(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2012년01월31일
(11) 등록번호 10-1109500
(24) 등록일자 2012년01월18일

(51) Int. Cl.
C07H 17/08 (2006.01) *A61P 33/00* (2006.01)
(21) 출원번호 10-2005-7011622
(22) 출원일자(국제출원일자) 2003년12월19일
심사청구일자 2008년12월18일
(85) 번역문제출일자 2005년06월20일
(65) 공개번호 10-2005-0088133
(43) 공개일자 2005년09월01일
(86) 국제출원번호 PCT/EP2003/014613
(87) 국제공개번호 WO 2004/056844
국제공개일자 2004년07월08일
(30) 우선권주장
0229804.0 2002년12월20일 영국(GB)
(56) 선행기술조사문헌
US04310519 A1*
US05169839 A1*
*는 심사관에 의하여 인용된 문헌

(73) 특허권자
신젠타 파티서페이션즈 아게
스위스 4058 바젤 슈바르츠발달레 215
(72) 발명자
마인피슈 페터
스위스 체하-4058 바젤 슈바르츠발달레 215
머피 케사비 피오나
스위스 체하-4058 바젤 슈바르츠발달레 215
(뒷면에 계속)
(74) 대리인
장훈

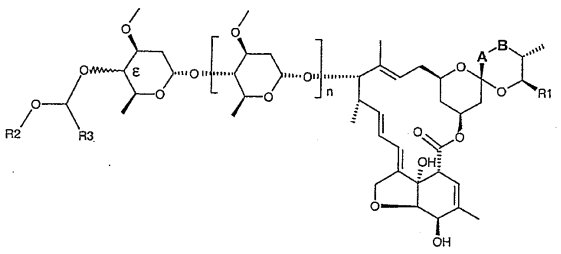
전체 청구항 수 : 총 7 항 심사관 : 김범수

(54) 4″ - 또는 4′ -위치에 알콕시메틸 치환체를 갖는 아버멕틴B1 및 아버멕틴 B1 모노사카라이드 유도체

(57) 요 약

본원에서는 각 경우 유리 형태 또는 염 형태인, 화학식 I의 화합물 및 경우에 따라, 이의 E/Z 이성체, E/Z 이성체의 혼합물 및/또는 호변이성체; 상기 화합물 및 이의 호변이성체의 제조 및 사용 방법; 활성 성분이 화학식 I의 화합물 및 이의 호변이성체로부터 선택된 살충제; 및 상기 화합물 및 조성물의 제조 방법 및 상기 화합물 및 조성물의 용도가 기술된다.

화학식 I



상기 화학식에서,

n은 0 또는 1이고;

A-B는 -CH=CH- 또는 $-CH_2-CH_2-$이며;

R_1은 C_1-C_{12}-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬 또는 C_2-C_{12}-알케닐이고;

R_2는 예를 들어, OH, 할로겐, CN, $-N_3$, $-NO_2$, C_3-C_8-사이클로알킬, 노르보르닐레닐-, C_3-C_8-사이클로알케닐; C_3-C_8-할로사이클로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알콕시, C_3-C_8-사이클로알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_3-C_8-사이클로알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_{12}-알킬설피닐, C_3-C_8-사이클로알킬설피닐, C_1-C_{12}-할로알킬설피닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬설피닐, C_1-C_{12}-알킬설포닐, C_3-C_8-사이클로알킬설포닐, C_1-C_{12}-할로알킬설포닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬설포닐, $-NR_4R_6$, $-X-C(=Y)-R_4$, $-X-C(=Y)-Z-R_4$, $-P(=O)(OC_1$-C_6-알

킬)$_2$, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴옥시, 아릴티오 및 헤테로사이클릴옥시로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 임의로 치환된 C_1-C_{12}-알킬, C_2-C_{12}-알케닐 또는 C_2-C_{12}-알키닐이며;

R_3은 예를 들어, H, C_1-C_{12}-알킬 또는 임의로 치환된 C_1-C_{12}-알킬이다.

(72) 발명자

까사이르 제롬

스위스 체하-4058 바젤 슈바르츠발달레 215

콰란타 라우라

스위스 체하-4058 바젤 슈바르츠발달레 215

피테르나 토마스

스위스 체하-4058 바젤 슈바르츠발달레 215

휘터 오트마르 프란츠

스위스 체하-4058 바젤 슈바르츠발달레 215

정 피에르

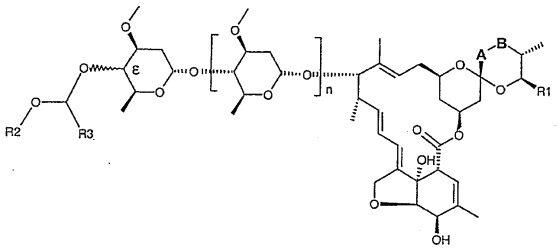
스위스 체하-4058 바젤 슈바르츠발달레 215

특허청구의 범위

청구항 1

각 경우 유리 형태 또는 염 형태인, 화학식 I의 화합물, 이의 E/Z 이성체, 이의 E/Z 이성체의 혼합물 또는 이의 호변이성체.

화학식 I



상기 화학식에서,

n은 0 또는 1이고;

A-B는 -CH=CH- 또는 $-CH_2-CH_2-$이며;

R_1은 C_1-C_{12}-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬 또는 C_2-C_{12}-알케닐이고;

R_2는 C_1-C_{12}-알킬, C_2-C_{12}-알케닐, C_2-C_{12}-알키닐; 또는 OH, 할로겐, CN, $-N_3$, $-NO_2$, 1 내지 3개의 C_1-C_6-알킬-그룹에 의해 치환되거나 비치환된 C_3-C_8-사이클로알킬, 1 내지 3개의 C_1-C_6-알킬-그룹에 의해 치환되거나 비치환된 C_3-C_8-사이클로알케닐, 노르보르닐레닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알콕시, C_3-C_8-사이클로알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_3-C_8-사이클로알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_{12}-알킬설피닐, C_3-C_8-사이클로알킬설피닐, C_1-C_{12}-할로알킬설피닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬설피닐, C_1-C_{12}-알킬설포닐, C_3-C_8-사이클로알킬설포닐, C_1-C_{12}-할로알킬설포닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬설포닐, $-NR_4R_6$, $-X-C(=Y)-R_4$, $-X-C(=Y)-Z-R_4$, $-P(=O)(OC_1-C_6$-알킬$)_2$, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴옥시, 아릴티오 및 헤테로사이클릴옥시[여기서 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴옥시, 아릴티오 및 헤테로사이클릴옥시 그룹은 치환되지 않거나 환에서의 치환 가능성에 따라서 OH, 할로겐, CN, NO_2, C_1-C_{12}-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬, C_1-C_{12}-할로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, $Si(C_1-C_{12}$-알킬$)_3$, $-X-C(=Y)-R_4$, $-X-C(=Y)-Z-R_4$, 아릴, 아릴옥시, 헤테로사이클릴 및 헤테로사이클릴옥시로 이루어진 그룹으로부터 선택되는 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환된다]로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환된 C_1-C_{12}-알킬, C_2-C_{12}-알케닐 또는 C_2-C_{12}-알키닐이거나,

R_2는 아릴, 헤테로사이클릴 C_3-C_8-사이클로알킬, C_3-C_8-사이클로알케닐; 또는 환에서의 치환 가능성에 따라 OH, 할로겐, CN, NO_2, C_1-C_{12}-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬, C_1-C_{12}-할로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알킬, 디메틸아미노-C_1-C_6-알콕시, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, 메틸렌디옥시, 아릴, 아릴옥시, 헤테로사이클릴 및 헤테로사이클릴옥시로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환되거나 비치환된 아릴, 헤테로사이클릴 C_3-C_8-사이클로알킬 또는 C_3-C_8-사이클로알케닐이고;

R_3은 H 또는 C_1-C_{12}-알킬, 또는 OH, 할로겐, CN, $-N_3$, $-NO_2$, 1 내지 3개의 C_1-C_6-알킬-그룹에 의해 치환되거나 비치환된 C_3-C_8-사이클로알킬, 노르보르닐레닐, 1 내지 3개의 메틸 그룹에 의해 치환되거나 비치환된 C_3-C_8-사이클로알케닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알콕시, C_3-C_8-사이클로알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_3-C_8-사이클로알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_{12}-알킬설피닐, C_3-C_8-사이클로알킬

설피닐, C_1-C_{12}-할로알킬설피닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬설피닐, C_1-C_{12}-알킬설포닐, C_3-C_8-사이클로알킬설포닐, C_1-C_{12}-할로알킬설포닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬설포닐, $-NR_4R_6$, $-X-C(=Y)-R_4$, $-X-C(=Y)-Z-R_4$, $-P(=O)(OC_1$-C_6-알킬$)_2$, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴옥시, 아릴티오 및 헤테로사이클릴옥시[여기서 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴옥시, 아릴티오 및 헤테로사이클릴옥시 그룹은 치환되지 않거나 환에서의 치환 가능성에 따라서 OH, 할로겐, CN, NO_2, C_1-C_{12}-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬, C_1-C_{12}-할로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, $Si(C_1$-C_{12}-알킬$)_3$, $-X-C(=Y)-R_4$, $-X-C(=Y)-Z-R_4$, 아릴, 아릴옥시, 헤테로사이클릴 및 헤테로사이클릴옥시로 이루어진 그룹으로부터 선택되는 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환된다]로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환된 C_1-C_{12}-알킬이거나;

R_2와 R_3은 함께 3 내지 7원의 알킬렌- 또는 4 내지 7원의 알케닐렌브릿지이고, 여기서, 1 또는 2개의 CH_2-그룹은 서로 독립적으로 그룹 -C(=O)-, -C(=S)-, O, S, $-NR_5$, -OC(=O)-O, -OC(=O)S-, $-OC(=O)N(R_5)-$, -C(=O)O-, -C(=O)S-, $-C(=O)N(R_5)-$, $-N(R_5)C(=O)S-$, $-N(R_5)C(=O)N(R_5)-$에 의해 대체될 수 있고, 알킬렌 또는 알케닐렌브릿지는 서로 독립적으로 C_1-C_4-알킬, C_1-C_4-알콕시 및 C_1-C_4-할로겐알킬로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환될 수 있으며;

X는 O, NR_5 또는 결합이고;

Y는 O 또는 S이며;

Z는 O, S 또는 NR_5이고;

R_4는 H, 또는 할로겐, 하이드록시, C_1-C_6-알콕시 및 CN으로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환되거나 비치환된 C_1-C_{12}-알킬; C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴-C_1-C_{12}-알킬, 헤테로사이클릴-C_1-C_{12}-알킬; 또는 환에서의 치환 가능성에 따라서 할로겐, C_1-C_6-알콕시, C_1-C_6-할로알킬 및 C_1-C_6-할로알콕시로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환되거나 비치환된 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴-C_1-C_{12}-알킬 또는 헤테로사이클릴-C_1-C_{12}-알킬이고;

R_5는 H, C_1-C_8-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, 벤질 또는 -C(=O)-C_1-C_{12}-알킬이며;

R_6은 H, 또는 할로겐, C_1-C_6-알콕시, CN, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-할로알케닐, C_2-C_8-알키닐, C_1-C_{12}-할로알케닐, $-X-C(=Y)-R_9$, $-X-C(=Y)-Z-R_9$, $-SO_2-R_9$, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴-C_1-C_{12}-알킬 또는 헤테로사이클릴-C_1-C_{12}-알킬에 의해 치환되거나 비치환된 C_1-C_{12}-알킬; 또는 환에서의 치환 가능성에 따라 할로겐, C_1-C_6-알콕시, C_1-C_6-할로알킬 및 C_1-C_6-할로알콕시로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환되거나 비치환된 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴-C_1-C_{12}-알킬 또는 헤테로사이클릴-C_1-C_{12}-알킬이거나;

R_4과 R_6은 함께 3 내지 5원 알킬렌 브릿지이고, 여기서, 메틸렌 그룹 중 하나는 O, S 또는 SO_2에 의해 대체될 수 있고;

R_9는 H, 또는 할로겐, 하이드록시, C_1-C_6-알콕시 및 CN으로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환되거나 비치환된 C_1-C_{12}-알킬; C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴-C_1-C_{12}-알킬, 헤테로사이클릴-C_1-C_{12}-알킬; 또는 환에서의 치환 가능성에 따라 할로겐, C_1-C_6-알콕시, C_1-C_6-할로알킬 및 C_1-C_6-할로알콕시로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환되거나 비치환된 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴-C_1-C_{12}-알킬 또는 헤테로사이클릴-C_1-C_{12}-알킬이며;

단, 당해 화합물은 n이 0이고 R_3이 H이며 R_2가 $-CH_2-CH_2-OCH_3$ 또는 $-CH_2-CH_2-O$-페닐인 아버멕틴 B1a 또는 B1b 유도체가 아니고, n이 1이고 R_3이 H이며 R_2가 $-CH_2-CH_2-O$-페닐인 B1a 또는 B1b 유도체가 아니며, n이 0이고 R_2 및

R_3이 함께 비치환된 $-CH_2-CH_2-CH_2-$인 B1a 또는 B1b 유도체가 아니다.

청구항 2

제1항에 있어서, 유리 형태인 화학식 I의 화합물.

청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, R_3이 메틸인 화학식 I의 화합물.

청구항 4

제1항 또는 제2항에 있어서, R_3이 C_3-C_8-알킬인 화학식 I의 화합물.

청구항 5

제1항 또는 제2항에 있어서, R_3이 OH, 할로겐, CN, $-N_3$, $-NO_2$, 1 내지 3개의 C_1-C_6-알킬-그룹에 의해 치환되거나 비치환된 C_3-C_8-사이클로알킬, 노르보르닐레닐, 1 내지 3개의 메틸-그룹에 의해 치환되거나 비치환된 C_3-C_8-사이클로알케닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬, C_3-C_8-사이클로알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴티오 및 헤테로사이클릴옥시[여기서 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴티오 및 헤테로사이클릴옥시 그룹은 치환되지 않거나 환에서의 치환 가능성에 따라서 OH, 할로겐, CN, NO_2, C_1-C_{12}-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬, C_1-C_{12}-할로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, $Si(C_1$-C_{12}-$알킬)_3$, $-X-C(=Y)-R_4$, $-X-C(=Y)-Z-R_4$, 아릴, 아릴옥시, 헤테로사이클릴 및 헤테로사이클릴옥시로 이루어진 그룹으로부터 선택되는 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환된다]로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환된 C_1-C_8-알킬인 화학식 I의 화합물.

청구항 6

활성 화합물로서의 제1항에 따른 하나 이상의 화학식 I의 화합물 및 하나 이상의 보조제를 함유하는 살충 조성물(pesticidal composition).

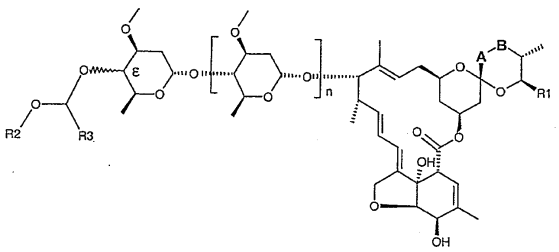
청구항 7

제6항에 따른 조성물을 해충 또는 이의 서식지에 적용하는, 해충의 방제 방법.

명 세 서

[0001] 본 발명은 (1) 각 경우에 유리 형태 또는 염 형태인, 화학식 I의 화합물 및 경우에 따라, 이의 E/Z 이성체, E/Z 이성체의 혼합물 및/또는 호변이성체; 상기 화합물 및 이의 이성체 및 호변이성체의 제조방법 및 용도; 화학식 I의 화합물의 제조를 위한 출발 물질 및 중간체; 활성 성분이 화학식 I의 화합물 및 이의 호변이성체로부터 선택된 살충 조성물(pesticidal composition); 상기 조성물의 제조방법 및 상기 조성물을 이용하여 해충을 방제하는 방법에 관한 것이다.

화학식 I



[0002]

[0003] 상기 화학식에서,

[0004] n은 0 또는 1이고;

[0005] A-B는 -CH=CH- 또는 $-CH_2-CH_2-$이며;

[0006] R_1은 C_1-C_{12}-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬 또는 C_2-C_{12}-알케닐이고;

[0007] R_2는 C_1-C_{12}-알킬, C_2-C_{12}-알케닐, C_2-C_{12}-알키닐; 또는 OH, 할로겐, CN, $-N_3$, $-NO_2$, 1 내지 3개의 C_1-C_6-알킬-그룹에 의해 임의로 치환된 C_3-C_8-사이클로알킬, 1 내지 3개의 C_1-C_6-알킬-그룹에 의해 임의로 치환된 C_3-C_8-사이클로알케닐, 노르보르닐레닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알콕시, C_3-C_8-사이클로알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_3-C_8-사이클로알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_{12}-알킬설피닐, C_3-C_8-사이클로알킬설피닐, C_1-C_{12}-할로알킬설피닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬설피닐, C_1-C_{12}-알킬설포닐, C_3-C_8-사이클로알킬설포닐, C_1-C_{12}-할로알킬설포닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬설포닐, $-NR_4R_6$, -X-C(=Y)-R_4, -X-C(=Y)-Z-R_4, $-P(=O)(OC_1-C_6-알킬)_2$, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴옥시, 아릴티오 및 헤테로사이클릴옥시[여기서 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴옥시, 아릴티오 및 헤테로사이클릴옥시 그룹은 환에서의 치환 가능성에 따라서 OH, 할로겐, CN, NO_2, C_1-C_{12}-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬, C_1-C_{12}-할로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, $Si(C_1-C_{12}-알킬)_3$, -X-C(=Y)-R_4, -X-C(=Y)-Z-R_4, 아릴, 아릴옥시, 헤테로사이클릴 및 헤테로사이클릴옥시로 이루어진 그룹으로부터 선택되는 1 내지 5개의 치환체에 의해 임의로 치환된다]로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환된 C_1-C_{12}-알킬, C_2-C_{12}-알케닐 또는 C_2-C_{12}-알키닐이거나,

[0008] R_2는 아릴, 헤테로사이클릴 C_3-C_8-사이클로알킬, C_3-C_8-사이클로알케닐; 또는 환에서의 치환 가능성에 따라 OH, 할로겐, CN, NO_2, C_1-C_{12}-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬, C_1-C_{12}-할로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알킬, 디메틸아미노-C_1-C_6-알콕시, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, 메틸렌디옥시, 아릴, 아릴옥시, 헤테로사이클릴 및 헤테로사이클릴옥시로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 임의로 치환된 아릴, 헤테로사이클릴 C_3-C_8-사이클로알킬 또는 C_3-C_8-사이클로알케닐이고;

[0009] R_3은 H 또는 C_1-C_{12}-알킬, 또는 OH, 할로겐, CN, $-N_3$, $-NO_2$, 1 내지 3개의 C_1-C_6-알킬-그룹에 의해 임의로 치환된 C_3-C_8-사이클로알킬, 노르보르닐레닐, 1 내지 3개의 메틸 그룹에 의해 임의로 치환된 C_3-C_8-사이클로알케닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알콕시, C_3-C_8-사이클로알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_3-C_8-사이클로알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_{12}-알킬설피닐, C_3-C_8-사이클로알킬설피닐, C_1-C_{12}-할로알킬설피닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬설피닐, C_1-C_{12}-알킬설포닐, C_3-C_8-사이클로알킬설포닐, C_1-C_{12}-할로알킬설포닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬설포닐, $-NR_4R_6$, -X-C(=Y)-R_4, -X-C(=Y)-Z-R_4, $-P(=O)(OC_1-C_6-알킬)_2$, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴옥시, 아릴티오 및 헤테로사이클릴옥시[여기서 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴옥시, 아릴티오 및 헤테로사이클릴옥시 그룹은 환에서의 치환 가능성에 따라서 OH, 할로겐, CN, NO_2, C_1-C_{12}-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬, C_1-C_{12}-할로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, $Si(C_1-C_{12}-알킬)_3$, -X-C(=Y)-R_4, -X-C(=Y)-Z-R_4, 아릴, 아릴옥시, 헤테로사이클릴 및 헤테로사이클릴옥시로 이루어진 그룹으로부터 선택되는 1 내지 5개의 치환체에 의해 임의로 치환된다]로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 치환된 C_1-C_{12}-알킬이거나;

[0010] R_2와 R_3은 함께 3 내지 7원의 알킬렌- 또는 4 내지 7원의 알케닐렌브릿지[여기서 1 또는 2개의 CH_2-그룹은 서로 독립적으로 그룹 -C(=O)-, -C(=S)-, O, S, $-NR_5$, -OC(=O)-O, -OC(=O)S-, -OC(=O)N(R_5)-, -C(=O)O-, -C(=O)S-, -C(=O)N(R_5)-, -N(R_5)C(=O)S-, -N(R_5)C(=O)N(R_5)-에 의해 대체될 수 있다]이고, 여기서 알킬렌 또는 알케닐렌브릿지는 서로 독립적으로 OH, 할로겐, CN, NO_2, $-N_3$ 및 C_1-C_4-알콕시로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 임의로 치환된 C_1-C_4-알킬로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 서로

독립적으로 치환될 수 있으며;

[0011] X는 O, NR_5 또는 결합이고;

[0012] Y는 O 또는 S이며;

[0013] Z는 O, S 또는 NR_5이고;

[0014] R_4는 H, 또는 할로겐, 하이드록시, C_1-C_6-알콕시 및 CN으로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 임의로 치환된 C_1-C_{12}-알킬; C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴-C_1-C_{12}-알킬, 헤테로사이클릴-C_1-C_{12}-알킬; 또는 환에서의 치환 가능성에 따라서 할로겐, C_1-C_6-알콕시, C_1-C_6-할로알킬 및 C_1-C_6-할로알콕시로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 임의로 치환된 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴-C_1-C_{12}-알킬 또는 헤테로사이클릴-C_1-C_{12}-알킬이고;

[0015] R_5는 H, C_1-C_8-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, 벤질 또는 -C(=O)-C_1-C_{12}-알킬이며;

[0016] R_6은 H, 또는 할로겐, C_1-C_6-알콕시, CN, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-할로알케닐, C_2-C_8-알키닐, C_1-C_{12}-할로알케닐, -X-C(=Y)-R_9, -X-C(=Y)-Z-R_9, -SO_2-R_9, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴-C_1-C_{12}-알킬 또는 헤테로사이클릴-C_1-C_{12}-알킬에 의해 임의로 치환된 C_1-C_{12}-알킬; 또는 환에서의 치환 가능성에 따라 할로겐, C_1-C_6-알콕시, C_1-C_6-할로알킬 및 C_1-C_6-할로알콕시로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 임의로 치환된 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴-C_1-C_{12}-알킬 또는 헤테로사이클릴-C_1-C_{12}-알킬이거나;

[0017] R_4과 R_6은 함께 3 내지 5원 알킬렌 브릿지[여기서, 메틸렌 그룹 중 하나는 O, S 또는 SO_2에 의해 대체될 수 있다]이고;

[0018] R_9는 H, 또는 할로겐, 하이드록시, C_1-C_6-알콕시 및 CN으로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 임의로 치환된 C_1-C_{12}-알킬; C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴-C_1-C_{12}-알킬, 헤테로사이클릴-C_1-C_{12}-알킬; 또는 환에서의 치환 가능성에 따라 할로겐, C_1-C_6-알콕시, C_1-C_6-할로알킬 및 C_1-C_6-할로알콕시로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 임의로 치환된 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴-C_1-C_{12}-알킬 또는 헤테로사이클릴-C_1-C_{12}-알킬이며;

[0019] 단, 당해 화합물은 n이 0이고 R_3이 H이며 R_2가 -CH_2-CH_2-OCH_3 또는 -CH_2-CH_2-O-페닐인 아버멕틴 B1 유도체가 아니고, n이 1이고 R_3이 H이며 R_2가 -CH_2-CH_2-O-페닐인 B1 유도체가 아니고, A-B가 -CH_2-CH_2-이고 n이 1이며 R_3이 H이고 R_2가 -CH_2-CH_2-OCH_3인 B1 유도체가 아니다.

[0020] 상기 및 하기에서, 화학식 I, II 및 IV에서 기호 "〰" 로 표시된 결합은 ε-위치에서 S-이성체 뿐만 아니라 R-이성체를 의미한다.

[0021] 특정 마크로라이드(macrolide) 화합물은 해충 방제용으로 문헌에 제안되어 있다. 그러나, 상기 공지된 화합물의 생물학적 특성은 전적으로 만족스럽지 않고, 이러한 이유로 인해 특히 곤충 및 진드기목 일원의 방제를 위한 살충 특성을 갖는 추가의 화합물을 제공해야할 필요가 있다. 이러한 문제는 본 발명에 따라서 당해 화학식 I의 화합물의 제공에 의해 해결된다.

[0022] 본 발명에 따라서 청구된 화합물은 아버멕틴의 유도체이다. 아버멕틴은 당해 분야의 숙련가에게 공지되어 있다. 이들은 스트렙토마이세스 아버미틸리스(*Streptomyces avermitilis*) 미생물 균주의 발효에 의해 수득되는, 구조적으로 서로 밀접하게 관련되는 살충 활성 화합물 그룹이다. 아버멕틴의 유도체는 통상의 화학적 합성을 통해서 수득될 수 있다.

[0023] 스트렙토마이세스 아버미틸리스로부터 수득할 수 있는 아버멕틴은 A1a, A1b, A2a, A2b, B1a, B1b, B2a 및 B2b로서 명명된다. "A"로서 명명되는 화합물은 5 위치에 메톡시 라디칼을 가지며, "B"로서 명명되는 화합물은 OH 그룹을 갖는다. "a" 부류는 (위치 25의) 치환체 R_1이 2급-부틸 라디칼인 화합물을 포함하며, "b" 부류는 25 위치에 이소프로필 라디칼을 갖는다. 화합물의 명칭에서 번호 1은 22번 및 23번 원자가 이중 결합에 의해 결합되어

있음을 나타내며, 번호 2는 22번 및 23번 원자가 단일 결합에 의해 결합되어 있고 23번 탄소원자가 OH 그룹을 보유함을 나타낸다. 상기 명명법은, 본 발명에 따른 비천연 아버멕틴 유도체의 경우에 천연 아버멕틴에 상응하는 특정 구조 유형을 나타내기 위해서 본 발명의 설명에서 유지된다. 본 발명에 따라서, B1 및 B2 부류의 화합물의 유도체, 보다 특히 아버멕틴 B1a, B1b, B2a 및 B2b의 유도체 또는 4'- 또는 4"-위치(ε-위치)에 S-배위 또는 R-배위를 갖는 상응하는 모노사카라이드의 혼합물이 청구된다.

[0024] 화학식 I의 화합물의 일부는 호변이성체 형태일 수 있다. 따라서, 상기 및 하기에서 화학식 I의 화합물에 대한 모든 인용은 상응하는 호변이성체가 모든 경우에 구체적으로 언급되지 않는다해도, 경우에 따라서 상응하는 호변이성체도 포함하는 것으로 이해되어야 한다.

[0025] 화학식 I의 화합물 및 경우에 따라, 이의 호변이성체는 염, 예를 들어, 산부가 염을 형성할 수 있다. 이러한 산부가 염은 광산(예: 황산, 인산 또는 할로겐화수소산)과 같은 강한 무기산; 비치환되거나 치환된, 예를 들어, 할로-치환된 C_1-C_4알칸카복실산(예: 아세트산), 불포화 또는 포화 디카복실산(예: 옥살산, 말론산, 말레산, 푸마르산 또는 프탈산), 하이드록시카복실산(예: 아스코르브산, 락트산, 말산, 타르타르산 또는 시트르산) 또는 벤조산과 같은 강한 유기 카복실산; 또는 비치환되거나 치환된, 예를 들어, 할로-치환된 C_1-C_4알칸- 또는 아릴-설폰산(예: 메탄- 또는 p-톨루엔-설폰산)과 같은 강한 유기 설폰산으로 형성시킨다. 또한, 하나 이상의 산 그룹을 갖는 화학식 I의 화합물은 염기와의 염을 형성할 수 있다. 적합한 염기와의 염은 예를 들어, 알칼리 금속 염 및 알칼리 토금속 염과 같은 금속 염, 예를 들어, 나트륨, 칼륨 및 마그네슘 염; 또는 암모니아 또는 유기 아민, 예를 들어, 모르폴린, 피페리딘, 피롤리딘, 모노-, 디- 또는 트리-저급 알킬아민(예: 에틸아민, 디에틸아민, 트리에틸아민 또는 디메틸프로필아민) 또는 모노-, 디- 또는 트리-하이드록시-저급 알킬아민(예: 모노-, 디- 또는 트리-에탄올아민)과의 염이다. 또한, 상응하는 내부 염이 경우에 따라 형성될 수도 있다. 유리 형태가 바람직하다. 화학식 I의 화합물의 염 중에서 농화학적으로 유리한 염이 바람직하다. 상기 및 하기에서 화학식 I의 유리 화합물 또는 이의 염은 경우에 따라 상응하는 염 및 화학식 I의 유리 화합물 둘다를 각각 포함하는 것으로 이해되어야 한다. 이는 화학식 I의 화합물의 호변이성체 및 이의 염의 경우에도 마찬가지이다.

[0026] 달리 정의하지 않는 한, 상기 및 하기에서 사용되는 일반적 용어는 하기 제시한 의미를 갖는다.

[0027] 달리 정의하지 않는 한, 탄소 함유 그룹 및 화합물은 각각 1 내지 6개, 바람직하게는 1 내지 4개, 특히 1 또는 2개의 탄소원자를 함유한다.

[0028] 그룹 자체로서 및 다른 그룹 및 화합물, 예를 들어, 할로알킬 및 할로알킬티오의 구조 요소로서의 할로겐은 불소, 염소, 브롬 또는 요오드, 특히 불소, 염소 또는 브롬, 보다 특히 불소 또는 염소이다.

[0029] 그룹 자체로서 및 다른 그룹 및 화합물, 예를 들어, 할로알킬, 알콕시 및 알킬티오의 구조 요소로서의 알킬은 각 경우에 해당 그룹이나 화합물내에 함유된 탄소원자의 수를 고려하여 직쇄, 즉 메틸, 에틸, 프로필, 부틸, 펜틸, 헥실, 헵틸 또는 옥틸이거나 측쇄, 예를 들어, 이소프로필, 이소부틸, 2급-부틸, 3급-부틸, 이소펜틸, 네오펜틸 또는 이소헥실이다.

[0030] 그룹 자체로서 및 다른 그룹과 화합물, 예를 들어, 할로사이클로알킬, 사이클로알콕시 및 사이클로알킬티오의 구조 요소로서의 사이클로알킬은 각 경우에 해당 그룹이나 화합물내에 함유된 탄소원자의 수를 고려하여, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로헵틸 또는 사이클로옥틸이다.

[0031] 그룹 자체로서 및 다른 그룹과 화합물의 구조 요소로서의 알케닐은 각 경우에 해당 그룹내에 함유된 탄소원자 및 공액되거나 분리된 이중 결합의 수를 고려하여, 직쇄, 예를 들어, 비닐, 알릴, 2-부테닐, 3-펜테닐, 1-헥세닐, 1-헵테닐, 1,3-헥사디에닐 또는 1,3-옥타디에닐이거나 측쇄, 예를 들어, 이소프로페닐, 이소부테닐, 이소프레닐, 3급-펜테닐, 이소헥세닐, 이소헵테닐 또는 이소옥테닐이다. 3개 내지 12개, 특히 3개 내지 6개, 보다 특히 3개 또는 4개의 탄소원자를 함유하는 알케닐 그룹이 바람직하다.

[0032] 그룹 자체로서 및 다른 그룹과 화합물의 구조 요소로서의 알키닐은 각 경우에 해당 그룹이나 화합물내에 함유된 탄소원자 및 공액되거나 분리된 이중 결합의 수를 고려하여, 직쇄, 예를 들어, 에티닐, 프로파길, 2-부티닐, 3-펜티닐, 1-헥시닐, 1-헵티닐, 3-헥센-1-이닐 또는 1,5-헵타디엔-3-이닐이거나 측쇄, 예를 들어, 3-메틸부트-1-이닐, 4-에틸펜트-1-이닐, 4-메틸헥스-2-이닐 또는 2-메틸헵트-3-이닐이다. 3개 내지 12개, 특히 3개 내지 6개, 보다 특히 3개 또는 4개의 탄소원자를 함유하는 알키닐 그룹이 바람직하다.

[0033] 알킬렌 및 알케닐렌은 직쇄 또는 측쇄 브릿지 구성원, 특히 $-CH_2-CH_2-CH_2-$, $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$, $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$

CH_2-, -$CH_2(CH_3)CH_2$-CH_2-, -$CH_2C(CH_3)_2$-CH_2-, -CH_2-CH=CH- CH_2- 또는 -CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-이다.

[0034] 할로-치환된 탄소 함유 그룹 및 화합물, 예를 들어, 할로겐에 의해 치환된 알킬, 알케닐, 알키닐, 사이클로알킬, 알콕시 또는 알킬티오는 부분적으로 할로겐화되거나 과할로겐화될 수 있으며, 다중 할로겐화의 경우에 할로겐 치환체는 동일하거나 상이하다. 그룹 자체로서 및 다른 그룹 및 화합물, 예를 들어, 할로알콕시 및 할로알킬티오의 구조 요소로서의 할로알킬의 예는 불소, 염소 및/또는 브롬에 의해 1회 내지 3회 치환된 메틸, 예를 들어 CHF_2 또는 CF_3; 불소, 염소 및/또는 브롬에 의해 2회 내지 5회 치환된 에틸, 예를 들어 CH_2CF_3, CF_2CF_3, CF_2CCl_3, CF_2CHCl_2, CF_2CHF_2, CF_2CFCl_2, CF_2CHBr_2, CF_2CHClF, CF_2CHBrF 또는 CClFCHClF; 불소, 염소 및/또는 브롬에 의해 각각 1회 내지 7회 치환된 프로필 또는 이소프로필, 예를 들어 $CH_2CHBrCH_2Br$, CF_2CHFCF_3, $CH_2CF_2CF_3$ 또는 $CH(CF_3)_2$; 불소, 염소 및/또는 브롬에 의해 1회 내지 9회 치환된 부틸 또는 이의 이성체, 예를 들어 $CF(CF_3)CHFCF_3$ 또는 $CH_2(CF_2)_2CF_3$; 불소, 염소 및/또는 브롬에 의해 1회 내지 11회 치환된 펜틸 또는 이의 이성체, 예를 들어 $CF(CF_3)(CHF)_2CF_3$ 또는 $CH_2(CF_2)_3CF_3$; 및 불소, 염소 및/또는 브롬에 의해 1회 내지 13회 치환된 헥실 또는 이의 이성체, 예를 들어 $(CH_2)_4CHBrCH_2Br$, $CF_2(CHF)_4CF_3$, $CH_2(CF_2)_4CF_3$ 또는 $C(CF_3)_2(CHF)_2CF_3$이다.

[0035] 아릴은 특히 페닐, 나프틸, 안트라세닐 또는 페릴레닐이며, 바람직하게는 페닐이다.

[0036] 헤테로사이클릴은 특히, 바람직하게는 탄소원자를 통해 결합된 피리딜, 피리미딜, s-트리아지닐, 1,2,4-트리아지닐, 티에닐, 푸릴, 테트라하이드로푸라닐, 피라닐, 테트라하이드로피라닐, 피롤릴, 피라졸릴, 이미다졸릴, 티아졸릴, 트리아졸릴, 테트라졸릴, 옥사졸릴, 티아디아졸릴, 옥사디아졸릴, 벤조티에닐, 퀴놀리닐, 퀴녹살리닐, 벤조푸라닐, 벤즈이미다졸릴, 벤조피롤릴, 벤조티아졸릴, 인돌릴, 쿠마리닐 또는 인다졸릴이며, 티에닐, 티아졸릴, 벤조푸라닐, 벤조티아졸릴, 푸릴, 테트라하이드로피라닐 및 인돌릴, 특히 피리딜 및 티아졸릴이 바람직하다.

[0037] 본 발명의 범주에서 다음 화합물들이 바람직하다:

[0038] (2) 유리 형태인 그룹 (1)에 따른 화학식 I의 화합물;

[0039] (3) R_3이 H인 그룹 (1) 또는 (2) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0040] (4) R_3이 C_1-C_8-알킬인 그룹 (1) 또는 (2) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0041] (5) R_2가 C_1-C_8-알킬, 특히 메틸인 그룹 (1) 내지 (4) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0042] (6) R_2가 C_3-C_8-알킬, 특히 프로필 또는 이소프로필인 그룹 (1) 내지 (5) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0043] (7) R_2가 측쇄 C_3-C_8-알킬, 특히 이소부틸, 2급-부틸 또는 3급-부틸인 그룹 (1) 내지 (5) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0044] (8) R_2가 C_1-C_8-알콕시-C_1-C_8-알킬인 그룹 (1) 내지 (4) 중 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0045] (9) R_2가 OH, 할로겐, CN, $-N_3$, $-NO_2$; 1 내지 3개의 C_1-C_6-알킬 그룹에 의해 임의로 치환된 C_3-C_8-사이클로알킬; 노르보르닐레닐; 1 내지 3개의 메틸 그룹에 의해 임의로 치환된 C_3-C_8-사이클로알케닐; C_3-C_8-할로사이클로알킬, C_3-C_8-사이클로알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴티오 및 헤테로사이클릴옥시[여기서, 아릴, 헤테로사이클릴, 아릴티오 및 헤테로사이클릴옥시 그룹은 환에서의 치환 가능성에 따라 OH, 할로겐, CN, NO_2, C_1-C_{12}-알킬, C_3-C_8-사이클로알킬, C_1-C_{12}-할로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, $Si(C_1$-C_{12}-알킬$)_3$, -X-C(=Y)-R_4, -X-C(=Y)-Z-R_4, 아릴, 아릴옥시, 헤테로사이클릴 및 헤테로사이클릴옥시로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 임의로 치환된다]로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 내지 5개의 치환체에 의해 임의로 치환된 C_1-C_8-알킬이고, 보다 특히

[0046] R_2가 C_3-C_8-사이클로알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_{12}-알킬설피닐, C_3-C_8-사이클로알킬설피닐, C_1-C_{12}-할로알

킬설피닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬설피닐, C_1-C_{12}-알킬설포닐, C_3-C_8-사이클로알킬설포닐, C_1-C_{12}-할로알킬설포닐, C_3-C_8-할로사이클로알킬설포닐, $-NR_4R_6$, $-X-C(=Y)-R_4$, $-X-C(=Y)-Z-R_4$ 및 $-P(=O)(OC_1$-C_6-알킬$)_2$로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1개의 치환체에 의해 치환된 C_1-C_8-알킬인 그룹 (1) 내지 (4) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0047] (10) R_2가 OH, 할로겐, CN, $-N_3$, $-NO_2$, C_1-C_{12}-알킬-설피닐, C_1-C_{12}-알킬-설포닐, C_1-C_{12}-할로알킬설포닐, $-NR_4R_6$, $-X-C(=Y)-R_4$, $-X-C(=Y)-Z-R_4$, 아릴 및 헤테로사이클릴[여기서, 아릴 및 헤테로사이클릴 환에서의 치환 가능성에 따라서 OH, 할로겐, CN, NO_2, C_1-C_4-알킬, $-C_8$-사이클로알킬, C_1-C_{12}-할로알킬, C_1-C_{12}-알콕시, C_1-C_{12}-할로알콕시, C_1-C_{12}-알킬티오, C_1-C_{12}-할로알킬티오, C_1-C_6-알콕시-C_1-C_6-알킬, C_2-C_8-알케닐, C_2-C_8-알키닐, $Si(C_1$-C_{12}-알킬$)_3$, $-X-C(=Y)-R_4$, $-X-C(=Y)-Z-R_4$, 아릴, 아릴옥시, 헤테로사이클릴 및 헤테로사이클릴옥시로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 임의로 치환된다]로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환된 C_1-C_4-알킬인 그룹 (1) 내지 (4) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0048] (11) R_2와 R_3이 함께 3 내지 5원 알케닐렌브릿지[여기서, 1 또는 2개의 CH_2-그룹은 그룹 -C(=O)-, -C(=S)-, O, S 또는 $-NR_5$-에 의해 대체될 수 있다]이고, 여기서 알킬렌 또는 알케닐렌브릿지는 서로 독립적으로 C_1-C_4-알킬로 이루어진 그룹으로부터 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환될 수 있는 그룹 (1) 내지 (4) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0049] (12) R_1이 이소프로필 또는 2급-부틸, 바람직하게는 이소프로필과 2급-부틸 유도체의 혼합물이 존재하는 그룹 (1) 내지 (11) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0050] (13) R_1이 사이클로헥실인 그룹 (1) 내지 (11) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0051] (14) n이 1인 그룹 (1) 내지 (12) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0052] (15) n이 0인 그룹 (1) 내지 (12) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0053] (16) A-B가 $-CH_2-CH_2-$인 그룹 (1) 내지 (15) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0054] (17) A-B가 -CH=CH-인 그룹 (1) 내지 (15) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0055] (18) ε-위치에 R-배위를 갖는 그룹 (1) 내지 (17) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0056] (19) ε-위치에 S-배위를 갖는 그룹 (1) 내지 (17) 중 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물;

[0057] (20) n이 1이고 R_2와 R_3이 함께 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$인 아버멕틴 B1 유도체가 아닌 그룹 (1) 내지 (19) 중의 어느 하나에 따른 화학식 I의 화합물.

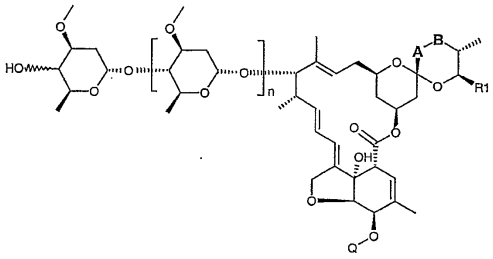
[0058] 표의 화합물들이 특히 바람직하다.

[0059] 추가로, 본 발명은

[0060] (A) 공지되어 있거나 공지된 방법으로 제조할 수 있는 화학식 II의 화합물을 공지되어 있거나 공지된 방법으로 제조할 수 있는 화학식 III의 화합물과 반응시켜 화학식 IV의 화합물을 형성시키고,

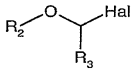
[0061] (B) 이렇게 수득된 화학식 IV의 화합물의 보호 그룹 Q를 제거함을 포함하는, 상기 (1)에서 정의한 바와 같은 화학식 I의 화합물 및 경우에 따라 이의 호변이성체의 제조방법에 관한 것이다.

화학식 II



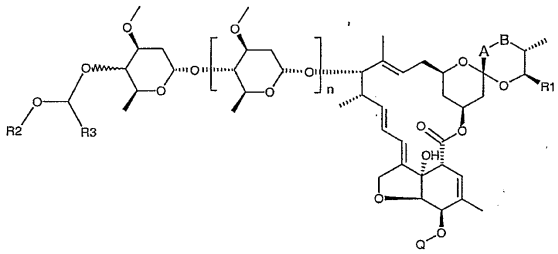
[0062]

화학식 III



[0063]

화학식 IV



[0064]

[0065] 상기 화학식에서,

[0066] R_1, n 및 그룹 A-B는 화학식 I에 대해 그룹 (1)에서 정의한 바와 같으며,

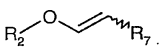
[0067] Q는 보호 그룹이며,

[0068] R_2 및 R_3 은 화학식 I에 대해 상기 정의한 바와 같으며,

[0069] Hal은 할로겐 원자, 바람직하게는 브롬 또는 요오드이다.

[0070] 본 발명은 또한 (C) 화학식 II의 화합물을 화학식 V의 화합물과 반응시킴을 포함하는, R_3이 $-CH_2R_7$인 상기 그룹 (1)에서 정의한 바와 같은 화학식 I의 화합물의 제조방법에 관한 것이다.

화학식 V



[0071]

[0072] 상기 화학식에서,

[0073] R_2는 화학식 I에 대해 정의한 바와 같으며,

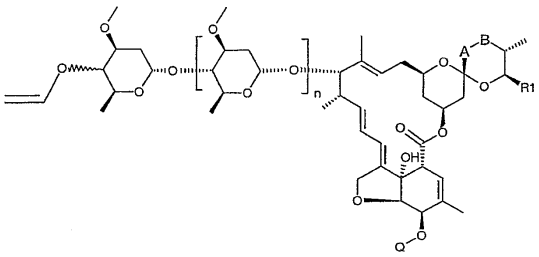
[0074] R_7은 H, C_1-C_{11}-알킬 또는 C_1-C_{11}-할로겐알킬이거나,

[0075] R_2와 R_7은 함께 3 내지 6원의 알킬렌- 또는 4 내지 6원의 알케닐렌[여기서, 1개의 CH_2-그룹은 C(=O), -C=S, O, S, $-NR_5$, -OC(=O)O-, -OC(=O)S-, $-OC(=O)NR_5$-, -C(=O)O-, -C(=O)S-, $-C(=O)NR_5$-, $-NR_5C(=O)S$- 및 $-NR_5CONR_5$-로부터 선택되는 그룹에 의해 임의로 대체된다]이고, 여기서 알케닐렌은 C_1-C_4-알킬, C_1-C_4-알콕시 및 C_1-C_4-할로겐알킬로 이루어진 그룹으로부터 선택되는 1 또는 2개의 치환체에 의해 임의로 치환되며, 상기 치환체들은 서로 독립적이다.

[0076] (D) 특히, R_3이 CH_2Hal이고 Hal이 할로겐인 화학식 I의 화합물은 R_3이 CH_2Hal인 화학식 IV의 화합물을 탈보호시

켜 제조할 수 있다. 화학식 IV의 화합물은 화학식 VI의 화합물을 할로아세탈화시켜 제조할 수 있다.

화학식 VI



[0077]

[0078] 화학식 VI의 화합물은 화학식 II의 화합물을 비닐화시켜 제조할 수 있다.

[0079] 특히, R_3이 CH_2Hal인 화학식 IV의 화합물을 사용하여 R_3이 CH_2R_8(여기서, R_8은 CN, NR_4R_6, $-NHC(=O)R_4$, $NHNH_2$, NHNH R_4, N R_4N R_4R_6, OR_4 또는 SR_4이다)인 화학식 IV의 다른 화합물을 제조할 수 있다.

[0080] 화학식 IV의 화합물은 화학식 I의 화합물의 제조에 바람직한 화합물이다.

[0081] 추가로, 작용 그룹을 유리 형태 또는 보호된 형태로 보유한 화학식 I의 화합물을 추가의 화학식 I의 화합물의 제조를 위한 출발 물질로서 사용할 수 있다. 이러한 조작에 대해서는 당해 분야의 숙련가에게 공지된 방법이 적용될 수 있다.

[0082] 예를 들어, R_2가 $CH_2CH_2OC(=O)CH_3$인 화학식 I의 화합물은 R_2가 CH_2CH_2OH인 화학식 I의 화합물로 전환시킬 수 있다. 추가로, 표준 반응은 R_2가 $CH_2CH_2OCH_2O$-알킬, $CH_2CH_2OC(=O)R_4$, $CH_2CH_2OC(=O)ZR_4$ 및 $CH_2CH_2N_3$인 화학식 I의 화합물을 초래할 수 있다. R_2가 $CH_2CH_2N_3$인 화학식 I의 화합물은 R_2가 $CH_2CH_2NH_2$인 화학식 I의 화합물로 전환시킬 수 있다. 화학식 I의 화합물을 Hal-$C(=O)R_4$ 또는 Hal-$C(=O)ZR_4$로 처리하면 R_2 가 각각 $CH_2CH_2NHC(=O)R_4$ 및 $CH_2CH_2NHC(=O)ZR_4$인 화학식 I의 화합물이 수득된다.

[0083] 상기 및 하기에서 기술하는 반응은 공지된 방식으로, 예를 들어, 적합한 용매 또는 희석제 또는 이들의 혼합물의 부재하에 또는 통상적으로는 존재하에 수행하며, 반응은 필요에 따라 실온에서 냉각시키면서 또는 약 -80℃ 내지 반응 매질의 비점, 바람직하게는 약 0℃ 내지 약 +150℃의 온도 범위에서 가열시키면서 필요에 따라 밀폐된 용기내에서 가압하에 불활성 가스 대기하에 및/또는 무수 조건하에 수행한다. 특히 유리한 반응 조건은 본 실시예에서 찾아볼 수 있다.

[0084] 반응 시간은 중요하지 않으나, 약 0.1시간 내지 약 72시간, 특히 약 0.5시간 내지 약 24시간이 바람직하다.

[0085] 생성물은 통상의 방법, 예를 들어, 여과, 결정화, 증류 또는 크로마토그래피 또는 이러한 방법들의 임의의 적합한 조합에 의해 분리시킨다.

[0086] 화학식 I의 화합물 및 경우에 따라 이의 호변이성체의 제조를 위해 사용되는 상기 및 하기에서 언급한 출발 물질은 공지되어 있거나 예를 들어, 하기에 기재한 바와 같은 자체 공지된 방법을 사용하여 제조할 수 있다.

[0087] 공정 변형 (A):

[0088] 용매 및 희석제의 예에는 방향족, 지방족 및 지환족 탄화수소 및 할로겐화 탄화수소, 예를 들어, 벤젠, 톨루엔, 크실렌, 메시틸렌, 테트랄린, 클로로벤젠, 디클로로벤젠, 브로모벤젠, 석유 에테르, 헥산, 사이클로헥산, 디클로로메탄, 트리클로로메탄, 테트라클로로메탄, 디클로로에탄, 트리클로로에탄 또는 테트라클로로에탄; 에테르, 예를 들어, 디에틸 에테르, 디프로필 에테르, 디이소프로필 에테르, 디부틸 에테르, 3급-부틸 메틸 에테르, 에틸렌 글리콜 모노메틸 에테르, 에틸렌 글리콜 모노에틸 에테르, 에틸렌 글리콜 디메틸 에테르, 디메톡시디에틸 에테르, 테트라하이드로푸란 또는 디옥산; 카복실산의 에스테르, 예를 들어, 에틸 아세테이트; 아미드, 예를 들어, 디메틸포름아미드, 디메틸아세트아미드 또는 1-메틸-2-피롤리디논; 니트릴, 예를 들어, 아세토니트릴; 설폭사이드, 예를 들어, 디메틸 설폭사이드; 또는 언급한 용매들의 혼합물이 포함된다. 디메틸포름아미드 및 디메틸아세트아미드, 특히 디메틸아세트아미드와 같은 아미드가 바람직하다.

[0089] 화학식 II 및 IV의 화합물내의 보호 그룹 Q에는 알킬 에테르 라디칼, 예를 들어, 메톡시메틸, 메틸티오메틸, 3

급-부틸티오메틸, 벤질옥시메틸, p-메톡시벤질, 2-메톡시에톡시메틸, 2,2,2-트리클로로에톡시메틸, 2-(트리메틸실릴)에톡시메틸, 테트라하이드로피라닐, 테트라하이드로푸라닐, 1-에톡시에틸, 1-(2-클로로에톡시)에틸, 1-메틸-1-메톡시에틸, 1-메틸-1-벤질옥시에틸, 트리클로로에틸, 2-트리메틸실릴에틸, 3급-부틸, 알릴, p-메톡시페닐, 2,4-디니트로페닐, 벤질, p-메톡시-벤질, o-니트로벤질, p-니트로벤질, 트리페닐메틸; 트리알킬실릴 라디칼, 예를 들어, 트리메틸실릴, 트리에틸실릴, 디메틸-3급-부틸실릴, 디메틸-이소프로필실릴, 디메틸-1,1,2-트리메틸프로필실릴, 디에틸-이소프로필실릴, 디메틸-3급-헥실실릴 뿐만 아니라, 페닐-3급-알킬-실릴 그룹, 예를 들어, 디페닐-3급-부틸실릴; 에스테르, 예를 들어, 포르메이트, 아세테이트, 클로로아세테이트, 디클로로아세테이트, 트리클로로아세테이트, 트리플루오로아세테이트, 메톡시아세테이트, 페녹시아세테이트, 피발로에이트, 벤조에이트; 알킬 카보네이트, 예를 들어, 메틸-, 9-플루오레닐메틸-, 에틸-, 2,2,2-트리클로로에틸-, 2-(트리메틸실릴)에틸-, 비닐-, 알릴-, 벤질-, p-메톡시벤질-, o-니트로벤질-, p-니트로벤질- 뿐만 아니라 p-니트로페닐-카보네이트가 포함된다.

[0090] 트리알킬실릴 라디칼, 예를 들어, 트리메틸실릴, 트리에틸실릴, 디메틸-3급-부틸실릴, 디페닐-3급-부틸실릴, 에스테르, 예를 들어, 메톡시아세테이트 및 페녹시아세테이트 및 카보네이트, 예를 들어, 9-플루오레닐메틸카보네이트 및 알릴카보네이트가 바람직하다. 디메틸-3급-부틸실릴 에테르가 특히 바람직하다.

[0091] 반응은 약 -70℃ 내지 +50℃, 바람직하게는 -10℃ 내지 25℃의 온도 범위에서 수행하는 것이 유리하다.

[0092] 실시예 P.1 및 P2는 반응 조건을 보다 상세히 제공한다.

[0093] 공정 변형 (B):

[0094] 용매 및 희석제의 예는 공정 변형 A에서 언급한 바와 동일하다. 또한, 알코올, 예를 들어, 메탄올, 에탄올 또는 2-프로판올 및 물이 적합하다.

[0095] 반응은 약 -70℃ 내지 +100℃, 바람직하게는 -10℃ 내지 25℃의 온도 범위에서 수행하는 것이 유리하다.

[0096] 보호 그룹의 제거에는, 루이스 산(예: 염산, 메탄설폰산, BF_3*OEt_2, 피리딘 중의 HF, $Zn(BF_4)_2$*H_2O, p-톨루엔설폰산, $AlCl_3$, $HgCl_2$); 불화 암모늄(예: 테트라부틸암모늄 플루오라이드); 염기(예: 암모니아, 트리알킬아민 또는 헤테로사이클릭 염기); 효소(예: 탄소상 팔라듐)를 이용한 가수분해; 효소(예: $Pd(PPh_3)_4$)와의 환원제(예: 수소화붕소나트륨 또는 트리부틸주석 수소화물) 또는 아세트산과의 아연이 적합하다.

[0097] 산, 예를 들어, 메탄설폰산 또는 피리딘 중의 HF; Pd(0)와의 수소화붕소나트륨; 염기, 예를 들어, 암모니아, 트리에틸아민 또는 피리딘, 특히 산, 예를 들어, 피리딘 중의 HF 또는 메탄설폰산이 바람직하다.

[0098] 특히 바람직한 반응 조건은 실시예 P.1, P2, P3, P4 및 P5에서 기술한다.

[0099] 공정 변형 (C):

[0100] 용매 및 희석제의 예는 공정 변형 A에서 언급한 바와 동일하다.

[0101] 반응은 약 -70℃ 내지 +100℃, 바람직하게는 -10℃ 내지 55℃의 온도 범위에서 수행하는 것이 유리하다.

[0102] 반응은 바람직하게는 산 또는 루이스 산의 존재하에 수행한다. 전형적 산 및 루이스산은 특히 광산, 예를 들어, 황산, 인산 또는 할로겐화수소산, 특히 염산, 메탄설폰산, 예를 들어, 할로-치환된 C_1-C_4알칸카복실산(예: 아세트산), 포화 또는 불포화 디카복실산(예: 옥살산, 말론산, 말레산, 푸마르산 또는 프탈산), 하이드록시카복실산(예: 아스코르브산, 락트산, 말산, 타르타르산 또는 시트르산) 또는 벤조산 또는 BF_3*OEt_2이다.

[0103] 공정 변형 (D):

[0104] 용매 및 희석제의 예는 공정 변형 A에서 언급한 바와 동일하다.

[0105] 반응은 약 -70℃ 내지 150℃, 바람직하게는 -20℃ 내지 120℃의 온도 범위에서 수행하는 것이 유리하다.

[0106] 할로아세탈화 및 비닐화에 바람직한 반응 조건은 당해 분야의 숙련가에게 공지된 문헌에 기재된 바와 같다.

[0107] 화학식 I의 화합물은 가능한 이성체 중 하나의 형태 또는 이들의 혼합물 형태, 순수한 이성체 형태, 이성체 혼합물의 형태, 즉 부분입체이성체 혼합물의 형태일 수 있으며, 본 발명은 순수한 이성체 및 부분입체이성체 혼합물 둘다에 관한 것이며, 입체화학적 세부사항이 모든 경우에 구체적으로 언급되지 않더라도 상기 및 하기에서 적절히 해석될 것이다.

[0108] 부분입체이성체 혼합물은 공지된 방법을 사용하여, 예를 들어, 용매로부터 재결정화시키거나, 크로마토그래피, 예를 들어, 아세틸셀룰로즈상에서 적합한 미생물을 보조로 하여 고성능 액체 크로마토그래피(HPLC)하거나, 특이적 고정화 효소로 절단시키거나, 오직 하나의 에난티오머만이 착체화된 경우에 예를 들어, 키랄 크라운 에테르를 사용하여 내포 화합물을 형성시킴으로써 순수한 이성체로 분해시킬 수 있다.

[0109] 이성체의 상응하는 혼합물을 분리시키는 것 이외에도, 순수한 부분입체이성체는 일반적으로 공지된 입체선택적 합성법을 사용하여, 예를 들어, 상응하게 적합한 입체화학을 갖는 출발 물질을 사용하여 본 발명에 따른 공정을 수행하여 수득할 수도 있다.

[0110] 각 경우에, 개개의 성분이 상이한 생물학적 활성을 갖는다면, 생물학적으로 보다 활성인 이성체를 분리시키거나 합성하는 것이 유리하다.

[0111] 또한, 화학식 I의 화합물은 수화물 형태로 수득할 수 있고/있거나 기타 용매, 예를 들어, 고체 형태의 화합물을 결정화시키는데 사용할 수 있는 용매를 포함할 수 있다.

[0112] 본 발명은 당해 공정의 어떠한 단계에서도 출발 물질 또는 중간체로서 수득할 수 있는 화합물이 출발 물질로서 사용되고, 나머지 단계의 모두 또는 일부가 수행되거나 출발 물질이 유도체 및/또는 염 및/또는 이의 부분입체이성체 형태로 사용되거나, 당해 반응 조건하에 형성되는 방법의 모든 양태에 관한 것이다. 예를 들어, 작용 그룹을 유리 형태 또는 보호된 형태로 보유하는 화학식 I의 화합물은 화학식 I의 추가의 화합물을 제조하기 위한 출발 물질로서 사용할 수 있다. 이러한 조작에 대해서는 당해 분야의 숙련가에게 공지된 방법이 적용될 수 있다.

[0113] 본 발명의 방법에서, 특히 바람직한 화학식 I의 화합물을 초래하는 상기한 출발 물질 및 중간체를 사용하는 것이 바람직하다.

[0114] 본 발명은 특히 본 실시예에서 기술하는 제조방법에 관한 것이다.

[0115] 본 발명은 추가로 각 경우에 유리 형태 또는 염 형태인, 화학식 I의 화합물 및 경우에 따라 E/Z 이성체, E/Z 이성체의 혼합물 및/또는 호변이성체에 관한 것이다.

[0116] 해충 방제 분야에서, 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물은 심지어 낮은 농도 비율에서도 유용한 보호 및/또는 치유 활성과 함께 매우 유리한 살균 스펙트럼 및 매우 광범위한 스펙트럼을 나타내는 활성 성분이고, 온혈 유기체, 어류 및 식물은 이에 대해 내성을 갖는다. 놀랍게도, 당해 화합물은 식물 해충, 및 사람 및 보다 특히 생산성 가축, 가정용 동물 및 애완동물의 체외- 및 체내-기생충을 방제하는데도 동등하게 적합하다. 당해 화합물은 보통으로 민감성인 동물 해충 뿐만 아니라 내성 동물 해충, 예를 들어, 곤충 및 대표적인 진드기목, 선충류, 촌충류 및 흡충류의 모든 또는 개개의 발달 단계에 대해 효과적이며, 동시에 유용한 유기체를 보호한다. 본 발명에 따른 활성 성분의 살충 또는 살비 활성은 직접적으로 자체로, 즉 예를 들어 탈피 동안에 즉시 또는 단지 약간의 시간이 지난 후 일어나는 해충의 사멸로서 나타나거나, 간접적으로 예를 들어 감소된 산란 및/또는 부화율로서 나타나며, 우수한 활성은 50 내지 60% 이상의 사멸에 상응한다.

[0117] 본 발명의 범주내에서, 특히 나비목, 딱정벌레목, 메뚜기목, 흰개미목, 다듬이벌레목, 이목, 털이목, 총채벌레목, 노린재목, 매미목, 벌목, 파리목, 벼룩목, 좀목 및 진드기목, 주로 진드기목, 파리목, 총채벌레목, 나비목 및 딱정벌레목으로부터의 해충을 성공적으로 방제할 수 있다. 다음 해충들의 매우 특히 우수한 방제가 가능하다:

[0118] 아바그로티스 종(Abagrotis spp.), 아브락사스 종(Abraxas spp.), 아칸톨레우카니아 종(Acantholeucania spp.), 아칸토플루시아 종(Acanthoplusia spp.), 아카루스 종(Acarus spp.), 아카루스 시로(Acarus siro,), 아세리아 종(Aceria spp.), 아세리아 쉘도니(Aceria sheldoni), 아클레리스 종(Acleris spp.), 아콜로티투스 종(Acoloithus spp.), 아콤프시아 종(Acompsia spp.), 아코수스 종(Acossus spp.), 아크리아 종(Acria spp.), 아크로바시스 종(Acrobasis spp.), 아크로세르코프트 종(Acrocercops spp.), 아크롤레피아 종(Acrolepia spp.), 아크롤레피오프시스 종(Acrolepiopsis spp.), 아크로니크타 종(Acronicta spp.), 아크로폴리티스 종(Acropolitis spp.), 아크테비아 종(Actebia spp.), 아쿨루스 종(Aculus spp.), 아쿨루스 슐레크텐달리(Aculus schlechtendali), 아독소피에스 종(Adoxophyes spp.), 아독소피에스 레티쿨레나(Adoxophyes reticulana), 아에데스 종(Aedes spp.), 아에게리아 종(Aegeria spp.), 아에테스 종(Aethes spp.), 아가페타 종(Agapeta spp.), 아고노프테릭스 종(Agonopterix spp.), 아그리오피스 종(Agriopis spp.), 아그리오테스 종(Agriotes spp.), 아그리필라 종(Agriphila spp.), 아그로콜라 종(Agrochola spp.), 아그로페리나 종

(Agroperina spp.), 알라바마 종(Alabama ssp.), 알라바마 아글리세아에(Alabama argillaceae), 아그로티스 종(Agrotis spp.), 알부나 종(Albuna spp.), 알카토에 종(Alcathoe spp.), 알시스 종(Alcis spp.), 알레이마 종(Aleimma spp.), 알레티아 종(Aletia spp.), 알레우로트릭수스 종(Aleurothrixus spp.), 알레우로트릭수스 플로코수스(Aleurothrixus floccosus), 알레이로데스 종(Aleyrodes spp.), 알레이로데스 브라시카에(Aleyrodes brassicae), 알로피에스 종(Allophyes spp.), 알소필라 종(Alsophila spp.), 아마타 종(Amata spp.), 아마테스 종(Amathes spp.), 암블리오마 종(Amblyomma spp.), 암블립틸리아 종(Amblyptilia spp.), 암모코니아 종(Ammoconia spp.), 아모르비아 종(Amorbia spp.), 암피온 종(Amphion spp.), 암피포에아 종(Amphipoea spp.), 암피피라 종(Amphipyra spp.), 아미엘로이스 종(Amyelois spp.), 아나캄프토데스 종(Anacamptodes spp.), 아나그라파 종(Anagrapha spp.), 아나르시아 종(Anarsia spp.), 아나트리킨티스 종(Anatrychyntis spp.), 아나비트리넬라 종(Anavitrinella spp.), 안실리스 종(Ancylis spp.), 안드로폴리아 종(Andropolia spp.), 안히멜라 종(Anhimella spp.), 안테라에아 종(Antheraea spp.), 안테리고나 종(Antherigona spp.), 안테리고나 소카타(Antherigona soccata), 안토노무스 종(Anthonomus ssp.), 안토노무스 그란디스(Anthonomus grandis), 안티카르시아 종(Anticarsia spp.), 안티카르시아 게마탈리스(Anticarsia gemmatalis), 아오니디엘라 종(Aonidiella spp.), 아파메아 종(Apamea spp.), 아파니아 종(Aphania spp.), 아펠리아 종(Aphelia spp.), 아피디다에(Aphididae), 아피스 종(Aphis spp.), 아포토미스 종(Apotomis spp.), 아프로아에레마 종(Aproaerema spp.), 아르키푸스 종(Archippus spp.), 아르키프스 종(Archips spp.), 아크로미르멕스(Acromyrmex), 아르크티아 종(Arctia spp.), 아르가스 종(Argas spp.), 아르골람프로테스 종(Argolamprotes spp.), 아르기레스티아 종(Argyresthia spp.), 아르기로그라마 종(Argyrogramma spp.), 아르기로플로세 종(Argyroploce spp.), 아르기로타에니아 종(Argyrotaenia spp.), 아로트로포라 종(Arotrophora spp.), 아스코티스 종(Ascotis spp.), 아스피디오투스 종(Aspidiotus spp.), 아스필라프테릭스 종(Aspilapteryx spp.), 아스테노프티카 종(Asthenoptycha spp.), 아테르피아 종(Aterpia spp.), 아테티스 종(Athetis spp.), 아토마리아 종(Atomaria spp.), 아토마리아 리네아리아(Atomaria linearis), 아타 종(Atta spp.), 아티파 종(Atypha spp.),오토그라파 종(Autographa spp.), 악실리아 종(Axylia spp.), 박트라 종(Bactra spp.), 바르바라 종(Barbara spp.), 바트라케드라 종(Batrachedra spp.), 박타리스티스 종(Battaristis spp.), 벰베시아 종(Bembecia spp.), 베미시아 종(Bemisia spp.), 베미시아 타바키(Bemisia tabaci), 비비오 종(Bibio spp.), 비비오 호르툴라니스(Bibio hortulanis), 비시그나 종(Bisigna spp.), 블라스테스티아 종(Blastesthia spp.), 블라타 종(Blatta spp.), 블라텔라 종(Blatella spp.), 블레파로시스 종(Blepharosis spp.), 블레프티나 종(Bleptina spp.), 보라미아 종(Boarmia spp.), 봄빅스 종(Bombyx spp.), 보몰로카 종(Bomolocha spp.), 부필루스 종(Boophilus spp.), 브라크미아 종(Brachmia spp.), 브라디나 종(Bradina spp.), 브레비팔푸스 종(Brevipalpus spp.), 브리티스 종(Brithys spp.), 브리오비아 종(Bryobia spp.), 브리오비아 프라에티오사(Bryobia praetiosa), 브리오트로파 종(Bryotropha spp.), 부팔루스 종(Bupalus spp.), 부세올라 종(Busseola spp.), 부세올라 푸스카(Busseola fusca), 카베라 종(Cabera spp.), 카코에시모르파 종(Cacoecimorpha spp.), 카드라 종(Cadra spp.), 카드라 카우텔라(Cadra cautella), 카에누르기나 종(Caenurgina spp.), 칼리피트리메루스 종(Calipitrimerus spp.), 칼리에르게스 종(Callierges spp.), 칼로프포라 종(Callophpora spp.), 칼로프포라 에리트로세팔라(Callophpora erythrocephala), 칼로파시아 종(Calophasia spp.), 칼로프틸리아 종(Caloptilia spp.), 칼리비테스 종(Calybites spp.), 카프노프티카 종(Capnoptycha spp.), 카푸아 종(Capua spp.), 카라드리나 종(Caradrina spp.), 카리페타 종(Caripeta spp.), 카르멘타 종(Carmenta spp.), 카르포시나 종(Carposina spp.), 카르포시나 니포넨시스(Carposina nipponensis), 카타마크타 종(Catamacta spp.), 카텔라프리스 종(Catelaphris spp.), 카토프트리아 종(Catoptria spp.), 카우스톨로마 종(Caustoloma spp.), 셀라에나 종(Celaena spp.), 셀리파 종(Celypha spp.), 세노피스 종(Cenopis spp.), 세푸스 종(Cephus spp.), 세라미카 종(Ceramica spp.), 세라프테릭스 종(Cerapteryx spp.), 세라티티스 종(Ceratitis spp.), 세라토필룰스 종(Ceratophyllus spp.), 세로플라스터 종(Ceroplaster spp.), 카에토크네마 종(Chaetocnema spp.), 카에토크네마 티빌라리스(Chaetocnema tibialis), 카마에스페시아 종(Chamaesphecia spp.), 카란브카 종(Charanvca spp.), 케미오필라 종(Cheimophila spp.), 케르소티스 종(Chersotis spp.), 키아스미아 종(Chiasmia spp.), 칠로 종(Chilo spp.), 치오노데스 종(Chionodes spp.), 코리오프테스 종(Chorioptes spp.), 코리스토네우라 종(Choristoneura spp.), 크리사스피디아 종(Chrysaspidia spp.), 크리소데익시스 종(Chrysodeixis spp.), 크리소미아 종(Chrysomya spp.), 크리솜팔루스 종(Chrysomphalus spp.), 크리솜팔루스 딕티오스페르미(Chrysomphalus dictyospermi), 크리솜팔루스 아오니디움(Chrysomphalus aonidium), 크리소테우치아 종(Chrysoteuchia spp.), 실릭스 종(Cilix spp.), 시멕스 종(Cimex spp.), 클리시아 종(Clysia spp.), 클리시아 암비구엘라(Clysia ambiguella), 클렙시스 종(Clepsis spp.), 크나에미도포루스 종(Cnaemidophorus

spp.), 크나팔로크로시스 종(Cnaphalocrocis spp.), 크네파시아 종(Cnephasia spp.), 코쿠스 종(Coccus spp.), 코쿠스 헤스페리둠(Coccus hesperidum), 코칠리스 종(Cochylis spp.), 콜레포라 종(Coleophora spp.), 콜로토이스 종(Colotois spp.), 코모필라 종(Commophila spp.), 코니스트라 종(Conistra spp.), 코노포모르파 종(Conopomorpha spp.), 코르시라 종(Corcyra spp.), 코르누티플루시아 종(Cornutiplusia spp.), 코스미아 종(Cosmia spp.), 코스모폴리테스 종(Cosmopolites spp.), 코스모프테릭스 종(Cosmopterix spp.), 코서스 종(Cossus spp.), 코스타에온벡사 종(Costaeonvexa spp.), 크람부스 종(Crambus spp.), 크레아토노스 종(Creatonotos spp.), 크로시돌로미아 종(Crocidolomia spp.), 크로시돌로미아 비노탈리스(Crocidolomia binotalis), 크로에시아 종(Croesia spp.), 크리모데스 종(Crymodes spp.), 크립타스파스마 종(Cryptaspasma spp.), 크립토블라베스 종(Cryptoblabes spp.), 크립토칼라 종(Cryptocala spp.), 크립토플레비아 종(Cryptophlebia spp.), 크립토플레비아 류코트레타(Cryptophlebia leucotreta), 크립토프틸라 종(Cryptoptila spp.), 크테노프세우스티스 종(Ctenopseustis spp.), 크테노세팔리데스 종(Ctenocephalides spp.), 쿠쿨리아 종(Cucullia spp.), 쿠르쿨리오 종(Curculio spp.), 쿨렉스 종(Culex spp.), 쿠테레브라 종(Cuterebra spp.), 시디아 종(Cydia spp.), 시디아 포모넬라(Cydia pomonella), 심발로포라 종(Cymbalophora spp.), 닥틸레트라 종(Dactylethra spp.), 다쿠스 종(Dacus spp.), 다디카 종(Dadica spp.), 다말리네아 종(Damalinea spp.), 다시키라 종(Dasychira spp.), 데카다르키스 종(Decadarchis spp.), 데코데스 종(Decodes spp.), 데일레필라 종(Deilephila spp.), 델토데스 종(Deltodes spp.), 덴드롤리무스 종(Dendrolimus spp.), 데프레사리아 종(Depressaria spp.), 데르메스테스 종(Dermestes spp.), 데르마니수스 종(Dermanyssus spp.), 데르마니수스 갈리나에(Dermanyssus gallinae), 디아브로티카 종(Diabrotica spp.), 디아크리시아 종(Diachrysia spp.), 디아파니아 종(Diaphania spp.), 디아르시아 종(Diarsia spp.), 디아세미아 종(Diasemia spp.), 디아트라에아 종(Diatraea spp.), 디세라투라 종(Diceratura spp.), 디코메리스 종(Dichomeris spp.), 디크로크로시스 종(Dichrocrocis spp.), 디크로람파 종(Dichrorampha spp.), 디사이클라 종(Dicycla spp.), 디오리크트리아 종(Dioryctria spp.), 디파로프시스 종(Diparopsis spp.), 디파로프시스 카스타네아(Diparopsis castanea), 디플레우리나 종(Dipleurina spp.), 디프리온 종(Diprion spp.), 디프리오니다에(Diprionidae), 디스세스트라 종(Discestra spp.), 디스탄티엘라 종(Distantiella spp.), 디스탄티엘라 테오브로마(Distantiella theobroma), 디툴라 종(Ditula spp.), 디우르네아 종(Diurnea spp.), 도라토프테릭스 종(Doratopteryx spp.), 드레파나 종(Drepana spp.), 드로스필라 종(Drosphila spp.), 드로스필라 메랄노가스터(Drosphila melanogaster), 디사욱세스 종(Dysauxes spp.), 디스데르쿠스 종(Dysdercus spp.), 디스트로마 종(Dysstroma spp.), 에아나 종(Eana spp.), 에아리아스 종(Earias spp.), 에클리티카 종(Ecclitica spp.), 에크디톨로파 종(Ecdytolopha spp.), 에크피로뢰 종(Ecpyrrhorrhoe spp.), 에크토미엘로이스 종(Ectomyelois spp.), 에트로피스 종(Eetropis spp.), 에기라 종(Egira spp.), 엘라스모팔푸스 종(Elasmopalpus spp.), 엠멜리아 종(Emmelia spp.), 므포아스카 종(mpoasca spp.), 엠피레우마 종(Empyreuma spp.), 에나르기아 종(Enargia spp.), 에나르모니아 종(Enarmonia spp.), 엔도피자 종(Endopiza spp.), 엔도테니아 종(Endothenia spp.), 엔도트리카 종(Endotricha spp.), 에오레우마 종(Eoreuma spp.), 에오테트라니쿠스 종(Eotetranychus spp.), 에오테트라니쿠스 카르피니(Eotetranychus carpini), 에파고게 종(Epagoge spp.), 에펠리스 종(Epelis spp.), 에페스티아 종(Ephestia spp.), 에페스티오데스 종(Ephestiodes spp.), 에피블레마 종(Epiblema spp.), 에피에호리스토데스 종(Epiehoristodes spp.), 에피노티아 종(Epinotia spp.), 에피파스 종(Epiphyas spp.), 에피플레마 종(Epiplema spp.), 에피프세스티스 종(Epipsestis spp.), 에피로에 종(Epirrhoe spp.), 에피시무스 종(Episimus spp.), 에피팀비아 종(Epitymbia spp.), 에플라크나 종(Epllachna spp.), 에라니스 종(Erannis spp.), 에라스트리아 종(Erastria spp.), 에렘누스 종(Eremnus spp.), 에레우네티스 종(Ereunetis spp.),에리오피에스 종(Eriophyes spp.), 에리오소마 종(Eriosoma spp.), 에리오소마 라니게룸(Eriosoma lanigerum), 에리트로네우라 종(Erythroneura spp.), 에스티그메네 종(Estigmene spp.), 에트미아 종(Ethmia spp.), 에티엘라 종(Etiella spp.), 유아그로티스 종(Euagrotis spp.), 유코스마 종(Eucosma spp.), 유엘라에나 종(Euehlaena spp.), 유엘리디아 종(Euelidia spp.), 유에오스마 종(Eueosma spp.), 유치스투스 종(Euchistus spp.), 유코슴모르파 종(Eucosmomorpha spp.), 유도니아 종(Eudonia spp.), 유피도니아 종(Eufidonia spp.), 유히포노메우토이데스 종(Euhyponomeutoides spp.), 율레피토데스 종(Eulepitodes spp.), 율리아 종(Eulia spp.), 율리티스 종(Eulithis spp.), 유피테시아 종(Eupithecia spp.), 유플렉시아 종(Euplexia spp.), 유포에실리아 종(Eupoecilia spp.), 유포에실리아 암비구엘라(Eupoecilia ambiguella), 유프록티스 종(Euproctis spp.), 유프실리아 종(Eupsilia spp.), 유로도페 종(Eurhodope spp.), 유로이스 종(Eurois spp.), 유리가스터 종(Eurygaster spp.), 유리스미아 종(Eurythmia spp.), 유스트로티아 종(Eustrotia spp.), 육소아 종(Euxoa spp.), 유조페라 종(Euzophera spp.), 에버게스티스

종(Evergestis spp.), 에비페 종(Evippe spp.), 엑사르테마 종(Exartema spp.), 파니아 종(Fannia spp.), 파론타 종(Faronta spp.), 펠티아 종(Feltia spp.), 필라티마 종(Filatima spp.), 피시아 종(Fishia spp.), 프랑클리니엘라 종(Frankliniella spp.), 푸미보티스 종(Fumibotys spp.), 가에사 종(Gaesa spp.), 가스가르디아 종(Gasgardia spp.), 가스트로필루스 종(Gastrophilus spp.), 겔레치아 종(Gelechia spp.), 길피니아 종(Gilpinia spp.), 길피니아 폴리토마(Gilpinia polytoma), 글로시나 종(Glossina spp.), 글리피프테릭스 종(Glyphipterix spp.), 글리포데스 종(Glyphodes spp.), 그노리모쉐미니 종(Gnorimoschemini spp.), 고노돈타 종(Gonodonta spp.), 고르티나 종(Gortyna spp.), 그라실라리아 종(Gracillaria spp.), 그라파니아 종(Graphania spp.), 그라폴리타 종(Grapholita spp.), 글라폴리타 종(Grapholitha spp.), 그라비타르마타 종(Gravitarmata spp.), 그레체나 종(Gretchena spp.), 그리셀다 종(Griselda spp.), 그리올탈파 종(Gryllotalpa spp.), 기나에포라 종(Gynaephora spp.), 기소노마 종(Gypsonoma spp.), 하다 종(Hada spp.), 하에마토피루스 종(Haematopinus spp.), 할리시도타 종(Halisidota spp.), 하르피프테릭스 종(Harpipteryx spp.), 하리시나 종(Harrisina spp.), 헤디아 종(Hedya spp.), 헬리코베르파 종(Helicoverpa spp.), 헬리오포부스 종(Heliophobus spp.), 헬리오티스 종(Heliothis spp.), 헬룰라 종(Hellula spp.), 헬로트로파 종(Helotropa spp.), 헤마리스 종(Hemaris spp.), 헤르시노트립스 종(Hercinothrips spp.), 헤르쿨리아 종(Herculia spp.), 헤르모나사 종(Hermonassa spp.), 헤테로게네아 종(Heterogenea spp.), 홀로멜리나 종(Holomelina spp.), 호마다울라 종(Homadaula spp.), 호모에오소마 종(Homoeosoma spp.), 호모글라에아 종(Homoglaea spp.), 호모하데나 종(Homohadena spp.), 호모나 종(Homona spp.), 호모노프시스 종(Homonopsis spp.), 호플로캄파 종(Hoplocampa spp.), 호플로드리나 종(Hoplodrina spp.), 호시노아 종(Hoshinoa spp.), 흐크살로마 종(Hxalomma spp.), 히드라에시아 종(Hydraecia spp.), 히드리오메나 종(Hydriomena spp.), 힐레스 종(Hyles spp.), 힐로이쿠스 종(Hyloicus spp.), 히파기르티스 종(Hypagyrtis spp.), 히파티마 종(Hypatima spp.), 히판트리아 종(Hyphantria spp.), 히판트리아 쿠네아(Hyphantria cunea), 히포칼라 종(Hypocala spp.), 히포코에나 종(Hypocoena spp.), 히포데마 종(Hypodema spp.), 히포보스카 종(Hyppobosca spp.), 히프시필라 종(Hypsipyla spp.), 히시아 종(Hyssia spp.), 히스테로시아 종(Hysterosia spp.), 이다에아 종(Idaea spp.), 이디아 종(Idia spp.), 이피모르파 종(Ipimorpha spp.), 이시아 종(Isia spp.), 이소코리스타 종(Isochorista spp.), 이소프리크티스 종(Isophrictis spp.), 이소폴리아 종(Isopolia spp.), 이소트리아스 종(Isotrias spp.), 익소데스 종(Ixodes spp.), 이타메 종(Itame spp.), 조디아 종(Jodia spp.), 조디스 종(Jodis spp.), 카와베아 종(Kawabea spp.), 케이페리아 종(Keiferia spp.), 케이페리아 리코페르시켈라(Keiferia lycopersicella), 라브디아 종(Labdia spp.), 라시니폴리아 종(Lacinipolia spp.), 람브디나 종(Lambdina spp.), 람프로트리트파 종(Lamprothritpa spp.), 라오델팍스 종(Laodelphax spp.), 라시우스 종(Lasius spp.), 라스페이레시아 종(Laspeyresia spp.), 렙티노타르사 종(Leptinotarsa spp.), 렙티노타르사 데셈리네아타(Leptinotarsa decemlineata), 렙토코리사 종(Leptocorisa spp.), 렙토스탈레스 종(Leptostales spp.), 레카니움 종(Lecanium spp.), 레카니움 코미(Lecanium comi), 레피도사페스 종(Lepidosaphes spp.), 레피스마 종(Lepisma spp.), 레피스마 사카리나(Lepisma saccharina), 레스모네 종(Lesmone spp.), 류카니아 종(Leucania spp.), 류시노데스 종(Leucinodes spp.), 류코파에아 종(Leucophaea spp.), 류코파에아 마데라에(Leucophaea maderae), 류코프테라 종(Leucoptera spp.), 류코프테라 시텔라(Leucoptera scitella), 리노그나투스 종(Linognathus spp.), 리포스셀리스 종(Liposcelis spp.), 리소르호프트루스 종(Lissorhoptrus spp.), 리타코디아 종(Lithacodia spp.), 리토콜레티스 종(Lithocolletis spp.), 리토모이아 종(Lithomoia spp.), 리토파네 종(Lithophane spp.), 릭소데사 종(Lixodessa spp.), 로베시아 종(Lobesia spp.), 로베시아 보트라나(Lobesia botrana), 로보포라 종(Lobophora spp.), 로쿠스타 종(Locusta spp.), 로마날테스 종(Lomanaltes spp.), 로모그라파 종(Lomographa spp.), 록사그로티스 종(Loxagrotis spp.), 록소스테게 종(Loxostege spp.), 루실리아 종(Lucilia spp.), 리만트리아 종(Lymantria spp.), 림나에시아 종(Lymnaecia spp.), 리오네티아 종(Lyonetia spp.), 리리오미자 종(Lyriomyza spp.), 마크도노우기아 종(Macdonnoughia spp.), 마크라우자타 종(Macrauzata spp.), 마크로녹투아 종(Macronoctua spp.), 마크로시푸스 종(Macrosiphus spp.), 말라코소마 종(Malacosoma spp.), 말리아르파 종(Maliarpha spp.), 마메스트라 종(Mamestra spp.), 마메스트라 브라시카에(Mamestra brassicae), 만두카 종(Manduca spp.), 만두카 섹스타(Manduca sexta), 마라스미아 종(Marasmia spp.), 마르가리티아 종(Margaritia spp.), 마트라티네아 종(Matratinea spp.), 마트수무라에세스 종(Matsumuraeses spp.), 멜라나그로미자 종(Melanagromyza spp.), 멜리포테스 종(Melipotes spp.), 멜리소푸스 종(Melissopus spp.), 멜리티아 종(Melittia spp.), 멜로론타 종(Melolontha spp.), 메리스티스 종(Meristis spp.), 메리타스티스 종(Meritastis spp.), 메로파스 종(Merophyas spp.), 메사파메아 종(Mesapamea spp.), 메소고나 종(Mesogona spp.), 메소류카 종(Mesoleuca spp.), 메타네마 종(Metanema

spp.), 메텐도테니아 종(Metendothenia spp.), 메츠네리아 종(Metzneria spp.), 미카르디아 종(Micardia spp.), 미크로코르세스 종(Microcorses spp.), 미크롤레온 종(Microleon spp.), 메시크테나 종(Mnesictena spp.), 모시스 종(Mocis spp.), 모니마 종(Monima spp.), 모노크로아 종(Monochroa spp.), 모노모리움 종(Monomorium spp.), 모노모리움 파라오니스(Monomorium pharaonis), 모노프시스 종(Monopsis spp.), 모리소니아 종(Morrisonia spp.), 무스카 종(Musca spp.), 무투라이아 종(Mutuuraia spp.), 미엘로시스 종(Myelois spp.), 미팀나 종(Mythimna spp.), 미주스 종(Myzus spp.), 나란가 종(Naranga spp.), 네드라 종(Nedra spp.), 네마포곤 종(Nemapogon spp.), 네오디프리온 종(Neodiprion spp.), 네오스파레로프테라 종(Neosphaleroptera spp.), 네펠로데스 종(Nephelodes spp.), 네포테틱스 종(Nephotettix spp.), 네자라 종(Nezara spp.), 닐라파르바타 종(Nilaparvata spp.), 니폰님파 종(Niphonympha spp.), 니포프틸라 종(Nippoptilia spp.), 녹투아 종(Noctua spp.), 놀라 종(Nola spp.), 노토셀리아 종(Notocelia spp.), 노토돈타 종(Notodonta spp.), 누다우렐리아 종(Nudaurelia spp.), 오크로플레우라 종(Ochropleura spp.), 오크네로스토마 종(Ocnerostoma spp.), 오에스트루스 종(Oestrus spp.), 올레트레우테스 종(Olethreutes spp.), 올리기아 종(Oligia spp.), 올린디아 종(Olindia spp.), 올리고니쿠스 종(Olygonychus spp.), 올리고니쿠스 갈리나에(Olygonychus gallinae), 온코네미스 종(Oncocnemis spp.), 오페로프테라 종(Operophtera spp.), 오피스마 종(Ophisma spp.), 오포고나 종(Opogona spp.), 오라에시아 종(Oraesia spp.), 오르니오도로스 종(Orniodoros spp.), 오르기이아 종(Orgyia spp.), 오리아 종(Oria spp.), 오르세올리아 종(Orseolia spp.), 오르토데스 종(Orthodes spp.), 오르토고니아 종(Orthogonia spp.), 오르토시아 종(Orthosia spp.), 오리자에필루스 종(Oryzaephilus spp.), 오스키넬라 종(Oscinella spp.), 오스키넬라 프리트(Oscinella frit), 오스미니아 종(Osminia spp.), 오스트리니아 종(Ostrinia spp.), 오스트리니아 누빌라리스(Ostrinia nubilalis), 오티오린쿠스 종(Otiorhynchus spp.), 오우라프테릭스 종(Ourapteryx spp.), 파체트라 종(Pachetra spp.), 파키스핀크스 종(Pachysphinx spp.), 파기다 종(Pagyda spp.), 팔레아크리타 종(Paleacrita spp.), 팔리가 종(Paliga spp.), 팔티스 종(Palthis spp.), 파메네 종(Pammene spp.), 판데미스 종(Pandemis spp.), 파네메리아 종(Panemeria spp.), 파놀리스 종(Panolis spp.), 파놀리스 플라메아(Panolis flammea), 파노니쿠스 종(Panonychus spp.), 파라르기레스티아 종(Parargyresthia spp.), 파라디아르시아 종(Paradiarsia spp.), 파라로베시아 종(Paralobesia spp.), 파란트레네 종(Paranthrene spp.), 파라판데미스 종(Parapandemis spp.), 파라페디아시아 종(Parapediasia spp.), 파라스티크티스 종(Parastichtis spp.), 파라신데미스 종(Parasyndemis spp.), 파라토리아 종(Paratoria spp.), 파레로메메 종(Parerommeme spp.), 페크티노포라 종(Pectinophora spp.), 페크티노포라 고시피엘라(Pectinophora gossypiella), 페디쿨루스 종(Pediculus spp.), 페고미이아 종(Pegomyia spp.), 페고미이아 히오스키아미(Pegomyia hyoscyami), 펠로크리스타 종(Pelochrista spp.), 페니세티아 종(Pennisetia spp.), 펜스테모니아 종(Penstemonia spp.), 펨피구스 종(Pemphigus spp.), 페리바토데스 종(Peribatodes spp.), 페리드로마 종(Peridroma spp.), 페리레우코프테라 종(Perileucoptera spp.), 페리플라네타 종(Periplaneta spp.), 페리조마 종(Perizoma spp.), 페트로바 종(Petrova spp.), 펙시코피아 종(Pexicopia spp.), 팔로니아 종(Phalonia spp.), 팔로니디아 종(Phalonidia spp.), 파네타 종(Phaneta spp.), 플리크타에니아 종(Phlyctaenia spp.), 필리크티누스 종(Phlyctinus spp.), 포르비아 종(Phorbia spp.), 프라그마토비아 종(Phragmatobia spp.), 프리칸테스 종(Phricanthes spp.), 프토리마에아 종(Phthorimaea spp.), 프토리마에아 오페르쿨레라(Phthorimaea operculella), 필로크니스티스 종(Phyllocnistis spp.), 필로코프트루타 종(Phyllocoptruta spp.), 필로코프트루타 올레이보라(Phyllocoptruta oleivora), 필로노리크터 종(Phyllonorycter spp.), 필로필라 종(Phyllophila spp.), 필록세라 종(Phylloxera spp.), 피에리스 종(Pieris spp.), 피에리스 라파에(Pieris rapae), 피에스마 종(Piesma spp.), 프라노코쿠스 종(Planococus spp.), 플라노토르트릭스 종(Planotortrix spp.), 플라티에드라(Platyedra spp.), 플라티노타 종(Platynota spp.), 플라티프틸리아 종(Platyptilia spp.), 플라티센타 종(Platysenta spp.), 플로디아 종(Plodia spp.), 플루시아 종(Plusia spp.), 플루텔라 종(Plutella spp.), 플루텔라 크실로스텔라(Plutella xylostella), 포도세시아 종(Podosesia spp.), 폴리아 종(Polia spp.), 포필리아 종(Popillia spp.), 폴리믹시스 종(Polymixis spp.), 폴리파고타르소네무스 종(Polyphagotarsonemus spp.), 폴리파고타르소네무스 라투스(Polyphagotarsonemus latus), 프라이스 종(Prays spp.), 프리오녹시스투스 종(Prionoxystus spp.), 프로볼레 종(Probole spp.), 프로세라스 종(Proceras spp.), 프로코에로데스 종(Prochoerodes spp.), 프로에울리아 종(Proeulia spp.), 프로스키스티스 종(Proschistis spp.), 프로셀레나 종(Proselena spp.), 프로세르피누스 종(Proserpinus spp.), 프로타그로티스 종(Protagrotis spp.), 프로테오테라스 종(Proteoteras spp.), 프로토바트라 종(Protobathra spp.), 프로토스키니아 종(Protoschinia spp.), 프셀노포루스 종(Pselnophorus spp.), 슈달레티아 종(Pseudaletia spp.), 슈단토노무스 종(Pseudanthonomus spp.), 슈다테

르넬리아 종(Pseudaternelia spp.), 슈다울라카스피스 종(Pseudaulacaspis spp.), 슈덱센테라 종(Pseudexentera spp.), 슈도코쿠스 종(Pseudococus spp.), 슈도헤르메니아스 종(Pseudohermenias spp.), 슈도플루시아 종(Pseudoplusia spp.), 프소르프테스 종(Psoroptes spp.), 프실라 종(Psylla spp.), 프실리도데스 종(Psylliodes spp.), 프테로포루스 종(Pterophorus spp.), 프티콜로마 종(Ptycholoma spp.), 풀비나리아 종(Pulvinaria spp.), 풀비나리아 아에티오피카(Pulvinaria aethiopica), 피랄리스 종(Pyralis spp.), 피라우스타 종(Pyrausta spp.), 피르고티스 종(Pyrgotis spp.), 필레페라 종(Pyrreferra spp.), 피라르크티아 종(Pyrrharctia spp.), 퀴드라스피디오투스 종(Quadraspidiotus spp.), 란코라 종(Rancora spp.), 라피아 종(Raphia spp.), 레티쿨테르메스 종(Reticultermes spp.), 레티니아 종(Retinia spp.), 라골레티스 종(Rhagoletis spp), 라골레티스 포모넬라(Rhagoletis pomo-nella), 리피세팔루스 종(Rhipicephalus spp.), 리조글리푸스 종(Rhizoglyphus spp.), 리조페르타 종(Rhizopertha spp.), 로드니우스 종(Rhodnius spp.), 로팔로시품 종(Rhophalosiphum spp.), 로포보타 종(Rhopobota spp.), 리아시아 종(Rhyacia spp.), 리아시오니아 종(Rhyacionia spp.), 린코파카 종(Rhynchopacha spp.), 리조테네스 종(Rhyzosthenes spp.), 리불라 종(Rivula spp.), 론도티아 종(Rondotia spp.), 루시드리나 종(Rusidrina spp.), 린차글라에아 종(Rynchaglaea spp.), 사불로데스 종(Sabulodes spp.), 살베르겔라 종(Sahlbergella spp.), 살베르겔라 싱귤라리스(Sahlbergella singularis), 사이세티아 종(Saissetia spp.), 사미아 종(Samia spp.), 사니나 종(Sannina spp.), 사니노이데아 종(Sanninoidea spp.), 사포이데우스 종(Saphoideus spp.), 사르코프테스 종(Sarcoptes spp.), 사트로브로타 종(Sathrobrota spp.), 스카라베이다에(Scarabeidae), 스켈리오데스 종(Sceliodes spp.), 시니아 종(Schinia spp.), 시스토세르카 종(Schistocerca spp.), 시자피스 종(Schizaphis spp.), 시주라 종(Schizura spp.), 슈레켄스테이니아 종(Schreckensteinia spp.), 시라라 종(Sciara spp.), 시르포파가 종(Scirpophaga spp.), 시르트리프스 아우란티(Scirthrips auranti), 스코파리아 종(Scoparia spp.), 스코풀라 종(Scopula spp.), 스코티아 종(Scotia spp.), 스코티노파라 종(Scotinophara spp.), 스코토그라마 종(Scotogramma spp.), 스크로비팔파 종(Scrobipalpa spp.), 스크로비팔포프시스 종(Scrobipalpopsis spp.), 세미오티사 종(Semiothisa spp.), 세레다 종(Sereda spp.), 세사미아 종(Sesamia spp.), 세시아 종(Sesia spp.), 시크야 종(Sicya spp.), 시데리디스 종(Sideridis spp.), 시미라 종(Simyra spp.), 시네우그라페 종(Sineugraphe spp.), 시토크로아 종(Sitochroa spp.), 시토비온 종(Sitobion spp.), 시토필루스 종(Sitophilus spp.), 시토트로가 종(Sitotroga spp.), 솔레노프시스 종(Solenopsis spp.), 스메린투스 종(Smerinthus spp.), 소프로니아 종(Sophronia spp.), 스파엘로티스 종(Spaelotis spp.), 스파르갈로마 종(Spargaloma spp.), 스파르가노티스 종스파르가노티스 종(Sparganothis spp.), 스파탈리스티스 종(Spatalistis spp.), 스페르치아 종(Sperchia spp.), 스페시아 종(Sphecia spp.), 스핀크스 종(Sphinx spp.), 스필로노타 종(Spilonota spp.), 스포돕테라 종(Spodoptera spp.), 스포독테라 리토랄리스(Spodoptera littoralis), 스타그마토포라 종(Stagmatophora spp.), 스타필리노크로우스 종(Staphylinochrous spp.), 스타트모포다 종(Stathmopoda spp.), 스테노데스 종(Stenodes spp.), 스테라 종(Sterrha spp.), 스토목시스 종(Stomoxis spp.), 스트로페드라 종(Strophedra spp.), 수니라 종(Sunira spp.), 수티나 종(Sutyna spp.), 스와머다미아 종(Swammerdamia spp.), 실로마티아 종(Syllomatia spp.), 심피스티스 종(Sympistis spp.), 시난테돈 종(Synanthedon spp.), 시낙시스 종(Synaxis spp.), 신코파크마 종(Syncopacma spp.), 신데미스 종(Syndemis spp.), 신그라파 종(Syngrapha spp.), 신토메이다 종(Synthomeida spp.), 타바누스 종(Tabanus spp.), 타에니아르치스 종(Taeniarchis spp.), 타에니오트리프스 종(Taeniothrips spp.), 타니아 종(Tannia spp.), 타르소네무스 종(Tarsonemus spp.), 테굴리페라 종(Tegulifera spp.), 테하마 종(Tehama spp.), 텔레이오데스 종(Teleiodes spp.), 텔로르타 종(Telorta spp.), 테네브리오 종(Tenebrio spp.), 테프리나 종(Tephrina spp.), 테라토그라에아 종(Teratoglaea spp.), 테리쿨라 종(Terricula spp.), 테테아 종(Tethea spp.), 테트라니쿠스 종(Tetranychus spp.), 탈포필라 종(Thalpophila spp.), 타우메토포에아 종(Thaumetopoea spp.), 티오디아 종(Thiodia spp.), 트리프스 종(Thrips spp.), 트리프스 팔미(Thrips palmi), 트리프스 타바키(Thrips tabaci), 티리도프테릭스 종(Thyridopteryx spp.), 티리스 종(Thyris spp.), 티네올라 종(Tineola spp.), 티풀라 종(Tipula spp.), 토르트리시디아 종(Tortricidia spp.), 토르트릭스 종(Tortrix spp.), 트라체아 종(Trachea spp.), 트리아류로데스 종(trialeurodes spp.), 트리아류로데스 바포라리오룸(trialeurodes vaporariorum), 트리아토마 종(triatoma spp.), 트리악소메라 종(triaxomera spp.), 트리볼리움 종(tribolium spp.), 트리코데크테스(tricodectes spp.), 트리초플루시아 종(trichoplusia spp.), 트리초플루시아 니(trichoplusia ni), 트리초프틸루스 종(trichoptilus spp.), 트리오자 종(trioza spp.), 트리오자 에리트레아에(trioza erytreae), 트리파에니아 종(triphaenia spp.), 트리포사 종(triphosa spp.), 트로고데르마 종(Trogoderma spp.), 티리아 종(Tyria spp.), 우데아 종(Udea spp.), 우나스피스 종(Unaspis spp.), 우나스피스 시트리(Unaspis citri), 우테테이사 종(Utetheisa spp.),

발레리오데스 종(Valeriodes spp.), 베스파 종(Vespa spp.), 베스파미마 종(Vespamima spp.), 비타세아 종(Vitacea spp.), 비툴라 종(Vitula spp.), 위틀레시아 종(Witlesia spp.), 크산티아 종(Xanthia spp.), 크산토르로에(Xanthorhoe spp.), 크산토티페 종(Xanthotype spp.), 제노미크타 종(Xenomicta spp.), 제노프실라 종(Xenopsylla spp.), 제노프실라 체노프시스(Xenopsylla cheopsis), 제스티아 종(Xestia spp.), (Xylena spp.), 크실로미게스 종(Xylomyges spp.), 크시로사리스 종(Xyrosaris spp.), 이포노뮤타 종(Yponomeuta spp.), 이프솔로파 종(Ypsolopha spp.), 잘레 종(Zale spp.), 잔클로그나투스 종(Zanclognathus spp.), 제이라페라 종(Zeiraphera spp.), 제노독수스 종(Zenodoxus spp.), 제우제라 종(Zeuzera spp.), 지가에나 종(Zygaena spp.).

[0119] 본 발명에 따른 화합물을 사용하여 선충류의 해충을 또한 방제할 수 있다. 이러한 해충에는 뿌리혹 선충, 포낭형성 선충 및 또한 줄기 및 잎 선충; 특히 헤테로데라 종(Heterodera spp.), 예를 들어, 헤테로데라 샤크티(Heterodera schachtii), 헤테로데라 아베나에(Heterodera avenae) 및 헤테로데라 트리폴리(Heterodera trifolii); 글로보데라 종(Globodera spp.), (예를 들어, 글로보데라 로스토키엔시스(Globodera rostochiensis); 멜로이도기네 종(Meloidogyne spp.), (예를 들어, 멜로이도기네 인코그니타(Meloidogyne incognita) 및 멜로이도기네 자바니카(Meloidogyne javanica); 라도폴루스 종(Radopholus spp.), (예를 들어, 라도폴루스 시밀리스(Radopholus similis); 프라틸렌쿠스(Pratylenchus), 예를 들어, 프라틸렌쿠스 네글렉탄스(Pratylenchus neglectans) 및 프라틸렌쿠스 페네트란스(Pratylenchus penetrans); 틸렌쿨루스(Tylenchulus), 예를 들어, 틸렌쿨루스 세미페네트란스(Tylenchulus semipenetrans); 롱기도루스(Longidorus), 트리코도루스(Trichodorus), 크시피네마(Xiphinema), 디틸렌쿠스(Ditylenchus), 아핀코이데스(Apheenchoides) 및 안구이나(Anguina), 특히 멜로이도기네, 예를 들어, 멜로이도기네 인코그니타 및 헤테로데라, 예를 들어, 헤테로데라 글리시네스(Heterodera glycines)가 포함된다.

[0120] 본 발명의 특히 중요한 양상은 섭식 기생충으로부터 식물을 보호하는데 있어 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물의 용도이다.

[0121] 본 발명에 따른 화합물 및 이를 포함하는 조성물의 동물 해충에 대한 작용은 상당히 광범위화될 수 있으며 기타 살충제, 살비제 또는 살선충제를 첨가하여 주어진 환경에 맞게 적용시킬 수 있다. 적합한 첨가제의 예에는 대표적으로 다음의 활성 성분 부류가 포함된다: 유기인계 화합물, 니트로페놀 및 유도체, 포름아미딘, 우레아, 카바메이트, 피레트로이드, 염소화된 탄화수소, 네오니코티노이드 및 바실러스 튜린지엔시스(*Bacillus thuringiensis*) 제제.

[0122] 특히 적합한 혼합 파트너의 예에는, 아자메티포스; 클로르펜빈포스; 사이퍼메트린, 사이퍼메트린, 고-시스; 사이로마진; 디아펜티우론; 디아지논; 디클로르보스; 디크로토포스; 디사이클라닐; 페녹시카브; 플루아주론; 푸라티오카브; 이사조포스; 이오드펜포스; 키노프렌; 루페누론; 메타크리포스; 메티다티온; 모노크로토소프; 포스파미돈; 프로페노포스; 디페놀란; 바실러스 튜린지엔시스 균주 GC91 또는 균주 NCTC11821으로부터 수득될 수 있는 화합물; 피메트로진; 브로모프로필레이트; 메토프렌; 디설포톤; 퀴날포스; 타우플루발리네이트; 티오사이클람; 티오메톤; 알디카브; 아진포스-메틸; 벤푸라카브; 비펜트린; 부프로페진; 카보푸란; 디부틸아미노티오; 카타프; 클로르플루아주론; 클로르피리포스; 클로티아니딘; 사이플루트린; 람다-사이할로트린; 알파-사이퍼메트린; 제타-사이퍼메트린; 델타메트린; 디플루벤주론; 엔도설푸란; 에티오펜카브; 페니트로티온; 페노부카브; 펜발러레이트; 포르모티온; 메티오카브; 헵테노포스; 이미다클로프리드; 이소프로카브; 메타미도포스; 메토밀; 메빈포스; 파라티온; 파라티온-메틸; 포살론; 피리미카브; 프로폭수르; 테플루벤주론; 테르부포스; 트리아자메이트; 페노부카브; 테부페노자이드; 피프로닐; 벤타-사이플루트린; 실라플루오펜; 펜피록시메이트; 피리다벤; 피리달릴; 펜아자퀸; 피리프록시펜; 피리미디펜; 니텐피람; 아세타미프리드; 에마멕틴; 에마멕틴 벤조에이트; 스피노사드; 곤충에 대해 활성인 식물 추출물; 선충류를 포함하며 곤충에 대해 활성인 제제; 바실러스 서브틸리스로부터 수득되는 제제; 진균류를 포함하고 곤충에 대해 활성인 제제; 바이러스를 포함하고 곤충에 대해 활성인 제제; 아바멕틴; 클로로페나피르; 아세페이트; 아크리나트린; 알라니카브; 알파메트린; 아미트라즈; AZ 60541; 아진포스 A; 아진포스 M; 아조사이클로틴; 벤디오카브; 벤설타프; 베타-시프루트린; BPMC; 브로펜폭스; 브로모포스 A; 부펜카브; 부토카복심; 부틸피리다벤; 카두사포스; 카브아릴; 카보페노티온; 클로에토카브; 클로르에톡시포스; 클로르메포스; 시스-레스메트린; 클로시트린; 클로펜테진; 시아노포스; 사이클로프로트린; 시헥사틴; 데메톤 M; 데메톤 S; 데메톤-S-메틸; 디클로로펜티온; 디클리포스; 디에티온; 디메토에이트; 디메틸빈포스; 디옥사티온; 에디펜포스; 에스펜발레레이트; 에티온; 에토펜프록스; 에토프로포스; 에트림포스; 페나미포스; 펜부타틴 옥사이드; 페노티오카브; 펜프로파트린; 펜피라드; 펜티온; 플루아지남; 플루사이클록수론; 플루사이트리네이트; 플루페녹수론; 플루펜프록스; 포노포스; 포스티아제이트; 푸브펜프록스; HCH; 헥사플루무론; 헥시티아족스; IKI-

220; 이프로벤포스; 이소펜포스; 이속사티온; 이베르멕틴; 말라티온; 메카르밤; 메설펜포스; 메트알데히드; 메톨카브; 밀베멕틴; 목시덱틴; 날레드; NC 184; 니티아진; 오메토에이트; 옥사밀; 옥시데메톤 M; 옥세데프로포스; 퍼메트린; 펜토에이트; 포레이트; 포스메트; 폭심; 피리미포스 M; 피리미포스 E; 프로메카브; 프로파포스; 프로티오포스; 프로토에이트; 피라클로포스; 피라다펜티온; 피레스메트린; 피레트럼; 테부페노지드; 살리티온; 세부포스; 설포텝; 설프로포스; 테부펜피라드; 테부피림포스; 테플루트린; 테메포스; 테르밤; 테트라클로르빈포스; 티아클로프리드; 티아페녹스; 티아메톡삼; 티오디카브; 티오파녹스; 티오나진; 투린지엔신; 트랄로메트린; 트리아르텐; 트리아조포스; 트리아주론; 트리클로르폰; 트리플루무론; 트리메타카브; 바미도티온; 크실릴카브; YI 5301/5302; 제타메트린; DPX-MP062-인독사카브; 메톡시페노지드; 비페나제이트; XMC(3,5-크실릴 메타카바메이트); 또는 진균 병원체 메타리지움 아니소플리아에가 포함된다.

[0123] 본 발명에 따른 화합물은 식물, 특히 농업, 원예업 및 임업에 유용한 식물 및 관상용 식물 또는 이러한 식물의 과실, 꽃, 잎, 줄기, 괴경 또는 뿌리와 같은 부분에서 발생하는 상기한 유형의 해충을 방제, 즉 억제하거나 파괴할 수 있으며, 일부 경우에는 이후에 성장하는 식물 부분을 이들 해충으로부터 보호할 수 있다.

[0124] 표적 작물에는 특히, 곡류(예: 밀, 보리, 호밀, 귀리, 쌀, 옥수수 및 사탕수수), 사탕무(예: 사탕무 및 사료 사탕무), 과실(예: 이과(梨科), 핵과(核果) 및 연과(軟科), 예를 들어, 사과, 배, 플럼, 복숭아, 아몬드, 체리 및 딸기, 예를 들어, 스트로베리, 라즈베리 및 블랙베리), 콩과 식물(예: 콩, 렌즈콩, 완두콩 및 대두), 오일 식물(예: 평지, 머스타드, 양귀비, 올리브, 해바라기, 코코넛, 피마자유, 코코아 및 땅콩), 박과 식물(예: 서양 호박, 오이 및 멜론), 섬유 식물(예: 면, 아마, 대마 및 황마), 감귤류(예: 오렌지, 레몬, 그레이프푸루트 및 만다린), 야채류(예: 시금치, 양상추, 아스파라거스, 양배추, 당근, 양파, 토마토, 감자 및 파프리카), 녹나무과(예: 아보카도, 계피 및 장뇌) 및 담배, 견과류, 커피, 가지, 사탕수수, 차, 후추, 덩굴식물, 홉, 바나나 및 천연 고무 식물 및 관상용 식물이 포함된다.

[0125] 본 발명에 따른 화합물의 추가의 사용 분야는 저장된 물품과 저장소의 보호 및 원료의 보호 및 또한 위생학 분야, 특히 상기한 유형의 해충으로부터 가축 및 생산성 가축의 보호, 보다 특히 벼룩, 진드기 및 선충류에 의한 감염으로부터 애완동물, 특히 고양이 및 개의 보호이다.

[0126] 따라서, 본 발명은 또한 본 발명에 따른 화합물 하나 이상을 포함하고 의도하는 목적 및 주된 환경에 따라 제형을 선택하는 유화성 농축액, 현탁 농축액, 직접 분무가능하거나 희석가능한 용액, 확전성 페이스트, 희석 에멀젼, 습윤성 분말, 가용성 분말, 분산성 분말, 습윤성 분말, 분제, 과립 및 중합체성 물질의 캡슐 형태인 살충 조성물에 관한 것이다.

[0127] 활성 성분은 당해 조성물 중에서, 예를 들어 특정 입자 크기의 순수한 형태의 고체 활성 성분으로 사용되거나, 바람직하게는 제형 기술에서 통상적인 하나 이상의 보조제, 예를 들어 증량제(예: 용매 또는 고체 담체) 또는 계면활성 화합물(계면활성제)과 함께 사용된다. 사람, 가축, 생산성 가축 및 애완 동물의 기생충 방제 분야에서, 생리학적으로 허용될 수 있는 첨가제만이 사용되는 것이 자명할 것이다.

[0128] 용매에는 예를 들어, 비수소화된 또는 부분적으로 수소화된 방향족 탄화수소, 바람직하게는 알킬벤젠의 C_8 내지 C_{12} 부분(예: 크실렌 혼합물), 알킬화된 나프탈렌 또는 테트라하이드로나프탈렌, 지방족 또는 지환족 탄화수소(예: 파라핀) 또는 사이클로헥산, 알콜(예: 에탄올, 프로판올 또는 부탄올), 글리콜과 이의 에테르 및 에스테르(예: 프로필렌 글리콜, 디프로필렌 글리콜 에테르, 에틸렌 글리콜 또는 에틸렌 글리콜 모노메틸 에테르 또는 에틸렌 글리콜 모노에틸 에테르), 케톤(예: 사이클로헥사논, 이소포론 또는 디아세톤 알콜), 강한 극성 용매(예: N-메틸-피롤리드-2-온, 디메틸 설폭시드 또는 N,N-디메틸포름아미드), 물, 비에폭시화 또는 에폭시화 식물 오일(예: 비에폭시화 또는 에폭시화 평지유, 피마자유, 코코넛유 또는 대두유) 및 실리콘 오일이 있다.

[0129] 예를 들어, 분제 및 분산성 분말용으로 사용되는 고체 담체는 일반적으로 천연 암석 분말, 예를 들어, 방해석, 활석, 카올린, 몬트모릴로나이트 또는 애타풀자이트이다. 물리적 특성을 개선시키기 위해, 고분산 실리카 또는 고분산 흡착성 중합체를 첨가할 수도 있다. 과립상의 흡착성 과립 담체는 다공질 형태, 예를 들어, 부석, 분쇄된 벽돌, 세피올라이트 또는 벤토나이트이며, 비흡착성 담체 물질은 방해석 또는 모래이다. 또한, 무기 또는 유기 성질의 다수의 과립상 물질, 특히 백운석 또는 분쇄된 식물 잔사를 사용할 수 있다.

[0130] 계면활성 화합물은 제형화하고자 하는 화합물의 성질에 따라서, 우수한 유화, 분산 및 습윤화 특성을 갖는 비이온성, 양이온성 및/또는 음이온성 계면활성제 또는 계면활성제 혼합물이다. 하기에 기재한 계면활성제는 단지 예로서 고려되며, 제형 기술에서 통상적이고 본 발명에 따라서 적합한 보다 많은 계면활성제는 관련 문헌에 기재되어 있다.

[0131] 비이온성 계면활성제는, 특히 (지방족) 탄화수소 라디칼내에 3개 내지 30개의 글리콜 에테르 그룹 및 8개 내지 20개의 탄소원자를 함유할 수 있고 알킬페놀의 알킬 라디칼내에 6개 내지 18개의 탄소원자를 함유할 수 있는, 지방족 또는 지환족 알콜 또는 포화 또는 불포화 지방산과 알킬페놀의 폴리글리콜 에테르 유도체이다. 또한 적합한 물질은 알킬 쇄내에 1개 내지 10개의 탄소를 갖는 프로필렌 글리콜, 에틸렌디아미노폴리프로필렌 글리콜 및 알킬폴리프로필렌 글리콜상에 20개 내지 250개의 에틸렌 글리콜 에테르 및 10개 내지 100개의 프로필렌 글리콜 에테르 그룹을 함유하는 수용성 폴리에틸렌 옥사이드 부가물이다. 상기한 화합물은 통상적으로 프로필렌 글리콜 단위당 1개 내지 5개의 에틸렌 글리콜을 함유한다. 예로는 노닐페놀폴리에톡시에탄올, 피마자유 폴리글리콜 에테르, 폴리프로필렌-폴리에틸렌 옥사이드 부가물, 트리부틸페녹시폴리에톡시에탄올, 폴리에틸렌 글리콜 및 옥틸페녹시폴리에톡시에탄올이 있다. 기타 물질로는 폴리옥시에틸렌 소르비탄의 지방산 에스테르, 예를 들어, 폴리옥시에틸렌 소르비탄 트리올레이트가 있다.

[0132] 양이온성 계면활성제는 특히, 치환체로서 탄소수 8 내지 22의 알킬 라디칼 하나 이상을 함유하며 추가의 치환체로서 비할로겐화 또는 할로겐화 저급 알킬, 벤질 또는 저급 하이드록시알킬 라디칼을 갖는 4급 암모늄 염이다. 염은 바람직하게는 할라이드, 메틸설페이트 또는 에틸설페이트 형태이다. 예로는 스테아릴-트리메틸-암모늄 클로라이드 및 벤질-디(2-클로로에틸)-에틸-암모늄 브로마이드가 있다.

[0133] 적합한 음이온성 계면활성제는 수용성 비누 및 수용성 합성 계면활성 화합물 둘다일 수 있다. 적합한 비누는 알칼리 금속 염, 알칼리 토금속 염 및 고급 지방산 (C_{10}-C_{22})의 비치환되거나 치환된 암모늄 염, 예를 들어, 올레산 또는 스테아르산 또는 코코넛유 또는 톨유로부터 수득될 수 있는 천연 지방산 혼합물의 나트륨 또는 칼륨 염이며, 또한 지방산 메틸-타우린 염이다. 그러나, 합성 계면활성제, 특히 지방 설포네이트, 지방 설페이트, 설포화된 벤즈이미다졸 유도체 또는 알킬아릴설포네이트가 보다 흔히 사용된다. 원칙적으로, 지방 설포네이트 및 지방 설페이트는 알칼리 금속 염, 알칼리 토금속 염 또는 비치환되거나 치환된 암모늄 염으로서 존재하며, 일반적으로 탄소수 8 내지 22의 알킬 라디칼을 가지며, 알킬은 또한 아실 라디칼의 알킬 잔기를 포함한다; 예로는 리그노설폰산, 도데실황산 에스테르 또는 천연 지방산으로부터 제조된 지방 알콜 설페이트의 나트륨 또는 칼슘 염이다. 이는 또한 지방 알콜-에틸렌 옥사이드 부가물의 황산 에스테르 및 설폰산의 염을 포함한다. 설폰화된 벤즈이미다졸 유도체는 바람직하게는 2개의 설폰산 그룹 및 약 8개 내지 22개의 C 원자를 갖는 1개의 지방산 라디칼을 함유한다. 알킬아릴설포네이트에는 예를 들어, 도데실벤젠설폰산, 디부틸나프탈렌설폰산 또는 나프탈렌설폰산-포름 알데히드 축합 생성물의 나트륨, 칼슘 또는 트리에탄올암모늄 염이 있다. 상응하는 포스페이트, 예를 들어, p-노닐페놀-(4-14)-에틸렌 옥사이드 부가물의 염 또는 인지질을 또한 사용할 수 있다.

[0134] 원칙적으로, 당해 조성물은 활성 성분 0.1 내지 99%, 특히 0.1 내지 95% 및 하나 이상의 고체 또는 액체 보조제 1 내지 99.9%, 특히 5 내지 99.9%를 포함하며, 원칙적으로 조성물의 0 내지 25%, 특히 0.1 내지 20%(%는 각 경우에 중량%이다)는 계면활성제일 수 있다. 농축 조성물이 시판용 제품으로서 보다 바람직하지만, 최종 소비자는 원칙적으로 상당히 저농도의 활성 성분을 갖는 희석 조성물을 사용한다. 바람직한 조성물은 다음 범위내에서 성분들을 포함한다(%=중량%):

[0135] <u>유화성 농축액:</u>

[0136] 활성 성분: 1 내지 90%, 바람직하게는 5 내지 20%

[0137] 계면활성제: 1 내지 30%, 바람직하게는 10 내지 20%

[0138] 용매: 5 내지 98%, 바람직하게는 70 내지 85%

[0139] <u>분제:</u>

[0140] 활성 성분: 0.1 내지 10%, 바람직하게는 0.1 내지 1%

[0141] 고체 담체: 99.9 내지 90%, 바람직하게는 99.9 내지 99%

[0142] <u>현탁 농축액:</u>

[0143] 활성 성분: 5 내지 75%, 바람직하게는 10 내지 50%

[0144] 물: 94 내지 24%, 바람직하게는 88 내지 30%

[0145] 계면활성제: 1 내지 40%, 바람직하게는 2 내지 30%

[0146] 습윤성 분말:

[0147] 활성 성분: 0.5 내지 90%, 바람직하게는 1 내지 80%

[0148] 계면활성제: 0.5 내지 20%, 바람직하게는 1 내지 15%

[0149] 고체 담체: 5 내지 99%, 바람직하게는 15 내지 98%

[0150] 과립:

[0151] 활성 성분: 0.5 내지 30%, 바람직하게는 3 내지 15%

[0152] 고체 담체: 99.5 내지 70%, 바람직하게는 97 내지 85%

[0153] 본 발명에 따른 조성물은 또한 추가의 고체 또는 액체 보조제, 예를 들어, 안정화제, 예를 들어, 식물성 오일 또는 에폭시화 식물성 오일(예: 에폭시화 코코넛유, 평지씨유 또는 대두유), 소포제(예: 실리콘 오일, 방부제, 점도 조절제, 결합제 및/또는 증점제), 및 비료 또는 특정 효과를 수득하기 위한 기타 활성 성분(예: 살진드기제, 살세균제, 살진균제, 살선충제, 살연체동물제(molluscicide) 또는 선택적 제초제)을 포함할 수 있다.

[0154] 본 발명에 따른 작물 보호 생성물은 보조제의 부재하에, 예를 들어 고체 활성 성분 또는 활성 성분의 혼합물을 분쇄 및/또는 스크리닝하여 예를 들어 특정한 입자 크기를 수득하는 공지된 방식 및 하나 이상의 보조제의 존재하에, 활성 성분 또는 활성 성분 혼합물을 보조제(들)과 친밀하게 혼합 및/또는 분쇄하는 공지된 방식으로 제조한다. 본 발명은 마찬가지로 본 발명에 따른 조성물의 제조방법 및 이러한 조성물의 제조시 화학식 I의 화합물의 용도에 관한 것이다.

[0155] 본 발명은 또한 작물 보호 생성물의 적용 방법, 즉 의도하는 목적 및 주된 환경에 따라서 선택되는 분사, 분무, 분진화, 드레싱, 살포 또는 따르기와 같은 언급한 유형의 해충을 방제하는 방법 및 언급한 유형의 해충을 방제하기 위한 조성물의 용도에 관한 것이다. 전형적 농도 비율은 활성 성분 0.1 내지 1000ppm, 바람직하게는 0.1 내지 500ppm이다. 헥타르(ha)당 적용율은 일반적으로 헥타르(ha)당 활성 성분 1 내지 2000g, 특히 10 내지 1000g/ha, 바람직하게는 20 내지 600g/ha, 보다 특히 20 내지 100g/ha이다.

[0156] 작물 보호 분야에서 바람직한 적용 방법은 식물의 잎에 대한 적용(엽면 시용)이며, 적용 빈도 및 적용율은 해당 해충에 의한 감염 위험성에 따라 좌우된다. 그러나, 활성 성분은 식물의 서식지를 액체 조성물로 흠뻑 젖게하거나, 활성 성분을 고체 형태로 식물의 서식지, 예를 들어, 토양에 과립의 형태로 혼입(토양 적용)시키는 경우 근계를 통하여 식물로 도입될 수 있다(전신 작용). 벼 작물의 경우에, 이러한 과립을 계량하여 담수답에 적용할 수 있다.

[0157] 본 발명에 따른 작물 보호 생성물은 또한 식물 번식 물질, 예를 들어, 과실, 괴경 또는 낟알과 같은 종자, 또는 묘목을 진균 감염 및 동물 해충으로부터 보호하는데 적합하다. 번식 물질은 식림 전에 조성물로 처리할 수 있는데, 예를 들어, 종자를 파종 전에 드레싱할 수 있다. 또한, 종자를 액체 조성물에 침지시키거나, 이들을 고체 조성물로 피복시켜 종자 낟알에 활성 성분을 적용(피복)시킬 수 있다. 당해 조성물은, 번식 물질을 예를 들어, 파종 도중에 파구에 식림하는 경우에 식림 부위에 적용시킬 수 있다. 본 발명은 또한 이러한 식물 번식 물질의 처리 방법 및 이렇게 처리된 식물 번식 물질에 관한 것이다.

[0158] 다음 실시예는 본 발명을 예시하기 위함이다. 이는 본 발명을 제한하지 않는다. 온도는 섭씨 온도이며, 용매의 혼합 비는 용적부로 기재한다. NMR 스펙트럼과 관련된 데이타에서, DMSO는 디메틸 설폭사이드를 의미하고, s는 단일선을 나타내고, t는 삼중선을 나타내고, d는 이중선을 나타내며, q는 사중선을 나타내고, m은 다중선을 나타낸다.

[0159] 제조 실시예

[0160] 다음 실시예에서는, 아버멕틴 B1 유도체(아버멕틴 B1a과 B1b 유도체의 혼합물)을 기술한다. B1b 유도체는 일반

적으로 혼합물의 약 5 내지 10중량%만을 구성하며, 이러한 이유로 인해 NMR 스펙트럼에서 통상적으로 B1a 유도체의 밴드만이 검출될 수 있다.

[0161] 당해 화합물들은 대부분의 경우에 아버멕틴 B1a 및 B1b 유도체의 혼합물 형태이기 때문에, 융점 또는 굴절률과 같은 통상의 물리적 데이터에 의한 특징은 거의 사용되지 않는다. 이러한 이유로, 당해 화합물들은 크로마토그래피에 의한 정제 후의 NMR 분광분석법에 의해 또는 HPLC(고분해능 액체 크로마토그래피)에 의해 분석시 측정된 체류 시간을 참조로 하여 특성 규명된다. 제조 실시예의 물리학적 데이타에서, "B1a"이란 용어는 R_1이 2급-부틸인 주 성분을 의미한다. "B1b"는 R_1이 이소프로필인 2차 성분을 의미한다. 체류 시간이 B1a 유도체에 대해서만 주어진 화합물인 경우에, 소량의 B1b 유도체로 인해 B1b 성분의 체류 시간을 측정하는 것은 불가능하다. B1a 및 B1b 성분의 정확한 구조의 할당은 질량 분광분석법에 의해 수행된다.

[0162] 다음의 방법들이 표의 HPLC 분석을 위해 사용된다.

[0163]

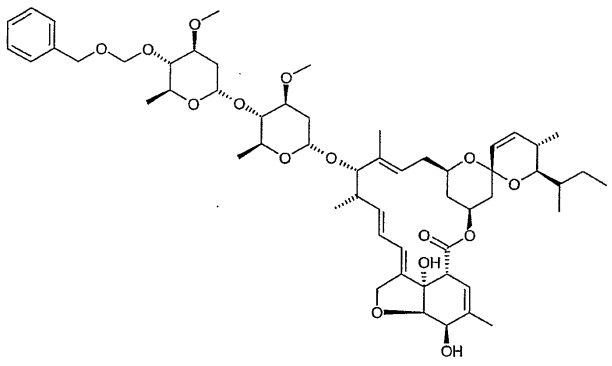
HPLC 구배 조건			
용매 A:	H_2O 중의 0.01% 트리플루오로아세트산		
용매 B:	CH_3CN 중의 0.01% 트리플루오로아세트산		
시간[분]	A [%]	B [%]	유속[㎕/분]
0	80	20	500
0.1	50	50	500
10	5	95	500
15	0	100	500
17	0	100	500
17.1	80	20	500
22	80	20	500
컬럼:	YMC-Pack ODS-AQ		
컬럼 길이:	125mm		
컬럼 내부 직경:	2mm		
온도:	40℃		

[0164] 당해 화합물들의 크로마토그래피에 사용되는 YMC-Pack ODS-AQ 컬럼은 독일 46514 쉐름벡크 알테 라에스펠터슈트라쎄 6(Alte Raesfelderstrasse 6, 46514 Schermbeck, Germany)에 소재하는 YMC에 의해 제조된다.

[0165] 생리학적 데이타 정보에서 사용되는 약어는 다음을 의미한다:

[0166] s: 단일선, MHz: 메가헤르츠, brs: 광역 단일선; t: 삼중선; m: 다중선; d: 이중선; J: 결합 상수; bd: 광역 이중선; LCMS: 액체 크로마토그래피 질량 분광분석법; t_{RT}: 체류 시간(분); M+H: 질량 피크 + H; M+Na: 질량 피크+ Na. 실시예에서 TBDMS는 라디칼 -Si$(CH_3)_2$(3급-부틸)을 의미한다. 용매의 혼합 비는 용적부로 기재한다. "에테르"는 디에틸 에테르를 의미하여 이해된다.

[0167] 실시예 P.1: 4"-O-벤질옥시메틸-아버멕틴 B_1



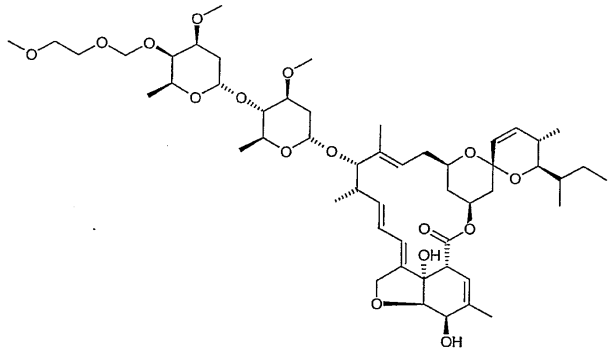
[0168]

[0169] 단계 A: 디클로로메탄 10ml 중의 5-OTBDMS-아버멕틴 B_1 0.5g 및 N,N-디이소프로필에틸아민 0.26g의 용액에 0℃

에서 벤질옥시메틸 클로라이드 276mg을 첨가한다. 당해 혼합물을 35℃에서 12시간 동안 교반한다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고 물에 붓고 에틸 아세테이트로 추출하고 Na_2SO_4로 건조시키고, 진공하에 농축시켜 조 5-OTBDMS-4"O-벤질옥시메틸-아버멕틴 B_1을 수득하고, 이를 다음과 같이 직접 사용하였다:

[0170] 단계 B: 테트라하이드로푸란 10ml 중의 5-OTBDMS-4"O-벤질옥시메틸-아버멕틴 B_1(단계 A에서 수득됨)의 용액에 HF-피리딘 용액 2.2ml(70% HF-피리딘 25g, 테트라하이드로푸란 27.5ml 및 피리딘 12.5ml로 구성됨)를 첨가하고, 혼합물을 실온에서 12시간 동안 교반하고 물에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, 유기 상을 포화 중탄산나트륨으로 세척하고, 황산나트륨으로 건조시키고 진공하에 농축시킨다. 잔사를 정제용 HPLC로 정제하여 4"-O-벤질-옥시메틸-아버멕틴 B_1를 수득한다. LCMS: B_{1a}: t_{RT},: 12.16분, 1015 (M+Na).

[0171] 실시예 P.2: 4"-에피-O-(2-메톡시에톡시메틸)-아버멕틴 B_1

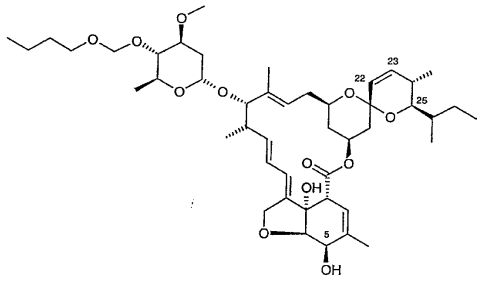


[0172]

[0173] 단계 A: 디클로로메탄 5ml 중의 5-OTBDMS-4"-에피-아버멕틴 B_1 0.3g 및 N,N-디이소프로필에틸아민 0.31g의 용액에 0℃에서 2-메톡시-에톡시메틸 클로라이드 0.21ml를 첨가한다. 혼합물을 환류하에 6시간 동안 교반한다. 반응 혼합물을 실온에서 냉각시키고 물에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, Na_2SO_4로 건조시키고, 진공하에 농축시켜 조 5-OTBDMS-4"-에피-O-(2-메톡시-에톡시메틸)-아버멕틴 B_1을 수득하고, 이를 다음과 같이 직접 사용한다:

[0174] 단계 B: 테트라하이드로푸란 10ml 중의 5-OTBDMS-4"-에피-O-(2-메톡시에톡시메틸)-아버멕틴 B_1의 용액에 HF-피리딘 용액 3.5ml(70% HF-피리딘 25g, 테트라하이드로푸란 27.5ml 및 피리딘 12.5ml로 구성됨)를 첨가하고, 혼합물을 50℃에서 2.5시간 동안 교반하고, 물에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, 유기 상을 포화 중탄산나트륨으로 세척하고 황산나트륨으로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 잔사를 섬광 크로마토그래피(실리카 겔 헥산/에틸 아세테이트 1/1)로 정제하여 4"-에피-O-(2-메톡시에톡시메틸)-아버멕틴 B_1을 수득한다. LCMS: B_{1a}: t_{RT},: 9.37분, 983.5 (M+Na), 961.6 (M+H); B_{1a}: t_{RT},: 8.65분, 969.5 (M+Na).

[0175] 실시예 P.3: 4'-O-부톡시메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드



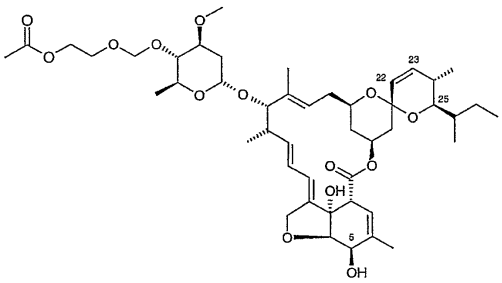
[0176]

[0177] 단계 A: 디클로로메탄(5ml) 중의 5-OTBDMS-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(420mg) 및 N,N-디이소프로필에틸아민(0.4ml)의 용액에 실온에서 클로로메틸 *n*-부틸 에테르(220mg)를 첨가한다. 혼합물을 35℃에서 24시간 동안 교반한다. 반응 혼합물을 염수에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, Na_2SO_4로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 잔사를 섬광 크로마토그래피(실리카 겔, 헥산/에틸 아세테이트 4/1)로 정제하여 5-OTBDMS-4"-O-부톡시메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0178] 단계 B: 메탄올(5ml)중의 5-OTBDMS-4'-O-부톡시메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(200mg)의 용액에 0℃에서 메탄설폰산(0.02ml)을 첨가한다. 반응 혼합물을 1시간 동안 교반하고 포화 중탄산나트륨에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, Mg_2SO_4로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 섬광 크로마토그래피(실리카 겔, 헥산/에틸 아세테이트 3/0)하여 4'-O-부톡시메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득한다.

[0179] 4'-O-부톡시메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드: B_{1a} $C_{46}H_{70}O_{12}$, MW: 814.5. LCMS: t_{RT},: 11.4분, 837.3 (M+Na); 1H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) 선택된 데이타, dH (ppm): 3.15 (t, J = 8.5 Hz, 1H, CH-4', 3.28 (m, 1H, CH-2), 3.44 (s, 3H, OCH_3). B_{1b} $C_{45}H_{68}O_{12}$, MW: 800.5. LCMS: t_{RT},: 10.6 823.5 (M+Na);

[0180] 실시예 P.4: 4'-O-(1-아세톡시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드



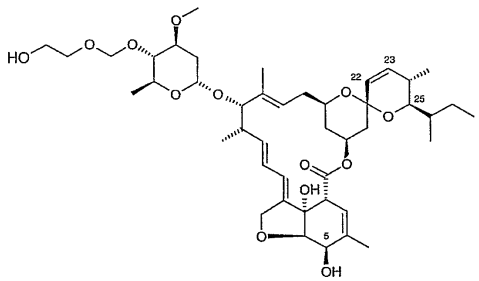
[0181]

[0182] 단계 A: 디클로로메탄(5ml) 중의 5-OTBDMS-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(422mg) 및 N,N-디이소프로필에틸아민(0.9ml)의 용액에 실온에서 1-아세톡시-2-클로로메톡시에탄(610mg)를 첨가한다. 혼합물을 45℃에서 32시간 동안 교반한다. 반응 혼합물을 염수에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, $MgSO_4$로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 잔사를 섬광 크로마토그래피(실리카 겔, 헥산/에틸 아세테이트 4/1)로 정제하여 5-OTBDMS-4'-O-(1-아세톡시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0183] 단계 B: 테트라하이드로푸란(5ml) 중의 5-OTBDMS-4'-O-(1-아세톡시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(384mg)의 용액에 피리딘(0.2ml) 및 70% HF-피리딘 용액 0.2ml를 첨가한다. 혼합물을 실온에서 18시간 동안 교반하고, 수성 $NaHCO_3$ (50%)에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, $MgSO_4$로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 섬광 크로마토그래피(실리카 겔, 헥산/에틸 아세테이트 1/1)하여 4'-O-(1-아세톡시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0184] 4'-O-(1-아세톡시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드: B_{1a} $C_{46}H_{68}O_{14}$, MW: 844.5. LCMS: t_{RT},: 8.49분, 867.5 (M+Na); B_{1b} $C_{45}H_{66}O_{12}$, MW: 830.5. LCMS: t_{RT},: 7.82분, 853.5 (M+Na).

[0185] 실시예 P.5: 4'-O-(1-하이드록시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드



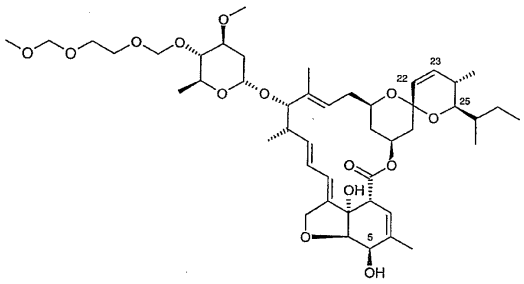
[0186]

[0187] 단계 A: 0℃로 냉각시킨 5-OTBDMS-4'-O-(1-아세톡시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(410mg)의 메탄올성 용액(10ml)에 수산화암모늄(2ml, H_2O 중의 25%)를 첨가한다. 혼합물을 실온에서 4시간 동안 교반한 다음, 진공하에 농축시킨다. 섬광 크로마토그래피(실리카 겔, 헥산/에틸 아세테이트 1/1)하여 4'-O-(1-하이드록시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0188] 단계 B: 테트라하이드로푸란(2ml) 중의 5-OTBDMS-4'-O-(1-하이드록시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(140mg)의 용액에 피리딘(80㎕) 및 70% HF-피리딘 용액(80㎕)을 첨가한다. 혼합물을 실온에서 5일 동안 교반하고, 수성 $NaHCO_3$ (50%)에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, $MgSO_4$로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 섬광 크로마토그래피(실리카 겔, 헥산/에틸 아세테이트 3/7)하여 4'-O-(1-하이드록시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0189] 4'-O-(1-하이드록시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드: B_{1a} $C_{44}H_{66}O_{13}$, MW: 802.5. LCMS: t_{RT},: 6.99분, 825.4 (M+Na); B_{1b} $C_{43}H_{64}O_{13}$, MW: 788.4. LCMS: t_{RT},: 6.35분, 811.4 (M+Na).

[0190] 실시예 P.6: 4'-O-(1-메톡시메톡시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드



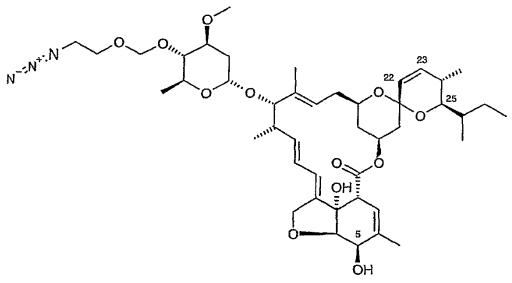
[0191]

[0192] 단계 A: 디클로로메탄(5ml) 중의 용액 5-OTBDMS-4'-O-(1-하이드록시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(138mg) 및 N,N-디이소프로필에틸아민(90㎕)의 용액에 실온에서 클로로메틸 메틸 에테르(29㎕)를 첨가한다. 혼합물을 35℃에서 20시간 동안 교반한다. 반응 혼합물을 물에 붓고, 디클로로메탄으로 추출하고, $MgSO_4$로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 잔사를 섬광 크로마토그래피(실리카 겔, 헥산/에틸 아세테이트 7/3)로 정제하여 5-OTBDMS-4'-O-(1-메톡시메톡시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0193] 단계 B: 테트라하이드로푸란(1.5ml) 중의 5-OTBDMS-4'-O-(1-메톡시메톡시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(100mg)의 용액에 피리딘(50㎕) 및 70% HF-피리딘 용액(50㎕)을 첨가한다. 혼합물을 실온에서 48시간 동안 교반하고, 포화 수성 $NaHCO_3$에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, $MgSO_4$로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 섬광 크로마토그래피(실리카 겔, 헥산/에틸 아세테이트 1/1)하여 4'-O-(1-메톡시메톡시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0194] 4'-O-(1-메톡시메톡시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드: B_{1a} $C_{46}H_{70}O_{14}$, MW: 846.5. LCMS: t_{RT},: 8.73분, 869.4 (M+Na); B_{1b} $C_{45}H_{68}O_{14}$, MW: 832.5. LCMS: t_{RT},: 7.89분, 855.4 (M+Na).

[0195] 실시예 P.7: 4'-O-(1-아지도-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드



[0196]

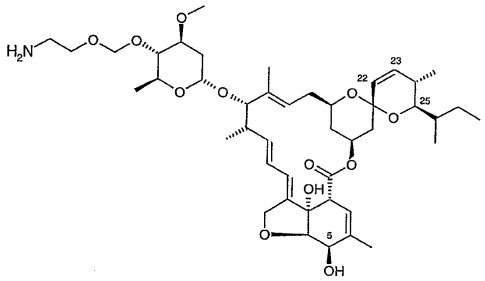
[0197] 단계 A: 0℃ 실온으로 냉각시킨 N,N-디메틸아세트아미드(7ml) 중의 용액 5-OTBDMS-4'-O-(1-하이드록시-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드 (642mg)의 용액에 트리페닐포스핀(551mg) 및 테트라브로모메탄(696mg)을 첨가한다. 혼합물을 0.5시간 동안 교반하고, 이후에 나트륨 아지드(228mg)을 첨가한다. 반응 혼합물을 40℃에서 1시간 동안 교반한 다음, 물에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, $MgSO_4$로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다.

잔사를 섬광 크로마토그래피(실리카 겔, 헥산/에틸 아세테이트 5/1)로 정제하여 5-OTBDMS-4'-O-(1-아지도-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0198] 단계 B: 테트라하이드로푸란 (2.0ml) 중의 5-OTBDMS-4'-O-(1-아지도-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(98mg)의 용액에 피리딘(50㎕) 및 70% HF-피리딘 용액(50㎕)을 첨가한다. 혼합물을 실온에서 48시간 동안 교반하고, 포화 수성 $NaHCO_3$에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, $MgSO_4$로 건조시키고 진공하에 농축시킨다. 섬광 크로마토그래피(실리카 겔, 헥산/에틸 아세테이트 1/1)하여 4'-O-(1-아지도-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0199] 4'-O-(1-아지도-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드: B_{1a} $C_{44}H_{65}N_3O_{12}$, MW: 827.5. LCMS: t_{RT},: 9.76분, 850.5 (M+Na); B_{1b} $C_{43}H_{63}N_3O_{12}$, MW: 813.4 LCMS: t_{RT},: 9.01분, 836.4 (M+Na).

[0200] 실시예 P.8: 4'-O-(1-아미노-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드

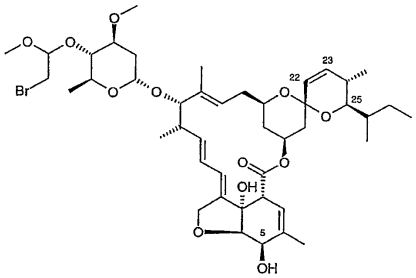


[0201]

[0202] 단계 A: 4'-O-(1-아지도-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드의 용액에 트리메틸포스핀(150㎕, 테트라하이드로푸란 중의 1.0M) 및 물(30㎕)을 첨가한다. 반응 혼합물을 실온에서 48시간 동안 교반한 다음, 물에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, $MgSO_4$로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 잔사를 섬광 크로마토그래피(실리카 겔, 헥산/에틸 아세테이트 5/1)로 정제하여 4'-O-(1-아미노-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0203] 4'-O-(1-아미노-에톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드: B_{1a} $C_{44}H_{67}NO_{12}$, MW: 801.5. LCMS: t_{RT},: 4.11분, 802.5 (M+Na).

[0204] 실시예 P.9: 4'-O-(1-브로모메틸-1-메톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드



[0205]

[0206] 단계 A: 5-OTBDMS-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(1.0 g), 수은 아세테이트(190mg)와 에틸 비닐 에테르(10ml)의 혼합물을 8시간 동안 환류시킨다. 반응 혼합물을 수성 Na_2CO_3에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출한다. Na_2SO_4로 건조시키고 진공하에 농축시켜 5-OTBDMS-4'-O-비닐-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

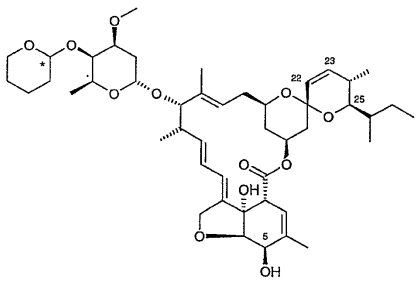
[0207] 단계 B: 메탄올 중의 5-OTBDMS-4'-O-비닐-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(200mg)의 용액에 N-브로모석신이미드(46mg)를 첨가한다. 실온에서 24시간 동안 교반한 후, 용매를 진공하에 제거하여 5-OTBDMS-4'-O-(1-브로모메틸-1-메톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 부분입체이성체의 혼합물로서 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0208] 5-OTBDMS-4'-O-(1-브로모메틸-1-메톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드: B_{1a} $C_{50}H_{79}BrO_{12}Si$, MW: 978.5. LCMS: 이성체 1 : t_{RT}, 14.94분, 979.5 (M+H); 이성체 2: t_{RT}, 14.64분, 1001.4 (M+Na).

[0209] 단계 C: THF(2.0ml) 중의 5-OTBDMS-4'-O-(1-브로모메틸-1-메톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(200mg)의 용액에 피리딘(50㎕) 및 70% HF-피리딘 용액 (100㎕)을 첨가한다. 혼합물을 실온에서 48시간 동안 교반하고, 포화 수성 $NaHCO_3$에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, $MgSO_4$로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 섬광 크로마토그래피(실리카 겔, 헥산/에틸 아세테이트 1/1)하여 4'-O-(1-브로모메틸-1-메톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0210] 4'-O-(1-브로모메틸-1-메톡시)메틸-아버멕틴 B_1 모노사카라이드: B_{1a} $C_{44}H_{65}BrO_{12}$, MW: 864.4. LCMS: 이성체 1 t_{RT}, 10.56분, 865.4 (M+H); 이성체 2: t_{RT}, 10.35분, 865.4 (M+Na).

[0211] 실시예 P.10: 하기 화학식의 4'-에피-O-(테트라하이드로-피란-2-일)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드

[0212] 

[0213] 단계 A: CH_2Cl_2 4ml 중의 5-OTBDMS-4-에피-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(500mg), 3,4-디하이드로-2H-피란(80.7㎕)과 피리디늄-(톨루엔-4-설포네이트)(14.9mg)의 혼합물을 실온에서 6시간 동안 교반한다. 반응 혼합물을 디에틸 에테르 20ml로 희석시키고 수성 NaCl로 세척한다. Na_2SO_4로 건조시키고 진공하에 농축시켜 5-OTBDMS-4'-에피-O-(테트라하이드로-피란-2-일)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드의 2개의 가능한 이성체를 수득하는데, 이는 섬광 크로마토그래피(헥산 - 에틸아세테이트 4:1)로 분리시키고 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성화할 수 있다.

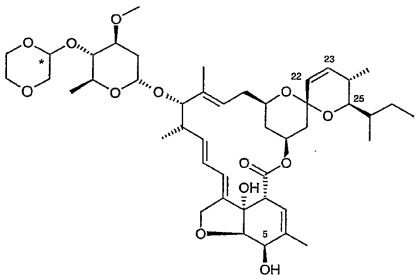
[0214] 단계 B': THF(2.5ml) 중의 5-OTBDMS-4'-에피-O-(테트라하이드로-피란-2-일)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(148mg)의 제1 이성체의 용액에 피리딘(244㎕) 및 70% HF-피리딘 용액(83㎕)을 첨가한다. 혼합물을 실온에서 72시간 동안 교반하고, 포화 수성 $NaHCO_3$에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, Na_2SO_4로 건조시키고 진공하에 농축시킨다. 분취 HPLC로 4'-에피-O-(테트라하이드로-피란-2-일)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드의 제1 이성체를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0215] 4'-에피-O-(테트라하이드로-피란-2-일)-아버멕틴 B_{1a} 모노사카라이드: $C_{46}H_{68}O_{12}$, MW: 812.5. LCMS: 이성체 1 t_{RT}, 10.26분, 813.5 (M+H); 835.5 (M+Na).

[0216] 단계 B": THF(1ml) 중의 5-OTBDMS-4'-에피-O-(테트라하이드로-피란-2-일)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(46mg)의 제2 이성체의 용액에 피리딘(76㎕) 및 70% HF-피리딘 용액(26㎕)을 첨가한다. 혼합물을 실온에서 72시간 동안 교반하고, 포화 수성 $NaHCO_3$에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, Na_2SO_4로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 분취 HPLC로 4'-에피-O-(테트라하이드로-피란-2-일)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드의 제2 이성체를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0217] 4'-에피-O-(테트라하이드로-피란-2-일)-아버멕틴 B_{1a} 모노사카라이드: $C_{46}H_{68}O_{12}$, MW: 812.5. LCMS: 이성체 2 t_{RT}, 11.03분, 813.5 (M+H); 835.5 (M+Na).

[0218] 실시예 P.11: 하기 화학식의 4'-O-([1,4]디옥산-2-일)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드



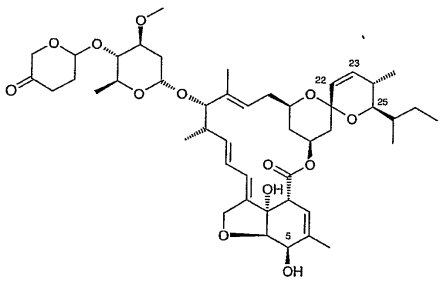
[0219]

[0220] 단계 A: CH_2Cl_2 8ml 중의 5-OTBDMS-4-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(500mg), 2-페닐-설파닐-[1,4]디옥산(163mg) 및 분자체(3Å)의 혼합물을 실온에서 2시간 동안 교반한다. 반응 혼합물을 -30℃로 냉각시키고 *N*-요오도석신이미드(267mg) 및 트리플루오로메탄설폰산(5.1㎕)를 첨가한다. 상기 온도에서 75분 동안 교반한 후, 반응물을 에틸디이소프로필아민(8.1㎕)로 급냉시키고 CH_2Cl_2 30ml로 희석시키고 수성 $Na_2S_2O_3$, 수성 $NaHCO_3$ 및 수성 NaCl로 세척한다. Na_2SO_4로 건조시키고 진공하에 농축시켜 5-OTBDMS-4'-O-([1,4]디옥산-2-일)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하는데, 이는 섬광 크로마토그래피(헥산-에틸아세테이트 3:1)로 분리시키고 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성화할 수 있다.

[0221] 단계 B: THF (0.7ml) 중의 5-OTBDMS-4'-O-([1,4]디옥산-2-일)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(29mg)의 용액에 HF-피리딘 용액(175㎕)을 첨가한다. 혼합물을 실온에서 18시간 동안 교반하고, 포화 수성 $NaHCO_3$에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, Na_2SO_4로 건조시키고 진공하에 농축시킨다. 섬광 크로마토그래피(헥산-에틸아세테이트 1:1)로 4'-O-([1,4]디옥산-2-일)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0222] 4'-O-([1,4]디옥산-2-일)-아버멕틴 B_{1a} 모노사카라이드: $C_{45}H_{66}O_{13}$, MW: 814.5. LCMS: t_{RT}, 10.07분, 815.5 (M+H); 837.4 (M+Na); 832.5 (M+NH4).

[0223] 실시예 P.12: 하기 화학식의 4'-O-(디하이드로-피란-3-온)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드



[0224]

[0225] 단계 A: N-메틸피롤리디논 40.0ml 중의 5-OTBDMS-4-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(7100mg), 탄산 알릴 에스테르 6-페닐설파닐-테트라하이드로-피란-3-일 에스테르(10240mg) 및 2,6-디-3급-부틸피리딘(1890㎕)를 N-요오도석신이미드(7650mg)로 40분 이내에 처리한다. 반응물을 수성 Na_2SO_3, 수성 K_2CO_3과 물의 혼합물로 급냉시킨다. 수성 상을 디에틸 에테르로 추출하고(3회), 유기 상을 물 및 수성 NaCl로 연속적으로 세척한다. Na_2SO_4로 건조시키고 진공하에 농축시켜 4'-O-(3-알릴옥시카보닐-디하이드로-피란)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드의 3개 에피머의 혼합물을 수득하는데, 이는 섬광 크로마토그래피(헥산-디에틸 에테르 1:0 내지 0:1)로 분리하고 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성화할 수 있다. 대안으로서, 상기 화합물을 다음 단계를 위해 혼합물로서 보관한다.

[0226] 단계 B: 테트라하이드로푸란 50.0ml 중의 4'-O-(3-알릴옥시카보닐-디하이드로-피란)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(54300mg), 테트라키스(트리페닐포스핀)-팔라듐(2870mg), 트리페닐포스핀(2580mg), 부틸아민(7460㎕)과 포름산의 혼합물의 용액을 실온에서 4시간 동안 교반한다. 반응물을 수성 $NaHCO_3$과 에틸 아세테이트의 혼합물에 붓는다. 수성 상을 에틸 아세테이트로 추출하고, Na_2SO_4로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 섬광 크로마토그래

피 (헥산-에틸 아세테이트 3:2)로 4'-O-(디하이드로-피란-3-올)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하는데, 이는 섬광 크로마토그래피 (헥산-디에틸 에테르 1:0 내지 0:1)로 분리하고 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 분리할 수 있다.

[0227] 단계 C: -75℃에서 교반되는 메틸렌 클로라이드 30ml 중의 옥살릴 클로라이드(1010㎕)를 함유하는 용액에 메틸렌 클로라이드 10mL 중에 용해된 DMSO(1390 ㎕)를 첨가한다. 이어서, 메틸렌 클로라이드 20mL 중에 용해된 4'-O-(디하이드로-피란-3-올)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(7550mg)의 용액을 -75℃에서 15분에 걸쳐서 첨가한다. 이 혼합물을 상기 온도에서 30분 동안 교반하고 트리에틸아민(3560㎕)을 첨가한다. 혼합물을 -75℃에서 추가로 10분 동안 교반하고, 반응 혼합물을 0℃가 되도록 한다. 반응물을 수성 $NaHCO_3$으로 급냉시키고, 수성 상을 디에틸 에테르로 추출한다(3회). 유기 상을 Na_2SO_4로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 섬광 크로마토그래피(헥산-에틸 아세테이트 1:3)로 4'-O-(디하이드로-피란-3-온)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드의 2개의 에피머를 수득하는데, 이는 분리시키고 이들의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성화할 수 있다.

[0228] 단계 D: THF(2.5ml) 중의 4'-O-(디하이드로-피란-3-온)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드(90mg)의 용액에 HF-피리딘 용액(500㎕)을 첨가한다. 혼합물을 실온에서 18시간 동안 교반하고, 포화 수성 $NaHCO_3$에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출하고, Na_2SO_4로 건조시키고, 진공하에 농축시킨다. 섬광 크로마토그래피(헥산-에틸 아세테이트 1:2 내지 0:1)로 4'-O-(디하이드로-피란-3-온)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드를 수득하고, 이를 이의 질량 및 NMR 스펙트럼으로 특성 규명한다.

[0229] 4'-O-(디하이드로-피란-3-온)-아버멕틴 B_1 모노사카라이드 :

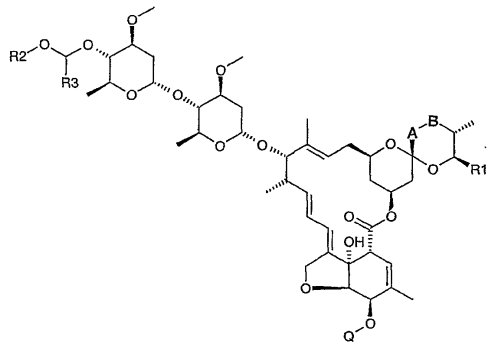
[0230] 제1 에피머: B_{1a} $C_{46}H_{66}O_{13}$, MW: 826.5. LCMS: t_{RT}, 11.69분, 827.5 (M+H); 849.3 (M+Na).

[0231] 제2 에피머: B_{1a} $C_{46}H_{66}O_{13}$, MW: 826.5. LCMS: t_{RT}, 10.94분, 849.4 (M+Na); 844.5 (M+NH4).

[0232] 실시예 P.13: 표에 열거한 화합물들은 상기 제조 실시예와 유사하게 제조할 수 있거나 당해 분야의 숙련가에게 공지된 다른 방법을 사용하여 제조할 수도 있다.

[0233] 표 1: 화학식 Ia의 화합물

화학식 Ia

[0234] 

[0235] 상기 화학식에서,

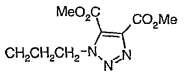
[0236] R_1은 2급-부틸(B1a) 또는 이소프로필(B1b)이고,

[0237] A-B는 -CH=CH-이며,

[0238] Q는 수소이다:

번호	R_2	R_3	체류시간(분)	
			B1a	B1b
1.1	$CH_2C_6H_5$	H	12.16	11.64
1.2	*p*-ClC_6H_5	H		
1.3	$(CH_2)_7CH_3$	H		
1.4	$(CH_2)_3CH_3$	H		
1.5	CH_2CH_3	H	10.02	9.36
1.6	CH_3	H	10.49	
1.7	$CH(CH_3)_2$	H		
1.8	$CH_2CH_2OCH_3$	H	10.46	9.72
1.9	CH_2CH_2OH	H	8.53	
1.10	$CH(CH_3)CH_2OH$	H		
1.11	$CH_2CH_2CH_2OH$	H	10.98	10.67
1.12	$CH(CH_3)CH_2CH_2OH$	H		
1.13	$CH_2CH_2OC(=O)CH_3$	H	10.08	9.39
1.14	$CH_2(CH_2)_2OC(=O)CH_3$	H	11.18	10.50
1.15	$CH(CH_3)CH_2OC(=O)CH_3$	H		
1.16	$CH(CH_3)(CH_2)_2OC(=O)CH_3$	H		
1.17	$CH_2CH_2N_3$	H		
1.18	$CH_2(CH_2)_2N_3$	H	16.16	

[0239]

번호	R_2	R_3	체류시간(분)	
			B1a	B1b
1.19	$CH_2CH_2NH_2$	H	6.19	5.66
1.20	$CH_2CH_2OCH_2OCH_3$	H		
1.21		H		
1.22	n-Pr	H		
1.23	n-Hexyl	H		
1.24	$CH(CH_3)CH_2CH_2N_3$	H		
1.25	$CH_2CH_2OC(=O)OCH_3$	H		
1.26	$CH_2CH_2OC(=O)NHCH_3$	H		
1.27	$CH_2CH_2OC(=O)N(CH_3)_2$	H		
1.28	$CH_2CH_2NHC(=O)NHCH_3$	H		
1.29	$CH_2CH_2NHC(=O)NHC_6H_5$	H		
1.30	$CH_2CH_2NHC(=O)OC_6H_5$	H		
1.31	$CH_2CH_2NHC(=S)NHC_6H_5$	H		
1.32	$CH_2CH_2NHC(=O)OCH_3$	H		
1.33	$CH_2CH_2NHC(=O)NHCH_3$	H		
1.34	$CH_2CH_2NHC(=O)N(CH_3)_2$	H		
1.35	$CH_2CH_2NHC(=S)NHCH_3$	H		
1.36	$CH_2CH_2NHCH_3$	H		
1.37	$CH_2CH_2N(CH_3)_2$	H		
1.38	$CH_2CH_2SCH_3$	H	10.08	9.33
1.39	$CH_2CH_2S(O)CH_3$	H	7.09	6.45
1.40	$CH_2CH_2S(O)_2CH_3$	H	7.47	6.88
1.41	CH_3	CH_2Br		
1.42	$CH_2CH=CH_2$	CH_2Br		
1.43	$CH_2CH_2SCH_2CH_3$	H	13.28	12.59
1.44	$CH_2CH_2S(O)CH_2CH_3$	H	9.87	8.91
1.45	$CH_2CH_2S(O)_2CH_2CH_3$	H	10.72	10.03
1.46	CH_2CH_2NHCHO	H		
1.47	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_3$	H		
1.48	$CH_2CH_2NH(C=O)OCH_3$	H		
1.49	$CH_2CH_2NH(C=O)OCH_2CH_3$	H		

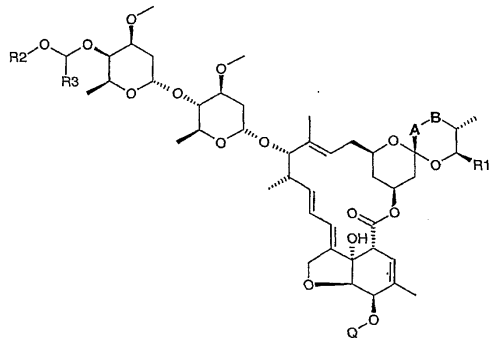
[0240]

번호	R_2	R_3	체류시간(분)	
			B1a	B1b
1.50	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_2OCH_3$	H		
1.51	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_2CO_2CH_3$	H		
1.52	$CH_2CH_2NH(C=O)OCH_2CH=CH_2$	H		
1.53	$CH_2CH_2OCH_2CH=CH_2$	H		
1.54	$CH_2CH_2SCH_3$	H		
1.55	$CH_2CH_2S(O)CH_3$	H		
1.56	$CH_2CH_2S(O)_2CH_3$	H		
1.57	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_2OCH_3$	H		
1.58	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_2CO_2CH_3$	H		
1.59	$CH_2CH_2NH(C=O)OCH_2CH=CH_2$	H		
1.60	$CH_2CH_2OCH_2CH=CH_2$	H		
1.61	$CH_2CH_2SCH_3$	H		
1.62	$CH_2CH_2S(O)CH_3$	H		
1.63	$CH_2CH_2S(O)_2CH_3$	H		
1.64	$-CH_2CH_2CH_2-$			
1.65	$-CH_2CH_2CH_2CH_2-$			
1.66	$-CH_2CH_2-O-CH_2-$			
1.67	$-CH_2CH_2-N(CH_3)-CH_2-$			
1.68	$-CH_2(C=O)CH_2CH_2-$			

[0241]

[0242] 표 2: 화학식 Ib의 화합물

화학식 Ib



[0243]

[0244] 상기 화학식에서,

[0245] R_1은 2급-부틸(B1a) 또는 이소프로필(B1b)이고,

[0246] A-B는 -CH=CH-이며,

[0247] Q는 수소이다:

번호	R_2	R_3	체류시간(분)	
			B1a	B1b
2.1	$CH_2C_6H_5$	H		
2.2	$pClC_6H_5$	H		
2.3	$(CH_2)_7CH_3$	H		
2.4	$(CH_2)_3CH_3$	H		
2.5	CH_2CH_3	H	7.14	
2.6	CH_3	H	9.65	8.91
2.7	$CH(CH_3)_2$	H		
2.8	$CH_2CH_2OCH_3$	H	9.39	8.69
2.9	CH_2CH_2OH	H	9.84	
2.10	$CH(CH_3)CH_2OH$	H		
2.11	$CH_2CH_2CH_2OH$	H		
2.12	$CH(CH_3)CH_2CH_2OH$	H		
2.13	$CH_2CH_2OC(=O)CH_3$	H	11.20	
2.14	$CH_2(CH_2)_2OC(=O)CH_3$	H	12.42	11.72
2.15	$CH_2CH_2SCH_2CH_3$	H	12.43	11.84
2.16	$CH_2CH_2S(O)CH_2CH_3$	H	8.85	8.11
2.17	$CH_2CH_2S(O)_2CH_2CH_3$	H	9.98	9.23
2.18	$CH_2CH_2N_3$	H	11.52	
2.19	$CH_2CH_2NH_2$	H	6.09	
2.20	CH_2CH_2NHCHO	H		
2.21	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_3$	H		
2.22	$CH_2CH_2NH(C=O)OCH_3$	H		
2.23	$CH_2CH_2NH(C=O)OCH_2CH_3$	H		
2.24	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_2OCH_3$	H		
2.25	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_2CO_2CH_3$	H		
2.26	$CH_2CH_2NH(C=O)OCH_2CH=CH_2$	H		
2.27	$CH_2CH_2OCH_2CH=CH_2$	H		
2.28	$CH_2CH_2SCH_3$	H		
2.29	$CH_2CH_2S(O)CH_3$	H		
2.30	$CH_2CH_2S(O)_2CH_3$	H		
2.31	$CH_2CH_2CH_2NH_2$	H		

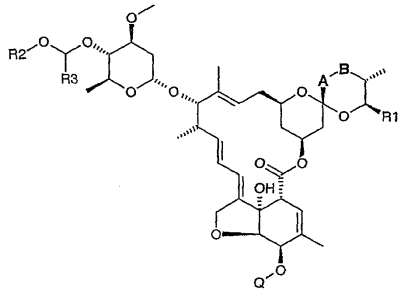
[0248]

번호	R_2	R_3	체류시간(분)	
			B1a	B1b
2.32	$CH_2CH_2NHCH_3$	H		
2.33	$CH_2CH_2N(CH_3)_2$	H		
2.34	$CH_2CH_2N(CH_3)CH_2CH_3$	H		
2.35	$CH_2CH_2N^+(CH_3)_2.C_6H_5CO_2^-$	H		
2.36	$-CH_2CH_2CH_2-$			
2.37	$-CH_2CH_2CH_2CH_2-$			
2.38	$-CH_2CH_2-O-CH_2-$			
2.39	$-CH_2CH_2-N(CH_3)-CH_2-$			
2.40	$-CH_2(C=O)CH_2CH_2-$			

[0249]

[0250] 표 3: 화학식 Ic의 화합물

화학식 Ic



[0251]

[0252] 상기 화학식에서,

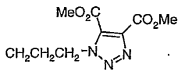
[0253] R_1은 2급-부틸(B1a) 또는 이소프로필(B1b)이고,

[0254] A-B는 -CH=CH-이며,

[0255] Q는 수소이다:

번호	R_2	R_3	체류시간(분)	
			B1a	B1b
3.1	$CH_2C_6H_5$	H		
3.2	$pClC_6H_5$	H		
3.3	$(CH_2)_7CH_3$	H	13.81	
3.4	$(CH_2)_3CH_3$	H	11.36	10.61
3.5	CH_2CH_3	H		
3.6	CH_3	H	9.39	8.69
3.7	$CH(CH_3)_2$	H	11.20	10.45
3.8	$CH_2CH_2OCH_3$	H		

[0256]

번호	R_2	R_3	체류시간(분)	
			B1a	B1b
3.9	CH_2CH_2OH	H	6.99	6.35
3.10	$CH(CH_3)CH_2OH$	H	8.64	7.95
3.11	$CH_2CH_2CH_2OH$	H	7.43	6.72
3.12	$CH(CH_3)CH_2CH_2OH$	H	8.70	8.00
3.13	$CH_2CH_2OC(=O)CH_3$	H	8.48	7.79
3.14	$CH_2(CH_2)_2OC(=O)CH_3$	H	9.28	8.64
3.15	$CH(CH_3)CH_2OC(=O)CH_3$	H	9.44	8.75
3.16	$CH(CH_3)(CH_2)_2OC(=O)CH_3$	H	9.71	9.07
3.17	$CH_2CH_2N_3$	H	9.76	9.01
3.18	$CH_2(CH_2)_2N_3$	H	10.89	10.09
3.19	$CH_2CH_2NH_2$	H	4.11	
3.20	$CH_2CH_2OCH_2OCH_3$	H	8.69	7.89
3.21		H	9.65	8.96
3.22	$CH(CH_3)CH_2CH_2OH$	H	8.69, 9.28	8.00
3.23	$CH(CH_3)CH_2CH_2N_3$	H	11.04	10.35
3.24	$CH_2CH_2SCH_3$	H	10.08	9.33
3.25	$CH_2CH_2S(O)CH_3$	H	7.09	6.45
3.26	$CH_2CH_2S(O)_2CH_3$	H	7.47	6.88
3.27	CH_2CH_2NHCHO	H	7.73	6.93
3.28	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_3$	H	7.84	7.04
3.29	$CH_2CH_2NH(C=O)OCH_3$	H	8.69	
3.30	$CH_2CH_2NH(C=O)OCH_2CH_3$	H	9.29	
3.31	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_2OCH_3$	H	8.16	7.41
3.32	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_2CO_2CH_3$	H	7.57	6.99
3.33	$CH_2CH_2NH(C=O)OCH_2CH=CH_2$	H	9.33	8.75
3.34	$CH_2CH_2OCH_2CH=CH_2$	H	11.36	10.61
3.35	$CH_2CH_2SCH_2CH_3$	H	12.11	11.41
3.36	$CH_2CH_2S(O)CH_2CH_3$	H	8.08	
3.37	$CH_2CH_2S(O)_2CH_2CH_3$	H	8.32	7.57
3.38	$CH_2CH_2CH_2NH_2$	H	4.69	4.37
3.39	$CH_2CH_2NHCH_3$	H		

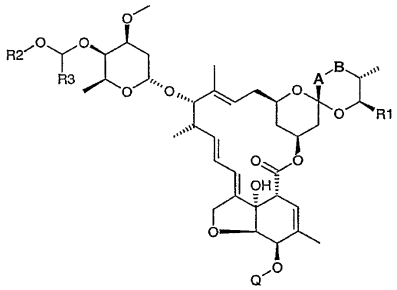
[0257]

번호	R_2	R_3	체류시간(분)	
			B1a	B1b
3.40	$CH_2CH_2N(CH_3)_2$	H	4.69	4.48
3.41	$CH_2CH_2N(CH_3)CH_2CH_3$	H		
3.42	$CH_2CH_2N^+(CH_3)_2.C_6H_5CO_2^-$	H		
3.43	CH_3	CH_2Br	10.56, 10.35	
3.44	$CH_2CH=CH_2$	CH_2Br	11.26, 11.09	10.7, 10.6
3.45	$-CH_2CH_2CH_2-$		9.07/9.49	10.45/10.93
3.46	$-CH_2CH_2-O-CH_2-$		10.07	
3.47	$-CH_2CH_2-N(CH_3)-CH_2-$			
3.48	$-CH_2(C=O)CH_2CH_2-$		10.94/11.69	
3.49	$-CH_2CH(CH_3)CH_2-$		9.98/10.51	
3.50	$-CH_2CH_2CH(CH_3)CH_2-$		11.87	11.20

[0258]

[0259] 표 4: 화학식 Id의 화합물

화학식 Id



[0260]

[0261] 상기 화학식에서,

[0262] R_1은 2급-부틸(B1a) 또는 이소프로필(B1b)이고,

[0263] A-B는 -CH=CH-이며,

[0264] Q는 수소이다:

[0265]

번호	R_2	R_3	체류시간(분)	
			B1a	B1b
4.1	$CH_2C_6H_5$	H	10.72	10.03
4.2	$pClC_6H_5$	H	11.63	
4.3	$(CH_2)_7CH_3$	H	13.71	13.17
4.4	$(CH_2)_3CH_3$	H	11.15	10.29
4.5	CH_2CH_3	H		
4.6	CH_3	H		

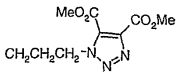
번호	R_2	R_3	체류시간(분)	
			B1a	B1b
4.7	$CH(CH_3)_2$	H	9.92	9.17
4.8	$CH_2CH_2OCH_3$	H		
4.9	CH_2CH_2OH	H	6.24	5.66
4.10	$CH(CH_3)CH_2OH$	H	6.94	6.45
4.11	$CH_2CH_2CH_2OH$	H	6.45	5.87
4.12	$CH(CH_3)CH_2CH_2OH$	H	6.89	6.25
4.13	$CH_2CH_2OC(=O)CH_3$	H	8.16	7.57
4.14	$CH_2(CH_2)_2OC(=O)CH_3$	H	8.69	8.05
4.15	$CH(CH_3)CH_2OC(=O)CH_3$	H	8.49	7.95
4.16	$CH(CH_3)(CH_2)_2OC(=O)CH_3$	H	8.97	8.32
4.17	$CH_2CH_2N_3$	H	8.75	8.11
4.18	$CH_2(CH_2)_2N_3$	H	9.33	8.69
4.19	$CH_2CH_2NH_2$	H	11.09	10.35
4.20	$CH_2CH_2SCH_2CH_3$	H	11.20	10.51
4.21	$CH_2CH_2S(O)CH_2CH_3$	H	6.93	6.29
4.22	$CH_2CH_2S(O)_2CH_2CH_3$	H	8.11	7.52
4.23	$CH(CH_3)CH_2CH_2N_3$	H		
4.24	$CH_2CH_2SCH_3$	H		
4.25	$CH_2CH_2S(O)CH_3$	H		
4.26	$CH_2CH_2S(O)_2CH_3$	H		
4.27	CH_2CH_2NHCHO	H		
4.28	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_3$	H		
4.29	$CH_2CH_2NH(C=O)OCH_3$	H		
4.30	$CH_2CH_2NH(C=O)OCH_2CH_3$	H		
4.31	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_2OCH_3$	H		
4.32	$CH_2CH_2NH(C=O)CH_2CO_2CH_3$	H		
4.33	$CH_2CH_2NH(C=O)OCH_2CH=CH_2$	H		
4.34	$CH_2CH_2OCH_2CH=CH_2$	H		
4.35	$CH_2CH_2CH_2NH_2$	H		
4.36	$CH_2CH_2NHCH_3$	H		
4.37	$CH_2CH_2N(CH_3)_2$	H		
4.38	$CH_2CH_2N(CH_3)CH_2CH_3$	H		

[0266]

번호	R_2	R_3	체류시간(분)	
			B1a	B1b
4.39	$CH_2CH_2N^+(CH_3)_2.C_6H_5CO_2^-$	H		
4.40	$-CH_2CH_2CH_2-$			
4.41	$-CH_2CH_2CH_2CH_2-$		10.26/11.03	
4.42	$-CH_2CH_2-O-CH_2-$			
4.43	$-CH_2CH_2-N(CH_3)-CH_2-$			
4.44	$-CH_2(C=O)CH_2CH_2-$			

[0267]

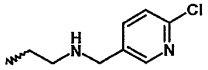
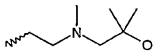
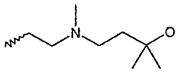
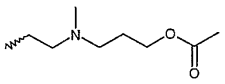
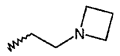
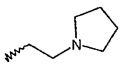
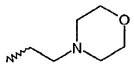
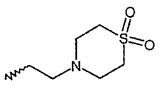
[0268] 표 A: 화학식 I의 화합물

번호	R_2	R_3
A.1	$CH_2C_6H_5$	H
A.2	*p*-ClC_6H_5	H
A.3	$(CH_2)_7CH_3$	H
A.4	$(CH_2)_3CH_3$	H
A.5	CH_2CH_3	H
A.6	CH_3	H
A.7	$CH(CH_3)_2$	H
A.8	$CH_2CH_2OCH_3$	H
A.9	CH_2CH_2OH	H
A.10	$CH(CH_3)CH_2OH$	H
A.11	$CH_2CH_2CH_2OH$	H
A.12	$CH(CH_3)CH_2CH_2OH$	H
A.13	$CH_2CH_2OC(=O)CH_3$	H
A.14	$CH_2(CH_2)_2OC(=O)CH_3$	H
A.15	$CH(CH_3)CH_2OC(=O)CH_3$	H
A.16	$CH(CH_3)(CH_2)_2OC(=O)CH_3$	H
A.17	$CH_2CH_2N_3$	H
A.18	$CH_2(CH_2)_2N_3$	H
A.19	$CH_2CH_2NH_2$	H
A.20	$CH_2CH_2OCH_2OCH_3$	H
A.21		H

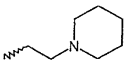
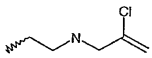
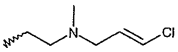
[0269]

번호	R_2	R_3
A.22	n-Pr	H
A.23	n-Hexyl	H
A.24	$CH(CH_3)CH_2CH_2N_3$	H
A.25	$CH_2CH_2OC(=O)OCH_3$	H
A.26	$CH_2CH_2OC(=O)NHCH_3$	H
A.27	$CH_2CH_2OC(=O)N(CH_3)_2$	H
A.28	$CH_2CH_2NHC(=O)NHCH_3$	H
A.29	$CH_2CH_2NHC(=O)NHC_6H_5$	H
A.30	$CH_2CH_2NHC(=O)OC_6H_5$	H
A.31	$CH_2CH_2NHC(=S)NHC_6H_5$	H
A.32	$CH_2CH_2NHC(=O)OCH_3$	H
A.33	$CH_2CH_2NHC(=O)NHCH_3$	H
A.34	$CH_2CH_2NHC(=O)N(CH_3)_2$	H
A.35	$CH_2CH_2NHC(=S)NHCH_3$	H
A.36	$CH_2CH_2NHCH_3$	H
A.37	$CH_2CH_2N(CH_3)_2$	H
A.38	$CH_2CH_2SCH_3$	H
A.39	$CH_2CH_2S(O)CH_3$	H
A.40	$CH_2CH_2S(O)_2CH_3$	H
A.41	CH_3	CH_2Br
A.42	$CH_2CH=CH_2$	CH_2Br
A.43	CH_2CH_2NHCHO	H
A.44	$CH_2CH_2N(CH_3)CHO$	H
A.45	$CH_2CH_2NHCH_2COOCH_3$	H
A.46	CH_2COCH_3	H
A.47	$-CH_2-CH_2-NH-C(=O)-CH_3$	H
A.48	$-CH_2-CH_2-NH-C(=O)-CH_2-O-CH_3$	H
A.49	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)-C(=O)-CH_3$	H
A.50	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)-C(=O)-CH_2-O-CH_3$	H
A.51	$-CH_2-CH_2-CH_2-NH-C(=O)-H$	H
A.52	$-CH_2-CH_2-CH_2-NH-C(=O)-CH_3$	H
A.53	$-CH_2-CH_2-CH_2-NH-C(=O)-CH_2-O-CH_3$	H
A.54	$-CH_2-CH_2-CH_2-N(CH_3)-C(=O)-H$	H

[0270]

번호	R_2	R_3
A.55	$-CH_2-CH_2-CH_2-N(CH_3)-C(=O)-CH_3$	H
A.56	$-CH_2-CH_2-CH_2-N(CH_3)-C(=O)-CH_2-O-CH_3$	H
A.57	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)-CH_2-CH_3$	H
A.58	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)-CH_2-CH=CH_2$	H
A.59	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)-CH_2-C(=O)-O-CH_2-CH_3$	H
A.60	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)-CH_2-C_6H_5$	H
A.61		H
A.62	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)-CN$	H
A.63	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)-CH_2-CH_2-OH$	H
A.64		H
A.65		H
A.66		H
A.67	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)-CH_2-C\equiv CH$	H
A.68	$-CH_2-CH_2-NH-SO_2-CH_3$	H
A.69	$-CH_2-CH_2-NH-CH_2-CH_2-CN$	H
A.70	$-CH_2-CH_2-N(CH_3)-CH(CH_3)_2$	H
A.71		H
A.72		H
A.73		H
A.74		H

[0271]

번호	R_2	R_3
A.75		H
A.76		H
A.77		H
A.78	$CH_2CH_2CH_2$	
A.79	$CH_2CH_2CH_2CH_2$	

[0272]

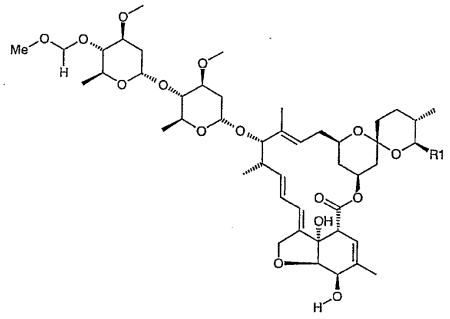
[0273] 표 5: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0274] 표 6: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0275] 표 7: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0276] 표 8: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3

의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.



[0277]

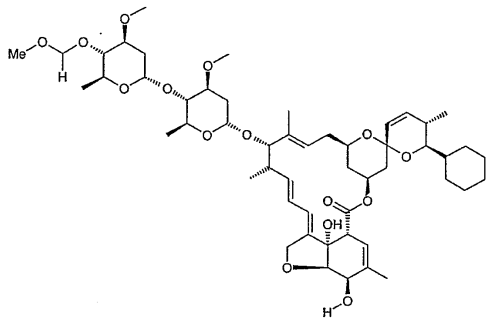
[0278] R_1이 2급-부틸인 유도체에 대한 HPLC 분석에서의 체류 시간: 13.83분

[0279] R_1이 이소프로필인 유도체에 대한 HPLC 분석에서의 체류 시간: 13.40분

[0280] 표 9: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0281] 표 10: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0282] 표 11: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 -CH=CH-, Q가 H이며, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.



[0283]

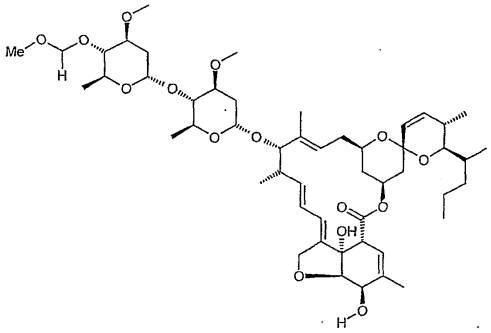
[0284] HPLC 분석에서의 체류 시간: 12.43분

[0285] 표 12: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0286] 표 13: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합무에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0287] 표 14: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0288] 표 15: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.



[0289]

[0290] HPLC 분석에서의 체류 시간: 13.37분

[0291] 표 16: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0292] 표 17: R_1이 에틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0293] 표 18: R_1이 에틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0294] 표 19: R_1이 에틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0295] 표 20: R_1이 에틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이며, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0296] 표 21: R_1이 메틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0297] 표 22: R_1이 메틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0298] 표 23: R_1이 메틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0299] 표 24: R_1이 메틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0300] 표 25: R_1이 i-프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0301] 표 26: R_1이 i-프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0302] 표 27: R_1이 i-프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0303] 표 28: R_1이 i-프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ia의 화합물.

[0304] 표 29: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고,각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0305] 표 30: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2

및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

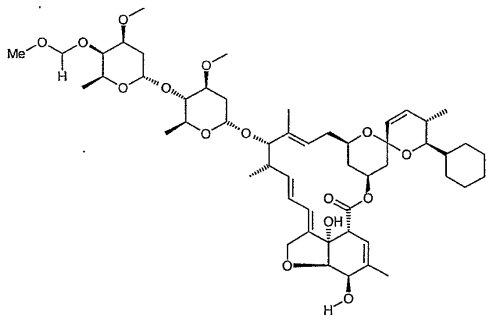
[0306] 표 31: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0307] 표 32: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0308] 표 33: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0309] 표 34: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0310] 표 35: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.



[0311]

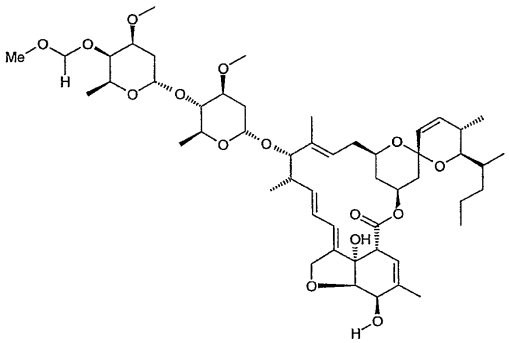
[0312] HPLC 분석에서의 체류 시간: 11.36분

[0313] 표 36: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0314] 표 37: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0315] 표 38: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0316] 표 39: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.



[0317]

[0318] HPLC 분석에서의 체류 시간: 12.59분

[0319] 표 40: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0320] 표 41: R_1이 에틸이고, A-B가 Q가 TBDMS이며, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0321] 표 42: R_1이 에틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0322] 표 43: R_1이 에틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0323] 표 44: R_1이 에틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0324] 표 45: R_1이 에틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0325] 표 46: R_1이 에틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0326] 표 47: R_1이 메틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0327] 표 48: R_1이 메틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0328] 표 49: R_1이 -프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0329] 표 50: R_1이 -프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0330] 표 51: R_1이 i-프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0331] 표 52: R_1이 i-프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ib의 화합물.

[0332] 표 53: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0333] 표 54: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0334] 표 55: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0335] 표 56: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0336]

번호	R_2	R_3	체류 시간(분)	
			B1a	B1b
56.6	CH_3	H	12.75	11.95
56.7	$CH(CH_3)_2$	H	13.87	13.07
56.78	$CH_2CH_2CH_2$		12.86, 12.21	12.11, 11.57

[0337] 표 57: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0338]

번호	R_2	R_3	체류 시간(분)
57.6	CH_3	H	15.42
57.7	$CH(CH_3)_2$	H	15.79

[0339] 표 58: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0340] 표 59: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0341]

번호	R_2	R_3	체류 시간(분)
59.6	CH_3	H	11.31
59.7	$CH(CH_3)_2$	H	12.56

[0342] 표 60: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0343] 표 61: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0344]

번호	R_2	R_3	체류 시간(분)
61.6	CH_3	H	15.36
61.7	$CH(CH_3)_2$	H	15.79

[0345] 표 62: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0346] 표 63: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0347]

번호	R_2	R_3	체류 시간(분)
63.6	CH_3	H	11.09
63.7	$CH(CH_3)_2$	H	12.27

[0348] 표 64: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표

A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0349] 표 65: R_1이 에틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0350] 표 66: R_1이 에틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0351] 표 67: R_1이 에틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0352] 표 68: R_1이 에틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0353] 표 69: R_1이 메틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0354] 표 70: R_1이 메틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0355] 표 71: R_1이 메틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0356] 표 72: R_1이 메틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0357] 표 73: R_1이 i-프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0358] 표 74: R_1이 i-프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0359] 표 75: R_1이 i-프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0360] 표 76: R_1이 i-프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Ic의 화합물.

[0361] 표 77: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0362] 표 78: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B is $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0363] 표 79: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0364] 표 80: R_1이 2급-부틸 또는 이소프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0365] 표 81: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0366] 표 82: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0367] 표 83: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0368] 표 84: R_1이 사이클로헥실이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0369] 표 85: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0370] 표 86: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0371] 표 87: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0372] 표 88: R_1이 1-메틸-부틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0373] 표 89: R_1이 에틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0374] 표 90: R_1이 에틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이고, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0375] 표 91: R_1이 에틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0376] 표 92: R_1이 에틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0377] 표 93: R_1이 메틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0378] 표 94: R_1이 메틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0379] 표 95: R_1이 메틸이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0380] 표 96: R_1이 메틸이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0381] 표 97: R_1이 i-프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0382] 표 98: R_1이 i-프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 TBDMS이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0383] 표 99: R_1이 i-프로필이고, A-B가 -CH=CH-이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0384] 표 100: R_1이 i-프로필이고, A-B가 $-CH_2-CH_2-$이며, Q가 H이고, 각 화합물에 대한 치환체 R_2 및 R_3의 조합이 표 A의 A.1 행 내지 A.79 행에 해당되는 화학식 Id의 화합물.

[0385] 작물 보호에서 사용하기 위한 제형 실시예(%=중량%)

[0386] 실시예 F1: 유화성 농축액 (a) (b) (c)

[0387] 활성 성분 25% 40% 50%

[0388] 칼슘 도데실벤젠설포네이트 5% 8% 6%

[0389] 피마자유 폴리에틸렌 글리콜

[0390] 에테르(EO 36mol) 5% - -

[0391] 트리부틸페놀 폴리에틸렌 글리콜

[0392] 에테르(EO 30mol) - 12% 4%

[0393] 사이클로헥사논 - 15% 20%

[0394] 크실렌 혼합물 65% 25% 20%

[0395] 미분된 활성 성분과 첨가제를 함께 혼합하여, 물로 희석시 목적하는 농도의 에멀젼이 생성되는 유화성 농축액을 수득한다.

[0396] 실시예 F2: 용액 (a) (b) (c) (d)

[0397] 활성 성분 80% 10% 5% 95%

[0398] 에틸렌 글리콜 모노메틸 에테르 20% - -

[0399] 폴리에틸렌 글리콜(MW 400) 70% - -

[0400] N-메틸피롤리드-2-온 20% - - -

[0401] 에폭시화 코코넛유 - - 1% 5%

[0402] 석유 에테르(비등 범위 160 내지 190℃) - - 94% -

[0403] 미분된 활성 성분과 첨가제를 함께 혼합하여, 미세적가 형태로 적용하기에 적합한 용액을 수득한다.

[0404] 실시예 F3: 과립 (a) (b) (c) (d)

[0405] 활성 성분 5% 10% 8% 21%

[0406] 카올린 94% - 79% 54%

[0407] 고분산 규산 1% - 13% 7%

[0408] 애타풀자이트 - 90% - 18%

[0409] 활성 성분을 디클로로메탄 속에 용해시키고, 용액을 담체 혼합물에 분무하고, 용매를 진공하에 증발 제거한다.

[0410] 실시예 F4: 습윤성 산제 (a) (b) (c)

[0411] 활성 성분 25% 50% 75%

[0412] 나트륨 리그노설페이트 5% 5% -

[0413] 나트륨 라우릴 설페이트 3% - 5%

[0414] 나트륨 디이소부틸나프탈렌-설포네이트 - 6% 10%

[0415] 옥틸페놀 폴리에틸렌 글리콜 에테르 - 2% -

[0416] (EO 7 내지 8mol)

[0417] 고분산 규산 5% 10% 10%

[0418] 카올린 62% 27% -

[0419] 활성 성분 및 첨가제를 혼합물과 함께 혼합하고, 혼합물을 적합한 밀에서 분쇄시켜, 물로 희석하여 목적하는 농도의 현탁액이 생성될 수 있는 습윤성 산제를 수득한다.

[0420] 실시예 F5: 유화성 농축액

[0421] 활성 성분 10%

[0422] 옥틸페놀 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0423] (EO 4 내지 5mol) 3%

[0424] 칼슘 도데실벤젠설포네이트 3%

[0425] 피마자유 폴리에틸렌 글리콜 에테르 4%

[0426] (EO 36mol)

[0427] 사이클로헥사논 30%

[0428] 크실렌 혼합물 50%

[0429] 미분된 활성 성분과 첨가제를 함께 혼합하여, 물로 희석시 목적하는 농도의 에멀젼이 생성되는 유화성 농축액을 수득한다.

[0430] 실시예 F6: 압출 과립

[0431] 활성 성분 10%

[0432] 나트륨 리그노설포네이트 2%

[0433] 카복시메틸셀룰로즈 1%

[0434] 카올린 87%

[0435] 활성 성분과 첨가제를 함께 혼합하고, 혼합물을 분쇄시키고, 물로 습윤화시키고 과립화시키고, 과립을 공기 스트림에서 건조시킨다.

[0436] 실시예 F7: 피복된 과립

[0437] 활성 성분 3%

[0438] 폴리에틸렌 글리콜(MW 200) 3%

[0439] 카올린 94%

[0440] 미분된 활성 성분을 혼합기내에서 폴리에틸렌 글리콜로 습윤화된 카올린에 균일하게 적용하여 비-분진 피복된 과립을 수득한다.

[0441] 실시예 F8: 현탁 농축액

[0442] 활성 성분 40%

[0443] 에틸렌 글리콜 10%

[0444] 노닐페놀 폴리에틸렌 글리콜 에테르(EO 15mol) 6%

[0445] 나트륨 리그노설포네이트 10%

[0446] 카복시메틸셀룰로즈 1%

[0447] 포름알데히드 수용액(37%) 0.2%

[0448] 수성 실리콘 오일 에멀젼(75%) 0.8%

[0449] 물 32%

[0450] 미분된 활성 성분과 첨가제를 함께 혼합하여, 물로 희석시 목적하는 농도의 현탁액이 생성되는 현탁 농축액을 수득한다.

[0451] 생물학적 실시예

[0452] 실시예 B1: 스포도프테라 리토랄리스(*Spodoptera littoralis*)에 대한 작용:

[0453] 어린 대두 식물에 시험 화합물 12.5ppm을 포함하는 수성 에멀젼 분무 혼합물을 분무하고, 분무-피복물이 건조된 후, 제1 단계에서 식물에 스포도프테라 리토랄리스 유충 10마리를 접종시킨 다음, 플라스틱 용기내에 놓는다. 3일 후, 개체수 감소율(%) 및 식해(食害)의 감소율(%)(% 활성)을, 처리된 식물에서의 죽은 유충의 수 및 식해와 미처리된 식물에서의 죽은 유충의 수 및 식해를 비교하여 측정한다.

[0454] 상기 표의 화합물들은 본 시험에서 우수한 활성을 나타낸다. 특히, 화합물 1.5, 1.6, 2.6, 3.2, 3.5, 3.6, 3.8, 3.19, 4.8 및 4.18이 본 시험에서 80% 이상의 활성을 나타낸다.

[0455] 실시예 B2: 스포도프테라 리토랄리스에 대한 전신 작용:

[0456] 옥수수 실생을 시험 용액 속에 놓는다. 6일 후, 잎을 잘라내어 페트리 접시내의 습윤화된 여과지 위에 놓고, L_1 단계에서 12 내지 15마리의 스포도프테라 리토랄리스 유충으로 감염시킨다. 4일 후, 개체수 감소율(%)(% 활성)을, 처리된 식물에서의 죽은 유충의 수와 처리되지 않은 식물에서의 죽은 유충의 수를 비교하여 측정한다.

[0457] 상기 표의 화합물들은 본 시험에서 우수한 활성을 나타낸다. 특히 화합물 2.6, 3.6, 3.19. 4.8 및 4.18이 본 시험에서 80% 이상의 활성을 나타낸다.

[0458] 실시예 B3: 헬리오티스 비레센스(*Heliothis virescens*)에 대한 작용

[0459] 0 내지 24시간이 지난 헬리오티스 비레센스의 30 내지 35개의 알을 인공 영양물 층 위의 페트리 접시내의 여과지에 놓는다. 이어서, 시험 용액 0.8ml을 상기 여과지로 피펫으로 옮긴다. 6일 후, 평가를 수행한다. 개체수 감소율(%)(% 활성)을, 상기 여과지 위의 죽은 알 및 유충의 수와 미처리된 여과지 위의 죽은 알 및 유충의 수를 비교하여 측정한다. 특히 화합물 1.5, 1.6 및 4.8이 본 시험에서 80% 이상의 활성을 나타낸다.

[0460] 상기 표의 화합물들은 본 시험에서 우수한 활성을 나타낸다.

[0461] 실시예 B4: 플루텔라 크실로스텔라(*Plutella xylostella*) 유충에 대한 작용

[0462] 어린 양배추 식물에 시험 화합물 12.5ppm을 포함하는 수성 에멀젼 분말 혼합물을 분무하고, 분무-피복물이 건조된 후, 제 1단계에서 플루텔라 크실로스텔라의 유충 10 마리를 접종시키고, 플라스틱 용기내에 놓는다. 3일 후, 평가를 수행한다. 개체수 감소율(%) 및 식해의 감소율(%)(% 활성)을, 처리된 식물에서의 죽은 유충의 수 및 식해와 미처리된 식물에서의 죽은 유충의 수 및 식해를 비교하여 측정한다.

[0463] 상기 표의 화합물들은 본 시험에서 플루텔라 크실로스텔라에 대한 우수한 활성을 나타낸다. 특히 화합물 2.5, 2.8, 4.5, 4.6 및 4.8이 본 시험에서 80% 이상의 활성을 나타낸다.

[0464] 실시예 B5: 디아브로티카 발테아타(*Diabrotica balteata*)에 대한 작용

[0465] 옥수수 실생에 시험 화합물 12.5ppm을 포함하는 수성 에멀젼 분무 혼합물을 분무하고, 분무-피복물을 건조시킨 후, 제2 단계에서 10마리의 디아브로티카 발테아타 유충을 접종시킨 다음, 플라스틱 용기내에 놓는다. 6일 후, 개체수의 감소율(%)(% 활성)을, 처리된 식물에서의 죽은 유충의 수와 미처리된 식물에서의 죽은 유충의 수를 비교하여 측정한다.

[0466] 상기 표의 화합물들은 본 시험에서 우수한 활성을 나타낸다. 특히, 화합물 1.5, 1.6, 2.6 및 4.8이 본 시험에서 80% 이상 효과적이다.

[0467] 실시예 B6: 테트라니쿠스 우르티카에(*Tetranychus urticae*)에 대한 작용

[0468] 어린 대두 식물에 테트라니쿠스 우티카에의 혼합된 개체군을 접종시키고, 1일 후, 시험 화합물 12.5ppm을 포함하는 수성 에멀젼 분무 혼합물을 분무하고, 6일 동안 25℃에서 항온처리한 다음, 평가한다. 개체수 감소율(%)(% 활성)을, 처리된 식물에서의 죽은 알, 유충 및 성충의 수와 미처리된 식물에서의 죽은 알, 유충 및 성충의 수를 비교하여 측정한다.

[0469] 상기 표의 화합물들은 본 시험에서 우수한 활성을 나타낸다. 특히, 화합물1.5, 1.6, 2.6, 3.2, 3.5, 3.6, 3.8, 3.19, 4.8 및 4.18이 본 시험에서 80% 이상의 활성을 나타낸다.