₁₁, R₁₂, R₁₃이 모두 H이고, R₂가 메틸이고, R₁이 플루오로이고, R₃이 H이고, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀의 값이 상기 표 Z에 정의된 바와 같은, 248개의 화학식 I-a의 화합물을 제공한다.

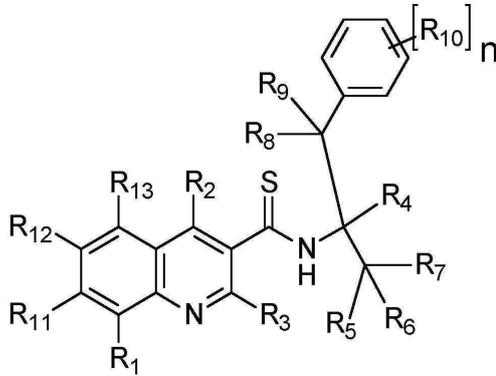
[0155]

표 A11은, R₁₁, R₁₂, R₁₃이 모두 H이고, R₃이 메틸이고, R₁이 플루오로이고, R₂가 H이고, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀의 값이 상기 표 Z에 정의된 바와 같은, 248개의 화학식 I-a의 화합물을 제공한다.

[0156] 표 A12는, R₁₂, R₁₃이 H이고, R₂ 및 R₃이 H이고, R₁ 및 R₁₁이 플루오로이고, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀의 값이 상기 표 Z에 정의된 바와 같은, 248개의 화학식 I-a의 화합물을 제공한다.

[0157] 표 A13은 248개의 화학식 I-b의 화합물을 제공한다:

[0158] [화학식 I-b]



[0159]

[0160] 상기 식에서, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₁, R₂ 및 R₃은 모두 H이고,

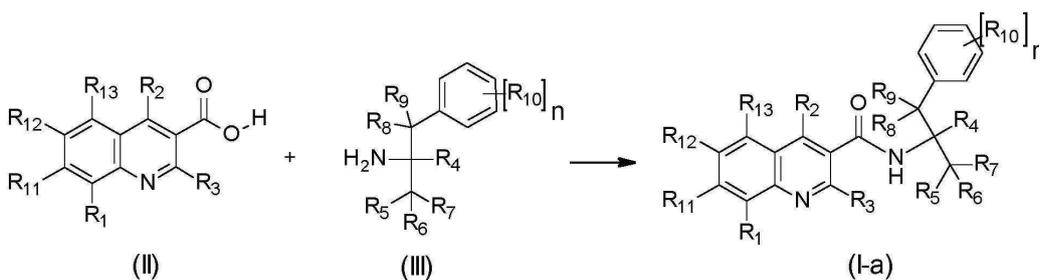
[0161] R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀의 값은 상기 표 Z에 정의된 바와 같다.

[0162] 표 A14는, R₁이 플루오로이고, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₂ 및 R₃이 H이고, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ 및 R₁₀의 값이 상기 표 Z에 정의된 바와 같은, 248개의 화학식 I-b의 화합물을 제공한다.

[0163] 본 발명의 화합물은 하기 반응도식에 나타낸 바와 같이 제조될 수 있으며, 여기서, 달리 언급되지 않는 한, 각각의 변수의 정의는 화학식 I의 화합물에 대해 상기에 정의된 바와 같다.

[0164] 반응도식 1에 나타낸 바와 같이, 일반 화학식 I-a의 화합물(여기서, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ 및 n은 화학식 I의 화합물에 대해 정의된 바와 같고, X는 O임)은 화학식 II의 화합물(여기서, R₁, R₂, R₃, R₁₁, R₁₂ 및 R₁₃은 화학식 I의 화합물에 대해 정의된 바와 같음)을 화학식 III의 아민(여기서, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀ 및 n은 화학식 I의 화합물에 대해 정의된 바와 같음)과 반응시킴으로써 제조될 수 있다.

[0165] [반응도식 1]

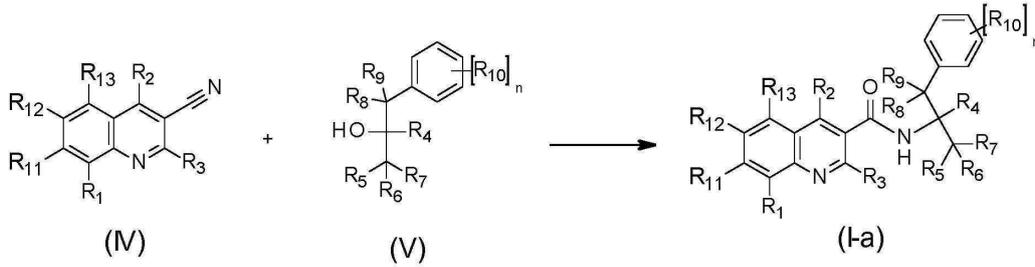


[0166]

[0167] 이러한 변환을 위한 각종 보고된 방법들 중에서, 가장 널리 적용되는 방법은, 문헌[*Chem. Soc. Rev.*, **2009**, 606-631] 또는 문헌[*Tetrahedron* **2005**, 10827-10852]에 기재된 바와 같이, 불활성 유기 용매, 예컨대 테트라하이드로퓨란(THF) 또는 디메틸포름아미드(DMF) 중에서 카르복실산(II)을 활성화제, 예컨대 염화티오닐 또는 아미드 커플링 시약, 예컨대 디사이클로헥실카르보디이미드로 처리하고, 촉매, 예컨대 디메틸아미노피리딘의 존재 하에서 아민(III)과 반응시키는 것을 수반한다.

[0168] 반응도식 2에 나타낸 바와 같이, 일반 화학식 I-a의 화합물(여기서, X는 O임)은 또한, 문헌[*Eur. J. Org. Chem.* **2015**, 2727-2732] 및 문헌[*Synthesis* **2000**, 1709-1712]에 기재된 바와 같이, -20°C 내지 +50°C의 온도에서 용매, 예컨대 디클로로메탄 또는 아세트산 중에서, 브린스테드 산, 예컨대 황산 또는 트리플루오로메탄 설펜산의 존재 하에서 화학식 IV의 화합물과 화학식 V의 화합물을 반응시킴으로써 제조될 수 있다.

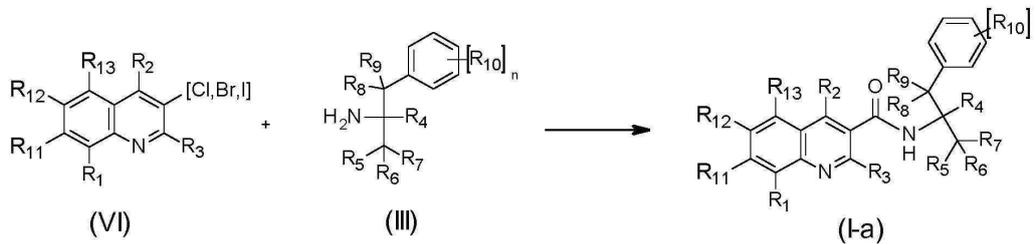
[0169] [반응도식 2]



[0170]

[0171] 대안적으로, 일반 화학식 I-a의 화합물(여기서, X는 O임)은 또한, 문헌[*Org. Lett.*, **2014**, 4296-4299 (및 그 안의 참조문헌)]에 기재되고 반응도식 3에 나타난 바와 같이, 20°C 내지 110°C의 온도에서 불활성 유기 용매, 예컨대 1,4-디옥산 중에서 화학식 VI의 화합물을 화학식 III의 아민, 일산화탄소, 염기, 예컨대 트리에틸아민 또는 탄산칼륨, 및 적합하게 지지된 전이 금속 촉매, 예컨대 팔라듐과 반응시킴으로써 제조될 수 있다.

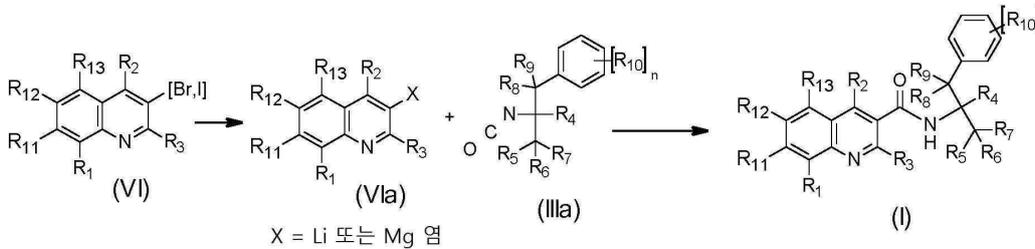
[0172] [반응도식 3]



[0173]

[0174] 대안적으로, 일반 화학식 I-a의 화합물(여기서, X는 O임)은 또한, 문헌[*Angew. Chem. Int. Ed.* **2012**, 9173-9175]에 기재되고 반응도식 4에 나타난 바와 같이, -78°C 내지 +40°C의 온도에서 불활성 유기 용매, 예컨대 디에틸 에테르 또는 THF 중에서 화학식 VIa의 유기금속 화합물을 화학식 IIIa의 이소시아네이트와 반응시킴으로써 제조될 수 있다.

[0175] [반응도식 4]

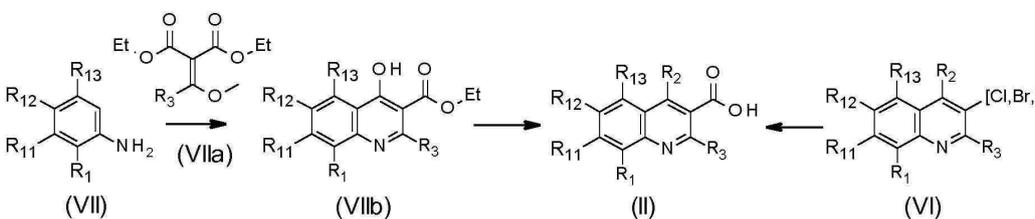


[0176]

[0177] -90°C 내지 +20°C의 온도에서 에테르 용매, 예컨대 THF 중에서 알킬 리튬 시약, 예컨대 s-부틸 리튬을 사용하는 리튬-할로겐 교환 또는 트리 n-부틸 마그네세이트를 사용하는 마그네슘-할로겐 교환에 의한 화학식 VI의 화합물로부터의 화학식 VIa의 유기금속 화합물의 제조는 당업자에게 전반적으로 알려져 있으며, 합성 화학 교재, 예컨대 문헌[*March's Advanced Organic Chemistry*]에 기재되어 있다.

[0178] 반응도식 5에 나타난 바와 같이, 화학식 II의 카르복실산은 다양한 방법에 의해 제조될 수 있으며, 다수는 구매 가능하다. 많은 보고된 그의 제조 방법들 중에서, 하기가 널리 적용되어 왔다:

[0179] [반응도식 5]



[0180]

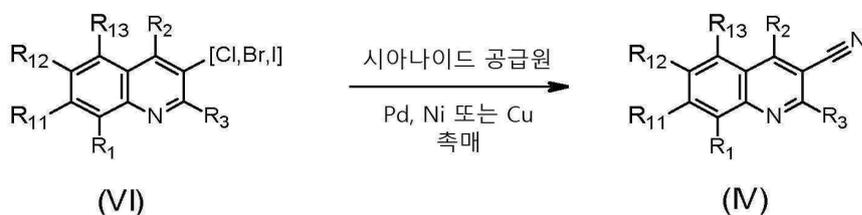
[0181] 1) US 20070015758에 기재된 바와 같이 100℃ 내지 260℃의 온도에서 불활성 용매, 예컨대 디페닐 에테르 중에서, 화학식 VII의 아닐린을 화학식 VIIa의 말로네이트 유도체와 반응시킴으로써 화학식 VIIb의 퀴놀론으로 변환시킨 후, 당업자에게 전반적으로 알려져 있고 또한 WO 2007133637에 기재된 잘 알려진 작용기 상호전환(interconversion)을 수행하는 방법.

[0182] 2) -90℃ 내지 +20℃의 온도에서 에테르 용매, 예컨대 THF 중에서 알킬 리튬 시약, 예컨대 s-부틸 리튬을 사용하여 리튬-할로젠 교환에 의해 또는 트리 n-부틸 마그네세이트를 사용하여 마그네슘-할로젠 교환에 의해 화학식 VI의 화합물을 화학식 VIa의 유기금속 중간체로 변환시키고, 후속으로 CO₂와 반응시키는 방법.

[0183] 3) 문헌[J. Am. Chem. Soc. **2013**, 2891-2894 (및 그 안의 참고문헌)] 또는 문헌[Tetrahedron **2003**, 8629-8640]에 기재된 바와 같이, 일산화탄소 공급원, 염기, 예컨대 트리에틸아민, 물 또는 이의 등가물, 및 예를 들어 팔라듐을 함유하는 적합하게 연결된 전이 금속 촉매의 존재 하에서 화학식 VI의 화합물을 변환시키는 방법.

[0184] 반응도식 6에 나타낸 바와 같이, 화학식 IV의 화합물은 문헌[J. Org. Chem. **2011**, 665-668] 또는 문헌[Bull. Chem. Soc. Jpn. **1993**, 2776-8]에 기재된 바와 같이 화학식 VI의 화합물로부터 제조될 수 있는데, 이는, 20℃ 내지 150℃의 온도에서 불활성 용매, 예컨대 DMF 중에서 팔라듐, 니켈 또는 구리 촉매의 존재 하에서 화학식 IV의 화합물을 시아나이드 공급원, 예컨대 시안화아연으로 처리함으로써 행해진다.

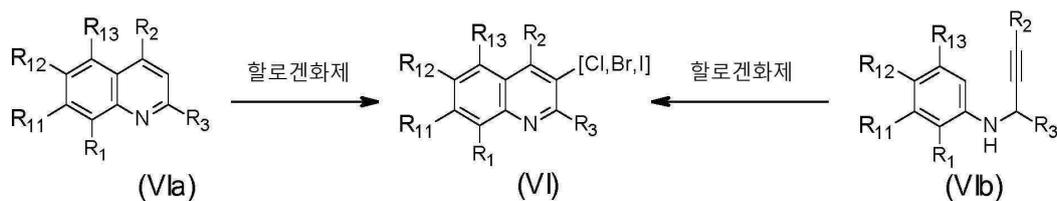
[0185] [반응도식 6]



[0186]

[0187] 반응도식 7에 나타낸 바와 같이, 화학식 VI의 화합물은 WO 2005113539 또는 JP 2001322979에 기재된 바와 같이 불활성 용매 중에서 화학식 VIa의 화합물을 할로젠화제, 예컨대 N-요오도석신이미드, 브롬 또는 염소로 처리함으로써 제조될 수 있다. 대안적으로, 화학식 VI의 화합물은 문헌[Org. Lett. **2005**, 763-766]에 기재된 바와 같이 0℃ 내지 80℃의 온도에서 불활성 용매, 예컨대 아세트니트릴 및 염기, 예컨대 탄산수소나트륨 중에서 화학식 VIb의 프로파르길화 아닐린을 할로젠화제, 예컨대 요오드로 처리함으로써 제조될 수 있다.

[0188] [반응도식 7]



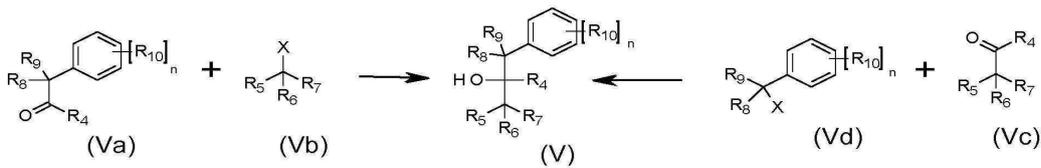
[0189]

[0190] 화학식 VIb의 프로파르길화 아닐린을 상응하는 구매 가능한 아닐린으로부터 제조하는 것은 당업자에게 간단한 일이며 문헌[March's Advanced Organic Chemistry, Smith and March, 6th edition, Wiley, 2007]에 기재되어 있다.

[0191] 화학식 VIa의 화합물의 합성은 당업자에게 전반적으로 알려져 있으며, 다수의 화합물이 구매 가능하다.

[0192] 반응도식 8에 나타낸 바와 같이, 화학식 V의 화합물은 화학식 Va 또는 화학식 Vc의 카르보닐 화합물로부터 제조될 수 있는데, 이는, -90℃ 내지 60℃의 온도에서 불활성 용매, 예컨대 디에틸 에테르 중에서 화학식 Va 또는 화학식 Vc의 카르보닐 화합물을 각각 화학식 Vb 또는 화학식 Vd의 유기금속중(여기서, X는 리튬, 알루미늄- 또는 마그네슘-염임)으로 처리함으로써 행해진다.

[0193] [반응도식 8]



[0194]

[0195] 화학식 Vb 및 화학식 Vd를 갖는 시약의 일반적인 제조, 취급 및 반응성은 문헌[*March's Advanced Organic Chemistry*, Smith and March, 6th edition, Wiley, 2007]에 기재되어 있으며, 당업자에게 전반적으로 알려져 있다. 화학식 Va 및 화학식 Vc의 다수의 화합물(여기서, 은 $R_4, R_5, R_6, R_7, R_8, R_9$ 및 R_{10} 은 상기에 정의된 바와 같음)은 또한 구매 가능하며, 이들의 합성은 과학 문헌 및 합성 화학 교재(예컨대, 문헌[*March's Advanced Organic Chemistry*])에 잘 기재되어 있으며, 추가로 당업자에게 전반적으로 알려져 있다.

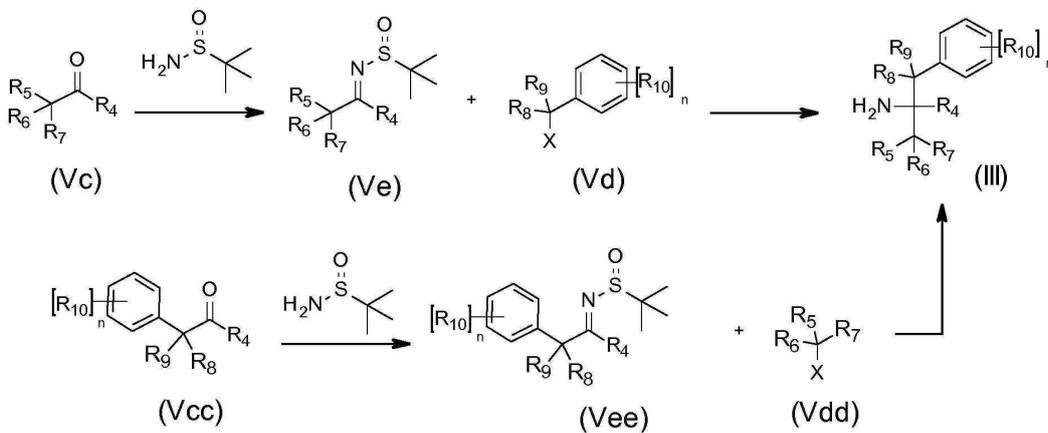
[0196]

반응도식 9에 나타난 바와 같이, 화학식 III의 아민은 화학식 Vc의 화합물로부터 제조될 수 있는데, 이는, 탈수제, 예컨대 $Ti(OEt)_4$ 의 존재 하에서 화학식 Vc의 화합물을 tert-부틸 설피아미드와 축합시켜 화학식 Ve의 설피민을 형성하고, 이어서 $-78^\circ C$ 내지 $+70^\circ C$ 의 온도에서 불활성 용매, 예컨대 THF 중에서 이것을 화학식 Vd의 유기금속 시약(여기서, X는 리튬, 알루미늄- 또는 마그네슘-염임)으로 처리할 수 있으며, 후속으로 설피아미드의 산성 가수분해함으로써 행해지며; 순서는 당업자에게 전반적으로 알려져 있으며, 또한 문헌[*Chem. Rev.* 2010, 3600-3740]에 기재되어 있다.

[0197]

대안적으로, 화학식 III의 아민은 화학식 Vcc의 화합물로부터 제조될 수 있는데, 이는, 탈수제, 예컨대 $Ti(OEt)_4$ 의 존재 하에서 화학식 Vcc의 화합물을 tert-부틸 설피아미드와 축합시켜 화학식 Vee의 설피민을 형성하고, 이어서 $-78^\circ C$ 내지 $+70^\circ C$ 의 온도에서 불활성 용매, 예컨대 THF 중에서 이것을 화학식 Vdd의 유기금속 시약(여기서, X는 리튬, 알루미늄- 또는 마그네슘-염임)으로 처리할 수 있으며, 후속으로 설피아미드의 산성 가수분해함으로써 행해진다.

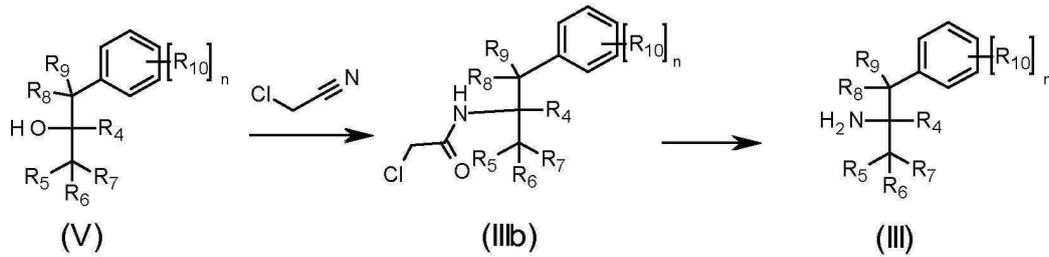
[0198] [반응도식 9]



[0199]

[0200] 대안적으로, 화학식 III의 아민은 또한, 문헌[*Synthesis* 2000, 1709 -1712]에 기재되고, 반응도식 10 나타난 바와 같이 화학식 V의 알코올로부터 제조될 수 있는데, 이는, $-10^\circ C$ 내지 $50^\circ C$ 의 온도에서 유기 용매, 예컨대 아세트산 중에서 클로로아세트니트릴의 존재 하에서 화학식 V의 알코올을 강산, 예컨대 황산으로 처리하여 화학식 IIIb의 아미드를 생성하고, 이는 $20^\circ C$ 내지 $100^\circ C$ 의 온도에서 유기 용매, 예컨대 에탄올 또는 아세트산 중에서 티오우레아에 의해 탈보호될 수 있음으로써 행해진다.

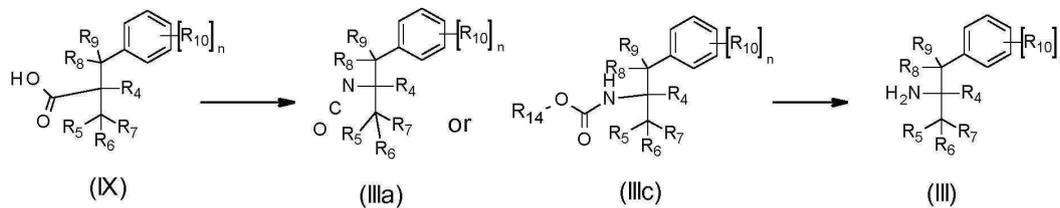
[0201] [반응도식 10]



[0202]

[0203] 대안적으로, 화학식 III의 아민은 또한, 반응도식 11에 나타낸 바와 같이 화학식 IX의 카르복실산으로부터 중간 단계의 화학식 IIIa의 이소시아네이트 또는 화학식 IIIc의 카르바메이트(여기서, R₁₄는 C₁-C₄ 알킬임)를 통해 제조될 수 있는데, 상기 중간단계의 물질이 0℃ 내지 100℃의 온도에서 수성 산 또는 염기에 의해 가수분해될 수 있다.

[0204] [반응도식 11]



[0205]

[0206] 이소시아네이트(IIIa)로의 산(IX)의 변환에 대해 보고된 다양한 프로토콜 중에서, 하기가 광범위하게 응용되었다:

[0207] 1) 문헌[Aust. J. Chem., 1973, 1591-3]에 기재된 바와 같이, 50℃ 내지 120℃의 온도에서 불활성 유기 용매, 예컨대 톨루엔 중에서 산(IX)을 디페닐포스포릴 아지드 및 아민 염기, 예컨대 트리부틸아민으로 처리하여 이소시아네이트(IIIa)를 생성함.

[0208] 2) 문헌[Synthesis 2011, 1477-1483]에 기재된 바와 같이, 20℃ 내지 100℃의 온도에서 불활성 용매, 예컨대 THF 중에서 아지드 공급원, 예컨대 아지드화나트륨 및 아민 염기, 예컨대 트리에틸 아민의 존재 하에서 산(IX)을 활성화제, 예컨대 염화티오닐 또는 프로필포스포산 무수물로 처리함.

[0209] 3) 산(IX)을 상응하는 하이드록삼산으로 전환시키고, 이어서 이는 20℃ 내지 120℃의 온도에서 불활성 유기 용매, 예컨대 톨루엔 중에서 탈수제, 예컨대 파라-톨루엔설포닐 클로라이드 및 염기, 예컨대 트리에틸아민으로 처리될 수 있음.

[0210] 4) 문헌[J. Org. Chem. 1984, 4212-4216]에 기재된 바와 같이, 산(IX)을 상응하는 1차 카르복사미드로 전환시키고, 이어서 이는 0℃ 내지 100℃의 온도에서 용매, 예컨대 아세트니트릴 중에서 산화제, 예컨대 디아세톡시 요오도벤젠 및 산, 예컨대 트리플루오로아세트산 또는 파라-톨루엔설포산으로 처리될 수 있음.

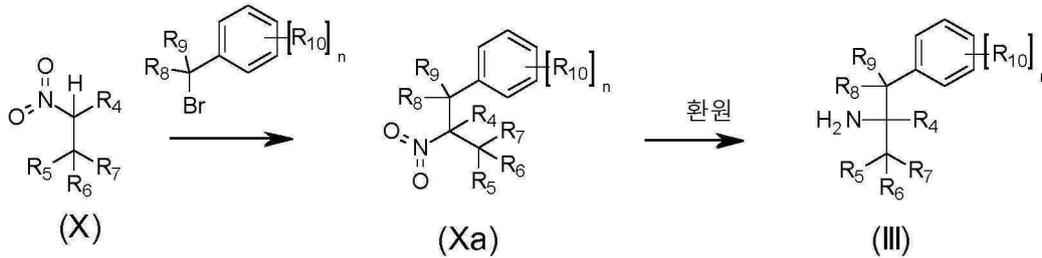
[0211] 5) 산(IX)을 상응하는 1차 카르복사미드로 전환시키고, 이어서 이는 0℃ 내지 100℃의 온도에서 용매, 예컨대 물 또는 메탄올 중에서 산화제, 예컨대 브롬 및 염기, 예컨대 수산화나트륨으로 처리될 수 있음.

[0212] 당업자는 화학식 IX의 카르복실산이 상응하는 에스테르로부터 제조될 수 있음을 이해할 것이다. 유사하게, 당업자는 문헌[March's Advanced Organic Chemistry, Smith and March, 6th edition, Wiley, 2007]에 기재된 바와 같이, 이들 에스테르의 알파 위치가 -78℃ 내지 20℃의 온도에서 불활성 용매, 예컨대 THF 중에서 강염기, 예컨대 리튬 디이소프로필아민에 의한 탈보호에 의해 작용화된 후, 친전자성 시약, 예컨대 알킬 요오다이드와 반응할 수 있음을 이해할 것이다. 이 반응을 반복하여, 구매 가능한 에스테르로부터 화학식 IX의 산을 제조할 수 있다.

[0213] 대안적으로, 화학식 III의 아민은 또한, 반응도식 12에 나타낸 바와 같이 20℃ 내지 120℃의 온도에서 유기 용매, 예컨대 아세트산 중에서 화학식 Xa의 니트로 화합물을 환원제, 예컨대 철로 환원시킴으로써 제조될 수 있다. 다시, 화학식 Xa의 니트로 화합물은 문헌[J. Am. Chem. Soc. 2012, 9942-9945]에 기재된 바와 같이 화학

식 X의 더 단순한 니트로 화합물로부터 제조될 수 있는데, 이는, 20℃ 내지 100℃의 온도에서 불활성 용매, 예컨대 헥산 중에서 구리 촉매의 존재 하에서 화학식 X의 니트로 화합물을 벤질 브로마이드 및 염기, 예컨대 나트륨 tert-부톡사이드로 처리함으로써 행해진다.

[0214] [반응도식 12]

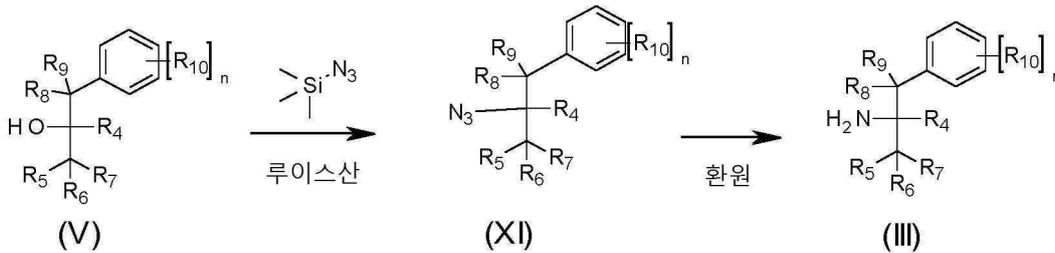


[0215]

[0216] 화학식 X의 화합물의 합성은 당업자에게 전반적으로 알려져 있으며, 다수가 구매 가능하다.

[0217] 대안적으로, 화학식 III의 아민은 또한, 문헌[*J. Am. Chem. Soc.* **2015**, 9555-9558]에 기재된 바와 같이 0℃ 내지 100℃의 온도에서 불활성 용매, 예컨대 톨루엔 중에서 화학식 V의 화합물을 트리메틸실릴 아지드 및 루이스산 촉매, 예컨대 B(C₆F₆)₃로 처리한 후, 반응도식 13에 나타난 바와 같이 0℃ 내지 80℃의 온도에서 유기 용매, 예컨대 메탄올 중에서 화학식 XI의 중간단계의 아지드를 환원제, 예컨대 수소/팔라듐으로 환원시킴으로써 제조될 수 있다.

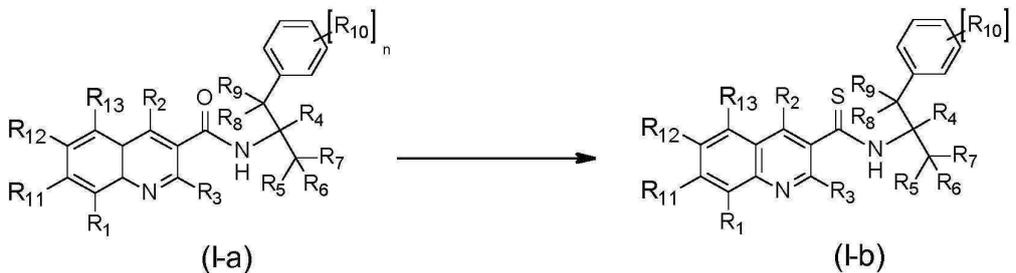
[0218] [반응도식 13]



[0219]

[0220] 반응도식 14에 나타난 바와 같이, 일반 화학식 I-b의 화합물(여기서, X는 S임)은 일반 화학식 I-a의 화합물(여기서, X는 O임)로부터 제조될 수 있는데, 이는, 일반 화학식 I-a의 화합물을 20℃ 내지 150℃의 온도에서 불활성 유기 용매, 예컨대 톨루엔 중에서 테옥소티오네이트화제, 예컨대 P₄S₁₀ 또는 라베슨(Lawesson) 시약으로 처리함으로써 행해진다.

[0221] [반응도식 14]

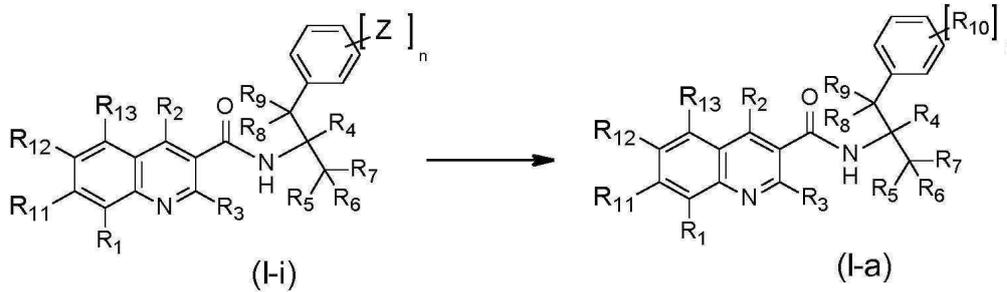


[0222]

[0223] 대안적으로, 화학식 I-a의 화합물(여기서, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ 및 n은 화학식 I의 화합물에 대해 정의된 바와 같고, X는 O임)은 염기의 존재 또는 부재 하에서, 그리고 커플링 시약 및 금속 촉매의 존재 하에서 용매 중에서 화학식 I-i의 화합물(여기서, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₁, R₁₂, R₁₃ 및 n은 화학식 I에 대해 정의된 바와 같으며, X는 O이고, Z는 염소, 브롬 또는 요오드를 나타냄)을 환원시킴으로써 수득될 수 있다. 통상의 커플링 반응에 사용된다면, 커플링제, 촉매, 용매 및 염기에 대한 특별한 제한은 없으며, 예컨대 문헌["Cross-Coupling Reactions: A Practical Guide (Topics in Current Chemistry)", edited by Norio Miyaura und S.L. Buchwald (editions Springer)], 또는 문헌["Metal-Catalyzed Cross-

Coupling Reactions", edited by Armin de Meijere and François Diederich (editions WILEY-VCH)]에 기재된 것들이다. 이는 반응도식 15에 나타나 있다.

[0224] [반응도식 15]



[0225]

[0226] 대안적으로, 화학식 I-a의 화합물(여기서, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃ 및 n은 화학식 I의 화합물에 대해 정의된 바와 같으며, X는 O임)은, 당업자에게 공지된 표준 합성 기법을 사용하여, 또 다른 밀접하게 관련된 화학식 I-a의 화합물을 변환시킴으로써 수득될 수 있다. 완전히 망라되지 않은 예에는 산화 반응, 환원 반응, 가수분해 반응, 커플링 반응, 방향족 친핵성 또는 친전자성 치환 반응, 친핵성 치환 반응, 친핵성 부가 반응, 및 할로겐화 반응이 포함된다.

[0227] 상기 반응도식에 기재된 소정의 중간체는 신규하며, 그 자체로서 본 발명의 추가의 양태를 형성한다.

[0228] 화학식 I의 화합물은, 예를 들어 인간에게 잠재적으로 해로운 부패 미생물 또는 유기체를 방제하기 위하여 무생물 재료 상에 또는 식물 해충을 방제하기 위한 활성 성분으로서 농업 부문 및 관련 사용 분야에 사용될 수 있다. 신규 화합물들은, 식물이 우수한 내성을 나타냄으로써 그리고 환경적으로 안전함으로써, 낮은 적용률에서의 탁월한 활성에 의해 구별된다. 이들은 매우 유용한 근치적, 예방적 그리고 침투적(systemic) 특성을 갖고, 다수의 재배 식물을 보호하는 데 사용될 수 있다. 화학식 I의 화합물은 유용한 식물의 상이한 작물들의 식물 또는 식물의 부분들(열매, 꽃, 잎, 줄기, 괴경, 뿌리) 상에서 발생하는 해충을 억제 또는 구제하면서, 동시에 또한, 예를 들어 식물병원성 미생물로부터, 추후에 성장하는 식물의 부분들을 보호하는 데 사용될 수 있다.

[0229] 또한, 살진균제로서 화학식 I의 화합물을 사용할 수 있다. 본 명세서에 사용되는 바와 같이, 용어 "살진균제"는 진균의 성장을 방제, 변형, 또는 예방하는 화합물을 의미한다. 용어 "살진균 유효량"은 진균의 성장에 대해 효과를 생성할 수 있는 이러한 화합물 또는 이러한 화합물들의 병용물의 양을 의미한다. 방제 또는 변형 효과는 자연적인 발달로부터의 모든 일탈, 예컨대 사멸, 지연 등을 포함하고, 예방은 진균 감염을 예방하기 위한 식물 내 또는 식물 상에서의 장벽 또는 다른 방어 형성을 포함한다.

[0230] 또한, 진균 감염에 대해 그리고 토양에서 발생하는 식물병원성 진균에 대해 보호하기 위하여, 식물 번식 재료, 예를 들어 종자, 예컨대 열매, 괴경 또는 낱알(grain), 또는 식물 삼수(plant cutting)(예를 들어, 벼)의 처리를 위한 분의제(dressing agent)로서 화학식 I의 화합물을 사용하는 것이 가능하다. 번식 재료는 식재(planting) 전에 화학식 I의 화합물을 포함하는 조성물로 처리될 수 있다: 예를 들어, 종자는 파종 전에 분의될 수 있다. 화학식 I의 화합물은 또한, 액체 제형 중에 종자를 침지함으로써 또는 고체 제형으로 코팅함으로써 낱알에 적용될 수 있다(코팅). 본 조성물은 또한, 번식 재료가, 예를 들어 파종 동안 종자 고랑에 식재되는 경우, 식재 부지에 적용될 수 있다. 본 발명은 또한 식물 번식 재료를 처리하는 방법 및 그렇게 처리된 식물 번식 재료에 관한 것이다.

[0231] 더욱이, 본 발명에 따른 화합물은 관련 분야에서, 예를 들어, 목재 및 목재 관련 공업 제품을 포함한 공업 재료의 보호에 있어서, 식품 저장에 있어서, 위생 관리에 있어서 진균을 방제하는 데 사용될 수 있다.

[0232] 게다가, 본 발명은 진균 공격으로부터 무생물 재료, 예를 들어 림버(lumber), 벽판(wall board) 및 페인트를 보호하는 데 사용될 수 있다.

[0233] 화학식 I의 화합물 및 이를 함유하는 살진균 조성물은 광범위한 스펙트럼의 진균 식물 병원체에 의해 야기되는 식물 질병을 방제하는 데 사용될 수 있다. 이것은 광범위한 스펙트럼의 식물 질병, 예컨대 관상용 작물, 잔디 작물, 채소류 작물, 밭작물(field crop), 곡류 작물, 및 과실 작물의 잎(foliar) 병원체를 방제하는 데 효과적이다.

- [0234] 방제될 수 있는, 질병의 이러한 진균 및 진균 벡터뿐만 아니라 식물병원성 세균 및 바이러스는, 예를 들어 하기 와 같다:
- [0235] 아브시디아 코림비페라(*Absidia corymbifera*), 알테르나리아 종(*Alternaria* spp.), 아파노미세스 종(*Aphanomyces* spp.), 아스코키타 종(*Ascochyta* spp.), 아스페르길루스 종(*Aspergillus* spp.), 예컨대 *A. 플라 부스*(*A. flavus*), *A. 푸미가투스*(*A. fumigatus*), *A. 니둘란스*(*A. nidulans*), *A. 니게르*(*A. niger*), *A. 테루스*(*A. terreus*), 아우레오바시디움 종(*Aureobasidium* spp.), 예컨대 *A. 풀루란스*(*A. pullulans*), 블라스토미세스 데르마티티디스(*Blastomyces dermatitidis*), 블루메리아 그라미니스(*Blumeria graminis*), 브레미아 락투카이(*Bremia lactucae*), 보트리오스파이리아 종(*Botryosphaeria* spp.), 예컨대 *B. 도티데아*(*B. dothidea*), *B. 옵투스 사*(*B. obtusa*), 보트리티스 종(*Botrytis* spp.), 예컨대 *B. 시네레아*(*B. cinerea*), 칸디다 종(*Candida* spp.), 예컨대 *C. 알비칸스*(*C. albicans*), *C. 글라브라타*(*C. glabrata*), *C. 크루세이*(*C. krusei*), *C. 루시타니아이*(*C. lusitaniae*), *C. 파라프실로시스*(*C. parapsilosis*), *C. 트로피칼리스*(*C. tropicalis*), 세팔로아스쿠스 프라그 란스(*Cephaloascus fragrans*), 세라토시스티스 종(*Ceratocystis* spp.), 세르코스포라 종(*Cercospora* spp.), 예 컨대 *C. 아라키디콜라*(*C. arachidicola*), 세르코스포리디움 페르소나툼(*Cercosporidium personatum*), 클라도스 포리움 종(*Cladosporium* spp.), 클라비셉스 푸르푸레아(*Claviceps purpurea*),
- [0236] 콕시디오이테스 임미티스(*Coccidioides immitis*), 코클리올볼루스 종(*Cochliobolus* spp.), 콜레토티리쿰 종(*Colletotrichum* spp.), 예컨대 *C. 무스아이*(*C. musae*),
- [0237] 크립토크쿠스 네오포르만스(*Cryptococcus neoformans*), 디아포르테 종(*Diaporthe* spp.), 디디멜라 종(*Didymella* spp.), 드레크슬레라 종(*Drechslera* spp.), 엘시노에 종(*Elsinoe* spp.),
- [0238] 에피데르모피톤 종(*Epidermophyton* spp.), 에르위니아 아밀로보라(*Erwinia amylovora*), 에리시페 종(*Erysiphe* spp.), 예컨대 *E. 시코라세아룸*(*E. cichoracearum*),
- [0239] 유티파 라타(*Eutypa lata*), 푸사리움 종(*Fusarium* spp.), 예컨대 *F. 쿨모룸*(*F. culmorum*), *F. 그라미나룸*(*F. graminearum*), *F. 란그세티아이*(*F. langsethiae*), *F. 모닐리포르메*(*F. moniliforme*), *F. 옥시스포룸*(*F. oxysporum*), *F. 프롤리페라툼*(*F. proliferatum*), *F. 수브글루티난스*(*F. subglutinans*), *F. 솔라니*(*F. solani*), 가이우만노미세스 그라미니스(*Gaeumannomyces graminis*), 깁벨렐라 푸지쿠로이(*Gibberella fujikuroi*), 글로에 오데스 폼이게나(*Gloeodes pomigena*), 글로에오스포리움 무사룸(*Gloeosporium musarum*), 글로메렐라 신굴라테(*Glomerella cingulate*), 구이그나르디아 비드웰리이(*Guignardia bidwellii*), 김노스포란기움 주니페리-비르기 니아나이(*Gymnosporangium juniperi-virginianae*), 헬민토스포리움 종(*Helminthosporium* spp.), 헤밀레이아 종(*Hemileia* spp.), 히스토플라스마 종(*Histoplasma* spp.), 예컨대 *H. 캡슐라툼*(*H. capsulatum*), 라이티사리아 푸키포르미스(*Laetisaria fuciformis*), 렙토그라피움 린드베르기(*Leptographium lindbergi*), 레베일룰라 타우 리카(*Leveillula taurica*), 로포데르미움 세디티오슘(*Lophodermium seditiosum*), 마이크로도키움 니발레(*Microdochium nivale*), 마이크로스포룸 종(*Microsporium* spp.), 모닐리니아 종(*Monilinia* spp.), 무코르 종(*Mucor* spp.), 미코스파이렐라 종(*Mycosphaerella* spp.), 예컨대 *M. 그라미니콜라*(*M. graminicola*), *M. 포미*(*M. pomi*), 온코바시디움 테오브로마이온(*Oncobasidium theobromaeon*), 오피오스토마 피세아이(*Ophiostoma piceae*), 파라콕시디오이테스 종(*Paracoccidioides* spp.), 페니실리움 종(*Penicillium* spp.), 예컨대 *P. 디기 타툼*(*P. digitatum*), *P. 이탈리아*(*P. italicum*), 페트리엘리디움 종(*Petriellidium* spp.), 페로노스클레로스포 라 종(*Peronosclerospora* spp.), 예컨대 *P. 마이디스*(*P. maydis*), *P. 필립핀렌시스*(*P. philippinensis*) 및 *P. 소르기*(*P. sorghi*), 페로노스포라 종(*Peronospora* spp.), 파이오스파이리아 노도룸(*Phaeosphaeria nodorum*), 파콕소라 파키리지(*Phakopsora pachyrhizi*), 펠리누스 이그니아루스(*Phellinus igniarius*), 피알로포라 종(*Phialophora* spp.), 포마 종(*Phoma* spp.), 포몹시스 비티콜라(*Phomopsis viticola*), 피토프토라 종(*Phytophthora* spp.), 예컨대 *P. 인페스탄스*(*P. infestans*), 플라스모파라 종(*Plasmopara* spp.), 예컨대 *P. 할 스테디이*(*P. halstedii*), *P. 비티콜라*(*P. viticola*), 플레오스포라 종(*Pleospora* spp.), 포도스파이라 종(*Podosphaera* spp.), 예컨대 *P. 류코트리카*(*P. leucotricha*), 폴리믹사 그라미니스(*Polymyxa graminis*), 폴리 믹사 베타이(*Polymyxa betae*), 슈도세르코스포렐라 헤르포트리코이테스(*Pseudocercospora herpotrichoides*), 슈도모나스 종(*Pseudomonas* spp.), 슈도페로노스포라 종(*Pseudoperonospora* spp.), 예컨대 *P. 쿠벤시스*(*P. cubensis*), *P. 후물리*(*P. humuli*), 슈도페지자 트라케이필라(*Pseudopeziza tracheiphila*), 푹 키니아 종(*Puccinia* spp.), 예컨대 *P. 호르데이*(*P. hordei*), *P. 레콘디타*(*P. recondita*), *P. 스트리이포르미스*(*P. striiformis*), *P. 트리티키나*(*P. trititina*), 피레노페지자 종(*Pyrenopeziza* spp.), 피레노포라 종(*Pyrenophora* spp.), 피리쿨라리아 종(*Pyricularia* spp.), 예컨대 *P. 오리자이*(*P. oryzae*), 피티움 종(*Pythium* spp.), 예컨대 *P. 울티움*(*P. ultimum*), 라물라리아 종(*Ramularia* spp.), 리족토니아 종(*Rhizoctonia* spp.), 리

조무코르 푸실루스(*Rhizomucor pusillus*), 리조푸스 아리주스(*Rhizopus arrhizus*), 린코스포리움 종(*Rhynchosporium* spp.), 스킨도스포리움 종(*Scedosporium* spp.), 예컨대 *S. 아피오스페르뎀*(*S. apiospermum*) 및 *S. 프로리피칸스*(*S. prolificans*), 스킨조티리움 폼(*Schizothyrium pomi*),

[0240] 스크레로티니아 종(*Sclerotinia* spp.), 스크레로티움 종(*Sclerotium* spp.), 셉토리아 종(*Septoria* spp.), 예컨대 *S. 노도룸*(*S. nodorum*), *S. 트리티키*(*S. tritici*), 스파이로테카 마쿨라리스(*Sphaerotheca macularis*), 스파이로테카 푸스카(*Sphaerotheca fusca*)(스파이로테카 풀리기네아(*Sphaerotheca fuliginea*)), 스포로토릭스 종(*Sporothrix* spp.), 스타고노스포라 노도룸(*Stagonospora nodorum*), 스템필리움 종(*Stemphylium* spp.), 스테레움 히르수툼(*Stereum hirsutum*), 타나테포루스 쿠쿠메리스(*Thanatephorus cucumeris*), 티엘라비옵시스 바시콜라(*Thielaviopsis basicola*), 틸레티아 종(*Tilletia* spp.), 트리코데르마 종(*Trichoderma* spp.), 예컨대 *T. 하르시아눔*(*T. harzianum*), *T. 슈도코닝기이*(*T. pseudokoningii*), *T. 비리데*(*T. viride*),

[0241] 트리코피톤 종(*Trichophyton* spp.), 티풀라 종(*Typhula* spp.), 운시놀라 네카토르(*Uncinula necator*), 우로시스티스 종(*Urocystis* spp.), 우스틸라고 종(*Ustilago* spp.), 벤투리아 종(*Venturia* spp.), 예컨대 *V. 이나이쿠알리스*(*V. inaequalis*), 베르티킬리움 종(*Verticillium* spp.), 및 잔토모나스 종(*Xanthomonas* spp.).

[0242] 특히, 화학식 I의 화합물 및 이를 함유하는 살진균 조성물은 강(class) 담자균강(Basidiomycete), 자낭균강(Ascomycete), 난균강(Oomycete) 및/또는 불완전균강(Deuteromycete), 블라스토클라디오미세테 강(Blastocladiomycete), 크리티디오미세테 강(Chytridiomycete), 글로메로미세테 강(Glomeromycete) 및/또는 무코로미세테 강(Mucoromycete)의 광범위한 스펙트럼의 진균 식물 병원체에 의해 야기되는 식물 질병을 방지하는데 사용될 수 있다.

[0243] 이들 병원체는 하기를 포함할 수 있다:

[0244] 난균강, 이를 테면, 피토프토라 질병, 예컨대 피토프토라 캡시키(*Phytophthora capsici*), 피토프토라 인페스탄스(*Phytophthora infestans*), 피토프토라 소자이(*Phytophthora sojae*), 피토프토라 프라가리아이(*Phytophthora fragariae*), 피토프토라 니코티아나이(*Phytophthora nicotianae*), 피토프토라 신나모미(*Phytophthora cinnamomi*), 피토프토라 시트리콜라(*Phytophthora citricola*), 피토프토라 시트로프토라(*Phytophthora citrophthora*) 및 피토프토라 에리트로셉티카(*Phytophthora erythroseptica*)에 의해 야기된 질병; 피티움 질병, 예컨대 피티움 아파니데르마툼(*Pythium aphanidermatum*), 피티움 아레노마네스(*Pythium arrhenomanes*), 피티움 그라미니콜라(*Pythium graminicola*), 피티움 이레귤라레(*Pythium irregulare*) 및 피티움 울티뎀(*Pythium ultimum*)에 의해 야기된 질병; 노균목(Peronosporales)에 의해 야기된 질병, 예컨대 페로노스포라 데스트루토르(*Peronospora destructor*), 페로노스포라 파라시티카(*Peronospora parasitica*), 플라스모파라 비티콜라(*Plasmopara viticola*), 플라스모파라 할스테디이(*Plasmopara halstedii*), 슈도페로노스포라 쿠벤시스(*Pseudoperonospora cubensis*), 알부고 칸디다(*Albugo candida*), 스크레로프토라 마크로스포라(*Sclerophthora macrospora*) 및 브레미아 락투카이(*Bremia lactucae*)에 의해 야기된 질병; 및 기타, 예컨대 아파노미세스 코클리오이데스(*Aphanomyces cochlioides*), 라비린툴라 조스테라이(*Labyrinthula zosterae*), 페로노스클레로스포라 소르기(*Peronosclerospora sorghi*) 및 스크레로스포라 그라미니콜라(*Sclerospora graminicola*)에 의해 야기된 질병.

[0245] 자낭균강, 이를 테면, 반병(blotch), 점병(spot), 도열병(blast) 또는 마름병(blight) 질병 및/또는 부패병(rot), 예를 들어 플레오스포랄레스 목(Pleosporales), 예컨대 스템필리움 솔라니(*Stemphylium solani*), 스타고노스포라 타이나넨시스(*Stagonospora tainanensis*), 스피로카이아 올레아기니아(*Spilocaea oleaginea*), 세토스파이리아 투르키카(*Setosphaeria turcica*), 피레노카이타 리코페리시키(*Pyrenochaeta lycoperisici*), 플레오스포라 헤르바툼(*Pleospora herbarum*), 포마 데스트루티바(*Phoma destructiva*), 파이오스파이리아 헤르포트리코이데스(*Phaeosphaeria herpotrichoides*), 파이오크립토쿠스 가이우만니이(*Phaeocryptococcus gaeumannii*), 오피오스파이렐라 그라미니콜라(*Ophiosphaerella graminicola*), 오피오볼루스 그라미니스(*Ophiobolus graminis*), 램토스파이리아 마쿨란스(*Leptosphaeria maculans*), 헨데르소니아 크레베리마(*Hendersonia creberrima*), 헬민토스포리움 트리티키레펜티스(*Helminthosporium tritici-repentis*), 세토스파이리아 투르키카(*Setosphaeria turcica*), 드레슬레라 글리키네스(*Drechslera glycines*), 디디멜라 브리오니아이(*Didymella bryoniae*), 시클로코니움 올레아기네움(*Cyloconium oleagineum*), 코리네스포라 카스시콜라(*Corynespora cassicola*), 코클리오볼루스 사티부스(*Cochliobolus sativus*), 비폴라리스 캅티보라(*Bipolaris cactivora*), 벤투리아 이나이쿠알리스(*Venturia inaequalis*), 피레노포라 테레스(*Pyrenophora teres*), 피레노포라 트리티키-레펜티스(*Pyrenophora tritici-repentis*), 알테르나리아 알테르나타(*Alternaria alternata*), 알테르나리아 브라스지키

콜라(*Alternaria brassicicola*), 알테르나리아 솔라니(*Alternaria solani*) 및 알테르나리아 토마토펠라(*Alternaria tomatophila*), 그을음병균목(Capnodiales), 예컨대 셉토리아 트리티키(*Septoria tritici*), 셉토리아 노도룸(*Septoria nodorum*), 셉토리아 글리키네스(*Septoria glycines*), 세르코스포라 아라키디콜라(*Cercospora arachidicola*), 세르코스포라 소지나(*Cercospora soja*), 세르코스포라 제아이-마이디스(*Cercospora zea-maydis*), 세르코스포렐라 캡셀라이(*Cercospora capsellae*) 및 세르코스포렐라 헤르포트리코이테스(*Cercospora herpotrichoides*), 클라도스포리움 카르포필룸(*Cladosporium carphophilum*), 클라도스포리움 에푸숨(*Cladosporium effusum*), 파스살로라 풀바(*Passalora fulva*), 클라도스포리움 옥시스포룸(*Cladosporium oxysporum*), 도티스트로마 셉토스포룸(*Dothistroma septosporum*), 이사리옵시스 클라비스포라(*Isariopsis clavispora*), 미코스파이렐라 피지엔시스(*Mycosphaerella fijiensis*), 미코스파이렐라 그라미니콜라(*Mycosphaerella graminicola*), 미코벨로시엘라 코엠펜케이(*Mycovellosiella koepkei*), 파이오이사리옵시스 바타티콜라(*Phaeoisariopsis bataticola*), 슈도세르코스포라 비티스(*Pseudocercospora vitis*), 슈도세르코스포렐라 헤르포트리코이테스(*Pseudocercospora herpotrichoides*), 라물라리아 베티콜라(*Ramularia beticola*), 라물라리아 콜로-시그니(*Ramularia collo-cygni*), 마그나포르탈레스 목(Magnaporthales), 예컨대 가이우만노미세스 그라미니스(*Gaeumannomyces graminis*), 마그나포르테 그리세아(*Magnaporthe grisea*), 피리쿨라리아 오리자이(*Pyricularia oryzae*), 검랭이침버섯목(Diaporthales), 예컨대 아니소그램마 아노말라(*Anisogramma anomala*), 아피오그노모니아 에라분다(*Apiognomonium errabunda*), 시토스포라 플라타니(*Cytospora platani*), 디아포르테 파세올로룸(*Diaporthe phaseolorum*), 디스쿨라 데스트루크티바(*Discula destructiva*), 그노모니아 프룩티콜라(*Gnomonia fructicola*), 그리네리아 우비콜라(*Greeneria uvicola*), 멜란코니움 주글란디눔(*Melanconium juglandinum*), 포몹시스 비티콜라(*Phomopsis viticola*), 시로콰쿠스 클라비기그넨티-주글란다케아룸(*Sirococcus clavignenti-juglandacearum*), 투바키아 드라이나(*Tubakia dryina*), 디카르펠라 종(*Dicarpella* spp.), 발사 세라토스페르마(*Valsa ceratosperma*), 및 기타, 예컨대 악티노트리움 그라미니스(*Actinothyrium graminis*), 아스코키타 피시(*Ascochyta pisi*), 아스페르길루스 플라부스(*Aspergillus flavus*), 아스페르길루스 푸미가투스(*Aspergillus fumigatus*), 아스페르길루스 니둘란스(*Aspergillus nidulans*), 아스페르길루스 카리카이(*Asperisporium caricae*), 블루메리엘라 자아피이(*Blumeriella jaapii*), 칸디다 종(*Candida* spp.), 캅노디움 라모숨(*Capnodium ramosum*), 세팔로아스쿠스 종(*Cephaloascus* spp.), 세팔로스포리움 그라미네움(*Cephalosporium gramineum*), 세라토시스티스 파라독사(*Ceratocystis paradoxa*), 카이트미움 종(*Chaetomium* spp.), 히메노스키푸스 슈도알비두스(*Hymenoscyphus pseudoalbidus*), 콕키디오이테스 종(*Coccidioides* spp.), 실린드로스포리움 파디(*Cylindrosporium padi*), 디플로카르폰 말라이(*Diplocarpon malae*), 드레파노페지자 캅페스트리스(*Drepanopeziza campestris*), 엘시노에 암펠리나(*Elsinoe ampelina*), 에피콕쿰 니그룸(*Epicoccum nigrum*), 에피데르모피톤 종(*Epidermophyton* spp.), 유티파 라타(*Eutypa lata*), 게오트리쿰 칸디둠(*Geotrichum candidum*), 기벨리나 세레알리스(*Gibellina cerealis*), 글로에오세르코스포라 소르기(*Gloeocercospora sorghi*), 글로에오테스 폼이게나(*Gloeodes pomigena*), 글로에오스포리움 페렌난스(*Gloeosporium perennans*); 글로에오티니아 테물렌타(*Gloeotinia temulenta*), 그리포스파이리아 코르티콜라(*Griphosphaeria corticola*), 카바티엘라 리니(*Kabatiella lini*), 랩토그라피움 미크로스포룸(*Leptographium microsporium*), 랩토스파이롤리니아 크라스시아스카(*Leptosphaerulina crassiasca*), 로포데르미움 세디티오숨(*Lophodermium seditiosum*), 마르스소니나 그라미니콜라(*Marssonina graminicola*), 마이크로도키움 니발레(*Microdochium nivale*), 모닐리니아 프룩티콜라(*Monilinia fructicola*), 모노그라펠라 알베스센스(*Monographella albescens*), 모노스포라스쿠스 칸논발루스(*Monosporascus cannonballus*), 나이마시클루스 종(*Naemacyclus* spp.), 오피오스토마 노보-울미(*Ophiostoma novo-ulmi*), 파라콕시디오이테스 브라실리엔시스(*Paracoccidioides brasiliensis*), 페니실리움 익스판숨(*Penicillium expansum*), 페스탈로티아 로도덴드리(*Pestalotia rhododendri*), 페트리엘리디움 종(*Petriellidium* spp.), 페지쿨라 종(*Pezizula* spp.), 피알로포라 그레가타(*Phialophora gregata*), 필라코라 폼이게나(*Phyllachora pomigena*), 피마토티리쿰 옴니보라(*Phymatotrichum omnivora*), 피살로스포라 압디타(*Physalospora abdita*), 플렉토스포리움 타바키눔(*Plectosporium tabacinum*), 폴리스키타룸 푸스툴란스(*Polyscytalum pustulans*), 슈도페지자 메디카기니스(*Pseudopeziza medicaginis*), 피레노페지자 브라시시카이(*Pyrenopeziza brassicae*), 라물리스포라 소르기(*Ramulispora sorghi*), 랍도클리네 슈도트수가이(*Rhabdocline pseudotsugae*), 런코스포리움 세칼리스(*Rhynchosporium secalis*), 사크로클라디움 오리자이(*Sacrocladium oryzae*), 스킨코스포리움 종(*Scedosporium* spp.), 스킨조티리움 폼이(*Schizothyrium pomi*), 스크레로티니아 스크레로티움(*Sclerotinia sclerotiorum*), 스크레로티니아 미노르(*Sclerotinia minor*); 스크레로티움 종(*Sclerotium* spp.), 티풀라 이시카리엔시스(*Typhula ishikariensis*), 세이마토스포리움 마리아이(*Seimatosporium mariae*), 랩테우티파 쿠프레시(*Lepteutypa cupressi*), 셉토시타 루보룸(*Septocytia ruborum*), 스파셀로마 페르세아이(*Sphaceloma perseae*), 스포로네마 파시디오이테스(*Sporonema phacidioides*),

스티그미나 팔미보라(*Stigmia palmivora*), 타페시아 알룬다이(*Tapesia yellundae*), 타프리나 불라타(*Taphrina bullata*), 티엘비옵시스 바시콜라(*Thielviopsis basicola*), 트리코셉토리아 프록티게나(*Trichoseptoria fructigena*), 지고피알라 자마이센시스(*Zygophiala jamaicensis*)에 의해 야기된 질병; 흰가루병균 질병, 예를 들어 흰가루병균목(*Erysiphales*), 예컨대 블루메리아 그라미니스(*Blumeria graminis*), 에리시페 폴리고니(*Erysiphe polygoni*), 운시놀라 네카토르(*Uncinula necator*), 스파이로테카 폴리게나(*Sphaerotheca fuligena*), 포도스파이라 류코트리카(*Podosphaera leucotricha*), 포도스파이라 마쿨라리스(*Podosphaera macularis*), 골로비노미세스 시코라세아룸(*Golovinomyces cichoracearum*), 레베일룰라 타우리카(*Leveillula taurica*), 마이크로스파이라 디푸사(*Microsphaera diffusa*), 오이디옵시스 고스시피이(*Oidiopsis gossypii*), 필락티니아 구트타타(*Phyllactinia guttata*) 및 오이디움 아라키디스(*Oidium arachidis*)에 의해 야기된 질병; 곰팡이, 예를 들어 겹무늬썩음병균목(*Botryosphaerales*), 예컨대 도티오렐라 아로마티카(*Dothiorella aromatica*), 디플로디아 세리아타(*Diplodia seriata*), 구이그나르디아 비드웰리이(*Guignardia bidwellii*), 보트리티스 시네레아(*Botrytis cinerea*), 보트리오티니아 알리이(*Botryotinia allii*), 보트리오티니아 파바이(*Botryotinia fabae*), 푸시콕컴 아미그달리(*Fusicoccum amygdali*), 라시오디플로디아 테오브로마이(*Lasiodyplodia theobromae*), 마크로포마 테이콜라(*Macrophoma theicola*), 마크로포미니 파세올리나(*Macrophomina phaseolina*), 필로스틱타 쿠쿠르비타세아룸(*Phyllosticta cucurbitacearum*)에 의해 야기된 질병; 탄저병, 예를 들어 글로메렐랄레스 목(*Glomerellales*), 예컨대 콜레토티리쿰 글로에오스포리오이데스(*Colletotrichum gloeosporioides*), 콜레토티리쿰 라게나리움(*Colletotrichum lagenarium*), 콜레토티리쿰 고스시피이(*Colletotrichum gossypii*), 글로메렐라 신굴라타(*Glomerella cingulata*), 및 콜레토티리쿰 그라미니콜라(*Colletotrichum graminicola*)에 의해 야기된 질병; 및 시들행(wilt) 또는 마름병, 예를 들어 동충하초목(*Hypocreales*), 예컨대 아크레모니움 스트릭툼(*Acremonium strictum*), 클라비셉스 푸르푸레아(*Claviceps purpurea*), 푸사리움 쿨모룸(*Fusarium culmorum*), 푸사리움 그라미네아룸(*Fusarium graminearum*), 푸사리움 비르굴리포르메(*Fusarium virguliforme*), 푸사리움 옥시스포룸(*Fusarium oxysporum*), 푸사리움 수브글루티난스(*Fusarium subglutinans*), 푸사리움 옥시스포룸 분화종 쿠벤세(*Fusarium oxysporum* f.sp. *cubense*), 게를라키아 니발레(*Gerlachia nivale*), 깬베렐라 푸지쿠로이(*Gibberella fujikuroi*), 깬베렐라 제아이(*Gibberella zeae*), 글리오클라디움 종(*Gliocladium* spp.), 미로테키움 베르루카리아(*Myrothecium verrucaria*), 넥트리아 라물라리아이(*Nectria ramulariae*), 트리코테르마 비리데(*Trichoderma viride*), 트리코테키움 로세움(*Trichothecium roseum*), 및 베르티실리움 테오브로마이(*Verticillium theobromae*)에 의해 야기된 질병.

[0246] 담자균강, 이를 테면, 감부기병(smut), 예를 들어 감부기균목(*Ustilaginales*), 예컨대 우스틸라기노이테아 비렌스(*Ustilago virens*), 우스틸라고 누다(*Ustilago nuda*), 우스틸라고 트리티시(*Ustilago tritici*), 우스틸라고 제아이(*Ustilago zeae*)에 의해 야기된 질병, 녹병(rust), 예를 들어 녹균목(*Pucciniales*), 예컨대 세로텔리움 피시(*Cerotelium fici*), 크리소믹사 아르코토스타펠리(*Chrysomyxa arctostaphyli*), 콜레오스포리움 이포모에아이(*Coleosporium ipomoeae*), 헤밀레이아 바스타트릭스(*Hemileia vastatrix*), 폭시니아 아라키디스(*Puccinia arachidis*), 폭시니아 카카바타(*Puccinia cacabata*), 폭시니아 그라미니스(*Puccinia graminis*), 폭시니아 레콘디타(*Puccinia recondita*), 폭시니아 소르기(*Puccinia sorghi*), 폭시니아 호르데이(*Puccinia hordei*), 폭시니아 스트리이포르미스 분화종 호르데이(*Puccinia striiformis* f.sp. *Hordei*), 폭시니아 스트리이포르미스 분화종 세칼리스(*Puccinia striiformis* f.sp. *Secalis*), 폭시니아스트룸 코틸리(*Pucciniastrum coryli*), 또는 우레디날레스 목(*Uredinales*), 예컨대 크로나르티움 리비콜라(*Cronartium ribicola*), 김노스포란기움 주니페리-비기니아나나(*Gymnosporangium juniperi-viginianae*), 멜람프소라 메두사이(*Melampsora medusae*), 파콕소라 파키리지(*Phakopsora pachyrhizi*), 프라그미디움 무크로나툼(*Phragmidium mucronatum*), 피소펠라 암펠로시디스(*Physopella ampeloidis*), 트란즈스켈리아 디스콜로르(*Tranzschelia discolor*) 및 우로미세스 비시아이-파바이(*Uromyces viciae-fabae*)에 의해 야기된 질병; 및 기타 부패병 및 질병, 예컨대 크립토크쿠스 종(*Cryptococcus* spp.), 엑소바시디움 벡산스(*Exobasidium vexans*), 마라스미엘루스 이노테르마(*Marasmiellus inoderma*), 미세나 종(*Mycena* spp.), 스파셀로테카 레일리아나(*Sphacelotheca reiliana*), 티플라 이시카리엔시스(*Typhula ishikariensis*), 우로시스티스 아그로피리(*Urocystis agropyri*), 이테르소닐리아 페르플렉산스(*Itersonilia perplexans*), 코르티키움 인비숨(*Corticium invisum*), 라이티사리아 푸시포르미스(*Laetisaria fuciformis*), 와이테아 시르시나타(*Waitea circinata*), 리족토니아 솔라니(*Rhizoctonia solani*), 타네테포루스 쿠쿠르메리스(*Thanetophorus cucurmeris*), 엔틸로마 달리아이(*Entyloma dahliae*), 엔틸로멜라 미크로스포라(*Entylomella microspora*), 네오보스시아 몰리니아(*Neovossia molinae*) 및 틸레티아 카리에스(*Tilletia caries*)에 의해 야기된 질병.

[0247] 블라스토클라디오미세테 강(*Blastocladiomycete*), 예컨대 피소테르마 마이디스(*Physoderma maydis*).

- [0248] 무코로미세테 강, 예컨대 코아네포라 쿠쿠르비타룸(*Choanephora cucurbitarum*); 무코르 종(*Mucor* spp.); 리조푸스 아리주스(*Rhizopus arrhizus*),
- [0249] 이뿐만 아니라, 상기에 열거된 것들과 밀접하게 관련된 다른 종 및 속에 의해 야기된 질병.
- [0250] 이들의 살진균 활성에 더하여, 화합물 및 이를 포함하는 조성물은 또한 세균, 예컨대 에르위니아 아밀로보라(*Erwinia amylovora*), 에르위니아 카라토보라(*Erwinia caratovora*), 잔토모나스 캄페스트리스(*Xanthomonas campestris*), 슈도모나스 시린가이(*Pseudomonas syringae*), 스트렙토미세스 스카비에스(*Streptomyces scabies*) 및 다른 관련 종뿐만 아니라 소정의 원생동물에 대한 활성을 가질 수 있다.
- [0251] 본 발명의 범주 내에서, 보호하고자 하는 표적 작물 및/또는 유용한 식물은 전형적으로 다년생 및 일년생 작물, 예컨대 베리 식물, 예를 들어 블랙베리, 블루베리, 크랜베리, 라즈베리 및 딸기; 곡류, 예를 들어 보리, 옥수수(콘), 기장, 귀리, 쌀, 호밀, 수수, 라이밀 및 밀; 섬유 식물, 예를 들어 목화, 아마, 대마, 황마 및 사이잘; 밭작물, 예를 들어 사탕무 및 사료용 무(fodder beet), 커피, 홉, 머스타드, 유채(oilseed rape)(카놀라), 양귀비, 사탕수수, 해바라기, 차 및 담배; 과실수, 예를 들어 사과, 아프리카도, 아보카도, 바나나, 체리, 감귤류, 넥타린, 복숭아, 배 및 자두; 목초(grass), 예를 들어 버뮤다 그래스(Bermuda grass), 블루그래스(bluegrass), 벤틀그래스(bentgrass), 센티피드 그래스(centipede grass), 페스큐(fescue), 라이그래스(ryegrass), 세인트 오거스틴 그래스(St. Augustine grass) 및 조이시아 그래스(Zoysia grass); 허브, 예컨대 바질, 보리지, 차이브, 고수, 라벤더, 러비지(lovage), 민트, 오레가노, 파슬리, 로즈마리, 세이지 및 타임; 콩과 식물, 예를 들어 빈(bean), 렌틸콩, 완두콩 및 대두콩; 견과류, 예를 들어 아몬드, 캐슈, 땅콩, 헤이즐넛, 피넛, 피칸, 피스타치오 및 호두; 야자, 예를 들어 기름 야자; 관상식물, 예를 들어 꽃, 관목 및 수목; 기타 수목, 예를 들어 카카오, 코코넛, 올리브 및 고무 나무; 채소류, 예를 들어 아스파라거스, 가지, 브로콜리, 양배추, 당근, 오이, 마늘, 상추, 매로우(marrow), 멜론, 오크라, 양파, 후추, 감자, 호박, 루바브, 시금치 및 토마토; 및 덩굴식물(vine), 예를 들어 포도를 포함한다.
- [0252] 본 발명에 따른 유용한 식물 및/또는 표적 작물은 통상적인 변종뿐만 아니라 유전자 향상 또는 조작된 변종, 예컨대 곤충 저항성(예를 들어, Bt. 및 VIP 변종)뿐만 아니라 질병 저항성, 제초제 내성(예를 들어, 상표명 RoundupReady® 및 LibertyLink®로 구매 가능한 글리포세이트- 및 글루포시네이트-저항성 옥수수 변종) 및 선충 내성 변종을 포함한다. 예로서, 적합한 유전자 향상 또는 조작된 작물 변종은 Stoneville 5599BR 목화 및 Stoneville 4892BR 목화 변종을 포함한다.
- [0253] 용어 "유용한 식물" 및/또는 "표적 작물"은 육종 또는 유전 공학의 통상적인 방법의 결과로서 브로복시닐과 같은 제초제 또는 제초제 부류(예컨대, HPPD 억제제, ALS 억제제, 예를 들어 프리미선푸론, 프로선푸론 및 트리플록시선푸론, EPSPS(5-에놀-피로빌-쉬키메이트-3-포스페이트-신타제) 억제제, GS(글루타민 신데타제) 억제제 또는 PPO(프로토포르피리노젠-옥시다제) 억제제에 대해 내성을 갖게 한 유용한 식물을 또한 포함하는 것으로 이해되어야 한다. 통상적인 육종 방법(돌연변이생성)에 의해 이미다졸리논, 예를 들어 이마자목스에 대해 내성을 갖게 한 작물의 한 예는 Clearfield® 여름 유채(카놀라)이다. 유전 공학 방법에 의해 제초제 또는 제초제 부류에 대해 내성을 갖게 한 작물의 예에는 상표명 RoundupReady®, Herculex I® 및 LibertyLink®로 구매 가능한 글리포세이트- 및 글루포시네이트-저항성 옥수수 변종이 포함된다.
- [0254] 용어 "유용한 식물" 및/또는 "표적 작물"은 유해 곤충에 대해 자연적으로 저항성을 나타내거나 저항성을 갖게 한 것들을 포함하는 것으로 이해되어야 한다. 이는 재조합 DNA 기법의 사용에 의해 형질전환된 식물을 포함하는데, 이러한 재조합 DNA 기법은, 예를 들어 하나 이상의 선택적으로 작용하는 독소, 예컨대, 예를 들어 독소-생성 세균으로부터 유래된 것으로 알려진 독소를 합성할 수 있다. 발현될 수 있는 독소의 예에는 δ-내독소, 식물 성장과 관련된 살곤충 단백질(Vip), 세균 군체형성 선충의 살곤충 단백질, 및 전갈, 거미, 말벌 및 진균에 의해 생성되는 독소가 포함될 수 있다. 바실루스 투링기엔시스(*Bacillus thuringiensis*) 독소를 발현하도록 변형된 작물의 예는 Bt 옥수수 KnockOut®(Syngenta Seeds사)이다. 살곤충 저항성을 암호화하고, 이에 따라 하나 초과 의 독소를 발현하는 하나 초과 의 유전자를 포함하는 작물의 예는 VipCot®(Syngenta Seeds사)이다. 작물 또는 이의 종자 재료가 또한 다수의 유형의 해충에 대해 저항성을 나타낼 수 있다(유전자 변형에 의해 생성될 때, 이른바 다형질 유전자도입 품종들(stacked transgenic events)). 예를 들어, 식물은 살곤충 단백질을 발현하면서, 동시에 제초제 내성을 나타내는 능력을 가질 수 있으며, 예를 들어 Herculex I®(Dow AgroSciences사, Pioneer Hi-Bred International사)이다.
- [0255] 용어 "유용한 식물" 및/또는 "표적 작물"은, 재조합 DNA 기술의 사용에 의해 형질전환되어, 선택적 작용을 갖는 항병원성 물질, 예컨대 이른바 "병원성-관련 단백질(pathogenesis-related protein)"(PRP, 예를 들어 EP-A-0

392 225 참조)을 합성할 수 있는 유용한 식물을 또한 포함하는 것으로 이해되어야 한다. 이러한 항병원성 물질 및 이러한 항병원성 물질을 합성할 수 있는 유전자도입 식물의 예는, 예를 들어 EP-A-0 392 225, WO 95/33818, 및 EP-A-0 353 191로부터 공지되어 있다. 이러한 유전자도입 식물의 생성 방법은 당업자에게 일반적으로 공지되어 있으며, 예를 들어 상기 언급된 간행물에 기재되어 있다.

[0256] 유전자도입 식물에 의해 발현될 수 있는 독소는, 예를 들어 바실루스 세레우스(*Bacillus cereus*) 또는 바실루스 포필리아이(*Bacillus popilliae*)로부터의 살곤충 단백질; 또는 바실루스 투린지엔시스(*Bacillus thuringiensis*)로부터의 살곤충 단백질, 예컨대 δ -내독소, 예를 들어 Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 또는 Cry9C, 또는 식물 성장과 관련된 살곤충 단백질(vegetative insecticidal protein, Vip), 예를 들어 Vip1, Vip2, Vip3 또는 Vip3A; 또는 세균 군체형성 선충, 예를 들어 포토랍두스 종(*Photorhabdus* spp.) 또는 제노랍두스 종(*Xenorhabdus* spp.), 예컨대 포토랍두스 루미네센스(*Photorhabdus luminescens*), 제노랍두스 네마토틸루스(*Xenorhabdus nematophilus*)의 살곤충 단백질; 동물에 의해 생성되는 독소, 예컨대 전갈 독소, 거미 독소, 말벌 독소 및 다른 곤충-특이적 신경독소; 진균에 의해 생성되는 독소, 예컨대 스트렙토미세테스(*Streptomyces*) 독소; 식물 렉틴, 예컨대 완두 렉틴, 보리 렉틴 또는 스노드롭(snowdrop) 렉틴; 어글루티닌; 프로테아제 억제제, 예컨대 트립신 억제제, 세린 프로테아제 억제제, 파타틴, 시스타틴, 파파인 억제제; 리보솜-불활성화 단백질(RIP), 예컨대 리신, 옥수수-RIP, 아브린, 루핀, 사포린 또는 브리오딘; 스테로이드 대사 효소, 예컨대 3-하이드록시스테로이드 옥시다제, 액디스테로이드-UDP-글리코실-트랜스퍼라제, 콜레스테롤 옥시다제, 액디손 억제제, HMG-COA-리덕타제, 이온 채널 차단제, 예컨대 나트륨 또는 칼슘 채널 차단제, 유충 호르몬 에스테라제, 이노 호르몬 수용체, 스틸벤 신타제, 바이벤질 신타제, 키티나제 및 글루카나제를 포함한다.

[0257] 또한, 본 발명과 관련하여, δ -내독소, 예를 들어 Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 또는 Cry9C, 또는 식물 성장과 관련된 살곤충 단백질(Vip), 예를 들어 Vip1, Vip2, Vip3 또는 Vip3A는 또한 하이브리드 독소(hybrid toxin), 절단 독소(truncated toxin) 및 변형 독소(modified toxin)로도 표현됨이 이해되어야 한다. 하이브리드 독소는 이러한 단백질의 상이한 도메인들의 새로운 조합에 의해 재조합적으로 생성된다(예를 들어, WO 02/15701 참조). 절단 독소, 예를 들어 절단 Cry1Ab는 공지되어 있다. 변형 독소의 경우, 천연 발생 독소의 하나 이상의 아미노산이 대체된다. 이러한 아미노산 대체 시, 바람직하게는 천연 비존재 프로테아제 인식 서열이 독소 내로 삽입되는데, 예를 들어 Cry3A055의 경우, 카텝신-G-인식 서열이 Cry3A 독소 내로 삽입된다(WO 03/018810 참조).

[0258] 이러한 독소, 또는 이러한 독소를 합성할 수 있는 유전자도입 식물의 더 많은 예는, 예를 들어 EP-A-0 374 753, WO93/07278, WO95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878 및 WO03/052073에 개시되어 있다.

[0259] 이러한 유전자도입 식물의 제조 방법은 당업자에게 일반적으로 공지되어 있으며, 예를 들어 상기 언급된 간행물에 기재되어 있다. CryI형 데옥시리보핵산 및 이의 제조는, 예를 들어 WO 95/34656, EP-A-0 367 474, EP-A-0 401 979 및 WO 90/13651로부터 공지되어 있다.

[0260] 유전자도입 식물에 함유된 독소는 유해 곤충에 대한 내성을 식물에 부여한다. 이러한 곤충은 임의의 곤충 분류 그룹에서 발생할 수 있지만, 딱정벌레(딱정벌레목), 쌍시류 곤충(파리목) 및 나비(인시목)에서 특히 일반적으로 발견된다.

[0261] 살곤충 저항성에 대해 암호화하고 하나 이상의 독소를 발현하는 하나 이상의 유전자를 함유하는 유전자도입 식물은 공지되어 있으며, 이들 중 일부는 구매 가능하다. 이러한 식물의 예는 하기와 같다: YieldGard®(Cry1Ab 독소를 발현하는 옥수수 변종); YieldGard Rootworm®(Cry3Bb1 독소를 발현하는 옥수수 변종); YieldGard Plus®(Cry1Ab 및 Cry3Bb1 독소를 발현하는 옥수수 변종); Starlink®(Cry9C 독소를 발현하는 옥수수 변종); Herculex I®(제조제 글루포시네이트 암모늄에 대한 내성을 달성하도록 포스포노트리신 N-아세틸트랜스퍼라제(PAT) 효소 및 Cry1Fa2 독소를 발현하는 옥수수 변종); NuCOTN 33B®(Cry1Ac 독소를 발현하는 목화 변종); Bollgard I®(Cry1Ac 독소를 발현하는 목화 변종); Bollgard II®(Cry1Ac 및 Cry2Ab 독소를 발현하는 목화 변종); VipCot®(Vip3A 및 Cry1Ab 독소를 발현하는 목화 변종); NewLeaf®(Cry3A 독소를 발현하는 감자 변종); NatureGard®, Agrisure® GT 어드밴티지(GA21 글리포세이트-내성 형질), Agrisure® CB 어드밴티지(Bt11 옥수수 천공충(CB) 형질) 및 Protecta®.

[0262] 이러한 유전자도입 작물의 추가의 예는 하기와 같다:

[0263] 1. **Bt11 옥수수**(제조원: Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, 등록번

호 C/FR/96/05/10). 절단 Cry1Ab 독소의 유전자도입 발현에 의해 유럽 옥수수 천공충(오스트리아 누빌랄리스 (*Ostrinia nubilalis*) 및 세사미아 노나그리오이데스(*Sesamia nonagrioides*))에 의한 공격에 대해 저항성을 갖게 한 유전자 변형 제아 마이스(*Zea mays*). Bt11 옥수수는 또한 효소 PAT를 유전자도입에 의해 발현하여 제초제 글루포시네이트 암모늄에 대한 내성을 달성한다.

[0264] 2. **Bt176 옥수수**(제조원: Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, 등록번호 C/FR/96/05/10). Cry1Ab 독소의 유전자도입 발현에 의해 유럽 옥수수 천공충(오스트리아 누빌랄리스 및 세사미아 노나그리오이데스)에 의한 공격에 대해 저항성을 갖게 한 유전자 변형 제아 마이스. Bt176 옥수수는 또한 효소 PAT를 유전자도입에 의해 발현하여 제초제 글루포시네이트 암모늄에 대한 내성을 달성한다.

[0265] 3. **MIR604 옥수수**(제조원: Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, 등록번호 C/FR/96/05/10). 변형 Cry3A 독소의 유전자도입 발현에 의해 곤충-저항성을 갖게 한 옥수수. 이 독소는 카텝신-G-프로테아제 인식 서열의 삽입에 의해 변형된 Cry3A055이다. 이러한 유전자도입 옥수수 식물의 제조는 WO 03/018810에 기재되어 있다.

[0266] 4. **MON 863 옥수수**(제조원: Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, 등록번호 C/DE/02/9). MON 863은 Cry3Bb1 독소를 발현하며, 소정의 딱정벌레목 곤충에 대해 저항성을 갖는다.

[0267] 5. **IPC 531 목화**(제조원: Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, 등록번호: C/ES/96/02).

[0268] 6. **1507 옥수수**(제조원: Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium, 등록번호 C/NL/00/10). 소정의 인시목 곤충에 대한 저항성을 달성하기 위한 단백질 Cry1F 및 제초제 글루포시네이트 암모늄에 대한 내성을 달성하기 위한 PAT 단백질의 발현을 위한 유전자 변형 옥수수.

[0269] 7. **NK603 x MON 810 옥수수**(제조원: Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, 등록번호 C/GB/02/M3/03). 유전자 변형된 변종 NK603과 MON 810을 교배함으로써 통상적으로 품종개발된 하이브리드 옥수수 변종으로 이루어진다. NK603 x MON 810 옥수수는 제초제 Roundup®(글리포세이트 함유)에 대해 내성을 부여하는, 아그로박테리움 종 균주(*Agrobacterium sp.* strain) CP4로부터 수득된 단백질 CP4 EPSPS, 및 또한 유럽 옥수수 천공충을 포함한 소정의 인시목에 대한 내성을 야기하는 바실루스 투링기엔시스 아종 쿠르스타키(*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*)로부터 수득된 Cry1Ab 독소를 유전자도입에 의해 발현한다.

[0270] 본 명세서에 사용되는 바와 같이, 용어 "식물"은, 식물이 안에서 또는 위에서 성장하고 있는 밭, 또는 재배 식물의 종자가 파종되는 곳, 또는 종자가 토양 속에 놓여질 곳을 의미한다. 그것은 토양, 종자, 및 묘목(seedling)뿐만 아니라 확립된 초목(established vegetation)을 포함한다.

[0271] 용어 "식물"은 식물의 모든 몸체 부분을 지칭하며, 이에는 종자, 묘목, 대묘(sapling), 뿌리, 괴경, 줄기(stem), 자루(stalk), 잎, 및 과실이 포함된다.

[0272] 용어 "식물 번식 재료"는 식물의 증식에 사용될 수 있는 식물의 생식 부분(generative part), 예컨대 종자, 및 식생 재료(vegetative material), 예컨대 삽수 또는 괴경, 예를 들어 감자를 나타내는 것으로 이해된다. 예를 들어, 종자(엄격한 의미에서), 뿌리, 과실, 괴경, 구근, 근경 및 식물의 부분들이 언급될 수 있다. 토양으로부터의 밭아 후에 또는 출아 후에 이식되어야 하는 발아된 식물 및 어린 식물이 또한 언급될 수 있다. 이러한 어린 식물은 침지(immersion)에 의한 전체 또는 부분 처리에 의해 이식 전에 보호될 수 있다. 바람직하게는 "식물 번식 재료"는 종자를 나타내는 것으로 이해된다.

[0273] 일반명을 사용하여 본 명세서에서 언급되는 살충제는, 예를 들어 문헌["The Pesticide Manual", 15th Ed., British Crop Protection Council 2009]으로부터 공지되어 있다.

[0274] 화학식 I의 화합물은 변형되지 않은 형태로 사용되거나, 바람직하게는 제형 분야에서 통상적으로 사용되는 애주번트(adjutant)와 함께 사용될 수 있다. 이 목적을 위하여, 이들은 공지된 방식으로 유화성 농축물(emulsifiable concentrate), 코팅 가능한 페이스트, 직접 분무 가능 또는 희석 가능한 용액 또는 현탁액, 희석 에멀전(dilute emulsion), 습윤성 분말(wettable powder), 가용성 분말(soluble powder), 분체(dust), 과립(granulate), 및 또한, 예를 들어 중합체 물질 내로의 캡슐화(encapsulation) 형태로 편의상 제형화될 수 있다. 조성물의 유형과 마찬가지로, 적용 방법, 예컨대 분무, 무화(atomising), 산분(dusting), 산포(scattering), 코팅 또는 주입은 의도된 목적 및 우세한 상황에 따라 선택된다. 본 조성물은 또한 추가의 애주번트, 예컨대 안

정제, 소포제, 점도 조절제, 결합제 또는 점착부여제뿐만 아니라 비료, 미량영양소 공급물질(micronutrient donor) 또는 특수 효과를 얻기 위한 다른 제형을 함유할 수 있다.

- [0275] 예를 들어 농업 용도에 적합한 담체 및 애주번트는 고체 또는 액체일 수 있고, 제형화 기술에 유용한 물질, 예를 들어 천연 또는 재생 광물 물질, 용매, 분산제, 습윤제, 점착부여제, 증점제, 결합제 또는 비료이다. 이러한 담체는, 예를 들어 WO 97/33890에 기재되어 있다.
- [0276] 현탁액 농축물은 활성 화합물의 미분된 고체 입자들이 현탁되어 있는 수성 제형이다. 이러한 제형은 침강방지제(anti-settling agent) 및 분산제를 포함하고, 활성을 향상시키기 위한 습윤제뿐만 아니라 소포제 및 결정 성장 억제제를 추가로 포함할 수 있다. 사용 시에, 이들 농축물은 물 중에 희석되고, 처리하고자 하는 영역에 스프레이로서 통상 적용된다. 활성 성분의 양은 농축물의 0.5% 내지 95%의 범위일 수 있다.
- [0277] 습윤성 분말은 물 또는 다른 액체 담체 중에 용이하게 분산되는 미분된 입자들의 형태이다. 입자들은 고체 매트릭스 내에 보유된 활성 성분을 함유한다. 전형적인 고체 매트릭스는 풀러토(fuller's earth), 카올린 점토, 실리카 및 다른 용이하게 습윤되는 유기 또는 무기 고체를 포함한다. 습윤성 분말은 통상 5% 내지 95%의 활성 성분 및 소량의 습윤제, 분산제 또는 유화제를 함유한다.
- [0278] 유화성 농축물은 물 또는 다른 액체 중에 분산 가능한 균질한 액체 조성물이고, 활성 화합물 및 액체 또는 고체 유화제로 완전히 이루어질 수 있거나, 액체 담체, 예컨대 자일렌, 중질 방향족 나프타, 이소포론 및 다른 비휘발성 유기 용매를 함유할 수 있다. 사용 시에, 이들 농축물은 물 또는 다른 액체 중에 분산되고, 처리하고자 하는 영역에 스프레이로서 통상 적용된다. 활성 성분의 양은 농축물의 0.5% 내지 95%의 범위일 수 있다.
- [0279] 과립 제형은 압출물 및 비교적 조대한 입자 둘 모두를 포함하고, 처리가 요구되는 영역에 희석 없이 통상 적용된다. 과립 제형을 위한 전형적인 담체는 모래, 풀러토, 에타펄자이트 점토, 벤토나이트 점토, 몬모릴로나이트 점토, 질석, 펄라이트, 탄산칼슘, 벽돌(brick), 부석, 피로필라이트, 카올린, 돌로마이트, 플라스터, 목분, 그라인딩된 옥수수대, 그라인딩된 땅콩 껍질, 당, 염화나트륨, 황산나트륨, 규산나트륨, 붕산나트륨, 마그네시아, 운모, 산화철, 산화아연, 산화티타늄, 산화안티몬, 빙정석, 석고, 규조토, 황산칼슘 및 활성 화합물을 흡수하거나 그로 코팅될 수 있는 다른 유기 또는 무기 재료를 포함한다. 과립 제형은 통상 5% 내지 25%의 활성 성분을 함유하며, 이는 표면활성제, 예컨대 중질 방향족 나프타, 등유 및 다른 석유 분획, 또는 식물성 오일; 및/또는 점착제(sticker), 예컨대 텍스트린, 글루 또는 합성 수지를 포함할 수 있다.
- [0280] 분제는 활성 성분과, 분산제 및 담체로서 작용하는 미분된 고체, 예컨대 활석, 점토, 가루 및 다른 유기 및 무기 고체의 자유-유동 혼합물(admixture)이다.
- [0281] 마이크로캡슐은 전형적으로 불활성 다공성 셸 내에 봉입된 활성 성분의 액적(droplet) 또는 과립이며, 이때 껍질은 봉입된 재료가 제어된 속도로 주위로 빠져나갈 수 있게 한다. 캡슐화된 액적은 전형적으로 직경이 1 내지 50 마이크론이다. 봉입된 액체는 전형적으로 캡슐의 중량의 50 내지 95%를 구성하고, 활성 화합물에 더하여 용매를 포함할 수 있다. 캡슐화된 과립은 일반적으로 다공성 막이 과립 기공 개구를 밀봉하여 액체 형태의 활성 중을 과립 기공의 내부에 보유하는 다공성 과립이다. 과립은 전형적으로 직경이 1 밀리미터 내지 1 센티미터, 바람직하게는 1 내지 2 밀리미터의 범위이다. 과립은 압출, 집괴화(agglomeration) 또는 프릴링(prilling)에 의해 형성되거나, 천연 발생된다. 이러한 재료의 예는 질석, 소결 점토, 카올린, 에타펄자이트 점토, 톱밥 및 과립형 탄소이다. 셸 또는 막 재료는 천연 및 합성 고무, 셀룰로스성 재료, 스티렌-부타디엔 공중합체, 폴리아크릴로니트릴, 폴리아크릴레이트, 폴리에스테르, 폴리아미드, 폴리우레아, 폴리우레탄 및 전분 잔테이트를 포함한다.
- [0282] 농약 응용을 위한 다른 유용한 제형은 용매 중 활성 성분의 단순 용액을 포함하며, 이때 용매 중에 활성 성분은 원하는 농도에서 완전 가용성이며, 이러한 용매는, 예컨대 아세톤, 알킬화 나프탈렌, 자일렌 및 기타 유기 용매이다. 가압 분무기가 또한 사용될 수 있는데, 여기서는 활성 성분이 저비점 분산 용매 담체의 기화의 결과로서 미분된 형태로 분산되어 있다.
- [0283] 본 발명의 조성물을 전술된 제형 유형으로 제형화하는 데 유용한 적합한 농업용 애주번트 및 담체는 당업자에게 잘 공지되어 있다.
- [0284] 사용될 수 있는 액체 담체는, 예를 들어 물, 톨루엔, 자일렌, 석유 나프타, 유료 작물(crop oil), 아세톤, 메틸 에틸 케톤, 사이클로헥산, 아세트산 무수물, 아세토니트릴, 아세토페논, 아밀 아세테이트, 2-부타논, 클로로벤젠, 사이클로헥산, 사이클로헥산올, 알킬 아세테이트, 디아세톤알코올, 1,2-디클로로프로판, 디에탄올아민, p-디에틸벤젠, 디에틸렌 글리콜, 디에틸렌 글리콜 아비에테이트, 디에틸렌 글리콜 부틸 에테르, 디에틸렌 글리콜 에틸 에테르, 디에틸렌 글리콜 메틸 에테르, N,N-디메틸 포름아미드, 디메틸 설펝사이드, 1,4-디옥산, 디프

로필렌 글리콜, 디프로필렌 글리콜 메틸 에테르, 디프로필렌 글리콜 디벤조에이트, 디프록시톨, 알킬 피롤리디논, 에틸 아세테이트, 2-에틸 헥산올, 에틸렌 카르보네이트, 1,1,1-트리클로로에탄, 2-헥타논, 알파 피넨, d-리모넨, 에틸렌 글리콜, 에틸렌 글리콜 부틸 에테르, 에틸렌 글리콜 메틸 에테르, 감마-부티로락톤, 글리세롤, 글리세롤 디아세테이트, 글리세롤 모노아세테이트, 글리세롤 트리아세테이트, 헥사데칸, 헥실렌 글리콜, 이소아밀 아세테이트, 이소보르닐 아세테이트, 이소옥탄, 이소포론, 이소프로필 벤젠, 이소프로필 미리스테이트, 락트산, 라우릴아민, 메틸 옥사이드, 메톡시-프로판올, 메틸 이소아밀 케톤, 메틸 이소부틸 케톤, 메틸 라우레이트, 메틸 옥타노에이트, 메틸 올레에이트, 메틸렌 클로라이드, m-자일렌, n-헥산, n-옥틸아민, 옥타데칸산, 옥틸아민 아세테이트, 올레산, 올레일아민, o-자일렌, 페놀, 폴리에틸렌 글리콜(PEG400), 프로피온산, 프로필렌 글리콜, 프로필렌 글리콜 모노메틸 에테르, p-자일렌, 톨루엔, 트리에틸 포스페이트, 트리에틸렌 글리콜, 자일렌 설펜산, 파라핀, 광유, 트리클로로에틸렌, 퍼클로로에틸렌, 에틸 아세테이트, 아밀 아세테이트, 부틸 아세테이트, 메탄올, 에탄올, 이소프로판올, 및 더 고분자량의 알코올, 예컨대 아밀 알코올, 테트라하이드로푸르푸릴 알코올, 헥산올, 옥탄올 등, 에틸렌 글리콜, 프로필렌 글리콜, 글리세린 및 N-메틸-2-피롤리디논을 포함한다. 물이 일반적으로 농축물의 희석을 위해 선택되는 담체이다.

[0285] 적합한 고체 담체는, 예를 들어 활석, 이산화티타늄, 피로필라이트 점토, 실리카, 애타필자이트 점토, 키젤구르(kieselguhr), 백악, 규조토, 석회, 탄산칼슘, 벤토나이트 점토, 플러토, 면실피(cotton seed hull), 밀가루, 대두분, 부석, 목분, 호두 껍질 가루 및 리그닌을 포함한다.

[0286] 광범위한 표면활성제가 상기 액체 및 고체 조성물 둘 모두에, 특히 적용 전에 담체를 사용하여 희석되도록 설계된 것들에 유리하게 사용된다. 사용되는 경우, 이러한 작용제는 통상 제형의 0.1 중량% 내지 15 중량%를 구성한다. 이것은 특성상 음이온성, 양이온성, 비이온성 또는 중합체성일 수 있고, 유화제, 습윤제, 현탁화제로서 또는 다른 목적으로 사용될 수 있다. 전형적인 표면활성제는 알킬 설펜산염의 염, 예컨대 디에탄올아민 라우릴 설펜산염; 알킬아릴설펜산염의 염, 예컨대 칼슘 도데실벤젠설펜산염; 알킬페놀-알킬렌 옥사이드 부가 생성물, 예컨대 노닐페놀-C₁₈ 에톡실레이트; 알코올-알킬렌 옥사이드 부가 생성물, 예컨대 트리데실 알코올-C₁₆ 에톡실레이트; 비누, 예컨대 스테아르산나트륨; 알킬나프탈렌설펜산염의 염, 예컨대 소듐 디부틸나프탈렌설펜산염; 설펜산염의 디알킬 에스테르, 예컨대 소듐 디(2-에틸헥실) 설펜산염; 소르비톨 에스테르, 예컨대 소르비톨 올레에이트; 4차 아민, 예컨대 라우릴 트리메틸암모늄 클로라이드; 지방산의 폴리에틸렌 글리콜 에스테르, 예컨대 폴리에틸렌 글리콜 스테아레이트; 에틸렌 옥사이드 및 프로필렌 옥사이드의 블록 공중합체; 및 모노 및 디알킬 포스페이트 에스테르의 염을 포함한다.

[0287] 농업용 조성물에서 일반적으로 이용되는 다른 애드밴트는 결정화 억제제, 점도 개질제, 현탁화제, 분무 액적 개질제, 안료, 산화방지제, 거품형성제, 거품형성 방지제, 광차단제, 상용화제, 소포제, 봉쇄제, 중화제 및 완충제, 부식 억제제, 염료, 취기제(odorant), 확산제(spreading agent), 침투 보조제, 미량영양소, 연화제, 윤활제 및 점착제를 포함한다.

[0288] 게다가, 추가로, 다른 살생물 활성 성분 또는 조성물이 본 발명의 조성물과 병용되어 본 발명의 방법에 사용되어 본 발명의 조성물과 동시에 또는 순차적으로 적용될 수 있다. 동시에 적용되는 경우, 이러한 추가의 활성 성분은 본 발명의 조성물과 함께 제형화되거나, 예를 들어 분무 탱크 중에서 혼합될 수 있다. 이러한 추가의 살생물 활성 성분은 살진균제, 제초제, 살곤충제, 살세균제, 살비제, 살선충제 및/또는 식물 성장 조절제일 수 있다.

[0289] 게다가, 본 발명의 조성물은 또한 하나 이상의 전신 획득 저항성 유도제("SAR" 유도제)와 함께 적용될 수 있다. SAR 유도제는 공지되어 있으며, 예를 들어 미국 특허 제6,919,298호에 기재되어 있으며, 예를 들어 살리실레이트 및 시판 SAR 유도제 아시벤졸라-S-메틸을 포함한다.

[0290] 화학식 I의 화합물은 통상 조성물의 형태로 사용되고, 추가의 화합물과 동시에 또는 연속하여, 처리하고자 하는 식물 또는 작물 영역에 적용될 수 있다. 이러한 추가의 화합물은, 예를 들어 비료 또는 미량영양소 공급물질, 또는 식물의 성장에 영향을 미치는 다른 조제물질일 수 있다. 이들은 또한 선택적 제초제 또는 비선택적 제초제일 수 있을 뿐만 아니라 살곤충제, 살진균제, 살세균제, 살선충제, 살연체동물제 또는 이들 조제물 중 몇몇의 혼합물일 수도 있으며, 필요하다면, 이에는 제형 분야에서 관습적으로 사용되는 추가의 담체, 계면활성제 또는 적용 촉진 애드밴트가 함께 존재할 수 있다.

[0291] 화학식 I의 화합물은, 활성 성분으로서, 유리 형태의 또는 농약적으로 유용한 염 형태의 적어도 하나의 화학식 I의 화합물 또는 상기에 정의된 바와 같은 적어도 하나의 바람직한 개별 화합물, 및 적어도 하나의 상기 언급된 애드밴트를 포함하는, 식물병원성 미생물을 방제하거나 이에 대해 보호하기 위한 (살진균) 조성물의 형태로 사

용될 수 있다.

- [0292] 따라서, 본 발명은 적어도 하나의 화학식 I의 화합물, 농업적으로 허용되는 담체 및 선택적으로 애주번트를 포함하는 조성물, 바람직하게는 살진균 조성물을 제공한다. 농업적으로 허용되는 담체는, 예를 들어 농업 용도에 적합한 담체이다. 농업용 담체는 당업계에 잘 공지되어 있다. 바람직하게는, 상기 조성물은, 화학식 I의 화합물에 더하여, 적어도 하나 이상의 살충 활성 화합물, 예를 들어 추가의 살진균 활성 성분을 포함할 수 있다.
- [0293] 화학식 I의 화합물은 조성물의 유일한 활성 성분일 수 있거나, 그것은 적절한 경우에 하나 이상의 추가의 활성 성분, 예컨대 살충제, 살진균제, 상승제, 제초제 또는 식물 성장 조절제와 혼합될 수 있다. 일부 경우에, 추가의 활성 성분은 예기치 않은 상승적 활성을 가져올 수 있다.
- [0294] 적합한 추가의 활성 성분의 예에는 하기가 포함된다: 1,2,4-티아디아졸, 2,6-디니트로아닐린, 아실알라닌, 지방족 질소 화합물, 아미딘, 아미노피리미디놀, 아닐리드, 아닐리노-피리딘, 안트라퀴논, 항생제, 아틸-페닐케톤, 벤즈아미드, 벤젠-설폰아미드, 벤즈이미다졸, 벤조티아졸, 벤조티오디아졸, 벤조티오펜, 벤조일피리딘, 벤즈티아디아졸, 벤질카르바메이트, 부틸아민, 카르바메이트, 카르복스아미드, 카르프로파미드, 클로로니트릴, 신남산아미드, 구리 함유 화합물, 시아노아세트아미드옥심, 시아노아크릴레이트, 시아노이미다졸, 시아노메틸렌-티아졸리딘, 디카르보니트릴, 디카르복스아미드, 디카르복스이미드, 디메틸설파메이트, 디니트로페놀 카르보네이트, 디니트로페닐, 디니트로페닐 크로토네이트, 디페닐 포스페이트, 디티이노 화합물, 디티오카르바메이트, 디티오에테르, 디티올란, 에틸-아미노-티아졸 카르복스아미드, 에틸-포스포네이트, 푸란 카르복스아미드, 글루코피라노실, 글루코피라노실, 글루타로니트릴, 구아니딘, 제초제/식물 성장 조절제, 핵스포라노실 항생제, 하이드록시(2-아미노)피리딘, 하이드록시아닐리드, 하이드록시이속사졸, 이미다졸, 이미다졸리논, 살곤충제/식물 성장 조절제, 이소벤조푸라논, 이속사졸리디닐-피리딘, 이속사졸린, 말레이미드, 만델산 아미드, 맥틴 유도체, 모르폴린, 노르폴린, n-페닐 카르바메이트, 유기주석 화합물, 옥사티인 카르복스아미드, 옥사졸, 옥사졸리딘-디온, 페놀, 페녹시 퀴놀린, 페닐-아세트아미드, 페닐아미드, 페닐벤즈아미드, 페닐-옥소-에틸-티오펜s 아미드, 페닐피롤, 페닐우레아, 포스포로티올레이트, 인산, 프탈람산, 프탈이미드, 피롤린아미드, 피페라진, 피페리딘, 식물 추출물, 폴리옥신, 프로피온아미드, 프탈이미드, 피라졸-4-카르복스아미드, 피라졸리논, 피리다지논, 피리딘, 피리딘 카르복스아미드, 피리디닐-에틸 벤즈아미드, 피리미딘아민, 피리딘, 피리딘-아민, 피리미디온-하이드존, 피롤리딘, 피롤퀴놀리온, 퀴나졸리논, 퀴놀린, 퀴놀린 유도체, 퀴놀린-7-카르복실산, 퀴놀살린, 스피로케탈아민, 스트로빌루린, 설파모일 트리아졸, 설파미드, 테트라졸릴옥심, 티아디아진, 티아디아졸 카르복스아미드, 티아졸 카르복스아미드, 티오시아네이트, 티오펜 카르복스아미드, 툴루아미드, 트리아진, 트리아조벤티아졸, 트리아졸, 트리아졸-티온, 트리아졸로-피리미디아민, 발린아미드 카르바메이트, 암모늄 메틸 포스포네이트, 비소-함유 화합물, 벤즈이미다졸릴카르바메이트, 카르보니트릴, 카르복스아닐리드, 카르복스이미드아미드, 카르복실산 페닐아미드, 디페닐 피리딘, 푸라닐리드, 하이드라진 카르복스아미드, 이미다졸린 아세테이트, 이소프탈레이트, 이속사졸론, 수은 염, 유기수은 화합물, 유기인산염, 옥사졸리딘디온, 펜틸설포닐 벤젠, 페닐 벤즈아미드, 포스포노티오네이트, 포스포로티오에이트, 피리딜 카르복스아미드, 피리딜 푸르푸릴 에테르, 피리딜 메틸 에테르, SDHI, 티아디아지난티온, 티아졸리딘.
- [0295] 본 발명의 추가의 양태는 식물, 예를 들어 유용한 식물, 예컨대 작물 식물, 이의 번식 재료, 예를 들어 종자, 수확된 작물, 예를 들어 수확된 식용 작물, 또는 무생물 재료에 인간에게 잠재적으로 해로운 식물병원성 또는 부패 미생물 또는 유기체, 특히 진균 유기체가 침입하는 것을 방제 또는 예방하는 방법에 관한 것으로, 본 방법은 활성 성분으로서 화학식 I의 화합물 또는 상기 정의된 바와 같은 바람직한 개별 화합물을 식물에, 식물의 부분들 또는 이의 서식지에, 이의 번식 재료에, 또는 무생물 재료의 임의의 부분에 적용하는 것을 포함한다.
- [0296] 방제 또는 예방은 곤충이, 또는 인간에게 잠재적으로 해로운 식물병원성 또는 부패 미생물 또는 유기체, 특히 진균 유기체가 침입하는 것을 개선이 입증되는 수준까지 감소시키는 것을 의미한다.
- [0297] 화학식 I의 화합물, 또는 상기 화합물들 중 적어도 하나를 함유하는 농약 조성물의 적용을 포함하는, 작물 식물에 식물병원성 미생물, 특히 진균 유기체, 또는 곤충이 침입하는 것을 방제 또는 예방하는 바람직한 방법은 엽면 적용이다. 적용 빈도 및 적용물은 상응하는 병원체 또는 곤충의 침입 위험에 따라 좌우될 것이다. 그러나, 화학식 I의 화합물은 또한, 액체 제형으로 식물의 서식지를 관주(drenching)시키거나, 화합물을 고체 형태, 예를 들어 과립 형태로 토양에 적용(토양 적용)함으로써, 토양을 통해 뿌리를 거쳐 식물에 침투될 수 있다(침투적 작용). 수벼(water rice) 작물에서는, 이러한 과립이 담수된 논에 적용될 수 있다. 화학식 I의 화합물은 또한, 종자 또는 괴경을 살진균제의 액체 제형으로 함침시키거나 이들을 고체 제형으로 코팅함으로써 종자에 적용될 수 있다(코팅).

- [0298] 제형, 예를 들어 화학식 I의 화합물, 및 필요하다면, 화학식 I의 화합물을 캡슐화하기 위한 고체 또는 액체 애췌번트 또는 단량체를 함유하는 조성물은 공지된 방식으로, 전형적으로 화합물을 증량제, 예를 들어 용매, 고체 담체, 및 선택적으로 표면 활성 화합물(계면활성제)과 친밀하게 혼합 및/또는 그라인딩함으로써 제조될 수 있다.
- [0299] 본 조성물의 적용 방법, 즉 전술된 유형의 해충을 방제하는 방법, 예컨대 분무, 무화, 산분, 브러싱, 분의, 산포 또는 주입(이들은 우세한 상황에 대해 의도된 목적에 적합하도록 선택되어야 함) 및 상기 언급된 유형의 해충들을 방제하기 위한 조성물의 용도가 본 발명의 다른 주제이다. 전형적인 농축물은 0.1 ppm 내지 1000 ppm, 바람직하게 0.1 ppm 내지 500 ppm의 활성 성분이다. 헥타르당 적용률은 바람직하게는 헥타르당 1 g 내지 2000 g의 활성 성분, 더 바람직하게는 10 내지 1000 g/ha, 가장 바람직하게는 10 내지 600 g/ha이다. 종자 관주제(drenching agent)로서 사용되는 경우, 편리한 투여량은 종자 kg당 10 mg 내지 1 g의 활성 물질이다.
- [0300] 본 발명의 병용물이 종자를 처리하는 데 사용되는 경우, 종자 kg당 0.001 내지 50 g의 화학식 I의 화합물, 바람직하게는 종자 kg당 0.01 내지 10 g의 화학식 I의 화합물의 적용률이면 일반적으로 충분하다.
- [0301] 적합하게는, 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물을 포함하는 조성물은 예방적(이는 질병 발생 전을 의미함)으로 또는 근치적(이는 질병 발생 후를 의미함)으로 적용된다.
- [0302] 본 발명의 조성물은 임의의 통상적인 형태로, 예를 들어 트윈 팩(twin pack), 건조 종자 처리용 분말(DS), 종자 처리용 에멀전(ES), 종자 처리용 유동성 농축물(FS), 종자 처리용 용액(LS), 종자 처리용 수분산성 분말(WS), 종자 처리용 캡슐 현탁액(CF), 종자 처리용 겔(GF), 유화성 농축물(EC), 현탁액 농축물(SC), 유현탁액(suspension)(SE), 캡슐 현탁액(CS), 수분산성 과립(WG), 유화성 과립(EG), 유중수 에멀전(EO), 수중유 에멀전(EW), 마이크로-에멀전(ME), 오일 분산물(OD), 오일 혼화성 유동액(OF), 오일 혼화성 액(OL), 수용성 농축물(SL), 초저용적 현탁액(SU), 초저용적 액(UL), 공업용 농축물(TK), 분산성 농축물(DC), 습윤성 분말(WP) 또는 농업적으로 허용되는 애췌번트와 배합된 임의의 기술적으로 실행 가능한 제형의 형태로 사용될 수 있다.
- [0303] 이러한 조성물은 통상적인 방식으로, 예를 들어 활성 성분들을 적절한 제형 불활성 물질(formulation inert)(희석제, 용매, 충전제 및 선택적으로 다른 제형화 성분, 예컨대 계면활성제, 살생물제, 동결방지제, 점착제, 증점제 및 애췌번시 효과를 제공하는 화합물)과 혼합함으로써 생성될 수 있다. 또한, 통상적인 서방형 제형이 사용될 수 있는데, 이러한 제형에서는 오래 지속되는 효능이 의도된다. 특히, 분무 형태로 적용될 제형, 예컨대 수분산성 농축물(예를 들어, EC, SC, DC, OD, SE, EW, EO 등), 습윤성 분말 및 과립은 습윤제 및 분산제와 같은 계면활성제 및 애췌번시 효과를 제공하는 다른 화합물, 예를 들어 포름알데하이드와 나프탈렌 설포네이트, 알킬아릴설포네이트, 리그닌 설포네이트, 지방 알킬 설페이트, 및 에톡실화 알킬페놀 및 에톡실화 지방 알코올의 축합 생성물을 함유할 수 있다.
- [0304] 적합한 종자 분의 제형 형태로, 예를 들어 종자에 대해 우수한 접착력을 갖는 수성 현탁액으로서 또는 건조한 분말 형태로 본 발명의 병용물 및 희석제를 사용하여, 종자 분의 제형이 그 자체로 공지된 방식으로 종자에 적용된다. 이러한 종자 분의 제형은 당업계에 공지되어 있다. 종자 분의 제형은 단일 활성 성분들을 함유하거나, 또는 캡슐화된 형태로, 예를 들어 서방형 캡슐 또는 마이크로캡슐로서 활성 성분들의 병용물을 함유할 수 있다.
- [0305] 일반적으로, 제형은 0.01 내지 90 중량%의 활성제, 0 내지 20 중량%의 농업적으로 허용되는 계면활성제 및 10 내지 99.99 중량%의 고체 또는 액체 제형 불활성 물질 및 애췌번트(들)를 포함하며, 상기 활성제는 적어도 화학식 I의 화합물 및 이와 함께 성분 (B) 및 성분 (C), 그리고 선택적으로 다른 활성제, 특히 살미생물제 또는 보존제 등으로 이루어진다. 조성물의 농축된 형태는 일반적으로 약 2 내지 80 중량%, 바람직하게는 약 5 내지 70 중량%의 활성제를 함유한다. 제형의 적용 형태는, 예를 들어 0.01 내지 20 중량%, 바람직하게는 0.01 내지 5 중량%의 활성제를 함유할 수 있다. 시판 제품은 바람직하게는 농축물로서 제형화될 것이지만, 최종 사용자는 통상적으로 희석된 제형을 사용할 것이다.
- [0306] 시판 제품은 농축물로서 제형화하는 것이 바람직하지만, 최종 사용자는 통상적으로 희석된 제형을 사용할 것이다.
- [0307] 실시예
- [0308] 하기의 실시예는 본 발명을 예시하는 역할을 한다. 본 발명의 소정의 화합물은 낮은 적용률에서의 더 큰 효능에 의해 공지된 화합물들과 구별될 수 있으며, 이는, 필요하다면 더 낮은 적용률, 예를 들어 50 ppm, 12.5 ppm, 6 ppm, 3 ppm, 1.5 ppm, 0.8 ppm 또는 0.2 ppm을 사용하여, 실시예에서 개략적으로 설명된 실험 절차를 사용하여

당업자에 의해 입증될 수 있다.

[0309] 본 명세서 전체에 걸쳐, 온도는 섭씨도로 주어지고, "m.p."는 용점을 의미한다. LC/MS는 액체 크로마토그래피 질량 분석을 의미하고, 장치 및 방법에 대한 설명은 하기와 같다:

[0310] 방법 G:

[0311] 하기의 질량분석계 상에서 스펙트럼을 기록하였다: 전기분무 공급원을 구비한 Waters사로부터의 질량 분석계 (SQD, SQDII 단일 사중극자 질량 분석계)(극성: 양이온 및 음이온), 모세관: 3.00 kV, 콘각: 30 V, 추출기: 2.00 V, 공급원 온도: 150°C, 탈용매화 온도: 350°C, 콘 가스 유량: 50 l/h, 탈용매화 가스 유량: 650 l/h, 질량 범위: 100 내지 900 Da) 및 Waters사로부터의 Acquity UPLC: 바이너리 펌프, 가열된 컬럼 구획, 다이오드-어레이 검출기 및 ELSD 검출기. 컬럼: Waters UPLC HSS T3, 1.8 μm, 30 x 2.1 mm, 온도: 60°C, DAD 파장 범위 (nm): 210 내지 500, 용매 구배: A = 물 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH, B = 아세트니트릴 + 0.05% HCOOH, 구배: 1.2분만에 10 내지 100% B; 유량(ml/min) 0.85

[0312] 방법 H:

[0313] 하기의 질량분석계 상에서 스펙트럼을 기록하였다: 전기분무 공급원을 구비한 Waters사로부터의 질량 분석계 (SQD, SQDII 단일 사중극자 질량 분석계)(극성: 양이온 및 음이온), 모세관: 3.00 kV, 콘각: 30V, 추출기: 2.00 V, 공급원 온도: 150°C, 탈용매화 온도: 350°C, 콘 가스 유량: 50 l/h, 탈용매화 가스 유량: 650 l/h, 질량 범위: 100 내지 900 Da) 및 Waters사로부터의 Acquity UPLC: 바이너리 펌프, 가열된 컬럼 구획, 다이오드-어레이 검출기 및 ELSD 검출기. 컬럼: Waters UPLC HSS T3, 1.8 μm, 30 x 2.1 mm, 온도: 60°C, DAD 파장 범위 (nm): 210 내지 500, 용매 구배: A = 물 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH, B = 아세트니트릴 + 0.05% HCOOH, 구배: 2.7분만에 10 내지 100% B; 유량(ml/min) 0.85

[0314] 방법 W:

[0315] 하기의 질량 분석계 상에서 스펙트럼을 기록하였다: 전기분무 공급원을 구비한 Waters사로부터의 질량 분석계 (ACQUITY UPLC)(SQD, SQDII 단일 사중극자 질량 분석계)(극성: 양이온 또는 음이온, 모세관: 3.0 kV, 콘: 30 V, 추출기: 3.00 V, 공급원 온도: 150°C, 탈용매화 온도: 400°C, 콘 가스 유량: 60 L/Hr, 탈용매화 가스 유량: 700 L/Hr, 질량 범위: 140 내지 800 Da), DAD 파장 범위 (nm): 210 내지 400, 및 Waters사로부터의 Acquity UPLC: 용매 탈기제, 바이너리 펌프, 가열된 컬럼 구획 및 다이오드-어레이 검출기. 컬럼: Waters UPLC HSS T3, 1.8 μm, 30 x 2.1 mm, 온도: 60°C, DAD 파장 범위(nm): 210 내지 500, 용매 구배: A = 물/메탄올 9:1, 0.1% 포름산, B = 아세트니트릴 + 0.1% 포름산, 구배: 2.5분만에 0 내지 100% B; 유량(ml/min) 0.75

[0316] 제형 실시예

습윤성 분말	a)	b)	c)
활성 성분 [화학식 I의 화합물]	25%	50%	75%
소듐 리그노설포네이트	5%	5%	-
소듐 라우릴 설페이트	3%	-	5%
소듐 디이소부틸나프탈렌설포네이트	-	6%	10%
페놀 폴리에틸렌 글리콜 에테르 (7 내지 8 몰의 에틸렌 옥사이드)	-	2%	-
고도로 분산된 규산	5%	10%	10%
카올린	62%	27%	-

[0317]

[0318] 활성 성분을 애주번트와 완전히 혼합하고, 혼합물을 적합한 밀(mill) 내에서 완전히 그라인딩하여 습윤성 분말을 획득하는데, 이 분말을 물로 희석시켜 원하는 농도의 현탁액을 제공할 수 있다.

건조 중자 처리용 분말	a)	b)	c)
활성 성분 [화학식 I의 화합물]	25%	50%	75%
경질 광유	5%	5%	5%
고도로 분산된 규산	5%	5%	-
카올린	65%	40%	-
활석	-	-	20

[0319]

[0320] 활성 성분을 애주번트와 완전히 혼합하고, 혼합물을 적합한 밀 내에서 완전히 그라인딩하여 분말을 획득하는데, 이 분말을 중자 처리에 직접 사용할 수 있다.

유화성 농축물	
활성 성분 [화학식 I의 화합물]	10%
옥틸페놀 폴리에틸렌 글리콜 에테르 (4 내지 5 몰의 에틸렌 옥사이드)	3%
칼슘 도데실벤젠설포네이트	3%
피마자유 폴리글리콜 에테르 (35 몰의 에틸렌 옥사이드)	4%
사이클로헥사논	30%
자일렌 혼합물	50%

[0321]

[0322]

이러한 농축물을 물로 희석하여, 식물 보호에 사용될 수 있는 임의의 필요한 희석물의 에멀전을 수득할 수 있다.

분제	a)	b)	c)
활성 성분 [화학식 I의 화합물]	5%	6%	4%
활석	95%	-	-
카올린	-	94%	-
광물 충전제	-	-	96%

[0323]

[0324]

활성 성분을 담체와 혼합하고 혼합물을 적합한 밀 내에서 그라인딩함으로써 즉시 사용가능한 분제를 수득한다. 이러한 분말은 또한 증자용 건조 분의에 사용할 수 있다.

압출기 과립	
활성 성분 [화학식 I의 화합물]	15%
소듐 리그노설포네이트	2%
카르복시메틸셀룰로스	1%
카올린	82%

[0325]

[0326]

활성 성분을 애췌번트와 혼합하고 그라인딩하고, 혼합물을 물로 가습시킨다. 혼합물을 압출하고, 이어서 공기 스트림 중에서 건조시킨다.

코팅된 과립	
활성 성분 [화학식 I의 화합물]	8%
폴리에틸렌 글리콜 (물중량 200)	3%
카올린	89%

[0327]

[0328]

미세하게 그라인딩된 활성 성분을 혼합기 내에서, 폴리에틸렌 글리콜로 가습된 카올린에 균일하게 적용한다. 이러한 방식으로 비분진성(non-dusty) 코팅된 과립을 수득한다.

[0329]

현탁액 농축물

활성 성분 [화학식 I의 화합물]	40%
프로필렌 글리콜	10%
노닐페놀 폴리에틸렌 글리콜 에테르 (15 몰의 에틸렌 옥사이드)	6%
소듐 리그노설포네이트	10%
카르복시메틸셀룰로스	1%
실리콘 오일 (물 중 75% 에멀전 형태임)	1%
물	32%

[0330]

[0331]

미세하게 그라인딩된 활성 성분을 애췌번트와 친밀하게 혼합하여, 현탁액 농축물을 제공하고, 이를 물로 희석하여 임의의 원하는 희석물의 현탁액을 수득할 수 있다. 이러한 희석물을 사용하여, 분무, 주입 또는 침지에 의해 살아있는 식물뿐만 아니라 식물 번식 재료를 미생물에 의한 침입에 대해 처리 및 보호할 수 있다.

[0332]

종자 처리용 유동성 농축물

활성 성분 [화학식 I의 화합물]	40%
프로필렌 글리콜	5%
공중합체 부탄올 PO/EO	2%
10 내지 20 몰의 EO를 갖는 트리스테렌페놀	2%
1,2-벤즈이소티아졸린-3-온 (물 중 20% 용액의 형태임)	0.5%
모노아조-안료 칼슘 염	5%
실리콘 오일 (물 중 75% 에멀전 형태임)	0.2%
물	45.3%

[0333]

[0334] 미세하게 그라인딩된 활성 성분을 애쥬번트와 친밀하게 혼합하여, 현탁액 농축물을 제공하고, 이를 물로 희석하여 임의의 원하는 희석물의 현탁액을 수득할 수 있다. 이러한 희석물을 사용하여, 분무, 주입 또는 침지에 의해 살아있는 식물뿐만 아니라 식물 번식 재료를 미생물에 의한 침입에 대해 처리 및 보호할 수 있다.

[0335] 서방형 캡슐 현탁액

[0336] 화학식 I의 화합물의 병용물 28 부를 2 부의 방향족 용매 및 7 부의 톨루엔 디이소시아네이트/폴리메틸렌-폴리페닐이소시아네이트-혼합물(8:1)과 혼합한다. 이 혼합물을 원하는 입자 크기가 달성될 때까지 1.2 부의 폴리비닐알코올, 0.05 부의 소포제 및 51.6 부의 물의 혼합물 중에 유화한다. 이 유화액에, 5.3 부의 물 중 2.8 부의 1,6-디아미노hex산의 혼합물을 첨가한다. 혼합물을 중합 반응이 완료될 때까지 교반한다.

[0337] 수득된 캡슐 현탁액을 0.25 부의 증점제 및 3 부의 분산제를 첨가함으로써 안정화시킨다. 캡슐 현탁액 제형은 28%의 활성 성분을 함유한다. 중간 캡슐 직경은 8 내지 15 마이크론이다.

[0338] 생성된 제형은 그러한 목적에 적합한 장치에서 수성 현탁액으로서 종자에 적용된다.

[0339] 제조예

[0340] 실시예 1: N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)퀴놀린-3-카르복사미드의 제조

[0341] 단계 1: 2,4-디메틸-1-페닐-펜탄-2-올의 제조

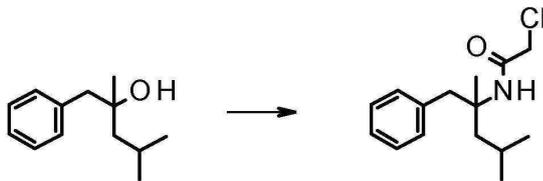


[0342]

[0343] 디에틸 에테르(25 mL) 중 4-메틸-2-펜타논(3.0 g, 29.4 mmol)의 용액을 실온에서 테트라하이드로푸란 중 벤질마그네슘 클로라이드(테트라하이드로푸란 중 2 M, 22 mL, 44 mmol)에 적가하였다. 이어서, 반응 혼합물을 35°C 까지 가온시키고, 이 온도에서 3시간 동안 에이징하였다. 실온까지 냉각시킨 후, HCl 수용액(2 M)을 반응물에 첨가하고, 혼합물을 물과 에틸 아세테이트 사이에 분배하였다. 유기 층을 염수로 세척하고, Na₂SO₄로 건조시키고, 여과하고, 진공 중에서 농축시켰다. 잔류물을 실리카 겔 상에서의 크로마토그래피로 정제하여, 무색 액체로서 표제 화합물을 수득하였다.

[0344] ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 7.18-7.34 (m, 5H), 2.65-2.85 (m, 2H), 1.81-1.99 (m, 1H), 1.42 (dd, 2H), 1.15 (s, 3H), 0.98 (dd, 6H).

[0345] 단계 2: N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-2-클로로-아세트아미드의 제조

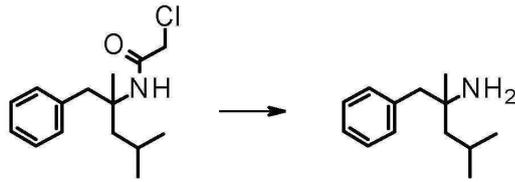


[0346]

[0347] 0 내지 5°C까지 냉각된 아세트산(11 mL) 중 2,4-디메틸-1-페닐-펜탄-2-올(3.6 g, 19 mmol) 및 클로로아세트오닐트릴(2.4 mL, 37 mmol)의 용액에 진한 황산(3.1 mL, 56 mmol)을 적가하였다. 생성된 슬러리를 20°C까지 가온시키고, 이 온도에서 3시간 동안 교반하였다. 이어서, 반응 혼합물을 물로 희석시키고 에틸 아세테이트로 추출하였다. 유기 층을 NaHCO₃ 수용액, 염수로 세척하고, MgSO₄로 건조시키고, 여과하고, 진공 중에서 농축시켰다. 잔류물을 실리카 겔 상에서의 크로마토그래피로 정제하여, 무색 고체로서 표제 화합물을 수득하였다.

[0348] ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 7.20-7.34 (m, 3H), 7.08-7.16 (m, 2H), 6.13 (br. s., 1H), 3.94 (s, 2H), 3.21 (d, 1H), 2.90 (d, 1H), 1.86-1.95 (m, 1H), 1.73-1.86 (m, 1H), 1.54 (dd, 1H), 1.31 (s, 3H), 0.96 (dd, 6H).

[0349] 단계 3: 2,4-디메틸-1-페닐-펜탄-2-아민의 제조

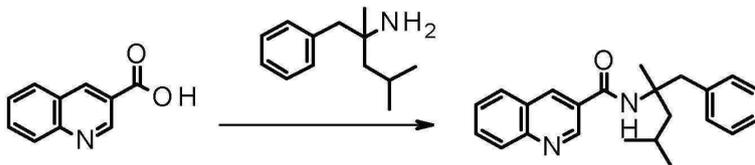


[0350]

[0351] 에탄올(30 mL) 중 N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-2-클로로-아세트아미드(3.0 g, 11.2 mmol), 아세트산(3.9 mL, 67 mmol) 및 티오우레아(1.02 g, 13.4 mmol)의 용액을 80°C까지 가온시키고, 이 온도에서 18시간 동안 교반하였다. 이어서, 반응 혼합물을 20°C까지 냉각시키고, HCl 수용액(0.5 M)으로 희석시키고, 셀라이트의 짧은 패드를 통해 여과하였다. 여과액을 에틸 아세테이트로 세척하였으며; 이어서, 수성 층을 4 M NaOH로 염기성화하고, n-헥산으로 추출하였다. n-헥산 층을 염수로 세척하고, Na₂SO₄로 건조시키고, 여과하고, 진공 중에서 농축시켜, 담갈색 오일로서 표제 화합물을 수득하였다.

[0352] ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 7.14-7.34 (m, 5H), 2.59-2.71 (m, 2H), 1.78-1.94 (m, 1H), 1.26-1.41 (m, 2H), 1.05 (s, 3H), 1.03 (br. s, 2H), 0.98 (dd, 6H).

[0353] 단계 4: N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)퀴놀린-3-카르복스아미드의 제조



[0354]

[0355] 건성 디메틸포름아미드(5 mL) 중 퀴놀린-3-카르복실산(0.20 g, 1.15 mmol), 2,4-디메틸-1-페닐-펜탄-2-아민(0.22 g, 1.15 mmol), 트리에틸아민(0.14 g, 1.4 mmol) 및 1-하이드록시-7-아자벤조트리아졸(0.16 g, 1.15 mmol)의 용액에 실온에서 N-(3-디메틸아미노프로필)-N'-에틸카르보디이미드 HCl(0.22 g, 1.15 mmol)을 첨가하고, 생성된 용액을 20°C에서 18시간 동안 에이징하였다. 물을 첨가하고, 혼합물을 에틸 아세테이트로 추출하였다. 유기 상을 염수로 세척하고, Na₂SO₄로 건조시키고, 여과하고, 진공 중에서 농축시켰다. 잔류물을 실리카 겔 상에서의 크로마토그래피로 정제하여, 백색 고체로서 표제 화합물을 수득하였다: m.p. 121°C.

[0356] ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 9.12 (d, 1H), 8.40 (d, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.86 (d, 1H), 7.74-7.82 (m, 1H), 7.56-7.64 (m, 1H), 7.16-7.30 (m, 5H), 5.73 (s, 1H), 3.46 (d, 1H), 2.98 (d, 1H), 2.17 (dd, 1H), 1.84-1.99 (m, 1H), 1.67 (dd, 1H), 1.43 (s, 3H), 1.02 (d, 6H).

[0357] 실시예 2: N-(1-벤질-1,3-디메틸-부트-3-에닐)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드의 제조

[0358] 단계 1: 2-메틸-N-(1-메틸-2-페닐-에틸리엔)프로판-2-설피나미드의 제조

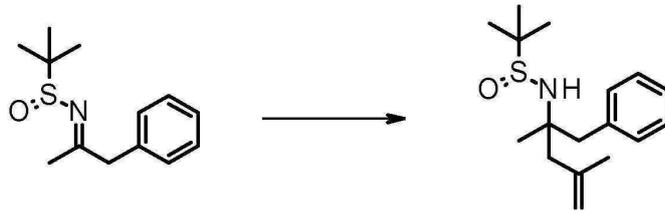


[0359]

[0360] 1-페닐프로판-2-온(8.30 g, 61.9 mmol)을 테트라하이드로푸란(75 mL) 중에 용해시키고, 티타늄(IV)에톡사이드(32.6 g, 92.8 mmol) 및 2-메틸프로판-2-설피나미드(7.50 g, 61.9 mmol)를 실온에서 순차적으로 첨가하고, 생성된 혼합물을 60°C까지 가온시켰다. 60°C에서 2시간 동안 교반한 후에, 반응물을 실온까지 냉각시키고, NaHCO₃ 수용액으로 켄칭(quenching)하였다. 생성된 혼합물을 여과하고, 여과 케이크를 에틸 아세테이트로 세척하였다. 합한 여과액을 에틸 아세테이트로 추출하고, 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨으로 건조시키고, 여과하고, 진공 중에서 농축시켜, 밝은황색 오일로서 표제 화합물(순도 80% 초과, 약 4:1 비의 시스-트랜스 이성체)을 수득하였으며, 이것을 그 자체로 다음 단계에 사용하였다.

[0361] ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3 , 주요 이성체) δ 7.17-7.43 (m, 5H), 3.72 (d, 1H), 3.70 (d, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.23 (s, 9H)

[0362] 단계 2: N-(1-벤질-1,3-디메틸-부트-3-에닐)-2-메틸-프로판-2-설펜아미드의 제조

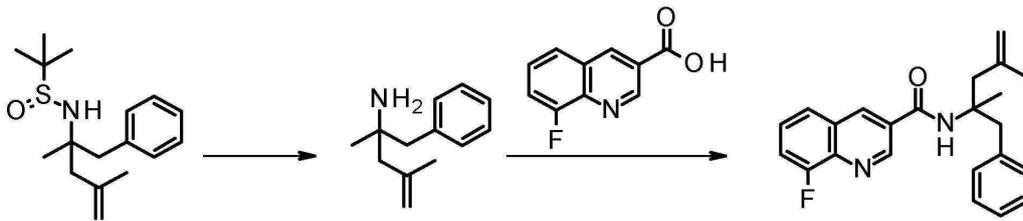


[0363]

[0364] 디클로로메탄(100 mL) 중 조(crude) 2-메틸-N-(1-메틸-2-페닐-에틸리텐)프로판-2-설펜아미드(80% purity, 7.4 g, 24.9 mmol)의 용액을 -50°C 로 유지된 THF 중 2-메틸알릴마그네슘 클로라이드(0.5 M, 75 mL, 37.4 mmol)의 구매 가능한 용액에 서서히 첨가하였다. 반응 혼합물을 4시간에 걸쳐 20°C 까지 서서히 가온시키고, 20°C 에서 하룻밤 교반하였다. 이어서, 포화 NH_4Cl 용액을 첨가하고, 혼합물을 에틸 아세테이트로 추출하고, 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨으로 건조시키고, 여과하고, 진공 중에서 농축시켰다. 잔류물을 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피로 정제하여, 부분입체 이성체 혼합물로서 표제 화합물을 수득하였다.

[0365] ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3 , 주요 이성체) δ 6.94-7.18 (m, 5H), 4.82 (s, 1H), 4.71 (s, 1H), 3.39 (s, 1H), 2.76 (d, 1H), 2.55 (d, 1H), 2.21 (d, 2H), 1.63 (s, 3H), 1.06 (s, 3H), 0.94 (s, 9H).

[0366] 단계 3: N-(1-벤질-1,3-디메틸-부트-3-에닐)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드의 제조



[0367]

[0368] 메탄올(16 mL) 중 N-(1-벤질-1,3-디메틸-부트-3-에닐)-2-메틸-프로판-2-설펜아미드(5.2 g, 15.9 mmol)의 병행 용액에 1,4-디옥산 중 HCl (4 M, 6 mL, 24 mmol)을 첨가하고, 생성된 용액을 0 내지 5°C 에서 2시간 동안 교반하였다. 이어서, 모든 휘발성 물질을 진공 중에서 제거하여 갈색의 검질(gummy) 잔류물을 수득하였으며, 이것을 디에틸 에테르/헵탄의 혼합물로 분쇄하였다. 생성된 담갈색 고체를 진공 중에서 건조시키고, 다음 단계에 그 자체를 사용하였다.

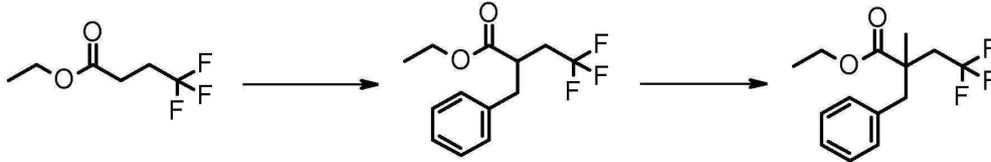
[0369] 상기에서 수득된 고체 하이드로클로라이드 염의 일부분(2 g, 8.0 mmol)을 디클로로메탄(40 mL) 중에 현탁시키고, 8-플루오로퀴놀린-3-카르복실산(1.68 g, 8.8 mmol), 트리에틸아민(2.8 mL, 19.9 mmol), 1-하이드록시-7-아자벤조트리아졸(1.2 g, 8.8 mmol) 및 N-(3-디메틸아미노프로필)-N'-에틸카르보디이미드-HCl(1.72 g, 8.8 mmol)을 주위 온도에서 순차적으로 첨가하였다. 생성된 혼합물을 20°C 에서 2시간 동안 에이징하였다. 이어서, 물을 첨가하고, 혼합물을 디클로로메탄으로 추출하였다. 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨으로 건조시키고, 여과하고, 진공 중에서 농축시켰다. 잔류물을 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피로 정제하여, 백색 고체로서 표제 화합물을 수득하였다: m.p. 115 내지 117°C .

[0370] ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 9.11-9.26 (m, 1H), 8.50 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.45-7.64 (m, 2H), 7.19-7.37 (m, 5H), 5.96 (s, 1H), 5.01 (s, 1H), 4.84 (s, 1H), 3.57 (d, 1H), 3.08 (dd, 2H), 2.46 (d, 1H), 1.89 (s, 3H), 1.47 (s, 3H).

[0371] ^{19}F NMR (377 MHz, CDCl_3) δ -124.64 (s).

[0372] 실시예 3: N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드

[0373] 단계 1: 에틸 2-벤질-4,4,4-트리플루오로-2-메틸-부타노에이트의 제조



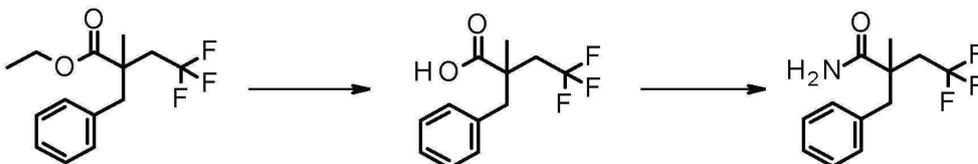
[0374]

[0375] n-부틸 리튬(헥산 중 2.5 M, 100 mL, 248.9 mmol)을 -70℃에서 테트라하이드로푸란(400 mL) 중 디이소프로필 아민(35.2 mL, 248.9 mmol)의 용액에 서서히 첨가하였다. 생성된 용액을 -70℃에서 30분 동안 에이징하고, 이어서 에틸 4,4,4-트리플루오로부티레이트(36 g, 207.4 mmol)를 적가하였다. 반응물을 -70℃에서 2시간 동안 교반하고, 벤질 브로마이드(43.2 g, 248.9 mmol)를 첨가하고, 반응 혼합물을 약 2시간에 걸쳐 실온까지 서서히 가온시켰다. 포화 NH₄Cl 용액을 첨가하고, 혼합물을 메틸 tert-부틸 에테르로 추출하였다. 유기 층을 물, 염수로 세척하고, MgSO₄로 건조시키고, 여과하고, 진공 중에서 농축시켰다. 잔류 오일을 실리카 겔의 짧은 패드에 통과시키고, 패드를 사이클로헥산:에틸 아세테이트(2:1)로 행구고, 여과액을 진공 중에서 농축시켜, 맑은 오렌지색 오일로서 에틸 4,4,4-트리플루오로-2-메틸-부타노에이트를 수득하였다.

[0376] n-부틸 리튬(헥산 중 2.5 M, 99 mL, 247.2 mmol)을 -70℃에서 테트라하이드로푸란(380 mL) 중 디이소프로필 아민(35 mL, 247.2 mmol)의 용액에 서서히 첨가하였다. 생성된 용액을 -70℃에서 30분 동안 에이징하고, 이어서 상기에서 수득된 조 생성물(49.5 g, 190.2 mmol, 테트라하이드로푸란(30 mL)으로 희석됨)을 -70℃에서 서서히 첨가하였다. 생성된 암색 용액을 -70℃에서 2시간 동안 교반한 후, 메틸 요오다이드(13.1 mL, 209.3 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 약 3시간에 걸쳐 20℃까지 서서히 가온시키고, 이어서 포화 NH₄Cl 용액으로 켄칭하고, 메틸 tert-부틸 에테르로 추출하였다. 유기 층을 물, 염수로 세척하고, MgSO₄로 건조시키고, 여과하고, 진공 중에서 농축시켰다. 잔류 오일을 실리카 겔의 짧은 패드에 통과시키고, 패드를 사이클로헥산:에틸 아세테이트(2:1)로 행구고, 여과액을 진공 중에서 농축시켜, 담갈색 오일로서 표제 화합물(약 80% 순도)을 수득하였다.

[0377] ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 7.05-7.33 (m, 5H), 4.13 (q, 2H), 2.98 (d, 1H), 2.81-2.72 (m, 2H), 2.11-2.32 (m, 1H), 1.28 (s, 3H), 1.21 (t, 3H).

[0378] 단계 2: 2-벤질-4,4,4-트리플루오로-2-메틸-부탄아미드의 제조



[0379]

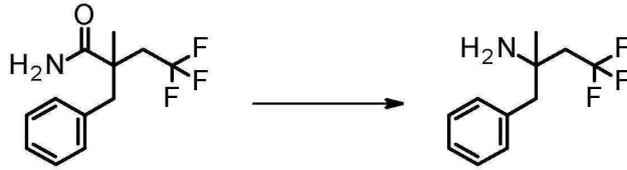
[0380] 1,4-디옥산(45 mL)/에탄올(45 mL) 중 에틸 2-벤질-4,4,4-트리플루오로-2-메틸-부타노에이트(25.5 g, 93.0 mmol)의 용액을 실온에서 NaOH(7.6 g, 186 mmol)로 처리하고, 생성된 용액을 90℃까지 가온시키고, 90℃에서 1시간 동안 에이징하였다. 실온까지 냉각시킨 후, 반응 혼합물을 원래 부피의 약 50%까지 농축시켰다. 잔류물을 물로 희석시키고, 사이클로헥산으로 세척하였다. 이어서, 수층을 25℃ 미만의 온도에서 빙랭 하에서 HCl(진한 것)로 산성화하고, 혼합물을 DCM으로 추출하였다. 유기 층을 염수로 세척하고, Na₂SO₄로 건조시키고, 여과하고, 진공 중에서 농축시켜, 암황색 오일로서 2-벤질-4,4,4-트리플루오로-2-메틸-부탄산을 수득하였다.

[0381] 디클로로메탄(25 mL) 중 조 2-벤질-4,4,4-트리플루오로-2-메틸-부탄산 (6.7 g, 27.2 mmol) 및 디메틸 포름아미드(0.1 mL, 1.4 mmol)의 용액에 20℃에서 염화옥살릴(2.5 mL, 28.6 mmol)를 첨가하였다. 생성된 용액을 20℃에서 1시간 동안 교반하고, 이어서 모든 휘발성 물질을 진공 중에서 제거하였다. 잔류물을 디클로로메탄(25 mL) 중에 용해시키고, 생성된 용액을 빙랭된 급속 교반된 암모니아 수용액(25 중량%, 21 mL)에 서서히 첨가하였다. 생성된 혼합물을 실온까지 서서히 가온시키고, 30분 동안 교반하였다. 이어서, 물을 첨가하고, 혼합물을 디클로로메탄으로 추출하였다. 유기 층을 물, 염수로 세척하고, Na₂SO₄로 건조시키고, 여과하고, 진공 중에서 농축시켜, 담갈색 오일로서 표제 화합물을 수득하였다.

[0382] ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 7.13-7.44 (m, 5H), 5.42 (br s, 2H), 3.13 (d, 1H), 2.97-3.09 (m, 1H), 2.67

(d, 1H), 2.18 (qd, 1H), 1.33 (s, 3H).

[0383] 단계 3: 4,4,4-트리플루오로-2-메틸-1-페닐-부탄-2-아민의 제조

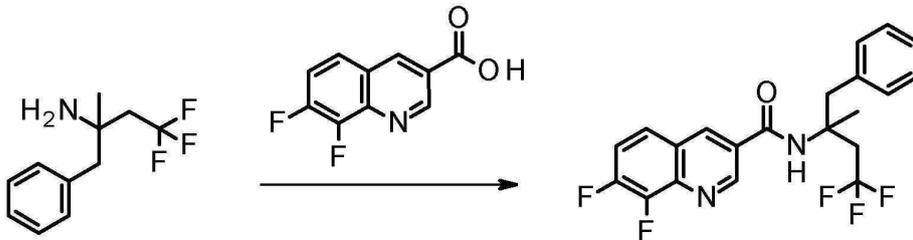


[0384]

[0385] 아세트니트릴(25 mL)/물(25 mL) 중 2-벤질-4,4,4-트리플루오로-2-메틸-부탄아미드(6.6 g, 26.9 mmol)의 용액에 실온에서 디아세톡시옥도벤젠 (9.73 g, 29.6 mmol) 및 트리플루오로아세트산(4.6 mL, 59.2 mmol)을 첨가하고, 생성된 혼합물을 실온에서 18시간 동안 교반하였다. 이어서, 아세트니트릴을 진공 중에서 제거하고, 잔류 수성 에멀전을 진한 HCl을 사용하여 pH 1로 조정하고, 메틸 tert-부틸 에테르로 세척하였다. 수성 층을 NaOH(8 M)를 사용하여 pH 12로 염기성화하고, 메틸 tert-부틸 에테르로 추출하였다. 유기 층을 염수로 세척하고, Na₂SO₄로 건조시키고, 여과하고, 진공 중에서 농축시켜, 황색 오일로서 표제 화합물을 수득하였다.

[0386] ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 7.16-7.50 (m, 5H), 2.81 (s, 2H), 2.13-2.41 (m, 2H), 1.28 (s, 3H).

[0387] 단계 4: N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드의 제조



[0388]

[0389] 디클로로메탄(10 mL) 중 7,8-디플루오로퀴놀린-3-카르복실산(0.35 g, 1.67 mmol), 4,4,4-트리플루오로-2-메틸-1-페닐-부탄-2-아민(0.40 g, 0.84 mmol), 트리에틸아민(0.6 mL, 4.2 mmol) 및 1-하이드록시-7-아자벤조트리아졸(0.27 g, 2.0 mmol)의 용액에 실온에서 N-(3-디메틸아미노프로필)-N'-에틸카르보디이미드-HCl(0.39 g, 2.0 mmol)을 첨가하였다. 생성된 혼합물을 실온에서 15시간 동안 교반하고, 이어서 물로 켄칭하였다. 혼합물을 디클로로메탄으로 추출하고, 유기 층을 물, 염수로 세척하고, Na₂SO₄로 건조시키고, 여과하고, 진공 중에서 농축시켰다. 잔류물을 실리카 겔 상에서의 플래시 크로마토그래피로 정제하여, 백색 고체로서 표제 화합물을 수득하였다: m.p. 158 내지 160°C.

[0390] ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 9.07 (d, 1H), 8.38 (t, 1H), 7.62 (ddd, 1H), 7.47 (dt, 1H), 7.11-7.38 (m, 5H), 6.14 (s, 1H), 3.62 (d, 1H), 3.46 (dd, 1H), 2.96 (d, 1H), 2.58 (qd, 1H), 1.50 (s, 3H).

[0391] ¹⁹F NMR (377 MHz, CDCl₃) δ -59.75 (s, 1F), -132.03 (d, 1F), -150.23 (d, 1F).

[0392] 실시예 4: 단일 이성체의 제조:

[0393] N-[(1S)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 및

[0394] N-[(1R)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드

[0395] 라세미 N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 혼합물에, 이하에서 개략적으로 설명된 조건을 사용하여 분취용 HPLC 크로마토그래피에 의한 키랄 분할을 거치게 하였다.

[0396] 분석용 HPLC 방법

[0397] SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

[0398] PDA 검출기: Waters Acquity UPC²

[0399] 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® OZ, 3 μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C

[0400] 이동상: A: CO₂ B: iPr 구배: 2.8분만에 10% B

[0401] ABPR: 1800 psi

[0402] 유량: 2.0 ml/min

[0403] 검출: 233 nm

[0404] 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL

[0405] 주입량: 1 μL

[0406] 분취용 HPLC 방법:

[0407] Waters사로부터의 자가정제 시스템: 2767 샘플 매니저, 2489 UV/가시광 검출기, 2545 4원 구배 모듈 (Quaternary Gradient Module).

[0408] 컬럼: Daicel CHIRALPAK® IF, 5 μm, 1.0 cm x 25 cm

[0409] 이동상: TBME/EtOH 98/02

[0410] 유량: 10 ml/min

[0411] 검출: UV 265 nm

[0412] 샘플 농도: EE/ACN 중 165 mg/mL

[0413] 주입량: 30 내지 90 μl, 5 내지 15 mg

[0414] 결과:

첫 번째로 용리되는 거울상 이성체	두 번째로 용리되는 거울상 이성체
체류 시간(분): 약 1.05	체류 시간(분): 약 1.51
화학적 순도(220 nm에서의 면적%): 99	화학적 순도(220 nm에서의 면적%): 99
거울상 이성체 과잉률(%): 99 초과	거울상 이성체 과잉률(%): 99 초과

[0415]

[0416] 1.05분의 용리 시간을 갖는 화합물은 화합물 F-38에 상응하는 N-[(1R)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드이다.

[0417] 1.51분의 용리 시간을 갖는 화합물은 화합물 F-37에 상응하는 N-[(1S)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드이다.

[0418] 실시예 5: 단일 이성체의 제조:

[0419] N-[(1S)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드

[0420] N-[(1R)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드

[0421] N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 혼합물에, 이하에서 개략적으로 설명된 조건을 사용하여 분취용 HPLC 크로마토그래피에 의한 키랄 분할을 거치게 하였다.

[0422] 분석용 HPLC 방법

[0423] SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

[0424] PDA 검출기: Waters Acquity UPC²

[0425] 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® ID, 3 μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C

[0426] 이동상: A: CO² B: iPr 구배: 2.8분만에 15% B

[0427] ABPR: 1800 psi

[0428] 유량: 2.0 ml/min

[0429] 검출: 235 nm

[0430] 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL

[0431] 주입량: 1 µL

[0432] 분취용 HPLC 방법:

[0433] Waters사로부터의 자가정제 시스템: 2767 샘플 매니저, 2489 UV/가시광 검출기, 2545 4원 구배 모듈.

[0434] 컬럼: Daicel CHIRALPAK® IF, 5 µm, 1.0 cm x 25 cm

[0435] 이동상: Hept/EtOH 95/05

[0436] 유량: 10 ml/min

[0437] 검출: UV 265 nm

[0438] 샘플 농도: MeOH/DCM(1/1) 중 10 mg/mL

[0439] 주입량: 500 µl

[0440] 결과:

첫 번째로 용리되는 거울상 이성체	두 번째로 용리되는 거울상 이성체
체류 시간(분): 약 1.49	체류 시간(분): 약 1.88
화학적 순도(235 nm에서의 면적%): 99	화학적 순도(235 nm에서의 면적%): 99
거울상 이성체 과잉률(%): 99 초과	거울상 이성체 과잉률(%): 99 초과

[0441]

[0442] 1.49분의 용리 시간을 갖는 화합물은 화합물 F-11에 상응하는 N-[(1S)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드이다.

[0443] 1.88분의 용리 시간을 갖는 화합물은 화합물 F-12에 상응하는 N-[(1R)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드이다.

[0444] 실시예 6: 단일 이성체의 제조:

[0445] N-[(1R)-1-벤질-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 및

[0446] N-[(1S)-1-벤질-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드

[0447] 라세미 N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 혼합물에, 이하에서 개략적으로 설명된 조건을 사용하여 분취용 HPLC 크로마토그래피에 의한 키랄 분할을 거치게 하였다.

[0448] 분석용 HPLC 방법:

[0449] SFC: Waters Acquity UPC²/QDa

[0450] PDA 검출기: Waters Acquity UPC²

[0451] 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3 µm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C

[0452] 이동상: A: CO₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 25% B

[0453] ABPR: 1800 psi

- [0454] 유량: 2.0 ml/min
- [0455] 검출: 240 nm
- [0456] 샘플 농도: Hept/EtOH 90/10 중 1 mg/mL
- [0457] 주입량: 3 µL
- [0458] 분취용 HPLC 방법:
- [0459] Waters사로부터의 자가정제 시스템: 2767 샘플 매니저, 2489 UV/가시광 검출기, 2545 4원 구배 모듈.
- [0460] 컬럼: Daicel CHIRALPAK® IE, 5 µm, 1.0 cm x 25 cm
- [0461] 이동상: Hept/EtOH 90/10
- [0462] 유량: 10 ml/min
- [0463] 검출: UV 265 nm
- [0464] 샘플 농도: MeOH/DCM(1/3)(여과됨) 중 100 mg/mL
- [0465] 주입량: 150 µl 내지 250 µl

첫 번째로 용리되는 거울상 이성체	두 번째로 용리되는 거울상 이성체
체류 시간(분): 약 0.97	체류 시간(분): 약 1.32
화학적 순도(240 nm에서의 면적%): 99	화학적 순도(240 nm에서의 면적%): 99
거울상 이성체 과잉률(%): 99 초과	거울상 이성체 과잉률(%): 99 초과

- [0466]
- [0467] 0.97분의 용리 시간을 갖는 화합물은 화합물 F-1에 상응하는 N-[(1S)-1-벤질-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드이다.
- [0468] 1.88분의 용리 시간을 갖는 화합물은 화합물 F-2에 상응하는 N-[(1R)-1-벤질-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드이다.
- [0469] 실시예 7: 단일 이성체의 제조:
- [0470] N-[(1R)-1-벤질-3-플루오로-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 및
- [0471] N-[(1S)-1-벤질-3-플루오로-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드
- [0472] 라세미 N-(1-벤질-3-플루오로-1,3-디메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드 혼합물에, 이하에서 개략적으로 설명된 조건을 사용하여 분취용 HPLC 크로마토그래피에 의한 키랄 분할을 거치게 하였다.
- [0473] 분석용 HPLC 방법:
- [0474] SFC: Waters Acquity UPC²/QDa
- [0475] PDA 검출기: Waters Acquity UPC²
- [0476] 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3 µm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C
- [0477] 이동상: A: CO₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 30% B
- [0478] ABPR: 1800 psi
- [0479] 유량: 2.0 ml/min
- [0480] 검출: 230 nm
- [0481] 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL

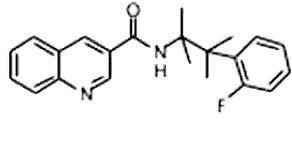
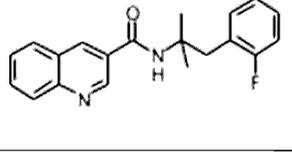
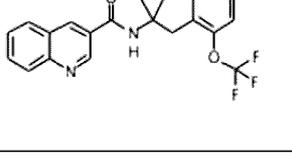
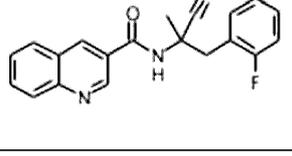
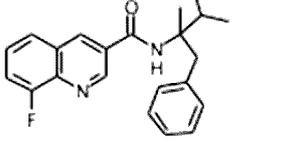
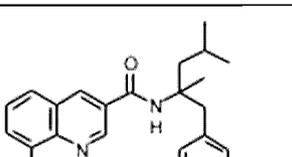
- [0482] 주입량: 1 μ L
- [0483] 분취용 HPLC 방법:
- [0484] Waters사로부터의 자가정제 시스템: 2767 샘플 매니저, 2489 UV/가시광 검출기, 2545 4원 구배 모듈.
- [0485] 컬럼: Daicel CHIRALPAK® IA, 5 μ m, 1.0 cm x 25 cm
- [0486] 이동상: Hept/EtOH 90/10
- [0487] 유량: 10 ml/min
- [0488] 검출: UV 265 nm
- [0489] 샘플 농도: EE 중 127 mg/mL
- [0490] 주입량: 40 내지 160 μ l, 5 내지 20 mg

첫 번째로 용리되는 거울상 이성체	두 번째로 용리되는 거울상 이성체
체류 시간(분): 약 0.88	체류 시간(분): 약 1.51
화학적 순도(235 nm에서의 면적%): 99	화학적 순도(235 nm에서의 면적%): 99
거울상 이성체 과잉률(%): 99 초과	거울상 이성체 과잉률(%): 99 초과

- [0491]
- [0492] 0.88분의 용리 시간을 갖는 화합물은 화합물 F-23에 상응하는 N-[(1R)-1-벤질-3-플루오로-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드이다.
- [0493] 1.51분의 용리 시간을 갖는 화합물은 화합물 F-24에 상응하는 N-[(1S)-1-벤질-3-플루오로-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드이다.

[0494]

[표 E] 화학식 I의 화합물의 물리적 데이터

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-1	N-[2-(2-플루오로페닐)-1,1,2-트리메틸-프로필]퀴놀린-3-카르복스아미드		1.08	351	G	
E-2	N-[2-(2-플루오로페닐)-1,1-디메틸-에틸]퀴놀린-3-카르복스아미드		1.00	323	G	
E-3	N-[1,1-디메틸-2-(2-(트리플루오로메톡시)페닐)에틸]퀴놀린-3-카르복스아미드		1.79	389	G	145 내지 149
E-4	N-[1-시아노-2-(2-플루오로페닐)-1-메틸-에틸]퀴놀린-3-카르복스아미드		1.35	334	G	134 내지 139
E-5	N-(1-벤질-1,2-디메틸-프로필)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.12	351	G	
E-6	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.17	365	H	110 내지 112

[0495]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-7	N-[2-(4-클로로페닐)-1-시아노-1-메틸-에틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.51	368	W	
E-8	N-[1-(1-시아노-2-(2,4-디플루오로페닐)-1-메틸-에틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.43	370	W	
E-9	8-플루오로-N-[2-(2-메톡시페닐)-1,1-디메틸-에틸]퀴놀린-3-카르복스아미드		1.64	353	W	
E-10	N-(1-(1-시아노-1-메틸-2-페닐-에틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.37	334	W	
E-11	N-(1,1-디메틸-2-페닐-에틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.56	323	W	

[0496]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-12	N-(1-벤질-2,2-디메틸-프로필)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.03	351	H	163 내지 164
E-13	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)퀴놀린-3-카르복스아미드		1.13	347	H	
E-14	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-8-클로로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.19	381	H	147 내지 148
E-15	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-8-플루오로-4-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.14	379	H	92 내지 94
E-16	N-(1-벤질-4,4,4-트리플루오로-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.64	391	H	157 내지 161
E-17	N-(1-벤질-4,4,4-트리플루오로-부틸)-8-클로로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.75	407	H	163 내지 167

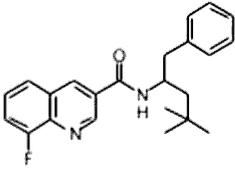
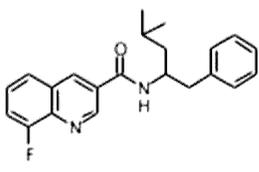
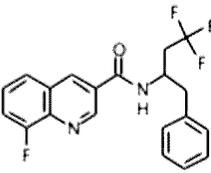
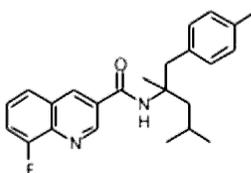
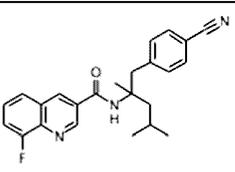
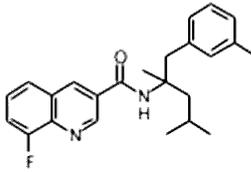
[0497]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-18	N-[2-(2-클로로페닐)-1-시아노-1-메틸-에틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		0.96	368 내지 370	G	198 내지 203
E-19	N-(1-벤질-4,4,4-트리플루오로부틸)-8-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.79	387	H	158 내지 161
E-20	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-8-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.24	361	H	132 내지 133
E-21	8-플루오로-N-[1-(2-플루오로페닐)메틸]-1,3-디메틸-부틸]퀴놀린-3-카르복스아미드		1.16	383	G	105 내지 106
E-22	N-[1-(2-클로로페닐)메틸]-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.21	399 내지 401	G	109 내지 110

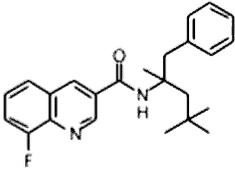
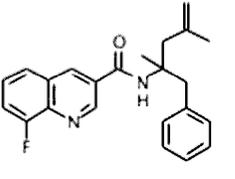
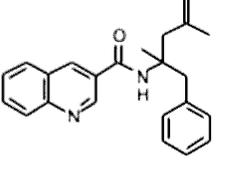
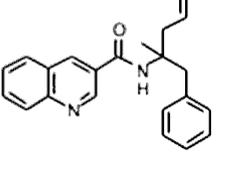
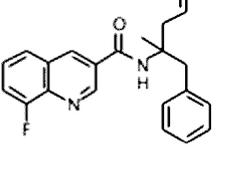
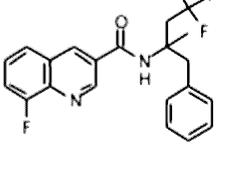
[0498]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-23	N-[1,3-디메틸-1-(o-톨릴메틸)부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.19	379	G	125 내지 126
E-24	8-플루오로-N-[1-(4-플루오로페닐)메틸]-1,3-디메틸-부틸]퀴놀린-3-카르복스아미드		1.15	383	G	38 내지 39
E-25	N-[1-(4-클로로페닐)메틸]-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.21	399 내지 401	G	57 내지 59
E-26	8-플루오로-N-[1-(3-플루오로페닐)메틸]-1,3-디메틸-부틸]퀴놀린-3-카르복스아미드		1.15	383	G	45 내지 47
E-27	N-[1-(3-클로로페닐)메틸]-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.20	399 내지 401	G	41 내지 42

[0499]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-28	N-(1-벤질-3,3-디메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.10	365	G	178 내지 180
E-29	N-(1-벤질-3-메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.07	351	G	136 내지 139
E-30	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-프로필)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		0.98	377	G	140 내지 142
E-31	N-[1,3-디메틸-1-(p-톨릴메틸)부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.21	379	G	116 내지 118
E-32	N-[1-(4-시아노페닐)메틸]-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.10	390	G	67 내지 69
E-33	N-[1,3-디메틸-1-(m-톨릴메틸)부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.20	379	G	94 내지 96

[0500]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-34	N-(1-벤질-1,3,3-트리메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.19	379	G	48 내지 50
E-35	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부트-3-에닐)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.12	363	G	115 내지 117
E-36	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부트-3-에닐)퀴놀린-3-카르복스아미드		1.11	345	G	99 내지 103
E-37	N-(1-벤질-1-메틸-부트-3-에닐)퀴놀린-3-카르복스아미드		1.07	331	G	
E-38	N-(1-벤질-1-메틸-부트-3-에닐)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.08	349	G	
E-39	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.06	391	G	158 내지 160

[0501]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-40	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-7-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.15	365	G	142 내지 144
E-41	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-1-옥시도-퀴놀린-1-움-3-카르복사미드		1.06	363	G	
E-42	N-(1-벤질-1-메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.12	351	G	
E-43	N-(1-벤질-1-메틸-부틸)퀴놀린-3-카르복사미드		1.10	333	G	
E-44	N-[1-(2-시아노페닐)메틸]-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.10	390	G	43 내지 44
E-45	N-[1-(3-브로모페닐)메틸]-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.22	443 내지 445	G	87 내지 89

[0502]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-46	N-[1-(3-시아노페닐)메틸-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.10	390	G	45 내지 46
E-47	N-[1-벤질-1-메틸-2-(1-메틸사이클로프로필)에틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.16	377	G	126 내지 129
E-48	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.19	383	G	114 내지 116
E-49	N-(1-벤질-2-사이클로프로필-1-메틸-에틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.11	363	G	
E-50	N-(1-벤질-3,3-디플루오로-1-메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.06	387	G	
E-51	N-[1-(디플루오로(페닐)메틸)-1,3-디메틸-부트-3-에틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.11	399	G	

[0503]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-52	N-(1-벤질-3,3-디플루오로-1-메틸-부틸)퀴놀린-3-카르복스아미드		1.05	369	G	131 내지 133
E-53	N-(1-벤질-1-사이클로프로필-3-메틸-부트-3-에닐)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		2.01	389	H	
E-54	N-[1-(디플루오로(페닐)메틸)-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.15	401	G	
E-55	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부트-3-에닐)-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.16	381	G	94 내지 96
E-56	N-(1-벤질-3-플루오로-1,3-디메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.08	383	G	
E-57	N-(1-벤질-3-플루오로-1,3-디메틸-부틸)퀴놀린-3-카르복스아미드		1.07	365	G	

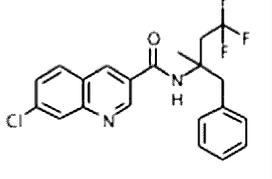
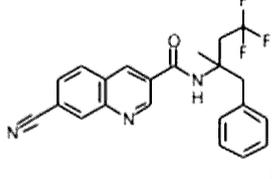
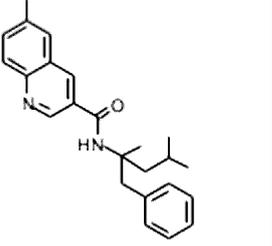
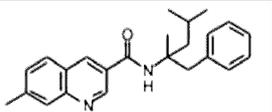
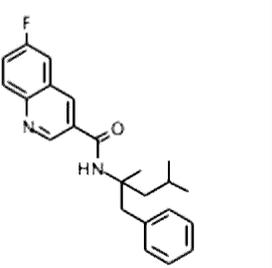
[0504]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-58	N-(1-벤질-3-하이드록시-1,3-디메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.02	381	G	
E-59	N-[1-(디플루오로(페닐)메틸)-1,3-디메틸-부틸]퀴놀린-3-카르복스아미드		1.12	383	G	
E-60	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-클로로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.11	408	G	141 내지 144
E-61	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.14	387	G	120 내지 123
E-62	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-시아노-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.06	398	G	175 내지 179

[0505]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-63	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-6-메톡시-퀴놀린-3-카르복사아미드		1.13	377	G	102 내지 105
E-64	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-5-클로로-퀴놀린-3-카르복사아미드		1.23	381 내지 383	G	50 내지 60
E-65	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-7-클로로-퀴놀린-3-카르복사아미드		1.22	381 내지 383	G	172 내지 174
E-66	8-플루오로-N-[3,3-트리플루오로-1-[(4-플루오로페닐)메틸]-1-메틸-프로필]퀴놀린-3-카르복사아미드		1.07	409	G	146 내지 147
E-67	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-7-시아노-퀴놀린-3-카르복사아미드		1.14	372	G	170 내지 172
E-68	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-5-클로로-퀴놀린-3-카르복사아미드		1.14	407 내지 409	G	85 내지 88

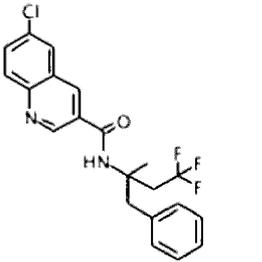
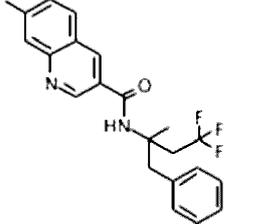
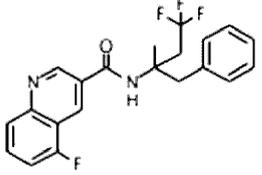
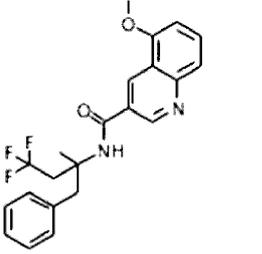
[0506]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-69	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-7-클로로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.14	407 내지 409	G	174 내지 176
E-70	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-7-시아노-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.06	398	G	172 내지 174
E-71	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-6-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.87	361	W	
E-72	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-7-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.84	361	W	
E-73	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-6-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.86	365	W	

[0507]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-74	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-5-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.89	365	W	
E-75	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-5-메톡시-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.82	377	W	
E-76	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-6-하이드록시-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.52	363	W	
E-77	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-6-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.70	387	W	

[0508]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-78	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-6-클로로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.81	407	W	
E-79	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-7-메틸-퀴놀린-3-카르복사미드		1.68	387	W	
E-80	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-5-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.72	391	W	
E-81	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-5-메톡시-퀴놀린-3-카르복사미드		1.66	403	W	

[0509]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-82	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-6-하이드록시-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.37	389	W	
E-83	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-6-클로로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.98	381	W	
E-84	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-6-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.69	391	W	
E-85	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-5-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.17	361	G	79 내지 81
E-86	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-5-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.09	387	G	101 내지 103

[0510]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-87	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-5-하이드록시-퀴놀린-3-카르복사미드		1.01	363	G	90 내지 95
E-88	N-[(E)-1-벤질-1-메틸-부트-2-에닐]퀴놀린-3-카르복사미드		1.05	331	G	
E-89	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-플루오로-2-메틸-퀴놀린-3-카르복사미드		1.09	405	G	
E-90	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-플루오로-4-메틸-퀴놀린-3-카르복사미드		1.08	404	G	154 내지 158
E-91	N-[1-벤질-1-(트리플루오로메틸)부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.15	405	G	
E-92	N-[1-벤질-1-(트리플루오로메틸)부트-3-에닐]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.13	403	G	

[0511]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-93	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-클로로-7-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드					150 내지 152
E-94	N-(1-벤질-3,3-디플루오로-1-메틸-알릴)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.05	371	G	99 내지 101
E-95	N-(1-벤질-3,3-디플루오로-1-메틸-프로필)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.01	373	G	
E-96	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-4-클로로-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.13	425	G	
E-97	N-(1-벤질-3-클로로-3,3-디플루오로-1-메틸-프로필)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.10	407 내지 409	G	
E-98	8-플루오로-N-[[3,3,3-트리플루오로-1-((2-플루오로페닐)메틸)-1-메틸-프로필]퀴놀린-3-카르복사미드		1.07	409	G	131 내지 133

[0512]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-99	8-플루오로-N- [3,3,3- 트리플루오로-1- [(3- 플루오로페닐)메 틸]-1-메틸- 프로필]퀴놀린- 3- 카르복스아미드		1.07	409	G	149 내지 151
E-100	N-(1-벤질-3,3,3- 트리플루오로-1- 메틸-프로필)-7- 플루오로-8- 메틸-퀴놀린-3- 카르복스아미드		1.17	405	G	127 내지 129
E-101	N-(1-벤질-1- 에틸-3,3,3- 트리플루오로- 프로필)-8- 플루오로- 퀴놀린-3- 카르복스아미드		1.11	405	G	127 내지 129
E-102	N-(1-벤질-3,3,3- 트리플루오로-1- 메틸-프로필)- 7,8-디플루오로- 퀴놀린-3- 카르복스아미드		1.10	409	G	158 내지 160
E-103	N-[1-벤질-1- (메톡시메틸)-3- 메틸-부트-3- 에닐]-8- 플루오로- 퀴놀린-3- 카르복스아미드		1.13	393	G	147 내지 149

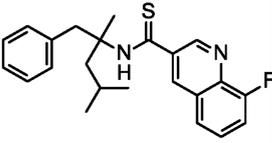
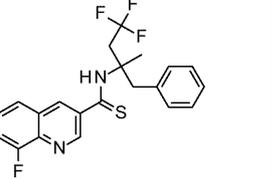
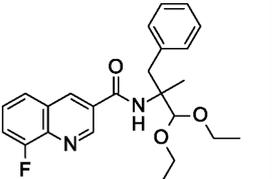
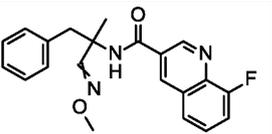
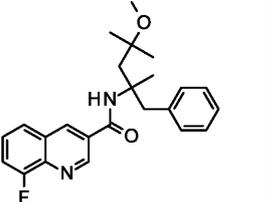
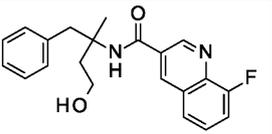
[0513]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-104	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-클로로-4-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.13	421	G	184 내지 186
E-105	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-시아노-4-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.07	412	G	194 내지 197
E-106	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-2-클로로-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.21	399	G	106 내지 108
E-107	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-8-클로로-4-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.21	395 내지 397	G	65 내지 70
E-108	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-8-시아노-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.14	372	G	160 내지 162

[0514]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-109	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-8-시아노-4-메틸-퀴놀린-3-카르복사미드		1.15	386	G	
E-110	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-클로로-2-메틸-퀴놀린-3-카르복사미드		1.16	422	G	176 내지 179
E-111	N-(1-벤질-2-사이클로부틸-1-메틸-에틸)퀴놀린-3-카르복사미드		1.16	359	G	88 내지 90
E-112	N-(1-벤질-2-사이클로부틸-1-메틸-에틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.18	377	G	125 내지 127
E-113	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-시아노-2-메틸-퀴놀린-3-카르복사미드		1.10	412	G	136 내지 140

[0515]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-114	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르보티오아미드		1.28	382	G	150 내지 153
E-115	N-(1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르보티오아미드		1.19	408	G	173 내지 175
E-116	N-(1-벤질-2,2-디에톡시-1-메틸-에틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.07	411	G	
E-117	N-(1-벤질-2-메톡시이미노-1-메틸-에틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.01	366	G	
E-118	N-(1-벤질-3-메톡시-1,3-디메틸-부틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.14	395	G	118 내지 120
E-119	N-(1-벤질-3-하이드록시-1-메틸-프로필)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		0.88	353	G	

[0516]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-120	N-(1-벤질-1-메틸-2-옥소-에틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		0.92	337	G	
E-121	N-(1-벤질-3-메톡시-1-메틸-프로필)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.02	367	G	
E-122	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-7-메톡시-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.14	377	G	136 내지 138
E-123	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-8-메톡시-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.11	377	G	155 내지 156
E-124	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부트-3-에닐)-8-플루오로-2-메틸-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.14	377	G	
E-125	N-(1-벤질-1,3-디메틸-부틸)-2,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.23	383	G	

[0517]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	방법	MP °C
E-126	N-(1-벤질-2-메톡시-1-메틸-에틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.00	353	G	
E-127	N-(1-벤질-2-에톡시-1-메틸-에틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.06	367	G	
E-128	N-(1-벤질-2-이소프로폭시-1-메틸-에틸)-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.13	381	G	

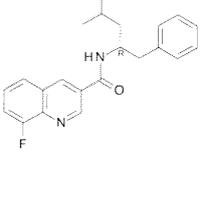
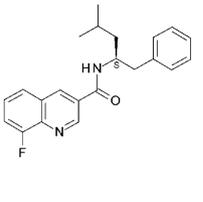
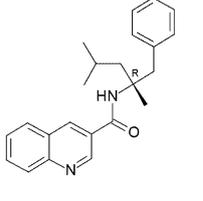
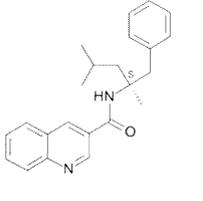
[0518]

[0519]

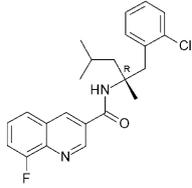
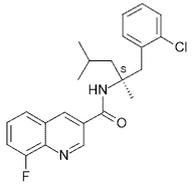
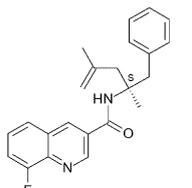
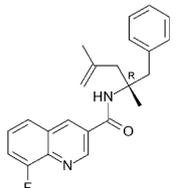
[표 F] 개별 거울상 이성체로서의 화학식 I의 화합물의 물리적 데이터

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	[α] _D ²⁰	방법
F-1	N-[(1R)-1-벤질-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.32	365	-90.79°	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity; UPC ² 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상:
F-2	N-[(1S)-1-벤질-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		0.97	365	+92.65°	A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 25% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 240 nm; 샘플 농도: Hept/EtOH 90/10 중 1 mg/mL; 주입량: 3 μL

[0520]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	[α] _D ²⁰	방법
F-3	N-[(1R)-1-벤질-3-메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		3.43	351		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK [®] ID 3μm, 0.3 cm x 10 cm,
F-4	N-[(1S)-1-벤질-3-메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		2.61	351		40°C; 이동상: A: CO ₂ B: iPr 구배: 4.8분만에 15% B; ABPR: 1800 psi 유량: 2.0 mL/min; 검출: 235 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-5	N-[(1R)-1-벤질-1,3-디메틸-부틸]퀴놀린-3-카르복사미드		1.59	348		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa;PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IA
F-6	N-[(1S)-1-벤질-1,3-디메틸-부틸]퀴놀린-3-카르복사미드		1.02	348		3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: EtOH 구배: 1.8분만에 30% B; ABPR: 1800 psi 유량: 2.0 mL/min; 검출: 232 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL

[0521]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	[α] _D ²⁰	방법
F-7	N-[(1R)-1-(2-클로로페닐)메틸]-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.61	399		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK [®] IA 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 20 내지 40% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 235 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-8	N-[(1S)-1-(2-클로로페닐)메틸]-1,3-디메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.21	399		이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 20 내지 40% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 235 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-9	N-[(1S)-1-벤질]-1,3-디메틸-부트-3-에닐]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		8.10	363		Waters UPLC -Hclass DAD 검출기 Waters UPLC; 컬럼: Daicel CHIRALPAK [®] IA, 3μm, 0.46 cm x 10 cm 이동상: Hept/EtOH 80/20 유량: 1.0 ml/min; 검출: 235 nm; 샘플 농도: ACN/Hept 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 2 μL
F-10	N-[(1R)-1-벤질]-1,3-디메틸-부트-3-에닐]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		5.99	363		Hept/EtOH 80/20 유량: 1.0 ml/min; 검출: 235 nm; 샘플 농도: ACN/Hept 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 2 μL

[0522]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	[α] _D ²⁰	방법
F-11	N-[(1S)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.70	391	-109.9°	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® ID, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: iPr 구배: 2.8분만에 15% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 235 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-12	N-[(1R)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		2.16	391	+111.9°	SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 20 내지 40% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 230 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-13	N-[(1R)-1-벤질-1,3-디메틸-부틸]-7-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.53	365		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 20 내지 40% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 230 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-14	N-[(1S)-1-벤질-1,3-디메틸-부틸]-7-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.15	365		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 20 내지 40% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 230 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL

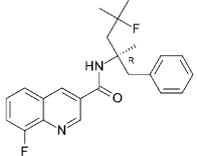
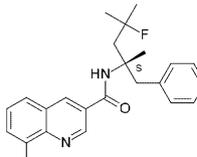
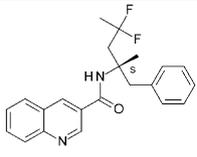
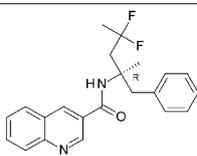
[0523]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	[α] _D ²⁰	방법
F-15	N-[(1S)-1-벤질-1-메틸-부트-3-에닐]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		2.17	349		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 4.8분만에 25% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 235 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-16	N-[(1R)-1-벤질-1-메틸-부트-3-에닐]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.58	349		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 25% B ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min 검출: 235 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL 주입량: 1 μL
F-17	N-[(1R)-1-벤질-1,3,3-트리메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.45	379		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 25% B ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min 검출: 235 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL 주입량: 1 μL
F-18	N-[(1S)-1-벤질-1,3,3-트리메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		0.94	379		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 25% B ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min 검출: 235 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL 주입량: 1 μL

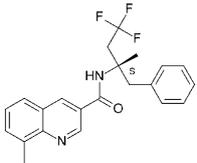
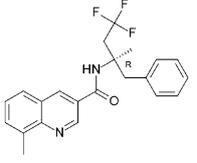
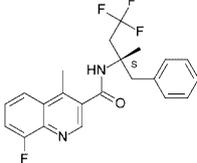
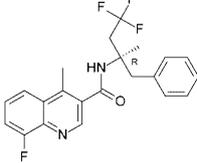
[0524]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	[α] _D ²⁰	방법
F-19	N-[(1S)-1-벤질-1,3-디메틸-부트-3-에닐]-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		4.96	381		컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: iPr 구배: 5.8분만에 15% B
F-20	N-[(1R)-1-벤질-1,3-디메틸-부트-3-에닐]-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		4.11	381		ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min 검출: 233 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL 주입량: 1 μL
F-21	N-[(1R)-1-벤질-1,3-디메틸-부틸]-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.50	383		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 25% B ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min 검출: 233 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL 주입량: 1 μL
F-22	N-[(1S)-1-벤질-1,3-디메틸-부틸]-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		1.09	383		

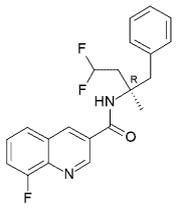
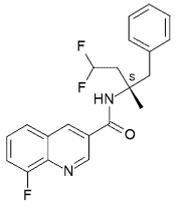
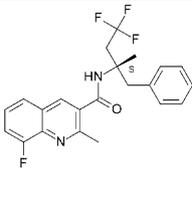
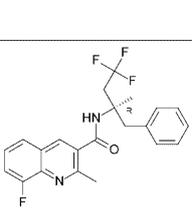
[0525]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] ⁺ 측정치	[α] _D ²⁰	방법
F-23	N-[(1R)-1-벤질-3-플루오로-1,3-디메틸부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		0.88	383		SFC: IA, 3μm, 0.3 cm x 10cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 30% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 230 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-24	N-[(1S)-1-벤질-3-플루오로-1,3-디메틸부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.51	383		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 30% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 230 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-25	N-[(1S)-1-벤질-3,3-디플루오로-1-메틸부틸]퀴놀린-3-카르복사미드		1.81	369		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 30% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 230 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-26	N-[(1R)-1-벤질-3,3-디플루오로-1-메틸부틸]퀴놀린-3-카르복사미드		1.30	369		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IA, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 1.8분만에 30% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 230 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL

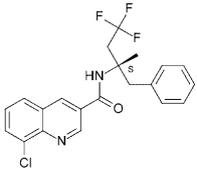
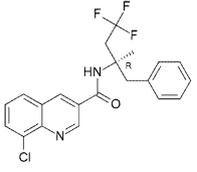
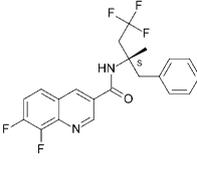
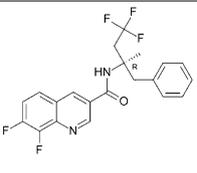
[0526]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	[α] _D ²⁰	방법
F-27	N-[(1S)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-메틸-퀴놀린-3-카르복사미드		0.45	387		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® AY, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: EtOH 구배: 1.8분만에 30% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 mL/min; 검출: 2338 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-28	N-[(1R)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-메틸-퀴놀린-3-카르복사미드		1.37	387		
F-29	N-[(1S)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-플루오로-4-메틸-퀴놀린-3-카르복사미드		1.97	405		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® OZ, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: iPr 구배: 1.8분만에 15% B ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 mL/min; 검출: 220 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-30	N-[(1R)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-플루오로-4-메틸-퀴놀린-3-카르복사미드		1.03	405		

[0527]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	$[\alpha]_D^{20}$	방법
F-31	N-[(1R)-1-벤질-3,3-디플루오로-1-메틸-프로필]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.84	373		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC; ² 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IF, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: MeOH 구배: 4.8분만에 30% B ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 mL/min; 검출: 220 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-32	N-[(1S)-1-벤질-3,3-디플루오로-1-메틸-프로필]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.03	373		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IC, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: iPr 구배: 4.8분만에 10% B ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 mL/min; 검출: 220 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-33	N-[(1S)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-플루오로-2-메틸-퀴놀린-3-카르복사미드		3.05	405		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® IC, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: iPr 구배: 4.8분만에 10% B ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 mL/min; 검출: 220 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-34	N-[(1R)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-플루오로-2-메틸-퀴놀린-3-카르복사미드		3.67	405		

[0528]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] 측정치	[α] _D ²⁰	방법
F-35	N-[(1S)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-클로로-퀴놀린-3-카르복사미드		4.99	407		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK [®] OZ, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A:
F-36	N-[(1R)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-8-클로로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.16	407		CO ₂ B: iPr 구배: 2.8분만에 15% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 237 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-37	N-[(1S)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.05	409		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa; PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK [®] OZ, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: iPr
F-38	N-[(1R)-1-벤질-3,3,3-트리플루오로-1-메틸-프로필]-7,8-디플루오로-퀴놀린-3-카르복사미드		1.51	409		구배: 2.8분만에 10% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 ml/min; 검출: 233 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL

[0529]

No.	IUPAC 명칭	구조	RT (분)	[M+H] ⁺ 측정치	[α] _D ²⁰	방법
F-39	N-[(1S)-1-벤질-3,3-디플루오로-1-메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		3.30	387		SFC: Waters Acquity UPC ² /QDa PDA 검출기: Waters Acquity UPC ² ; 컬럼: Daicel SFC CHIRALPAK® OZ, 3μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C; 이동상: A: CO ₂ B: iPr 구배: 4.8분만에 12% B; ABPR: 1800 psi; 유량: 2.0 mL/min; 검출: 234 nm; 샘플 농도: ACN/iPr 50/50 중 1 mg/mL; 주입량: 1 μL
F-40	N-[(1R)-1-벤질-3,3-디플루오로-1-메틸-부틸]-8-플루오로-퀴놀린-3-카르복스아미드		2.10	387		

[0530]

[0531] 생물학적 실시예

[0532] 보트리오티니아 폭켈리아나(Botryotinia fuckeliana)(보트리티스 시네레아(Botrytis cinerea)) / 액체 배양물 (회색 곰팡이)

[0533] 극저온 저장으로부터의 진균의 분생자를 영양 브로쓰(보겔스 브로쓰) 중에 직접 혼합한다. 시험 화합물의 (DMSO) 용액을 마이크로타이터 플레이트(96웰 포맷) 내에 넣은 후, 진균 포자를 함유하는 영양 브로쓰를 첨가한다. 시험 플레이트를 24°C에서 인큐베이션하고, 적용 후 3 내지 4일째에 광도측정법으로 성장 억제를 결정한다.

[0534] 표 E 및 표 F의 하기의 화합물은, 동일한 조건 하에서, 비처리 대조군(이는 광범위한 질병 발생을 나타내었음) 과 대비하여, 200 ppm에서 보트리오티니아 폭켈리아나의 적어도 80% 방제율을 제공하였다:

[0535] E-1, E-2, E-3, E-5, E-6, E-7, E-8, E-10, E-11, E-12, E-13, E-14, E-15, E-16, E-17, E-18, E-19, E-20, E-21, E-22, E-23, E-24, E-25, E-26, E-27, E-28, E-29, E-30, E-31, E-32, E-33, E-34, E-35, E-36, E-37, E-38, E-39, E-40, E-41, E-42, E-43, E-44, E-45, E-46, E-47, E-48, E-49, E-50, E-51, E-52, E-53, E-54, E-55, E-56, E-57, E-58, E-59, E-60, E-61, E-62, E-63, E-64, E-65, E-66, E-67, E-69, E-70, E-71, E-72, E-73, E-74, E-75, E-76, E-77, E-79, E-80, E-81, E-82, E-84, E-85, E-86, E-87, E-88, E-89, E-90, E-91, E-92, E-93, E-94, E-95, E-96, E-97, E-98, E-99, E-100, E-101, E-102, E-103, E-104, E-106, E-107, E-109, E-110, E-111, E-112, E-113, E-114, E-115, E-116, E-117, E-118, E-119, E-121, E-123, E-124, E-125, F-1, F-2, F-3, F-4, F-5, F-6, F-7, F-8, F-9, F-10, F-11, F-12, F-13, F-14, F-16, F-17, F-18, F-19, F-20, F-21, F-22, F-23, F-24, F-25, F-26, F-27, F-28, F-29, F-30, F-31, F-32, F-33, F-34, F-35, F-36, F-37, F-38, F-39, F-40.

[0536] 푸사리움 쿨모룸(Fusarium culmorum) / 액체 배양물(이삭 마름병(Head blight))

[0537] 극저온 저장으로부터의 진균의 분생자를 영양 브로쓰(PDB 감자 텍스트로스 브로쓰) 중에 직접 혼합한다. 시험 화합물의 (DMSO) 용액을 마이크로타이터 플레이트(96웰 포맷) 내에 넣은 후, 진균 포자를 함유하는 영양 브로쓰를 첨가한다. 시험 플레이트를 24°C에서 인큐베이션하고, 적용 후 3 내지 4일째에 광도측정법으로 성장 억제를 결정한다.

[0538] 표 E 및 표 F의 하기의 화합물은, 동일한 조건 하에서, 비처리 대조군(이는 광범위한 질병 발생을 나타내었음) 과 대비하여, 200 ppm에서 푸사리움 쿨모룸의 적어도 80% 방제율을 제공하였다:

[0539] E-1, E-2, E-4, E-5, E-6, E-7, E-8, E-10, E-11, E-12, E-13, E-14, E-15, E-16, E-17, E-18, E-19, E-20, E-21, E-22, E-23, E-24, E-25, E-26, E-27, E-28, E-29, E-30, E-31, E-32, E-33, E-34, E-35, E-36, E-37, E-38, E-39, E-40, E-41, E-42, E-43, E-44, E-45, E-46, E-47, E-48, E-49, E-50, E-51, E-52, E-53, E-54,

E-55, E-56, E-57, E-58, E-59, E-60, E-61, E-62, E-64, E-65, E-66, E-67, E-68, E-69, E-70, E-71, E-72, E-73, E-74, E-75, E-76, E-77, E-78, E-79, E-80, E-81, E-82, E-84, E-85, E-86, E-87, E-88, E-89, E-90, E-91, E-92, E-93, E-94, E-95, E-96, E-97, E-98, E-99, E-100, E-101, E-102, E-103, E-104, E-105, E-106, E-107, E-109, E-110, E-111, E-112, E-113, E-114, E-115, E-116, E-117, E-118, E-119, E-120, E-121, E-123, E-124, E-125, F-1, F-2, F-3, F-4, F-5, F-6, F-7, F-8, F-9, F-10, F-11, F-12, F-13, F-14, F-16, F-17, F-18, F-19, F-20, F-21, F-22, F-23, F-24, F-25, F-26, F-27, F-28, F-29, F-30, F-31, F-32, F-33, F-34, F-35, F-36, F-37, F-38, F-39, F-40.

[0540] 푸사리움 쿨모룸(*Fusarium culmorum*) / 밀 / 잔이삭 예망(이삭 마름병)

[0541] 재배품종 몬순(cv. Monsun)의 밀 잔이삭을 멀티웰 플레이트(24웰 포맷) 내의 한천 상에 놓고, 물 중에 희석된, 제형화된 시험 화합물을 분무한다. 적용 후 1일째에, 잔이삭에 진균의 포자 현탁액을 접종한다. 접종된 잔이삭을 기후 챔버에서 72시간의 어두운 상태(semi darkness) 이후 12시간 명/12시간 암의 조명 계획 하에서 20℃ 및 60% rh에서 인큐베이션하고, 적절한 수준의 질병 손상이 비처리 대조군 잔이삭 상에 나타날 때(적용 후 6 내지 8일째), 비처리된 것과 대비하여% 질병 방제율로서 화합물의 활성을 평가한다.

[0542] 표 E 및 표 F의 하기의 화합물은, 동일한 조건 하에서, 비처리 대조군(이는 광범위한 질병 발생을 나타내었음)과 대비하여, 200 ppm에서 푸사리움 쿨모룸의 적어도 80% 방제율을 제공하였다:

[0543] E-1, E-5, E-6, E-10, E-11, E-12, E-13, E-15, E-16, E-17, E-19, E-20, E-21, E-22, E-23, E-24, E-25, E-26, E-28, E-29, E-30, E-35, E-36, E-38, E-39, E-42, E-43, E-44, E-48, E-49, E-50, E-51, E-52, E-55, E-56, E-57, E-58, E-59, E-60, E-61, E-62, E-66, E-67, E-69, E-70, E-71, E-72, E-74, E-75, E-76, E-77, E-79, E-80, E-81, E-82, E-84, E-85, E-86, E-88, E-89, E-90, E-91, E-92, E-93, E-94, E-95, E-96, E-97, E-98, E-99, E-100, E-101, E-102, E-103, E-104, E-105, E-106, E-107, E-109, E-113, E-114, E-125, F-1, F-2, F-3, F-4, F-5, F-9, F-10, F-11, F-12, F-13, F-14, F-16, F-17, F-18, F-19, F-20, F-21, F-23, F-24, F-25, F-26, F-27, F-28, F-29, F-31, F-32, F-33, F-35, F-36, F-37, F-39, F-40.

[0544] 글로메렐라 라게나리움(*Glomerella lagenarium*) 콜렉토티리쿰 라게나리움(*Colletotrichum lagenarium*) / 액체 배양물(탄저병)

[0545] 극저온 저장으로부터의 진균의 분생자를 영양 브로쓰(PDB 감자 텍스트로스 브로쓰) 중에 직접 혼합한다. 시험 화합물의 (DMSO) 용액을 마이크로타이터 플레이트(96웰 포맷) 내에 넣은 후, 진균 포자를 함유하는 영양 브로쓰를 첨가한다. 시험 플레이트를 24℃에서 인큐베이션하고, 적용 후 3 내지 4일째에 광도측정법으로 성장 억제율을 측정한다.

[0546] 표 E 및 표 F의 하기의 화합물은, 동일한 조건 하에서, 비처리 대조군(이는 광범위한 질병 발생을 나타내었음)과 대비하여, 200 ppm에서 글로메렐라 라게나리움의 적어도 80% 방제율을 제공하였다:

[0547] E-1, E-2, E-5, E-6, E-12, E-13, E-14, E-15, E-20, E-21, E-22, E-23, E-24, E-25, E-26, E-27, E-28, E-29, E-30, E-31, E-32, E-33, E-34, E-35, E-36, E-37, E-38, E-39, E-40, E-42, E-43, E-44, E-45, E-46, E-47, E-48, E-49, E-50, E-51, E-52, E-53, E-54, E-55, E-56, E-57, E-58, E-60, E-61, E-62, E-66, E-69, E-79, E-86, E-87, E-89, E-90, E-91, E-92, E-93, E-94, E-95, E-96, E-97, E-98, E-99, E-100, E-101, E-102, E-103, E-104, E-106, E-111, E-112, E-113, E-114, E-115, E-118, E-125, F-1, F-2, F-3, F-4, F-5, F-6, F-7, F-8, F-9, F-10, F-11, F-12, F-13, F-14, F-16, F-17, F-18, F-19, F-20, F-21, F-22, F-23, F-24, F-25, F-26, F-27, F-28, F-29, F-30, F-31, F-32, F-33, F-34, F-35, F-36, F-37, F-38, F-39, F-40.

[0548] 가이우만노미세스 그라미니스(*Gaeumannomyces graminis*) / 액체 배양물(곡류의 장승병(Take-all))

[0549] 극저온 저장으로부터의 진균의 균사 단편을 영양 브로쓰(PDB 감자 텍스트로스 브로쓰) 중에 직접 혼합하였다. 시험 화합물의 (DMSO) 용액을 마이크로타이터 플레이트(96웰 포맷) 내에 넣은 후, 진균 포자를 함유하는 영양 브로쓰를 첨가한다. 시험 플레이트를 24℃에서 인큐베이션하고, 적용 후 4 내지 5일째에 광도측정법으로 성장 억제율을 결정한다.

[0550] 표 E 및 표 F의 하기의 화합물은, 동일한 조건 하에서, 비처리 대조군(이는 광범위한 질병 발생을 나타내었음)과 대비하여, 200 ppm에서 가이우만노미세스 그라미니스의 적어도 80% 방제율을 제공하였다:

[0551] E-1, E-2, E-6, E-7, E-8, E-10, E-13, E-14, E-17, E-19, E-20, E-21, E-22, E-23, E-24, E-25, E-26, E-27, E-28, E-35, E-37, E-38, E-39, E-40, E-42, E-43, E-45, E-46, E-47, E-48, E-53, F-1, F-2, F-3, F-4, F-5,

F-6, F-7, F-8, F-10, F-16, F-17, F-18.

- [0552] 모노그라펠라 니발리스(Monographella nivalis)(미크로도키움 니발레(Microdochium nivale)) / 액체 배양물(곡류의 갈색 부패병(foot rot))
- [0553] 극저온 저장으로부터의 진균의 분생자를 영양 브로쓰(PDB 감자 텍스트로스 브로쓰) 중에 직접 혼합한다. 시험 화합물의 (DMSO) 용액을 마이크로타이터 플레이트(96웰 포맷) 내에 넣은 후, 진균 포자를 함유하는 영양 브로쓰를 첨가한다. 시험 플레이트를 24℃에서 인큐베이션하고, 적용 후 4 내지 5일째에 광도측정법으로 성장 억제를 결정한다.
- [0554] 표 E 및 표 F의 하기의 화합물은, 동일한 조건 하에서, 비처리 대조군(이는 광범위한 질병 발생을 나타내었음)과 대비하여, 200 ppm에서 모노그라펠라 니발리스의 적어도 80% 방제율을 제공하였다:
- [0555] E-1, E-2, E-5, E-6, E-12, E-13, E-14, E-20, E-21, E-22, E-23, E-24, E-26, E-27, E-28, E-30, E-31, E-33, E-34, E-35, E-36, E-37, E-38, E-42, E-43, E-45, E-48, E-49, E-53, E-54, E-55, E-56, E-57, E-58, E-59, E-60, E-61, E-88, E-92, E-97, E-99, E-103, E-112, E-114, E-116, E-117, E-118, E-121, E-122, E-123, F-1, F-2, F-4, F-5, F-8, F-9, F-10, F-18, F-20, F-23, F-24, F-25, F-26, F-27, F-29, F-30, F-32, F-39.
- [0556] 미코스파이렐라 아라키디스(Mycosphaerella arachidis)(세르코스포라 아라키디콜라(Cercospora arachidicola)) / 액체 배양물 (이른잎점병(early leaf spot))
- [0557] 극저온 저장으로부터의 진균의 분생자를 영양 브로쓰(PDB 감자 텍스트로스 브로쓰) 중에 직접 혼합한다. 시험 화합물의 (DMSO) 용액을 마이크로타이터 플레이트(96웰 포맷) 내에 넣은 후, 진균 포자를 함유하는 영양 브로쓰를 첨가한다. 시험 플레이트를 24℃에서 인큐베이션하고, 적용 후 4 내지 5일째에 광도측정법으로 성장 억제를 결정한다.
- [0558] 표 E 및 표 F의 하기의 화합물은, 동일한 조건 하에서, 비처리 대조군(이는 광범위한 질병 발생을 나타내었음)과 대비하여, 200 ppm에서 미코스파이렐라 아라키디스의 적어도 80% 방제율을 제공하였다:
- [0559] E-2, E-35, E-55, F-26.
- [0560] 마그나포르테 그리세아(피리쿨라리아 오리자이) / 액체 배양물(도열병)
- [0561] 극저온 저장으로부터의 진균의 분생자를 영양 브로쓰(PDB 감자 텍스트로스 브로쓰) 중에 직접 혼합한다. 시험 화합물의 (DMSO) 용액을 마이크로타이터 플레이트(96웰 포맷) 내에 넣은 후, 진균 포자를 함유하는 영양 브로쓰를 첨가한다. 시험 플레이트를 24℃에서 인큐베이션하고, 적용 후 3 내지 4일째에 광도측정법으로 성장 억제를 결정한다.
- [0562] 표 E 및 표 F의 하기의 화합물은, 동일한 조건 하에서, 비처리 대조군(이는 광범위한 질병 발생을 나타내었음)과 대비하여, 200 ppm에서 마그나포르테 그리세아의 적어도 80% 방제율을 제공하였다:
- [0563] E-5, E-6, E-12, E-14, E-15, E-16, E-17, E-19, E-20, E-21, E-22, E-23, E-24, E-25, E-26, E-27, E-28, E-29, E-30, E-31, E-32, E-33, E-34, E-35, E-36, E-37, E-38, E-39, E-40, E-42, E-43, E-44, E-45, E-46, E-47, E-48, E-49, E-50, E-51, E-52, E-53, E-54, E-55, E-56, E-57, E-58, E-59, E-60, E-61, E-62, E-65, E-66, E-69, E-114, F-1, F-37, F-38, F-39, F-40.
- [0564] 피레노포라 테레스(Pyrenophora teres) / 보리 / 잎 워반 예방(망반병(Net blotch))
- [0565] 재배품종 하소(cv. Hasso)의 보리잎 절편을 멀티웰 플레이트(24웰 포맷) 내의 한천 상에 놓고, 물 중에 희석된, 제형화된 시험 화합물을 분무한다. 적용 후 2일째에, 잎 절편에 진균의 포자 현탁액을 접종한다. 접종된 잎 절편을 기후 캐비닛에서 12시간 명/12시간 암의 조명 하에서 20℃ 및 65% rh에서 인큐베이션하고, 적절한 수준의 질병 손상이 비처리 대조군 잎 절편에서 나타날 때(적용 후 5 내지 7일째), 비처리된 것과 대비하여 질병 방제율로서 화합물의 활성을 평가한다.
- [0566] 표 E 및 표 F의 하기의 화합물은, 동일한 조건 하에서, 비처리 대조군(이는 광범위한 질병 발생을 나타내었음)과 대비하여, 200 ppm에서 피레노포라 테레스의 적어도 80% 방제율을 제공하였다:
- [0567] E-14, E-26, E-55, E-114.
- [0568] 미코스파이렐라 그라미니콜라(Mycosphaerella graminicola)(셉토리아 트리티시(Septoria tritici)) / 액체 배

양물(셉토리아 반병)

- [0569] 극저온 저장으로부터의 진균의 분생자를 영양 브로쓰(PDB 감자 텍스트로스 브로쓰) 중에 직접 혼합한다. 시험 화합물의 (DMSO) 용액을 마이크로타이터 플레이트(96웰 포맷) 내에 넣은 후, 진균 포자를 함유하는 영양 브로쓰를 첨가한다. 시험 플레이트를 24℃에서 인큐베이션하고, 적용 후 4 내지 5일째에 광도측정법으로 성장 억제를 결정한다.
- [0570] 표 E 및 표 F의 하기의 화합물은, 동일한 조건 하에서, 비처리 대조군(이는 광범위한 질병 발생을 나타내었음)과 대비하여, 200 ppm에서 미코스파이렐라 그라미니콜라의 적어도 80% 방제율을 제공하였다:
- [0571] E-2, E-6, E-55, E-58, E-61, F-2, F-3, F-6, F-24, F-26.
- [0572] 스클레로티니아 스클레로티오룸(*Sclerotinia sclerotiorum*) / 액체 배양물(솜털 부패병(*cottony rot*))
- [0573] 진균의 새로 성장된 액체 배양물의 균사체 단편을 영양 브로쓰(보겔스 브로쓰) 중에 직접 혼합한다. 시험 화합물의 (DMSO) 용액을 마이크로타이터 플레이트(96웰 포맷) 내에 넣은 후, 진균 물질을 함유하는 영양 브로쓰를 첨가한다. 시험 플레이트를 24℃에서 인큐베이션하고, 적용 후 3 내지 4일째에 광도측정법으로 성장 억제를 결정한다.
- [0574] 표 E 및 표 F의 하기의 화합물은, 동일한 조건 하에서, 비처리 대조군(이는 광범위한 질병 발생을 나타내었음)과 대비하여, 20 ppm에서 스클레로티니아 스클레로티오룸의 적어도 80% 방제율을 제공하였다:
- [0575] E-6, E-14, E-15, E-20, E-24, E-25, E-26, E-28, E-29, E-34, E-35, E-36, E-39, E-47, E-114, F-1, F-2, F-3, F-10.