



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2014-0033354
(43) 공개일자 2014년03월18일

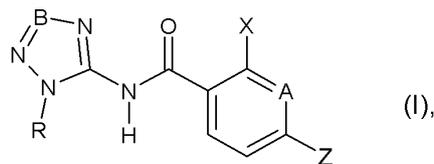
- | | |
|---|--|
| <p>(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
C07D 249/14 (2006.01) C07D 257/06 (2006.01)
A01N 43/653 (2006.01) A01N 43/713 (2006.01)
A01P 13/00 (2006.01)</p> <p>(21) 출원번호 10-2013-7027333</p> <p>(22) 출원일자(국제) 2012년03월21일
심사청구일자 없음</p> <p>(85) 번역문제출일자 2013년10월16일</p> <p>(86) 국제출원번호 PCT/EP2012/054981</p> <p>(87) 국제공개번호 WO 2012/130685
국제공개일자 2012년10월04일</p> <p>(30) 우선권주장
11159755.5 2011년03월25일
유럽특허청(EPO)(EP)
61/467,619 2011년03월25일 미국(US)</p> | <p>(71) 출원인
바이엘 인텔렉처 프로퍼티 게엠베하
독일, 40789 몬헤임 엠 레인, 알프레드-노엘-스트라쎄 10</p> <p>(72) 발명자
푸레이 파비엔
독일 65936 프랑크푸르트 두나트링 89
판 알름직크 안드레아스
독일 61184 카르벤 암 브로일 4베
(뒷면에 계속)</p> <p>(74) 대리인
최규팔</p> |
|---|--|

전체 청구항 수 : 총 7 항

(54) 발명의 명칭 HPPD 억제 제조제에 대해서 내성인 유전자이식 농작물의 영역에서 원치 않는 식물을 방제하기 위한 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 그의 염의 용도

(57) 요약

본 발명은 (I) (a) 아베나, (b) 슈도모나스, (c) 시네코코코이테아에, (d) 블레파리스미다에, (e) 로도코커스, (f) 피크로필라세아에, (g) 코르디아로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열을 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유함으로써 HPPD 억제 제조제에 대해 내성인 유전자이식 농작물의 영역에서 원치 않는 식물을 방제하기 위한 하기 화학식 I의 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 용도에 관한 것이다.



(72) 발명자

브라운 칼프

독일 76857 람베르크 비쇼프-벡-슈트라쎬 1아

라베르 베른트

독일 65510 이트슈타인 그라프-폰-슈타우펜베르크
-슈트라쎬 12

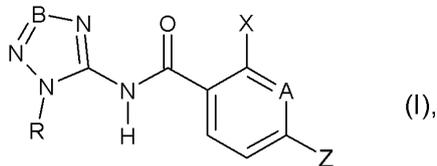
하인 뤼디거

독일 60594 프랑크푸르트 드라이아이히슈트라쎬 44

특허청구의 범위

청구항 1

(I) (a) 아베나, (b) 슈도모나스, (c) 시네코코코이데아에, (d) 블레파리스미다에, (e) 로도코쿠스, (f) 피크로필라세아에, (g) 코르디아로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열을 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유함으로써 HPPD 억제제 초제에 대해 내성인 유전자이식 농작물의 영역에서 원치 않는 식물을 방제하기 위한 화학식 I의 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 용도:



상기 식에서,

A는 N 또는 CY이고,

B는 N 또는 CH이며,

X는 니트로, 할로젠, 시아노, 포르밀, 티오시아네이트, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₃-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-OCOR¹, (C₁-C₆)-알킬-OSO₂R², (C₁-C₆)-알킬-CO₂R¹, (C₁-C₆)-알킬-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R², NR₁R₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴이고, 여기에 서 마지막으로 언급된 두 개의 래디칼은 각각의 경우에 s 개의 할로젠, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시 및/또는 할로-(C₁-C₆)-알콕시 래디칼에 의해 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하고,

Y는 수소, 니트로, 할로젠, 시아노, 티오시아네이트, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알케닐, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, CO(NOR¹)R¹, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-OCOR¹, (C₁-C₆)-알킬-OSO₂R², (C₁-C₆)-알킬-CO₂R¹, (C₁-C₆)-알킬-CN, (C₁-C₆)-알킬-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, (C₁-C₆)-알킬-페닐, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, 페닐, 헤테로아릴 또는 헤테로사이클릴이며, 여기에서 마지막 6 개의 래디칼은 각각의 경우에 할로젠, 니트로, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시, 할로-(C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-알콕시-(C₁-C₄)-알킬 및 시아노메틸로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되고, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함

하며,

Z는 할로젠, 시아노, 티오시아네이트, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-OCOR¹, (C₁-C₆)-알킬-OSO₂R², (C₁-C₆)-알킬-CO₂R¹, (C₁-C₆)-알킬-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, 헤테로아릴, 헤테로사이클릴 또는 페닐이고, 여기에서 마지막 3 개의 래디칼은 각각의 경우에 할로젠, 니트로, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시 또는 할로-(C₁-C₆)-알콕시로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하거나,

그렇지 않으면 Z는 Y가 래디칼 S(O)_nR²인 경우에, 수소, (C₁-C₆)-알킬 또는 (C₁-C₆)-알콕시일 수 있고,

R은 (C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₇)-사이클로알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₂-C₆)-알키닐, CH₂R⁶, 헤테로아릴, 헤테로사이클릴 또는 페닐이며, 여기에서 마지막 3 개의 래디칼은 각각의 경우에 할로젠, 니트로, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시, 할로-(C₁-C₆)-알콕시 및 (C₁-C₆)-알콕시-(C₁-C₄)-알킬로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되고,

R¹은 수소, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-할로알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₂-C₆)-할로알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알케닐, (C₃-C₆)-할로사이클로알킬, (C₁-C₆)-알킬-O-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 페닐, 페닐-(C₁-C₆)-알킬, 헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, 헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로사이클릴이며, 여기에서 마지막으로 언급된 21 개의 래디칼은 시아노, 할로젠, 니트로, 티오시아네이트, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ 및 (C₁-C₄)-알콕시-(C₂-C₆)-알콕시카보닐로 구성된 그룹으로의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되고, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하며,

R²는 (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-할로알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₂-C₆)-할로알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알케닐, (C₃-C₆)-할로사이클로알킬, (C₁-C₆)-알킬-O-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 페닐, 페닐-(C₁-C₆)-알킬, 헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, 헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로사이클릴이고, 여기에서 마지막으로 언급된 21 개의 래디칼은 시아노, 할로젠, 니트로, 티오시아네이트, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ 및 (C₁-C₄)-알콕시-(C₂-C₆)-알콕시카보닐로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하고,

R³는 수소, (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬 또는 (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-

C₆)-알킬이며,

R⁴는 (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐 또는 (C₂-C₆)-알키닐이고,

R⁵는 메틸 또는 에틸이며,

R⁶은 아세톡시, 아세트아미도, N-메틸아세트아미도, 벤조일옥시, 벤즈아미도, N-메틸벤즈아미도, 메톡시카보닐, 에톡시카보닐, 벤조일, 메틸카보닐, 피페리디닐카보닐, 모르폴리닐카보닐, 트리플루오로메틸카보닐, 아미노카보닐, 메틸아미노카보닐, 디메틸아미노카보닐, (C₁-C₆)-알콕시 또는 (C₃-C₆)-사이클로알킬이거나, 각각의 경우에 메틸, 에틸, 메톡시, 트리플루오로메틸 및 할로젠으로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환된 헤테로아릴, 헤테로사이클릴 또는 페닐이고,

n은 0, 1 또는 2이며,

s는 0, 1, 2 또는 3이다.

청구항 2

제1항에 있어서, 화학식 I에서

A는 N 또는 CY이고,

B는 N 또는 CH이며,

X는 니트로, 할로젠, 시아노, 티오시아네이토, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₃-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₁-C₆)-알킬-O-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, COR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-OCOR¹, (C₁-C₆)-알킬-OSO₂R², (C₁-C₆)-알킬-CO₂R¹, (C₁-C₆)-알킬-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹ 또는 (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R², (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴이고, 여기에서 마지막으로 언급된 2 개의 래디칼은 각각의 경우에 s 개의 할로젠, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시 및/또는 할로-(C₁-C₆)-알콕시 래디칼에 의해서 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하고,

Y는 수소, 니트로, 할로젠, 시아노, 티오시아네이토, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₃-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알케닐, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, COR¹, OR¹, COOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-OCOR¹, (C₁-C₆)-알킬-OSO₂R², (C₁-C₆)-알킬-CO₂R¹, (C₁-C₆)-알킬-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R², (C₁-C₆)-알킬-페닐, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, 페닐, 헤테로아릴 또는 헤테로사이클릴이며, 여기에서 마지막 6 개의 래디칼은 각각의 경우에 할로젠, 니트로, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시, 할로-(C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-알콕시-(C₁-C₄)-알킬 및 시아노메틸로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되고, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하며,

Z는 할로젠, 시아노, 티오시아네이토, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₃-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-

(C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, COR¹, COOR¹, C(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-OCOR¹, (C₁-C₆)-알킬-OSO₂R², (C₁-C₆)-알킬-CO₂R¹, (C₁-C₆)-알킬-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R² 또는 1,2,4-트리아졸-1-일이거나,

그렇지 않으면 Z는 Y가 래디칼 S(O)_nR²인 경우에, 수소, (C₁-C₆)-알킬 또는 (C₁-C₆)-알콕시일 수 있고,

R은 (C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₇)-사이클로알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₇)-사이클로알킬메틸, 메톡시카보닐메틸, 에톡시카보닐메틸, 아세틸메틸, 메톡시메틸, 또는 각각 메틸, 메톡시, 트리플루오로메틸 및 할로겐으로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환된 페닐 또는 벤질이며,

R¹은 수소, (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알킬-O-(C₁-C₆)-알킬, 페닐, 페닐-(C₁-C₆)-알킬, 헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, 헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로아릴 또는 (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로사이클릴이고, 여기에서 마지막으로 언급된 16 개의 래디칼은 시아노, 할로겐, 니트로, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, CON(R³)₂ 및 (C₁-C₄)-알콕시-(C₂-C₆)-알콕시카보닐로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하고,

R²는 (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알킬-O-(C₁-C₆)-알킬, 페닐, 페닐-(C₁-C₆)-알킬, 헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, 헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로아릴 또는 (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로사이클릴이며, 여기에서 이들 래디칼은 시아노, 할로겐, 니트로, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, NR³SO₂R⁴, COR³, OCOR³, NR³COR³, CO₂R³, CON(R³)₂ 및 (C₁-C₄)-알콕시-(C₂-C₆)-알콕시카보닐로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되고, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하며,

R³은 수소, (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬 또는 (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬이고,

R⁴는 (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐 또는 (C₂-C₆)-알키닐이며,

n은 0, 1 또는 2이고,

s는 0, 1, 2 또는 3인 용도.

청구항 3

제1항에 있어서, 화학식 I에서

A는 N 또는 CY이고,

B는 N 또는 CH이며,

X는 니트로, 할로겐, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, OR¹, S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알

킬-NR¹SO₂R², (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴 또는 (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴이고, 여기에서 마지막으로 언급된 2 개의 래디칼은 각각의 경우에 s 개의 할로젠, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시 및/또는 할로-(C₁-C₆)-알콕시 래디칼에 의해서 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하고,

Y는 수소, 니트로, 할로젠, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, OR¹, S(O)_nR², SO₂N(R¹)₂, N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R², (C₁-C₆)-알킬-페닐, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, 페닐, 헤테로아릴 또는 헤테로사이클릴이며, 여기에서 마지막 6 개의 래디칼은 각각의 경우에 할로젠, 니트로, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시, 할로-(C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-알콕시-(C₁-C₄)-알킬, 및 시아노메틸로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되고, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하며,

Z는 할로젠, 시아노, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, S(O)_nR² 또는 1,2,4-트리아졸-1-일이거나, 그렇지 않으면 Z는 Y가 래디칼 S(O)_nR²인 경우에 수소, 메틸, 메톡시 또는 에톡시일 수 있고,

R은 (C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₇)-사이클로알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₇)-사이클로알킬메틸, 메톡시카보닐메틸, 에톡시카보닐메틸, 아세틸메틸 또는 메톡시메틸이거나, 메틸, 메톡시, 트리플루오로메틸 및 할로젠으로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환된 페닐이며,

R¹은 수소, (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알킬-O-(C₁-C₆)-알킬, 페닐, 페닐-(C₁-C₆)-알킬, 헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, 헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로아릴 또는 (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로사이클릴이고, 여기에서 마지막으로 언급된 16 개의 래디칼은 시아노, 할로젠, 니트로, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, CON(R³)₂, 및 (C₁-C₄)-알콕시-(C₂-C₆)-알콕시카보닐로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하고,

R²는 (C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬 또는 (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬이며, 여기에서 이들 전술한 3 개의 래디칼은 각각의 경우에 할로젠 및 OR³로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되고,

R³은 수소 또는 (C₁-C₆)-알킬이며,

R⁴는 (C₁-C₆)-알킬이고,

n은 0, 1 또는 2이며,

s는 0, 1, 2 또는 3인 용도.

청구항 4

(I) (a) 아베나, (b) 슈도모나스, (c) 시네코코코이테아에, (d) 블레파리스미다에, (e) 로도코쿠스, (f) 피크로필라세아에, (g) 코르디아로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열을 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메릭 유전자(들)를 함유함으로써 HPPD 억제제 제조에 대해 내성인 유전자이식 농작물의 영역에서 (a) 원치 않는 식물, (b) 원치 않는 식물의 종자, 및/또는 (c) 식물이 성장하고 있는 영역에 제1항에 따르는 하나 또는 그 이상의 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-

3-일)아릴카복사미드를 적용하는 것을 포함하여, 원치 않는 식물을 방제하는 방법.

청구항 5

제4항에 있어서, 상기 유전자이식 식물이 아라키스, 베타, 브라시카, 쿠쿠미스, 쿠쿠르비타, 헬리안투스, 다우쿠스, 글리신, 고시뽀, 이포모에아, 락투카, 리눔, 라이코페르시콘, 니코티아나, 파세올루스, 피숨, 솔라눔, 및 비시아로 구성된 쌍자엽 작물의 그룹, 또는 알룸, 아나나스, 아스파라거스, 아베나, 호르데움, 오리자, 파니쿰, 사카룸, 세케일, 소르غم, 트리티케일, 트리티쿰, 제아로 구성된 단자엽 작물의 그룹에 속하는 방법.

청구항 6

제4항 또는 제5항에 있어서, 제1항에 따르는 하나 또는 그 이상의 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드를 혼합 제제로서, 또는 탱크 믹스로서 트리케톤 또는 피라졸리네이트 제초제로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 또는 그 이상의 HPPD 억제 제초제와 함께, 및/또는 아세토락테이트 신타제, 아세틸-CoA 카복실라제, 셀룰로즈 신타제, 에놀피루빌시킴에이트-3-포스페이트 신타제, 글루타민 신데타제, p-하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제, 파이토엔 테세투라제, 포토시스TEM I, 포토시스TEM II, 프로토포르피리노겐 옥시다제의 억제에 기초하거나 성장 조절제로서 작용하는 추가의 공지된 활성 물질과 함께 적용하는 방법.

청구항 7

제6항에 있어서, 하나 또는 그 이상의 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드를 템보트리온, 메소트리온, 비사이클로피론, 테푸릴트리온, 피라살포톨, 피라졸레이트, 디케토니트릴, 벤조페남, 및 솔코트리온으로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 또는 그 이상의 HPPD 억제 제초제와 함께 적용하는 방법.

명세서

기술분야

[0001] 본 발명은 HPPD 억제 제초제에 대해 내성인 유전자이식 농작물의 영역에서 원치 않는 식물을 방제하기 위한 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드의 용도에 관한 것이다.

배경기술

[0002] EP 10174893 (2010년 9월 1일에 Bayer CropScience AG의 이름으로 EPO에 출원됨) 및 그의 상응하는 국제출원 PCT/EP2011/064820에는 몇 가지의 새로운 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 및 잡초 방제를 위한 HPPD 억제 제초제로서의 그들의 용도가 기술되어 있다.

[0003] 그러나, N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드의 제초활성은 몇 가지 농작물에 대해 이러한 농작물이 성장하는 영역에서 잡초 방제를 위한 제초제로서의 그들의 용도를 제한하는 손상을 야기할 수 있다.

[0004] HPPD 억제 제초제는 이들이 빠르게 분해되는 옥수수 (Zea mays)와 같은, 대사 내성 (metabolic tolerance)을 나타내는 농작물에서 풀 및/또는 광엽 잡초에 대해 사용될 수 있다 [Schulz et al., (1993). FEBS letters, 318, 162-166; Mitchell et al., (2001) Pest Management Science, Vol 57, 120-128; Garcia et al., (2000) Biochem., 39, 7501-7507; Pallett et al., (2001) Pest Management Science, Vol 57, 133-142]. 이들 HPPD 억제 제초제의 범위를 넓히기 위해서, 몇 가지의 노력이 식물, 특히 수준이 낮은 대사 내성이 있거나 없는 식물에게 작물 현장조건 하에서 허용되는 내성 수준을 부여하기 위하여 개발되었다.

[0005] 한편, 유전자이식 식물은 호모겐티세이트 (homogentisate)의 HPPD-매개된 생산을 우회하거나 (US 6,812,010), 민감성 효소를 과발현시켜 식물에서 제초제와 관련하여 충분한 양의 표적 효소의 생산이 수행되도록 조작되었다 [W096/38567].

[0006] 대신으로, HPP의 호모겐티세이트로의 변형을 촉진시키는 그의 특성을 유지하면서 돌연변이 전의 천연 HPPD보다 HPPD 억제 제초제에 대해서 덜 민감한 표적 효소를 획득하도록 다양한 위치에서 돌연변이된 HPPD 단백질을 발현하는 유전자이식 식물이 생성되었다 [예를 들어, EP496630, WO 99/24585 참조].

[0007] 더욱 최근에, 담배 및 대두의 색소체 계놈 내로의 슈도모나스 (Pseudomonas) HPPD 유전자의 도입이 적어도 하나의 HPPD 억제제의 발아-후 적용에 대한 내성까지를 부여하여 핵 변형보다 더 효과적인 것으로 나타났다

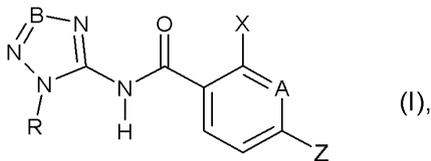
[Dufourmantel et al., 2007, Plant Biotechnol J.5(1):118-33].

- [0008] WO 2009/144079에는 슈도모나스 플루오레센스 (*Pseudomonas fluorescens*) HPPD 단백질의 위치 336에서 돌연변이된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 핵산 서열, 및 HPPD 억제 제조제에 대해 내성인 식물을 수득하기 위한 그의 용도가 기술되어 있다.
- [0009] WO 04/024928에서, 발명자들은 이들 식물의 세포 내로 HPP 전구체의 흐름을 증가시킴으로써 식물의 세포에서 프레닐퀴논 생합성 (예를 들어, 플라스토퀴논, 토코페롤의 합성)을 증가시키고자 하였다. 이것은 프레페네이트-데하이드로게나제 (PDH)의 과발현에 의해 상기 전구체의 합성을 "시키메이트 (shikimate)" 경로에 연결시킴으로써 수행되었다. 이들은 또한, PDH 효소를 코드화한 유전자에 의한 식물의 변형이 HPPD 억제제에 대한 상기 식물의 내성이 증가하도록 만들 수 있는 것으로 주목하였다.
- [0010] WO 2002/046387에는, HPPD를 코드화한 아베나 사티바 (*Avena sativa*)로부터 수득된 유전자가 이러한 유전자를 과발현하며, 따라서 다양한 HPPD-억제 제조제에 대한 내성을 야기하는 식물을 생성시키기 위해서 기술되었다.
- [0011] WO 2008/150473에는, HPPD 억제 제조제에 대한 개선된 내성을 수득하기 위한 두 가지 별개의 내성 기전, 즉 돌연변이체 HPPD 효소에 대해 코드화한 변형된 아베나 사티바 (*Avena sativa*) 유전자 및 CYP450 옥수수 모노옥시게나제 (nsf1 유전자)의 조합이 예시되어 있지만, 두 가지 단백질의 조합에 근거한 상승적 효과를 입증하는 어떤 데이터도 기술되지 않았다.
- [0012] WO 2010/085705에는, 아베나 사티바 HPPD의 몇 가지 돌연변이체뿐만 아니라 이러한 돌연변이된 HPPD를 코드화한 유전자를 포함하며, 따라서 비-돌연변이된 HPPD에 비해 다양한 HPPD-억제 제조제에 대해 증가된 내성을 야기하는 식물이 기술되어 있다.
- [0013] 최근에, 다양한 유기체로부터 HPPD 효소를 코드화한 몇 가지의 새로운 유전자가 확인되었으며, 다양한 HPPD 억제 제조제의 적용에 관한 내성의 작물학적으로 유용한 수준을 나타내는 농작물을 수득하기 위해서 사용되었다.
- [0014] HPPD 억제 제조제에 대한 이러한 내성의 이행에 관한 연구는 2010년 12월 22일에 Bayer CropScience AG의 이름으로 출원된 것으로 출원번호 PCT/EP2010/070561 (WO 2011/076877로 공개됨; 시네코코코이테아에 (*Synechococcoideae*) 아과 및 그의 특정한 돌연변이체에 속하는 박테리아로부터 수득된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 핵산 서열에 관한 것임); PCT/EP2010/070567 (WO 2011/076882로 공개됨; 블레파리스미다에 (*Blepharismidae*) 과에 속하는 원생생물로부터 수득된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제를 코드화); PCT/EP2010/070578 (WO 2011/076892로 공개됨; 로도코커스 (*Rhodococcus*) 속 및 그의 특정한 돌연변이체에 속하는 박테리아로부터 수득된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제를 코드화); PCT/EP2010/070570 (WO 2011/076885로 공개됨; 피크로필라세아에 (*Picrophilaceae*) 과에 속하는 유리아르카에 오타 (*Euryarchaeota*) 및 그의 특정한 돌연변이체로부터 수득된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제를 코드화); PCT/EP2010/070575 (WO 2011/076889로 공개됨; 코르디아 (*Kordia*) 속 및 그의 특정한 돌연변이체에 속하는 박테리아로부터 수득된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제를 코드화)를 가지며, 이에 의해 HPPD 억제 제조제에 대한 내성을 부여한 각각의 유전자이식 식물의 생산에 관한 참고로 포함된 PCT-출원에 기술되어 있다.
- [0015] 이제, N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드가 HPPD 억제 제조제에 대한 내성을 부여하는 하나 또는 그 이상의 유전자를 함유함으로써 HPPD 억제 제조제에 대해 내성인 유전자이식 농작물 상에서 사용될 수 있다는 것이 밝혀졌다.

발명의 내용

- [0016] 본 발명의 대상은 (I) (a) 아베나 (*Avena*), 바람직하게는 아베나 사티바 (*Avena sativa*), 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스 (*Pseudomonas*), 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스 (*Pseudomonas fluorescens*), 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에 (*Synechococcoideae*), 바람직하게는 시네코코커스 종 (*Synechococcus* sp.), 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에 (*Blepharismidae*), 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰 (*Blepharisma japonicum*), 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스 (*Rhodococcus*), 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트

레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에 (Picrophilaceae), 바람직하게는 피크로필루스 토리두스 (Picrophilus torridus), 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아 (Kordia), 바람직하게는 코르디아 알기시다 (Kordia algicida), 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메릭 유전자(들)를 함유함으로써 HPPD 억제 제초제에 대해 내성인 유전자이식 농작물의 영역에서 원치 않는 식물을 방제하기 위한 화학식 I의 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 용도에 관한 것이다:



[0017]

[0018]

[0019]

[0020]

[0021]

상기 식에서,

A는 N 또는 CY이고,

B는 N 또는 CH이며,

X는 니트로, 할로젠, 시아노, 포르밀, 티오시아네이트, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₃-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-OCOR¹, (C₁-C₆)-알킬-OSO₂R², (C₁-C₆)-알킬-CO₂R¹, (C₁-C₆)-알킬-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R², NR₁R₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴이고, 여기에서 마지막으로 언급된 두 개의 래디칼은 각각의 경우에 s 개의 할로젠, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시 및/또는 할로-(C₁-C₆)-알콕시 래디칼에 의해 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하고,

[0022]

Y는 수소, 니트로, 할로젠, 시아노, 티오시아네이트, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알케닐, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, CO(NOR¹)R¹, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-OCOR¹, (C₁-C₆)-알킬-OSO₂R², (C₁-C₆)-알킬-CO₂R¹, (C₁-C₆)-알킬-CN, (C₁-C₆)-알킬-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, CH₂P(O)(OR⁵)₂, (C₁-C₆)-알킬-페닐, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, 페닐, 헤테로아릴 또는 헤테로사이클릴이며, 여기에서 마지막 6 개의 래디칼은 각각의 경우에 할로젠, 니트로, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시, 할로-(C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-알콕시-(C₁-C₄)-알킬 및 시아노메틸로 구성된

그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되고, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하며,

[0023] Z는 할로젠, 시아노, 티오시아네이트, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, COR¹, COOR¹, OCOOR¹, NR¹COOR¹, C(O)N(R¹)₂, NR¹C(O)N(R¹)₂, OC(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-OCOR¹, (C₁-C₆)-알킬-OSO₂R², (C₁-C₆)-알킬-CO₂R¹, (C₁-C₆)-알킬-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R², N(R¹)₂, P(O)(OR⁵)₂, 헤테로아릴, 헤테로사이클릴 또는 페닐이고, 여기에서 마지막 3 개의 래디칼은 각각의 경우에 할로젠, 니트로, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시 또는 할로-(C₁-C₆)-알콕시로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하거나,

[0024] 그렇지 않으면 Z는 Y가 래디칼 S(O)_nR²인 경우에, 수소, (C₁-C₆)-알킬 또는 (C₁-C₆)-알콕시일 수 있고,

[0025] R은 (C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₇)-사이클로알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₂-C₆)-알키닐, CH₂R⁶, 헤테로아릴, 헤테로사이클릴 또는 페닐이며, 여기에서 마지막 3 개의 래디칼은 각각의 경우에 할로젠, 니트로, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시, 할로-(C₁-C₆)-알콕시 및 (C₁-C₆)-알콕시-(C₁-C₄)-알킬로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되고,

[0026] R¹은 수소, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-할로알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₂-C₆)-할로알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알케닐, (C₃-C₆)-할로사이클로알킬, (C₁-C₆)-알킬-O-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 페닐, 페닐-(C₁-C₆)-알킬, 헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, 헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로사이클릴이며, 여기에서 마지막으로 언급된 21 개의 래디칼은 시아노, 할로젠, 니트로, 티오시아네이트, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ 및 (C₁-C₄)-알콕시-(C₂-C₆)-알콕시카보닐로 구성된 그룹으로의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되고, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하며,

[0027] R²는 (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-할로알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₂-C₆)-할로알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알케닐, (C₃-C₆)-할로사이클로알킬, (C₁-C₆)-알킬-O-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 페닐, 페닐-(C₁-C₆)-알킬, 헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, 헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로사이클릴이고, 여기에서 마지막으로 언급된 21 개의 래디칼은 시아노, 할로젠, 니트로, 티오시아네이트, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, SCOR⁴, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, COSR⁴, CON(R³)₂ 및 (C₁-C₄)-알콕시-(C₂-C₆)-알콕시카보닐로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하고,

[0028] R³는 수소, (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬 또는 (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-

C₆)-알킬이며,

[0029] R⁴는 (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐 또는 (C₂-C₆)-알키닐이고,

[0030] R⁵는 메틸 또는 에틸이며,

[0031] R⁶은 아세톡시, 아세트아미도, N-메틸아세트아미도, 벤조일옥시, 벤즈아미도, N-메틸벤즈아미도, 메톡시카보닐, 에톡시카보닐, 벤조일, 메틸카보닐, 피페리디닐카보닐, 모르폴리닐카보닐, 트리플루오로메틸카보닐, 아미노카보닐, 메틸아미노카보닐, 디메틸아미노카보닐, (C₁-C₆)-알콕시 또는 (C₃-C₆)-사이클로알킬이거나, 각각의 경우에 메틸, 에틸, 메톡시, 트리플루오로메틸 및 할로겐으로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환된 헤테로아릴, 헤테로사이클릴 또는 페닐이고,

[0032] n은 0, 1 또는 2이며,

[0033] s는 0, 1, 2 또는 3이다.

[0034] 화학식 I 및 이하의 모든 화학식에서, 2 개 이상의 탄소 원자를 갖는 알킬 래디칼은 직쇄이거나 분지될 수 있다. 알킬 래디칼은 예를 들어, 메틸, 에틸, n- 또는 이소프로필, n-, 이소-, t- 또는 2-부틸, 펜틸, n-헥실, 이소헥실 및 1,3-디메틸부틸과 같은 헥실이다. 할로겐은 불소, 염소, 브롬 또는 요오드이다.

[0035] 헤테로사이클릴은 3 내지 6 개의 환 원자를 함유하고, 이들 중의 1 내지 4 개는 산소, 질소 및 황으로 구성된 그룹으로부터 선택되며, 추가로 벤조 환에 의해서 융합될 수 있는 포화되거나, 부분적으로 포화되거나, 완전히 불포화된 사이클릭 래디칼이다. 예를 들어, 헤테로사이클릴은 피페리디닐, 피롤리디닐, 테트라하이드로푸라닐, 디하이드로푸라닐, 4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일 및 옥세타닐이다.

[0036] 헤테로아릴은 3 내지 6 개의 환 원자를 함유하고, 이들 중의 1 내지 4 개는 산소, 질소 및 황으로 구성된 그룹으로부터 선택되며, 추가로 벤조 환에 의해서 융합될 수 있는 방향족 사이클릭 래디칼이다. 예를 들어, 헤테로아릴은 벤즈이미다졸-2-일, 푸라닐, 이미다졸릴, 이속사졸릴, 이소티아졸릴, 옥사졸릴, 피라지닐, 피리미디닐, 피리다지닐, 피리디닐, 벤즈이속사졸릴, 티아졸릴, 피롤릴, 피라졸릴, 티오펜일, 1,2,3-옥사디아졸릴, 1,2,4-옥사디아졸릴, 1,2,5-옥사디아졸릴, 1,3,4-옥사디아졸릴, 1,2,4-트리아졸릴, 1,2,3-트리아졸릴, 1,2,5-트리아졸릴, 1,3,4-트리아졸릴, 1,2,4-트리아졸릴, 1,2,4-티아디아졸릴, 1,3,4-티아디아졸릴, 1,2,3-티아디아졸릴, 1,2,5-티아디아졸릴, 2H-1,2,3,4-테트라졸릴, 1H-1,2,3,4-테트라졸릴, 1,2,3,4-옥사트리아졸릴, 1,2,3,5-옥사트리아졸릴, 1,2,3,4-티아트리아졸릴 및 1,2,3,5-티아트리아졸릴이다.

[0037] 그룹이 다수의 래디칼에 의해서 치환된 경우에, 이것은 이 그룹이 언급된 래디칼 중의 하나 또는 그 이상의 동일하거나 상이한 대표적 래디칼에 의해서 치환된 것을 의미한다.

[0038] 치환체의 성질 및 부착에 따라, 화학식 I의 화합물은 입체이성체로 존재할 수 있다. 예를 들어, 하나 또는 그 이상의 비대칭 탄소 원자가 존재하는 경우에는 에난티오머 및 부분입체이성체가 존재할 수 있다. 또한, n이 1 (설폰사이드)인 경우에는 입체이성체가 존재할 수 있다. 입체이성체는 제조로부터 생성되는 혼합물로부터 통상적인 분리방법을 사용하여, 예를 들어, 크로마토그래피 분리기술에 의해서 수득될 수 있다. 또한, 입체이성체는 광학적으로 활성인 출발물질 및/또는 보조제를 사용한 입체선택적 반응을 사용함으로써 선택적으로 제조할 수도 있다. 본 발명은 또한, 구체적으로 정의되지는 않지만 화학식 I의 화합물에 포함되는 모든 입체이성체 및 이들의 혼합물에 관한 것이다.

[0039] 바람직한 것은 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티마, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하

게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유함으로써 HPPD 억제 제조제에 대해 내성인 유전자이식 농작물의 영역에서 원치 않는 식물을 방제하기 위한

[0040] A가 N 또는 CY이고,

[0041] B가 N 또는 CH이며,

[0042] X는 니트로, 할로젠, 시아노, 티오시아네이트, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₃-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₁-C₆)-알킬-O-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, COR¹, OR¹, OCOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-OCOR¹, (C₁-C₆)-알킬-OSO₂R², (C₁-C₆)-알킬-CO₂R¹, (C₁-C₆)-알킬-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹ 또는 (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R², (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴이고, 여기에서 마지막으로 언급된 2 개의 래디칼은 각각의 경우에 s 개의 할로젠, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시 및/또는 할로-(C₁-C₆)-알콕시 래디칼에 의해서 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하고,

[0043] Y는 수소, 니트로, 할로젠, 시아노, 티오시아네이트, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₃-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알케닐, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, COR¹, OR¹, COOR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-OCOR¹, (C₁-C₆)-알킬-OSO₂R², (C₁-C₆)-알킬-CO₂R¹, (C₁-C₆)-알킬-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R², (C₁-C₆)-알킬-페닐, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, 페닐, 헤테로아릴 또는 헤테로사이클릴이며, 여기에서 마지막 6 개의 래디칼은 각각의 경우에 할로젠, 니트로, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시, 할로-(C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-알콕시-(C₁-C₄)-알킬 및 시아노메틸로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되고, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하며,

[0044] Z는 할로젠, 시아노, 티오시아네이트, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, 할로-(C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, 할로-(C₃-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, COR¹, COOR¹, C(O)N(R¹)₂, C(O)NR¹OR¹, OSO₂R², S(O)_nR², SO₂OR¹, SO₂N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-OCOR¹, (C₁-C₆)-알킬-OSO₂R², (C₁-C₆)-알킬-CO₂R¹, (C₁-C₆)-알킬-SO₂OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R² 또는 1,2,4-트리아졸-1-일이거나,

[0045] 그렇지 않으면 Z는 Y가 래디칼 S(O)_nR²인 경우에 수소, (C₁-C₆)-알킬 또는 (C₁-C₆)-알콕시일 수 있고,

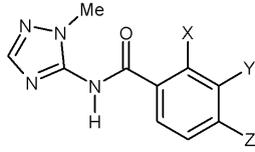
- [0046] R은 (C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₇)-사이클로알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₇)-사이클로알킬메틸, 메톡시카보닐메틸, 에톡시카보닐메틸, 아세틸메틸, 메톡시메틸, 또는 각각 메틸, 메톡시, 트리플루오로메틸 및 할로겐으로 구성된 그룹으로부터의 래디칼에 의해서 치환된 페닐 또는 벤질이며,
- [0047] R¹은 수소, (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알킬-O-(C₁-C₆)-알킬, 페닐, 페닐-(C₁-C₆)-알킬, 헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, 헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로아릴 또는 (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로사이클릴이고, 여기에서 마지막으로 언급된 16 개의 래디칼은 시아노, 할로겐, 니트로, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, CON(R³)₂ 및 (C₁-C₄)-알콕시-(C₂-C₆)-알콕시카보닐로 구성된 그룹으로부터의 래디칼에 의해서 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하고,
- [0048] R²는 (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알킬-O-(C₁-C₆)-알킬, 페닐, 페닐-(C₁-C₆)-알킬, 헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, 헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로아릴 또는 (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로사이클릴이며, 이들 래디칼은 시아노, 할로겐, 니트로, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, NR³SO₂R⁴, COR³, OCOR³, NR³COR³, CO₂R³, CON(R³)₂ 및 (C₁-C₄)-알콕시-(C₂-C₆)-알콕시카보닐로 구성된 그룹으로부터의 래디칼에 의해서 치환되고, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하며,
- [0049] R³은 수소, (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬 또는 (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬이고,
- [0050] R⁴는 (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐 또는 (C₂-C₆)-알키닐이며,
- [0051] n은 0, 1 또는 2이고,
- [0052] s는 0, 1, 2 또는 3인 화학식 I의 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드의 본 발명의 용도이다.
- [0053] 특히 바람직한 것은 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이데아에, 바람직하게는 시네코코쿠스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코쿠스, 바람직하게는 로도코쿠스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코쿠스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의

키메릭 유전자(들)를 함유함으로써 HPPD 억제 제조제에 대해 내성인 유전자이식 농작물의 영역에서 원치 않는 식물을 방제하기 위한

- [0054] A가 N 또는 CY이고,
- [0055] B가 N 또는 CH이며,
- [0056] X는 니트로, 할로젠, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, OR¹, S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R², (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴 또는 (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴이고, 여기에서 마지막으로 언급된 2 개의 래디칼은 각각의 경우에 s 개의 할로젠, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시 및/또는 할로-(C₁-C₆)-알콕시 래디칼에 의해서 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하고,
- [0057] Y는 수소, 니트로, 할로젠, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-할로알킬, OR¹, S(O)_nR², SO₂N(R¹)₂, N(R¹)₂, NR¹SO₂R², NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-S(O)_nR², (C₁-C₆)-알킬-OR¹, (C₁-C₆)-알킬-CON(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-SO₂N(R¹)₂, (C₁-C₆)-알킬-NR¹COR¹, (C₁-C₆)-알킬-NR¹SO₂R², (C₁-C₆)-알킬-페닐, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, 페닐, 헤테로아릴 또는 헤테로사이클릴이며, 여기에서 마지막 6 개의 래디칼은 각각의 경우에 할로젠, 니트로, 시아노, (C₁-C₆)-알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, S(O)_n-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알콕시, 할로-(C₁-C₆)-알콕시, (C₁-C₆)-알콕시-(C₁-C₄)-알킬, 및 시아노메틸로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되고, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하며,
- [0058] Z는 할로젠, 시아노, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬, S(O)_nR² 또는 1,2,4-트리아졸-1-일이거나, 그렇지 않으면 Z는 Y가 래디칼 S(O)_nR²인 경우에 수소, 메틸, 메톡시 또는 에톡시일 수 있고,
- [0059] R은 (C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₇)-사이클로알킬, 할로-(C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₇)-사이클로알킬메틸, 메톡시카보닐메틸, 에톡시카보닐메틸, 아세틸메틸 또는 메톡시메틸이거나, 메틸, 메톡시, 트리플루오로메틸, 및 할로젠으로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환된 페닐이며;
- [0060] R¹은 수소, (C₁-C₆)-알킬, (C₂-C₆)-알케닐, (C₂-C₆)-알키닐, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬, (C₁-C₆)-알킬-O-(C₁-C₆)-알킬, 페닐, 페닐-(C₁-C₆)-알킬, 헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로아릴, 헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로아릴, (C₁-C₆)-알킬-O-헤테로사이클릴, (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로아릴 또는 (C₁-C₆)-알킬-NR³-헤테로사이클릴이고, 여기에서 마지막으로 언급된 16 개의 래디칼은 시아노, 할로젠, 니트로, OR³, S(O)_nR⁴, N(R³)₂, NR³OR³, COR³, OCOR³, NR³COR³, NR³SO₂R⁴, CO₂R³, CON(R³)₂, 및 (C₁-C₄)-알콕시-(C₂-C₆)-알콕시카보닐로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되며, 여기에서 헤테로사이클릴은 0 내지 2 개의 옥소 그룹을 포함하고,
- [0061] R²는 (C₁-C₆)-알킬, (C₃-C₆)-사이클로알킬 또는 (C₃-C₆)-사이클로알킬-(C₁-C₆)-알킬이며, 전술한 이들 3 개의 래디칼은 각각의 경우에 할로젠 및 OR³으로 구성된 그룹으로부터의 s 개의 래디칼에 의해서 치환되고,
- [0062] R³은 수소 또는 (C₁-C₆)-알킬이며,
- [0063] R⁴는 (C₁-C₆)-알킬이고,
- [0064] n은 0, 1 또는 2이며,

[0071] c-Pr = 사이클로프로필 Ph = 페닐 Ac = 아세틸 Bz = 벤조일

표 1: A가 CY이고, B가 CH이며, R이 메틸인 본 발명에 따르는 화학식 I의
화합물



No.	X	Y	Z
1-1	F	H	Cl
1-2	F	H	Br
1-3	F	H	SO ₂ Me
1-4	F	H	SO ₂ Et
1-5	F	H	CF ₃
1-6	F	H	NO ₂
1-7	Cl	H	F
1-8	Cl	H	Cl
1-9	Cl	H	Br
1-10	Cl	H	SMe
1-11	Cl	H	SOMe
1-12	Cl	H	SO ₂ Me
1-13	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl
1-14	Cl	H	SEt
1-15	Cl	H	SO ₂ Et
1-16	Cl	H	CF ₃
1-17	Cl	H	NO ₂
1-18	Cl	H	피라졸-1-일
1-19	Cl	H	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
1-20	Br	H	Cl
1-21	Br	H	Br
1-22	Br	H	SO ₂ Me
1-23	Br	H	SO ₂ Et
1-24	Br	H	CF ₃
1-25	SO ₂ Me	H	Cl
1-26	SO ₂ Me	H	Br
1-27	SO ₂ Me	H	SMe
1-28	SO ₂ Me	H	SOMe
1-29	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me
1-30	SO ₂ Me	H	SO ₂ Et

[0072]

No.	X	Y	Z
1-31	SO ₂ Me	H	CF ₃
1-32	SO ₂ Et	H	Cl
1-33	SO ₂ Et	H	Br
1-34	SO ₂ Et	H	SMe
1-35	SO ₂ Et	H	SOMe
1-36	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me
1-37	SO ₂ Et	H	CF ₃
1-38	NO ₂	H	F
1-39	NO ₂	H	Cl
1-40	NO ₂	H	Br
1-41	NO ₂	H	I
1-42	NO ₂	H	CN
1-43	NO ₂	H	SO ₂ Me
1-44	NO ₂	H	SO ₂ Et
1-45	NO ₂	H	CF ₃
1-46	Me	H	Cl
1-47	Me	H	Br
1-48	Me	H	SMe
1-49	Me	H	SO ₂ Me
1-50	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl
1-51	Me	H	SEt
1-52	Me	H	SO ₂ Et
1-53	Me	H	CF ₃
1-54	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃
1-55	Et	H	Cl
1-56	Et	H	Br
1-57	Et	H	SMe
1-58	Et	H	SO ₂ Me
1-59	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl
1-60	Et	H	SEt
1-61	Et	H	SO ₂ Et
1-62	Et	H	CF ₃
1-63	CF ₃	H	Cl
1-64	CF ₃	H	Br
1-65	CF ₃	H	SO ₂ Me
1-66	CF ₃	H	SO ₂ Et
1-67	CF ₃	H	CF ₃
1-68	NO ₂	NH ₂	F
1-69	NO ₂	NHMe	F
1-70	NO ₂	NMe ₂	F

[0073]

No.	X	Y	Z
1-71	NO ₂	Me	Cl
1-72	NO ₂	NH ₂	Cl
1-73	NO ₂	NHMe	Cl
1-74	NO ₂	NMe ₂	Cl
1-75	NO ₂	NH ₂	Br
1-76	NO ₂	NHMe	Br
1-77	NO ₂	NMe ₂	Br
1-78	NO ₂	NH ₂	CF ₃
1-79	NO ₂	NMe ₂	CF ₃
1-80	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me
1-81	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et
1-82	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me
1-83	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me
1-84	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et
1-85	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
1-86	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
1-87	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
1-88	Me	SMe	H
1-89	Me	SOMe	H
1-90	Me	SO ₂ Me	H
1-91	Me	SEt	H
1-92	Me	SOEt	H
1-93	Me	SO ₂ Et	H
1-94	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H
1-95	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H
1-96	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H
1-97	Me	F	F
1-98	Me	F	Cl
1-99	Me	SEt	F
1-100	Me	SOEt	F
1-101	Me	SO ₂ Et	F
1-102	Me	Me	Cl
1-103	Me	F	Cl
1-104	Me	Cl	Cl
1-105	Me	NH ₂	Cl
1-106	Me	NHMe	Cl
1-107	Me	NMe ₂	Cl
1-108	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-109	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
1-110	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl

[0074]

No.	X	Y	Z
1-111	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
1-112	Me	O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂	Cl
1-113	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂	Cl
1-114	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl
1-115	Me	O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me	Cl
1-116	Me	OCH ₂ -NHCO ₂ cPr	Cl
1-117	Me	O(CH ₂)-5-2,4-디메틸-2,4- 디하이드로-3H-1,2,4-트리아졸-3-온	Cl
1-118	Me	O(CH ₂)-3,5-디메틸-1,2-옥사졸-4-일	Cl
1-119	Me	SMe	Cl
1-120	Me	SOMe	Cl
1-121	Me	SO ₂ Me	Cl
1-122	Me	SEt	Cl
1-123	Me	SOEt	Cl
1-124	Me	SO ₂ Et	Cl
1-125	Me	S(CH ₂) ₂ Ome	Cl
1-126	Me	SO(CH ₂) ₂ Ome	Cl
1-127	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	Cl
1-128	Me	NH ₂	Br
1-129	Me	NHMe	Br
1-130	Me	NMe ₂	Br
1-131	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Br
1-132	Me	O(CH ₂)-5-피롤리딘-2-온	Br
1-133	Me	Sme	Br
1-134	Me	SOMe	Br
1-135	Me	SO ₂ Me	Br
1-136	Me	SEt	Br
1-137	Me	SOEt	Br
1-138	Me	SO ₂ Et	Br
1-139	Me	SMe	I
1-140	Me	SOMe	I
1-141	Me	SO ₂ Me	I
1-142	Me	SEt	I
1-143	Me	SOEt	I
1-144	Me	SO ₂ Et	I
1-145	Me	Cl	CF ₃
1-146	Me	SMe	CF ₃
1-147	Me	SOMe	CF ₃
1-148	Me	SO ₂ Me	CF ₃
1-149	Me	SEt	CF ₃

[0075]

No.	X	Y	Z
1-150	Me	SOEt	CF ₃
1-151	Me	SO ₂ Et	CF ₃
1-152	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-153	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-154	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-155	Me	Me	SO ₂ Me
1-156	Me	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
1-157	Me	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
1-158	Me	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
1-159	Me	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
1-160	Me	NH ₂	SO ₂ Me
1-161	Me	NHMe	SO ₂ Me
1-162	Me	NMe ₂	SO ₂ Me
1-163	Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-164	Me	피라졸-1-일	SO ₂ Me
1-165	Me	OH	SO ₂ Me
1-166	Me	OMe	SO ₂ Me
1-167	Me	OMe	SO ₂ Et
1-168	Me	OEt	SO ₂ Me
1-169	Me	OEt	SO ₂ Et
1-170	Me	OiPr	SO ₂ Me
1-171	Me	OiPr	SO ₂ Et
1-172	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-173	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
1-174	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
1-175	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
1-176	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
1-177	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
1-178	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me
1-179	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et
1-180	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
1-181	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
1-182	Me	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
1-183	Me	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et

[0076]

1-184	Me	O(CH ₂) ₂ -O(3,5-디메톡시피리미딘-2-일	SO ₂ Me
1-185	Me	Cl	SO ₂ Me
1-186	Me	SMe	SO ₂ Me
1-187	Me	SOMe	SO ₂ Me
1-188	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
1-189	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et
1-190	Me	SEt	SO ₂ Me
1-191	Me	SOEt	SO ₂ Me
1-192	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me
1-193	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-194	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-195	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-196	CH ₂ SMe	OMe	SO ₂ Me
1-197	CH ₂ OMe	OMe	SO ₂ Me
1-198	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me
1-199	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me
1-200	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	OMe	SO ₂ Me
1-201	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-202	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
1-203	Et	SMe	Cl
1-204	Et	SO ₂ Me	Cl
1-205	Et	SMe	CF ₃
1-206	Et	SO ₂ Me	CF ₃
1-207	Et	F	SO ₂ Me
1-208	Et	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-209	iPr	SO ₂ Me	CF ₃
1-210	cPr	SO ₂ Me	CF ₃
1-211	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	F
1-212	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	F
1-213	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F
1-214	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	F
1-215	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-216	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
1-217	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
1-218	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	Cl
1-219	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
1-220	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Br
1-221	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br
1-222	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	Br
1-223	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	I
1-224	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	I

[0077]

1-225	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I
1-226	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	I
1-227	CF ₃	F	SO ₂ Me
1-228	CF ₃	F	SO ₂ Et
1-229	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-230	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
1-231	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
1-232	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
1-233	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me
1-234	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et
1-235	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
1-236	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
1-237	F	SMe	CF ₃
1-238	F	SOMe	CF ₃
1-239	Cl	Me	Cl
1-240	Cl	OCH ₂ CHCH ₂	Cl
1-241	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl
1-242	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-243	Cl	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
1-244	Cl	O(CH ₂)-5-피롤리딘-2-온	Cl
1-245	Cl	SMe	Cl
1-246	Cl	SOMe	Cl
1-247	Cl	SO ₂ Me	Cl
1-248	Cl	F	SMe
1-249	Cl	Cl	SO ₂ Me
1-250	Cl	COOMe	SO ₂ Me
1-251	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me
1-252	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me
1-253	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me
1-254	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et
1-255	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Me
1-256	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Et
1-257	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
1-258	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
1-259	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et
1-260	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
1-261	Cl	CH ₂ Oc 펜틸	SO ₂ Me
1-262	Cl	CH ₂ PO(OMe) ₂	SO ₂ Me
1-263	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SMe
1-264	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
1-265	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et

[0078]

1-266	Cl	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
1-267	Cl	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
1-268	Cl	5-(메톡시메틸)-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
1-269	Cl	5-(메톡시메틸)-5-메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
1-270	Cl	CH ₂ O-테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Me
1-271	Cl	CH ₂ O-테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Et
1-272	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-2-일	SO ₂ Me
1-273	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-2-일	SO ₂ Et
1-274	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Me
1-275	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Et
1-276	Cl	OMe	SO ₂ Me
1-277	Cl	OMe	SO ₂ Et
1-278	Cl	OEt	SO ₂ Me
1-279	Cl	OEt	SO ₂ Et
1-280	Cl	OiPr	SO ₂ Me
1-281	Cl	OiPr	SO ₂ Et
1-282	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-283	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
1-284	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
1-285	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
1-286	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
1-287	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-288	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
1-289	Cl	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
1-290	Cl	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
1-291	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
1-292	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
1-293	Cl	SMe	SO ₂ Me
1-294	Cl	SOMe	SO ₂ Me
1-295	Br	OMe	Br
1-296	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
1-297	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-298	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
1-299	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
1-300	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
1-301	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
1-302	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et

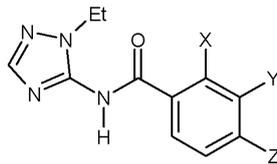
[0079]

1-303	Br	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
1-304	Br	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
1-305	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-306	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
1-307	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
1-308	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
1-309	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
1-310	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
1-311	I	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
1-312	I	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
1-313	OMe	SMe	CF ₃
1-314	OMe	SOMe	CF ₃
1-315	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
1-316	OMe	SOEt	CF ₃
1-317	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
1-318	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-319	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-320	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-321	OMe	SMe	Cl
1-322	OMe	SOMe	Cl
1-323	OMe	SO ₂ Me	Cl
1-324	OMe	SEt	Cl
1-325	OMe	SOEt	Cl
1-326	OMe	SO ₂ Et	Cl
1-327	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-328	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-329	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-330	OCH ₂ c-Pr	SMe	CF ₃
1-331	OCH ₂ c-Pr	SOMe	CF ₃
1-332	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃
1-333	OCH ₂ c-Pr	SEt	CF ₃
1-334	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃
1-335	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃
1-336	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-337	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-338	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-339	OCH ₂ c-Pr	SMe	Cl
1-340	OCH ₂ c-Pr	SOMe	Cl
1-341	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl
1-342	OCH ₂ c-Pr	SEt	Cl
1-343	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl

[0080]

1-344	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl
1-345	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-346	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-347	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-348	OCH ₂ c-Pr	SMe	SO ₂ Me
1-349	OCH ₂ c-Pr	SOMe	SO ₂ Me
1-350	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me
1-351	OCH ₂ c-Pr	SEt	SO ₂ Me
1-352	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me
1-353	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me
1-354	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-355	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-356	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-357	SO ₂ Me	F	CF ₃
1-358	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃
1-359	SO ₂ Me	NHEt	Cl
1-360	SMe	SEt	F
1-361	SMe	SMe	F

표 2: A가 CY 이고, B가 CH 이며, R이 에틸인 본 발명에 따르는 화학식 I의 화합물



No	X	Y	Z
2-1	F	H	Cl
2-2	F	H	Br
2-3	F	H	SO ₂ Me
2-4	F	H	SO ₂ Et
2-5	F	H	CF ₃
2-6	F	H	NO ₂
2-7	Cl	H	F

[0081]

No	X	Y	Z
2-8	Cl	H	Cl
2-9	Cl	H	Br
2-10	Cl	H	SMe
2-11	Cl	H	SOMe
2-12	Cl	H	SO ₂ Me
2-13	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl
2-14	Cl	H	SEt
2-15	Cl	H	SO ₂ Et
2-16	Cl	H	CF ₃
2-17	Cl	H	NO ₂
2-18	Cl	H	피라졸-1-일
2-19	Cl	H	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
2-20	Br	H	Cl
2-21	Br	H	Br
2-22	Br	H	SO ₂ Me
2-23	Br	H	SO ₂ Et
2-24	Br	H	CF ₃
2-25	SO ₂ Me	H	Cl
2-26	SO ₂ Me	H	Br
2-27	SO ₂ Me	H	SMe
2-28	SO ₂ Me	H	SOMe
2-29	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me
2-30	SO ₂ Me	H	SO ₂ Et
2-31	SO ₂ Me	H	CF ₃
2-32	SO ₂ Et	H	Cl
2-33	SO ₂ Et	H	Br
2-34	SO ₂ Et	H	SMe
2-35	SO ₂ Et	H	SOMe
2-36	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me
2-37	SO ₂ Et	H	CF ₃
2-38	NO ₂	H	F
2-39	NO ₂	H	Cl
2-40	NO ₂	H	Br
2-41	NO ₂	H	I
2-42	NO ₂	H	CN
2-43	NO ₂	H	SO ₂ Me
2-44	NO ₂	H	SO ₂ Et
2-45	NO ₂	H	CF ₃
2-46	Me	H	Cl
2-47	Me	H	Br

[0082]

No	X	Y	Z
2-48	Me	H	SMe
2-49	Me	H	SO ₂ Me
2-50	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl
2-51	Me	H	SEt
2-52	Me	H	SO ₂ Et
2-53	Me	H	CF ₃
2-54	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃
2-55	Et	H	Cl
2-56	Et	H	Br
2-57	Et	H	SMe
2-58	Et	H	SO ₂ Me
2-59	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl
2-60	Et	H	SEt
2-61	Et	H	SO ₂ Et
2-62	Et	H	CF ₃
2-63	CF ₃	H	Cl
2-64	CF ₃	H	Br
2-65	CF ₃	H	SO ₂ Me
2-66	CF ₃	H	SO ₂ Et
2-67	CF ₃	H	CF ₃
2-68	NO ₂	NH ₂	F
2-69	NO ₂	NHMe	F
2-70	NO ₂	NMe ₂	F
2-71	NO ₂	Me	Cl
2-72	NO ₂	NH ₂	Cl
2-73	NO ₂	NHMe	Cl
2-74	NO ₂	NMe ₂	Cl
2-75	NO ₂	NH ₂	Br
2-76	NO ₂	NHMe	Br
2-77	NO ₂	NMe ₂	Br
2-78	NO ₂	NH ₂	CF ₃
2-79	NO ₂	NMe ₂	CF ₃
2-80	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me
2-81	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et
2-82	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me
2-83	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me
2-84	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et
2-85	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
2-86	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
2-87	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4-트리아졸-1-일

[0083]

No	X	Y	Z
2-88	Me	SMe	H
2-89	Me	SOMe	H
2-90	Me	SO ₂ Me	H
2-91	Me	SEt	H
2-92	Me	SOEt	H
2-93	Me	SO ₂ Et	H
2-94	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H
2-95	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H
2-96	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H
2-97	Me	F	F
2-98	Me	F	Cl
2-99	Me	SEt	F
2-100	Me	SOEt	F
2-101	Me	SO ₂ Et	F
2-102	Me	Me	Cl
2-103	Me	F	Cl
2-104	Me	Cl	Cl
2-105	Me	NH ₂	Cl
2-106	Me	NHMe	Cl
2-107	Me	NMe ₂	Cl
2-108	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
2-109	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
2-110	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl
2-111	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
2-112	Me	O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂	Cl
2-113	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂	Cl
2-114	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl
2-115	Me	O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me	Cl
2-116	Me	O-CH ₂ -NHSO ₂ cPr	Cl
2-117	Me	O(CH ₂) ₅ -2,4-디메틸-2,4- 디하이드로-3H-1,2,4-트리아졸-3-온	Cl
2-118	Me	O(CH ₂) ₃ -3,5-디메틸-1,2-옥사졸-4-일	Cl
2-119	Me	Sme	Cl
2-120	Me	SOMe	Cl
2-121	Me	SO ₂ Me	Cl
2-122	Me	Set	Cl
2-123	Me	SOEt	Cl
2-124	Me	SO ₂ Et	Cl
2-125	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
2-126	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl

[0084]

No	X	Y	Z
2-127	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	Cl
2-128	Me	NH ₂	Br
2-129	Me	NHMe	Br
2-130	Me	NMe ₂	Br
2-131	Me	O(CH ₂)CONEt ₂	Br
2-132	Me	O(CH ₂)-5-피롤리딘-2-온	Br
2-133	Me	SMe	Br
2-134	Me	SOMe	Br
2-135	Me	SO ₂ Me	Br
2-136	Me	SEt	Br
2-137	Me	SOEt	Br
2-138	Me	SO ₂ Et	Br
2-139	Me	SMe	I
2-140	Me	SOMe	I
2-141	Me	SO ₂ Me	I
2-142	Me	SEt	I
2-143	Me	SOEt	I
2-144	Me	SO ₂ Et	I
2-145	Me	Cl	CF ₃
2-146	Me	SMe	CF ₃
2-147	Me	SOMe	CF ₃
2-148	Me	SO ₂ Me	CF ₃
2-149	Me	SEt	CF ₃
2-150	Me	SOEt	CF ₃
2-151	Me	SO ₂ Et	CF ₃
2-152	Me	S(CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
2-153	Me	SO(CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
2-154	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
2-155	Me	Me	SO ₂ Me
2-156	Me	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
2-157	Me	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
2-158	Me	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
2-159	Me	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
2-160	Me	NH ₂	SO ₂ Me
2-161	Me	NHMe	SO ₂ Me
2-162	Me	NMe ₂	SO ₂ Me
2-163	Me	NH(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
2-164	Me	피라졸-1-일	SO ₂ Me
2-165	Me	OH	SO ₂ Me

[0085]

No	X	Y	Z
2-166	Me	OMe	SO ₂ Me
2-167	Me	OMe	SO ₂ Et
2-168	Me	OEt	SO ₂ Me
2-169	Me	OEt	SO ₂ Et
2-170	Me	OiPr	SO ₂ Me
2-171	Me	OiPr	SO ₂ Et
2-172	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-173	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
2-174	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
2-175	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
2-176	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
2-177	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
2-178	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me
2-179	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et
2-180	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
2-181	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
2-182	Me	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
2-183	Me	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
2-184	Me	O(CH ₂) ₂ -O(3,5-디메톡시피리미딘-2-일	SO ₂ Me
2-185	Me	Cl	SO ₂ Me
2-186	Me	Sme	SO ₂ Me
2-187	Me	SOMe	SO ₂ Me
2-188	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
2-189	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et
2-190	Me	SEt	SO ₂ Me
2-191	Me	SOEt	SO ₂ Me
2-192	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me
2-193	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-194	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-195	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-196	CH ₂ SMe	OMe	SO ₂ Me
2-197	CH ₂ OMe	OMe	SO ₂ Me
2-198	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me
2-199	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me
2-200	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	OMe	SO ₂ Me
2-201	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-202	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
2-203	Et	SMe	Cl
2-204	Et	SO ₂ Me	Cl

[0086]

No	X	Y	Z
2-205	Et	SMe	CF ₃
2-206	Et	SO ₂ Me	CF ₃
2-207	Et	F	SO ₂ Me
2-208	Et	NH(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
2-209	iPr	SO ₂ Me	CF ₃
2-210	cPr	SO ₂ Me	CF ₃
2-211	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	F
2-212	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	F
2-213	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F
2-214	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	F
2-215	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	Cl
2-216	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	Cl
2-217	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
2-218	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	Cl
2-219	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	Br
2-220	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	Br
2-221	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br
2-222	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	Br
2-223	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	I
2-224	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	I
2-225	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I
2-226	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	I
2-227	CF ₃	F	SO ₂ Me
2-228	CF ₃	F	SO ₂ Et
2-229	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
2-230	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
2-231	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
2-232	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
2-233	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me
2-234	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et
2-235	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
2-236	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
2-237	F	Sme	CF ₃
2-238	F	SOMe	CF ₃
2-239	Cl	Me	Cl
2-240	Cl	OCH ₂ CHCH ₂	Cl
2-241	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl
2-242	Cl	O(CH ₂) ₂ Ome	Cl
2-243	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Cl
2-244	Cl	O(CH ₂)-5-피롤리딘-2-온	Cl

[0087]

No	X	Y	Z
2-245	Cl	Sme	Cl
2-246	Cl	SOMe	Cl
2-247	Cl	SO ₂ Me	Cl
2-248	Cl	F	SMe
2-249	Cl	Cl	SO ₂ Me
2-250	Cl	COOMe	SO ₂ Me
2-251	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me
2-252	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me
2-253	Cl	CH ₂ Ome	SO ₂ Me
2-254	Cl	CH ₂ Ome	SO ₂ Et
2-255	Cl	CH ₂ Oet	SO ₂ Me
2-256	Cl	CH ₂ Oet	SO ₂ Et
2-257	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
2-258	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
2-259	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et
2-260	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
2-261	Cl	CH ₂ Oc 펜틸	SO ₂ Me
2-262	Cl	CH ₂ PO(OMe) ₂	SO ₂ Me
2-263	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SMe
2-264	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
2-265	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
2-266	Cl	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
2-267	Cl	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
2-268	Cl	5-(메톡시메틸)-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
2-269	Cl	5-(메톡시메틸)-5-메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
2-270	Cl	CH ₂ O-테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Me
2-271	Cl	CH ₂ O-테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Et
2-272	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-2-일	SO ₂ Me
2-273	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-2-일	SO ₂ Et
2-274	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Me
2-275	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Et
2-276	Cl	Ome	SO ₂ Me
2-277	Cl	OMe	SO ₂ Et
2-278	Cl	OEt	SO ₂ Me
2-279	Cl	OEt	SO ₂ Et
2-280	Cl	OiPr	SO ₂ Me
2-281	Cl	OiPr	SO ₂ Et

[0088]

No	X	Y	Z
2-282	Cl	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
2-283	Cl	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Me
2-284	Cl	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Et
2-285	Cl	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
2-286	Cl	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
2-287	Cl	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
2-288	Cl	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
2-289	Cl	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
2-290	Cl	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
2-291	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
2-292	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
2-293	Cl	SMe	SO ₂ Me
2-294	Cl	SOMe	SO ₂ Me
2-295	Br	OMe	Br
2-296	Br	O(CH ₂) ₂ Ome	Br
2-297	Br	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
2-298	Br	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
2-299	Br	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
2-300	Br	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
2-301	Br	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Me
2-302	Br	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Et
2-303	Br	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
2-304	Br	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
2-305	I	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
2-306	I	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
2-307	I	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
2-308	I	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
2-309	I	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Me
2-310	I	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Et
2-311	I	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
2-312	I	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
2-313	OMe	Sme	CF ₃
2-314	OMe	SOMe	CF ₃
2-315	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
2-316	OMe	SOEt	CF ₃
2-317	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
2-318	OMe	S(CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
2-319	OMe	SO(CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
2-320	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
2-321	OMe	Sme	Cl

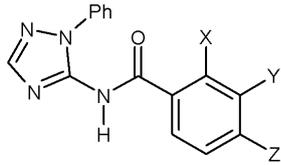
[0089]

No	X	Y	Z
2-322	OMe	SOMe	Cl
2-323	OMe	SO ₂ Me	Cl
2-324	OMe	Set	Cl
2-325	OMe	SOEt	Cl
2-326	OMe	SO ₂ Et	Cl
2-327	OMe	S(CH ₂) ₂ Ome	Cl
2-328	OMe	SO(CH ₂) ₂ Ome	Cl
2-329	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	Cl
2-330	OCH ₂ c-Pr	Sme	CF ₃
2-331	OCH ₂ c-Pr	SOMe	CF ₃
2-332	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃
2-333	OCH ₂ c-Pr	Set	CF ₃
2-334	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃
2-335	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃
2-336	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
2-337	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
2-338	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
2-339	OCH ₂ c-Pr	Sme	Cl
2-340	OCH ₂ c-Pr	SOMe	Cl
2-341	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl
2-342	OCH ₂ c-Pr	Set	Cl
2-343	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl
2-344	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl
2-345	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ Ome	Cl
2-346	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ Ome	Cl
2-347	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	Cl
2-348	OCH ₂ c-Pr	Sme	SO ₂ Me
2-349	OCH ₂ c-Pr	SOMe	SO ₂ Me
2-350	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me
2-351	OCH ₂ c-Pr	Set	SO ₂ Me
2-352	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me
2-353	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me
2-354	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
2-355	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
2-356	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
2-357	SO ₂ Me	F	CF ₃
2-358	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃
2-359	SO ₂ Me	NH ₂ Et	Cl
2-360	SMe	Set	F
2-361	SMe	Sme	F

[0090]

표 3: A가 CY 이고, B가 CH 이며, R이 페닐인 본 발명에 따르는 화학식 I의

화합물



No.	X	Y	Z
3-1	F	H	Cl
3-2	F	H	Br
3-3	F	H	SO ₂ Me
3-4	F	H	SO ₂ Et
3-5	F	H	CF ₃
3-6	F	H	NO ₂
3-7	Cl	H	F
3-8	Cl	H	Cl
3-9	Cl	H	Br
3-10	Cl	H	SMe
3-11	Cl	H	SOMe
3-12	Cl	H	SO ₂ Me
3-13	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl
3-14	Cl	H	SEt
3-15	Cl	H	SO ₂ Et
3-16	Cl	H	CF ₃
3-17	Cl	H	NO ₂
3-18	Cl	H	피라졸-1-일
3-19	Cl	H	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
3-20	Br	H	Cl
3-21	Br	H	Br
3-22	Br	H	SO ₂ Me
3-23	Br	H	SO ₂ Et
3-24	Br	H	CF ₃
3-25	SO ₂ Me	H	Cl
3-26	SO ₂ Me	H	Br
3-27	SO ₂ Me	H	SMe
3-28	SO ₂ Me	H	SOMe
3-29	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me
3-30	SO ₂ Me	H	SO ₂ Et

[0091]

No.	X	Y	Z
3-31	SO ₂ Me	H	CF ₃
3-32	SO ₂ Et	H	Cl
3-33	SO ₂ Et	H	Br
3-34	SO ₂ Et	H	SMe
3-35	SO ₂ Et	H	SOMe
3-36	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me
3-37	SO ₂ Et	H	CF ₃
3-38	NO ₂	H	F
3-39	NO ₂	H	Cl
3-40	NO ₂	H	Br
3-41	NO ₂	H	I
3-42	NO ₂	H	CN
3-43	NO ₂	H	SO ₂ Me
3-44	NO ₂	H	SO ₂ Et
3-45	NO ₂	H	CF ₃
3-46	Me	H	Cl
3-47	Me	H	Br
3-48	Me	H	SMe
3-49	Me	H	SO ₂ Me
3-50	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl
3-51	Me	H	SEt
3-52	Me	H	SO ₂ Et
3-53	Me	H	CF ₃
3-54	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃
3-55	Et	H	Cl
3-56	Et	H	Br
3-57	Et	H	SMe
3-58	Et	H	SO ₂ Me
3-59	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl
3-60	Et	H	SEt
3-61	Et	H	SO ₂ Et
3-62	Et	H	CF ₃
3-63	CF ₃	H	Cl
3-64	CF ₃	H	Br
3-65	CF ₃	H	SO ₂ Me
3-66	CF ₃	H	SO ₂ Et
3-67	CF ₃	H	CF ₃
3-68	NO ₂	NH ₂	F
3-69	NO ₂	NHMe	F
3-70	NO ₂	NMe ₂	F

[0092]

No.	X	Y	Z
3-71	NO ₂	Me	Cl
3-72	NO ₂	NH ₂	Cl
3-73	NO ₂	NHMe	Cl
3-74	NO ₂	NMe ₂	Cl
3-75	NO ₂	NH ₂	Br
3-76	NO ₂	NHMe	Br
3-77	NO ₂	NMe ₂	Br
3-78	NO ₂	NH ₂	CF ₃
3-79	NO ₂	NMe ₂	CF ₃
3-80	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me
3-81	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et
3-82	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me
3-83	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me
3-84	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et
3-85	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
3-86	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
3-87	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
3-88	Me	SMe	H
3-89	Me	SOMe	H
3-90	Me	SO ₂ Me	H
3-91	Me	SEt	H
3-92	Me	SOEt	H
3-93	Me	SO ₂ Et	H
3-94	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H
3-95	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H
3-96	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H
3-97	Me	F	F
3-98	Me	F	Cl
3-99	Me	SEt	F
3-100	Me	SOEt	F
3-101	Me	SO ₂ Et	F
3-102	Me	Me	Cl
3-103	Me	F	Cl
3-104	Me	Cl	Cl
3-105	Me	NH ₂	Cl
3-106	Me	NHMe	Cl
3-107	Me	NMe ₂	Cl
3-108	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-109	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
3-110	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl

[0093]

No.	X	Y	Z
3-111	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
3-112	Me	O(CH ₂) ₂ -CONMe ₂	Cl
3-113	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂	Cl
3-114	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl
3-115	Me	O(CH ₂) ₂ NHCO ₂ Me	Cl
3-116	Me	OCH ₂ NHSO ₂ cPr	Cl
3-117	Me	O(CH ₂)-5-2,4-디메틸-2,4- 디하이드로-3H-1,2,4-트리아졸 -3-온	Cl
3-118	Me	O(CH ₂)-3,5-디메틸-1,2-옥사졸 -4-일	Cl
3-119	Me	SMe	Cl
3-120	Me	SOMe	Cl
3-121	Me	SO ₂ Me	Cl
3-122	Me	SEt	Cl
3-123	Me	SOEt	Cl
3-124	Me	SO ₂ Et	Cl
3-125	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-126	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-127	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-128	Me	NH ₂	Br
3-129	Me	NHMe	Br
3-130	Me	NMe ₂	Br
3-131	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Br
3-132	Me	O(CH ₂)-5-피롤리딘-2-온	Br
3-133	Me	Sme	Br
3-134	Me	SOMe	Br
3-135	Me	SO ₂ Me	Br
3-136	Me	Set	Br
3-137	Me	SOEt	Br
3-138	Me	SO ₂ Et	Br
3-139	Me	Sme	I
3-140	Me	SOMe	I
3-141	Me	SO ₂ Me	I
3-142	Me	Set	I
3-143	Me	SOEt	I
3-144	Me	SO ₂ Et	I
3-145	Me	Cl	CF ₃
3-146	Me	Sme	CF ₃
3-147	Me	SOMe	CF ₃
3-148	Me	SO ₂ Me	CF ₃

[0094]

No.	X	Y	Z
3-149	Me	Set	CF ₃
3-150	Me	SOEt	CF ₃
3-151	Me	SO ₂ Et	CF ₃
3-152	Me	S(CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
3-153	Me	SO(CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
3-154	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
3-155	Me	Me	SO ₂ Me
3-156	Me	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
3-157	Me	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
3-158	Me	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
3-159	Me	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
3-160	Me	NH ₂	SO ₂ Me
3-161	Me	NHMe	SO ₂ Me
3-162	Me	NMe ₂	SO ₂ Me
3-163	Me	NH(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
3-164	Me	피라졸-1-일	SO ₂ Me
3-165	Me	OH	SO ₂ Me
3-166	Me	OMe	SO ₂ Me
3-167	Me	OMe	SO ₂ Et
3-168	Me	OEt	SO ₂ Me
3-169	Me	OEt	SO ₂ Et
3-170	Me	OiPr	SO ₂ Me
3-171	Me	OiPr	SO ₂ Et
3-172	Me	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
3-173	Me	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
3-174	Me	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
3-175	Me	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
3-176	Me	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Me
3-177	Me	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Et
3-178	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me
3-179	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et
3-180	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
3-181	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
3-182	Me	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
3-183	Me	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
3-184	Me	O(CH ₂) ₂ -O(3,5-디메톡시피리미딘-2-일	SO ₂ Me
3-185	Me	Cl	SO ₂ Me
3-186	Me	SMe	SO ₂ Me

[0095]

No.	X	Y	Z
3-187	Me	SOMe	SO ₂ Me
3-188	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
3-189	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et
3-190	Me	SEt	SO ₂ Me
3-191	Me	SOEt	SO ₂ Me
3-192	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me
3-193	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-194	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-195	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-196	CH ₂ SMe	OMe	SO ₂ Me
3-197	CH ₂ OMe	OMe	SO ₂ Me
3-198	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me
3-199	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me
3-200	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	OMe	SO ₂ Me
3-201	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-202	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
3-203	Et	SMe	Cl
3-204	Et	SO ₂ Me	Cl
3-205	Et	SMe	CF ₃
3-206	Et	SO ₂ Me	CF ₃
3-207	Et	F	SO ₂ Me
3-208	Et	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-209	iPr	SO ₂ Me	CF ₃
3-210	cPr	SO ₂ Me	CF ₃
3-211	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	F
3-212	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	F
3-213	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F
3-214	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	F
3-215	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	Cl
3-216	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	Cl
3-217	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
3-218	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	Cl
3-219	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	Br
3-220	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	Br
3-221	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br
3-222	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	Br
3-223	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	I
3-224	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	I
3-225	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I
3-226	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	I

[0096]

No.	X	Y	Z
3-227	CF ₃	F	SO ₂ Me
3-228	CF ₃	F	SO ₂ Et
3-229	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
3-230	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
3-231	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
3-232	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
3-233	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me
3-234	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et
3-235	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
3-236	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
3-237	F	SMe	CF ₃
3-238	F	SOMe	CF ₃
3-239	Cl	Me	Cl
3-240	Cl	OCH ₂ CHCH ₂	Cl
3-241	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl
3-242	Cl	O(CH ₂) ₂ Ome	Cl
3-243	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Cl
3-244	Cl	O(CH ₂)-5-피롤리딘-2-온	Cl
3-245	Cl	Sme	Cl
3-246	Cl	SOMe	Cl
3-247	Cl	SO ₂ Me	Cl
3-248	Cl	F	SMe
3-249	Cl	Cl	SO ₂ Me
3-250	Cl	COOMe	SO ₂ Me
3-251	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me
3-252	Cl	CONMe(Ome)	SO ₂ Me
3-253	Cl	CH ₂ Ome	SO ₂ Me
3-254	Cl	CH ₂ Ome	SO ₂ Et
3-255	Cl	CH ₂ Oet	SO ₂ Me
3-256	Cl	CH ₂ Oet	SO ₂ Et
3-257	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
3-258	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
3-259	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et
3-260	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
3-261	Cl	CH ₂ Oc 펜틸	SO ₂ Me
3-262	Cl	CH ₂ PO(Ome) ₂	SO ₂ Me
3-263	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SMe
3-264	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
3-265	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et

[0097]

3-266	Cl	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
3-267	Cl	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
3-268	Cl	5-(메톡시메틸)-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
3-269	Cl	5-(메톡시메틸)-5-메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
3-270	Cl	CH ₂ O-테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Me
3-271	Cl	CH ₂ O-테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Et
3-272	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-2-일	SO ₂ Me
3-273	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-2-일	SO ₂ Et
3-274	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Me
3-275	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Et
3-276	Cl	OMe	SO ₂ Me
3-277	Cl	OMe	SO ₂ Et
3-278	Cl	OEt	SO ₂ Me
3-279	Cl	OEt	SO ₂ Et
3-280	Cl	OiPr	SO ₂ Me
3-281	Cl	OiPr	SO ₂ Et
3-282	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-283	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
3-284	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
3-285	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
3-286	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
3-287	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-288	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
3-289	Cl	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
3-290	Cl	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
3-291	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
3-292	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
3-293	Cl	SMe	SO ₂ Me
3-294	Cl	SOMe	SO ₂ Me
3-295	Br	OMe	Br
3-296	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
3-297	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-298	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
3-299	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
3-300	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
3-301	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
3-302	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
3-303	Br	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me

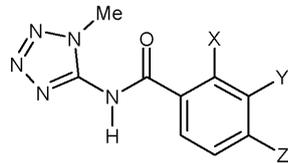
[0098]

3-304	Br	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
3-305	I	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
3-306	I	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
3-307	I	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
3-308	I	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
3-309	I	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Me
3-310	I	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Et
3-311	I	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
3-312	I	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
3-313	OMe	SMe	CF ₃
3-314	OMe	SOMe	CF ₃
3-315	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
3-316	OMe	SOEt	CF ₃
3-317	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
3-318	OMe	S(CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
3-319	OMe	SO(CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
3-320	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
3-321	OMe	SMe	Cl
3-322	OMe	SOMe	Cl
3-323	OMe	SO ₂ Me	Cl
3-324	OMe	SEt	Cl
3-325	OMe	SOEt	Cl
3-326	OMe	SO ₂ Et	Cl
3-327	OMe	S(CH ₂) ₂ Ome	Cl
3-328	OMe	SO(CH ₂) ₂ Ome	Cl
3-329	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	Cl
3-330	OCH ₂ c-Pr	SMe	CF ₃
3-331	OCH ₂ c-Pr	SOMe	CF ₃
3-332	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃
3-333	OCH ₂ c-Pr	SEt	CF ₃
3-334	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃
3-335	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃
3-336	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
3-337	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
3-338	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	CF ₃
3-339	OCH ₂ c-Pr	SMe	Cl
3-340	OCH ₂ c-Pr	SOMe	Cl
3-341	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl
3-342	OCH ₂ c-Pr	SEt	Cl
3-343	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl
3-344	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl

[0099]

3-345	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-346	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-347	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-348	OCH ₂ c-Pr	SMe	SO ₂ Me
3-349	OCH ₂ c-Pr	SOMe	SO ₂ Me
3-350	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me
3-351	OCH ₂ c-Pr	SEt	SO ₂ Me
3-352	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me
3-353	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me
3-354	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-355	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-356	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-357	SO ₂ Me	F	CF ₃
3-358	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃
3-359	SO ₂ Me	NHEt	Cl
3-360	SMe	SEt	F
3-361	SMe	SMe	F

표 4: A 가 CY 이고, B 가 N 이며, R 이 메틸인 본 발명에 따르는 화학식 I 의
화합물



No.	X	Y	Z
4-1	F	H	Cl
4-2	F	H	Br
4-3	F	H	SO ₂ Me
4-4	F	H	SO ₂ Et
4-5	F	H	CF ₃
4-6	Cl	H	F
4-7	Cl	H	Cl
4-8	Cl	H	Br

[0100]

No.	X	Y	Z
4-9	Cl	H	SMe
4-10	Cl	H	SO ₂ Me
4-11	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl
4-12	Cl	H	SEt
4-13	Cl	H	SO ₂ Et
4-14	Cl	H	CF ₃
4-15	Br	H	Cl
4-16	Br	H	Br
4-17	Br	H	SO ₂ Me
4-18	Br	H	SO ₂ Et
4-19	Br	H	CF ₃
4-20	SO ₂ Me	H	Cl
4-21	SO ₂ Me	H	Br
4-22	SO ₂ Me	H	SMe
4-23	SO ₂ Me	H	SOMe
4-24	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me
4-25	SO ₂ Me	H	CF ₃
4-26	SO ₂ Et	H	Cl
4-27	SO ₂ Et	H	Br
4-28	SO ₂ Et	H	SMe
4-29	SO ₂ Et	H	SOMe
4-30	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me
4-31	SO ₂ Et	H	CF ₃
4-32	NO ₂	H	F
4-33	NO ₂	H	Cl
4-34	NO ₂	H	Br
4-35	NO ₂	H	I
4-36	NO ₂	H	CN
4-37	NO ₂	H	SO ₂ Me
4-38	NO ₂	H	SO ₂ Et
4-39	NO ₂	H	CF ₃
4-40	Me	H	Cl
4-41	Me	H	Br
4-42	Me	H	SO ₂ Me
4-43	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl
4-44	Me	H	SO ₂ Et
4-45	Me	H	CF ₃
4-46	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃
4-47	Et	H	Cl
4-48	Et	H	Br

[0101]

No.	X	Y	Z
4-49	Et	H	SO ₂ Me
4-50	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl
4-51	Et	H	SEt
4-52	Et	H	SO ₂ Et
4-53	Et	H	CF ₃
4-54	CF ₃	H	Cl
4-55	CF ₃	H	Br
4-56	CF ₃	H	SO ₂ Me
4-57	CF ₃	H	CF ₃
4-58	NO ₂	NH ₂	F
4-59	NO ₂	NHMe	F
4-60	NO ₂	NMe ₂	F
4-61	NO ₂	Me	Cl
4-62	NO ₂	NH ₂	Cl
4-63	NO ₂	NHMe	Cl
4-64	NO ₂	NMe ₂	Cl
4-65	NO ₂	NH ₂	Br
4-66	NO ₂	NHMe	Br
4-67	NO ₂	NMe ₂	Br
4-68	NO ₂	NH ₂	CF ₃
4-69	NO ₂	NMe ₂	CF ₃
4-70	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me
4-71	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et
4-72	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me
4-73	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me
4-74	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et
4-75	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4-트리아졸 -1-일
4-76	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4-트리아졸 -1-일
4-77	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4-트리아졸 -1-일
4-78	Me	SMe	H
4-79	Me	SOMe	H
4-80	Me	SO ₂ Me	H
4-81	Me	SEt	H
4-82	Me	SOEt	H
4-83	Me	SO ₂ Et	H
4-84	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H
4-85	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H

[0102]

No.	X	Y	Z
4-86	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H
4-87	Me	F	F
4-88	Me	SEt	F
4-89	Me	SOEt	F
4-90	Me	SO ₂ Et	F
4-91	Me	Me	Cl
4-92	Me	F	Cl
4-93	Me	Cl	Cl
4-94	Me	NH ₂	Cl
4-95	Me	NHMe	Cl
4-96	Me	NMe ₂	Cl
4-97	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-98	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
4-99	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl
4-100	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
4-101	Me	O(CH ₂) ₂ CONMe ₂	Cl
4-102	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂	Cl
4-103	Me	O(CH ₂) ₂ NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl
4-104	Me	O(CH ₂) ₂ NHCO ₂ Me	Cl
4-105	Me	OCH ₂ NHSO ₂ cPr	Cl
4-106	Me	O(CH ₂)-5-(2,4-디메틸-2,4-디하이드로)- 3H-1,2,4-트리아졸-3-온	Cl
4-107	Me	O(CH ₂)-3,5-디메틸-1,2-옥사졸-4-일	Cl
4-108	Me	Sme	Cl
4-109	Me	SOMe	Cl
4-110	Me	SO ₂ Me	Cl
4-111	Me	SEt	Cl
4-112	Me	SOEt	Cl
4-113	Me	SO ₂ Et	Cl
4-114	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-115	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-116	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-117	Me	NH ₂	Br
4-118	Me	NHMe	Br
4-119	Me	NMe ₂	Br
4-120	Me	OCH ₂ CONEt ₂	Br
4-121	Me	O(CH ₂)-5-피롤리딘-2-온	Br
4-122	Me	SMe	Br
4-123	Me	SOMe	Br
4-124	Me	SO ₂ Me	Br

[0103]

No.	X	Y	Z
4-125	Me	SEt	Br
4-126	Me	SOEt	Br
4-127	Me	SO ₂ Et	Br
4-128	Me	SMe	I
4-129	Me	SOMe	I
4-130	Me	SO ₂ Me	I
4-131	Me	SEt	I
4-132	Me	SOEt	I
4-133	Me	SO ₂ Et	I
4-134	Me	Cl	CF ₃
4-135	Me	SMe	CF ₃
4-136	Me	SOMe	CF ₃
4-137	Me	SO ₂ Me	CF ₃
4-138	Me	SEt	CF ₃
4-139	Me	SOEt	CF ₃
4-140	Me	SO ₂ Et	CF ₃
4-141	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-142	Me	S(O)(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-143	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-144	Me	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
4-145	Me	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
4-146	Me	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
4-147	Me	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
4-148	Me	NH ₂	SO ₂ Me
4-149	Me	NHMe	SO ₂ Me
4-150	Me	NMe ₂	SO ₂ Me
4-151	Me	NH(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
4-152	Me	Pyrazol-1-yl	SO ₂ Me
4-153	Me	OH	SO ₂ Me
4-154	Me	Ome	SO ₂ Me
4-155	Me	Ome	SO ₂ Et
4-156	Me	Oet	SO ₂ Me
4-157	Me	Oet	SO ₂ Et
4-158	Me	OiPr	SO ₂ Me
4-159	Me	OiPr	SO ₂ Et
4-160	Me	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
4-161	Me	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
4-162	Me	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
4-163	Me	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et

[0104]

No.	X	Y	Z
4-164	Me	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Me
4-165	Me	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Et
4-166	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me
4-167	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et
4-168	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
4-169	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
4-170	Me	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
4-171	Me	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
4-172	Me	O(CH ₂) ₂ -O(3,5-디메톡시피리미딘-2-일)	SO ₂ Me
4-173	Me	Cl	SO ₂ Me
4-174	Me	Sme	SO ₂ Me
4-175	Me	SOMe	SO ₂ Me
4-176	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
4-177	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et
4-178	Me	Set	SO ₂ Me
4-179	Me	SOEt	SO ₂ Me
4-180	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me
4-181	Me	S(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
4-182	Me	SO(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
4-183	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
4-184	CH ₂ SMe	Ome	SO ₂ Me
4-185	CH ₂ Ome	Ome	SO ₂ Me
4-186	CH ₂ O(CH ₂) ₂ Ome	NH(CH ₂) ₂ Oet	SO ₂ Me
4-187	CH ₂ O(CH ₂) ₂ Ome	NH(CH ₂) ₃ Oet	SO ₂ Me
4-188	CH ₂ O(CH ₂) ₃ Ome	Ome	SO ₂ Me
4-189	CH ₂ O(CH ₂) ₂ Ome	NH(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
4-190	CH ₂ O(CH ₂) ₂ Ome	NH(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
4-191	Et	Sme	Cl
4-192	Et	SO ₂ Me	Cl
4-193	Et	Sme	CF ₃
4-194	Et	SO ₂ Me	CF ₃
4-195	Et	F	SO ₂ Me
4-196	Et	NH(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
4-197	iPr	SMe	CF ₃
4-198	iPr	SO ₂ Me	CF ₃
4-199	cPr	SO ₂ Me	CF ₃
4-200	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	F
4-201	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	F
4-202	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F
4-203	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	F

[0105]

No.	X	Y	Z
4-204	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	Cl
4-205	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	Cl
4-206	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
4-207	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	Cl
4-208	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	Br
4-209	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	Br
4-210	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	Br
4-211	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br
4-212	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	Br
4-213	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	I
4-214	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	I
4-215	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I
4-216	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	I
4-217	CF ₃	F	SO ₂ Me
4-218	CF ₃	F	SO ₂ Et
4-219	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
4-220	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
4-221	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
4-222	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
4-223	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me
4-224	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et
4-225	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
4-226	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
4-227	F	SMe	CF ₃
4-228	F	SOMe	CF ₃
4-229	Cl	SMe	H
4-230	Cl	SOMe	H
4-231	Cl	SO ₂ Me	H
4-232	Cl	SEt	H
4-233	Cl	SOEt	H
4-234	Cl	SO ₂ Et	H
4-235	Cl	S(CH ₂) ₂ Ome	H
4-236	Cl	SO(CH ₂) ₂ Ome	H
4-237	Cl	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	H
4-238	Cl	Me	Cl
4-239	Cl	Cl	Cl
4-240	Cl	OCH ₂ CHCH ₂	Cl
4-241	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl
4-242	Cl	O(CH ₂) ₂ Ome	Cl
4-243	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Cl

[0106]

No.	X	Y	Z
4-244	Cl	O(CH ₂)-5-피롤리딘-2-온	Cl
4-245	Cl	SMe	Cl
4-246	Cl	SOMe	Cl
4-247	Cl	SO ₂ Me	Cl
4-248	Cl	F	SMe
4-249	Cl	Cl	SO ₂ Me
4-250	Cl	COOMe	SO ₂ Me
4-251	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me
4-252	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me
4-253	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-254	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et
4-255	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Me
4-256	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Et
4-257	Cl	CH ₂ OiPr	SO ₂ Me
4-258	Cl	CH ₂ OcPentyl	SO ₂ Me
4-259	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
4-260	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
4-261	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et
4-262	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
4-263	Cl	CH ₂ PO ₃ Me ₂	SO ₂ Me
4-264	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SMe
4-265	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
4-266	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
4-267	Cl	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
4-268	Cl	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
4-269	Cl	CH ₂ O-테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Me
4-270	Cl	CH ₂ O-테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Et
4-271	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-2-일	SO ₂ Me
4-272	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-2-일	SO ₂ Et
4-273	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Me
4-274	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Et
4-275	Cl	피라졸-1-일	SO ₂ Me
4-276	Cl	OMe	SO ₂ Me
4-277	Cl	OMe	SO ₂ Et
4-278	Cl	OEt	SO ₂ Me
4-279	Cl	OEt	SO ₂ Et
4-280	Cl	OiPr	SO ₂ Me
4-281	Cl	OiPr	SO ₂ Et
4-282	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me

[0107]

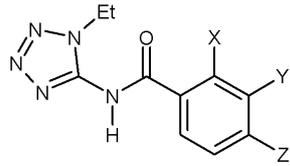
No.	X	Y	Z
4-283	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
4-284	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
4-285	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
4-286	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
4-287	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
4-288	Cl	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
4-289	Cl	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
4-290	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
4-291	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
4-292	Cl	SMe	SO ₂ Me
4-293	Cl	SOMe	SO ₂ Me
4-294	Br	OMe	Br
4-295	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
4-296	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-297	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
4-298	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
4-299	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
4-300	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
4-301	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
4-302	Br	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
4-303	Br	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
4-304	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-305	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
4-306	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
4-307	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
4-308	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
4-309	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
4-310	I	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
4-311	I	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
4-312	OMe	SMe	CF ₃
4-313	OMe	SOMe	CF ₃
4-314	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
4-315	OMe	SEt	CF ₃
4-316	OMe	SOEt	CF ₃
4-317	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
4-318	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-319	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-320	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-321	OMe	SMe	Cl
4-322	OMe	SOMe	Cl

[0108]

No.	X	Y	Z
4-323	OMe	SO ₂ Me	Cl
4-324	OMe	SEt	Cl
4-325	OMe	SOEt	Cl
4-326	OMe	SO ₂ Et	Cl
4-327	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-328	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-329	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-330	OCH ₂ c-Pr	SMe	CF ₃
4-331	OCH ₂ c-Pr	SOMe	CF ₃
4-332	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃
4-333	OCH ₂ c-Pr	SEt	CF ₃
4-334	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃
4-335	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃
4-336	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-337	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-338	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-339	OCH ₂ c-Pr	SMe	Cl
4-340	OCH ₂ c-Pr	SOMe	Cl
4-341	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl
4-342	OCH ₂ c-Pr	SEt	Cl
4-343	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl
4-344	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl
4-345	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-346	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-347	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-348	OCH ₂ c-Pr	SMe	SO ₂ Me
4-349	OCH ₂ c-Pr	SOMe	SO ₂ Me
4-350	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me
4-351	OCH ₂ c-Pr	SEt	SO ₂ Me
4-352	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me
4-353	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me
4-354	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-355	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-356	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-357	SO ₂ Me	F	CF ₃
4-358	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃
4-359	SO ₂ Me	NHEt	Cl
4-360	SMe	SEt	F
4-361	SMe	SMe	F

[0109]

표 5: A가 CY이고, B가 N이며, R이 에틸인 본 발명에 따르는 화학식 I의
화합물



No.	X	Y	Z
5-1	F	H	Cl
5-2	F	H	Br
5-3	F	H	SO ₂ Me
5-4	F	H	SO ₂ Et
5-5	F	H	CF ₃
5-6	F	H	NO ₂
5-7	Cl	H	F
5-8	Cl	H	Cl
5-9	Cl	H	Br
5-10	Cl	H	SMe
5-11	Cl	H	SOMe
5-12	Cl	H	SO ₂ Me
5-13	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl
5-14	Cl	H	SEt
5-15	Cl	H	SO ₂ Et
5-16	Cl	H	CF ₃
5-17	Cl	H	NO ₂
5-18	Cl	H	피라졸-1-일
5-19	Cl	H	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
5-20	Br	H	Cl
5-21	Br	H	Br
5-22	Br	H	SO ₂ Me
5-23	Br	H	SO ₂ Et
5-24	Br	H	CF ₃
5-25	SO ₂ Me	H	Cl
5-26	SO ₂ Me	H	Br
5-27	SO ₂ Me	H	Sme
5-28	SO ₂ Me	H	SOMe
5-29	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me
5-30	SO ₂ Me	H	SO ₂ Et

[0110]

No.	X	Y	Z
5-31	SO ₂ Me	H	CF ₃
5-32	SO ₂ Et	H	Cl
5-33	SO ₂ Et	H	Br
5-34	SO ₂ Et	H	SMe
5-35	SO ₂ Et	H	SOMe
5-36	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me
5-37	SO ₂ Et	H	CF ₃
5-38	NO ₂	H	F
5-39	NO ₂	H	Cl
5-40	NO ₂	H	Br
5-41	NO ₂	H	I
5-42	NO ₂	H	CN
5-43	NO ₂	H	SO ₂ Me
5-44	NO ₂	H	SO ₂ Et
5-45	NO ₂	H	CF ₃
5-46	Me	H	Cl
5-47	Me	H	Br
5-48	Me	H	SMe
5-49	Me	H	SO ₂ Me
5-50	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl
5-51	Me	H	SEt
5-52	Me	H	SO ₂ Et
5-53	Me	H	CF ₃
5-54	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃
5-55	Et	H	Cl
5-56	Et	H	Br
5-57	Et	H	SMe
5-58	Et	H	SO ₂ Me
5-59	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl
5-60	Et	H	SEt
5-61	Et	H	SO ₂ Et
5-62	Et	H	CF ₃
5-63	CF ₃	H	Cl
5-64	CF ₃	H	Br
5-65	CF ₃	H	SO ₂ Me
5-66	CF ₃	H	SO ₂ Et
5-67	CF ₃	H	CF ₃
5-68	NO ₂	NH ₂	F
5-69	NO ₂	NHMe	F
5-70	NO ₂	NMe ₂	F
5-71	NO ₂	Me	Cl

[0111]

No.	X	Y	Z
5-72	NO ₂	NH ₂	Cl
5-73	NO ₂	NHMe	Cl
5-74	NO ₂	NMe ₂	Cl
5-75	NO ₂	NH ₂	Br
5-76	NO ₂	NHMe	Br
5-77	NO ₂	NMe ₂	Br
5-78	NO ₂	NH ₂	CF ₃
5-79	NO ₂	NMe ₂	CF ₃
5-80	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me
5-81	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et
5-82	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me
5-83	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me
5-84	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et
5-85	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
5-86	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
5-87	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
5-88	Me	SMe	H
5-89	Me	SOMe	H
5-90	Me	SO ₂ Me	H
5-91	Me	SEt	H
5-92	Me	SOEt	H
5-93	Me	SO ₂ Et	H
5-94	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H
5-95	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H
5-96	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H
5-97	Me	F	F
5-98	Me	F	Cl
5-99	Me	SEt	F
5-100	Me	SOEt	F
5-101	Me	SO ₂ Et	F
5-102	Me	Me	Cl
5-103	Me	F	Cl
5-104	Me	Cl	Cl
5-105	Me	NH ₂	Cl
5-106	Me	NHMe	Cl
5-107	Me	NMe ₂	Cl
5-108	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-109	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
5-110	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl
5-111	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
5-112	Me	O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂	Cl

[0112]

No.	X	Y	Z
5-113	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂	Cl
5-114	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl
5-115	Me	O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me	Cl
5-116	Me	O-CH ₂ -NHCO ₂ cPr	Cl
5-117	Me	O(CH ₂) ₂ -5,2,4-디메틸-2,4-디하이드로-3H-1,2,4-트리아졸-3-온	Cl
5-118	Me	O(CH ₂) ₂ -3,5-디메틸-1,2-옥사졸-4-일	Cl
5-119	Me	SMe	Cl
5-120	Me	SOMe	Cl
5-121	Me	SO ₂ Me	Cl
5-122	Me	SEt	Cl
5-123	Me	SOEt	Cl
5-124	Me	SO ₂ Et	Cl
5-125	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-126	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-127	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-128	Me	NH ₂	Br
5-129	Me	NHMe	Br
5-130	Me	NMe ₂	Br
5-131	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Br
5-132	Me	O(CH ₂) ₂ -5-피롤리딘-2-온	Br
5-133	Me	SMe	Br
5-134	Me	SOMe	Br
5-135	Me	SO ₂ Me	Br
5-136	Me	SEt	Br
5-137	Me	SOEt	Br
5-138	Me	SO ₂ Et	Br
5-139	Me	SMe	I
5-140	Me	SOMe	I
5-141	Me	SO ₂ Me	I
5-142	Me	SEt	I
5-143	Me	SOEt	I
5-144	Me	SO ₂ Et	I
5-145	Me	Cl	CF ₃
5-146	Me	SMe	CF ₃
5-147	Me	SOMe	CF ₃
5-148	Me	SO ₂ Me	CF ₃
5-149	Me	SEt	CF ₃
5-150	Me	SOEt	CF ₃
5-151	Me	SO ₂ Et	CF ₃
5-152	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃

[0113]

No.	X	Y	Z
5-153	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-154	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-155	Me	Me	SO ₂ Me
5-156	Me	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
5-157	Me	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
5-158	Me	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
5-159	Me	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
5-160	Me	NH ₂	SO ₂ Me
5-161	Me	NHMe	SO ₂ Me
5-162	Me	NMe ₂	SO ₂ Me
5-163	Me	NH(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
5-164	Me	피라졸-1-일	SO ₂ Me
5-165	Me	OH	SO ₂ Me
5-166	Me	OMe	SO ₂ Me
5-167	Me	OMe	SO ₂ Et
5-168	Me	OEt	SO ₂ Me
5-169	Me	OEt	SO ₂ Et
5-170	Me	OiPr	SO ₂ Me
5-171	Me	OiPr	SO ₂ Et
5-172	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-173	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
5-174	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
5-175	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
5-176	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
5-177	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
5-178	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me
5-179	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et
5-180	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
5-181	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
5-182	Me	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
5-183	Me	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
5-184	Me	O(CH ₂) ₂ -O(3,5-디메톡시피리미딘-2-일	SO ₂ Me
5-185	Me	Cl	SO ₂ Me
5-186	Me	Sme	SO ₂ Me
5-187	Me	SOMe	SO ₂ Me
5-188	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
5-189	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et
5-190	Me	Set	SO ₂ Me
5-191	Me	SOEt	SO ₂ Me

[0114]

No.	X	Y	Z
5-192	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me
5-193	Me	S(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
5-194	Me	SO(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
5-195	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
5-196	CH ₂ SMe	Ome	SO ₂ Me
5-197	CH ₂ Ome	Ome	SO ₂ Me
5-198	CH ₂ O(CH ₂) ₂ Ome	NH(CH ₂) ₂ Oet	SO ₂ Me
5-199	CH ₂ O(CH ₂) ₂ Ome	NH(CH ₂) ₃ Oet	SO ₂ Me
5-200	CH ₂ O(CH ₂) ₃ Ome	Ome	SO ₂ Me
5-201	CH ₂ O(CH ₂) ₂ Ome	NH(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
5-202	CH ₂ O(CH ₂) ₂ Ome	NH(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
5-203	Et	Sme	Cl
5-204	Et	SO ₂ Me	Cl
5-205	Et	Sme	CF ₃
5-206	Et	SO ₂ Me	CF ₃
5-207	Et	F	SO ₂ Me
5-208	Et	NH(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
5-209	iPr	SO ₂ Me	CF ₃
5-210	oPr	SO ₂ Me	CF ₃
5-211	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	F
5-212	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	F
5-213	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F
5-214	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	F
5-215	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	Cl
5-216	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	Cl
5-217	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
5-218	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	Cl
5-219	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	Br
5-220	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	Br
5-221	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br
5-222	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	Br
5-223	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	I
5-224	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	I
5-225	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I
5-226	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	I
5-227	CF ₃	F	SO ₂ Me
5-228	CF ₃	F	SO ₂ Et
5-229	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
5-230	CF ₃	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
5-231	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
5-232	CF ₃	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et

[0115]

No.	X	Y	Z
5-233	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me
5-234	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et
5-235	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
5-236	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
5-237	F	Sme	CF ₃
5-238	F	SOMe	CF ₃
5-239	Cl	Me	Cl
5-240	Cl	OCH ₂ CHCH ₂	Cl
5-241	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl
5-242	Cl	O(CH ₂) ₂ Ome	Cl
5-243	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Cl
5-244	Cl	O(CH ₂)-5-피롤리딘-2-온	Cl
5-245	Cl	Sme	Cl
5-246	Cl	SOMe	Cl
5-247	Cl	SO ₂ Me	Cl
5-248	Cl	F	SMe
5-249	Cl	Cl	SO ₂ Me
5-250	Cl	COOMe	SO ₂ Me
5-251	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me
5-252	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me
5-253	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-254	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et
5-255	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Me
5-256	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Et
5-257	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
5-258	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
5-259	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et
5-260	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
5-261	Cl	CH ₂ Oc 펜틸	SO ₂ Me
5-262	Cl	CH ₂ PO(OMe) ₂	SO ₂ Me
5-263	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SMe
5-264	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
5-265	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
5-266	Cl	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
5-267	Cl	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
5-268	Cl	5-(메톡시메틸)-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
5-269	Cl	5-(메톡시메틸)-5-메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
5-270	Cl	CH ₂ O-테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Me

[0116]

No.	X	Y	Z
5-271	Cl	CH ₂ O-테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Et
5-272	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-2-일	SO ₂ Me
5-273	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-2-일	SO ₂ Et
5-274	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Me
5-275	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Et
5-276	Cl	Ome	SO ₂ Me
5-277	Cl	Ome	SO ₂ Et
5-278	Cl	Oet	SO ₂ Me
5-279	Cl	Oet	SO ₂ Et
5-280	Cl	OiPr	SO ₂ Me
5-281	Cl	OiPr	SO ₂ Et
5-282	Cl	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
5-283	Cl	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Me
5-284	Cl	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Et
5-285	Cl	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
5-286	Cl	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
5-287	Cl	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
5-288	Cl	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
5-289	Cl	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
5-290	Cl	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
5-291	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
5-292	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
5-293	Cl	Sme	SO ₂ Me
5-294	Cl	SOMe	SO ₂ Me
5-295	Br	Ome	Br
5-296	Br	O(CH ₂) ₂ Ome	Br
5-297	Br	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
5-298	Br	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
5-299	Br	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
5-300	Br	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
5-301	Br	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Me
5-302	Br	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Et
5-303	Br	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
5-304	Br	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
5-305	I	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
5-306	I	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
5-307	I	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
5-308	I	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
5-309	I	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Me
5-310	I	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Et
5-311	I	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me

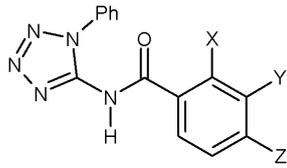
[0117]

No.	X	Y	Z
5-312	I	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
5-313	OMe	SMe	CF ₃
5-314	OMe	SOMe	CF ₃
5-315	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
5-316	OMe	SOEt	CF ₃
5-317	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
5-318	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-319	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-320	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-321	OMe	SMe	Cl
5-322	OMe	SOMe	Cl
5-323	OMe	SO ₂ Me	Cl
5-324	OMe	SEt	Cl
5-325	OMe	SOEt	Cl
5-326	OMe	SO ₂ Et	Cl
5-327	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-328	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-329	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-330	OCH ₂ c-Pr	SMe	CF ₃
5-331	OCH ₂ c-Pr	SOMe	CF ₃
5-332	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃
5-333	OCH ₂ c-Pr	SEt	CF ₃
5-334	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃
5-335	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃
5-336	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-337	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-338	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-339	OCH ₂ c-Pr	SMe	Cl
5-340	OCH ₂ c-Pr	SOMe	Cl
5-341	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl
5-342	OCH ₂ c-Pr	SEt	Cl
5-343	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl
5-344	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl
5-345	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-346	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-347	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-348	OCH ₂ c-Pr	SMe	SO ₂ Me
5-349	OCH ₂ c-Pr	SOMe	SO ₂ Me
5-350	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me
5-351	OCH ₂ c-Pr	SEt	SO ₂ Me
5-352	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me

[0118]

표 6: A가 CY 이고, B가 N이며, R이 페닐인 본 발명에 따르는 화학식 I의

화합물



No.	X	Y	Z
6-1	F	H	Cl
6-2	F	H	Br
6-3	F	H	SO ₂ Me
6-4	F	H	SO ₂ Et
6-5	F	H	CF ₃
6-6	F	H	NO ₂
6-7	Cl	H	F
6-8	Cl	H	Cl
6-9	Cl	H	Br
6-10	Cl	H	SMe
6-11	Cl	H	SOMe
6-12	Cl	H	SO ₂ Me
6-13	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl
6-14	Cl	H	SEt
6-15	Cl	H	SO ₂ Et
6-16	Cl	H	CF ₃
6-17	Cl	H	NO ₂
6-18	Cl	H	피라졸-1-일
6-19	Cl	H	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
6-20	Br	H	Cl
6-21	Br	H	Br
6-22	Br	H	SO ₂ Me
6-23	Br	H	SO ₂ Et
6-24	Br	H	CF ₃
6-25	SO ₂ Me	H	Cl
6-26	SO ₂ Me	H	Br
6-27	SO ₂ Me	H	SMe
6-28	SO ₂ Me	H	SOMe
6-29	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me
6-30	SO ₂ Me	H	SO ₂ Et

[0119]

No.	X	Y	Z
6-31	SMe	H	CF ₃
6-32	SO ₂ Me	H	CF ₃
6-33	SO ₂ Et	H	Cl
6-34	SO ₂ Et	H	Br
6-35	SO ₂ Et	H	SMe
6-36	SO ₂ Et	H	SOMe
6-37	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me
6-38	SO ₂ Et	H	CF ₃
6-39	NO ₂	H	F
6-40	NO ₂	H	Cl
6-41	NO ₂	H	Br
6-42	NO ₂	H	I
6-43	NO ₂	H	CN
6-44	NO ₂	H	SO ₂ Me
6-45	NO ₂	H	SO ₂ Et
6-46	NO ₂	H	CF ₃
6-47	Me	H	Cl
6-48	Me	H	Br
6-49	Me	H	SMe
6-50	Me	H	SO ₂ Me
6-51	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl
6-52	Me	H	SEt
6-53	Me	H	SO ₂ Et
6-54	Me	H	CF ₃
6-55	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃
6-56	Et	H	Cl
6-57	Et	H	Br
6-58	Et	H	SMe
6-59	Et	H	SO ₂ Me
6-60	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl
6-61	Et	H	SEt
6-62	Et	H	SO ₂ Et
6-63	Et	H	CF ₃
6-64	CF ₃	H	Cl
6-65	CF ₃	H	Br
6-66	CF ₃	H	SO ₂ Me
6-67	CF ₃	H	SO ₂ Et
6-68	CF ₃	H	CF ₃
6-69	NO ₂	NH ₂	F
6-70	NO ₂	NHMe	F
6-71	NO ₂	NMe ₂	F

[0120]

No.	X	Y	Z
6-72	NO ₂	Me	Cl
6-73	NO ₂	NH ₂	Cl
6-74	NO ₂	NHMe	Cl
6-75	NO ₂	NMe ₂	Cl
6-76	NO ₂	NH ₂	Br
6-77	NO ₂	NHMe	Br
6-78	NO ₂	NMe ₂	Br
6-79	NO ₂	NH ₂	CF ₃
6-80	NO ₂	NMe ₂	CF ₃
6-81	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me
6-82	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et
6-83	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me
6-84	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me
6-85	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et
6-86	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
6-87	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
6-88	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4-트리아졸-1-일
6-89	Me	SMe	H
6-90	Me	SOMe	H
6-91	Me	SO ₂ Me	H
6-92	Me	SEt	H
6-93	Me	SOEt	H
6-94	Me	SO ₂ Et	H
6-95	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H
6-96	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H
6-97	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H
6-98	Me	F	F
6-99	Me	F	Cl
6-100	Me	SEt	F
6-101	Me	SOEt	F
6-102	Me	SO ₂ Et	F
6-103	Me	Me	Cl
6-104	Me	F	Cl
6-105	Me	Cl	Cl
6-106	Me	NH ₂	Cl
6-107	Me	NHMe	Cl
6-108	Me	NMe ₂	Cl
6-109	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-110	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
6-111	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl
6-112	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl

[0121]

No.	X	Y	Z
6-113	Me	O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂	Cl
6-114	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂	Cl
6-115	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl
6-116	Me	O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me	Cl
6-117	Me	O-CH ₂ -NHSO ₂ cPr	Cl
6-118	Me	O(CH ₂) ₂ -5-2,4-디메틸-2,4-디하이드로-3H-1,2,4-트리아졸-3-온	Cl
6-119	Me	O(CH ₂) ₂ -3,5-디메틸-1,2-옥사졸-4-일	Cl
6-120	Me	Sme	Cl
6-121	Me	SOMe	Cl
6-122	Me	SO ₂ Me	Cl
6-123	Me	Set	Cl
6-124	Me	SOEt	Cl
6-125	Me	SO ₂ Et	Cl
6-126	Me	S(CH ₂) ₂ Ome	Cl
6-127	Me	SO(CH ₂) ₂ Ome	Cl
6-128	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ Ome	Cl
6-129	Me	NH ₂	Br
6-130	Me	NHMe	Br
6-131	Me	NMe ₂	Br
6-132	Me	O(CH ₂) ₂ - (CO)NEt ₂	Br
6-133	Me	O(CH ₂) ₂ -5-피롤리딘-2-온	Br
6-134	Me	Sme	Br
6-135	Me	SOMe	Br
6-136	Me	SO ₂ Me	Br
6-137	Me	Set	Br
6-138	Me	SOEt	Br
6-139	Me	SO ₂ Et	Br
6-140	Me	Sme	I
6-141	Me	SOMe	I
6-142	Me	SO ₂ Me	I
6-143	Me	SEt	I
6-144	Me	SOEt	I
6-145	Me	SO ₂ Et	I
6-146	Me	Cl	CF ₃
6-147	Me	SMe	CF ₃
6-148	Me	SOMe	CF ₃
6-149	Me	SO ₂ Me	CF ₃
6-150	Me	SEt	CF ₃
6-151	Me	SOEt	CF ₃
6-152	Me	SO ₂ Et	CF ₃

[0122]

No.	X	Y	Z
6-153	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-154	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-155	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-156	Me	Me	SO ₂ Me
6-157	Me	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
6-158	Me	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
6-159	Me	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
6-160	Me	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
6-161	Me	NH ₂	SO ₂ Me
6-162	Me	NHMe	SO ₂ Me
6-163	Me	NMe ₂	SO ₂ Me
6-164	Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-165	Me	피라졸-1-일	SO ₂ Me
6-166	Me	OH	SO ₂ Me
6-167	Me	Ome	SO ₂ Me
6-168	Me	Ome	SO ₂ Et
6-169	Me	Oet	SO ₂ Me
6-170	Me	Oet	SO ₂ Et
6-171	Me	OiPr	SO ₂ Me
6-172	Me	OiPr	SO ₂ Et
6-173	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-174	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
6-175	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
6-176	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
6-177	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
6-178	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
6-179	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me
6-180	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et
6-181	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
6-182	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
6-183	Me	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
6-184	Me	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
6-185	Me	O(CH ₂) ₂ -O(3,5-디메톡시피리미딘-2-일)	SO ₂ Me
6-186	Me	Cl	SO ₂ Me
6-187	Me	SMe	SO ₂ Me
6-188	Me	SOMe	SO ₂ Me
6-189	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
6-190	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et
6-191	Me	SEt	SO ₂ Me

[0123]

No.	X	Y	Z
6-192	Me	SOEt	SO ₂ Me
6-193	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me
6-194	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-195	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-196	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-197	CH ₂ SMe	OMe	SO ₂ Me
6-198	CH ₂ OMe	OMe	SO ₂ Me
6-199	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me
6-200	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me
6-201	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	OMe	SO ₂ Me
6-202	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-203	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
6-204	Et	SMe	Cl
6-205	Et	SO ₂ Me	Cl
6-206	Et	SMe	CF ₃
6-207	Et	SO ₂ Me	CF ₃
6-208	Et	F	SO ₂ Me
6-209	Et	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-210	iPr	SO ₂ Me	CF ₃
6-211	oPr	SO ₂ Me	CF ₃
6-212	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	F
6-213	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	F
6-214	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F
6-215	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	F
6-216	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-217	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
6-218	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
6-219	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	Cl
6-220	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
6-221	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Br
6-222	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br
6-223	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	Br
6-224	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	I
6-225	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	I
6-226	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I
6-227	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	I
6-228	CF ₃	F	SO ₂ Me
6-229	CF ₃	F	SO ₂ Et
6-230	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-231	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
6-232	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me

[0124]

No.	X	Y	Z
6-233	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
6-234	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me
6-235	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et
6-236	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
6-237	CF ₃	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
6-238	F	SMe	CF ₃
6-239	F	SOMe	CF ₃
6-240	Cl	Me	Cl
6-241	Cl	OCH ₂ CHCH ₂	Cl
6-242	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl
6-243	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-244	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Cl
6-245	Cl	O(CH ₂)-5-피롤리딘-2-온	Cl
6-246	Cl	SMe	Cl
6-247	Cl	SOMe	Cl
6-248	Cl	SO ₂ Me	Cl
6-249	Cl	F	SMe
6-250	Cl	Cl	SO ₂ Me
6-251	Cl	COOMe	SO ₂ Me
6-252	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me
6-253	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me
6-254	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-255	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et
6-256	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Me
6-257	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Et
6-258	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
6-259	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
6-260	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et
6-261	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
6-262	Cl	CH ₂ Oc 펜틸	SO ₂ Me
6-263	Cl	CH ₂ PO(OMe) ₂	SO ₂ Me
6-264	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SMe
6-265	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
6-266	Cl	4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
6-267	Cl	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Me
6-268	Cl	5-시아노메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
6-269	Cl	5-(메톡시메틸)-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et
6-270	Cl	5-(메톡시메틸)-5-메틸-4,5-디하이드로-1,2-옥사졸-3-일	SO ₂ Et

[0125]

No.	X	Y	Z
6-271	Cl	CH ₂ O-테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Me
6-272	Cl	CH ₂ O-테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Et
6-273	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-2-일	SO ₂ Me
6-274	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-2-일	SO ₂ Et
6-275	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Me
6-276	Cl	CH ₂ OCH ₂ -테트라하이드로푸란-3-일	SO ₂ Et
6-277	Cl	Ome	SO ₂ Me
6-278	Cl	OMe	SO ₂ Et
6-279	Cl	OEt	SO ₂ Me
6-280	Cl	OEt	SO ₂ Et
6-281	Cl	OiPr	SO ₂ Me
6-282	Cl	OiPr	SO ₂ Et
6-283	Cl	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
6-284	Cl	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Me
6-285	Cl	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Et
6-286	Cl	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
6-287	Cl	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
6-288	Cl	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
6-289	Cl	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
6-290	Cl	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
6-291	Cl	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
6-292	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
6-293	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
6-294	Cl	SMe	SO ₂ Me
6-295	Cl	SOMe	SO ₂ Me
6-296	Br	OMe	Br
6-297	Br	O(CH ₂) ₂ Ome	Br
6-298	Br	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
6-299	Br	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
6-300	Br	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
6-301	Br	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
6-302	Br	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Me
6-303	Br	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Et
6-304	Br	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
6-305	Br	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
6-306	I	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Me
6-307	I	O(CH ₂) ₂ Ome	SO ₂ Et
6-308	I	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Me
6-309	I	O(CH ₂) ₃ Ome	SO ₂ Et
6-310	I	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Me
6-311	I	O(CH ₂) ₄ Ome	SO ₂ Et

[0126]

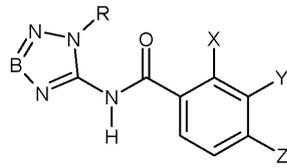
No.	X	Y	Z
6-312	I	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Me
6-313	I	[1,4]디옥산-2-일-메톡시	SO ₂ Et
6-314	OMe	SMe	CF ₃
6-315	OMe	SOMe	CF ₃
6-316	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
6-317	OMe	SOEt	CF ₃
6-318	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
6-319	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-320	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-321	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-322	OMe	SMe	Cl
6-323	OMe	SOMe	Cl
6-324	OMe	SO ₂ Me	Cl
6-325	OMe	SEt	Cl
6-326	OMe	SOEt	Cl
6-327	OMe	SO ₂ Et	Cl
6-328	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-329	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-330	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-331	OCH ₂ c-Pr	SMe	CF ₃
6-332	OCH ₂ c-Pr	SOMe	CF ₃
6-333	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃
6-334	OCH ₂ c-Pr	SEt	CF ₃
6-335	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃
6-336	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃
6-337	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-338	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-339	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-340	OCH ₂ c-Pr	SMe	Cl
6-341	OCH ₂ c-Pr	SOMe	Cl
6-342	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl
6-343	OCH ₂ c-Pr	SEt	Cl
6-344	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl
6-345	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl
6-346	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-347	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-348	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-349	OCH ₂ c-Pr	SMe	SO ₂ Me
6-350	OCH ₂ c-Pr	SOMe	SO ₂ Me
6-351	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me
6-352	OCH ₂ c-Pr	SEt	SO ₂ Me

[0127]

No.	X	Y	Z
6-353	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me
6-354	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me
6-355	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-356	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-357	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-358	SO ₂ Me	F	CF ₃
6-359	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃
6-360	SO ₂ Me	NHEt	Cl
6-361	SMe	SEt	F
6-362	SMe	SMe	F

[0128]

표 7: A가 CY인 본 발명에 따르는 화학식 I의 화합물



No.	B	R	X	Y	Z
7-1	CH	nPr	Cl	H	SO ₂ Me
7-2	CH	iPr	Cl	H	SO ₂ Me
7-3	N	nPr	Cl	H	SO ₂ Me
7-4	N	iPr	Cl	H	SO ₂ Me
7-5	N	cPr	Cl	H	SO ₂ Me
7-6	N	Allyl	Cl	H	SO ₂ Me
7-7	N	CH ₂ OMe	Cl	H	SO ₂ Me
7-8	CH	nPr	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-9	CH	iPr	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-10	N	nPr	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-11	N	iPr	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-12	N	cPr	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-13	N	Allyl	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-14	N	CH ₂ OMe	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-15	CH	nPr	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-16	CH	iPr	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-17	N	nPr	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-18	N	iPr	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-19	N	cPr	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-20	N	Allyl	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-21	N	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-22	CH	nPr	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-23	CH	iPr	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-24	N	nPr	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-25	N	iPr	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-26	N	cPr	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-27	N	알릴	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-28	N	CH ₂ OMe	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-29	CH	nPr	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-30	CH	iPr	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-31	CH	피리드-2-일	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-32	N	nPr	Me	SO ₂ Me	CF ₃

[0129]

No.	B	R	X	Y	Z
7-33	N	iPr	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-34	N	cPr	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-35	N	알릴	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-36	N	CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-37	N	CH ₂ (CO)Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-38	N	CH ₂ COOEt	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-39	N	4-Cl-벤질	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-40	CH	nPr	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-41	CH	iPr	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-42	N	nPr	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-43	N	iPr	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-44	N	cPr	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-45	N	CH ₂ Ome	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-46	N	CH ₂ (CO)Me	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-47	N	CH ₂ COOEt	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-48	N	4-Cl-벤질	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me

표 8: A가 N인 본 발명에 따르는 화학식 I의 화합물



No.	B	R	X	Z
8-1	CH	Me	Cl	Cl
8-2	N	Me	Cl	Cl
8-3	CH	Me	Me	Cl
8-4	N	Me	Me	Cl
8-5	CH	Me	Cl	SMe
8-6	N	Me	Cl	SMe
8-7	CH	Me	Me	SO ₂ Me
8-8	N	Me	Me	SO ₂ Me
8-9	CH	Me	Cl	CF ₃
8-10	N	Me	Cl	CF ₃
8-11	CH	Ph	Cl	CF ₃
8-12	N	Ph	Cl	CF ₃
8-13	N	CH ₂ (CO)Me	Cl	CF ₃

[0130]

No.	B	R	X	Z
8-14	N	벤조일	Cl	CF ₃
8-15	N	알릴	Cl	CF ₃
8-16	N	4-Cl-벤질	Cl	CF ₃
8-17	N	CH ₂ CO ₂ Et	Cl	CF ₃
8-18	CH	Me	Me	CF ₃
8-19	N	Me	Me	CF ₃
8-20	CH	Me	CH ₂ OMe	CF ₃
8-21	N	Me	CH ₂ OMe	CF ₃
8-22	CH	Me	CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe	CF ₃
8-23	N	Me	CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe	CF ₃

[0131]

[0132] 유럽 특허출원 "EP 10174893" (2010년 9월 1일에 Bayer CropScience AG의 이름으로 EPO에 출원됨) 및 그의 상

응하는 국제출원 PCT/EP 2011/064820에 이미 기술된 바와 같이, 이하에서 또한 "본 발명에 따르는 화합물"로 함께 언급되는 본 발명에 따라 사용될 화학식 I의 화합물 및/또는 그들의 염은 경제적으로 중요한 단자엽 및 쌍자엽 일년생 유해식물에 대한 탁월한 제초 활성을 갖는다. 활성 화합물은 근경, 뿌리 줄기 및 그 밖의 다른 다년생 기관으로부터 받아하며, 방제하기가 어려운 다년생 잡초에 대해서도 효율적으로 작용한다.

[0133] 따라서, 본 발명은 상기 정의된 바와 같은 하나 또는 그 이상의 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드를 식물 (예를 들어, 단자엽 또는 쌍자엽 잡초 또는 원치 않는 농작물과 같은 유해 식물), 종자 (예를 들어, 곡물, 종자, 또는 괴경 또는 싹이 있는 발아 부분과 같은 식물 번식체), 또는 식물이 성장하는 영역 (예를 들어, 경작하고 있는 영역)에 적용하는 것을 포함하여, (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코쿠스 중, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코쿠스, 바람직하게는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유함으로써 HPPD 억제 제초제에 대해 내성인 유전자이식 농작물의 영역에서 원치 않는 식물을 방제하는 방법에 관한 것이다. 본 발명에 따르는 화합물에 의해서 방제될 수 있는 단자엽 및 쌍자엽 잡초중의 일부의 대표적인 구체적 예는 특정의 종에 대해 제한되는 것으로 열거함이 없이 언급될 수 있다.

[0134] 다음 속의 단자엽 유해 식물: 에이질롭스 (Aegilops), 아그로파이론 (Agropyron), 아그로스티스 (Agrostis), 알로페큐러스 (Alopecurus), 아페라 (Apera), 아베나 (Avena), 브라키아리아 (Brachiaria), 브로무스 (Bromus), 쉐크러스 (Cenchrus), 코멜리나 (Commelina), 사이노돈 (Cynodon), 사이페리스 (Cyperus), 닥틸록테늄 (Dactyl-octenium), 디기타리아 (Digitaria), 에키노클로아 (Echinochloa), 엘레오카리스 (Eleocharis), 엘로이신 (Eleusine), 에라그로스티스 (Eragrostis), 에리오클로아 (Erio-chloa), 페스투카 (Festuca), 펴브리스틸리스 (Fimbristylis), 헤테란테라 (Heteranthera), 임페라타 (Imperata), 이스케뎀 (Ischaemum), 렙토클로아 (Leptochloa), 롤리움 (Lolium), 모노코리아 (Monochoria), 파니쿰 (Panicum), 파스팔룸 (Paspalum), 팔라리스 (Phalaris), 플레움 (Phleum), 포아 (Poa), 로트보엘리아 (Rottboellia), 사기타리아 (Sagittaria), 시르푸스 (Scirpus), 세타리아 (Setaria), 소르검 (Sorghum).

[0135] 다음 속의 쌍자엽 잡초: 아부틸론 (Abutilon), 아마란투스 (Amaranthus), 암브로시아 (Ambrosia), 아노다 (Anoda), 안테미스 (Anthemis), 아페인스 (Aphanes), 아르테미시아 (Artemisia), 아트리플렉스 (Atriplex), 벨리스 (Bellis), 비덴스 (Bidens), 캡셀라 (Capsella), 카르두스 (Carduus), 카시아 (Cassia), 쉐타우레아 (Centaurea), 케노포듐 (Chenopodium), 시르시움 (Cirsium), 컨볼부루스 (Convolvulus), 다투라 (Datura), 데스모듐 (Desmodium), 에멕스 (Emex), 에리시뎀 (Erysimum), 유포르비아 (Euphorbia), 갈레옵시스 (Galeopsis), 갈린소가 (Galinsoga), 갈륨 (Galium), 히비스쿠스 (Hibiscus), 이포모에아 (Ipomoea), 코키아 (Kochia), 라뎀 (Lamium), 레피듐 (Lepidium), 린데르니아 (Lindernia), 매트리카리아 (Matricaria), 멘타 (Mentha), 머큐리알리스 (Mercurialis), 멀루고 (Mullugo), 마이오소티스 (Myosotis), 파파베르 (Papaver), 파르비티스 (Pharbitis), 플란타고 (Plantago), 폴리고눔 (Polygonum), 포르투라카 (Portulaca), 라눈쿨러스 (Ranunculus), 라파누스 (Raphanus), 로리파 (Rorippa), 로탈라 (Rotala), 루멕스 (Rumex), 샬소라 (Salsola), 세네시오 (Senecio), 세스바니아 (Sesbania), 시다 (Sida), 시나피스 (Sinapis), 솔라눔 (Solanum), 손커스 (Sonchus), 스펜노클레아 (Sphenoclea), 스텔라리아 (Stellaria), 타락사쿰 (Taraxacum), 트라스피 (Thlaspi),

트리폴륨 (Trifolium), 우르티카 (Urtica), 베로니카 (Veronica), 비올라 (Viola), 크산튠 (Xanthium).

[0136] 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드가 적용될 수 있는 경제적으로 중요한 작물의 유전자 이식 농작물은 예를 들어, 아라키스 (Arachis), 베타 (Beta), 브라시카 (Brassica), 쿠쿠미스 (Cucumis), 쿠쿠르비타 (Cucurbita), 헬리안투스 (Helianthus), 다우쿠스 (Daucus), 글리신 (Glycine), 고시뽀 (Gossypium), 이포모에아 (Ipomoea), 락투카 (Lactuca), 리눔 (Linum), 라이코페르시콘 (Lycopersicon), 니코티아나 (Nicotiana), 파세올루스 (Phaseolus), 피숨 (Pisum), 솔라눔 (Solanum), 비시아 (Vicia) 속의 쌍자엽 작물, 또는 알룸 (Allium), 아나나스 (Ananas), 아스파라거스 (Asparagus), 아베나 (Avena), 호르데움 (Hordeum), 오리자 (Oryza), 파니쿰 (Panicum), 사카룸 (Saccharum), 세케일 (Secale), 소르검 (Sorghum), 트리티케일 (Triticale), 트리티쿰 (Triticum), 제아 (Zea), 특히 제아 및 트리티쿰 속의 단자엽 작물이다.

[0137] 이것은 본 발명이 바람직하게는 상기 정의된 바와 같은 하나 또는 그 이상의 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드를 아라키스, 베타, 브라시카, 쿠쿠미스, 쿠쿠르비타, 헬리안투스, 다우쿠스, 글리신, 고시뽀, 이포모에아, 락투카, 리눔, 라이코페르시콘, 니코티아나, 파세올루스, 피숨, 솔라눔, 비시아 속의 쌍자엽 작물, 또는 알룸, 아나나스, 아스파라거스, 아베나, 호르데움, 오리자, 파니쿰, 사카룸, 세케일, 소르검, 트리티케일, 트리티쿰, 제아, 특히 제아 및 트리티쿰 속의 단자엽 작물에서 식물 (예를 들어, 단자엽 또는 쌍자엽 잡초 또는 원치 않는 농작물과 같은 유해 식물), 종자 (예를 들어, 곡물, 종자, 또는 괴경 또는 싹이 있는 발아 부분과 같은 식물 번식체), 또는 식물이 성장하는 영역 (예를 들어, 경작하고 있는 영역)에 적용하는 것을 포함하여, (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네크코코이데아에, 바람직하게는 시네크코코쿠스 중, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코쿠스, 바람직하게는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유함으로써 HPPD 억제 제조제에 대해 내성인 유전자이식 농작물의 영역에서 원치 않는 식물을 방제하는 방법에 관한 것인지의 이유이다.

[0138] 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염은 유용한 식물 및 관상 식물, 예를 들어, 밀, 보리, 호밀, 귀리, 수수/기장, 쌀, 카사바 및 옥수수과 같은 곡물류 또는 사탕무, 사탕수수, 목화, 대두, 평지, 감자, 토마토, 완두콩 및 그 밖의 다른 식물류의 경제적으로 중요한 유전자 이식 작물에서 사용하는 것이 바람직하며, 여기에서 상기 작물은 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네크코코이데아에, 바람직하게는 시네크코코쿠스 중, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코쿠스, 바람직하게는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No.

15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유한다.

[0139] 본 발명은 또한, HPPD 억제제인 제초제에 대한 내성을 식물에 부여하도록 할 수 있는 코드화 서열로서 또는 마커 유전자로서 HPPD를 코드화한 핵산의 식물을 형질전환시키는 방법에 있어서의 용도, 및 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코아테아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유하는 식물에 대한 용도에 관한 것이다.

[0140] 작물의 상업적 생산에 있어서는, 신뢰할 수 있는 농약 관리 하에 농작물의 필드 (field)로부터 원치 않는 식물 (즉, "잡초")를 제거하는 것이 바람직하다. 이상적인 처리는 전체 필드에 적용될 수 있지만, 농작물은 영향을 없게 놓아두면서 원치 않는 식물만을 제거할 수 있는 것일 수 있다. 이러한 처리 시스템의 한가지는 제초제를 제초제-내성 농작물의 필드에 스프레이하는 경우에, 비-제초제-내성 잡초는 사멸시키거나 심하게 손상시키면서 농작물은 계속해서 잘 자랄 수 있도록, 제초제에 대해 내성인 농작물의 사용을 포함할 수 있다. 이상적으로, 이러한 처리 시스템은 잡초 방제가 유연성 및 경제성의 최상의 가능한 조합을 제공할 수 있도록 다양한 제초제 특성을 이용할 수 있다. 예를 들어, 개별적인 제초제는 필드에서 상이한 수명을 가지며, 일부의 제초제는 이들이 필드에 적용된 후에 존속하며, 비교적 긴 시간 동안 효과적인 반면에 다른 제초제는 다른 것 및/또는 비-활성 화합물로 빠르게 분해된다. 이상적인 처리 시스템은 재배자가 제초제의 선택을 특별한 상황에 맞출 수 있도록 상이한 제초제의 사용을 허용할 수 있다.

[0141] 다수의 제초제-내성 농작물을 현재 상업적으로 이용할 수 있지만, 다수의 상업적 제초제 및 제초제/작물 조합에 대해 야기된 한 가지 문제는 개개의 제초제가 전형적으로 통상적인 잡초 종에 대해 불완전한 활성 스펙트럼을 갖는다는 점이다. 한동안 사용되어온 대부분의 개개 제초제의 경우에, 제초제 저항성 잡초 종 및 생물형 (biotypes)의 집단이 만연해졌다 [예를 들어, 참조: Tranel and Wright (2002) *Weed Science* 50: 700-712; Owen and Zelaya (2005) *Pest Manag. Sci.* 61: 301-311]. 하나 이상의 제초제에 대해서 저항성인 유전자이식 식물은 기술되어 있다 [예를 들어, 참조: W02005/012515]. 그러나, 작물 생산, 잡초 방제 옵션, 잔류 잡초 방제의 확대의 모든 관점에서의 개선 및 작물 수율에서의 개선이 지속적으로 요구된다.

[0142] 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 그들의 염의 클래스에 속하는 HPPD 억제 제초제에 대한 내성을 수행하기 위해 유전자이식 식물에서 기능성인 하나 또는 그 이상 HPPD 단백질(들) 또는 그의 돌연변이체를 코드화하는 상기 정의된 키메라 유전자(들)은 유리하게는 식물에서, 이러한 식물에 유용한 작물학적 특성을 부여하는 단백질 또는 RNAs를 코드화하는 다른 유전자와 조합된다. 형질전환된

식물에 유용한 작물학적 특성을 부여하는 단백질 또는 RNAs를 코드화한 유전자 중에서는, 그들의 화학구조에 따라 HPPD 억제 제조제와는 다른 하나 또는 그 이상의 제조제에 내성을 부여하는 단백질을 코드화한 DNA 서열, 및 특성의 곤충에 대한 내성을 부여하는 다른 것, 특성의 질병 및/또는 생물 및 비생물적 스트레스에 대한 내성을 부여하는 것, 선충 또는 곤충 방제를 제공하는 RNAs를 코드화한 DNAs 등이 언급될 수 있다.

- [0143] 이러한 유전자는 특히 공개된 PCT 특허출원 WO 91/02071 및 W095/06128에 기술되어 있다.
- [0144] 형질전환된 식물 세포 및 식물에 특성의 제조제에 대한 내성을 부여하는 단백질을 코드화한 DNA 서열 중에서는, bar 또는 PAT 유전자 또는 글루포시네이트 제조제에 대한 내성을 부여하는 W02009/152359에 기술된 스트렙토마이세스 코엘리칼라 (*Streptomyces coelicolor*) 유전자, 글리포세이트 및 그의 염과 같이 표적으로 EPSPS를 갖는 제조제에 대한 내성을 부여하는 적합한 EPSPS를 코드화한 유전자 [US 4,535,060, US 4,769,061, US 5,094,945, US 4,940,835, US 5,188,642, US 4,971,908, US 5,145,783, US 5,310,667, US 5,312,910, US 5,627,061, US 5,633,435], 또는 글리포세이트 옥시도리덕타제를 코드화한 유전자 [US 5,463,175]가 언급될 수 있다.
- [0145] 표적으로 EPSPS를 갖는 제조제에 대한 내성을 부여하는 적합한 EPSPS를 코드화한 DNA 서열 중에서는, 더욱 특히 식물 EPSPS, 특히 옥수수 EPSPS, 특히 두 개의 돌연변이, 특히 아미노산 위치 102에서의 돌연변이 및 아미노산 위치 106에서의 돌연변이 (WO 2004/074443)를 포함하며, 특허출원 US 6566587에 기술되어 있는 것으로서 이하에서 이중 돌연변이체 옥수수 EPSPS 또는 2mEPSPS로 불리는 옥수수 EPSPS를 코드화한 유전자, 또는 아그로박테리움 (*Agrobacterium*)으로부터 분리된 EPSPS를 코드화하며 미국 특허 제5,633,435호의 SEQ ID No. 2 및 SEQ ID No. 3로 기술되고 또한 CP4로 불리는 유전자가 언급될 수 있다.
- [0146] 표적으로 EPSPS를 갖는 제조제에 대한 내성을 부여하는 적합한 EPSPS를 코드화한 DNA 서열 중에서는, 더욱 특히 아트로박터 글로비포르미스 (*Arthrobacter globiformis*)로부터의 EPSPS GRG23뿐만 아니라 돌연변이체 GRG23 ACE1, GRG23 ACE2, 또는 GRG23 ACE3, 특히 W02008/100353에서의 SEQ ID No. 29의 GRG23(ace3)R173K와 같은 W02008/100353에 기술된 GRG23의 돌연변이체 또는 변이체를 코드화한 유전자가 언급될 수 있다.
- [0147] EPSPS를 코드화하며, 더욱 특히 상기 유전자를 코드화하는 DNA 서열의 경우에, 유리하게는 이들 효소를 코드화한 서열에 앞서 수송 펩타이드 (transit peptide), 특히 미국 특허 제5,510,471 또는 5,633,448호에 기술된 "최적화 수송 펩타이드"가 선행한다.
- [0148] WO 2007/024782에는 글리포세이트 및 적어도 하나의 ALS (아세트락테이트 신타제) 억제제에 대해 내성인 식물이 기술되어 있다. 더욱 구체적으로, GAT (글리포세이트-N-아세틸트랜스퍼라제) 폴리펩타이드 및 ALS 억제제에 대한 저항성을 부여하는 폴리펩타이드를 코드화한 유전자를 함유하는 식물이 기술되어 있다.
- [0149] US 6855533에는 돌연변이된 아라비도시스 (*Arabidopsis*) ALS/AHAS 유전자를 함유하는 유전자이식 담배 식물이 기술되었다.
- [0150] US 6,153,401에는 대사화 (metabolisation)에 의해 2,4-D (2,4-디클로로페녹시아세트산)에 대한 내성을 부여하는 2,4-D-모노옥시게나제를 코드화한 유전자를 함유하는 식물이 기술되어 있다.
- [0151] US 2008/0119361 및 US 2008/0120739에는 대사화에 의해 디캄바 (dicamba) (3,6-디클로로-2-메톡시벤조산)에 대한 내성을 부여하는 디캄바 모노옥시게나제를 코드화한 유전자를 함유하는 식물이 기술되어 있다.
- [0152] W02011/028833 및 W02011/028832에는 알록시딴, 부트록시딴, 클레토딴, 클로프로록시딴, 사이클록시딴, 세톡시딴, 테프랄록시딴, 트랄록시딴, 클로라지포프, 클로디나포프, 클로포프, 디클로포프, 페녹사프로프, 페녹사프로프-P, 펜티아프로프, 플루아지포프, 플루아지포프-P, 할록시포프, 할록시포프-P, 이속사피리포프, 프로파퀴자포프, 퀴잘로포프, 퀴잘로포프-P, 트리포프, 및 피녹사텐 또는 이들 제조제 중의 어떤 것의 작물학적으로 허용되는 염 또는 에스테르로 구성된 그룹으로부터 선택된 적어도 하나의 제조제에 대한 내성을 부여하는 돌연변이 또는 재조합체 아세틸-코엔자임-A 카보일라제 (ACCCase)를 코드화한 유전자를 함유하는 식물이 기술되어 있다.
- [0153] 상기 언급된 모든 제조제 내성 형질은 식물에서 (1) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네키코코이데아에, 바람직하게는 시네키코코쿠스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코쿠스, 바람직하게는 로도코쿠스 종

(스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메릭 유전자(들)를 함유함으로써 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염에 관한 HPPD 내성을 수행하는 것과 조합될 수 있다.

[0154] 곤충에 대한 내성의 특징에 관한 단백질을 코드화한 DNA 서열 중에서는, 더욱 특히 문헌에 광범하게 기술되고 본 기술분야에서 숙련된 전문가에게 잘 알려진 Bt 단백질이 언급될 수 있다. 또한, 포토랍두스 (*Photorhabdus*)와 같은 박테리아로부터 추출된 단백질이 언급될 수 있다 [WO 97/17432 & WO 98/08932].

[0155] 곤충에 대한 내성의 신규한 특성을 부여하는, 관심이 있는 단백질을 코드화한 이러한 DNA 서열 중에서는, 더욱 특히 문헌에 광범하게 기술되고 본 기술분야에서 숙련된 전문가에게 잘 알려진 Bt Cry 또는 VIP 단백질이 언급될 수 있다. 이들에는 Cry1F 단백질 또는 Cry1F 단백질로부터 유도된 하이브리드 (예를 들어, US 6,326,169; US 6,281,016; US 6,218,188에 기술된 하이브리드 Cry1A-Cry1F 단백질, 또는 그의 독성 단편), Cry1A-타입 단백질 또는 그의 독성 단편, 바람직하게는 Cry1Ac 단백질 또는 Cry1Ac 단백질로부터 유도된 하이브리드 (예를 들어, US 5,880,275에 기술된 하이브리드 Cry1Ab-Cry1Ac 단백질) 또는 EP451878에 기술된 바와 같은 Cry1Ab 또는 Bt2 단백질 또는 그의 살충성 단편, WO02/057664에 기술된 바와 같은 Cry2Ae, Cry2Af 또는 Cry2Ag 단백질 또는 그의 독성 단편, WO 2007/140256에 기술된 Cry1A.105 단백질 (SEQ ID No. 7) 또는 그의 독성 단편, NCBI 수탁번호 ABG20428의 VIP3Aa19 단백질, NCBI 수탁번호 ABG20429의 VIP3Aa20 단백질 (WO 2007/142840에서 SEQ ID No. 2), COT202 또는 COT203 코튼 이벤트 (cotton events)에서 생산된 VIP3A 단백질 (각각 WO 2005/054479 및 WO 2005/054480), WO01/47952에 기술된 바와 같은 Cry 단백질, 문헌 [Estruch et al. (1996), Proc Natl Acad Sci U S A. 28:93(11):5389-94 및 US 6,291,156]에 기술된 바와 같은 VIP3Aa 단백질 또는 그의 독성 단편, WO98/08932에 기술된 바와 같은 포토랍두스로부터의 Tc-단백질과 같은 제노랍투스 (*Xenorhabdus*) (WO98/50427에 기술된 바와 같음), 세라티아 (*Serratia*) (특히, 세라티아 엔토모필라 (*S. entomophila*)) 또는 포토랍투스 중 스트레인으로로부터의 살충성 단백질 [에난티오머 Waterfield et al., 2001, Appl Environ Microbiol. 67(11):5017-24; Ffrench-Constant and Bowen, 2000, Cell Mol Life Sci.; 57(5):828-33]이 포함된다. 또한, 상기 서열, 특히 그들의 독성 단편의 서열과 일부의 (1-10 개, 바람직하게는 1-5 개) 아미노산이 상이하거나, 플라스티드 (plastid) 수송 펩타이드와 같은 수송 펩타이드, 또는 또 다른 단백질 또는 펩타이드에 융합된 이들 단백질 중의 어느 하나의 모든 변이체 또는 돌연변이체가 여기에 포함된다.

[0156] 본 발명은 또한, (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이데아에, 바람직하게는 시네코코커스 중, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미디아에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 HPPD를 코드화하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 돌연변이된 핵산 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561,

PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체에 의해서 코드화된 HPPD를 나타내는 적어도 하나의 핵산 서열을 함유하는 코드화 서열과 함께, 5' 및/또는 3' 위치, 적어도 5' 위치에서 숙주 유기체, 특히 식물 세포 또는 식물에서 기능을 할 수 있는 이종 조절 요소뿐만 아니라 코드화 서열을 포함하는 키메릭 유전자 (또는 발현 카세트)를 포함하는 유전자이식 식물에서의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 용도에 관한 것이다.

[0157]

또 다른 특별한 구체예에서, 본 발명은 전술한 바와 같은 키메릭 유전자를 포함하는 유전자이식 식물에서의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 용도에 관한 것이며, 여기에서 키메릭 유전자는 5' 위치에 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네키크코이테아에, 바람직하게는 시네키크코쿠스 중, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코쿠스, 바람직하게는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도되거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 돌연변이된 핵산 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체에 의해서 코드화된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 핵산 서열, 수송 펩타이드/HPPD 융합 단백질의 발현을 허용하도록 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네키크코이테아에, 바람직하게는 시네키크코쿠스 중, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코쿠스, 바람직하게는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도되거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 돌연변이된 핵산 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체에 의해서 코드화된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 핵산 서열과 프로모터 부분 사이에 배열된, 식물 수송 펩타이드를 코드화한 핵산 서열을 함유한다.

[0158]

추가적 특별한 구체예에서, 본 발명은 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네키크코이테아에, 바람직하게는 시네키크코쿠스 중, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코쿠스, 바람직하게는 로도코쿠스 중 (스트레인

RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메릭 유전자(들)를 함유하는 식물, 식물 부분 또는 식물 종자 상에서의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 그들의 염의 용도, 또는 단독으로, 또는 HPPD 억제제에 대해 상이한 방식으로 작용하는 하나 또는 그 이상의 다른 공지된 제초제와 조합한 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 이러한 식물, 식물 부분 또는 종자가 성장하거나 파종되는 토양 상에서의 용도에 관한 것이다.

[0159] 추가의 특별한 구체예에서, 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염 제초제는 템보트리온, 술코트리온, 메소트리온, 비사이클로피론, 테푸릴트리온, 특히 템보트리온과 같은 트리케톤 (트리케톤 HPPD 억제제라 칭함), 디케토니트릴과 같은 디케톤 부류, 이속사플루톨과 같은 이속사졸 부류, 또는 피라살포톨, 피라졸레이트, 토포라메존, 벤조페납과 같은 피라졸리네이트 부류 (피라졸리네이트 HPPD 억제제라 칭함)으로 구성된 그룹으로부터 선택된 HPPD 억제 제초제와 함께 혼합물로, 동시에 또는 연속적으로 적용될 수 있으며, 더 더욱 구체적으로 본 발명은 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이데아에, 바람직하게는 시네코코커스 중, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메릭 유전자(들)를 함유하는 이러한 HPPD 억제제 내성 식물, 식물 부분 또는 식물 종자에 대한 템보트리온, 메소트리온, 디케토니트릴, 비사이클로피론, 테푸릴트리온, 벤조페납, 피라살포톨, 피라졸레이트 및 술코트리온의 적용에 관한 것이다.

[0160] 식물 세포 및 식물에서 작용하는 조절 서열로서는, 식물-리블로즈-비스카복실라제/옥시게나제 (RuBisCO) 소형 서브유닛 유전자 또는 사용될 수 있는 발현가능한 모든 적합한 공지된 프로모터와 같은 예를 들어, "광-의존적" 프로모터 또는 박테리아, 바이러스 또는 식물 기원의 "구성적 프로모터"와 같이 식물에서 자연적으로 발현되는 유전자의 모든 프로모터 서열, 특히 식물의 잎에서 특별하게 발현되는 프로모터를 사용할 수 있다. 식물 기원의 프로모터 중에서는 EP 0 507 698 A1에 기술된 바와 같은 히스톤 프로모터, 쌀 액틴 프로모터 (US 5,641,876), 또는 식물 유비퀴틴 프로모터 (US 5,510,474)가 언급될 수 있다. 식물 바이러스 유전자의 프로모터 중에서는 칼리플라워 모자이크 바이러스 (cauliflower mosaic virus) [CaMV 19S 또는 35S, Sanders et al. (1987), Nucleic Acids Res. 15(4):1543-58.], 시르코바이러스 (circovirus) (AU 689 311) 또는 카사바 베인 (Cassava vein) 모자이크 바이러스 (CsVMV, US 7,053,205)의 프로모터가 언급될 수 있다.

[0161] 추가의 특별한 구체예에서, 본 발명은 종자에 대해 특이적인 프로모터 [Datla, R. et al., 1997,

Biotechnology Ann. Rev. 3, 269-296], 특히 나뎨 프로모터 [EP 255 378 A1], 파세올린 프로모터, 글루테닌 프로모터, 헬리안티닌 프로모터 [WO 92/17580], 알부민 프로모터 [WO 98/45460], 올레오신 프로모터 [WO 98/45461], SAT1 프로모터 또는 SAT3 프로모터 [PCT/US98/06978]와 같은, (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코코스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코코스, 바람직하게는 로도코코스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코코스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 발현시키기 위해서 사용될 수 있는 식물의 특별한 부분 또는 조직에 대해서 특이적인 프로모터 서열을 포함하는 식물, 식물 부분 또는 식물 종자 상에서의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 용도에 관한 것이다.

[0162] 유리하게는 페닐알라닌 암모니아 리아제 (PAL), HMG-CoA 리덕타제 (HMG), 키티나제, 글루카나제, 프로테이나제 억제제 (PI), PR1 패밀리 유전자, 노팔린 신타제 (nos) 및 vspB 프로모터 (US 5 670 349, 표 3), HMG2 프로모터 (US 5 670 349), 애플 베타-갈락토시다제 (ABG1) 프로모터 및 애플 아미노사이클로프로판 카복실레이트 신타제 (ACC 신타제) 프로모터 (WO 98/45445)로부터 선택된 유도 가능한 프로모터의 사용이 또한 언급될 수 있다.

[0163] (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코코스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코코스, 바람직하게는 로도코코스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코코스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도되거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체에 의해서 표시된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 유전자는 또한, 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염에 대한 충분한 내성을 수행하기 위해서 프로모터와 코드화 서열 사이에 위치하는 다른 조절 서열의 프로모터, 예를 들어, 전사 활성화인자 ("인핸서 (enhancers)"), 예를 들어, 출원 WO 87/07644에 기술된 담배 모자이크 바이러스 (TMV) 또는 문헌 [Carrington & Freed 1990, J. Virol. 64: 1590-1597]에 기술된 담배 식각 바이러스 (TEV)의 전사 활성화인자, 예를 들어, 또는 옥수수의 adh1 인트론 또는 쌀 액틴의 인트론 1과 같은 인트론과 함께 사용될 수도 있다.

[0164] 추가의 특별한 구체예에서, 본 발명은 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴

카복사미드 또는 이들의 염에 대한 내성을 부여하기 위해서 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네키코코이테아에, 바람직하게는 시네키코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메릭 유전자(들)를 함유하며, 동일하거나 상이한 식물 발현 프로모터의 제어 하에 CYP450 옥수수 모노옥시게나제 (nsf1 유전자) 유전자를 또한 함유하는 식물, 식물 부분 또는 식물 종자 상에서의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 용도에 관한 것이다.

[0165] 조절 종결인자 (regulatory terminator) 또는 폴리아데닐화 서열로서는 예를 들어, 아그로박테리움 투메파시엔스 (*Agrobacterium tumefaciens*)의 nos 종결인자와 같은 박테리아 기원의, 예를 들어, CaMV 35S 종결인자와 같은 바이러스 기원의, 또는 예를 들어, 공개 특허출원 EP 0 633 317 A1에 기술된 바와 같은 히스톤 종결인자와 같은 식물 기원의 상응하는 서열 중의 어떤 것이더라도 사용될 수 있다.

[0166] 숙주 적합 코돈 사용에 의해 각각의 키메릭 유전자(들)의 최적화된 발현을 수득하기 위해서, 이러한 키메릭 유전자가 삽입될 각각의 식물 유기체의 코돈 사용에 대해 비-식물 유전자를 채택할 수 있는 것으로 이해된다. 따라서, 비-식물 기원의 HPPD를 발현하는 기술된 키메릭 유전자 모두에서, 각각의 HPPD 코드화 DNA 서열은 동일한 아미노산 서열을 코드화한 보정된 DNA 서열에 의해서 대체될 수 있으며, 즉 SEQ ID No. 3은 SEQ ID No. 5에 의해서 대체될 수 있고, SEQ ID No. 6은 SEQ ID No. 18에 의해서 대체될 수 있으며, SEQ ID No. 8은 SEQ ID No. 19에 의해서 대체될 수 있고, SEQ ID No. 10은 SEQ ID No. 20에 의해서 대체될 수 있으며, SEQ ID No. 12는 SEQ ID No. 21에 의해서 대체될 수 있고, SEQ ID No. 14는 SEQ ID No. 22에 의해서 대체될 수 있으며, SEQ ID No. 16은 SEQ ID No. 23에 의해서 대체될 수 있다.

[0167] 본 명세서에서 사용된 것으로서, 용어 "유전자"는 전형적으로 적어도 하나의 프로모터 부분을 포함하며, 단백질로 해독될 수 있는 RNA가 해독되도록 허용하는 5' 및/또는 3' 조절 서열이 측면에 있는 DNA 코드화 부분을 나타낸다. HPPD 코드화 DNA를 언급하는 경우에 "키메릭 유전자"는 그의 천연 숙주 세포에서 HPPD 단백질을 발현을 구동시키는 천연적으로 존재하는 박테리아 5' 및/또는 3' 조절 서열과는 상이한 5' 및/또는 3' 조절 서열 (또한, "이중 프로모터" 또는 "이중 조절 서열"로도 칭함)을 갖는 HPPD 코드화 DNA 서열을 나타낸다.

[0168] 본 명세서에서 사용된 것으로서, 용어 "서열 X를 포함하는 DNA/단백질" 및 "서열 X를 포함하는 서열을 갖는 DNA/단백질"은 다른 뉴클레오타이드 또는 아미노산 서열, 에난티오머 N-말단 변화 또는 시그널 펩타이드가 5' (또는 N-말단) 및/또는 3' (또는 C-말단)에서 포함될 수 있도록, 그들의 뉴클레오타이드 또는 아미노산 서열 내에 적어도 서열 X를 포함하거나 함유하는 DNA 또는 단백질을 나타낸다. 본 명세서에서 사용된 것으로서, 용어 "포함하는 (comprising)"은 구체적으로 열거된 것 이외의 다른 요소들이 또한 존재할 수 있음을 의미하는, "포함하는 (including)"의 의미로서의 개방형 (open-ended) 언어이다. 본 명세서에서 사용된 것으로서, 용어 "~로 구성되는"은 폐쇄형 (closed-ended) 언어이며, 즉 단지 구체적으로 열거된 요소들만이 존재한다. 본 명세서에서 사용된 것으로서, 용어 "서열 X를 포함하는 단백질을 코드화한 DNA"는 전사 및 해독 후에 적어도 아미노산 서열 X를 함유하는 단백질을 제공하는 코드화 서열을 포함하는 DNA를 나타낸다. 단백질을 코드화한 DNA는 천연적으로 존재하는 DNA일 필요는 없으며, 반-합성, 완전 합성 또는 인공 DNA일 수 있고, 인트론 및 5' 및/또는 3' 측면 부분 (flanking region)을 포함할 수 있다. 본 명세서에서 사용된 것으로서, 용어 "뉴클레오타이드 서

열"은 단일- 또는 이중-스트랜드 형태일 수 있는 DNA 또는 RNA 분자의 서열을 나타낸다.

[0169] 본 발명에 따르는 HPPD 단백질은 본 기술분야에서, 예를 들어, 공개된 PCT 특허출원 WO 96/10083에서 공지된 절차에 따라 단일 펩타이드를 가질 수 있거나, 이들은 단백질의 염록체로의 수송을 야기하는 염록체 수송 펩타이드 [예를 들어, Van Den Broeck et al., 1985, Nature 313, 358, 또는 미국 특허 5, 510,471의 변형된 염록체 수송 펩타이드)와 같은 또 다른 펩타이드에 의해서, 분비 시그널 펩타이드 또는 단백질을 다른 플라스티드, 미토콘드리아, ER 또는 또 다른 세포기관에 대해 표적화하는 펩타이드에 의해서 대체될 수 있거나, 또는 이것은 메티오닌 아미노산에 의해서 또는 메티오닌-알라닌 디펩타이드에 의해서 대체될 수 있다. 세포내 세포기관에 대한 표적화 또는 식물 세포 밖으로 또는 세포벽에 대한 분비를 위한 시그널 서열은 천연적으로 표적화되거나 분비된 단백질, 바람직하게는 문헌 [Klosgen et al., 1989, Mol. Gen. Genet. 217, 155-161; Klosgen and Weil, 1991, Mol. Gen. Genet. 225, 297-304; Neuhaus & Rogers, 1998, Plant Mol. Biol. 38, 127-144; Bih et al., 1999, J. Biol. Chem. 274, 22884-22894; Morris et al., 1999, Biochem. Biophys. Res. Commun. 255, 328-333; Hesse et al., 1989, EMBO J. 8 2453-2461; Tavladoraki et al., 1998, FEBS Lett. 426, 62-66; Terashima et al., 1999, Appl. Microbiol. Biotechnol. 52, 516-523; Park et al., 1997, J. Biol. Chem. 272, 6876-6881; Shcherban et al., 1995, Proc. Natl. Acad. Sci USA 92, 9245-9249; 이들은 모두 본 발명에 참고로 포함된다]에 기술된 것, 특히 옥수수, 목화, 대두 또는 쌀의 표적화되거나 분비된 단백질로부터의 시그널 펩타이드 서열에서 발견된다. 이러한 식물 시그널 펩타이드를 코드화한 DNA 서열은 식물에서의 발현을 위해 HPPD 단백질을 코드화한 키메라 유전자 내에 삽입될 수 있다.

[0170] 본 발명은 또한, SEQ ID No. 2, SEQ ID No. 4, SEQ ID No. 7, SEQ ID No. 9, SEQ ID No. 11, SEQ ID No. 13, SEQ ID No. 15, 및 SEQ ID No. 17의 HPPD 아미노산 서열과 유사한 아미노산 서열이며, 여기에서 전술한 것의 각각에 하나 또는 그 이상의 아미노산이 삽입, 결실 또는 치환된 변이체 HPPD 효소를 포함한다. 본 발명과 관련하여, 아미노산 서열의 변이체는 그에 대한 어떤 아미노산 치환, 부가 또는 결실에 불구하고, 본 발명에 기술된 아미노산 서열과 유사한 촉매적 활성을 갖는 이들 폴리펩타이드, 효소 또는 단백질을 나타낸다. 바람직하게는, 변이체 아미노산 서열은 SEQ ID No. 2, SEQ ID No. 4, SEQ ID No. 7, SEQ ID No. 9, SEQ ID No. 11, SEQ ID No. 13, SEQ ID No. 15, 및 SEQ ID No. 17의 아미노산 서열과 각각 적어도 약 80%, 또는 85 또는 90%, 95%, 97%, 98% 또는 99%의 서열 동일성을 갖는다. 또한 바람직하게는, 변이체 아미노산 서열을 포함하는 폴리펩타이드는 HPPD 효소 활성을 갖는다. HPPD 효소 활성을 측정하는 방법은 본 기술분야에서 잘 알려져 있으며, WO 2009/144079 또는 WO 2002/046387, 또는 PCT/EP2010/070561에 광범하게 기술된 것과 같은 측정방법을 포함한다.

[0171] 치환은 아미노산이 상이한 천연적으로 존재하거나 비-통상적인 아미노산 잔기로 대체되는 아미노산 변화를 포함한다. 이러한 치환은 "보존적"인 것으로 분류될 수 있으며, 여기에서는 본 발명의 HPPD 단백질에 함유된 아미노산 잔기가 유사한 특징의 또 다른 천연적으로 존재하는 아미노산으로, 예를 들어, Gly↔Ala, Val↔Ile↔Leu, Asp↔Glu, Lys↔Arg, Asn↔Gln 또는 Phe↔Trp↔Tyr로 대체된다. 본 발명에 포함되는 치환은 또한, "비-보존적"일 수도 있으며, 여기에서는 본 발명의 HPPD 단백질 내에 존재하는 아미노산 잔기가 상이한 그룹으로부터의 천연적으로 존재하는 아미노산과 같은 상이한 특성을 갖는 아미노산으로 치환된다 (예를 들어, 하전되거나 소수성인 아미노산을 알라닌으로 치환). 아미노산 치환은 전형적으로 단일 잔기의 치환이지만, 군집화되거나 분산된 다수의 잔기의 치환일 수도 있다. 아미노산 결실은 통상적으로 약 1-10 개의 아미노산 잔기 정도일 수 있는 반면에, 삽입은 어떤 길이라도 될 수 있다. 결실 및 삽입은 N-말단, C-말단에 대해서 만들어질 수 있거나 내부 결실 또는 삽입될 수 있다. 일반적으로, 아미노산 서열 내에서의 삽입은 아미노- 또는 카복시-말단 용합보다는 더 작을 수 있고, 1-4 개의 아미노산 잔기 정도일 수 있다. 본 명세서에서 사용된 것으로서, "유사한 아미노산"은 유사한 아미노산 측쇄를 갖는 아미노산, 즉 극성, 비-극성 또는 실질적으로 중성인 측쇄를 갖는 아미노산을 나타낸다. 본 명세서에서 사용된 것으로서, "비-유사 아미노산"은 상이한 아미노산 측쇄를 갖는 아미노산을 나타내며, 예를 들어, 극성 측쇄를 갖는 아미노산은 비-극성 측쇄를 갖는 아미노산과 비-유사한 것이다. 극성 측쇄는 통상적으로 단백질의 표면 상에 존재하는 경향이 있고, 여기에서 이들은 세포 내에 존재하는 수성 환경과 상호작용할 수 있다 ("친수성" 아미노산). 다른 한편으로, "비-극성" 아미노산은 단백질의 중심에 존재하는 경향이 있으며, 여기에서 이들은 유사한 비-극성 이웃과 상호작용할 수 있다 ("소수성" 아미노산). 극성 측쇄를 갖는 아미노산의 예는 아르기닌, 아스파라긴, 아스파르테이트, 시스테인, 글루타민, 글루탐레이트, 히스티딘, 리신, 세린 및 트레오닌이다 (소수성인 시스테인을 제외하고는 모두 친수성이다). 비-극성 측쇄를 갖는 아미노산의 예는 알라닌, 글리신, 이소류신, 류신, 메티오닌, 페닐알라닌, 프롤린 및 트립토판이다 (중성인 글리신을 제외하고는 모두 소수성이다).

- [0172] 실시예에서 다른 식으로 언급되지 않는 한, 재조합 DNA를 제조 및 조작하는 모든 절차는 문헌 [Sambrook et al., Molecular Cloning - A Laboratory Manual, Second Ed., Cold Spring Harbor Laboratory Press, NY (1989), 및 Volumes 1 and 2 of Ausubel et al. (1994) Current Protocols in Molecular Biology, Current Protocols, USA]에 기술된 표준 절차에 의해서 수행된다. 식물 분자생물학 작업을 위한 표준 재료 및 방법은 BIOS Scientific Publications Ltd (UK) 및 Blackwell Scientific Publications (UK)에 의해서 공동으로 발행된 문헌 [Plant Molecular Biology Labfax (1993) by R.R.D. Croy]에 기술되어 있다. PCR 기술을 위한 절차는 문헌 ["PCR protocols: a guide to methods and applications", Edited by M.A. Innis, D.H. Gelfand, J.J. Sninsky and T.J. White (Academic Press, Inc., 1990)]에서 확인될 수 있다.
- [0173] 용어 "내성", "내성인" 또는 "덜 민감한"은 상호 교환하여 사용되며, 다양한 HPPD 억제 제조제의 상이한 농도의 존재 하에서 각각의 HPPD 단백질에 대해 코드화한 유전자를 포함하는 핵산에 의해서 형질전환된 스트레인 또는 식물의 가시적 지표 표현형 (visible indicator phenotype)에 따라 스크리닝된 HPPD의 고유 내성의 상대적 레벨을 의미한다. 용량 반응 및 이들 지표 표현형 (갈색 색상의 형성, 성장 억제, 표백, 제조효과 등)과 연관된 용량 반응에서의 상대적 이동은 편리하게는, GR50 (성장의 50% 감소를 위한 농도) 또는 MIC (최소 억제 농도) 값의 관점에서 표현되며, 여기에서 이들 값의 증가는 제조제의 상이한 농도의 범위에서 식물 손상, 분열조직 표백 증상 등에 기초한 표준 방식으로, 발현된 HPPD의 고유 내성에 있어서의 증가에 상응한다. 이들 데이터는 예를 들어, x-축 상에 표시된 "용량" 및 y-축 상에 표시된 "사멸 백분율", "제조 효과", "발아한 녹색 식물의 수" 등을 갖는 용량/반응 곡선으로부터 유도된 GR50 값의 관점으로 표현될 수 있으며, 여기에서 증가된 GR50 값은 발현된 HPPD의 고유 내성의 증가된 레벨에 상응한다. 제조제는 적합하게는 발아-전 또는 발아-후에 적용될 수 있다.
- [0174] 마찬가지로, 내성 레벨은 담배, 또는 대두 또는 목화과 같은 농작물과 같은 시험 식물의 유전자이식 (transgenesis), 재생 (regeneration), 번식 (breeding) 및 스프레이 시험을 통해서 스크리닝되며, 이들 결과에 따라 이러한 식물은 HPPD 단백질을 코드화한 어떤 외인성 유전자도 함유하지 않는 식물보다, 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염과 같은 HPPD 억제 제조제에 대해서 적어도 2-4x 더 내성이다.
- [0175] "숙주 유기체" 또는 "숙주"는 HPPD를 생산할 목적으로 본 발명에 따르는 핵산 또는 키메릭 유전자가 도입될 수 있는 모든 단세포성 또는 다세포성 이종 유기체인 것으로 이해된다. 이들 유기체는 특히, 박테리아, 예를 들어, 이. 콜라이 (*E. coli*), 효모, 특히 사카로마이세스 (*Saccharomyces*) 또는 클루이베로마이세스 (*Kluyveromyces*), 피치아 (*Pichia*) 속의 효모, 진균, 특히 아스퍼질러스 (*Aspergillus*), 바콜로바이러스 (baculovirus) 또는, 바람직하게는 식물 세포 및 식물이다.
- [0176] "식물 세포"는 본 발명에 따라, 식물로부터 유도되거나 식물에서 발견되며, 캘러스 (calli)와 같은 비분화된 조직의 일부분, 배아와 같은 분화된 조직, 식물의 부분, 식물 또는 종자이거나 이들을 형성하는 모든 세포인 것으로 이해된다. 이것은 원형질체 (protoplasts) 및 화분, 배양된 식물 세포 또는 시험관내에서 성장한 원형질체, 및 완전한 식물로 재생시킬 수 있는 식물 세포를 포함한다.
- [0177] "식물"은 본 발명에 따라, 광합성을 할 수 있는 모든 분화된 다세포 유기체, 특히 단자엽 또는 쌍자엽 유기체, 더욱 특히는 옥수수 또는 콘, 밀, 브라시카 나푸스 (*Brassica napus*) 또는 브라시카 준세아 (*Brassica juncea*)와 같은 브라시카 종 (*Brassica spp.*) 식물, 대두 종, 쌀, 사탕수수, 비트 (beetroot), 담배, 목화, 오이, 리크 (leek), 당근, 토마토, 상추, 후추, 멜론, 수박 등과 같은 야채 식물과 같은 동물 또는 인간의 영양을 목적으로 하거나 하지 않는 배양된 식물인 것으로 이해된다. 본 명세서에서 사용된 것으로서 유전자이식 식물은 그들의 계통 내로 안정하게 삽입된 하나 또는 그 이상의 외래 또는 이종 유전자(들)를 포함하는 식물을 나타낸다.
- [0178] 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염에 대한 내성을 실행하기 위해서, 식물에서 천연적으로 발현된 유전자의 모든 프로모터 서열, 또는 아그로박테리움 (*Agrobacterium*) 또는 식물 바이러스 프로모터를 포함한, 식물에서 천연적으로 발현된 유전자의 프로모터 요소의 모든 하이브리드 또는 조합, 또는 식물에서 제조제 내성 유전자의 전사를 제어하는데 적합한 모든 프로모터가 본 발명의 식물에서 프로모터 서열로 사용될 수 있다 (본 발명에서는 "식물-발현 프로모터"로 칭함). 이러한 적합한 식물-발현 프로모터의 예는 상기에 기술하였다. 본 발명의 한가지 구체예에서, 이러한 식물-발현 프로모터는 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레

센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코커스 중, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열, 또는 (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이된 DNA에 작동적으로-연결된다.

[0179] 본 발명에 따르면, 또한 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염에 대한 내성을 실행시키기 위해서 인트론 서열 또는 전사 활성화인자 (인헨서)와 같은, 프로모터와 코드화 서열 사이에 위치하는 다른 조절 서열을 프로모터 조절 서열과 함께 사용할 수도 있다. 이러한 적합한 조절 서열의 예는 상기에 기술된다.

[0180] 아그로박테리움 투메파시엔스 (*Agrobacterium tumefaciens*)로부터의 nos 종결인자와 같은 박테리아 또는 바이러스 기원, 또는 출원 EP 0 633 317 A1에 기술된 것과 같은 히스톤 종결인자와 같은 식물 기원의 모든 상응하는 서열이 전사 종결 (및 폴리아데닐화) 조절 서열로 사용될 수 있다.

[0181] 추가의 특별한 구체예에서, 본 발명은 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코커스 중, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하며, 또한 수송 펩타이드-HPPD 융합 단백질의 발현을 허용하도록 프로모터 부분과 외인성 HPPD를 코드화한 서열 사이에 배열된 수송 펩타이드 서열을 함유하는 외인성 키메릭 유전자(들)를 코드화한 핵산 서열의 5' (상류)에서 사용된 수송 펩타이드를 코드화한 핵산 서열을 함유하는 식물, 식물 부분 또는 식물 종자 상에서의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 용도에 관한 것이다. 수송 펩타이드는 HPPD를 플라스티드, 더욱 특히는 엽록체 내로 유도할 수 있으며, 여기에서 융합 단백질은 후자가 플라스티드에 들어가면 수송 펩타이드와 HPPD 단백질 사이에서 분해된다. 수송 펩타이드는 경우에 따라 성숙 RuBisCO ssu (EP 189 707 A1)의 N-말단 부분의 몇 개의 아미노산을 포함하는 식물 리블로즈 비스포스페이트 카복실라제/옥시게나제 소형 서브유닛 (RuBisCO ssu)의 수송 펩타이드 또는 EPSPS 수송 펩타이드 (미국 특허 5,188,642에 기술됨)와 같은 단일 펩타이드일 수 있거나, 그렇지 않으면 플라스티드 위치를 갖는 성숙 단백질의 N-말단 서열의 일부분에 융합된 제1 식물 수송 펩타이드를 포함하며, 이 부분은 다시 특허 EP 508 909 A1에 기술된 바와 같은 제2 식물 수송 펩타이드에 융합된 수송 펩타이드, 및 더욱 특히는 옥수수 RuBisCO ssu의

N-말단성 말단의 22 아미노산에 융합되고, 다시 그의 코드화 서열에 의해 특허 EP 508 909 A1에 기술된 바와 같이 옥수수 RuBisCO ssu의 수송 펩타이드에 융합된 해바라기 RuBisCO ssu의 수송 펩타이드를 포함하는 최적화된 수송 펩타이드와 같은 몇 가지 수송 펩타이드의 융합물일 수 있다.

[0182] 본 발명은 또한, 수송 펩타이드 HPPD 융합 단백질 및 이러한 융합 단백질을 코드화한 핵산 또는 식물-발현 키메라 유전자에 관한 것이며, 여기에서 이 융합 단백질의 두 개의 요소는 상기 정의된 바와 같다.

[0183] 추가의 특별한 구체예에서, 본 발명은 클로닝, 발현 벡터에 의한 형질전환에 의해서 수득된 식물, 식물 부분 또는 식물 종자 상에서의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 용도에 관한 것이며, 여기에서 상기 발현 벡터는 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코쿠스 중, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코쿠스, 바람직하게는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 적어도 하나의 키메라 유전자를 함유한다. 상기 키메라 유전자 이외에도, 이 벡터는 복제의 기원을 함유할 수 있다. 이 벡터는 본 발명에 따른 키메라 유전자를 도입시킴으로써 형질전환된 플라스미드 또는 플라스미드 일부분, 코스미드, 또는 박테리오파지 또는 바이러스일 수 있다. 형질전환 벡터는 숙련된 전문가에게 잘 공지되어 있으며, 문헌에 광범하게 기술되어 있다. 특히 식물 세포 또는 식물을 형질전환시키는데 사용될 수 있는 형질전환 벡터는 식물 세포 또는 식물을 형질전환시키기 위해서 사용될 수 있고, 추가로 그 자신의 복제 및 발현 요소를 함유하는 바이러스일 수 있다. 식물 세포 또는 식물을 형질전환시키기 위한 벡터는 바람직하게는 무력화된 (disarmed) 아그로박테리움 Ti 플라스미드와 같은 플라스미드이다.

[0184] 추가의 특별한 구체예에서, 본 발명은 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코쿠스 중, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코쿠스, 바람직하게는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코쿠스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 서열을 포함하는 키메라 유전자를 함유하는 식물, 식물 부분 또는 식물 종자 상에서의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드의 용도, 및 식물을 성장시키고, 식물 생성물, 예를 들어, 대두 중, 쌀,

밀, 보리, 또는 콘 그레인 (corn grains) 또는 목화 꼬투리를 수확하는 분야에서의 상기 식물 또는 종자의 용도에 관한 것이며, 여기에서 한가지 구체예에서 상기 용도는 잡초를 방제하기 위해서 이러한 식물에 대해 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염을 적용하는 것을 포함한다.

[0185] 또 다른 특별한 구체예에서, 본 발명은 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴 카복사미드 또는 이들의 염에 대한 내성을 부여하기 위해서 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이데아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유하며, 또한 추가로 PDH (프리페네이트 데하이드로게나제) 효소를 코드화한 핵산 서열 (US 2005/0257283)에 작동적으로 연결된 상술한 바와 같은 식물-발현 프로모터를 포함하는 키메라 유전자를 더 함유하는 것을 특징으로 하는 식물, 식물 부분 또는 식물 종자 상에서의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 용도에 관한 것이다. 이러한 두 개의 이식유전자를 포함하는 식물은 본 기술분야에서 잘 알려진 바와 같이, 식물을 하나의 이식유전자로 형질전환시킨 다음에, 이 유전자이식 식물을 제2 이식유전자로 재-형질전환시키거나, 식물을 두 개의 이식유전자로 동시에 형질전환시키거나 (동일하거나, 2 개의 상이한 형질전환 DNAs 또는 벡터 내에서), 또는 제1 이식유전자를 포함하는 식물을 제2 이식유전자를 포함하는 식물과 교배시킴으로써 획득될 수 있다.

[0186] (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이데아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유함으로써 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염에 대해 내성인 식물, 식물 부분 또는 식물 종자를 획득하기 위한 한 가지 형질전환 방법은 세포, 원형질체 또는 조직에 DNA가 부착되거나 DNA를 함유하는 고체 또는 액체 입자로 충격을 가하는 것을

포함한다. 또 다른 형질전환 방법은 식물 내로 전이시키기 위한 수단으로서 아그로박테리움 투메파시엔스 (*Agrobacterium tumefaciens*) Ti 플라스미드 또는 아그로박테리움 라이조게네스 (*Agrobacterium rhizogenes*) Ri 플라스미드 내로 삽입된 키메릭 유전자를 사용하는 것을 포함한다. 현미주사 (microinjection) 또는 전기천공 (electroporation) 또는 그렇지 않으면 PEG를 사용한 직접 유전자 전이와 같은 그 밖의 다른 방법이 사용될 수 있다. 숙련된 전문가가 선택된 숙주 유기체, 특히 식물 세포 또는 식물을 형질전환시키는 어떤 적절한 방법을 선택할 수 있다. 예로써, 대두 형질전환을 위한 기술은 본 명세서에 참고로 포함된 EP 1186666 A1에 기술된 실시예 1 내지 3에 광범하게 기술되어 있다. 쌀의 경우에는, 아그로박테리움-매개 형질전환 [Hiei et al., 1994 Plant J 6:271-282, 및 Hiei et al., 1997 Plant Mol Biol. 35:205-21; 본 명세서에 참고로 포함됨], 전기천공 [본 명세서에 참고로 포함됨 US 5,641,664 및 US 5,679,558], 또는 충격 (bombardment) [Christou et al., 1991, Biotechnology 9:957; 본 명세서에 참고로 포함됨]이 실행될 수 있었다. 단자엽 식물, 특히 쌀의 형질전환을 위한 적합한 기술은 본 명세서에 참고로 포함됨 WO 92/09696에 기술되었다. 목화의 경우에는, 아그로박테리움-매개된 형질전환 [Gould J.H. and Magallanes-Cedeno M., 1998 Plant Molecular Biology reporter, 16:1-10 및 Zapata C., 1999, Theoretical Applied Genetics, 98(2):1432-2242; 본 명세서에 참고로 포함됨], 폴리브렌 및/또는 처리-매개된 형질전환 [Sawahel W.A., 2001, - Plant Molecular Biology reporter, 19:377a-377f; 본 명세서에 참고로 포함됨]이 기술되었다.

[0187]

대신으로, 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염은 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메릭 유전자(들)를 함유하는 식물, 식물 부분 또는 식물 종자에 대해 사용될 수 있으며, 여기에서 이 HPPD는 엽록체 게놈과 같은 플라스티드의 형질전환을 사용하여 엽록체와 같은 플라스티드 내에서 직접 발현된다. 적합한 방법은 DNA로 코딩된 고체 입자 또는 DNA를 포함하는 액체 입자에 의한 식물 세포 또는 조직의 충격, 및 상동 재조합에 의한 도입된 유전자의 통합 (integration)을 포함한다. 적합한 벡터 및 선택 시스템은 본 기술분야에서 숙련된 전문가에게 공지되어 있다. 담배 식물의 엽록체 게놈 내로의 이러한 통합을 위해서 사용될 수 있는 수단 및 방법의 예는 그의 내용이 이에 의해서 참고로 포함됨 WO 06/108830에 제시되어 있다.

[0188]

본 발명은 또한, 식물을 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No.

14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)로 형질전환시키는 것을 특징으로 하여, 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염에 대해 내성인 식물을 수득하는 방법에 관한 것이다.

[0189]

따라서, 본 발명은 또한 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유시킴으로써 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염에 대해 내성인 식물을 수득하는 방법에 관한 것이며, 여기에서 상기 식물은 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하며, 5'에서, 및 임의로 3' 위치에서 이중 조절 요소뿐만 아니라 숙주 유기체에서 기능을 할 수 있는 코드화 서열을 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유하는 것을 특징으로 하며, 여기에서 코드화 서열은 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염에 대한 충분히 높은 레벨의 내성을 실행하도록 전술한 바와 같은 본 발명의 HPPD를 코드화한 유전자를 규정하는 적어도 하나의 핵산 서열을 포함하는 것을 특징으로 한다.

[0190] 본 발명의 한가지 구체예에서, 상기 방법에서의 HPPD 억제제는 단독이거나 트리케톤 또는 피라졸리네이트 제초제, 바람직하게는 템보트리온, 메소트리온, 비사이클로피론, 테푸틸트리온, 피라설포톨, 피라졸레이트, 디케토니트릴, 벤조페남, 또는 술코트리온, 특히 템보트리온으로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 또는 그 이상의 HPPD 억제 제초제와 조합한 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염이다.

[0191] 본 발명은 또한, 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염을 작물을 파종하기 전 (이하에서는 식재-전 (pre-planting) 적용이라 칭함), 작물의 발아 전 (이하에서는 발아-전 적용이라 칭함), 또는 작물의 발아 후 (이하에서는 발아-후 적용이라 칭함)에, (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이데아에, 바람직하게는 시네코코쿠스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코쿠스, 바람직하게는 로도코쿠스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코쿠스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)에 따라 형질전환된 식물에 적용하는 것을 특징으로 하여, 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염을 필드 또는 농작물에 적용함으로써 식물이 식재되거나 종자가 파종될 필드에서, 또는 농작물에서 잡초를 선택적으로 제거하거나 잡초의 발아를 방지하는 방법에 관한 것이다.

[0192] 본 발명은 또한, 본 발명에서 전술한 바와 같이 형질전환된 종자를 함유하는 영역 또는 필드에 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이데아에, 바람직하게는 시네코코쿠스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코쿠스, 바람직하게는 로도코쿠스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코쿠스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유하는 종자 또는 식물에는 상당한 영향을 미치지 않으면서 잡초에 대해서는 독성인 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 용량을 적용하는 것을 포함하여, 본 발명에서 전술한 바와 같은 형질전환된 종자를 함유하는 영역 또는 필드에서 잡초를 방제하는 방법에 관한 것이다.

[0193] 본 발명은 또한, (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)에 의해서 형질전환된 식물을 재배하는 방법에 관한 것이며, 이 방법은 상기 식물을 재배하는 데 적합한 필드의 영역에 전술한 키메라 유전자를 포함하는 종자를 식재하고, 잡초가 존재한다면 상기 형질전환된 종자 또는 상기 형질전환 식물에는 상당한 영향을 미치지 않으면서 잡초에 대해서는 독성인 용량의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염을 상기 필드의 영역에 적용한 다음에, 재배된 식물 또는 식물 부분이 원하는 성숙 단계에 도달하면 이들을 수확하고, 적절한 경우에, 수확된 식물로부터 종자를 분리시키는 것을 포함한다.

[0194] 상기 방법에서, 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염은 본 발명에 따라 작물을 파종하기 전, 작물이 발아하기 전, 또는 작물이 발아한 후에 적용될 수 있다.

[0195] 본 발명의 의미 내에서, "제초제"는 그 자체가 제초적으로 활성인 물질, 또는 예를 들어, 그의 활성을 증가시키거나 (상승적 작용제) 또는 그의 활성을 제한하는 (완화제 (safener)) 작용제와 같이 그의 효능을 변화시키는 첨가제와 조합된 그런 물질인 것으로 이해된다. 물론, 실제 그들의 적용을 위해서 상기 제초제는 그 자체가 공지된 방식으로, 농업 화학에서 통상적으로 사용되는 제제화 보조제와 조합되는 것으로 이해된다.

[0196] 따라서, (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)이외에도, 상동 (= 천연) 유전자 또는 유전자 서열의 과발현, 억제 또는 저지 또는 이중 (= 외래) 유전자 또는 유전자 서열의 발현의 결과로서 변형된 특성을 갖는 유전자이식 식물이 수득될 수 있다.

[0197] (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한

SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이데아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유하는 식물, 식물 부분 또는 식물 종자 상에서는, 하나 또는 그 이상의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염을, 예를 들어, 2,4-D 또는 디캄바와 같은 성장 조절제에 대해서, 또는 필수 식물 효소를 억제하는 제초제, 예를 들어, 아세트라테이트 신타제 (ALS), EPSP 신타제, 글루타민 신타제 (GS), 아세틸-조효소 A 카복실라제 (ACCCase)에 대해서, 또는 설폰일우레아, 이미다졸리논, 글리포세이트, 글루포시네이트, ACCCase 억제제 및 유사한 활성 물질의 그룹으로부터의 제초제에 대해서 또한 저항성인 유전자이식 작물에서 템보트리온, 숄코트리온 및 메소트리온과 같은 트리케톤의 부류, 또는 피라설포톨 및 토프라메존과 같은 피라졸리네이트의 부류에 속하며, 특히 템보트리온, 숄코트리온, 토프라메존, 비사이클로피론, 테푸릴트리온 및 메소트리온으로부터 선택된 하나 또는 그 이상의 추가의 HPPD 억제제 제초제, 더욱 특히는 템보트리온과 함께 사용하는 것이 바람직하다.

[0198] 따라서, 본 발명은 또한, 하나 또는 그 이상의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염에 대한 저항성과 함께 두 번째 또는 그 이상의 제초제 저항성(들)을 포함하는 유전자이식 농작물에 대해서도 영향을 미치는, 유해한 식물 (즉, 잡초)을 방제하기 위해서 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이데아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유하는 HPPD 내성 식물에 대해서 적용된 제초제의 용도에 관한 것이다.

[0199] 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염은 우세한 생물학적 및/또는 물리-화학적 파라미터에 따라 다양한 방식으로 제제화될 수 있다. 가능한 제제의 예는 다음과 같다: 수화제 (wetttable powders; WP), 수용성 분말 (SP), 수용성 농축물, 유화성 농축물 (EC), 수중유 및 유중수 에멀션과 같은 에멀션 (EW), 스프레이 가능한 용액, 현탁 농축물 (SC), 유성 또는 수성 분산액, 오일-혼화

성 용액, 캡셀 현탁제 (CS), 더스트 (dusts; DP), 종자-드레싱 생성물 (seed-dressing products), 살포함으로써 토양 상에 적용하기 위한 과립제, 미세과립의 형태인 과립제 (GR), 스프레이 과립제, 코팅 과립제 및 흡착 과립제, 수-분산성 과립제 (WG), 수용성 과립제 (SG), ULV 제제, 마이크로캡셀제 및 왁스.

- [0200] 이들 각각의 제제 타입은 원칙적으로 공지되어 있으며, 예를 들어, 문헌 [Winnacker-Kuchler, "Chemische Technologie" [Chemical technology], volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Ed. 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London]에 기술되어 있다.
- [0201] 불활성 물질, 계면활성제, 용매 및 추가의 첨가제와 같은 필요한 제제화 보조제는 또한 공지되어 있으며, 예를 들어, 문헌 [Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schonfeldt, "Grenzflächenaktive Athylenoxidaddukte" [Interface-active ethylene oxide adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Kuchler, "Chemische Technologie" [Chemical technology], volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Ed. 1986]에 기술되어 있다.
- [0202] 이들 제제를 기초로 하여, 또한 예를 들어, 살충제, 살비제, 제초제, 살진균제와 같은 살충 활성 물질, 및 완화제, 비료 및/또는 성장 조절제와의 조합물을 예를 들어, 레디 믹스 (ready mix) 또는 탱크 믹스 (tank mix)의 형태로 제조할 수도 있다.
- [0203] 수화제는 물에 균일하게 분산될 수 있고, 활성 물질 이외에 또한 희석제 또는 불활성 물질과 함께 이온성 및/또는 비이온성 계면활성제 (습윤제 (wetters), 분산제), 예를 들어, 폴리옥시에틸화 알킬페놀, 폴리옥시에틸화 지방 알콜, 폴리옥시에틸화 지방 아민, 지방 알콜 폴리글리콜 에테르 설페이트, 알칸실포네이트, 알킬벤젠설포네이트, 나트륨 리그노설포네이트, 나트륨 2,2'-디나프틸메탄-6,6'-디설포네이트, 나트륨 디부틸나프탈렌설포네이트, 또는 그렇지 않으면 나트륨 올레오일메틸타우리네이트를 포함하는 제제이다. 수화제를 제조하기 위해서, 제초 활성 물질은 예를 들어, 햄머 밀 (hammer mills), 블로워 밀 (blower mills), 에어-제트 밀 (air-jet mills)과 같은 통상적인 기구 내에서 미세하게 분쇄하고, 제제화 보조제와 동시에 또는 순차적으로 혼합시킨다.
- [0204] 유화성 농축물은 활성 물질을 유기 용매, 예를 들어, 부탄올, 사이클로헥사논, 디메틸포름아미드, 크실렌, 또는 그렇지 않으면 고비점 방향족 또는 탄화수소, 또는 하나 또는 그 이상 이온성 및/또는 비이온성 계면활성제 (유화제)를 첨가한 유기 용매의 혼합물에 용해시킴으로써 제조된다. 사용될 수 있는 유화제의 예는 다음과 같다: 갈습 도데실벤젠설포네이트와 같은 갈습 알킬아릴설포네이트, 또는 비이온성 유화제, 예를 들어, 지방산 폴리글리콜 에스테르, 알킬아릴폴리글리콜 에테르, 지방 알콜 폴리글리콜 에테르, 프로필렌 옥사이드/에틸렌 옥사이드 축합물, 알킬 폴리에테르, 예를 들어, 소르비탄 지방산 에스테르와 같은 소르비탄 에스테르, 또는 예를 들어, 폴리옥시에틸렌 소르비탄 지방산 에스테르와 같은 폴리옥시에틸렌 소르비탄 에스테르.
- [0205] 더스트는 활성 물질을 예를 들어, 탈크, 카올린, 벤토나이트 및 프로필라이트와 같은 천연 점토, 또는 구조도와 같은 미분된 고체 물질과 함께 분쇄함으로써 수득된다.
- [0206] 현탁 농축물은 수성 또는 유성일 수 있다. 이들은 예를 들어, 적절한 경우에는 예를 들어, 다른 제제 타입의 경우에서 상기에 이미 열거한 바와 같은 계면활성제를 첨가하여, 상업적으로 이용할 수 있는 비드 밀 (bead mills)을 사용하여 습식-분쇄함으로써 제조될 수 있다.
- [0207] 에멀션, 예를 들어, 수중유 에멀션 (EW)은 예를 들어, 교반기, 콜로이드 밀 및/또는 정지상 믹서 (static mixers)를 이용하여, 수성 유기 용매, 및 적절한 경우에 다른 제제 타입에 대해 예를 들어, 상기에 이미 언급된 것과 같은 계면활성제를 사용하여 제조될 수 있다.
- [0208] 과립제는 활성 물질을 흡착성 과립화 불활성 물질 상에 스프레이하거나, 또는 활성 물질 농축물을 스티커 (sticker), 예를 들어, 폴리비닐 알콜, 나트륨 폴리아크릴레이트, 또는 그렇지 않으면 광유의 도움을 받아 모래, 카올리나이트 또는 과립화 불활성 물질과 같은 담체의 표면에 적용함으로써 제조될 수 있다. 적합한 활성 물질은 또한, 필요한 경우에 비료와의 혼합물로서, 비료 과립제의 생산에 통상적인 방식으로 과립화될 수도 있다.
- [0209] 수분산성 과립제는 일반적으로, 고체 불활성 물질이 없이 스프레이 건조, 유동화-상 과립화, 디스크 과립화, 고

속 교반기에 의한 혼합, 및 압출과 같은 통상적인 방법에 의해서 제조될 수 있다.

- [0210] 디스크 과립제, 유동화-상 과립제, 압출기 과립제 및 스프레이 과립제를 제조하기 위해서는 예를 들어, 문헌 ["Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, pages 147 et seq.; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, p. 8-57]에서의 방법을 참조한다.
- [0211] 작물 보호제품의 제제화에 대한 더 상세한 내용에 대해서는 예를 들어, 문헌 [G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pages 81-96 및 J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101-103]을 참고로 한다.
- [0212] 원칙적으로, 농약 제제는 0.1 내지 99 중량%, 특히 0.1 내지 95 중량%의 본 발명에 따르는 화합물을 포함한다.
- [0213] 수화제에, 활성 물질 농도는 예를 들어, 약 10 내지 90 중량%이고, 100 중량%까지의 나머지는 통상적인 제제화 구성성분으로 구성된다. 유화성 농축물의 경우에, 활성 물질 농도는 약 1 내지 90 중량%, 바람직하게는 5 내지 80 중량%에 달 할 수 있다. 더스트의 형태인 제제는 1 내지 30 중량%의 활성 물질, 바람직하게는 대부분의 경우에 5 내지 20 중량%의 활성 물질을 포함하고, 스프레이 가능한 용액은 약 0.05 내지 80, 바람직하게는 2 내지 50 중량%의 활성 물질을 포함한다. 수-분산성 과립제의 경우에, 활성 물질 함량은 부분적으로, 활성 화합물이 액체 형태인지 또는 고체 형태인지에 따라서, 및 사용되는 과립화 보조제, 충전제 등에 따라 좌우된다. 수-분산성 과립제의 경우에, 예를 들어, 활성 물질 함량은 1 내지 95 중량%, 바람직하게는 10 내지 80 중량%이다.
- [0214] 또한, 언급된 활성 물질 제제는 적절한 경우에, 스티커, 습윤제, 분산제, 유화제, 침투제, 보존제, 부동제, 용매, 충전제, 담체, 착색제, 소포제, 증발 억제제, 및 pH 및 점도 조절제와 같은 각각의 경우에 통상적인 보조제를 포함한다.
- [0215] 이들 제제를 기초로 하여, 템보트리온, 술코트리온 및 메소트리온과 같은 트리케톤의 부류, 또는 피라살포톨 및 토프라메존과 같은 피라졸리네이트의 부류의, 특히 템보트리온, 술코트리온, 토프라메존, 비사이클로피론, 테푸릴트리온 및 메소트리온으로부터 선택된 HPPD 억제 제초제, 더욱 특히는 템보트리온과 예를 들어, 살충제, 살비제, 제초제, 살진균제와 같은 그 밖의 다른 살충적 활성 물질과의, 및 완화제, 비료 및/또는 성장 조절제와의 조합물을 예를 들어, 본 발명에 따라 HPPD 내성 식물에 적용될 레디 믹스 또는 탱크 믹스의 형태로 제조할 수도 있다.
- [0216] **제제화 예**
- [0217] a) 더스트는 10 중량부의 화학식 I의 화합물 및/또는 그의 염 및 불활성 물질로서 90 중량부의 탈크를 혼합시키고, 혼합물을 햄머 밀로 세분함으로써 취득된다.
- [0218] b) 물에 쉽게 분산될 수 있는 수화제는 25 중량부의 화학식 I의 화합물 및/또는 그의 염, 불활성 물질로서 64 중량부의 카올린-함유 석영, 습윤제로서 10 중량부의 칼륨 리그노설포네이트 및 1 중량부의 나트륨 올레오일메틸타우리네이트, 및 분산제를 혼합시키고, 혼합물을 핀-디스크 밀 (pinned-disk mill)에서 분쇄함으로써 취득된다.
- [0219] c) 쉽게 수-분산성인 분산 농축물은 20 중량부의 화학식 I의 화합물 및/또는 그의 염을 6 중량부의 알킬페놀 글리콜 에테르 (®Triton X 207), 3 중량부의 이소트리데칸올 폴리글리콜 에테르 (8 E0) 및 71 중량부의 파라핀 광유 (비점 범위, 예를 들어, 약 255 내지 277°C 이상)와 혼합시키고, 혼합물을 볼 밀 (ball mill)에서 5 미크론 이하의 분말도 (fineness)로 분쇄함으로써 취득된다.
- [0220] d) 유화성 농축물은 15 중량부의 화학식 I의 화합물 및/또는 그의 염, 용매로서 75 중량부의 사이클로헥사논, 및 유화제로서 10 중량부의 옥시에틸화 노닐페놀로부터 취득된다.
- [0221] e) 수-분산성 과립제는 75 중량부의 화학식 I의 화합물 및/또는 그의 염, 10 중량부의 칼슘 리그노설포네이트, 5 중량부의 나트륨 라우릴 설페이트, 3 중량부의 폴리비닐 알콜, 및 7 중량부의 카올린을 혼합시키고, 혼합물을 핀-디스크 밀에서 분쇄하고, 분말을 과립화 액체로서 물 상에 스프레이함으로써 유동화 상에서 과립화시킴으로써 취득된다.
- [0222] f) 수-분산성 과립제는 또한, 콜로이드 밀에서 25 중량부의 화학식 I의 화합물 및/또는 그의 염, 5 중량부의 나트륨 2,2'-디나프틸메탄-6,6'-디설포네이트, 2 중량부의 나트륨 올레오일메틸타우리네이트, 1 중량부의 폴리비

닐 알콜, 17 중량부의 칼슘 카보네이트 및 50 중량부의 물을 균질화 및 전세분하고, 이어서 혼합물을 비드 밀에서 분쇄하고, 생성된 현탁액을 단일-물질 노즐을 사용하여 스프레이 타워 (spray tower)에서 분무 및 건조시킴으로써 수득된다.

[0223]

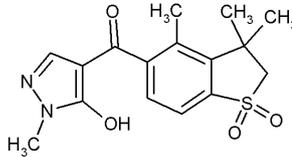
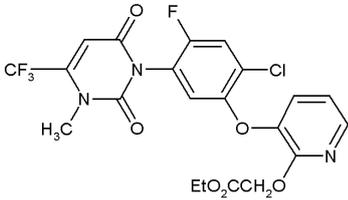
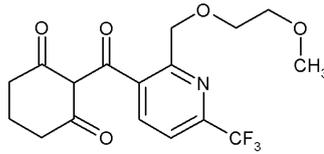
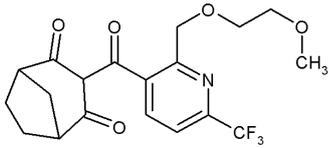
본 발명의 추가의 관점은 혼합 제제에서, 또는 탱크 믹스에서 템보트리온, 술코트리온 및 메소트리온과 같은 트리케톤의 부류, 또는 피라살포톨 및 토프라메존과 같은 피라졸리네이트의 부류에 속하며, 특히 템보트리온, 술코트리온, 토프라메존, 비사이클로피론, 테푸틸트리온 및 메소트리온으로부터 선택된 추가의 HPPD 억제 제초제, 더욱 특히는 템보트리온과, 및/또는 예를 들어, 문헌 [Weed Research 26 (1986) 441-445 or "The Pesticide Manual", 14th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2003, 및 여기에 인용된 문헌]에 기술된 바와 같은, 예를 들어, 아세토라테이트 신타제, 아세틸-CoA 카복실라제, 셀룰로즈 신타제, 에놀피루빌시킴에이트-3-포스페이트 신타제, 글루타민 신타제, p-하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제, 파이토엔 데세투라제 (desaturase), 포토시스템 I, 포토시스템 II, 프로토포르피리노겐 옥시다제의 억제에 기초한 추가의 공지된 활성 물질과 조합한 하나 또는 그 이상의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이테아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메릭 유전자(들)를 함유하는 HPPD 내성 식물에 대한 용도이다. 본 발명에 따르는 화합물과 조합될 수 있는 공지의 제초제 또는 식물 성장 조절제는 예를 들어, 다음의 활성 물질이며 (화합물은 International Organization for Standardization (ISO)에 따르는 통칭 (common name)으로, 또는 적절한 경우에 코드 번호와 함께 화학명으로 지정된다), 항상 산, 염, 에스테르, 및 입체이성체 및 광학 이성체와 같은 이성체와 같은 모든 사용 형태를 포함한다. 이와 관련하여, 하나 및 일부의 경우에서의 몇 가지 사용 형태를 또한 예를 들어 언급한다:

[0224]

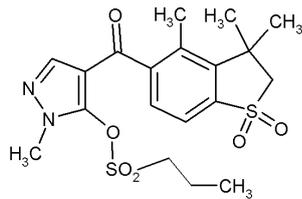
아세토클로르, 아시벤조라르, 아시벤조라르-S-메틸, 아시플루오르펜, 아시플루오르펜-나트륨, 아클로니펜, 알라클로르, 알리도클로르, 알록시딤, 알록시딤-나트륨, 아메트린, 아미카바존, 아미도클로르, 아미도설푸론, 아미노사이클로피라클로르, 아미노피랄리드, 아미트롤, 암모늄 설파메이트, 안시미돌, 아닐로포스, 아술람, 아트라진, 아자페니딘, 아짐설푸론, 아지프로트린, BAH-043, BAS-140H, BAS-693H, BAS-714H, BAS-762H, BAS-776H, BAS-800H, 베플루부타미드, 베나졸린, 베나졸린-에틸, 벤카바존, 벤플루랄린, 벤푸레세이트, 벤솔리드, 벤설푸론-메틸, 벤타존, 벤즈펜디존, 벤조비사이클론, 벤조페남, 벤조플루오르, 벤조일프롭, 비페녹스, 빌라나포스, 빌라나포스-나트륨, 비스피리박, 비스피리박-나트륨, 브로마실, 브로모부티드, 브로모페녹심, 브로목시닐, 브로뮤론, 부미나포스, 부속시논, 부타클로르, 부타펜아실, 부타미포스, 부테나클로르, 부트랄린, 부트록시딤, 부틸레이트, 카펜스트롤, 카베타미드, 카펜트라존, 카펜트라존-에틸, 클로메톡시펜, 클로람벤, 클로라지폼, 클로라지폼-부틸, 클로르브로뮤론, 클로르부팜, 클로르페낙, 클로르페낙-나트륨, 클로르펜프롭, 클로르플루레놀, 클로르플루레놀-메틸, 클로리다존, 클로리뮤론, 클로리뮤론-에틸, 클로르메파트-클로라이드, 클로르니트로펜, 클로로프탈림, 클로르탈-디메틸, 클로로톨루론, 클로르설푸론, 시니돈, 시니돈-에틸, 신메틸린, 시노설푸론, 클레토딤, 클로디나폼, 클로디나폼-프로파길, 클로펜세트, 클로마존, 클로메프롭, 클로프롭, 클로피랄리드, 클로란술람, 클로란술람-메틸, 쿠밀루론, 사이아나미드, 사이아나진, 사이클라닐리드, 사이클로에이트, 사이클로설파무론, 사이클록시딤, 사이클루론, 사이할로폼, 사이할로폼-부틸, 사이피콕트, 사이프라진, 사이프라졸, 2,4-D,

2,4-DB, 다이퓨론/다임론, 달라폰, 다미노지드, 다조메트, n-데카놀, 데스메디팜, 데스메트린, 데토실-피라졸레이트 (DTP), 디-알레이트, 디감바, 디클로베닐, 디클로로프롭, 디클로로프롭-P, 디클로프롭, 디클로프롭-메틸, 디클로로프롭-P-메틸, 디클로솔람, 디에타틸, 디에타틸-에틸, 디페녹수론, 디펜조콕트, 디플루페니칸, 디플루벤조피르, 디플루벤조피르-나트륨, 디메푸론, 디케굴락-나트륨, 디메푸론, 디메피페레이트, 디메타클로르, 디메타메트린, 디메테나미드, 디메테나미드-P, 디메티핀, 디메트라셀푸론, 디니트라민, 디노셉, 디노텃, 디펜아미드, 디프로페트린, 디콕트, 디콕트-디브로마이드, 디티오피르, 디우론, DNOC, 에글리나진-에틸, 엔도탈, EPTC, 에스프로캅, 에탈플루랄린, 에타메트셀푸론-메틸, 에테폰, 에티디무론, 에티오진, 에토푸메세이트, 에톡시펜, 에톡시펜-에틸, 에톡시셀푸론, 에토벤자니드, F-5331, 즉 N-[2-클로로-4-플루오로-5-[4-(3-플루오로-프로필)-4,5-디하이드로-5-옥소-1H-테트라졸-1-일]-페닐]에탄설펜아미드, 페노프롭, 페녹사프롭, 페녹사프롭-P, 페녹사프롭-에틸, 페녹사프롭-P-에틸, 펜트라자미드, 페누론, 플람프롭, 플람프롭-M-이소프로필, 플람프롭-M-메틸, 플라자셀푸론, 플로라솔람, 플루아지폼, 플루아지폼-P, 플루아지폼-부틸, 플루아지폼-P-부틸, 플루아졸레이트, 플루카바존, 플루카바존-나트륨, 플루세토셀푸론, 플루클로랄린, 플루페나세트 (티아플루아미드), 플루펜피르, 플루펜피르-에틸, 플루메트랄린, 플루메트솔람, 플루미클로락, 플루미클로락-펜틸, 플루미옥사진, 플루미프로핀, 플루오메투론, 플루오로디펜, 플루오로글리코펜, 플루오로글리코펜-에틸, 플루폭삼, 플루프로파실, 플루프로파네이트, 플루피르셀푸론, 플루피르셀푸론-메틸-나트륨, 플루레놀, 플루레놀-부틸, 플루리돈, 플루로클로리돈, 플루록시피르, 플루록시피르-메틸, 플루르피리미들, 플루르타몬, 플루티아세트, 플루티아세트-메틸, 플루티아미드, 포메사펜, 포람셀푸론, 포클로르페누론, 포사민, 푸틸옥시펜, 지베렐산, 글루포시네이트, L-글루포시네이트, L-글루포시네이트-암모늄, 글루포시네이트-암모늄, 글리포세이트, 글리포세이트-이소프로필 암모늄, H-9201, 할로사펜, 할로셀푸론, 할로셀푸론-메틸, 할록시폼, 할록시폼-P, 할록시폼-에톡시에틸, 할록시폼-P-에톡시에틸, 할록시폼-메틸, 할록시폼-P-메틸, 헥사지논, HNPC-9908, HOK-201, HW-02, 이마자메타벤즈, 이마자메타벤즈-메틸, 이마자목스, 아미자픽, 이마자피르, 아미자퀸, 이마제타피르, 이마조셀푸론, 이나벤피드, 인다노판, 인돌아세트산 (IAA), 4-인돌-3-일부티르산 (IBA), 요오도셀푸론, 요오도셀푸론-메틸-나트륨, 아이옥시닐, 이소카바미드, 이소프로팔린, 이소프로투론, 이소우론, 이속사벤, 이속사클로르톨, 이속사플루톨, 이속사피리폼, KUH-043, KUH-071, 카르부틸레이트, 케토스피라독스, 락토펜, 레나실, 리누론, 말레익 하이드라지드, MCPA, MCPB, MCPB-메틸, -에틸 및 -나트륨, 메코프롭, 메코프롭-나트륨, 메코프롭-부토틸, 메코프롭-P-부토틸, 메토프롭-P-디메틸암모늄, 메코프롭-P-2-에틸헥실, 메코프롭-P-칼륨, 메페나세트, 메플루이다이드, 메피콕트-클로라이드, 메소셀푸론, 메소셀푸론-메틸, 메타벤즈티아주론, 메탐, 메타미폼, 메타미투론, 메타자클로르, 메타졸, 메톡시페논, 메틸딤론, 1-메틸사이클로프로펜, 메틸 이소티오시아네이트, 메토벤주론, 메토벤주론, 메토브로루론, 메톨라클로르, S-메톨라클로르, 메토솔람, 메톡수론, 메트리부진, 메트셀푸론, 메트셀푸론-메틸, 몰리네이트, 모날리드, 모노카바미드, 모노카바미드 디하이드로젠 셀레이트, 모노리누론, 모노셀푸론, 모누론, MT 128, MT-5950, 즉 N-[3-클로로-4-(1-메틸에틸)-페닐]-2-메틸펜탄아미드, NGGC-011, 나프로아닐리드, 나프로파미드, 납탈람, NC-310, 즉 4-(2,4-디클로로벤조일)-1-메틸-5-벤질옥시피라졸, 네부론, 니코셀푸론, 니피라클로펜, 니트랄린, 니트로펜, 니트로페놀라트-나트륨 (이성체 혼합물), 니트로플루오르펜, 노나노산, 노르플루라존, 오르벤카브, 오르토셀파무론, 오리잘린, 옥사디아르길, 옥사디아존, 옥사셀푸론, 옥사지클로메폰, 옥시플루오르펜, 파클로부트라졸, 파라콕트, 파라콕트 디클로라이드, 펠라르곤산 (노나노산), 펜디메탈린, 펜드랄린, 페녹솔람, 펜타노클로르, 펜톡사존, 퍼플루이돈, 페톡사미드, 페니소팜, 펜메디팜, 펜메디팜-에틸, 피클로람, 피콜리나펜, 피녹사텐, 피페로포스, 피리페늄, 피리페늄-부틸, 프레틸라클로르, 프리미셀푸론, 프리미셀푸론-메틸, 프로벤아졸, 프로플루아졸, 프로시아진, 프로디아민, 프리플루랄린, 프로폭시딤, 프로헥사디온, 프로헥사디온-칼슘, 프로하이드로자스몬, 프로메톤, 프로메트린, 프로파클로르, 프로파닐, 프로파퀴자폼, 프로파진, 프로팜, 프로피소클로르, 프로폭시카바존, 프로폭시카바존-나트륨, 프로피자미드, 프로셀파린, 프로셀포카브, 프로셀푸론, 프리나클로르, 피라클로닐, 피라플루펜, 피라플루펜-에틸, 피라졸리네이트 (피라졸레이트), 피라조셀푸론-에틸, 피라족시펜, 피리밤벤즈, 피리밤벤즈-이소프로필, 피리벤족심, 피리부티카브, 피리다폴, 피리데이트, 피리프탈리드, 피리미노박, 피리미노박-메틸, 피리미셀판, 피리티오박, 피리티오박-나트륨, 피록사셀폰, 피록솔람, 퀴날로락, 퀴네락, 퀴노클라민, 퀴잘로폼, 퀴잘로폼-에틸, 퀴잘로폼-P, 퀴잘로폼-P-에틸, 퀴잘로폼-P-테푸틸, 림셀푸론, 사플루펜아실, 세크부메톤, 세톡시딤, 시두론, 시마진, 시메트린, SN-106279, 설프-알레이트 (CDEC), 설프엔트라존, 설프메투론, 설프메투론-메틸, 설프세이트 (글리포세이트-트리메슘), 설프셀푸론, SYN-523, SYP-249, SYP-298, SYP-300, 테부탐, 테부티우론, 테크나젠, 테프랄옥시딤, 터바실, 터부카브, 터부클로르, 터부메톤, 터부틸라진, 터부트린, TH-547, 테닐클로르, 티아플루아미드, 티아자플루론, 티아조피르, 티디아지민, 티디아주론, 티엔카바존, 티엔카바존-메틸, 티펜셀푸론, 티펜셀푸론-메틸, 티오벤카브, 티오카바질, 트랄록시딤, 트리-알레이트, 트리아셀푸론, 트리아지플람, 트리아조펜아미드, 트리베누론, 트리베누론-메틸, 트리클로로아세트산 (TCA), 트리클로피르, 트리디페인, 트리에타진, 트리플옥시셀푸론, 트리플옥시셀푸론-나트륨,

트리플루랄린, 트리플루설푸론, 트리플루설푸론-메틸, 트리메투론, 트리넥사팍, 트리넥사팍-에틸, 트리토설푸론, 트시토데프, 유니코나졸, 유니코타졸-P, 베르놀레이트, ZJ-0166, ZJ-0270, ZJ-0543, ZJ-0862 및 하기의 화합물



[0225]



[0226]

[0227]

(I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이데아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자(들)의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유하는 HPPD 내성 식물이 성장하고 있는 영역에 적용될 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 필요한 적용율은 온도, 습도, 사용된 제초제의 성질 등과 같은 외부 조건에 따라 변화한다. 이것은 넓은 한계 내에서, 예를 들어, 0.001 내지 1.0 kg/ha 및 그 이상의 활성 물질 사이에서 변화할 수 있지만, 이것은 바람직하게는 0.005 내지 750 g/ha 사이이다.

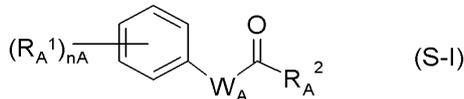
[0228]

상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염과 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염과는 상이한 제초제의 (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이데아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD

를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코쿠스, 바람직하게는 로도코쿠스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코쿠스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유하는 HPPD 내성 식물에 대한 조합 적용의 경우에, 이들 혼합물은 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염과는 상이한 제조제의 존재에 근거하여 작물 손상을 야기할 수 있다. 이러한 작물 손상을 감소/제거시키기 위해서, 적절한 완화제가 첨가될 수 있다. 해독제로서의 활성량으로 이용되는 이들 완화제는 예를 들어, 곡물류 (밀, 보리, 호밀, 옥수수, 쌀, 기장), 알팔파, 사탕무, 사탕수수, 평지, 목화 및 대두 중, 바람직하게는 옥수수, 목화, 사탕무 또는 대두 종과 같은 경제적으로 중요한 작물에서, 사용된 제조제/살충제의 식물독소 부작용을 감소시킨다.

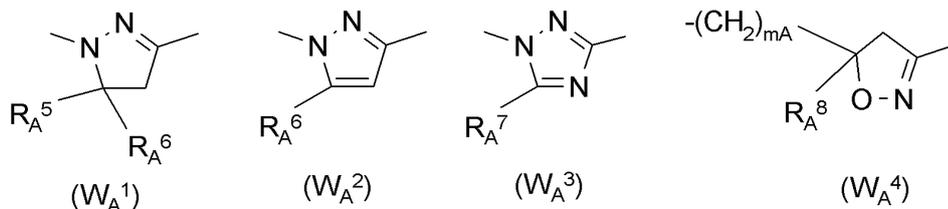
[0229] 완화제는 바람직하게는 다음의 화합물로 구성된 그룹으로부터 선택된다.

[0230] A) 하기 화학식 S-I의 화합물



[0231] 여기에서 기호 (symbols) 및 인덱스 (indices)는 다음의 의미를 갖는다:
 [0232] n_A 는 0 내지 5, 바람직하게는 0 내지 3의 자연수이고;

[0233] R_A^1 는 할로젠, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -알콕시, 니트로 또는 (C_1-C_4) -할로알킬이며;
 [0234] W_A 는 타입 N 또는 0의 1 내지 3 개의 헤테로 환 원자를 가지며, 여기에서 적어도 하나의 질소 원자 및 최대 1 개의 산소 원자가 환 내에 존재하는 부분적으로 불포화되거나 방향족인 5-원 헤테로사이클로 구성된 그룹으로부터의 비치환되거나 치환된 2가 헤테로사이클릭 라디칼, 바람직하게는 (W_A^1) 내지 (W_A^4) 로 구성된 그룹으로부터의 라디칼이고,



[0235] m_A 는 0 또는 1이며;

[0236] R_A^2 는 OR_A^3 , SR_A^3 또는 $NR_A^3R_A^4$, 또는 질소 원자를 통해서 (S-I)에서의 카보닐 그룹에 부착되고, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -알콕시 및 임의로 치환된 페닐로 구성된 그룹으로부터의 라디칼에 의해서 비치환되거나 치환되며, 적어도 하나의 질소 원자 및 바람직하게는 0 및 S로 구성된 그룹으로부터의 3 개까지의 헤테로 원자를 갖는 포화되거나 불포화된 3- 내지 7-원 헤테로사이클, 바람직하게는 화학식 OR_A^3 , NHR_A^4 또는 $N(CH_3)_2$, 특히 OR_A^3 의 라디칼이

고;

[0239] R_A^3 은 수소, 또는 바람직하게는 총 1 내지 18 개의 탄소 원자를 갖는 비치환되거나 치환된 지방족 탄화수소 래디칼이며;

[0240] R_A^4 는 수소, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -알콕시 또는 치환되거나 비치환된 페닐이고;

[0241] R_A^5 는 H, (C_1-C_8) -알킬, (C_1-C_8) -할로알킬, (C_1-C_4) -알콕시- (C_1-C_8) -알킬, 시아노 또는 $COOR_A^9$ 이며, 여기에서 R_A^9 는 수소, (C_1-C_8) -알킬, (C_1-C_8) -할로알킬, (C_1-C_4) -알콕시- (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_6) -하이드록시알킬, (C_3-C_{12}) -사이클로알킬 또는 트리- (C_1-C_4) -알킬실릴이고;

[0242] R_A^6 , R_A^7 , R_A^8 은 동일하거나 상이하며, 수소, (C_1-C_8) -알킬, (C_1-C_8) -할로알킬, (C_3-C_{12}) -사이클로알킬 또는 치환되거나 비치환된 페닐이고;

[0243] 바람직하게는

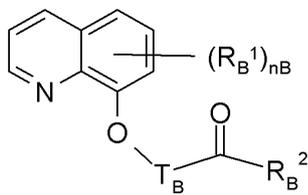
[0244] a) 디클로로페닐피라졸린-3-카복실산의 타입의 화합물, 바람직하게는 WO 91/07874에 기술된 바와 같은 에틸 1-(2,4-디클로로페닐)-5-(에톡시카보닐)-5-메틸-2-피라졸린-3-카복실레이트 (S1-1) ("메펜피르-디에틸", 참조: Pestic. Man.), 및 관련된 화합물;

[0245] b) 디클로로페닐피라졸카복실산의 유도체, 바람직하게는 EP-A-333 131 및 EP-A-269 806에 기술된 바와 같은 에틸 1-(2,4-디클로로페닐)-5-메틸피라졸-3-카복실레이트 (S1-2), 에틸 1-(2,4-디클로로페닐)-5-이소프로필피라졸-3-카복실레이트 (S1-3), 에틸 1-(2,4-디클로로페닐)-5-(1,1-디메틸에틸)피라졸-3-카복실레이트 (S1-4), 에틸 1-(2,4-디클로로페닐)-5-페닐피라졸-3-카복실레이트 (S1-5) 및 관련된 화합물과 같은 화합물;

[0246] c) 트리아졸카복실산의 타입의 화합물, 바람직하게는 EP-A-174 562 및 EP-A-346 620에 기술된 바와 같은 펜클로라졸-(에틸 에스테르), 즉 에틸 1-(2,4-디클로로페닐)-5-트리클로로-메틸-(1H)-1,2,4-트리아졸-3-카복실레이트 (S1-6), 및 관련된 화합물과 같은 화합물;

[0247] d) 5-벤질- 또는 5-페닐-2-이속사졸린-3-카복실산 또는 5,5-디페닐-2-이속사졸린-3-카복실산의 타입의 화합물, 바람직하게는 WO 91/08202에 기술된 바와 같은 에틸 5-(2,4-디클로로벤질)-2-이속사졸린-3-카복실레이트 (S1-7) 또는 에틸 5-페닐-2-이속사졸린-3-카복실레이트 (S1-8) 및 관련된 화합물, 또는 특허출원 WO-A-95/07897에 기술된 바와 같은 에틸 5,5-디페닐-2-이속사졸린 카복실레이트 (S1-9) ("이속사디펜-에틸") 또는 n-프로필 5,5-디페닐-2-이속사졸린 카복실레이트 (S1-10) 또는 에틸 5-(4-플루오로페닐)-5-페닐-2-이속사졸린-3-카복실레이트 (S1-11).

[0248] B) 화학식 S-II의 퀴놀린 유도체



(S-II)

[0249] 여기서 기호 및 인덱스는 다음의 의미를 갖는다:
 [0250]

[0251] R_B^1 은 할로젠, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -알콕시, 니트로 또는 (C_1-C_4) -할로알킬이며;

[0252] n_B 는 0 내지 5, 바람직하게는 0 내지 3의 자연수이고;

[0253] R_B^2 는 OR_B^3 , SR_B^3 또는 $NR_B^3R_B^4$, 또는 질소 원자를 통해서 (S-II)에서의 카보닐 그룹에 부착되고, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -알콕시 또는 임의로 치환된 페닐로 구성된 그룹으로부터의 래디칼에 의해서 비치환되거나 치환되며, 적

어도 하나의 질소 원자 및 바람직하게는 0 및 S로 구성된 그룹으로부터의 3 개까지의 헤테로 원자를 갖는 포화되거나 불포화된 3- 내지 7-원 헤테로사이클, 바람직하게는 화학식 OR_B^3 , NHR_B^4 또는 $N(CH_3)_2$, 특히 화학식 OR_B^3 의 래디칼이며;

[0254] R_B^3 은 수소, 또는 바람직하게는 총 1 내지 18 개의 탄소 원자를 갖는 비치환되거나 치환된 지방족 탄화수소 래디칼이고;

[0255] R_B^4 는 수소, (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_6) -알콕시 또는 치환되거나 비치환된 페닐이며;

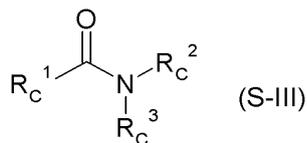
[0256] T_B 는 하나 또는 두 개의 (C_1-C_4) -알킬 래디칼에 의해서, 또는 $[(C_1-C_3)$ -알콕시]카보닐에 의해서 비치환되거나 치환된 $(C_1-$ 또는 $C_2)$ -알칸디일 쇠이고;

[0257] 바람직하게는

[0258] a) 8-퀴놀린옥시아세트산 (S2)의 타입의 화합물, 바람직하게는 EP-A-86 750, EP-A-94 349 및 EP-A-191 736 또는 EP-A-0 492 366에 기술된 바와 같은 1-메틸헥실 (5-클로로-8-퀴놀린옥시)아세테이트 (통칭 "클로퀸토세트-헥실" (S2-1)) (참조: Pestic. Man.), 1,3-디메틸부트-1-일 (5-클로로-8-퀴놀린옥시)아세테이트 (S2-2), 4-알릴옥시부틸 (5-클로로-8-퀴놀린옥시)아세테이트 (S2-3), 1-알릴옥시프로프-2-일 (5-클로로-8-퀴놀린옥시)아세테이트 (S2-4), 에틸 (5-클로로-8-퀴놀린옥시)아세테이트 (S2-5), 메틸 (5-클로로-8-퀴놀린옥시)아세테이트 (S2-6), 알릴 (5-클로로-8-퀴놀린옥시)아세테이트 (S2-7), 2-(2-프로필리텐이미녹시)-1-에틸 (5-클로로-8-퀴놀린옥시)아세테이트 (S2-8), 2-옥소프로프-1-일 (5-클로로-8-퀴놀린옥시)아세테이트 (S2-9) 및 관련된 화합물, 및 WO-A-2002/034048에 기술된 바와 같은 이들의 수화물 및 염.

[0259] b) (5-클로로-8-퀴놀린옥시)말론산의 타입의 화합물, 바람직하게는 EP-A-0 582 198에 기술된 바와 같은 디에틸 (5-클로로-8-퀴놀린옥시)말로네이트, 디알릴 (5-클로로-8-퀴놀린옥시)말로네이트, 메틸 에틸 (5-클로로-8-퀴놀린옥시)말로네이트 및 관련된 화합물.

[0260] C) 화학식 S-III의 화합물



[0261]

[0262] 여기에서 기호 및 인덱스는 다음 의미를 갖는다:

[0263] R_C^1 은 (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -할로알킬, (C_2-C_4) -알케닐, (C_2-C_4) -할로알케닐, (C_3-C_7) -사이클로알킬, 바람직하게는 디클로로메틸이며;

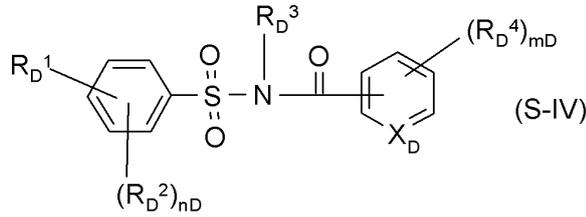
[0264] R_C^2 , R_C^3 은 동일하거나 상이하고, 수소, (C_1-C_4) -알킬, (C_2-C_4) -알케닐, (C_2-C_4) -알키닐, (C_1-C_4) -할로알킬, (C_2-C_4) -할로알케닐, (C_1-C_4) -알킬카바모일- (C_1-C_4) -알킬, (C_2-C_4) -알케닐카바모일- (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -알콕시- (C_1-C_4) -알킬, 디옥솔라닐- (C_1-C_4) -알킬, 티아졸릴, 푸릴, 푸릴알킬, 티에닐, 피페리딜, 치환되거나 비치환된 페닐이거나, R_C^2 및 R_C^3 은 함께 치환되거나 비치환된 헤테로사이클릭 환, 바람직하게는 옥사졸리딘, 티아졸리딘, 피페리딘, 모르폴린, 헥사하이드로피리미딘 또는 벤즈옥사진 환을 형성하고;

[0265] 바람직하게는,

[0266] 예를 들어, "디클로르미드" (참조: Pestic.Man.) (= N,N-디알릴-2,2-디클로로아세트아미드), "R-29148" (= 3-디클로로아세틸-2,2,5-트리메틸-1,3-옥사졸리딘; Stauffer), "R-28725" (= 3-디클로로아세틸-2,2,-디메틸-1,3-옥사졸리딘; Stauffer), "베녹사코르" (참조: Pestic. Man.) (= 4-디클로로아세틸-3,4-디하이드로-3-메틸-2H-1,4-벤즈옥사진), "PPG-1292" (= N-알릴-N-[(1,3-디옥솔라닐-2-일)메틸]디클로로아세트아미드; PPG Industries), "DKA-24" (= N-알릴-N-[(알릴아미노카보닐)메틸]디클로로아세트아미드; Sagro-Chem), "AD-67" 또는 "MON 4660" (= 3-디클로로아세틸-1-옥사-3-아자-스피로[4,5]데칸; Nitrokemia 또는 Monsanto), "TI-35" (= 1-디클로로아세

틸아제판; TRI-Chemical RT), "디클로논" (디사이클로논) 또는 "BAS145138" 또는 "LAB145138" (= 3-디클로로아세틸-2,5,5-트리메틸-1,3-디아자비사이클로[4.3.0]노난; BASF), 및 "푸릴라졸" 또는 "MON 13900" (참조: Pestic. Man.) (= (RS)-3-디클로로아세틸-5-(2-푸릴-2,2-디메틸옥사졸리딘)과 같은, 발아-전 완화제 (토양-작용 완화제)로 빈번하게 사용되는 디클로로아세트아미드의 타입의 활성 화합물.

[0267] D) 하기 화학식 S-IV의 N-아실설폰아미드 및 이들의 염



[0268]

여기에서,

[0269]

X_D 는 CH 또는 N이며;

[0270]

R_D^1 은 $CO-NR_D^5 R_D^6$ 또는 $NHCO-R_D^7$ 이고;

[0271]

R_D^2 는 할로젠, (C_1-C_4) -할로알킬, (C_1-C_4) -할로알콕시, 니트로, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -알콕시, (C_1-C_4) -알킬설포닐, (C_1-C_4) -알콕시카보닐 또는 (C_1-C_4) -알킬카보닐이며;

[0272]

R_D^3 은 수소, (C_1-C_4) -알킬, (C_2-C_4) -알케닐 또는 (C_2-C_4) -알키닐이고;

[0273]

R_D^4 는 할로젠, 니트로, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -할로알킬, (C_1-C_4) -할로알콕시, (C_3-C_6) -사이클로알킬, 페닐, (C_1-C_4) -알콕시, 시아노, (C_1-C_4) -알킬티오, (C_1-C_4) -알킬설피닐, (C_1-C_4) -알킬설포닐, (C_1-C_4) -알콕시카보닐 또는 (C_1-C_4) -알킬카보닐이며;

[0274]

R_D^5 는 수소, (C_1-C_6) -알킬, (C_3-C_6) -사이클로알킬, (C_2-C_6) -알케닐, (C_2-C_6) -알키닐, (C_5-C_6) -사이클로알케닐, 페닐, 또는 질소, 산소 및 황으로 구성된 그룹으로부터의 v_D 헤테로 원자를 함유하는 3- 내지 6-원 헤테로사이클릴이고, 여기에서 마지막으로 언급된 7 개의 래디칼은 할로젠, (C_1-C_6) -알콕시, (C_1-C_6) -할로알콕시, (C_1-C_2) -알킬설피닐, (C_1-C_2) -알킬설포닐, (C_3-C_6) -사이클로알킬, (C_1-C_4) -알콕시카보닐, (C_1-C_4) -알킬카보닐 및 페닐, 및 사이클릭 래디칼의 경우에는 또한 (C_1-C_4) -알킬 및 (C_1-C_4) -할로알킬로 구성된 그룹으로부터의 v_D 치환체에 의해서 치환되며;

[0275]

R_D^6 은 수소, (C_1-C_6) -알킬, (C_2-C_6) -알케닐 또는 (C_2-C_6) -알키닐이고, 여기에서 마지막으로 언급된 3 개의 래디칼은 할로젠, 하이드록시, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -알콕시 및 (C_1-C_4) -알킬티오로 구성된 그룹으로부터의 v_D 래디칼에 의해서 치환되거나,

[0276]

R_D^5 및 R_D^6 는 이들을 갖는 질소 원자와 함께 피롤리디닐 또는 피페리디닐 래디칼을 형성하며;

[0277]

R_D^7 는 수소, (C_1-C_4) -알킬아미노, 디- (C_1-C_4) -알킬아미노, (C_1-C_6) -알킬, (C_3-C_6) -사이클로알킬이고, 여기에서 마지막으로 언급된 2 개의 래디칼은 할로젠, (C_1-C_4) -알콕시, 할로젠- (C_1-C_6) -알콕시 및 (C_1-C_4) -알킬티오, 및 사이클릭 래디칼의 경우에는 또한 (C_1-C_4) -알킬 및 (C_1-C_4) -할로알킬로 구성된 그룹으로부터의 v_D 치환체에 의해서 치환되며;

[0278]

n_D 는 0, 1 또는 2이고;

[0279]

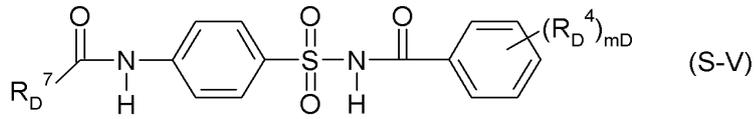
m_D 는 1 또는 2이며;

[0280]

[0281] v_D 는 0, 1, 2 또는 3이고;

[0282] 이들 중에서 바람직한 것은 다음의 화합물들이다:

[0283] 예를 들어, WO 97/45016으로부터 공지된 것으로, 예를 들어, 하기 화학식 S-V의 N-아실설폰아미드의 타입의 화합물:



[0284] 여기서,

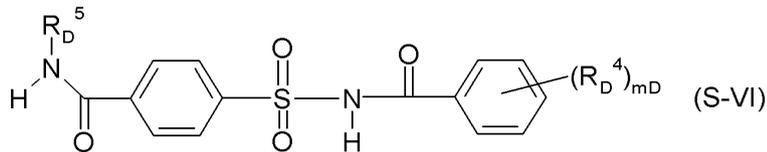
[0286] R_D^7 는 (C_1-C_6) -알킬, (C_3-C_6) -사이클로알킬이며, 여기에서 마지막으로 언급된 2 개의 래디칼은 할로젠, (C_1-C_4) -알콕시, 할로젠- (C_1-C_6) -알콕시 및 (C_1-C_4) -알킬티오, 및 사이클릭 래디칼의 경우에는 또한 (C_1-C_4) -알킬 및 (C_1-C_4) -할로알킬로 구성된 그룹으로부터의 v_D 치환체에 의해서 치환되고;

[0287] R_D^4 는 할로젠, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -알콕시, CF_3 이며;

[0288] m_D 는 1 또는 2이고;

[0289] v_D 는 0, 1, 2 또는 3이다; 및

[0290] 또한, 예를 들어, WO 99/16744로부터 공지된 것으로서, 예를 들어, 이하의 화학식 S-VI의 아실설폰아미드:



[0291] 예를 들어,

[0293] R_D^5 = 사이클로프로필이고, (R_D^4) = 2-OMe ("사이프로실파미드", S3-1),

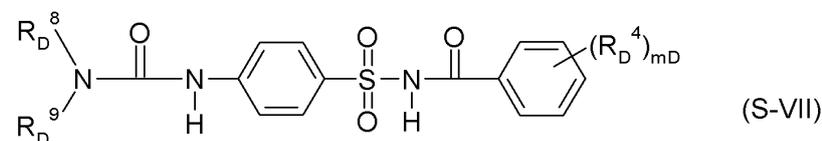
[0294] R_D^5 = 사이클로프로필이고, (R_D^4) = 5-C1-2-OMe (S3-2),

[0295] R_D^5 = 에틸이고, (R_D^4) = 2-OMe (S3-3),

[0296] R_D^5 = 이소프로필이고, (R_D^4) = 5-C1-2-OMe (S3-4), 및

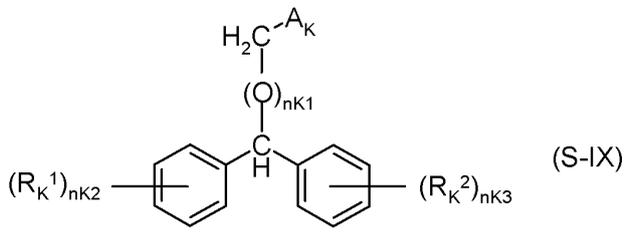
[0297] R_D^5 = 이소프로필이고, (R_D^4) = 2-OMe (S3-5)인 화합물; 및

[0298] 또한, 예를 들어, EP-A-365484로부터 공지된 것으로서, 예를 들어, 하기 화학식 S-VII의 N-아실설폰아미드페닐우레아의 타입의 화합물:



[0299] 여기서

- [0301] R_D^8 및 R_D^9 는 서로 독립적으로 수소, (C_1-C_8) -알킬, (C_3-C_8) -사이클로알킬, (C_3-C_6) -알케닐, (C_3-C_6) -알키닐이며,
- [0302] R_D^4 는 할로젠, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -알콕시, CF_3 이고,
- [0303] m_D 는 1 또는 2이며;
- [0304] 이들 중에서 특히
- [0305] 1-[4-(N-2-메톡시벤조일설파모일)페닐]-3-메틸우레아,
- [0306] 1-[4-(N-2-메톡시벤조일설파모일)페닐]-3,3-디메틸우레아,
- [0307] 1-[4-(N-4,5-디메틸벤조일설파모일)페닐]-3-메틸우레아,
- [0308] 1-[4-(N-나프토일설파모일)페닐]-3,3-디메틸우레아.
- [0309] G) 하이드록시지방족 및 지방족-지방족 카복실산 유도체의 부류로부터의 활성 화합물, 예를 들어, WO 2004084631, WO 2005015994, WO 2006007981, WO 2005016001에 기술된 바와 같은 에틸 3,4,5-트리아세톡시벤조에이트, 3,5-디메톡시-4-하이드록시벤조산, 3,5-디하이드록시벤조산, 4-하이드록시살리실산, 4-플루오로살리실산, 1,2-디하이드로-2-옥소-6-트리플루오로메틸피리딘-3-카복사미드, 2-하이드록시신남산, 2,4-디클로로신남산.
- [0310] H) 1,2-디하이드로퀴녹살린-2-온의 부류로부터의 활성 화합물, 예를 들어, WO 2005112630에 기술된 바와 같은 1-메틸-3-(2-티에닐)-1,2-디하이드로퀴녹살린-2-온, 1-메틸-3-(2-티에닐)-1,2-디하이드로퀴녹살린-2-티온, 1-(2-아미노에틸)-3-(2-티에닐)-1,2-디하이드로퀴녹살린-2-온 하이드로클로라이드, 1-(2-메틸설포닐아미노에틸)-3-(2-티에닐)-1,2-디하이드로-퀴녹살린-2-온.
- [0311] I) 예를 들어, 제초제 몰리네이트에 의한 손상에 대한 쌀의 완화제로 공지되어 있는 "디메피페레이트" 또는 "MY-93" (참조: Pestic. Man.) (= S-1-메틸-1-페닐에틸 피페리딘-1-티오카복실레이트), 제초제 이마조선헤론에 의한 손상에 대한 쌀의 완화제로 공지되어 있는 "다이무론" 또는 "SK 23" (참조: Pestic. Man.) (= 1-(1-메틸-1-페닐에틸)-3-p-톨릴-우레아), 다수의 제초제에 의한 손상에 대한 쌀의 완화제로 공지되어 있는 "쿠밀루론" = "JC-940" (= 3-(2-클로로페닐메틸)-1-(1-메틸-1-페닐-에틸)우레아 (참조: JP-A-60087254), 다수의 제초제에 의한 손상에 대한 쌀의 완화제로 공지되어 있는 "메톡시페논" 또는 "NK 049" (= 3,3'-디메틸-4-메톡시벤조페논), 쌀에서 다수의 제초제에 의한 손상에 대한 완화제로 공지되어 있는 "CSB" (= 1-브로모-4-(클로로메틸설포닐)벤젠) (CAS Reg. No. 54091-06-4; Kumiai)와 같은, 유해한 식물에 대한 제초 작용 이외에도 쌀과 같은 작물에 대한 완화제 작용을 갖는 활성 화합물.
- [0312] K) WO-A-1998/38856에 기술된 바와 같은 하기 화학식 S-IX의 화합물



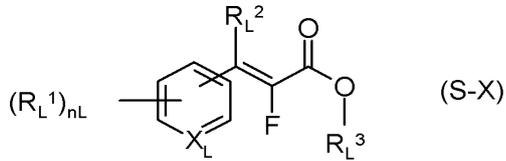
- [0313]
- [0314] 여기에서 기호 및 인덱스는 다음의 의미를 갖는다:
- [0315] R_K^1 , R_K^2 는 서로 독립적으로 할로젠, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -알콕시, (C_1-C_4) -할로알킬, (C_1-C_4) -알킬아미노, 디- (C_1-C_4) -알킬아미노, 니트로이고,
- [0316] A_K 는 $COOR_K^3$ 또는 $COOR_K^4$ 이며,
- [0317] R_K^3 , R_K^4 는 서로 독립적으로 수소, (C_1-C_4) -알킬, (C_2-C_6) -알케닐, (C_2-C_4) -알키닐, 시아노알킬, (C_1-C_4) -할로알킬, 페닐, 니트로페닐, 벤질, 할로벤질, 피리디닐알킬 또는 알킬암모늄이고,

[0318] n_K^1 은 0 또는 1이며,

[0319] n_K^2 , n_K^3 은 서로 독립적으로 0, 1 또는 2이고,

[0320] 바람직하게는, 메틸 (디페닐메톡시)아세테이트 (CAS Reg. No.: 41858-19-9)이다.

[0321] L) WO A-98/27049에 기술된 바와 같은 화학식 S-X의 화합물, 또는 그의 염



[0322]

[0323] 여기에서 기호 및 인덱스는 다음의 의미를 갖는다:

[0324] X_L 은 CH 또는 N이고,

[0325] n_L 은 $X = N$ 인 경우에는 0 내지 4의 정수이며, $X = CH$ 인 경우에는 0 내지 5의 정수이고,

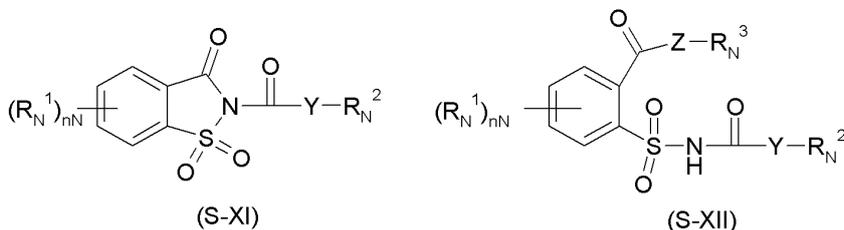
[0326] R_L^1 은 할로젠, (C_1-C_4) -알킬, (C_1-C_4) -할로알킬, (C_1-C_4) -알콕시, (C_1-C_4) -할로알콕시, 니트로, (C_1-C_4) -알킬티오, (C_1-C_4) -알킬설포닐, (C_1-C_4) -알콕시카보닐, 임의로 치환된 페닐, 임의로 치환된 페녹시이며,

[0327] R_L^2 는 수소 또는 (C_1-C_4) -알킬이고,

[0328] R_L^3 은 수소, (C_1-C_8) -알킬, (C_2-C_4) -알케닐, (C_2-C_4) -알키닐 또는 아릴이며, 여기에서 상기 언급된 탄소-함유 래디칼의 각각은 할로젠 및 알콕시로 구성된 그룹으로부터의 하나 또는 그 이상, 바람직하게는 3 개까지의 동일하거나 상이한 래디칼에 의해서 비치환되거나 치환된다.

[0329] M) 3-(5-테트라졸릴카보닐)-2-퀴놀론의 부류로부터의 활성 화합물, 예를 들어, WO-A-1999000020에 기술된 바와 같은 1,2-디하이드로-4-하이드록시-1-에틸-3-(5-테트라졸릴카보닐)-2-퀴놀론 (CAS Reg. No.: 219479-18-2), 1,2-디하이드로-4-하이드록시-1-메틸-3-(5-테트라졸릴카보닐)-2-퀴놀론 (CAS Reg. No.: 95855-00-8).

[0330] N) WO-A-2007023719 및 WO-A-2007023764에 기술된 바와 같은 화학식 S-XI 또는 S-XII의 화합물



[0331]

[0332] 여기에서

[0333] R_N^1 은 할로젠, (C_1-C_4) -알킬, 메톡시, 니트로, 시아노, CF_3 , OCF_3 이며,

[0334] Y, Z는 서로 독립적으로 0 또는 S이고,

[0335] n_N 은 0 내지 4의 정수이며,

[0336] R_N^2 는 (C_1-C_{16}) -알킬, (C_2-C_6) -알케닐, (C_3-C_6) -사이클로알킬, 아릴, 벤질, 할로벤질이고,

[0337] R_N^3 은 수소, (C_1-C_6) 알킬이다.

[0338] O) 입체이성체를 포함하는

- [0339] 1,8-나프탈릭 안하이드라이드,
- [0340] 0,0-디에틸 S-2-에틸티오에틸 포스포로티오에이트 (디설포톤),
- [0341] 4-클로로페닐 메틸카바메이트 (메페네이트),
- [0342] 0,0-디에틸 0-페닐 포스포로티오에이트 (디에틀레이트),
- [0343] 4-카복시-3,4-디하이드로-2H-1-벤조피란-4-아세트산 (CL-304415, CAS Reg. No.: 31541-57-8),
- [0344] 2-프로페닐 1-옥사-4-아자스피로[4.5]데칸-4-카보디티오에이트 (MG-838, CAS Reg. No.: 133993-74-5),
- [0345] 메틸 [(3-옥소-1H-2-벤조티오피란-4(3H)-일리덴)메톡시]아세테이트 (WO-A-98/13361; CAS Reg. No.: 205121-04-6),
- [0346] 시아노메톡시이미노(페닐)아세토니트릴 (시오메트리닐),
- [0347] 1,3-디옥솔란-2-일메톡시이미노(페닐)아세토니트릴 (옥사벤트리닐),
- [0348] 4'-클로로-2,2,2-트리플루오로아세토페논 0-1,3-디옥솔란-2-일메틸옥심 (플록소페닐),
- [0349] 4,6-디클로로-2-페닐피리미딘 (펜클로람),
- [0350] 벤질 2-클로로-4-트리플루오로메틸-1,3-티아졸-5-카복실레이트 (플루라졸),
- [0351] 2-디클로로메틸-2-메틸-1,3-디옥솔란 (MG-191)으로 구성된 그룹으로부터의 하나 또는 그 이상의 화합물, 및 농업에서 통상적인 염.
- [0352] (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (c) 시네코코코이데아에, 바람직하게는 시네코코커스 종, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유하는 유전자이식 식물에 대해서 살진균제, 살충제, 살비제, 살선충제, 조류 기피제, 식물 영양제 및 토양 구조 개선제와 같은 다른 공지의 활성 화합물과 관련하여 적용될 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드 또는 이들의 염의 혼합물도 마찬가지로 가능하다.
- [0353] 완화제의 일부는 이미 제초제로서 공지되어 있으며, 따라서 유해한 식물에 대한 제초 작용 이외에, 또한 농작물을 보호함으로써 작용한다.
- [0354] 완화제에 대한 제초제 (혼합물)의 중량비는 일반적으로, 제초제 적용을 및 문제의 완화제의 유효성에 따라 좌우되며, 넓은 한계 내에서, 예를 들어, 200:1 내지 1:200, 바람직하게는 100:1 내지 1:100, 특히 20:1 내지 1:20의 범위에서 변화할 수 있다. 완화제는 화학식 I의 화합물 또는 다른 제초제/살충제와 이들의 혼합물과 유사하게 제제화될 수 있으며, 가공된 제제로서 또는 제초제와의 탱크 믹스로서 제공되고 사용될 수 있다.
- [0355] (I) (a) 아베나, 바람직하게는 아베나 사티바, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 2에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 1과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (b) 슈도모나스, 바람직하게는 슈도모나스 플루오레센스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 4에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 3과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것,

(c) 시네코코코이데아에, 바람직하게는 시네코코커스 중, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 7에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 6과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (d) 블레파리스미다에, 바람직하게는 블레파리스마 야포니쿰, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 9에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 8과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (e) 로도코커스, 바람직하게는 로도코커스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 11에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 10과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, 또는 로도코커스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 13에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 12와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (f) 피크로필라세아에, 바람직하게는 피크로필루스 토리두스, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 15에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 14와 동일한 DNA 서열을 포함하는 것, (g) 코르디아, 바람직하게는 코르디아 알기시다, 더욱 바람직하게는 SEQ ID No. 17에 의해 정의된 HPPD를 코드화한 SEQ ID No. 16과 동일한 DNA 서열을 포함하는 것으로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 유도된 하이드록시페닐피루베이트 디옥시게나제 (HPPD)를 코드화한 DNA 서열을 포함하거나, (II) 상기 정의된 유기체의 HPPD 코드화 유전자의 하나 또는 그 이상의 돌연변이된 DNA 서열, 바람직하게는 WO 2010/085705, US6,245,968, WO 2009/144079, PCT/EP2010/070561, PCT/EP2010/070567, PCT/EP2010/070578, PCT/EP2010/070570, 또는 PCT/EP2010/070575에 기술된 것과 같은 돌연변이체를 포함하는 하나 또는 그 이상의 키메라 유전자(들)를 함유하는 이러한 유전자이식 식물이 존재하는 영역에 대한 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아틸카복사미드의 필요한 적용율은 특히, 온도, 습도 및 사용된 제초제의 타입과 같은 외부 조건에 따라 변화한다. 이것은 넓은 한계 내에서, 예를 들어, 0.001 내지 10 000 g/ha 또는 그 이상의 활성 물질로 변화할 수 있다; 그러나, 이것은 바람직하게는 0.5 내지 5000 g/ha, 특히 바람직하게는 0.5 내지 1000 g/ha, 매우 특히 바람직하게는 0.5 내지 500 g/ha이다.

[0356] **서열 목록**

- [0357] SEQ ID No. 1: 이. 콜라이 세포에서의 발현을 위해서 최적화된 아베나 사티바 (*Avena sativa*) HPPD를 코드화한 핵산 서열
- [0358] SEQ ID No. 2: SEQ ID No. 1에 의해서 코드화된 단백질
- [0359] SEQ ID No. 3: 위치 336에서 돌연변이된 슈도모나스 플루오레센스 (*Pseudomonas fluorescens*) HPPD를 코드화한 핵산 서열; 돌연변이 Gly => Trp
- [0360] SEQ ID No. 4: SEQ ID No. 3에 의해서 코드화된 단백질
- [0361] SEQ ID No. 5: 위치 336에서 돌연변이된 슈도모나스 플루오레센스 HPPD를 코드화한 핵산 서열; 돌연변이 Gly => Trp; 대두 및 목화에서의 발현을 위해서 최적화된
- [0362] SEQ ID No. 6: 시네코코커스 중 HPPD를 코드화한 핵산 서열
- [0363] SEQ ID No. 7: SEQ ID No. 6에 의해서 코드화된 단백질
- [0364] SEQ ID No. 8: 블레파리스마 야포니쿰 (*Blepharisma japonicum*) HPPD를 코드화한 핵산 서열
- [0365] SEQ ID No. 9: SEQ ID No. 8에 의해서 코드화된 단백질
- [0366] SEQ ID No. 10: 로도코커스 중 (*Rhodococcus* sp.) (스트레인 RHA1), 분리체 ro03041 HPPD를 코드화한 핵산 서열
- [0367] SEQ ID No. 11: SEQ ID No. 10에 의해서 코드화된 단백질
- [0368] SEQ ID No. 12: 로도코커스 중 (스트레인 RHA1), 분리체 ro02040 HPPD를 코드화한 핵산 서열
- [0369] SEQ ID No. 13: SEQ ID No. 12에 의해서 코드화된 단백질
- [0370] SEQ ID No. 14: 피크로필루스 토리두스 (*Picrophilus torridus*) HPPD를 코드화한 핵산 서열
- [0371] SEQ ID No. 15: SEQ ID No. 14에 의해서 코드화된 단백질
- [0372] SEQ ID No. 16: 코르디아 알기시다 (*Kordia algicida*) HPPD를 코드화한 핵산 서열
- [0373] SEQ ID No. 17: SEQ ID No. 16에 의해서 코드화된 단백질
- [0374] SEQ ID No. 18: 대두 및 목화에서의 발현을 위해서 최적화된 시네코코커스 중 HPPD를 코드화한 핵산 서열

- [0375] SEQ ID No. 19: 대두 및 목화에서의 발현을 위해서 최적화된 블레파리스마 야포니쿰 HPPD를 코드화한 핵산 서열
- [0376] SEQ ID No. 20: 대두 및 목화에서의 발현을 위해서 최적화된 로도코쿠스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro0341 HPPD를 코드화한 핵산 서열
- [0377] SEQ ID No. 21: 대두 및 목화에서의 발현을 위해서 최적화된 로도코쿠스 종 (스트레인 RHA1), 분리체 ro0240 HPPD를 코드화한 핵산 서열
- [0378] SEQ ID No. 22: 대두 및 목화에서의 발현을 위해서 최적화된 피크로필루스 토리두스 HPPD를 코드화한 핵산 서열
- [0379] SEQ ID No. 23: 대두 및 목화에서의 발현을 위해서 최적화된 코르디아 알기시다 HPPD를 코드화한 핵산 서열

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

- [0380] I. 다양한 유기체로부터의 HPPDs에 대해 코드화한 특성의 유전자의 클로닝
- [0381] A. 아베나 HPPD의 클로닝 (W002/46387에 따름)
- [0382] A1- 이. 콜라이 세포에서의 발현을 위한 클로닝
- [0383] 아베나 사티바 (*Avena sativa*) HPPD에 대해 코드화한 cDNA (AvHPPD; SEQ ID No. 1)는 에세리키아 콜라이 (*Escherichia coli*) 세포에서의 유전자의 발현을 위해서 최적화된 코돈 용법을 사용하여 GeneArt (Regensburg, Germany)에서 주문되었다. 출발 코돈 ATG에 대한 상류에서 제한효소 BamHI의 인식 부위에 상응하는 서열을 추가하였으며, 정지 코돈에 대한 하류에는 효소 HindIII의 인식 부위에 상응하는 서열 스트레치 (stretch)를 추가하였다. 합성된 단편은 AvHPPD 단백질 (SEQ ID No. 2)로부터의 N-말단 극한에서 벡터 내에 존재하는 HisTag와의 융합물을 획득하기 위해서, 미리 개방된 벡터 pET32a (Novagen, Darmstadt, Germany) 내에 제한효소 BamHI 및 HindIII를 사용하여 클로닝하였다. 생성된 벡터는 pET32a-AvHPPDe로 칭하였다.
- [0384] 단백질은 이. 콜라이 내에서 생산되고, 표준 프로토콜 (예를 들어, W02009/144097에 기술된 바와 같음)에 따라 분리하였다.
- [0385] A2- 담배 식물에서의 발현을 위해 pBin19 바이너리 벡터 (binary vector)에서의 AvHPPD 유전자의 클로닝
- [0386] AvHPPD 단백질에 대해 코드화한 유전자에 상응하는 cDNA를 제한효소 NcoI 및 NotI을 사용하여 플라스미드 pET32a-AvHPPDe로부터 절단하였다. NotI 제한으로부터 생성된 돌출 (overhang) 서열을 채운 다음에, 생성된 단편을 효소 NcoI 및 SmaI로 미리 제한된 벡터 pRT100-OTPc [참조: 예를 들어, Topfer (1987), *Nucleic Acids Res.* 15: 5890, 및 PCT/EP2010/070561] 내에 클로닝하였다. 이 벡터에서, AvHPPD에 대해 코드화한 서열은 그 자체가 CaMV 35S 프로모터 [참조: 예를 들어, W02009/144097]에 상응하는 서열의 하류에 있는, 염록체로의 단백질의 전좌에 책임이 있는 최적화된 수송 펩타이드에 상응하는 서열에 대해 하류에 위치하였다. 발현 카세트 CaMV35S-OTPc-AvHPPDe-35S에 상응하는 뉴클레오타이드 서열을 효소 SbfI를 사용하여 제한하고, 동일한 효소를 사용하여 미리 개방된 벡터 pBin19 내로 더 클로닝하였다. 생성된 플라스미드는 pBin19-CaMV35S-OTPc-AvHPPDe-35S로 칭하였으며, 아그로박테리움 투메파시엔스 (*Agrobacterium tumefaciens*) 스트레인 ATHV (참조: 예를 들어, PCT/EP2010/070561)를 형질전환시키기 위해서 사용하였다.
- [0387] B. PfHPPD-G336W의 클로닝
- [0388] B1- 이. 콜라이 세포에서의 발현을 위한 PfHPPD-G336W의 클로닝
- [0389] 플라스미드 pKK233-2 (Clontech) (US 6245968) 내의 슈도모나스 플루오레센스로부터의 돌연변이체 HPPD G336W (SEQ ID No. 3) (US 6,245,968)를 코드화하는 유전자를 PCR을 위한 주형으로 사용하여 그의 5' 극한에 효소 NcoI의 인식 부위에 상응하는 서열을 추가하고, 그의 3' 극한에 효소 XbaI의 인식 부위에 상응하는 서열을 추가하였다 [참조: WO 2009/144079]. 클로닝은 "pSE420(RI)NX-PfG336W"로 불리는 슈도모나스 HPPD G336W (SEQ ID No. 4)의 N-말단 극한에서의 His tag 융합 단백질을 획득하기 위해서 이루어졌다.
- [0390] B2- 담배 식물 pFCO117에서의 발현을 위한 PfHPPD-G336W의 클로닝
- [0391] 담배 또는 대두 형질전환을 위한 바이너리 벡터는 예를 들어, 쌍자엽 식물에서의 발현을 위해서 최적화된 코돈 용법에 의해 유전자 PfHPPD-G336W (SEQ ID No 5)의 발현을 구동시키는 CaMV35 프로모터를 사용하여 제작하였으며, 그의 5' 말단에서 OTP에 대해 코드화한 서열, 및 추가로 식물에서 mRNA의 안정성을 개선시키기 위한 서열 TEV (담배 식각 바이러스)에 이어서 CaMV35S 종결인자를 추가하였다. 추가로, 형질전환 벡터는 또한

PAT 유전자 카세트 (여기에서, 유전자는 CaMV35S 프로모터에 의해서 구동되며, 형질전환 과정 중에 글루포시네이트 기본 선택을 위해서 CaMV35S 종결인자로 이어진다) 및 2mEPSPS 유전자 카세트 (여기에서, 유전자는 아라비돕시스 (*Arabidopsis*)로부터의 히스톤 프로모터에 의해서 구동되어 형질전환된 식물에 제초제 글리포세이트에 대한 내성을 부여한다)를 함유한다. 바이너리 벡터는 pFC0117이라 칭한다.

- [0392] C. 이. 콜라이에서, 또는 담배 식물에서의 발현을 위한 블레파리스마 (*Blepharisma*) 및 코르디아 (*Kordia*)로부터 수득된 HPPD의 클로닝
- [0393] 이들 클로닝은 PCT/EP2010/070567 (블레파리스마 야포니쿰, FMP37, 실시예 1, 명칭 "pSE420(RI)NX-FMP37") 및 PCT/EP2010/070575 (코르디아 알기시다, FMP27, 실시예 1, 명칭 "pSE420(RI)NX-FMP27")에 기술된 바와 같이 수행하였다.
- [0394] D. 이. 콜라이에서 HPPD 단백질의 생산, His-Tag를 통한 정제
- [0395] 아라비돕시스 탈리아나 (*Arabidopsis thaliana*) AtHPPD 코드화 서열 (1335 bp; Genebank AF047834; WO 96/38567)을 우선 발현 벡터 pQE-30 (QIAGEN, Hilden, Germany) 내의 BamHI와 HindIII의 제한부위 사이에 클로닝하였다. 수득된 벡터는 "pQE30-AtHPPD"로 칭하였다 [참조: WO 2009/144079].
- [0396] 플라스미드는 *trp-lac* (*trc*) 프로모터, 및 모든 이. 콜라이 숙주 스트레인에서 *lac* 리프레서 (repressor)를 제공하는 *lacI^q* 유전자를 갖는다. *lac* 리프레서는 *lac* 오퍼레이터 (*lacO*)에 결합하고, 표적 유전자의 발현을 제한하며; 이 억제제는 이소프로필 β-D-1-티오갈락토피라노사이드 (IPTG)에 의한 유도에 의해서 완화될 수 있다.
- [0397] 상기에 정의된 모든 이. 콜라이 발현 벡터들 사용하여 에세리키아 콜라이 BL21 세포 (Merck, Darmstadt, Germany)를 형질전환시켰다.
- [0398] 참조로 사용된 AtHPPD (아라비돕시스 탈리아나 (*Arabidopsis thaliana*) HPPD)의 경우에는 WO 2009/144079를 참고로 한다.
- [0399] HPPD의 발현은 pQE30-AtHPPD, pET32a-AvHPPDe, pSE420(RI)NX-PfG336W, pSE420(RI)NX-FMP27 또는 pSE420(RI)NX-FMP37을 함유하는 이. 콜라이 K-1에서 수행하였다. 세포를 OD가 0.5에 도달할 때까지 성장시킨 다음에, 발현은 *lac* 리프레서에 결합하고, *lac* 오페론으로부터 그의 해리를 야기하는 1 mM IPTG로 유도함으로써 *trp-lac* (*trc*) 프로모터로부터 개시시켰다. 발현은 28°C에서 15 시간에 걸쳐 수행하였다.
- [0400] 전-스타터 (pre-starter) 배양액을 제조하기 위해서, 2 ml의 TB 배지 (100 μg*ml⁻¹ 카베니실린)를 50 μl의 이. 콜라이 K-12 BL21 글리세롤 저장액 (stock)으로 접종하였다. 전-스타터 배양액을 15 시간 동안 140 rpm에서 진탕하면서 37°C에서 배양하였다. 200 μl의 전-스타터 배양액을 사용하여 스타터 배양 (100 μg*L⁻¹로의 5 ml TB 보충)을 개시시켰으며, 이것은 37°C에서 3 시간 동안 배양하였다.
- [0401] 주 배양액 (main culture)을 제조하기 위해서, 400 ml의 TB 배지 (100 μg*ml⁻¹ 카베니실린)를 4 ml의 스타터 배양액으로 접종하였다. 이 스타터 배양액은 OD₆₀₀ 0.5에 도달할 때까지 140 rpm에서 진탕하면서 37°C에서 배양하였다. 그 후, 400 μl의 1 M IPTG 용액에 의해서 재조합 단백질 발현을 유도하였다. 세포를 이들 조건 하에서 추가로 한 시간 동안 성장하도록 한 후에, 온도를 28°C로 저하시키고, 배양액을 15 시간 동안 140 rpm에서 진탕하였다. 세포를 4°C에서 6000 x g으로 15 분 동안 원심분리하여 수확하였다. 그 후, 세포 펠릿은 -80°C에서 저장하였다.
- [0402] 자연적 형태인 His₆-AtHPPD, His₆-AvHPPD, His₆-PfHPPD-G336W, His₆-FMP27 및 His₆-FMP37의 분리 및 정제
- [0403] 세포의 용해
- [0404] 세포를, 박테리아 세포벽을 형성하는 펩티도글리칸 내의 N-아세틸뮤라민산과 N-아세틸-D-글루코사민 잔기 사이의 1,4-β-결합을 분해하는 효소인 리소자임을 사용하여 용해시켰다. 그 후, 세포막을 박테리아 세포의 내부 압력에 의해서 붕괴시켰다. 또한, 용해 완충액은 단백질을 손상시키지 않으면서 DNA 및 RNA의 모든 형태를 가수분해시킴으로써 세포 용해물의 점도를 크게 감소시키는 엔도뉴클레아제인 벤조나제 (Benzonase®) 뉴클레아제를 함유하였다. 자연적 조건 하에서의 용해는 얼음 상에서 수행하였다.
- [0405] His₆-태깅된 단백질의 정제를 위해서, 퀴아익스프레스 (QIAexpressN®) Ni-NTA 패스트 스타트 키트 (Fast Start

Kit)를 사용자 취급 설명서에 따라 사용하였다.

- [0406] 고정화된 금속 이온 친화성 크로마토그래피 (IMAC)에 의한 His₆-태깅된 단백질의 정제
- [0407] 용해 반응액의 원심분리 후에 수득된 맑은 세포 용해액 (10 ml)을 퀴아익스프레스 (QIAexpress®) Ni-NTA 패스트 스타트 키트 (Qiagen, Hilden, Germany)로부터의 Ni-NTA 패스트 스타트 칼럼 상에 부하시키고, 취급 설명서에 따라 정제를 수행하였다. His₆-태깅된 단백질을 2.5 ml의 용출 완충액으로 용출시켰다.
- [0408] 겔 여과에 의한 HPPD 용액의 탈염 (desalting)
- [0409] 2.5 ml의 용출 완충액에 의해서 Ni-NTA 패스트 스타트 칼럼으로부터 용출된 HPPD 용액을 사용자 취급 설명서에 따라 세파덱스 (Sephadex) G-25 PD-10 칼럼 (GE Healthcare, Freiburg, Germany)에 적용하였다. 전체 샘플이 겔 베드에 들어간 후에, 3.5 ml의 저장 완충액을 사용하여 용출을 수행하였다.
- [0410] 탈염 칼럼으로부터 용출된 HPPD 용액을 1 ml 분취액으로 -80°C에서 동결시켰다.
- [0411] 브래드포드 (Bradford) 단백질 측정검사를 사용한 HPPD 단백질 농도의 결정
- [0412] 단백질 농도는 표준 브래드포드 측정검사 [Bradford, (1976), Anal Biochem 72: 248-254]를 사용하여 결정하였다.
- [0413] SDS-PAGE를 사용한 HPPD 용액의 순도의 결정
- [0414] 용출된 단백질의 온전성 (integrity)은 약 10 µg의 단백질이 부하된 겔 NuPAGE® Novex 4-12% 비스-트리스 겔 (Invitrogen, Karlsruhe, Germany)을 사용하여 SDS-PAGE 단백질 겔 전기영동에 의해서 검사하였다. 10 µl의 램리 샘플 완충액 (Laemli Sample Buffer)을 1-10 µl의 단백질 용액에 첨가하고, 혼합물을 90°C에서 10 분 동안 배양하였다. 짧은 원심분리 단계 후에, 전체 혼합물을 NuPAGE® MOPS SDS 주행 완충액 (Running Buffer) (20 x-용액으로부터 ddH₂O로 희석됨)으로 충전된 XCell SureLock™ Novex 미니-셀 (Mini-Cell) 겔 챔버 내에 미리 고정시킨 SDS 겔의 슬롯 (slot) 내에 부하시켰다. 그 후, 150의 전압을 1 시간 동안 겔 챔버에 적용하였다. 단백질 밴드의 염색을 위해서, 겔을 쿠마시 브릴리언트 블루 (Coomassie Brilliant Blue) R-250 염색 용액에 침지시켰다. 폴리아크릴아미드 겔의 오염물 제거 (destaining)를 위해서, 이것을 단백질 밴드가 백색 겔 상에 청색으로 나타날 때까지 쿠마시 브릴리언트 블루 R-250 오염물 제거 용액에 침지시켰다.
- [0415] HPPD 효소의 HPPD 억제제에 대한 내성의 평가
- [0416] HPPD 활성은 표준 분광광도 측정검사 (방법은 WO 2009/144079에 광범하게 기술되어 있다)에 의해서 검시하였다.
- [0417] E- HPPD 억제 제조제에 대한 내성의 평가
- [0418] 몇 가지 HPPD 억제제의 존재 하에서의 HPPD 활성의 측정
- [0419] 상이한 유기체로부터 수득된 HPPD 단백질의 내성의 레벨은 PCT/EP2010/070575에 기술된 바와 같은 절차에 따라 측정하였다.
- [0420] 이하의 표 E1에서는, 코르디아 알기시다 (FMP27), 블레파리σμα 야포니쿰 (FMP37), 아베나 사티바 (AvHPPD), 및 슈도모나스 플루오레센스로부터의 돌연변이된 HPPD-G336W로부터 수득된 HPPDs가 동일한 실험 조건 하에, 시험한 HPPD 억제제의 모든 농도에서 아라비도시스 탈리아나 HPPD (AtHPPD)보다 시험한 모든 HPPD 억제제에 대해 탁월한 레벨의 내성을 나타내었음을 명백하게 볼 수 있다.
- [0421] [표 E1]
- [0422] 아라비도시스 탈리아나 (AtHPPD), 돌연변이된 슈도모나스 플루오레센스 PfHPPD-G336W, 아베나 사티바 (AvHPPD), FMP27 (코르디아 알기시다로부터 유도됨) 및 FMP37 (블레파리σμα 야포니쿰으로부터 유도됨)로부터 유래하는 HPPD를 사용한 화합물 "4-137"의 부재 하에서 측정된 활성과 비교한 5.0x10⁻⁶ M의 화합물 "4-137"의 존재 하에서의 억제 백분율의 측정.

표 F1. 화합물 "4-137"	
단백질	억제율 %
AtHPPD	100
PfHPPD-G336W	92
AvHPPD	93
FMP27	90
FMP37	82

- [0423]
- [0424] 이들 데이터는, 화합물 "4-137"에 대해서 나타난 것과 같이 코르디아 알기시다, 블레파리스마 야포니쿰, 아베나 사티바, 및 슈도모나스 플루오레센스의 돌연변이체 HPPD-G336W로부터 유도된 HPPD가 아라비도시스 탈리아나로부터 유도된 HPPD에 의해서 관찰된 억제에 비해서 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드에 대해 덜 민감한 것을 나타낸다.
- [0425] F- 내성 HPPD 효소를 발현하는 담배 식물의 HPPD 억제제에 대한 내성의 평가
- [0426] 선택된 HPPD에 대해 코드화한 유전자는 아베나 사티바, 슈도모나스 플루오레센스 돌연변이체 G336W, 블레파리스마 야포니쿰 및 코르디아 알기시다로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 획득되었으며, CaMV35S 프로모터의 제어 하에서 담배 게놈 내로의 DNA의 통합을 허용하는 바이너리 벡터 pBin19 내로 클로닝하였다. 클로닝 절차를 위해서, 아베나 사티바의 경우에는 상기 A2를 참조하고, 슈도모나스 플루오레센스 돌연변이체 G336W의 경우에는 상기 B2를 참조하며, 블레파리스마 야포니쿰 (FMP37)의 경우에는 PCT/EP2010/070567 (WO 2011/076882로 공개됨, 실시예 5)을 참조하고, 코르디아 알기시다 (FMP27)의 경우에는 PCT/EP2010/070575 (실시예 5)를 참조한다.
- [0427] 단백질의 N-말단 극한에 식물 엽록체 내로의 HPPD 단백질의 국재화를 허용하기 위한 표적 시그널을 추가하기 위해서, 프로모터에 상응하는 서열과 HPPD에 대한 코드화 서열 사이에 엽록체로의 수송 펩타이드에 대한 코드화 DNA 서열을 삽입하였다.
- [0428] T0 형질전환체로부터 수확된 종자를 발아를 위한 표준 토양 상에 놓았다. 3 주일 후에, 묘목 (T1)을 단일 포트 로 옮기고, 표준 재배 조건 (PCT/EP2010/070575, WO 2011/076889로 공개) 하에서 성장시켰다. 2 주일 후에, 식물에 몇 개의 상기 정의된 바와 같은 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드를 스프레이 하였다. 예를 들어, 화합물 "5-148", "4-137", "4-253", "4-278" 및 "4-25"의 적용 1 주일 후에, 제초제의 적용에 기인한 증상을 평가하였으며, 유전자이식 식물은 각각 이하의 표 F1 내지 F5에서 입증되는 바와 같이 우수한 내성을 나타내었다.
- [0429] 표 F1 내지 F5: 비-형질전환된 담배 식물 ("wt")과 비교하여, 돌연변이체 슈도모나스 플루오레센스 HPPD G336W, 아베나 HPPD (AvHPPD), 코르디아 알기시다 FMP27로부터의 HPPD 또는 블레파리스마 야포니쿰 (FMP37)으로부터의 HPPD를 발현하는 유전자이식 담배 식물에 대한 제초제의 적용에 기인하여 관찰된 증상의 평가
- [0430] 제초제 ("g AI/ha"는 "활성 성분 g/ha"를 의미한다)는 이식유전자당 1 내지 3 개의 독립적인 유전자이식 이벤트로부터 유래하는 8 내지 10 개의 식물 상에 적용하였다.
- [0431] 증상은 다음과 같이 평가 및 분류하였다:
- [0432] 3 = 매우 강한 손상
- [0433] 2 = 강한 손상
- [0434] 1 = 가볍고 일시적인 손상
- [0435] 0 = 손상 없음
- [0436] [표 F1]
- [0437] 화합물 "5-148" (WP20 제제)을 2 l/ha 평지 메틸 에스테르 및 1 kg/ha 암모늄 설페이트와 혼합시킨 다음에, 표준 제초제 스프레이어를 사용하여 25 g AI/ha의 비율로 유전자이식 식물에 적용하였다.

HPPD	계통	손 상			
		0	1	2	3
Wt		0	0	0	10
PfHPPD-G336W	646	0	3	2	4
AvHPPD	656	2	1	3	4
	659	3	1	0	6
	699	1	1	1	7
FMP27	733	3	1	4	2
	734	4	2	0	4
	735	0	4	4	2
FMP37	749	2	3	2	3
	754	2	1	5	2
	795	1	0	6	3

[0438]

[0439]

[표 F2]

[0440]

화합물 "4-137"; 25 g/ha (WP20 제제)을 2 l/ha 평지 메틸 에스테르 및 1 kg/ha 암모늄 설페이트와 혼합시킨 다음에, 표준 제초제 스프레이어를 사용하여 25 g AI/ha의 비율로 유전자이식 식물에 적용하였다.

HPPD	계통	손 상			
		0	1	2	3
Wt		0	0	0	10
PfHPPD-G336W	646	5	2	0	3
AvHPPD	656	3	1	1	5
	659	3	3	0	4
	699	1	2	0	7
FMP27	733	4	0	1	5
	734	5	2	0	3
	735	3	0	4	3
FMP37	749	8	2	0	0
	754	0	1	1	8
	795	2	0	2	6

[0441]

[0442]

[표 F3]

[0443]

화합물 "4-253"; 50 g/ha (WP20 제제)을 2 l/ha 평지 메틸 에스테르 및 1 kg/ha 암모늄 설페이트와 혼합시킨 다음에, 표준 제초제 스프레이어를 사용하여 50 g AI/ha의 비율로 유전자이식 식물에 적용하였다.

HPPD	계통	손 상			
		0	1	2	3
Wt		0	0	0	10
PfHPPD-G336W	646	9	0	0	1
AvHPPD	659	3	0	0	7
FMP27	733	4	4	2	0
	734	6	1	2	1
	735	2	5	0	3
FMP37	749	7	2	0	1
	754	6	2	1	1
	795	3	4	0	3

[0444]

[0445]

[표 F4]

[0446]

화합물 "4-278"; 50 g/ha (WP20 제제)을 2 l/ha 평지 메틸 에스테르 및 1 kg/ha 암모늄 설페이트와 혼합시킨 다음에, 표준 제초제 스프레이어를 사용하여 50 g AI/ha의 비율로 유전자이식 식물에 적용하였다.

HPPD	계통	손 상			
		0	1	2	3
Wt		0	0	0	10
PfHPPD-G336W	646	6	3	0	1
AvHPPD	659	9	0	0	1
FMP27	733	6	4	0	0
	734	6	3	0	1
	735	6	2	0	2
FMP37	749	5	4	0	1
	754	5	4	0	1
	795	4	3	0	3

[0447]

[0448]

[표 F5]

[0449]

화합물 "4-25"; 50 g/ha (WP20 제제)을 2 l/ha 평지 메틸 에스테르 및 1 kg/ha 암모늄 설페이트와 혼합시킨 다음에, 표준 제초제 스프레이어를 사용하여 50 g AI/ha의 비율로 유전자이식 식물에 적용하였다.

HPPD	계통	손 상			
		0	1	2	3
Wt		0	0	0	10
PfHPPD-G336W	646	10	0	0	0
AvHPPD	659	6	1	0	3
FMP27	733	9	1	0	0
	734	6	3	0	1
	735	5	3	0	0
FMP37	749	8	0	0	2
	754	3	5	1	1
	795	7	0	1	2

[0450]

[0451]

이들 데이터는, 화합물 "5-148", "4-137", "4-253", "4-278" 및 "4-25"에 대해서 나타난 바와 같이, 코르디아 알기시다, 블레파리스마 야포니쿰, 아베나 사티바, 및 슈도모나스 플루오레센스 HPPD의 돌연변이체 "G336W"으로부터 유도된 HPPD를 발현하는 시험한 모든 독립적인 계통의 담배 식물이 야생형 (wt) 식물보다 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드의 작물적으로 적절한 용량에 대해서 덜 민감한 것을 나타낸다.

[0452]

G- 내성 HPPD 효소, 슈도모나스 플루오레센스 "G336W" 돌연변이체, FMP 27, 및 FMP 37을 발현하는 대두 식물의 HPPD 억제제에 대한 내성의 평가

[0453]

선택된 HPPD에 대해 코드화한 유전자는 블레파리스마 야포니쿰 및 코르디아 알기시다로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 획득되었으며, CaMV35S 프로모터의 제어 하에서 대두 게놈 내로의 DNA의 통합을 허용하는 적절한 바이너리 벡터 내에 클로닝하였다. 각각의 클로닝 절차에 대해서, 블레파리스마 야포니쿰 (FMP37)의 경우에는 WO2011076882 (PCT/EP2010/070567), 실시예 9를 참조하고; 코르디아 알기시다 (FMP27)의 경우에는 WO2011076889 (PCT/EP2010/070575), 실시예 9를 참조한다.

[0454]

단백질의 N-말단 극한에 식물 엽록체 내로의 HPPD 단백질의 국재화를 허용하기 위한 표적 시그널을 추가하기 위해서, 프로모터에 상응하는 서열과 HPPD에 대한 코드화 서열 사이에 엽록체로의 수송 펩타이드에 대한 코드화 DNA 서열을 삽입하였다. 벡터 "pFC0112" (블레파리스마 야포니쿰, WO2011076882), pFC0116 (코르디아 알기시다, WO2011076889), 및 "pFC0117" (참조: 상기 실시예 B2)을 사용함으로써, 대두 형질전환은 블레파리스마 야포니쿰 (FMP37)의 경우에는 WO2011076882 (PCT/EP2010/070567)의 실시예 10, 및 코르디아 알기시다 (FMP27)의 경우에는 WO2011076889 (PCT/EP2010/070575)에 기술된 바와 같이 달성하였다. 템보트리온에 대한 내성을 나타내는 T0 이벤트로부터의 종자를 수확하였다.

[0455]

T1 대두 종자를 단일 포트에 옮기고, 표준 재배 조건 하에서 성장시켰다 (참조: WO2011076882).

[0456]

2 주일 후에, 식물에 상기 정의된 바와 같은 몇 개의 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드를 스프레이하였다. 예를 들어, 화합물 "5-148", "4-137", "4-253", "4-278" 및 "4-25"를 적용한 지 1 주일 후에 제초제의 적용에 기인한 증상을 평가하였으며, 유전자이식 식물은 야생형 대두 식물에 비해 탁월한 내성을 나타낼 것이다.

[0457]

H- 내성 HPPD 효소 FMP 27 및 FMP 37을 발현하는 목화 식물의 HPPD 억제제에 대한 내성의 평가

- [0458] 선택된 HPPD에 대해 코드화된 유전자는 블레파리스마 야포니쿰 및 코르디아 알기시다로 구성된 유기체의 그룹의 구성원으로부터 취득되었으며, CaMV35S 프로모터의 제어 하에서 목화 게놈 내로의 DNA의 통합을 허용하는 적절한 바이너리 벡터 내에 클로닝하였다. 각각의 클로닝 절차에 대해서, 블레파리스마 야포니쿰 (FMP37)의 경우에는 WO2011076882 (PCT/EP2010/070567), 실시예 11, 및 코르디아 알기시다 (FMP27)의 경우에는 WO2011076889 (PCT/EP2010/070575), 실시예 11을 참조한다.
- [0459] 단백질의 N-말단 극한에 식물 엽록체 내로의 HPPD 단백질의 국제화를 허용하기 위한 표적 시그널을 부가하기 위해서, 프로모터에 상응하는 서열과 HPPD에 대한 코드화 서열 사이에 엽록체로의 수송 펩타이드에 대한 코드화 DNA 서열을 삽입하였다. 목화 형질전환은 블레파리스마 야포니쿰 (FMP37)의 경우에는 WO2011076882 (PCT/EP2010/070567)의 실시예 12, 및 코르디아 알기시다 (FMP27)의 경우에는 WO2011076889 (PCT/EP2010/070575)에 기술된 바와 같이 달성하였다. 템보트리온에 대한 내성을 나타내는 T0 이벤트로부터의 종자를 수확하였다.
- [0460] T1 목화 종자를 단일 포트에 옮기고, 표준 재배 조건 하에서 성장시켰다 (참조: 블레파리스마 야포니쿰 (FMP37)의 경우에는 WO2011076882 (PCT/EP2010/070567) 및 코르디아 알기시다 (FMP27)의 경우에는 WO2011076889 (PCT/EP2010/070575)).
- [0461] 적어도 4 주일 후에, 식물에 상기 정의된 바와 같은 몇 개의 N-(테트라졸-4-일)- 또는 N-(트리아졸-3-일)아릴카복사미드를 스프레이하였다. 예를 들어, 화합물 "5-148", "4-137", "4-253", "4-278" 및 "4-25"를 적용한 지 1 주일 후에 제초제의 적용에 기인한 증상을 평가하였으며, 유전자이식 식물은 야생형 목화 식물에 비해 탁월한 내성을 나타낼 것이다.

서열 목록

SEQUENCE LISTING

<110> Bayer CropScience AG

<120> Use of N-(tetrazol-4-yl)- or N-(triazol-3-yl)arylcarboxamides or their salts for controlling unwanted plants in areas of transgenic crop plants being tolerant to HPPD inhibitor herbicides

<130> BCS 11-1013

<160> 23

<170> PatentIn version 3.3

<210> 1

<211> 1323

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220><223> Nucleic acid sequence encoding Avena sativa HPPD optimized for the expression in Escherichia coli cells

<400> 1

```

atgcctccga caccggcaac agcaaccggt gcagcagcag cagccgttac accggaacat      60
gcagcacgta gctttccgcg tgttgttcgt gttaatccgc gtagcgatcg ttttccggtt      120
ctgagctttc atcatgttga actgtgggtg gcagatgcag caagcgcagc aggtcgtttt      180
agctttgcac tgggtgcacc tctggcagca cgttctgatc tgagcaccgg taatagcgca      240
catgcaagcc tgctgctgcg tagcggtgca ctggcatttc tgtttaccgc tccgtatgca      300
    
```

cctcctccgc aggaagcagc aaccgcagcc gcaaccgcaa gcattccgag ctttagcgca 360
gatgcagccc gtacctttgc agcagcacat ggcttggcag ttcgtagcgt tgggttctgt 420

gttgcagatg ccgcagaagc atttcgcgtt agcgttgcgg gaggtgcacg tectgcattt 480
gcaccggcag atctgggtca tggttttggt ctggcagaag ttgaactgta cggcgatggt 540
gttctgcgtt ttgttagcta tccggatgaa accgatctgc cgtttctgcc tggttttgaa 600
cgtgtagct ctccgggtgc agttgattat ggtctgacce gttttgatca tgttgttggc 660
aatgttccgg aaatggcacc ggttattgat tatatgaaag gctttctggg ctttcatgaa 720
tttgcagaat ttaccgcaga agatgttggc accaccgaaa gcggtctgaa tagcgttgtt 780
ctggccaata atagcgaagc agttctgctg ccgctgaatg aaccgggtgca tggcaccaaa 840

cgctctagcc agattcagac ctatctggaa tatcatgggtg gtccgggtgt tcagcatatt 900
gcactggcaa gcaatgatgt tctgcgtacc ctgcgtgaaa tgcgtgcacg taccccgatg 960
ggtgggtttg aatttatggc acctccgcag gcaaaatatt atgaagggtg gcgtcgtatt 1020
gccggtgatg ttctgagcga agagcagatt aaagaatgcc aggaactggg cgttctggtt 1080
gatcgtgatg atcagggtgt tctgctgcag atttttacca aaccggttgg tgategtccg 1140
accttttttc tggaaatgat tcagcgtatt ggctgcatgg aaaaagatga agtgggtcag 1200
gaatatcaga aaggcgggtg tgggtggtttt ggtaaaggca attttagcga actgtttaaa 1260

agcattgaag attatgaaaa aagcctggaa gttaaacaga gcgttgttgc ccagaaaagc 1320
taa 1323

<210> 2
<211> 440
<212> PRT
<213> Avena sativa
<400> 2

Met Pro Pro Thr Pro Ala Thr Ala Thr Gly Ala Ala Ala Ala Ala Val
1 5 10 15
Thr Pro Glu His Ala Ala Arg Ser Phe Pro Arg Val Val Arg Val Asn
 20 25 30
Pro Arg Ser Asp Arg Phe Pro Val Leu Ser Phe His His Val Glu Leu
 35 40 45
Trp Cys Ala Asp Ala Ala Ser Ala Ala Gly Arg Phe Ser Phe Ala Leu
50 55 60

305 310 315 320
 Gly Gly Phe Glu Phe Met Ala Pro Pro Gln Ala Lys Tyr Tyr Glu Gly
 325 330 335
 Val Arg Arg Ile Ala Gly Asp Val Leu Ser Glu Glu Gln Ile Lys Glu
 340 345 350
 Cys Gln Glu Leu Gly Val Leu Val Asp Arg Asp Asp Gln Gly Val Leu

 355 360 365
 Leu Gln Ile Phe Thr Lys Pro Val Gly Asp Arg Pro Thr Phe Phe Leu
 370 375 380
 Glu Met Ile Gln Arg Ile Gly Cys Met Glu Lys Asp Glu Val Gly Gln
 385 390 395 400
 Glu Tyr Gln Lys Gly Gly Cys Gly Gly Phe Gly Lys Gly Asn Phe Ser
 405 410 415
 Glu Leu Phe Lys Ser Ile Glu Asp Tyr Glu Lys Ser Leu Glu Val Lys

 420 425 430
 Gln Ser Val Val Ala Gln Lys Ser
 435 440

<210> 3
 <211> 1077
 <212> DNA
 <213> Pseudomonas fluorescens
 <220><221> misc_feature
 <222> (1006)..(1008)
 <223> GGT codon is replaced by codon TGG
 <400> 3

atggcagatc tatacgaaaa cccaatgggc ctgatgggct ttgaattcat cgaattcgcg 60
 tcgccgacgc cgggtaccct ggagccgac ttcgagatca tgggcttcac caaagtcgcg 120
 acccaccgtt ccaagaacgt gcacctgtac cgccagggcg agatcaacct gatcctcaac 180

 aacgagccca acagcatcgc ctctacttt gggccgaac acggcccgtc ggtgtgcggc 240
 atggcgttcc gcgtgaagga ctcgcaaaag gcctacaacc ggcacctgga actcggcgcc 300
 cagccgatcc atattgacac cgggccgatg gaattgaacc tgccggcgat caagggcatc 360
 ggccggcgcg cgttgtacct gatcgaccgt ttcggcgaag gcagctcgat ctacgacatc 420

gacttcgtgt acctcgaagg tgtggagcgc aatccggtcg gtgcaggtct caaagtcac 480
gaccactga cccacaact ctatcgccgc cgcattgtct actgggcaa cttctacgag 540
aaattgttca acttcctga agcgcgttac ttcgatatca agggcgagta caccggcctg 600

acttccaagg ccatgagtgc gccggacggc atgatccgca tcccgtgaa cgaagagtcg 660
tccaaggcgc cggggcagat cgaagagttc ctgatgcagt tcaacggcga aggcattccag 720
cacgtggcgt tectaccga cgacctggc aagacctggg acgcgttgaa gaaaatcggc 780
atgcgcttca tgaccgcgc gccagacact tattacgaaa tgctcgaagg ccgcctgcct 840
gaccacggcg agccggtgga tcaactgcag gcacgcgta tctgctgga cggatcttcc 900
gtggaaggcg acaaacgct gctgctgcag atcttctcgg aaacctgat gggcccggcg 960
ttcttgaat tcatccagcg caagggcgac gatgggttg gcgagtggaa cttcaaggcg 1020

ctgttcgagt ccatcgaacg tgaccaggtg cgtcgtggtg tattgaccgc cgattaa 1077

<210> 4

<211> 358

<212> PRT

<213> Pseudomonas fluorescens

<220><221> MISC_FEATURE

<222> (336)..(336)

<223> Gly replaced by Trp

<400> 4

Met Ala Asp Leu Tyr Glu Asn Pro Met Gly Leu Met Gly Phe Glu Phe

1 5 10 15

Ile Glu Phe Ala Ser Pro Thr Pro Gly Thr Leu Glu Pro Ile Phe Glu

20 25 30

Ile Met Gly Phe Thr Lys Val Ala Thr His Arg Ser Lys Asn Val His

35 40 45

Leu Tyr Arg Gln Gly Glu Ile Asn Leu Ile Leu Asn Asn Glu Pro Asn

50 55 60

Ser Ile Ala Ser Tyr Phe Ala Ala Glu His Gly Pro Ser Val Cys Gly

65 70 75 80

Met Ala Phe Arg Val Lys Asp Ser Gln Lys Ala Tyr Asn Arg Ala Leu

85 90 95

Glu Leu Gly Ala Gln Pro Ile His Ile Asp Thr Gly Pro Met Glu Leu
 100 105 110
 Asn Leu Pro Ala Ile Lys Gly Ile Gly Gly Ala Pro Leu Tyr Leu Ile
 115 120 125
 Asp Arg Phe Gly Glu Gly Ser Ser Ile Tyr Asp Ile Asp Phe Val Tyr
 130 135 140
 Leu Glu Gly Val Glu Arg Asn Pro Val Gly Ala Gly Leu Lys Val Ile
 145 150 155 160
 Asp His Leu Thr His Asn Val Tyr Arg Gly Arg Met Val Tyr Trp Ala
 165 170 175
 Asn Phe Tyr Glu Lys Leu Phe Asn Phe Arg Glu Ala Arg Tyr Phe Asp
 180 185 190
 Ile Lys Gly Glu Tyr Thr Gly Leu Thr Ser Lys Ala Met Ser Ala Pro
 195 200 205
 Asp Gly Met Ile Arg Ile Pro Leu Asn Glu Glu Ser Ser Lys Gly Ala
 210 215 220
 Gly Gln Ile Glu Glu Phe Leu Met Gln Phe Asn Gly Glu Gly Ile Gln
 225 230 235 240
 His Val Ala Phe Leu Thr Asp Asp Leu Val Lys Thr Trp Asp Ala Leu
 245 250 255
 Lys Lys Ile Gly Met Arg Phe Met Thr Ala Pro Pro Asp Thr Tyr Tyr
 260 265 270
 Glu Met Leu Glu Gly Arg Leu Pro Asp His Gly Glu Pro Val Asp Gln
 275 280 285
 Leu Gln Ala Arg Gly Ile Leu Leu Asp Gly Ser Ser Val Glu Gly Asp
 290 295 300
 Lys Arg Leu Leu Leu Gln Ile Phe Ser Glu Thr Leu Met Gly Pro Val
 305 310 315 320
 Phe Phe Glu Phe Ile Gln Arg Lys Gly Asp Asp Gly Phe Gly Glu Trp
 325 330 335
 Asn Phe Lys Ala Leu Phe Glu Ser Ile Glu Arg Asp Gln Val Arg Arg

340

345

350

Gly Val Leu Thr Ala Asp

355

<210> 5

<211> 1077

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220><223> Nucleic acid sequence encoding *Pseudomonas fluorescens* HPPD mutated at the position 336 (Gly to Trp) optimized for the expression in soybean and cotton

<220><221> misc_feature

<222> (1006)..(1008)

<223> GGT codon is replaced by codon TGG

<400> 5

```

atggctgac ttiatgagaa ccctatgggt cttatgggct tcgagttat tgagttcgct    60
tctctacce ctggtactct tgaacctatt ttcgagatca tgggcttcac taaggttgca    120
actcacaggt ctaagaacgt tcacctttac aggcagggtg agatcaacct tacccttaac    180

aacgagccta actccattgc ttcttatttc gctgctgagc atggtccatc tgtttgcggt    240
atggctttca gagttaagga ttctcagaag gcttacaaca gggctcttga acttggtgct    300
cagcctatcc atattgatac cggacctatg gaactcaacc ttctgctat taaggttatt    360
ggtggtgctc ctctttacct tattgataga ttcggtgagg gctcctccat ctacgatatt    420
gatttcgttt accttgaggg cgttgagaga aacctgttg gtgctggtct taaggttacc    480
gatcacctta cccacaacgt ttacagaggt aggatggttt actgggctaa ctctacgag    540
aagttgttca acttcagaga ggctcgttac ttcgatatta agggcgagta cactggtcct    600

accttaagg ctatgtctgc tcctgatggt atgatcagga ttcctcttaa cgaagagtec    660
tctaagggtg ctggtcaaat tgaagagttc ctcgatcaat tcaacggtga ggtattcag    720
catgttgctt tcttgaccga tgaccttgtt aagacttggg acgctcttaa gaaaatcggc    780
atgcgtttca tgactgctcc tccagatact tactacgaaa tgcttgaggg taggcttctc    840
gatcatggtg aacctgttga tcaacttcag gctaggggta ttcttcttga tggttcttct    900
gttgagggcg ataagagctt tttgcttcag attttctccg agactcttat gggctctgtg    960
ttcttcgagt tcattcagag aaagggtgat gatggtttcg gtgaatggaa cttcaaggct   1020
    
```

cttttcgagt ccattgagag ggatcaagtt agaaggggtg ttcttaccgc tgattaa 1077

<210> 6

<211> 1053

<212> DNA

<213> Synechococcus sp.

<400> 6

atgaaccctg ccattcgaat tgtccaaggg atccaccacc tgcacttcta cttttgggat 60

ctgccccgtt ggcgggaaca cttttgtcgg gtttggggct tccgggtgac aagcgacgcc 120

ggcaacaccc tggagctgga gcagggatcc ctgcgcttgc gcctgtctca gccggcacgg 180

gcgggggacg aggtggaccg ccatttgcag cggcatgggc cgggggtggt ggatgtggcc 240

ttggcgggtg gagagcagga gctaccggcc ttggcgggac tgttgcgggg ccgagcgccc 300

caactggcgt ggatcccggc agcagcggcg ctctgcctcc acaccacctc cgggatccgg 360

cattctctga tccttggccc cttggatgcc gccctgccg aagcgggcct gttttccac 420

tgggatcacg tgggtgtgaa cgtggagcag ggatccctgc aggcggcagc cgactggtat 480

gggcgggtgc tgggctggcg gcggctgtac cgctacagca tcggcaccgc cacctccggc 540

ctggaaagcg tgggtgtggg ggatccggaa gcggggatcc aatgggcat caacgagccc 600

acctgtgccg ctcccagat tcaggagttt ttgcatgccc atggcggccc gggcattcag 660

cacgcggcgc tgcacagctc agacattgtt gccagcctgc gccggttgcg gcagggggga 720

gtggactttt tgcaagtggc gccgcagtac tacaccagcc tggaaaggga gctggggttg 780

gcgctccgtt ctgcccctgg gcagccatc tcctggcaag acctggtgga gcagcagatc 840

cttctggatg ctaccctgcc cgcttctgat ggccaggatc gcccccttct gctgcagacc 900

tttaccagc cctcttttgg tcggcccacc tttttctttg aagtcattca acggctagcc 960

ggggccacgg gctttggcga ggccaatttt caggctttgt tcgaggccct ggaacggcaa 1020

cagcgacagc gacaccagc gctgaccct tag 1053

<210> 7

<211> 350

<212> PRT

<213> Synechococcus sp.

<400> 7

Met Asn Pro Ser Ile Arg Ile Val Gln Gly Ile His His Leu His Phe

1 5 10 15

Tyr Leu Trp Asp Leu Pro Arg Trp Arg Glu His Phe Cys Arg Val Trp

Gln Asp Leu Val Glu Gln Gln Ile Leu Leu Asp Ala Thr Leu Pro Ala
 275 280 285
 Ser Asp Gly Gln Asp Arg Pro Leu Leu Leu Gln Thr Phe Thr Gln Pro
 290 295 300
 Leu Phe Gly Arg Pro Thr Phe Phe Phe Glu Val Ile Gln Arg Leu Gly
 305 310 315 320

Gly Ala Thr Gly Phe Gly Glu Ala Asn Phe Gln Ala Leu Phe Glu Ala
 325 330 335
 Leu Glu Arg Gln Gln Arg Gln Arg His Gln Ala Leu Thr Pro
 340 345 350

<210> 8

<211> 1149

<212> DNA

<213> *Blepharisma japonicum*

<400> 8

atgacttatt acgacaagca agaaacgcgt ccagatcttg gcgaattcta tggtttccat 60
 cacgttcggt tttactgtct caactcagag caagccgctt cgttctacac atctcgtttt 120
 gggttttctc cggttgccta tgaaggattg gaaacaggaa accaaaaatt ctgtaccaat 180

 gtcgtccgaa gcaacctatg agtcatcgct ttacctcag ctctcactcc tgaagacaat 240
 gaagtgaacc gtcacgttgg caagcatagt gatggagttc aagacattgc ctttagtgta 300
 agtgacgcaa gagggatgta tgagaaagcg atagctaaag gctgtaaaag ctcccgtag 360
 ccacaggttt tacaagatca atttggatct gttataatag cgtctctcca gacttatgga 420
 gacactgttc acacattagt ccaaaatgic gactatacag gacccttttt gcctggcttc 480
 agagcaatca caaaagatga tccattaaac tctgcctttc ctcaggtaaa ttatgacatt 540
 attgatcatg ttgtaggaaa tcagcctggt ggcgatatga ctctacagt agaatggtat 600

 gagaaatatic tagaatttca tcgatattgg tctgctgatg agtctgtaat ccataccgat 660
 tattcagcat taaggtctgt tgtggttgcg gattgggatg aagtgatcaa aatgcctatt 720
 aatgacctg ctgatggact tagaaaaagt caaatccaag aatatgtcga atattatggt 780
 ggagcaggcg tacaacatat tgccttaaaa gtcaatgata ttatttcagt aataagcacc 840
 ttaagggcta gaggtgtgga attcttagaa gttctctcta aatattatga tagcttaaga 900
 aaaagacttg cgcattctgc ggtacaaatt gaagaagact taaaagaat tgaagacctt 960

catatTTTGG ttgactTTG cgaccGTGGG tattTactTc agatTTTcAc aaaaccagTa 1020

gaagacagac ctactcTgtt ttatgaaatt attcaaagac ataataaCaa tggattcGga 1080

attggaatt ttaaagccct atttgaatca ttggaacaag agcaagaaag aagaggtaat 1140

ttgatctaa 1149

<210> 9

<211> 382

<212> PRT

<213> *Blepharisma japonicum*

<400> 9

Met Thr Tyr Tyr Asp Lys Gln Glu Thr Arg Pro Asp Leu Gly Glu Phe
 1 5 10 15

Tyr Gly Phe His His Val Arg Phe Tyr Val Ser Asn Ser Glu Gln Ala
 20 25 30

Ala Ser Phe Tyr Thr Ser Arg Phe Gly Phe Ser Pro Val Ala Tyr Glu
 35 40 45

Gly Leu Glu Thr Gly Asn Gln Lys Phe Cys Thr Asn Val Val Arg Ser
 50 55 60

Asn His Val Val Ile Ala Phe Thr Ser Ala Leu Thr Pro Glu Asp Asn
 65 70 75 80

Glu Val Asn Arg His Val Gly Lys His Ser Asp Gly Val Gln Asp Ile
 85 90 95

Ala Phe Ser Val Ser Asp Ala Arg Gly Met Tyr Glu Lys Ala Ile Ala
 100 105 110

Lys Gly Cys Lys Ser Phe Arg Glu Pro Gln Val Leu Gln Asp Gln Phe
 115 120 125

Gly Ser Val Ile Ile Ala Ser Leu Gln Thr Tyr Gly Asp Thr Val His
 130 135 140

Thr Leu Val Gln Asn Val Asp Tyr Thr Gly Pro Phe Leu Pro Gly Phe
 145 150 155 160

Arg Ala Ile Thr Lys Asp Asp Pro Leu Asn Ser Ala Phe Pro Gln Val
 165 170 175

Asn Tyr Asp Ile Ile Asp His Val Val Gly Asn Gln Pro Gly Gly Asp
 180 185 190
 Met Thr Pro Thr Val Glu Trp Tyr Glu Lys Tyr Leu Glu Phe His Arg
 195 200 205
 Tyr Trp Ser Ala Asp Glu Ser Val Ile His Thr Asp Tyr Ser Ala Leu
 210 215 220

Arg Ser Val Val Val Ala Asp Trp Asp Glu Val Ile Lys Met Pro Ile
 225 230 235 240
 Asn Glu Pro Ala Asp Gly Leu Arg Lys Ser Gln Ile Gln Glu Tyr Val
 245 250 255
 Glu Tyr Tyr Gly Gly Ala Gly Val Gln His Ile Ala Leu Lys Val Asn
 260 265 270
 Asp Ile Ile Ser Val Ile Ser Thr Leu Arg Ala Arg Gly Val Glu Phe
 275 280 285

Leu Glu Val Pro Pro Lys Tyr Tyr Asp Ser Leu Arg Lys Arg Leu Ala
 290 295 300
 His Ser Ala Val Gln Ile Glu Glu Asp Leu Lys Arg Ile Glu Asp Leu
 305 310 315 320
 His Ile Leu Val Asp Phe Asp Asp Arg Gly Tyr Leu Leu Gln Ile Phe
 325 330 335
 Thr Lys Pro Val Glu Asp Arg Pro Thr Leu Phe Tyr Glu Ile Ile Gln
 340 345 350

Arg His Asn Asn Asn Gly Phe Gly Ile Gly Asn Phe Lys Ala Leu Phe
 355 360 365
 Glu Ser Leu Glu Gln Glu Gln Glu Arg Arg Gly Asn Leu Ile
 370 375 380

<210> 10

<211> 1206

<212> DNA

<213> Rhodococcus sp.

<400> 10

atgacgatcg agcagactct caccgacaag gaacgcctgg caggtctcga cctcggccag 60

ctcgagcagt tggtcgggct cgtcagtagt gacggcacc ggcaccggtt cccggtcagc 120
 ggctgggatg ccgtcgtctg ggtggtcggc aacgccacc agaccgcca ctactccag 180

tccgcgttcg ggatgacct cgtgcctac tccggaacca ccaccggcaa cgcgaccac 240
 cacagcttcg tcctcgaatc cggggccgtc cgcttcgtca tcaaaggcgc ggtgaaccg 300
 gacagccccc tgatcgacca ccaccgacc cacggcgagc gctcgtcga catcgcctc 360
 gccgtccccg acgtcgaaa gtgcatgcc cacgcccgcg cccagggcgc caccgtcctc 420
 gacgaacccc acgacgtgac cgacgaccac ggcaccgtcc gcctcgcgc gatcgcacc 480
 tacggcgaca cccgccacac cctcgtcagc cgcagccact acaccggccc ctacctgcc 540
 ggctacaccg cccgcacctc cggccacacc aaacgggacg gggcacccaa ggcctgttc 600

caggccctcg accacgtcgt cggcaacgtc gaactcggca agatggacca ctgggtcagc 660
 ttctacaacc gggctcatggg ctttacgaac atggccgagt tcgtcggcga ggacatgcc 720
 accgactact ccgcgtgat gagcaaggc gtctccaacg gcaaccaccg ggtcaagttc 780
 cccctcaacg aaccgcctt cgccaagaaa cgtcgcaga tcgacgaata cctcgacttc 840
 taccgcgcc cggcgccca gcaacctggc ctggccacca atgacatcct caccgctgc 900
 gaccagctga ccgcccaggc cgtcagttc ctggccacc cgcactccta ctacaggac 960
 cccgaactgc gggcccgat cggcaacgtc cgcgccccca tcgccgaact gcagaaacgc 1020

ggcatcctcg tcgaccgca cgaagacggc tacctgtgc agatcttac caaacccctc 1080
 gtcgaccgce ccaccgtgtt cttcgaactc atcgaacgcc acggctcctt cggcttcggc 1140
 atcggcaact tcaaagcctt cttcagggc atcgaacgag aacaagccgc ccgcggaaac 1200
 ttctga 1206

<210> 11

<211> 401

<212> PRT

<213> Rhodococcus sp.

<400> 11

Met Thr Ile Glu Gln Thr Leu Thr Asp Lys Glu Arg Leu Ala Gly Leu

1 5 10 15

Asp Leu Gly Gln Leu Glu Gln Leu Val Gly Leu Val Glu Tyr Asp Gly

20 25 30

Thr Arg Asp Pro Phe Pro Val Ser Gly Trp Asp Ala Val Val Trp Val

35 40 45

Val Gly Asn Ala Thr Gln Thr Ala His Tyr Phe Gln Ser Ala Phe Gly
 50 55 60

Met Thr Leu Val Ala Tyr Ser Gly Pro Thr Thr Gly Asn Arg Asp His
 65 70 75 80

His Ser Phe Val Leu Glu Ser Gly Ala Val Arg Phe Val Ile Lys Gly
 85 90 95

Ala Val Asn Pro Asp Ser Pro Leu Ile Asp His His Arg Thr His Gly
 100 105 110

Asp Gly Val Val Asp Ile Ala Leu Ala Val Pro Asp Val Asp Lys Cys
 115 120 125

Ile Ala His Ala Arg Ala Gln Gly Ala Thr Val Leu Asp Glu Pro His
 130 135 140

Asp Val Thr Asp Asp His Gly Thr Val Arg Leu Ala Ala Ile Ala Thr
 145 150 155 160

Tyr Gly Asp Thr Arg His Thr Leu Val Asp Arg Ser His Tyr Thr Gly
 165 170 175

Pro Tyr Leu Pro Gly Tyr Thr Ala Arg Thr Ser Gly His Thr Lys Arg
 180 185 190

Asp Gly Ala Pro Lys Arg Leu Phe Gln Ala Leu Asp His Val Val Gly
 195 200 205

Asn Val Glu Leu Gly Lys Met Asp His Trp Val Asp Phe Tyr Asn Arg
 210 215 220

Val Met Gly Phe Thr Asn Met Ala Glu Phe Val Gly Glu Asp Ile Ala
 225 230 235 240

Thr Asp Tyr Ser Ala Leu Met Ser Lys Val Val Ser Asn Gly Asn His
 245 250 255

Arg Val Lys Phe Pro Leu Asn Glu Pro Ala Leu Ala Lys Lys Arg Ser
 260 265 270

Gln Ile Asp Glu Tyr Leu Asp Phe Tyr Arg Gly Pro Gly Ala Gln His
 275 280 285

Leu Ala Leu Ala Thr Asn Asp Ile Leu Thr Ala Val Asp Gln Leu Thr

290 295 300
 Ala Glu Gly Val Glu Phe Leu Ala Thr Pro Asp Ser Tyr Tyr Glu Asp
 305 310 315 320
 Pro Glu Leu Arg Ala Arg Ile Gly Asn Val Arg Ala Pro Ile Ala Glu
 325 330 335
 Leu Gln Lys Arg Gly Ile Leu Val Asp Arg Asp Glu Asp Gly Tyr Leu
 340 345 350
 Leu Gln Ile Phe Thr Lys Pro Leu Val Asp Arg Pro Thr Val Phe Phe
 355 360 365
 Glu Leu Ile Glu Arg His Gly Ser Leu Gly Phe Gly Ile Gly Asn Phe
 370 375 380
 Lys Ala Leu Phe Glu Ala Ile Glu Arg Glu Gln Ala Ala Arg Gly Asn
 385 390 395 400
 Phe

<210> 12

<211> 1209

<212> DNA

<213> Rhodococcus sp.

<400> 12

atgactaccg cgcacattcg cctgacgcc cgcgaggtgg ccgcacatct ggagaccgac 60
 gagctccggc agttggtcgg gctcgtcgaa cacgacgac cgtcggatcc gtttcccggtg 120
 gtcgcatgg atgccgtggt gttcgtgtgc ggcaacgca cgcagagcac gcagtacttc 180
 gtctccactg ggggcatgac cctcgtcgcc tacgccgggc cggagaccgg tcagcgtcgc 240
 cacaagtect tcgtcctcga gtcggggtcg gcacggttcg tgctgcacgg ccccgtcgat 300
 ccgaagagcc cgctcgcgga ccatcaccgg gcgcacggcg acggcgtggt ggacctggcg 360
 atggaagttc tcgactcga ccgtgcac gcgcatgcac gctcgcagg ggccaccatt 420
 ctcgaggagc cgcgcgact cacggatcag ttcggcaccg tgcggctcgc ggcatcgcc 480
 acgtacggca gcaccggca caccatcgtc gaccgaagcc gatacgacgg ccctacctc 540
 cccgatttc tcgctcgtc cagcggtttc gcggcgcgac cgggtaaacc cccgcgattg 600
 ttccaggcgc tcgaccagc cgctcggaac gtcgagatgg gccgatgga tcaactgggtc 660
 cggttctaca accgcgtcat gggcttcacg aacatggccg aattcgtcgg cgacgacatc 720

gccacggagt actcggcgct gatgtcgaag gtcgtggcga acggcaatca cgggtgaag 780
 ttcccgtca acgaaccgc ggtgggaaag aagaagtcgc agatcgacga atatctcgag 840

ttctacggtg agccgggctg ccagcatctg gcctcgcga ccggagacat cctcgcgacg 900
 gtggacgctg tgcgggccga ggggtgcgaa ttctgaaca cacccgacgc gtactacgag 960
 gaccacagc tgcgcgccg gatcggcagg gtgcgggtgc cggaggagga actgcagaag 1020
 cgcggaatcc tegtgcaccg cgacgaggac ggatacctcc tgcagatctt caccaaaccg 1080
 ctcggcgacc ggccgaccgt gttcttcgag gtgatcgaac ggcacggttc gctcgggttc 1140
 ggggcgggta acttccaggc cctgttcgaa tccatcgagc gtgagcaggc ggcgcgcggc 1200
 aatctgtga 1209

<210> 13

<211> 402

<212> PRT

<213> Rhodococcus sp.

<400> 13

Met Thr Thr Ala Asp Ile Arg Leu Thr Pro Arg Glu Val Ala Ala His
 1 5 10 15

Leu Glu Thr Asp Glu Leu Arg Gln Leu Val Gly Leu Val Glu His Asp
 20 25 30

Asp Ala Ser Asp Pro Phe Pro Val Val Ala Met Asp Ala Val Val Phe
 35 40 45

Val Cys Gly Asn Ala Thr Gln Ser Thr Gln Tyr Phe Val Ser Thr Trp
 50 55 60

Gly Met Thr Leu Val Ala Tyr Ala Gly Pro Glu Thr Gly Gln Arg Ser
 65 70 75 80

His Lys Ser Phe Val Leu Glu Ser Gly Ser Ala Arg Phe Val Leu His
 85 90 95

Gly Ala Val Asp Pro Lys Ser Pro Leu Ala Asp His His Arg Ala His
 100 105 110

Gly Asp Gly Val Val Asp Leu Ala Met Glu Val Leu Asp Val Asp Arg
 115 120 125

Cys Ile Ala His Ala Arg Ser Gln Gly Ala Thr Ile Leu Glu Glu Pro

130 135 140
 Arg Asp Val Thr Asp Gln Phe Gly Thr Val Arg Leu Ala Ala Ile Ala
 145 150 155 160
 Thr Tyr Gly Ser Thr Arg His Thr Ile Val Asp Arg Ser Arg Tyr Asp
 165 170 175
 Gly Pro Tyr Leu Pro Gly Phe Val Ala Arg Ser Ser Gly Phe Ala Ala

 180 185 190
 Arg Pro Gly Lys Pro Pro Arg Leu Phe Gln Ala Leu Asp His Ala Val
 195 200 205
 Gly Asn Val Glu Met Gly Arg Met Asp His Trp Val Arg Phe Tyr Asn
 210 215 220
 Arg Val Met Gly Phe Thr Asn Met Ala Glu Phe Val Gly Asp Asp Ile
 225 230 235 240
 Ala Thr Glu Tyr Ser Ala Leu Met Ser Lys Val Val Ala Asn Gly Asn

 245 250 255
 His Arg Val Lys Phe Pro Leu Asn Glu Pro Ala Val Gly Lys Lys Lys
 260 265 270
 Ser Gln Ile Asp Glu Tyr Leu Glu Phe Tyr Gly Glu Pro Gly Cys Gln
 275 280 285
 His Leu Ala Leu Ala Thr Gly Asp Ile Leu Ala Thr Val Asp Ala Leu
 290 295 300
 Arg Ala Glu Gly Val Glu Phe Leu Asn Thr Pro Asp Ala Tyr Tyr Glu

 305 310 315 320
 Asp Pro Gln Leu Arg Ala Arg Ile Gly Arg Val Arg Val Pro Val Glu
 325 330 335
 Glu Leu Gln Lys Arg Gly Ile Leu Val Asp Arg Asp Glu Asp Gly Tyr
 340 345 350
 Leu Leu Gln Ile Phe Thr Lys Pro Leu Gly Asp Arg Pro Thr Val Phe
 355 360 365
 Phe Glu Val Ile Glu Arg His Gly Ser Leu Gly Phe Gly Ala Gly Asn

 370 375 380

Phe Gln Ala Leu Phe Glu Ser Ile Glu Arg Glu Gln Ala Ala Arg Gly

385 390 395 400

Asn Leu

<210> 14

<211> 1107

<212> DNA

<213> *Picrophilus torridus*

<400> 14

atgtatggca aaaatttaat ctcaagaacta agggaaaagg agatctttaa acgattacat 60
 cacgtggaat tttacgttag cagtgccaaa acatggcat atttcatgaa caggggtctt 120
 ggatttaaaa cagtggcata tgccggteca gaaaccggga taagggacaa gatatcctat 180

gttatgtccc agggcactgc aaggatatct tttacatcat caatgaatga tgatagctat 240
 atatcgaatc atgttaaaaa acacggggat ggcgtaaagg atatagcact tgaggtcgat 300
 gatctggacg aggcaaaaag cctgatagaa aagtatggaa caaaggttc aaaaataaat 360
 gaaataaagg atggaaatgg aaagataaga actgcagaga taaaaacgta cggatgaaacc 420
 gttcatacat taatagaaac cggggattac aatggcgtat tcatgcccg tttataggaa 480
 tctgaaataa attcaaaaa cactgggata aaaaagatcg atcatatagt tggaaatgct 540
 tatgagggcg agatggatag ctgggttaat tttacatag aaaaacttgg ctttgagcat 600

ttaataacct ttgatgataa agatataaga actgattaca ggcattaag atcaaaggtt 660
 gtaaaataca atgacgatat cgtatttcca ataatgagc ctgcaaagg ctttaagaaaa 720
 tcacagatag aggaatatct tgactattac aggtctgagg gcgttcagca catagcactg 780
 ttaactgatg atataataaa aactgtatcc atgatggagg aaaacggcat agaattttta 840
 aaaacaccag gatcatacta tgaatcccta tcatcaagga taggctcaat agacaggat 900
 ttaaataaaa tagagaaaca taacatactt gtggatcgtg atgagaacgg atacctatta 960
 cagatcttca caaagcctgt tactgacagg ccaacgttct tctttgaggt catacagaga 1020

aagggtgcaa ggtcattcgg caacggtaac ttttaaggcac tttttgagc gatagaaagg 1080
 gagcaggcaa agagaggaaa cctatga 1107

<210> 15

<211> 368

<212> PRT

<213> *Picrophilus torridus*

<400> 15

Met Tyr Gly Lys Asn Leu Ile Ser Glu Leu Arg Glu Lys Glu Ile Phe
 1 5 10 15
 Lys Arg Leu His His Val Glu Phe Tyr Val Ser Ser Ala Lys Thr Trp
 20 25 30
 Ser Tyr Phe Met Asn Arg Gly Leu Gly Phe Lys Thr Val Ala Tyr Ala
 35 40 45
 Gly Pro Glu Thr Gly Ile Arg Asp Lys Ile Ser Tyr Val Met Ser Gln
 50 55 60
 Gly Thr Ala Arg Ile Ser Phe Thr Ser Ser Met Asn Asp Asp Ser Tyr
 65 70 75 80
 Ile Ser Asn His Val Lys Lys His Gly Asp Gly Val Lys Asp Ile Ala
 85 90 95
 Leu Glu Val Asp Asp Leu Asp Glu Ala Lys Ser Leu Ile Glu Lys Tyr
 100 105 110
 Gly Thr Lys Val Ser Lys Ile Asn Glu Ile Lys Asp Gly Asn Gly Lys
 115 120 125
 Ile Arg Thr Ala Glu Ile Lys Thr Tyr Gly Glu Thr Val His Thr Leu
 130 135 140
 Ile Glu Thr Gly Asp Tyr Asn Gly Val Phe Met Pro Gly Tyr Glu Glu
 145 150 155 160
 Ser Glu Ile Asn Ser Lys Asn Thr Gly Ile Lys Lys Ile Asp His Ile
 165 170 175
 Val Gly Asn Val Tyr Glu Gly Glu Met Asp Ser Trp Val Asn Phe Tyr
 180 185 190
 Ile Glu Lys Leu Gly Phe Glu His Leu Ile Thr Phe Asp Asp Lys Asp
 195 200 205
 Ile Arg Thr Asp Tyr Ser Ala Leu Arg Ser Lys Val Val Lys Tyr Asn
 210 215 220
 Asp Asp Ile Val Phe Pro Ile Asn Glu Pro Ala Lys Gly Leu Arg Lys
 225 230 235 240

Ser Gln Ile Glu Glu Tyr Leu Asp Tyr Tyr Arg Ser Glu Gly Val Gln
 245 250 255
 His Ile Ala Leu Leu Thr Asp Asp Ile Ile Lys Thr Val Ser Met Met
 260 265 270
 Glu Glu Asn Gly Ile Glu Phe Leu Lys Thr Pro Gly Ser Tyr Tyr Glu
 275 280 285
 Ser Leu Ser Ser Arg Ile Gly Ser Ile Asp Glu Asp Leu Asn Glu Ile

290 295 300
 Glu Lys His Asn Ile Leu Val Asp Arg Asp Glu Asn Gly Tyr Leu Leu
 305 310 315 320
 Gln Ile Phe Thr Lys Pro Val Thr Asp Arg Pro Thr Phe Phe Phe Glu
 325 330 335
 Val Ile Gln Arg Lys Gly Ala Arg Ser Phe Gly Asn Gly Asn Phe Lys
 340 345 350
 Ala Leu Phe Glu Ala Ile Glu Arg Glu Gln Ala Lys Arg Gly Asn Leu

355 360 365
 <210> 16
 <211> 1164
 <212> DNA
 <213> *Kordia algicida*
 <400> 16
 atggcagcag aaataaaaaa cttaaaagat ttacaaaata cagaatacgg actcaaaaaa 60
 ttatttgacg aagcagaaga ctttcttcca cttttaggaa cagactacgt agaattatac 120
 gtcggaacg ccaacaac ggcacatttc taaaaacgg cttttggttt tcaatcagaa 180
 gcttacgcag gattggaac aggattaacc gacagagttt catacgtatt aaaacaagat 240
 aaaattcgct tggctttaac aacaccatta ggaaaagggtg gcgaaatcaa tgagcatatc 300

 gatttacacg gcgatggcgt aaaagtagta gcactttggg tagaagatgc tacaaaagcc 360
 tttgaagaaa cgacaaaaag aggcgcaaaa ccgtacatgg aaccaacaaa agaagaagat 420
 gaaaacggat atgtaattcg ctcaggaatc tatacgtacg gaaaacgggt tcatgttttt 480
 gtagaacgta aaaactataa cggagtcttt ttaccaggat atcaaagatg ggaatctcac 540
 tacaatccgg agccagtgg cttaaaattc atcgatcaca tggtaggaaa tntaggttgg 600
 ggagaaatga aagaatgggtg tgaattctac gcgaaagtaa tgggatttgc gcaaattatc 660

tcctttacag atgatgatat ttctaccgat tttactgcgt tgatgagtaa agtaatgagt 720

aatggaatg gtagaatcaa atttccaatc aatgaaccgc cagaaggaaa aaagaaatcg 780

caaattgaag aatatctaga cttttacaat ggttcaggag tacaacatat tgcggttgc 840

acagacaata ttattgatac ggtttcgcaa atgcgcgaaac gtggagtaga attcttatac 900

gttcagata catattatga tgacttgta gaacgtgttg gcgacatcga tgaagatgta 960

gaagaactca aaaaacacgg aatcttaatt gatcgtgatg aagaaggata cttattgcag 1020

ttattacca aaaccattgt agacagacca acaatgttct ttgaagtcac tcagcgtaaa 1080

ggcgcacaat catttggagt aggaaacttt aaagctttat ttgaagcgat agaaagagaa 1140

caagctgctc gcggaacatt gtaa 1164

<210> 17

<211> 387

<212> PRT

<213> Kordia algicida

<400> 17

Met Ala Ala Glu Ile Lys Asn Leu Lys Asp Leu Gln Asn Thr Glu Tyr

1 5 10 15

Gly Leu Lys Lys Leu Phe Asp Glu Ala Glu Asp Phe Leu Pro Leu Leu

 20 25 30

Gly Thr Asp Tyr Val Glu Leu Tyr Val Gly Asn Ala Lys Gln Ser Ala

 35 40 45

His Phe Tyr Lys Thr Ala Phe Gly Phe Gln Ser Glu Ala Tyr Ala Gly

 50 55 60

Leu Glu Thr Gly Leu Thr Asp Arg Val Ser Tyr Val Leu Lys Gln Asp

65 70 75 80

Lys Ile Arg Leu Val Leu Thr Thr Pro Leu Gly Lys Gly Gly Glu Ile

 85 90 95

Asn Glu His Ile Asp Leu His Gly Asp Gly Val Lys Val Val Ala Leu

 100 105 110

Trp Val Glu Asp Ala Thr Lys Ala Phe Glu Glu Thr Thr Lys Arg Gly

 115 120 125

Ala Lys Pro Tyr Met Glu Pro Thr Lys Glu Glu Asp Glu Asn Gly Tyr

130 135 140
 Val Ile Arg Ser Gly Ile Tyr Thr Tyr Gly Glu Thr Val His Val Phe
 145 150 155 160
 Val Glu Arg Lys Asn Tyr Asn Gly Val Phe Leu Pro Gly Tyr Gln Arg
 165 170 175

 Trp Glu Ser His Tyr Asn Pro Glu Pro Val Gly Leu Lys Phe Ile Asp
 180 185 190
 His Met Val Gly Asn Val Gly Trp Gly Glu Met Lys Glu Trp Cys Glu
 195 200 205
 Phe Tyr Ala Lys Val Met Gly Phe Ala Gln Ile Ile Ser Phe Thr Asp
 210 215 220
 Asp Asp Ile Ser Thr Asp Phe Thr Ala Leu Met Ser Lys Val Met Ser
 225 230 235 240

 Asn Gly Asn Gly Arg Ile Lys Phe Pro Ile Asn Glu Pro Ala Glu Gly
 245 250 255
 Lys Lys Lys Ser Gln Ile Glu Glu Tyr Leu Asp Phe Tyr Asn Gly Ser
 260 265 270
 Gly Val Gln His Ile Ala Val Ala Thr Asp Asn Ile Ile Asp Thr Val
 275 280 285
 Ser Gln Met Arg Glu Arg Gly Val Glu Phe Leu Tyr Val Pro Asp Thr
 290 295 300

 Tyr Tyr Asp Asp Leu Leu Glu Arg Val Gly Asp Ile Asp Glu Asp Val
 305 310 315 320
 Glu Glu Leu Lys Lys His Gly Ile Leu Ile Asp Arg Asp Glu Glu Gly
 325 330 335
 Tyr Leu Leu Gln Leu Phe Thr Lys Thr Ile Val Asp Arg Pro Thr Met
 340 345 350
 Phe Phe Glu Val Ile Gln Arg Lys Gly Ala Gln Ser Phe Gly Val Gly
 355 360 365

 Asn Phe Lys Ala Leu Phe Glu Ala Ile Glu Arg Glu Gln Ala Ala Arg
 370 375 380

Gly Thr Leu

385

<210> 18

<211> 1056

<212> DNA

<213> Artificial sequence

<220><223> Nucleic acid sequence encoding *Synechococcus* sp. HPPD optimized
for the expression in soybean and cotton

<400> 18

atggctaacc catccattag gatcgttcag ggaatccatc accttcactt ctacctttgg 60

gatcttccaa ggtggagaga gcatttctgt agagtttggg gattcagagt tgcttctgat 120

gctggaaca ctcttgaact tgagcaagga tctcttaggc ttaggctttc tcaaccagct 180

agagctggtg atgaagtga taggcatctt caagacatg gaccaggtgt tgttgatgtt 240

gctcttgctg ttggagaaca agaacttcca gctcttgctg aacttcttag aggaaggggt 300

gctcaacttg ctiggattcc agctgctgct gctctttgcc ttcatactcc atacggaatt 360

aggcactccc ttattccagg accacttgat gctgctccag ctgaggctgg actttttct 420

cattgggatac acgttgttct taatgtggag cagggatctc ttcaagctgc tgctgattgg 480

tatggaagag ttcttggatg gcgtagactt taccgttact ccatcggaac tgctacttca 540

ggacttgagt ctgttgttgt tggagatcca gaggctggca ttcaatgggc tatcaacgaa 600

ctacttgcg ctgcttctca gattcaagag ttcttcatg ctcatggtgg accaggtatt 660

caacatgctg ctctccactc ttcagatatt gtggcttctc ttagaaggct taggcaaggt 720

ggagttgatt tcttcaagt ggctccacag tactatactt ctcttgagag agagcttgga 780

cttgctctta gatctgctct tggacaggct atttcttggc aggatcttgt tgagcagcag 840

attcttcttg atgtactct tccagcttct gatggacaag ataggccact tttgctccaa 900

actttcactc aaccactttt cggaggcca acatttctt tcgaagtgat tcaaagactt 960

ggaggtgcta ctggatttgg agaggctaatt ttccaagctc ttttcgagc tcttgaagg 1020

caacaaagge aaagcatca agctcttact ccatga 1056

<210> 19

<211> 1152

<212> DNA

<213> Artificial sequence

<220><223> Nucleic acid sequence encoding *Blepharisma japonicum* HPPD

optimized for the expression in soybean and cotton

<400> 19

atggctactt actacgataa gcaagagact agaccagatc ttggagagt ctacggattc 60
 caccatgtta ggttctactg gtctaattct gagcaagctg cttctttcta cacttcccgt 120
 ttcggatfff ctccagttgc ttacgaagga cttgagactg gaaatcagaa gttctgcact 180

 aacgttgtaa ggictaacca cgtggtgatt gcttttactt ctgctctcac tccagaggat 240
 aatgaggta acaggcatgt tggaaagcac tctgatggtg ttcaggatat tgctttctct 300
 gtgtctgatg ctagaggaat gtacgagaag gctattgcta agggatgcaa gtctttcaga 360
 gagccacaag ttcttcaaga tcagttcgga tcagtgatta ttgcttcctc tcagacttac 420
 ggtgatactg ttcacactct cgttcagaac gttgattaca ctggaccatt ccttccaggt 480
 ttcagggcta tctaagga tgatccactt aactctgctt tcccacaggt gaactacgat 540
 atcattgatc acgttgtggg aaatcagcca ggtggagata tgactccaac tgttgagtgg 600

 tacgagaagt accttgagtt tcacaggtat tggagtctg atgagtctgt gatccacact 660
 gattactctg ctcttagatc tgttgtgtg gctgattggg atgaggttat caagatgcct 720
 attaacgaac cagctgatgg acttaggaag tcccagattc aagagtacgt tgagtattat 780
 ggtggagctg gtgttcaaca cattgctctc aagtgtaacg atatcattc cgtgatttcc 840
 actcttagag ctagaggagt tgagtttctt gaagtccac caaagtacta cgattctctc 900
 agaaagaggc ttgctcattc tgctgttcag atcgaagagg atcttaaacg tattgaggac 960
 cttcacatcc tcgtggatff tgatgatagg ggataccttc tccagatfff cactaagcca 1020

 gttgaggata ggccaactff gttctacgag atcatccaaa ggcataaaa caacggattc 1080
 ggaatcgaa atttcaaggc tcttttcgag tctcttgagc aagaacaaga gagaagggga 1140
 aacctcatct ga 1152

<210> 20

<211> 1209

<212> DNA

<213> Artificial sequence

<220><223> Nucleic acid sequence encoding Rhodococcus sp. (strain RHA1),
 isolate ro03041 HPPD optimized for the expression in soybean and
 cotton

<400> 20

atggctacta ttgagcagac tctcactgat aaggaaaggc ttgctggact tgatcttga 60

caacttgagc agcttgttgg acttgttgag tacgatggaa ctagggaccc atttccagtt 120
 tctggatggg atgctgttgt ttgggttgg ggaatgcta ctcaaactgc tctactcttc 180
 caatctgctt tcggaatgac tcttgtggct tactctggac caactactgg aatagggat 240
 caccactctt tcgttcttga atctgggtgct gtgagattcg ttattaaggg tgctgtgaac 300
 ccagattctc cacttattga tcaccatagg actcatgggtg atgggttgtt ggatattgct 360
 ctgtctgttc cagatgttga taagtgcatt gctcatgcta gggtcaagg tgctactgtt 420
 cttgatgagc cacacgatgt tactgatgat cacggaactg ttaggcttgc tgctattgct 480

acttacggtg atacaaggca cactcttgtt gataggtcac actacactgg accatatctt 540
 ccaggataca ctgctagaac ttccggacac actaagaggg atgggtctcc aaagagactt 600
 ttccaggctc ttgatcacgt tgttggaaac gttgagcttg gaaagatgga tctactgggtg 660
 gacttctaca atagggatg gggattcact aatattggctg agtttgtggg agaagatatac 720
 gctactgatt actctgctct catgtctaag gttgtgtcta atggaaacca cagggigaag 780
 ttcccactta atgaaccagc tctcgtaaa aaaaggtcac agatcgatga gtacctgat 840
 ttttatcgtg gaccaggtgc tcaacatctt gctctcgtc ctaacgatata tctactgct 900

gtggatcaac ttactgctga ggggtttgag tttcttgcta ctccagattc ctattacgag 960
 gaccagaac ttagagctag gatcggaat gttagggtc caatcgtga acttcagaag 1020
 aggggaatac tcgttgatag agatgaggat ggatacctt tccagatctt cactaagcca 1080
 ttggttgata ggccaactgt tttcttcgag cttattgaga ggcatggatc tcttgattc 1140
 ggaatcgga acttcaaggc tcttttcgag gctattgaga gagaacaagc tgctagggga 1200
 aatttctga 1209

<210> 21

<211> 1212

<212> DNA

<213> Artificial sequence

<220><223> Nucleotide sequence encoding Rhodococcus sp. (strain RHA1),
 isolate ro02040 HPPD optimized optimized for the expression in
 soybean and cotton

<400> 21

atggctacta ctgctgatat taggcttact ccaaggaag ttgctgctca tcttgagact 60
 gatgagctta ggcaacttgt tggacttgtt gagcacgatg atgcttcaga tccattccca 120
 gttgttgcta tggatgctgt tgtttttgtt tgcgaaacg ctactcaatc tactcagtac 180
 ttcgtgtcta cttggggaat gactcttgtt gcttatgctg gaccagaaac tggacagaga 240

tctcacaagt ctttcgtgct tgaatctgga tctgctagat tcgttcttca cgggtgctgtt 300

gatccaaagt ctccacttgc tgatcatcat agggctcatg gtgatggtgt tgtggatctt 360

gctatggaag tgcttgatgt ggatagatgc attgctcatg ctagatctca ggggtgctact 420

attcttgaag aacctcgtga tgtgactgat cagtttggaa ctgttaggct tgctgctatt 480

gctacttacg gctccactag gcacactatt gtggataggt ccagatatga tggaccatac 540

cttccaggat ttgttgctag gtcatctgga tttgctgcta gaccaggaaa gccaccaaga 600

cttttccaag ctcttgatca cgctgttggga aatgttgaaa tgggaaggat ggatcattgg 660

gtgaggttct acaatagggt gatgggattc actaatatgg ctgagttcgt gggatgatgat 720

attgctactg agtactctgc tcttatgtct aaggttgtgg ctaatggaaa tcacagggtg 780

aagttccac ttaatgaacc agctgtggga aagaagaagt cccagatcga cgagtacctt 840

gagttttacg gtgaaccagg atgtcaacat cttgctctcg ctaactggtga tattcttctt 900

actgtggatg ctcttagagc tgaagggtt gagttcctca atactccaga tgcttactac 960

gaggaccac aacttagagc taggattgga agagttaggg ttccagtga ggaacttcag 1020

aagaggggaa tactcgttga tagagatgag gatggatacc ttctccagat cttcactaag 1080

ccacttggag ataggccaac tgttttcttc gaagtgattg agaggcatgg atctcttggga 1140

tttgagcag gaaacttcca ggcacttttc gagtctattg agagagaaca agctgctagg 1200

ggaaatcttt ga 1212

<210> 22

<211> 1110

<212> DNA

<213> Artificial sequence

<220><223> Nucleic acid sequence encoding *Picrophilus torridus* HPPD
 optimized for the expression in soybean and cotton

<400> 22

atggcttacg gaaagaacct tatttctgag cttagagaga aagagatctt caagaggctt 60

catcacgttg agttctacgt ttcttccgct aagacttggc cctacttcat gaatagggga 120

ctcggattca agactgttgc ttatgctgga ccagaaactg gaatcaggga taagatctcc 180

tacgttatgt ctcaaggtag tgctaggatt tctttcactt cctccatgaa cgatgattcc 240

tacatttcca accacgttaa gaaacacggt gatggtgtta aggatcgc tctcgaagtg 300

gatgatcttg atgaggttaa gtctctcatt gagaagtacg gaactaaggt gtccaagatc 360

aacgagatca aggatggaaa cggaaagatt aggactgctg agatcaagac ttacggtgaa 420

actgtgcaca ctcttatcga gactggatg tacaacgggtg ttttcatgcc aggatacгаа 480
 gagtctgaga tcaactcгаа gaacactggt atcaaaaaaaaa tcgatcacat tgtgggaaat 540
 gtttacgagg gtgaaatgga ttcttgggtg aacttctaca ttgagaagtт gggattcgag 600

caccttatca ctttcgatga taaggatatc aggactgatt actctgctct taggtctaag 660
 gtggatgaagt acaactgatga tatcgtgttc cctattaacg aaccagctaa gggacttagg 720
 aagtccaaaa tcgaagagta cctcgattat taccgttctg aggggtgttca acacattgct 780
 ttgctcacag acgatatcat caagactgtg tccatgatgg aagagaacgg aattgagttc 840
 cttaaagactc caggatctta ctacgagtct ttgtcctcta ggattggatc tatcgatgag 900
 gatctcaacg aaatcgagaa gcacaacatt cttgtggata gggatgagaa cggatacctт 960
 ctccagattt tactaagcc agtgactgat aggccaacat tcttcttcga agtgatcгаа 1020

agaaagggtg ctagatcttt cggaaacgga aacttcaagg ctcttttcga ggctattgag 1080
 agagaacaag ctaagagggg aaacctttga 1110

<210> 23

<211> 1167

<212> DNA

<213> Artificial sequence

<220><223> Nucleic acid sequence encoding Kordia algicida HPPD optimized for
 the expression in soybean and cotton

<400> 23

atggctgctg ctgagattaa gaacctcaag gatctccaga atactgagta cggactcaag 60
 aaactttttg atgaggctga ggatttcctt ccacttctcg gaactgatta cgttgagctт 120
 tatgtgggaa acgcaaagca atctgctcac ttctacaaga ctgctttcgg atttcaatct 180

gaggcttacg ctggacttga aactggactt actgataggg tttcctacgt gcttaagcag 240
 gataagatta ggcttgtgct cactactcca cttggaaagg gtggagagat taacgagcac 300
 attgalcttc atggtgatgg tgтaaaggт gtggctcttt gggтgaaga tgctactaag 360
 gctttcgaag agactactaa gagaggtgca aagccttata tggaacctac aaaagaagag 420
 gacgagaacg gatacgtgat tagatccgga atctacactt acggtgagac tgttcacgtт 480
 ttcgtggaga ggaagaacta caacggagtc tttcttctcg gataccaacg atgggagtct 540
 cattacaatc cagagccagt gggacttaag ttcatcgatc acatgggtggg таatgttгga 600

tggggagaga tgaaggaatg gtgсgagttт tacgctaagg ttatgggatt cgctcagatc 660
 atttcttca ctgatgatga tatctccact gatttctactg ctcttatgtc caaggтgatg 720

tctaattgaa acggaaggat caagttccct attaacgaac cagctgaggg aaagaagaag 780
 tcccagatcg aagagtacct cgatttctac aacggatctg gtgttcagca tattgctgtg 840
 gcaactgata acatcatcga tactgtgtct caaatgagag aaaggggagt ggagtttctt 900
 tacgtcccag atacttacta cgatgatctc cttgagagag tgggagatat tgacgaggat 960
 gttgaggaac ttaagaagca cggaatcctc attgatagag atgaagaggg ataccttctc 1020

cagcttttca ctaagactat cgtggatagg ccaactatgt tcttcgaagt gatccaaaga 1080
 aagggtgctc aatctttcgg agtgggaaac ttcaaggctc ttttcgagc tattgagaga 1140
 gaacaagctg ctagaggaac tctttga 1167

2