(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2017-0044103
(43) 공개일자 2017년04월24일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
C07D 249/08 (2006.01) *A01N 25/00* (2006.01)
A01N 47/34 (2006.01) *A01N 47/36* (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
(52) CPC특허분류
C07D 249/08 (2013.01)
A01N 25/00 (2013.01)
(21) 출원번호 10-2017-7004038
(22) 출원일자(국제) 2015년08월25일
심사청구일자 없음
(85) 번역문제출일자 2017년02월14일
(86) 국제출원번호 PCT/US2015/046667
(87) 국제공개번호 WO 2016/033025
국제공개일자 2016년03월03일
(30) 우선권주장
62/041,685 2014년08월26일 미국(US)

(71) 출원인
다우 아그로사이언시즈 엘엘씨
미국 인디아나주 46268-1054 인디아나폴리스 자이언스빌 로드 9330
(72) 발명자
바움 에리히 더블유
미국 46268 인디애나주 인디애나폴리스 자이언즈 빌 로드 9330
피셔 린제이 지
미국 46268 인디애나주 인디애나폴리스 자이언즈 빌 로드 9330
(뒷면에 계속)
(74) 대리인
양영준, 류현경

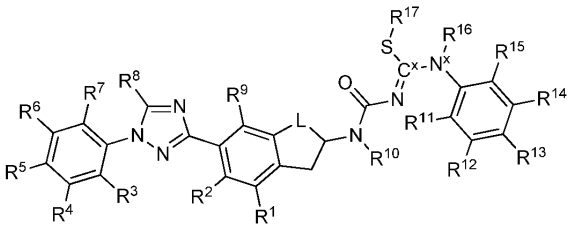
전체 청구항 수 : 총 14 항

(54) 발명의 명칭 **특정 살충 유용성을 갖는 분자, 및 그와 관련된 중간체, 조성물 및 방법**

(57) 요 약

본 개시내용은 선형동물문, 절지동물문 및/또는 연체동물문의 해충에 대해 살충 유용성을 갖는 분자, 이러한 분자를 제조하는 방법, 및 이러한 방법에 사용되는 중간체, 이러한 분자를 함유하는 조성물, 및 이러한 해충에 대해 이러한 분자를 사용하는 방법의 분야에 관한 것이다. 이들 분자는, 예를 들어 살선충제, 살진드기제, 살곤충제, 살응애제 및/또는 살연체동물제로서 사용될 수 있다. 본원은 하기 화학식 ("화학식 1")을 갖는 분자를 개시한다.

<화학식 1>



(52) CPC특허분류
A01N 47/34 (2013.01)
A01N 47/36 (2013.01)
C07D 417/12 (2013.01)
Y10S 514/919 (2013.01)
(72) 발명자
크로우즈 개리 디
미국 46268 인디애나주 인디애나폴리스 자이언즈빌 로드 9330
스파르크스 토마스 씨
미국 46268 인디애나주 인디애나폴리스 자이언즈빌 로드 9330

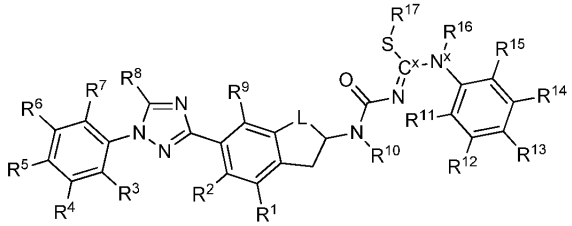
명 세 서

청구범위

청구항 1

하기 화학식 1을 갖는 분자.

<화학식 1>



여기서

(A) R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, 및 R^9는 각각 독립적으로 H, F, Cl, Br, I, CN, NO_2, OH, (C_1-C_4)알킬, (C_2-C_4)알케닐, (C_2-C_4)알키닐, (C_1-C_4)할로알킬, (C_1-C_4)알콕시, (C_1-C_4)할로알콕시, (C_3-C_6)시클로알킬, 및 (C_3-C_6)시클로알콕시로 이루어진 군으로부터 선택되고,

여기서 각각의 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시, 시클로알킬, 및 시클로알콕시는 F, Cl, CN, OH, 및 옥소로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환되고;

(B) R^8은 H이고;

(C) L은 F, Cl, CN, OH, 및 옥소로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환되는 (C_1-C_4)알킬이고;

(D) R^{10}은 H, (C_1-C_4)알킬, (C_2-C_4)알케닐, (C_2-C_4)알키닐, (C_1-C_4)할로알킬, $((C_1-C_4)$알킬$)((C_3-C_6)$시클로알킬), (C_1-C_4)알킬페닐, (C_1-C_4)알킬헤테로시클릴, $((C_1-C_4)$알킬$)O((C_1-C_4)$알킬), $((C_1-C_4)$알킬$)OC(O)((C_1-C_4)$알킬), $((C_1-C_4)$알킬$)OC(O)O((C_1-C_4)$알킬), $C(O)((C_1-C_4)$알킬), 및 C(O)페닐로 이루어진 군으로부터 선택되고,

여기서 각각의 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 시클로알킬, 페닐, 및 헤테로시클릴은 F, Cl, CN, OH, 및 옥소로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환되고;

(E) R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, 및 R^{15}는 각각 독립적으로 H, F, Cl, Br, I, CN, NO_2, OH, (C_1-C_4)알킬, (C_2-C_4)알케닐, (C_2-C_4)알키닐, (C_1-C_4)할로알킬, (C_1-C_4)알콕시, (C_1-C_4)할로알콕시, (C_3-C_6)시클로알킬, 및 (C_3-C_6)시클로알콕시로 이루어진 군으로부터 선택되고;

(F) R^{16} 및 R^{17}은 각각 독립적으로 (G), H, (C_1-C_4)알킬, (C_2-C_4)알케닐, (C_2-C_4)알키닐, (C_1-C_4)할로알킬, $((C_1-C_4)$알킬$)((C_3-C_6)$시클로알킬), (C_1-C_4)알킬페닐, (C_1-C_4)알킬헤테로시클릴, $((C_1-C_4)$알킬$)C(O)((C_1-C_4)$알킬), 및 $((C_1-C_4)$알킬$)C(O)O((C_1-C_4)$알킬)로 이루어진 군으로부터 선택되고,

여기서 각각의 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 시클로알킬, 페닐, 및 헤테로시클릴은 F, Cl, CN, OH, 및 옥소로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환되고;

(G) R^{16} 및 R^{17}은 $(S)C^x(N^x)$와 함께 4 내지 8원 헤테로시클릴 고리를 형성하고,

여기서 상기 헤테로시클릴 고리는 R^{18}로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환될 수 있고,

여기서 R^{18}은 H, F, Cl, Br, I, CN, OH, (C_1-C_4)알킬, 옥소, (C_1-C_4)알킬, (C_2-C_4)알케닐, (C_2-C_4)알키닐, (C_1-C_4)할로알킬, $((C_1-C_4)$알킬$)((C_3-C_6)$시클로알킬), (C_1-C_4)알킬페닐, (C_1-C_4)알킬헤테로시클릴, $((C_1-C_4)$알킬$)C(O)((C_1-C_4)$알킬), $((C_1-C_4)$알킬$)C(O)O((C_1-C_4)$알킬), 페닐, 및 헤테로시클릴로 이루어진 군으로부터 선택되고,

여기서 각각의 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 시클로알킬, 페닐, 및 헤테로시클릴은 F, Cl, Br, I, CN, OH, 및 옥소로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환된다.

청구항 2

제1항에 있어서,

(A) R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, 및 R^9가 각각 독립적으로 H 및 (C_1-C_4)할로알콕시로 이루어진 군으로부터 선택되고;

(B) R^8이 H이고;

(C) L이 (C_1-C_4)알킬이고;

(D) R^{10}이 H이고;

(E) R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, 및 R^{15}가 각각 독립적으로 H, F, Cl, Br, I, (C_1-C_4)알킬, (C_1-C_4)알콕시, 및 (C_3-C_6)시클로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되고;

(F) R^{16} 및 R^{17}이 (G) 또는 H이고;

(G) R^{16} 및 R^{17}이 $(S)C^x(N^x)$와 함께 4 내지 8원 헤테로시클릴 고리를 형성하고,

여기서 상기 헤테로시클릴 고리는 R^{18}로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환될 수 있고,

여기서 R^{18}은 H, CH_3, 및 옥소로 이루어진 군으로부터 선택되는 것인 분자.

청구항 3

제1항에 있어서,

(A) R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, 및 R^9가 각각 독립적으로 H, OCF_3, 및 OCF_2CF_3으로 이루어진 군으로부터 선택되고;

(B) R^8이 H이고;

(C) L이 $-CH_2-$ 또는 $-CH_2CH_2-$이고;

(D) R^{10}이 H이고;

(E) R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, 및 R^{15}가 각각 독립적으로 H, F, Cl, CH_3, CH_2CH_3, $CH_2CH_2CH_3$, $CH(CH_3)_2$, OCH_3, 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터 선택되고;

(F) R^{16} 및 R^{17}이 (G) 또는 H이고;

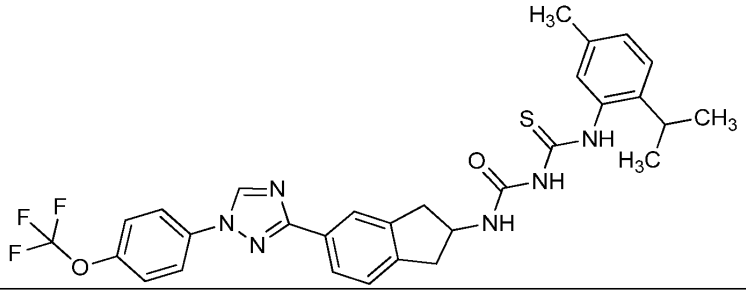
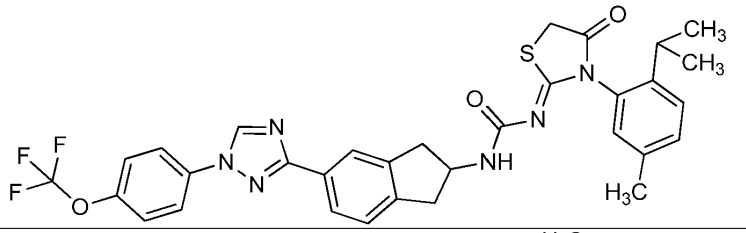
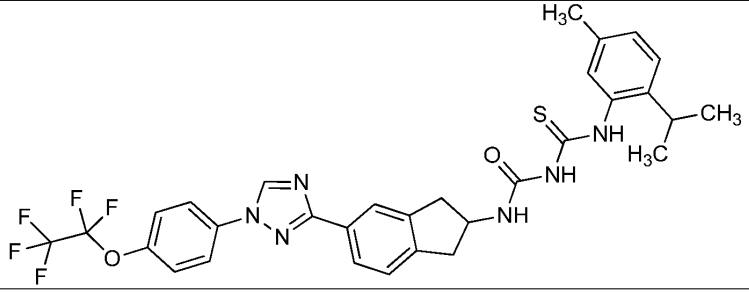
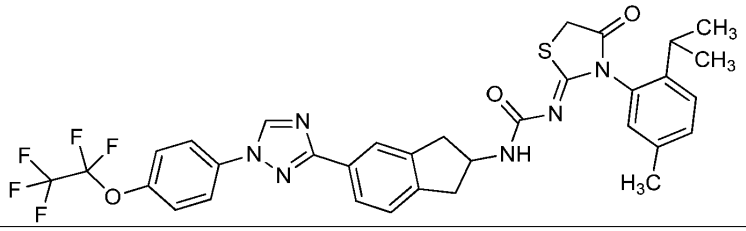
(G) R^{16} 및 R^{17}이 $(S)C^x(N^x)$와 함께 4 내지 8원 헤테로시클릴 고리를 형성하고,

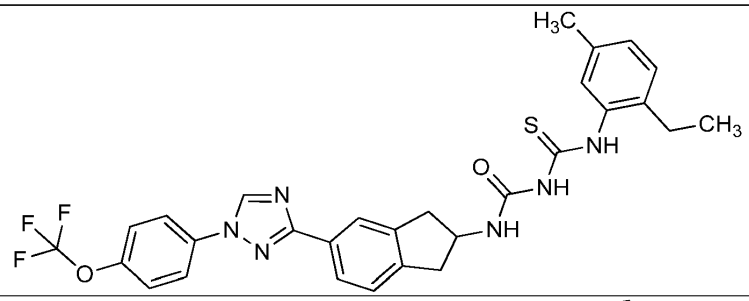
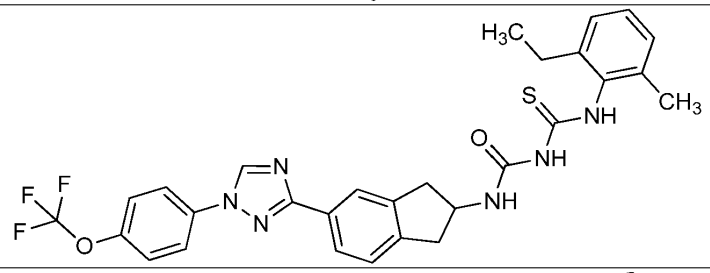
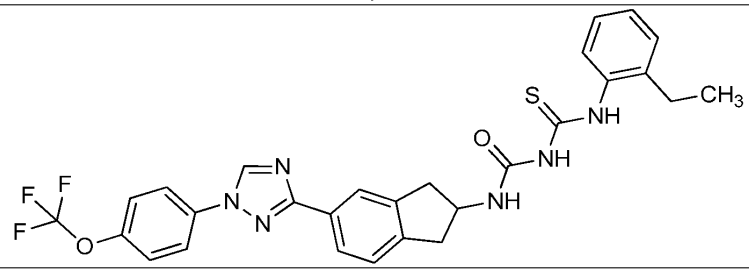
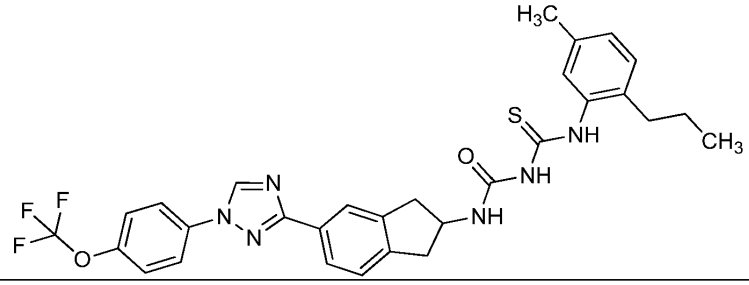
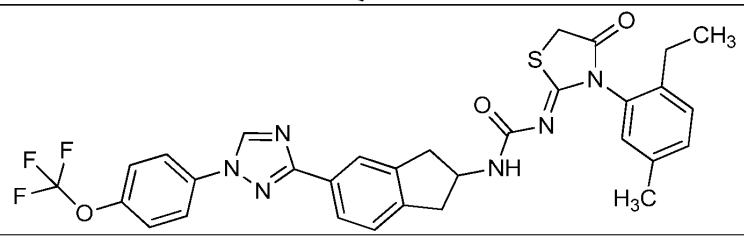
여기서 상기 헤테로시클릴 고리는 R^{18}로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환될 수 있고,

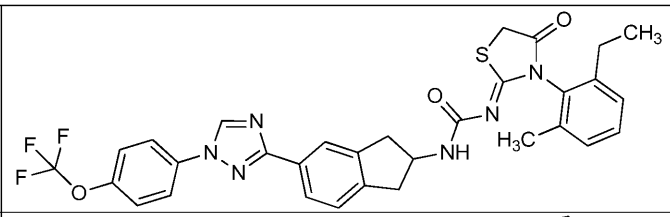
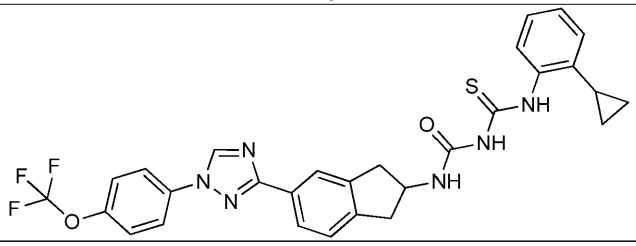
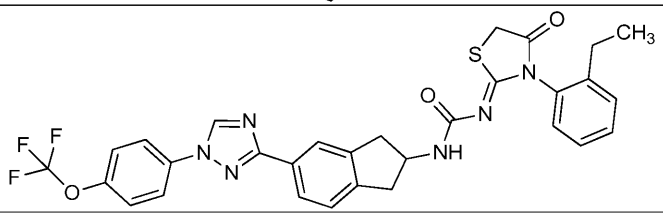
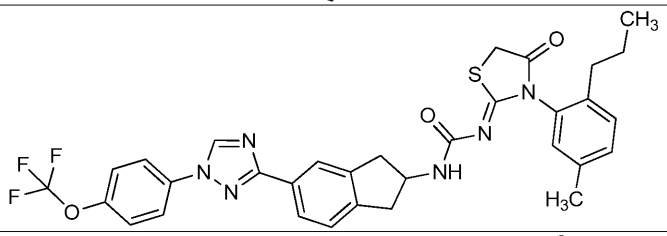
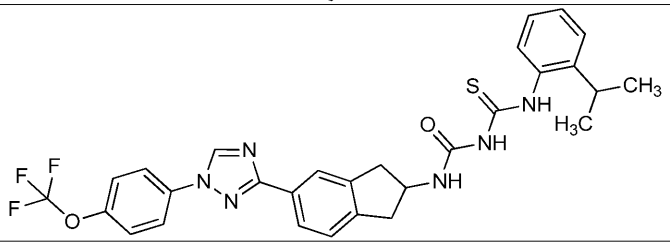
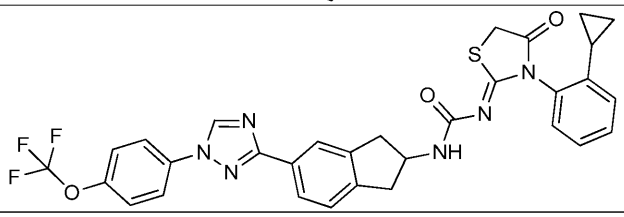
여기서 R^{18}은 H, CH_3, 및 옥소로 이루어진 군으로부터 선택되는 것인 분자.

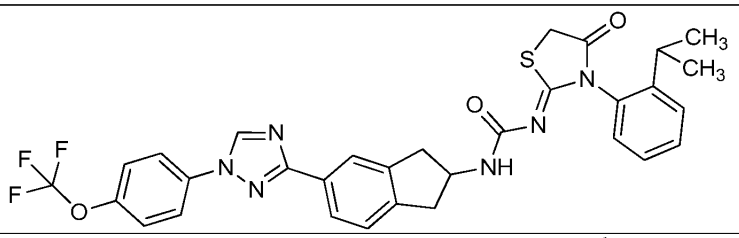
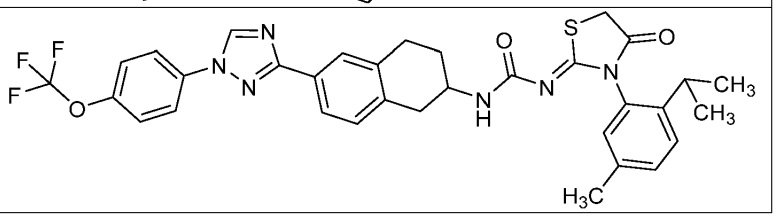
청구항 4

제1항에 있어서, 하기 분자 중 하나로부터 선택된 분자.

번호	구조
F1	
F2	
F3	
F4	

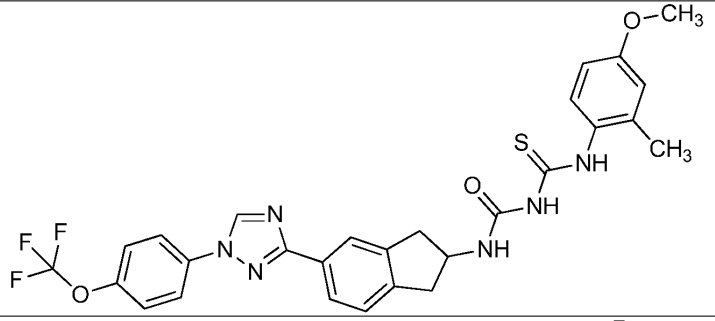
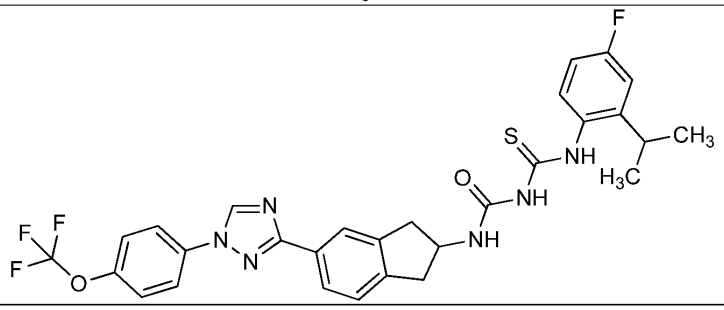
F5	
F6	
F7	
F8	
F9	

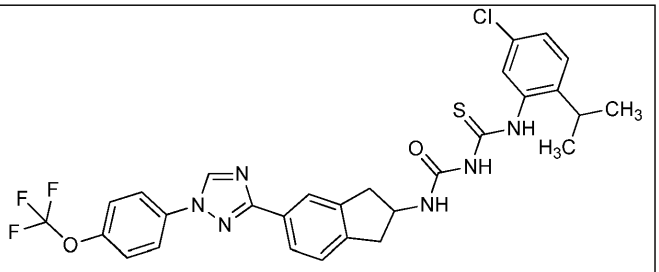
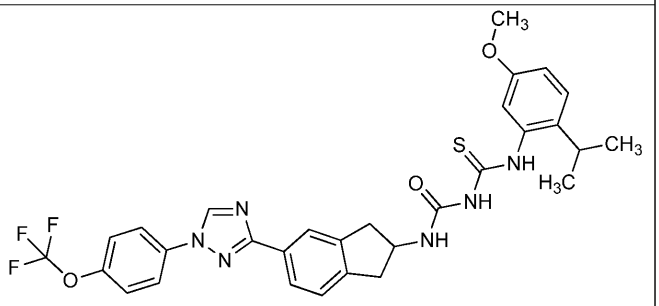
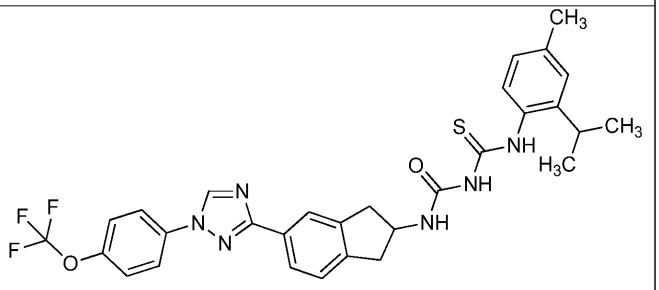
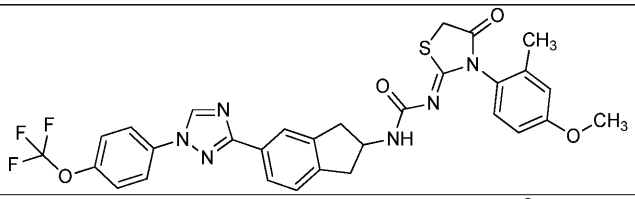
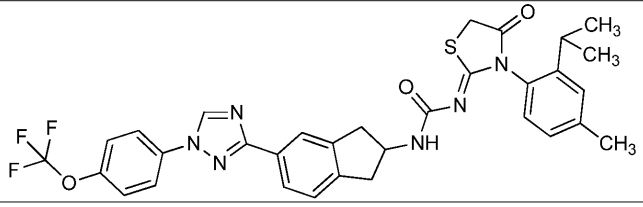
F10	
F11	
F12	
F13	
F14	
F15	

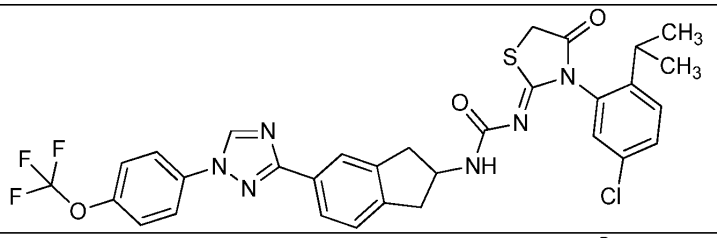
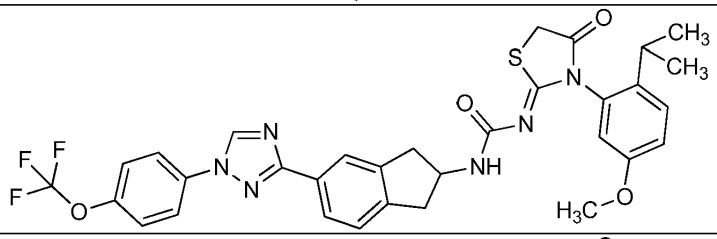
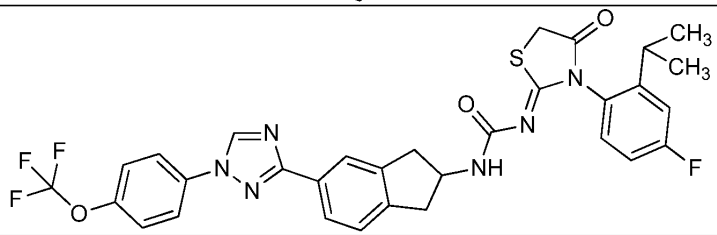
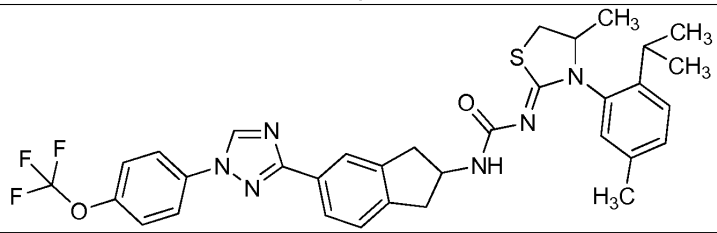
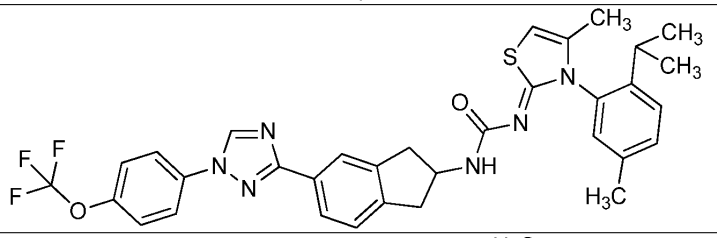
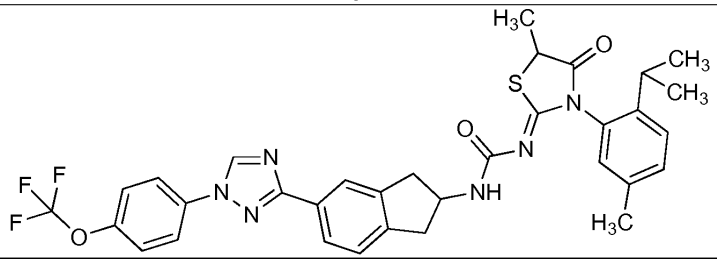
F16	
F17	

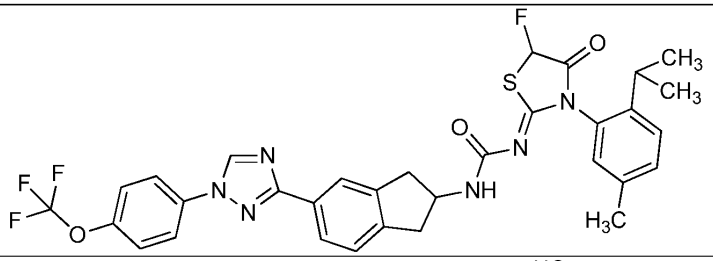
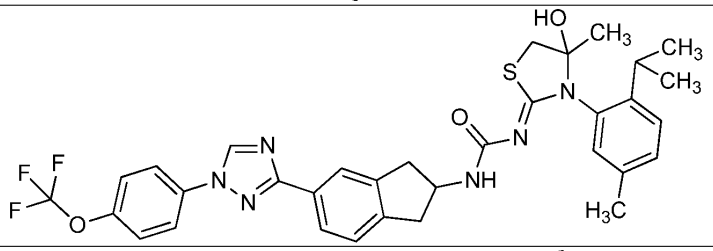
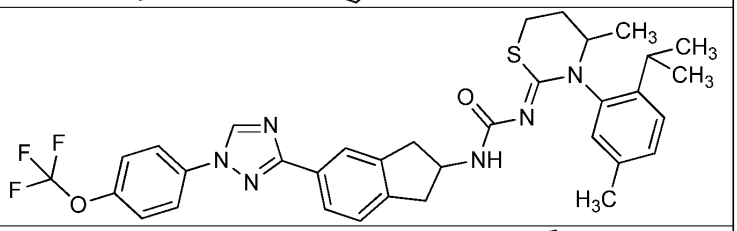
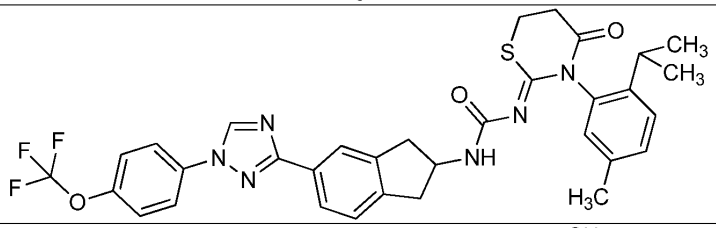
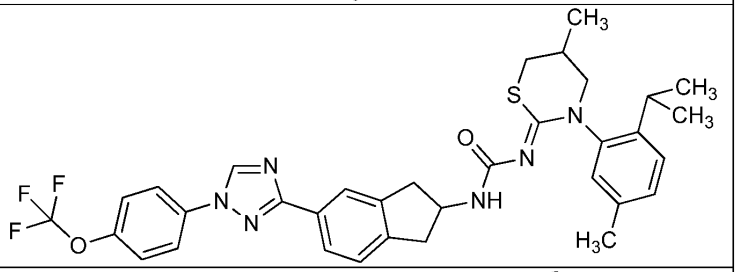
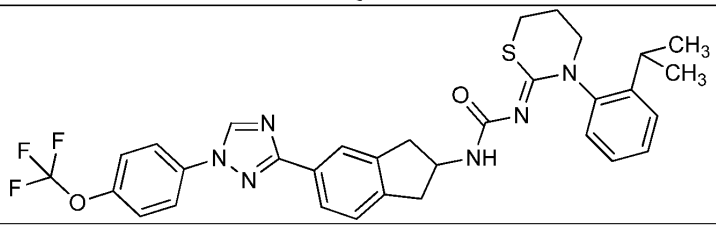
청구항 5

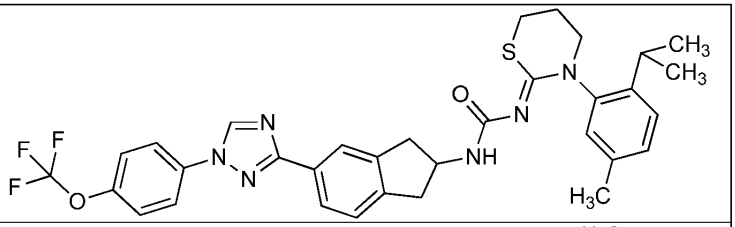
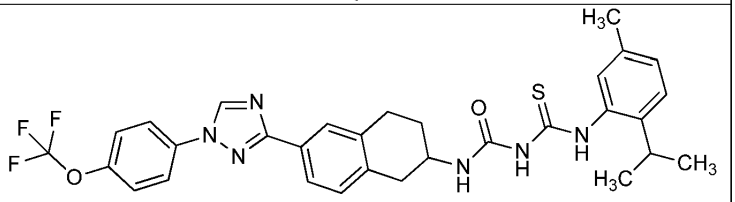
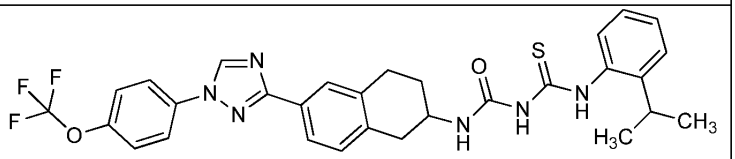
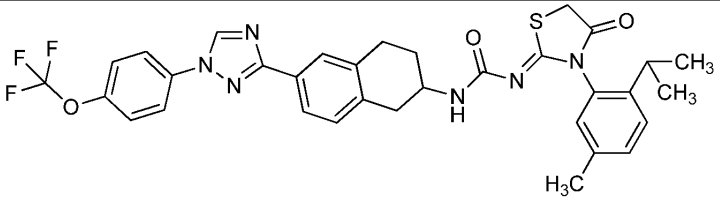
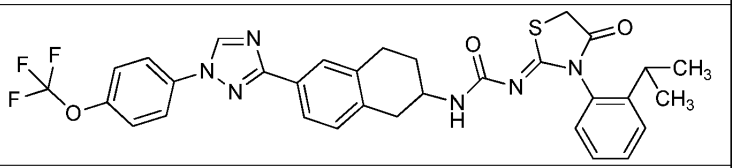
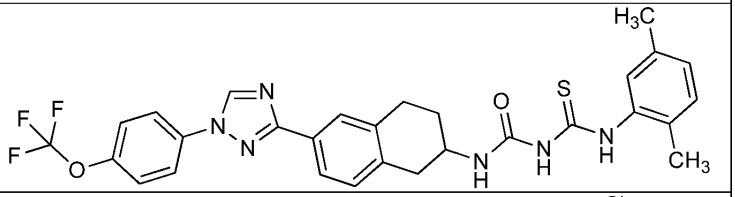
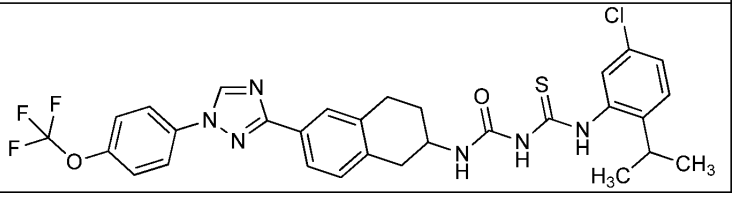
제1항에 있어서, 하기 분자 중 하나로부터 선택된 분자.

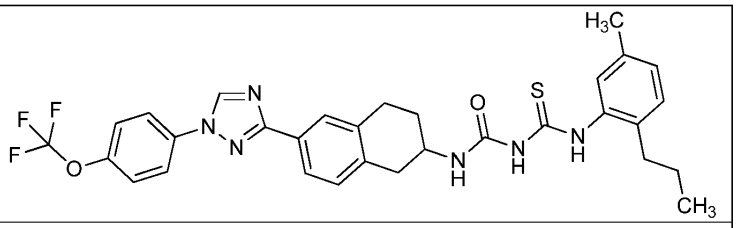
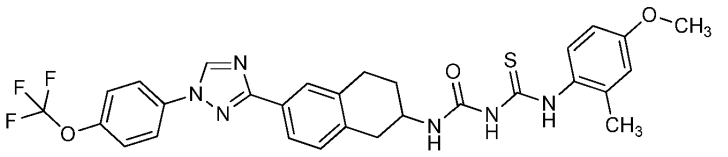
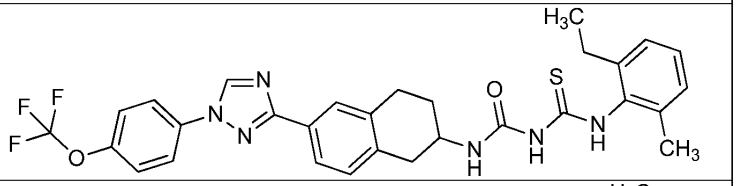
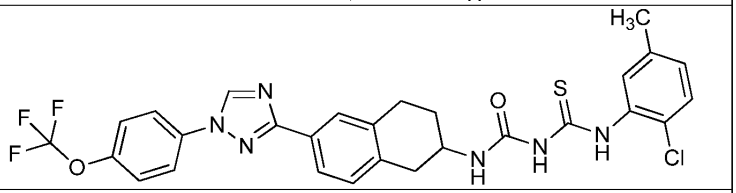
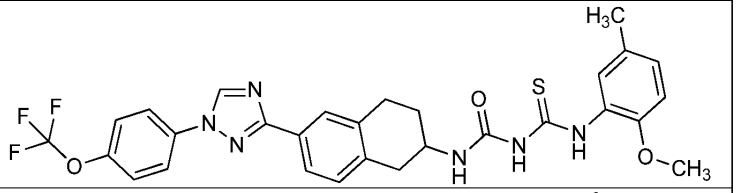
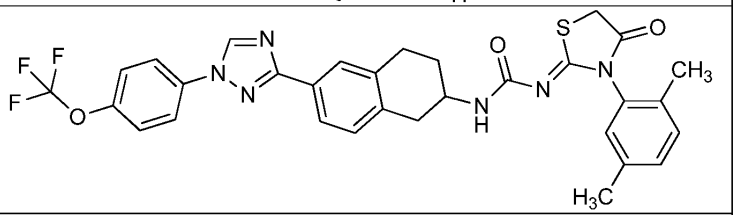
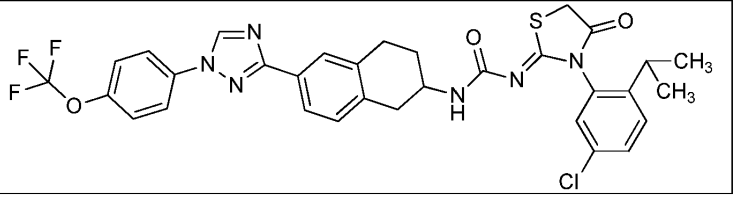
번호	구조
P1	
P2	

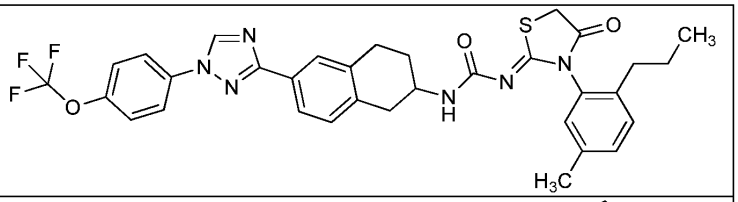
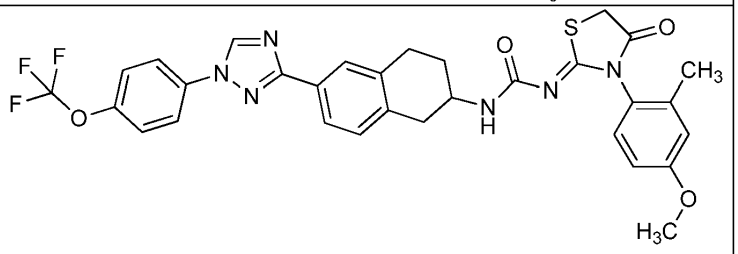
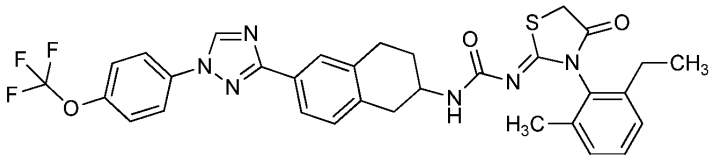
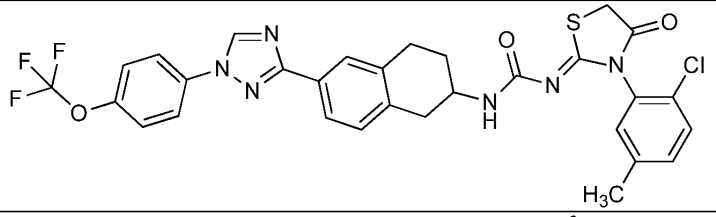
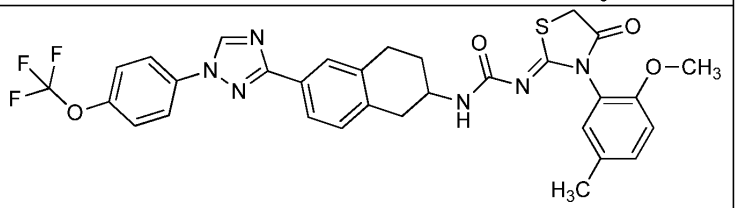
P3	
P4	
P5	
P6	
P7	

P8	
P9	
P10	
P11	
P12	
P13	

P14	
P15	
P16	
P17	
P18	
P19	

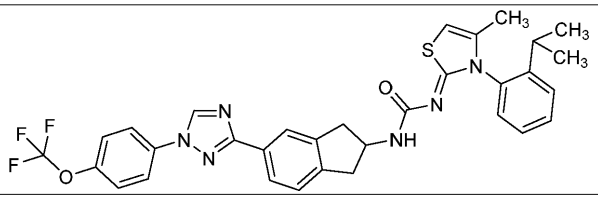
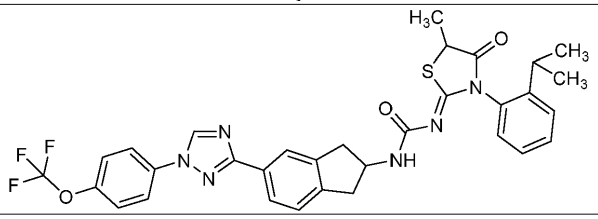
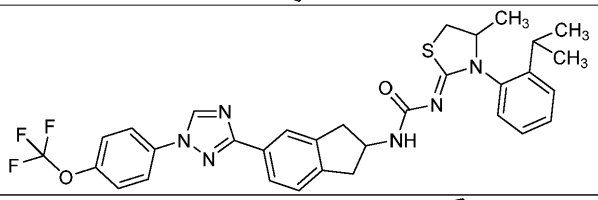
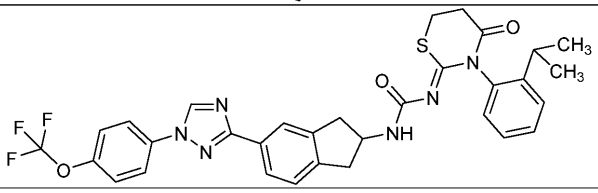
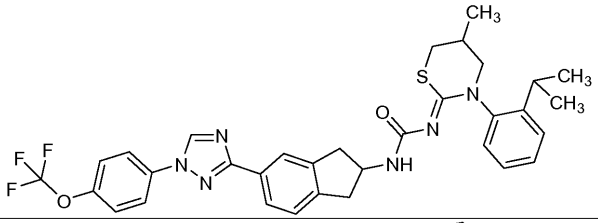
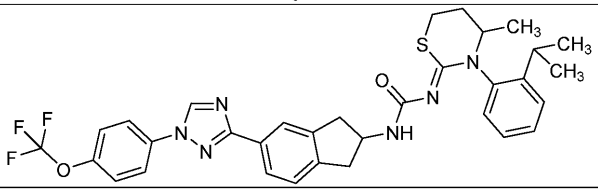
P20	
P21	
P22	
P23	
P24	
P25	
P26	

P27	
P28	
P29	
P30	
P31	
P32	
P33	

P34	
P35	
P36	
P37	
P38	

청구항 6

제1항에 있어서, 하기 분자 중 하나로부터 선택된 분자.

번호	구조
FA1	
FA2	
FA3	
FA4	
FA5	
FA6	

청구항 7

제1항 내지 제6항 중 어느 한 항에 따른 분자 및 담체를 포함하는 살충 조성물.

청구항 8

제7항에 있어서, 살진드기, 살조, 살금, 살박테리아, 살진균, 제초, 살곤충, 살연체동물, 살선충, 살서 및/또는 살바이러스 특성을 갖는 1종 이상의 화합물을 추가로 포함하는 살충 조성물.

청구항 9

제7항에 있어서, 1종 이상의 생물살충제를 추가로 포함하는 살충 조성물.

청구항 10

제7항에 있어서, 종자를 추가로 포함하는 살충 조성물.

청구항 11

제7항에 따른 살충 조성물을 해충을 방제하기 위한 생육지에 상기 해충을 방제하는데 충분한 양으로 적용하는 것을 포함하는 방법.

청구항 12

제11항에 있어서, 상기 해충이 개미, 진딧물, 딱정벌레, 좀, 바퀴벌레, 귀뚜라미, 집게벌레, 벼룩, 파리, 방아깨비, 매미충, 이, 메뚜기, 응애, 나방, 선충, 깍지벌레, 결합강, 흰개미, 총채벌레, 진드기, 말벌 및 가루이로부터 선택되는 것인 방법.

청구항 13

제11항에 있어서, 상기 해충이 LAPHEG, TRIPNI, MYZUPE, 또는 AEDSAE인 방법.

청구항 14

제11항에 있어서, 상기 생육지가

(a) 작물, 나무, 과일, 곡류, 사료 종, 포도나무, 잔디 및/또는 관상 식물이 성장하는 곳;

(b) 가축이 거주하는 곳;

(c) 건물 (예컨대 곡물이 저장되는 장소)의 내부 또는 외부 표면;

(d) 건물에 사용되는 건축 자재 (예컨대 주입 목재); 및/또는

(e) 건물 주위 토양

인 방법.

발명의 설명

기 술 분 야

[0001] 관련 출원에 대한 상호 참조

[0002] 본 출원은 그 전체 개시내용이 명백하게 본원에 참조로 포함되는 2014년 8월 26일에 출원된 미국 특허 가출원 일련 번호 62/041,685를 우선권 주장한다.

[0003] 개시내용의 분야

[0004] 본원에 개시된 본 발명은 살충제 (예를 들어, 살진드기제, 살곤충제, 살연체동물제, 및 살선충제)로서 유용한 분자의 제조 방법, 이러한 분자, 및 이러한 분자를 사용하여 해충을 방제하는 방법의 분야에 관한 것이다.

배 경 기 술

[0005] 해충으로 인해 매년 전세계적으로 수백만명의 인간이 사망한다. 또한, 농업에서의 손실을 유발하는 1만 종 초과의 해충이 존재한다. 전세계적 농업적 손실은 매년 수십억 미국 달러에 달한다.

[0006] 흰개미는 모든 종류의 개인 및 공공 구조물에 피해를 유발한다. 흰개미에 의한 전세계적 피해 손실은 매년 수십억 미국 달러에 달한다.

[0007] 저장 식품 해충은 저장 식품을 섭취하고 품질을 저하시킨다. 전세계적 저장 식품 손실은 매년 수십억 미국 달러에 달하지만, 보다 중요하게는 사람에게서 필요한 식품을 박탈한다.

[0008] 새로운 살충제가 시급히 요구되고 있다. 특정 해충은 현재 사용 중인 살충제에 대해 저항성이 발생하고 있다. 수백 종의 해충은 1종 이상의 살충제에 대해 저항성이 있다. 보다 오래된 살충제 중 일부, 예컨대 DDT, 카르바메이트, 및 유기포스페이트에 대한 저항성의 발생은 널리 공지되어 있다. 그러나, 심지어는 보다 새로운 살충제 중 일부, 예를 들어 이미다클로프리드에 대해서도 저항성이 발생된 바 있다.

[0009] 따라서, 상기 이유를 비롯한 수많은 이유로, 새로운 살충제에 대한 필요가 존재한다.

발명의 내용

[0010] 정의

[0011] 정의에 주어진 예는 일반적으로 비포괄적이며, 본원에 개시된 본 발명을 제한하는 것으로 해석되어서는 안된다. 치환기는 부착되는 특정한 분자와 관련하여 화학 결합 규칙 및 입체 상용성 제약에 따라야 하는 것으로 이해된다.

[0012] "알케닐"은 탄소 및 수소로 이루어진 비-시클릭 불포화 (적어도 1개의 탄소-탄소 이중 결합) 분지형 또는 비분지형 치환기, 예를 들어 비닐, 알릴, 부테닐, 펜테닐 및 헥세닐을 의미한다.

[0013] "알케닐옥시"는 탄소-산소 단일 결합으로 추가로 이루어진 알케닐, 예를 들어 알릴옥시, 부테닐옥시, 펜테닐옥시, 헥세닐옥시를 의미한다.

[0014] "알콕시"는 탄소-산소 단일 결합으로 추가로 이루어진 알킬, 예를 들어 메톡시, 에톡시, 프로폭시, 이소프로폭시, 부톡시, 이소부톡시 및 tert-부톡시를 의미한다.

[0015] "알킬"은 탄소 및 수소로 이루어진 비-시클릭 포화 분지형 또는 비분지형 치환기, 예를 들어 메틸, 에틸, n-프로필 및 이소프로필을 나타내는 (C_3)알킬, n-부틸, sec-부틸, 이소부틸, 및 tert-부틸을 나타내는 (C_4)알킬을 의미한다.

[0016] "알키닐"은 탄소 및 수소로 이루어진 비-시클릭 불포화 (적어도 1개의 탄소-탄소 삼중 결합), 분지형 또는 비분지형 치환기, 예를 들어 에티닐, 프로파르길, 부티닐 및 펜티닐을 의미한다.

[0017] "알키닐옥시"는 탄소-산소 단일 결합으로 추가로 이루어진 알키닐, 예를 들어 펜티닐옥시, 헥시닐옥시, 헵티닐옥시 및 옥티닐옥시를 의미한다.

[0018] "아릴"은 수소 및 탄소로 이루어진 시클릭 방향족 치환기, 예를 들어 페닐, 나프틸 및 비페닐을 의미한다.

[0019] "시클로알킬"은 탄소 및 수소로 이루어진 모노시클릭 또는 폴리시클릭 포화 치환기, 예를 들어 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 노르보르닐, 비시클로[2.2.2]옥틸 및 데카히드로나프틸을 의미한다.

[0020] "시클로알콕시"는 탄소-산소 단일 결합으로 추가로 이루어진 시클로알킬, 예를 들어 시클로프로필옥시, 시클로부틸옥시, 시클로펜틸옥시, 노르보르닐옥시 및 비시클로[2.2.2]옥틸옥시를 의미한다.

[0021] "할로"는 플루오로, 클로로, 브로모 및 아이오도를 의미한다

[0022] "할로알콕시"는 1 내지 최대 가능한 개수의 동일하거나 상이한 할로로 추가로 이루어진 알콕시, 예를 들어 플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 2,2-디플루오로프로폭시, 클로로메톡시, 트리클로로메톡시, 1,1,2,2-테트라플루오로에톡시 및 펜타플루오로에톡시를 의미한다.

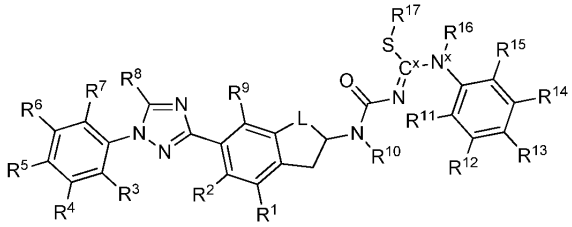
[0023] "할로알킬"은 1 내지 최대 가능한 개수의 동일하거나 상이한 할로로 추가로 이루어진 알킬, 예를 들어 플루오로메틸, 트리플루오로메틸, 2,2-디플루오로프로필, 클로로메틸, 트리클로로메틸 및 1,1,2,2-테트라플루오로에틸을 의미한다.

[0024] "헤테로시클릴"은 완전 포화, 부분 불포화, 또는 완전 불포화일 수 있는 시클릭 치환기를 의미하고, 여기서 시클릭 구조는 적어도 1개의 탄소 및 적어도 1개의 헤테로원자를 함유하고, 여기서 상기 헤테로원자는 질소, 황 또는 산소이다. 황의 경우에, 그 원자는 술폭시드 및 술폰과 같은 다른 산화 상태일 수 있다. 방향족 헤테로시클릴의 예는 벤조푸라닐, 벤조이소티아졸릴, 벤조이속사졸릴, 벤족사졸릴, 벤조티에닐, 벤조티아졸릴, 신놀리닐, 푸라닐, 이미다졸릴, 인다졸릴, 인돌릴, 이소인돌릴, 이소퀴놀리닐, 이소티아졸릴, 이속사졸릴, 옥사디아졸릴, 옥사졸리닐, 옥사졸릴, 프탈라지닐, 피라지닐, 피라졸리닐, 피라졸릴, 피리다지닐, 피리딜, 피리미디닐, 피롤릴, 퀴나졸리닐, 퀴놀리닐, 퀴녹살리닐, 테트라졸릴, 티아졸리닐, 티아졸릴, 티에닐, 트리아지닐 및 트리아졸릴을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 완전 포화 헤테로시클릴의 예는 피페라지닐, 피페리디닐, 모르폴리닐, 피롤리디닐, 옥세타닐, 테트라히드로푸라닐, 테트라히드로티에닐 및 테트라히드로피라닐을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 부분 불포화 헤테로시클릴의 예는 1,2,3,4-테트라히드로퀴놀리닐, 4,5-디히드로-옥사졸릴, 4,5-디히드로-1H-피라졸릴, 4,5-디히드로-이속사졸릴 및 2,3-디히드로-[1,3,4]-옥사디아졸릴을 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

[0025] 본원은 하기 화학식 ("화학식 1")을 갖는 분자를 개시한다.

[0026] <화학식 1>

[0027] 

[0028] 여기서

[0029] (A) R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, 및 R^9는 각각 독립적으로 H, F, Cl, Br, I, CN, NO_2, OH, (C_1-C_4)알킬, (C_2-C_4)알케닐, (C_2-C_4)알키닐, (C_1-C_4)할로알킬, (C_1-C_4)알콕시, (C_1-C_4)할로알콕시, (C_3-C_6)시클로알킬, 및 (C_3-C_6)시클로알콕시로 이루어진 군으로부터 선택되고,

[0030] 여기서 각각의 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 알콕시, 할로알콕시, 시클로알킬, 및 시클로알콕시는 F, Cl, CN, OH, 및 옥소로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환되고;

[0031] (B) R^8은 H이고;

[0032] (C) L은 F, Cl, CN, OH, 및 옥소로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환되는 (C_1-C_4)알킬이고;

[0033] (D) R^{10}은 H, (C_1-C_4)알킬, (C_2-C_4)알케닐, (C_2-C_4)알키닐, (C_1-C_4)할로알킬, $((C_1-C_4)$알킬$)((C_3-C_6)$시클로알킬), (C_1-C_4)알킬페닐, (C_1-C_4)알킬헤테로시클릴, $((C_1-C_4)$알킬$)O((C_1-C_4)$알킬), $((C_1-C_4)$알킬$)OC(O)((C_1-C_4)$알킬), $((C_1-C_4)$알킬$)OC(O)O((C_1-C_4)$알킬), C(O)$((C_1-C_4)$알킬), 및 C(O)페닐로 이루어진 군으로부터 선택되고,

[0034] 여기서 각각의 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 시클로알킬, 페닐, 및 헤테로시클릴은 F, Cl, CN, OH, 및 옥소로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환되고;

[0035] (E) R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, 및 R^{15}는 각각 독립적으로 H, F, Cl, Br, I, CN, NO_2, OH, (C_1-C_4)알킬, (C_2-C_4)알케닐, (C_2-C_4)알키닐, (C_1-C_4)할로알킬, (C_1-C_4)알콕시, (C_1-C_4)할로알콕시, (C_3-C_6)시클로알킬, 및 (C_3-C_6)시클로알콕시로 이루어진 군으로부터 선택되고;

[0036] (F) R^{16} 및 R^{17}은 각각 독립적으로 (G), H, (C_1-C_4)알킬, (C_2-C_4)알케닐, (C_2-C_4)알키닐, (C_1-C_4)할로알킬, $((C_1-C_4)$알킬$)((C_3-C_6)$시클로알킬), (C_1-C_4)알킬페닐, (C_1-C_4)알킬헤테로시클릴, $((C_1-C_4)$알킬$)C(O)((C_1-C_4)$알킬), 및 $((C_1-C_4)$알킬$)C(O)O((C_1-C_4)$알킬)로 이루어진 군으로부터 선택되고,

[0037] 여기서 각각의 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 시클로알킬, 페닐, 및 헤테로시클릴은 F, Cl, CN, OH, 및 옥소로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환되고;

[0038] (G) R^{16} 및 R^{17}은 $(S)C^x(N^x)$와 함께 4 내지 8원 헤테로시클릴 고리를 형성하고,

[0039] 여기서 상기 헤테로시클릴 고리는 R^{18}로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환될 수 있고,

[0040] 여기서 R^{18}은 H, F, Cl, Br, I, CN, OH, (C_1-C_4)알킬, 옥소, (C_1-C_4)알킬, (C_2-C_4)알케닐, (C_2-C_4)알키닐, (C_1-C_4)할로알킬, $((C_1-C_4)$알킬$)((C_3-C_6)$시클로알킬), (C_1-C_4)알킬페닐, (C_1-C_4)알킬헤테로시클릴, $((C_1-C_4)$알킬$)C(O)((C_1-C_4)$알킬), $((C_1-C_4)$알킬$)C(O)O((C_1-C_4)$알킬), 페닐, 및 헤테로시클릴로 이루어진 군으로부터 선택되

고,

[0041] 여기서 각각의 알킬, 알케닐, 알키닐, 할로알킬, 시클로알킬, 페닐, 및 헤테로시클릴은 F, Cl, Br, I, CN, OH, 및 옥소로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환된다.

[0042] 또 다른 실시양태에서 R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, 및 R^{14}는 H이다. 이 실시양태는 R^5, L, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0043] 또 다른 실시양태에서 R^5는 (C_1-C_4)할로알콕시이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0044] 또 다른 실시양태에서 R^5는 OCF_3 또는 OCF_2CF_3이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0045] 또 다른 실시양태에서 L은 $-CH_2-$ 또는 $-CH_2CH_2-$이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0046] 또 다른 실시양태에서 R^{11}은 (C_1-C_4)알킬이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0047] 또 다른 실시양태에서 R^{11}은 H 또는 CH_3이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0048] 또 다른 실시양태에서 R^{12}는 할로, (C_1-C_4)알킬, 또는 (C_1-C_4)알콕시이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0049] 또 다른 실시양태에서 R^{12}는 H, Cl, CH_3, 또는 OCH_3이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0050] 또 다른 실시양태에서 R^{13}은 할로, (C_1-C_4)알킬, 또는 (C_1-C_4)알콕시이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0051] 또 다른 실시양태에서 R^{13}은 H, F, CH_3, 또는 OCH_3이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0052] 또 다른 실시양태에서 R^{15}는 할로, (C_1-C_4)알킬, (C_3-C_6)시클로알킬, 또는 (C_1-C_4)알콕시이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{16}, R^{17}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0053] 또 다른 실시양태에서 R^{15}는 Cl, CH_3, CH_2CH_3, $CH_2CH_2CH_3$, $CH(CH_3)_2$, 시클로프로필, 또는 OCH_3이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{16}, R^{17}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0054] 또 다른 실시양태에서 R^{16}은 H이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{17}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0055] 또 다른 실시양태에서 R^{16} 및 R^{17}은 함께 $-C(R^{18})-C(R^{18})-$, $-C(R^{18})-C(R^{18})-C(R^{18})-$, 또는 $-C(R^{18})=C(C\ R^{18})-$이다.

이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, 및 R^{15}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0056] 또 다른 실시양태에서 R^{17}은 H이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, 및 R^{18}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0057] 또 다른 실시양태에서 R^{18}은 (C_1-C_4)알킬이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, 및 R^{17}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0058] 또 다른 실시양태에서 R^{18}은 H, F, CH_3, OH, 또는 옥소이다. 이 실시양태는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, 및 R^{17}의 다른 실시양태와 조합되어 사용될 수 있다.

[0059] 또 다른 실시양태에서

[0060] (A) R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, 및 R^9는 각각 독립적으로 H 및 (C_1-C_4)할로알콕시로 이루어진 군으로부터 선택되고;

[0061] (B) R^8은 H이고;

[0062] (C) L은 (C_1-C_4)알킬이고;

[0063] (D) R^{10}은 H이고;

[0064] (E) R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, 및 R^{15}는 각각 독립적으로 H, F, Cl, Br, I, (C_1-C_4)알킬, 및 (C_3-C_6)시클로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되고;

[0065] (F) R^{16} 및 R^{17}은 (G) 또는 H이고;

[0066] (G) R^{16} 및 R^{17}은 $(S)C^x(N^x)$와 함께 4 내지 8원 헤테로시클릴 고리를 형성하고,

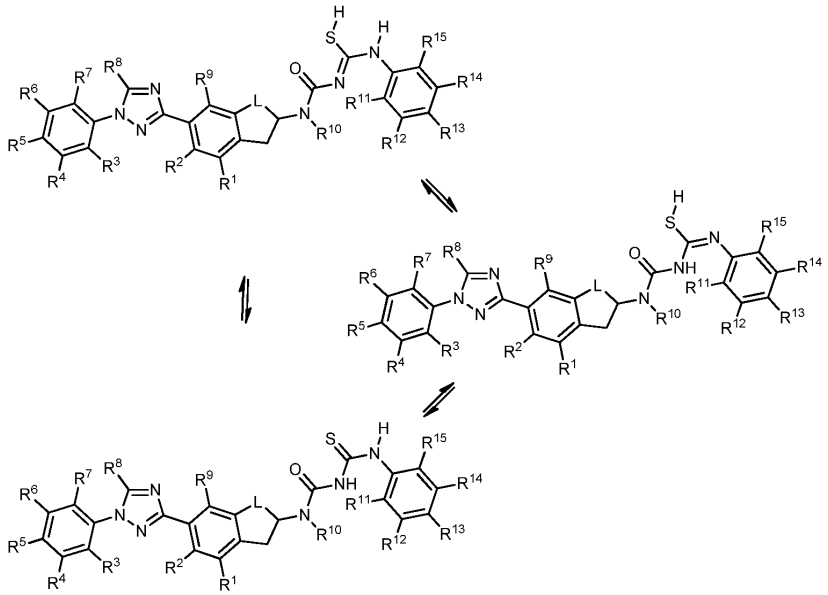
[0067] 여기서 상기 헤테로시클릴 고리는 R^{18}로부터 독립적으로 선택된 1개 이상의 치환기로 임의로 치환될 수 있고,

[0068] 여기서 R^{18}은 H, CH_3, 및 옥소로 이루어진 군으로부터 선택된다.

[0069] 화학식 1의 분자의 제조

[0070] 다수의 화학식 1의 분자가 R^{16} 및 R^{17}이 H인 경우와 같은 2종 이상의 호변이성질체 형태로 도시될 수 있다 (반응식 TAU). 반응식을 단순화하기 위해, 모든 분자를 단일 호변이성질체로 존재하는 것으로 도시하였다. 임의의 모든 효과적으로 접근가능한 호변이성질체가 이 화학식 1의 범위 내에 포함되며, 분자가 도시된 호변이성질체 형태로서 존재하는지 여부에 대해서는 추론하지 않는다.

[0071] 반응식 TAU

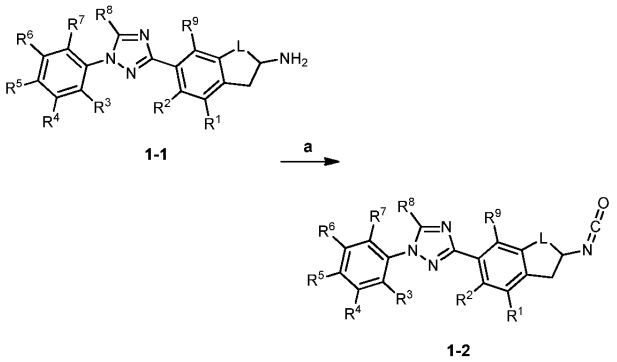


[0072]

[0073] 화학식 1의 분자는 일반적으로 약 400 달톤 내지 약 1200 달톤의 분자 질량을 가질 것이다.

[0074] 티오뷰렛의 제조

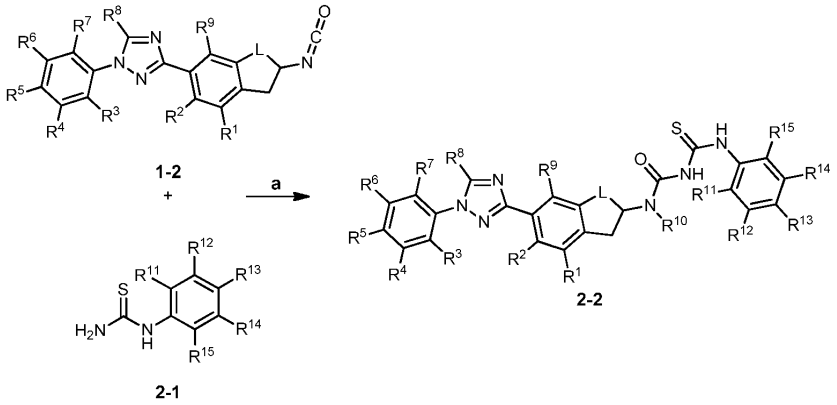
[0075] 반응식 1



[0076]

[0077] 본원에 개시된 티오뷰렛은 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, 및 L이 이전에 개시된 바와 같은 것인 상응하는 이소시아네이트 1-2로부터 제조된다. 전형적으로, 이소시아네이트 1-2는 단리되지 않지만, 대신 적합한 전구체로부터 제자리에서 생성되고 티오뷰렛의 제조에 직접 사용된다. 적합한 전구체는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, 및 L이 이전에 개시된 바와 같은 것인 아민 1-1이며, 이는 혼합된 용매계, 예컨대 디클로로메탄 및 물 또는 디에틸 에테르 및 물 중에서 염기, 예컨대 중탄산나트륨 또는 트리에틸아민의 존재 하에 약 -10℃ 내지 약 50℃의 온도에서 여러 통상의 시약, 예컨대 포스겐, 디포스겐 또는 트리포스겐 중 하나를 사용하여 이소시아네이트 1-2로 전환시킬 수 있다 (반응식 1, 단계 1a).

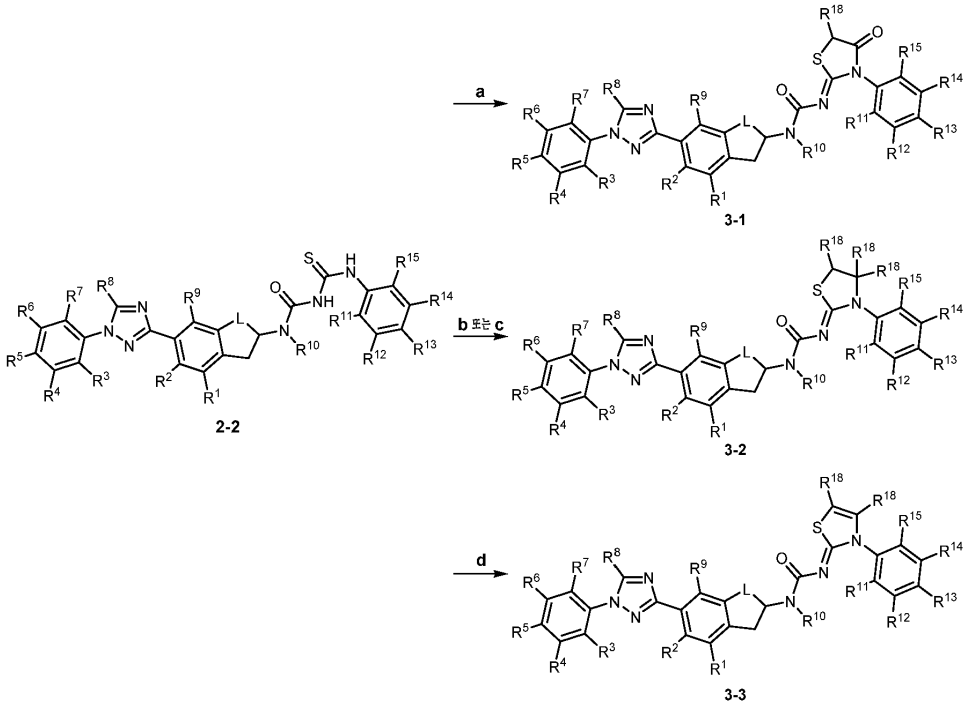
[0078] 반응식 2



[0079]

[0080] 이소시아네이트 1-2는 약 0.1 당량 내지 약 2 당량의 무기 염기, 예컨대 탄산세슘 또는 수소화나트륨의 존재 하에 R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, 및 R^{15}가 이전에 개시된 바와 같은 것인 N-아릴 티오우레아 2-1로 직접 처리하고, 이에 따라 R^{1}, R^{2}, R^{3}, R^{4}, R^{5}, R^{6}, R^{7}, R^{8}, R^{9}, L, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, 및 R^{15}가 이전에 개시된 바와 같은 것인 티오뷰렛 2-2가 형성될 수 있다 (반응식 2, 단계 2a). 반응은 약 0℃ 내지 약 100℃, 바람직하게는 약 20℃ 내지 약 80℃의 온도에서 아세토니트릴, 아세톤, 톨루엔, 테트라히드로푸란, 1,2-디클로로에탄, 디클로로메탄 또는 그의 혼합물로부터 선택된 비양성자성 용매 또는 용매 혼합물 중에서 수행할 수 있으나, 아세토니트릴의 사용이 바람직하다.

[0081] 반응식 3

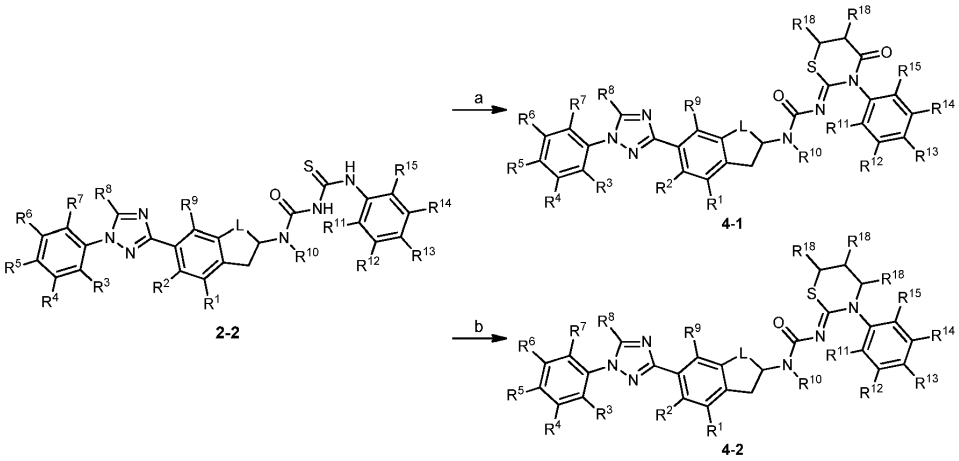


[0082]

[0083] 제자리에서 생성된 티오뷰렛 2-2는 정제하지 않고 직접 고리화된 유사체로 전환될 수 있거나 (반응식 3, 단계 3a), 또는 고리화 전에 반응 매질로부터 단리될 수 있다. 고리화는 α-할로 에스테르, 예컨대 메틸 브로모아세테이트로 처리하여 R^{1}, R^{2}, R^{3}, R^{4}, R^{5}, R^{6}, R^{7}, R^{8}, R^{9}, L, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, 및 R^{18}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 2-이미노 1,3-티아졸린-4-온 3-1을 형성시키거나 (단계 a); 이웃자리 디할라이드, 예컨대 1-브로모-2-클로로에탄 또는 1,2-디클로로에탄으로 처리하여 R^{1}, R^{2}, R^{3}, R^{4}, R^{5}, R^{6}, R^{7}, R^{8}, R^{9}, L, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, 및 R^{18}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 2-이미노-1,3-티아졸린 3-2를 형성시키거나 (단계 3b); α-할로 케

톤, 예컨대 클로로아세톤으로 처리하여 2-이미노-1,3-티아졸리놀 3-2를 형성시키거나 (단계 3c); 또는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, 및 R^{18}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 2-이미노-1,3-티아졸 3-3을 형성시킴 (단계 3d)으로써 달성될 수 있다. 단계 a에서, 양성자성 용매, 예컨대 에탄올 또는 메탄올 중에서 약 20℃ 내지 약 70℃ 범위의 온도에서 아세트산나트륨을 사용하는 것이 바람직하다. 단계 b에서, 용매, 예컨대 아세토니트릴 또는 2-부타논 중에서 약 0℃ 내지 약 80℃의 온도에서 무기 염기, 예컨대 탄산칼륨을 사용하는 것이 바람직하다.

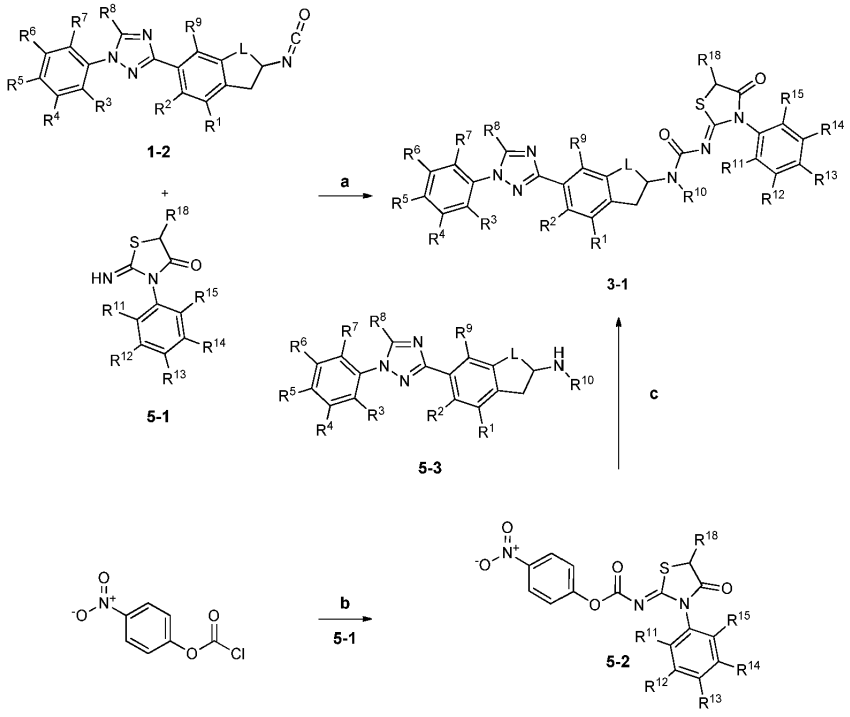
[0084] 반응식 4



[0085]

[0086] 고리화는 또한 티오우레아 2-2를 α,β-불포화 산 클로라이드, 예컨대 아크릴로일 클로라이드로 처리하여 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, 및 R^{18}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 2-이미노-1,3-티아지논 4-1을 형성시키거나 (반응식 4, 단계 4a) 또는 1,3-디할로프로판, 예컨대 1-브로모-3-클로로-프로판으로 처리하여 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, 및 R^{18}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 2-이미노-1,3-티아지난 4-2를 형성시킴으로써 달성될 수 있다 (단계 4b).

[0087] 반응식 5

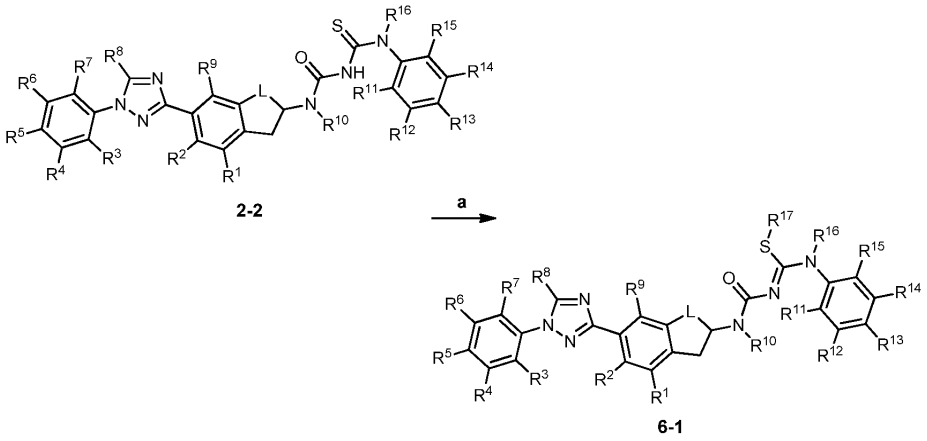


[0088]

[0089] 일반 구조 3-1을 갖는 유사체를 제조하는 대안적 방법이 반응식 5에 기재된다. R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, 및 R^{18}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 2-이미노티아졸리딘-4-온 5-1은 염기의 부재 하에 또는 약 0.1 당량 내지 약 2 당량의 무기 염기, 예컨대 탄산세슘 또는 수소화나트륨의 존재 하에 이소시아네이트 1-2로 직접 처리하고, 이에 따라 고리화된 티오뷰렛 3-1이 형성될 수 있다 (단계 5a). 반응은 약 0℃ 내지 약 100℃, 바람직하게는 약 20℃ 내지 약 80℃의 온도에서 아세토니트릴, 아세톤, 톨루엔, 테트라히드로푸란, 1,2-디클로로에탄, 디클로로메탄, 또는 그의 혼합물로부터 선택된 비양성자성 용매 또는 용매 혼합물 중에서 수행할 수 있으나, 아세토니트릴의 사용이 바람직하다.

[0090] 대안적으로, 2-이미노티아졸리딘-2-온 5-1은 4-니트로페닐 클로로포르메이트와 반응하여, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, 및 R^{18}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 4-니트로페닐 카르바메이트 5-2를 형성할 수 있다 (단계 5b). 이 반응은 극성 비양성자성 용매, 예컨대 테트라히드로푸란, 디옥산, 또는 아세토니트릴 중에서 약 0.1 당량 내지 약 2 당량의 무기 염기, 예컨대 탄산세슘 또는 탄산칼륨의 존재 하에, 바람직하게는 약 실온에서 등몰량의 2-이미노티아졸리딘-2-온 5-1 및 클로로포르메이트를 사용하여 수행할 수 있다. 4-니트로페닐 카르바메이트 5-2는 여과 및 여과물의 농축에 의해 단리될 수 있거나, 또는 4-니트로페닐 카르바메이트 5-2는 단계 5c에 직접 사용될 수 있다. 4-니트로페닐 카르바메이트 5-2를 R^{1}, R^{2}, R^{3}, R^{4}, R^{5}, R^{6}, R^{7}, R^{8}, R^{9}, L, 및 R^{10}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 트리아릴 아민 5-3으로 처리하여 고리화된 티오뷰렛 3-1을 생성시킬 수 있다. 단계 5c는 또한 무기 염기, 예컨대 탄산세슘 또는 탄산칼륨의 존재 하에 약 0.1 당량 내지 약 2 당량, 바람직하게는 약 1 당량 내지 약 1.2 당량에서 약 0℃ 내지 약 100℃, 바람직하게는 약 실온에서 수행할 수 있다.

[0091] 반응식 6

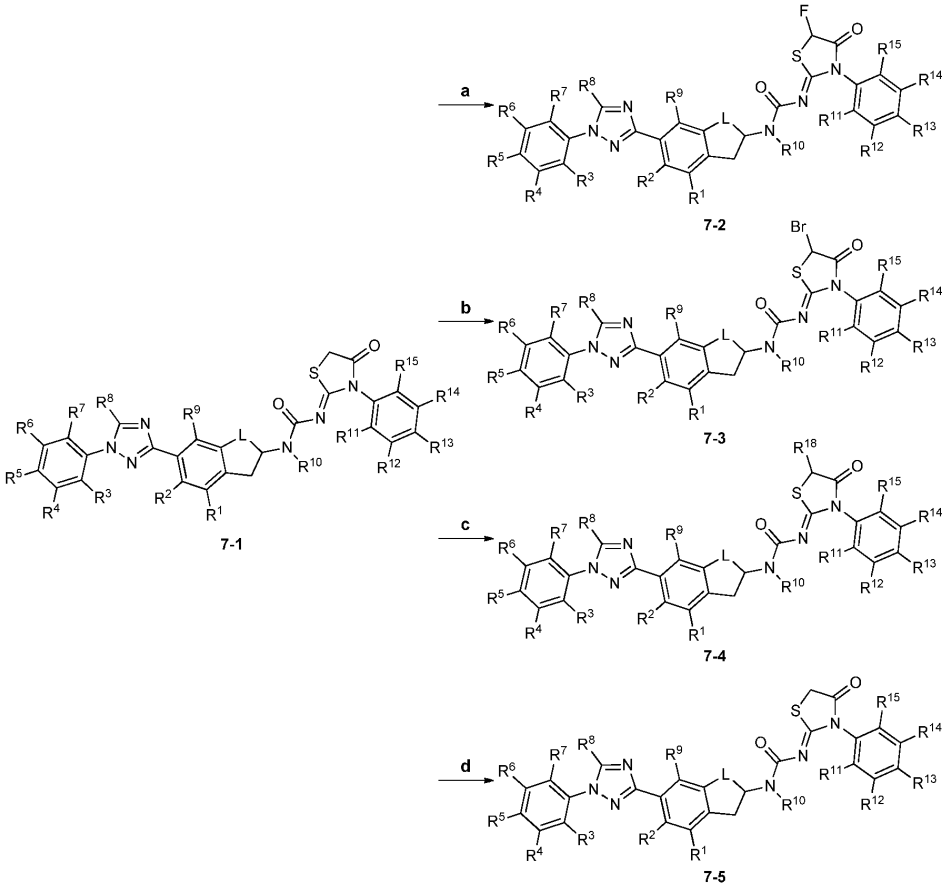


[0092]

[0093] 티오뷰렛 2-2는 양성자성 용매, 예컨대 에탄올 중에서 염기, 예컨대 아세트산나트륨의 존재 하에 약 0℃ 내지 약 60℃의 온도에서 R17이 이전에 개시된 바와 같은 것인 R^{17}-할로로 처리하고, 이에 따라 R^{1}, R^{2}, R^{3}, R^{4}, R^{5}, R^{6}, R^{7}, R^{8}, R^{9}, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, 및 R^{17}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 S-알킬화된 티오뷰렛 6-1이 생성될 수 있다 (반응식 6, 단계 6a).

[0094] 치환된 티오뷰렛의 제조

[0095] 반응식 7

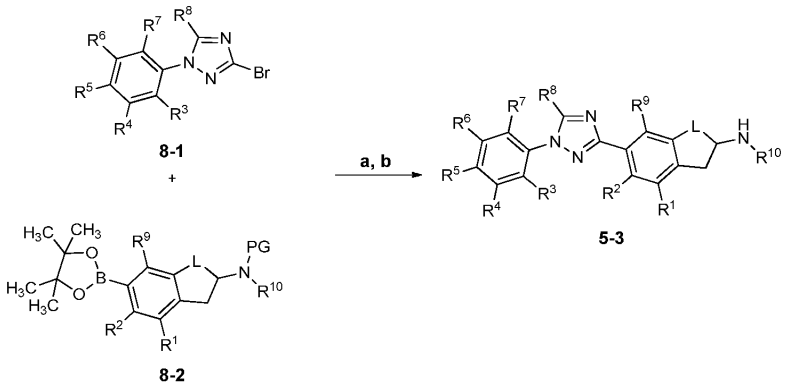


[0096]

[0097] R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, 및 R^{15}가 이전에 개시된 바와 같은 것인 2-이미노 1,3-티아졸린-4-온 7-1은 셀렉트플루오르(Selectfluor)® 및 9-플루오레논으로 무수 아세토니트릴 중에서 처리하고 (JACS. 2013, 135, 17494.), 이에 따라 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, 및 R^{15}가 이전에 개시된 바와 같은 것인 모노-플루오로 유사체 7-2가 제공될 수 있다 (반응식 7, 단계 7a). 비양성자성 용매, 예컨대 디클로로메탄 중에서 약 0℃ 내지 약 30℃ 범위의 온도에서 분자 브로민으로 처리하여 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, 및 R^{15}가 이전에 개시된 바와 같은 것인 모노-브로모 유사체 7-3을 제공할 수 있다 (단계 7b). 극성 비양성자성 용매, 예컨대 디메틸포름아미드 또는 테트라히드로푸란 중에서 R^{18}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 약 1 당량 또는 약 2 당량의 알킬화제 R^{18}-할로, 및 강염기, 예컨대 수소화나트륨 또는 리튬 디이소프로필아미드를 사용하는 알킬화는 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, 및 R^{18}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 모노 또는 디-알킬화된 유사체 7-4를 생성시킬 수 있다 (단계 7c). R^{10}이 H인 2-이미노 1,3-티아졸린-4-온 7-1은 용매, 예컨대 디클로로메탄 중에서 파라포름알데히드 및 트리플루오로아세트산으로 처리한 후에 산 클로라이드로 처리하고, 이에 따라 R^{10}이 $CH_2OCO(C_1$-C_4 알킬)이고 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, L, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, 및 R^{18}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 2-이미노 1,3-티아졸린-4-온 7-5가 제공될 수 있다 (단계 7d). 마찬가지로, R^{10}이 H인 2-이미노 1,3-티아졸린-4-온 7-1은 염기의 존재 하에 용매, 예컨대 디클로로메탄 중에서 산 클로라이드로 처리하고, 이에 따라 R^{10}이 C(O)($(C_1$-C_4)알킬) 또는 C(O)페닐인 2-이미노 1,3-티아졸린-4-온 7-5가 제공될 수 있다 (단계 7d).

[0098] 트리시클릭 아민 전구체의 제조

[0099] 반응식 8

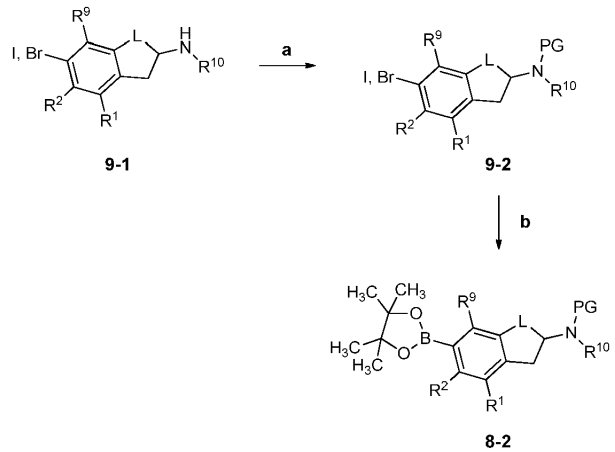


[0100]

[0101] 화학식 1의 분자의 제조에 필요한 트리시클릭 아민의 제조 방법이 반응식 8에 기재된다. R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, 및 R^8이 이전에 개시된 바와 같은 것인 브로모-헤테로사이클 8-1의, PG가 아민 보호기, 예컨대 tert-부톡시카르보닐 (Boc) 또는 벤질옥시카르보닐 (Cbz)이고 R^1, R^2, R^9, L, 및 R^{10}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 보로네이트 에스테르 8-2와의 커플링은 염기, 예컨대 중탄산나트륨, 인산칼륨, 또는 플루오린화세슘의 존재 하에 적합한 용매계, 예컨대 디옥산 및 물 중에서 통상의 또는 마이크로웨이브 가열을 사용하여 약 50℃ 내지 약 120℃의 온도에서 팔라듐 촉매 및 포스핀 리간드를 사용하여 달성되고, 이에 따라 N-보호된 아미노알킬페닐 중간체가 형성될 수 있다 (반응식 7, 단계 7a). tert-부톡시카르보닐 기의 탈보호는 강산, 예컨대 염화수소 또는 트리플루오로아세트산을 사용하는 산성 조건 하에서, 이어서 염기, 예컨대 중탄산나트륨 또는 수산화나트륨을 사용하는 유리 염기화에 의해 달성되고, 이에 따라 트리아릴 아민 5-3가 생성될 수 있다 (단계 b). 벤질옥시카르보닐 기의 탈보호는 수소와 전이 금속 촉매, 예컨대 팔라듐(0)을 사용하는 표준 조건 하에서 달성될 수 있다. 이 반응 순서가 아민 1-1의 합성에 적용될 수 있는 것으로 이해된다.

[0102] 보로네이트 에스테르의 제조

[0103] 반응식 9



[0104]

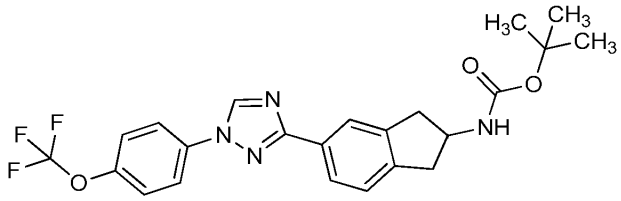
[0105] R^1, R^2, R^9, L, R^{10}, 및 PG가 이전에 개시된 바와 같은 것인 보호된 아릴 아민 9-2는 염기, 예컨대 트리에틸아민의 존재 하에 약 -10℃ 내지 약 50℃의 온도에서 용매, 예컨대 디클로로메탄 중에서 R^1, R^2, R^9, L, 및 R^{10}이 이전에 개시된 바와 같은 것인 아릴 아민 9-1을 활성화된 질소 보호기, 예컨대 디-tert-부톡시디카르보닐 또는 벤질옥시카르보닐 클로라이드로 처리하여 제조될 수 있다 (반응식 9, 단계 9a). 보로네이트 에스테르 8-2는 아릴 아민 9-1로부터 미야우라 조건을 사용하여 제조될 수 있다 (단계 9b). 미야우라 커플링 조건 하에 상용성인 것으로 알려진 표준 질소 보호기가 사용될 수 있다.

[0106] 실시예

[0107] 이들 실시예는 예시 목적을 위한 것이며, 본 개시내용이 단지 이들 실시예에 개시된 실시양태만으로 제한되는 것으로 해석되어서는 안 된다.

[0108] 상업적 공급원으로부터 입수한 출발 물질, 시약 및 용매를 추가로 정제하지 않고 사용하였다. 무수 용매는 알드리치(Aldrich)로부터의 슈어/실(Sure/Seal)™로 구입하였고, 제공받은 대로 사용하였다. 융점은 스탠포드 리서치 시스템즈(Stanford Research Systems)로부터의 토마스 후버 유니멜트(Thomas Hoover Unimelt) 모세관 융점 장치 또는 옵티멜트(OptiMelt) 자동화 융점 시스템 상에서 얻었고, 보정하지 않는다. "실온"을 사용하는 실시예는 약 20℃ 내지 약 24℃ 범위의 온도를 갖는 기후 제어 실험실에서 수행하였다. 분자는 아이시스 드로우(ISIS Draw), 켐드로우(ChemDraw) 또는 ACD 네임 프로(ACD Name Pro) 내의 명명 프로그램에 따라 명명된, 그의 공지된 명칭이 주어진다. 이러한 프로그램이 분자를 명명할 수 없는 경우에, 분자는 통상의 명명 규칙을 사용하여 명명되었다. 달리 언급되지 않는 한, ^{1}H NMR 스펙트럼 데이터는 ppm (δ) 단위이고, 300, 400 또는 600 MHz에서 기록되었고; ^{13}C NMR 스펙트럼 데이터는 ppm (δ) 단위이고, 75, 100 또는 150 MHz에서 기록되었고, ^{19}F NMR 스펙트럼 데이터는 ppm (δ) 단위이고, 376 MHz에서 기록되었다.

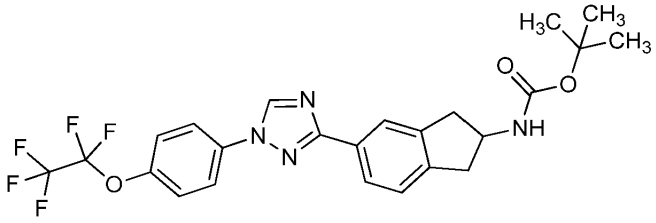
[0109] 실시예 1: tert-부틸 (5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)카르바메이트 (C1)의 제조



[0110]

[0111] 교반 막대 및 질소가 장착된 둥근-바닥 플라스크 (100 mL) 중의 3-브로모-1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸 (2.75 g, 8.93 mmol), tert-부틸 (5-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-디옥사보롤란-2-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)카르바메이트 (3.21 g, 8.93 mmol), 중탄산나트륨 (1.50 g, 17.9 mmol), 디옥산 (45 mL) 및 물 (15 mL)에 테트라키스(트리페닐포스핀)팔라듐(0) (1.03 g, 0.893 mmol)을 첨가하였다. 반응 용기를 진공으로 배기시키고, 질소 (2x)로 퍼징하였다. 반응물을 80℃로 밤새 가열하였다. 반응물을 냉각시키고, 에틸 아세테이트로 희석하고, 물로 세척하였다. 수성 층을 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 0-40% 에틸 아세테이트/B (여기서 B = 1:1 디클로로메탄/헥산)를 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 백색 고체로서 수득하였다 (2.10 g, 51%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (s, 1H), 8.05 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.01 (dd, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.83 - 7.77 (m, 2H), 7.39 (dt, J = 7.9, 1.0 Hz, 2H), 7.32 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 4.78 (s, 1H), 4.53 (s, 1H), 3.43 - 3.22 (m, 2H), 2.85 (ddd, J = 15.9, 10.1, 4.9 Hz, 2H), 1.45 (s, 9H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.03; ESIMS m/z 461 ($[M+H]^+$).

[0112] 실시예 2: tert-부틸 (5-(1-(4-(퍼플루오로에톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)카르바메이트 (C2)의 제조

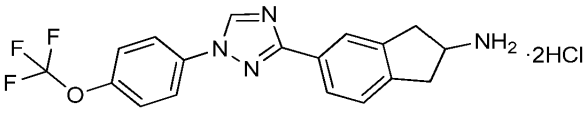


[0113]

[0114] 바이알 (20 mL) 중의 3-브로모-1-(4-(퍼플루오로에톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸 (0.409 g, 1.14 mmol), tert-부틸 (5-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-디옥사보롤란-2-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)카르바메이트 (0.411 g, 1.14 mmol), 중탄산나트륨 (0.0960 g, 1.14 mmol), 테트라키스(트리페닐포스핀)팔라듐(0) (0.132 g, 0.114 mmol), 디옥산 (6 mL), 및 물 (2 mL)을 캡핑하고, 용기의 측면으로부터의 외부 IR-센서 온도 모니터링과 함께 바이오타지 이니시에이터® 마이크로웨이브 반응기에서 140℃에서 30분 동안 가열하였다. 반응물을 에틸 아세

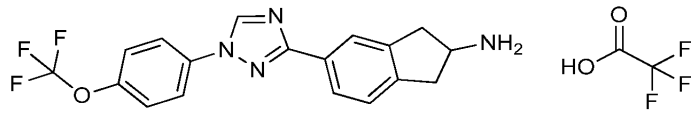
테이트로 희석하고, 물로 세척하였다. 수성 층을 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 층을 염수로 세척하였다. 유기 층을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 0-20% 에틸 아세테이트/B (여기서 B = 1:1 디클로로메탄/헥산)를 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제한 후에 50℃에서 약 25 in. Hg에서 건조시켜 표제 화합물을 백색 고체로서 수득하였다 (0.345 g, 59%): mp 161-165℃; ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.56 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 8.02 (dd, J = 7.7, 1.6 Hz, 1H), 7.84 - 7.78 (m, 2H), 7.39 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.32 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 4.87 - 4.70 (m, 1H), 4.60 - 4.45 (m, 1H), 3.34 (dt, J = 16.2, 8.0 Hz, 2H), 2.86 (ddd, J = 15.8, 10.1, 4.9 Hz, 2H), 1.45 (s, 9H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -85.89, -87.85; ESIMS m/z 511 ($[M+H]^+$).

[0115] 실시예 3: 5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민 디히드로클로라이드 (C3)의 제조

[0116] 

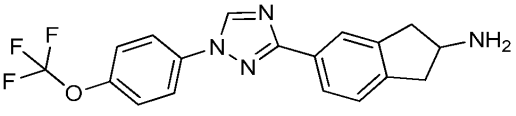
[0117] 교반 막대 및 질소가 장착된 둥근-바닥 플라스크 (100 mL) 중의 tert-부틸 (5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)카르바메이트 (C1) (0.484 g, 1.05 mmol)에 디옥산 (3 mL) 및 염화수소 (디옥산 중 4 M, 3.02 mL, 12.1 mmol)를 첨가하였다. 반응물을 밤새 실온에서 교반하였다. 추가의 염화수소 (디옥산 중 4 M, 3.02 mL, 12.1 mmol)를 첨가하고, 반응물을 40℃로 밤새 가열하였다. 보다 많은 염화수소 (디옥산 중 4 M, 3.02 mL, 12.1 mmol)를 첨가하였다. 수시간 후에, 반응물을 실온으로 냉각시키고, 디에틸 에테르로 희석하였다. 고체를 여과하고, 디에틸 에테르로 세척하고, 하우스 진공 하에 건조시켜 표제 화합물을 백색 고체로서 수득하였다 (0.379 g, 83%): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 9.41 (s, 1H), 8.36 - 8.17 (m, 3H), 8.11 - 8.04 (m, 2H), 8.02 (s, 1H), 7.98 (dd, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.65 - 7.60 (m, 2H), 7.43 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 4.11 - 4.00 (m, 2H), 3.36 (ddd, J = 16.9, 13.8, 7.7 Hz, 2H), 3.04 (ddd, J = 17.2, 12.3, 5.2 Hz, 2H); ^{19}F NMR (376 MHz, DMSO-d_6) δ -56.96; ESIMS m/z 361 ($[M+H]^+$).

[0118] 실시예 4: 5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민 2,2,2-트리플루오로아세테이트 (C4)의 제조

[0119] 

[0120] 교반 막대 및 질소가 장착된 둥근-바닥 플라스크 (200 mL) 중의 tert-부틸 (5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)카르바메이트 (C1) (2.1 g, 4.6 mmol)에 디클로로메탄 (30 mL)을 첨가하였다. 반응물을 빙수조로 냉각시키고, 트리플루오로아세트산 (3.9 mL, 50 mmol)을 한 번에 첨가하였다. 빙조를 제거하고, 반응물을 실온에서 밤새 교반하였다. 반응 혼합물을 농축시키고, 잔류물을 디에틸 에테르로 슬러리화하고, 백색 고체가 수득될 때까지 농축시켰다. 고체를 디에틸 에테르 및 헥산으로 연화처리하고, 여과하고, 수집하고, 50℃에서 약 25 in. Hg에서 밤새 건조시켜 표제 화합물을 백색 고체로서 수득하였다 (1.9 g, 86%): ^{19}F NMR (376 MHz, DMSO-d_6) δ -56.96, -73.55; ESIMS m/z 361 ($[M+H]^+$).

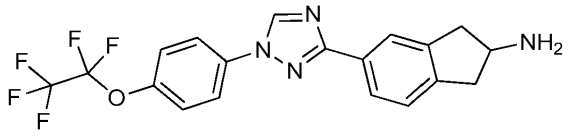
[0121] 실시예 5: 5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민 (C5)의 제조

[0122] 

[0123] 디클로로메탄 중의 5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민

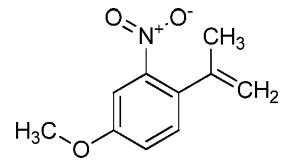
2,2,2-트리플루오로아세테이트 (C4) (1.46 g, 3.08 mmol)를 분리 깔때기에서 수산화나트륨 (1 N)으로 세척하였다. 유기 층을 상 분리기를 통해 붓고, 농축시켰다. 고체를 50℃에서 약 25 in. Hg에서 밤새 건조시켜 표제 화합물을 황갈색 고체로서 수득하였다 (0.779 g, 70%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (s, 1H), 8.05 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.02 - 7.97 (m, 1H), 7.86 - 7.75 (m, 2H), 7.43 - 7.34 (m, 2H), 7.32 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 3.90 (s, 1H), 3.25 (ddd, J = 16.6, 10.2, 6.7 Hz, 2H), 2.75 (ddd, J = 16.4, 9.4, 5.1 Hz, 2H) (NH_2 관찰되지 않음); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.03; ESIMS m/z 361 ($[M+H]^+$).

[0124] 실시예 6: 5-(1-(4-(퍼플루오로에톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민 (C6)의 제조

[0125] 

[0126] 교반 막대 및 질소가 장착된 둥근-바닥 플라스크 (100 mL) 중의 tert-부틸 (5-(1-(4-(퍼플루오로에톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)카르바메이트 (C2) (0.305 g, 0.598 mmol)에 디클로로메탄 (4 mL)에 이어 트리플루오로아세트산 (0.506 mL, 6.57 mmol)을 첨가하였다. 반응물을 실온에서 밤새 교반하였다. 반응 혼합물을 빙수조로 냉각시키고, 수산화나트륨 (2 M, 3.29 mL, 6.57 mmol)을 사용하여 염기성으로 만들었다. 층을 분리하고, 수성 층을 클로로포름/이소프로판올 (3:1, 3x)로 추출하였다. 유기 층을 상 분리기를 통해 붓고, 농축시켜 표제 화합물을 황색 오일로서 수득하였으며, 이를 추가로 정제하지 않고 사용하였다 (0.290 g, 118%): ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -85.90, -87.85; ESIMS m/z 411 ($[M+H]^+$).

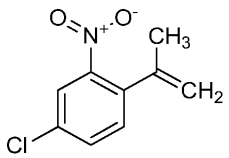
[0127] 실시예 7: 4-메톡시-2-니트로-1-(프로프-1-엔-2-일)벤젠 (C7)의 제조

[0128] 

[0129] 1-클로로-4-메톡시-2-니트로벤젠 (5.03 g, 26.8 mmol), 4,4,5,5-테트라메틸-2-(프로프-1-엔-2-일)-1,3,2-디옥사보롤란 (5.41 g, 32.2 mmol), 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II) 클로라이드 (1.50 g, 2.15 mmol), 및 탄산나트륨 (3.41 g, 32.2 mmol)에 디옥산/물 (4:1, 100 mL:25 mL)을 첨가하였다. 반응물을 80℃에서 5시간 동안 가열하였다. 반응물을 실온으로 밤새 냉각시켰다. 반응 혼합물을 물로 희석하고, 에틸 아세테이트 (3x)로 추출하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 0-5% 에틸 아세테이트/헥산을 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제한 후에 진공 오븐에서 건조시켜 표제 화합물을 오렌지색 오일로서 수득하였다 (2.74 g, 53%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.37 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.08 (dd, J = 8.5, 2.6 Hz, 1H), 5.24 - 4.75 (m, 2H), 3.86 (s, 3H), 2.19 - 1.88 (m, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 158.79, 148.61, 142.53, 131.41, 131.32, 119.24, 115.20, 108.64, 55.84, 23.38; EIMS m/z 193 ($[M]^+$).

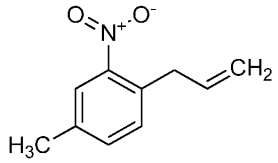
[0130] 하기 화합물을 실시예 7에서의 절차에 따라 제조하였다.

[0131] 4-클로로-2-니트로-1-(프로프-1-엔-2-일)벤젠 (C8)

[0132] 

[0133] 표제 화합물을 1-브로모-4-클로로-2-니트로벤젠을 사용하여 실시예 7에 기재된 바와 같이 제조하고, 밤새 가열하고, 밝은 오렌지색 액체로서 단리하였다 (10.73 g, 84%): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.04 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.76 (dd, J = 8.3, 2.2 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 5.24 (p, J = 1.5 Hz, 1H), 4.95 (p, J = 1.0 Hz, 1H), 2.07 (dd, J = 1.5, 0.9 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, DMSO) δ 148.37, 140.83, 136.10, 132.62, 132.45, 131.63, 123.50, 115.98, 22.60; EIMS m/z 197 ([M]$^{+}$).

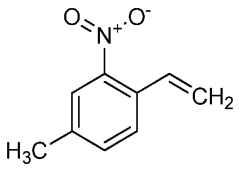
[0134] 실시예 8: 1-알릴-4-메틸-2-니트로벤젠 (C9)의 제조

[0135] 

[0136] 2개의 25-mL 반응 바이알 중의 1-클로로-4-메틸-2-니트로벤젠 (2.00 g, 11.7 mmol), 알릴트리부틸스탄난 (5.79 g, 17.5 mmol) 및 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II) 디클로라이드 (0.818 g, 1.17 mmol)에 1,2-디클로로에탄 (20 mL)을 첨가하였다. 바이알을 캡핑하고, 용기의 측면으로부터의 외부 IR-센서 온도 모니터링과 함께 바이오타지 이니시에이터® 마이크로웨이브 반응기에서 120℃에서 45분 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 셀라이트® 카트리지 상에 로딩하였다. 조 물질을 용리액으로서 0-50% 에틸 아세테이트/헥산을 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제한 후에 용리액으로서 0-100% 아세토니트릴/물을 사용하여 역상 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하였다. 합한 아세토니트릴/물 분획을 농축시키고, 에틸 아세테이트로 추출하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시키고, 진공 오븐에서 건조시켜 표제 화합물을 황색 액체로서 수득하였다 (1.76 g, 84%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.73 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 7.8, 1.2 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 5.96 (ddt, J = 16.6, 10.1, 6.4 Hz, 1H), 5.08 (ddq, J = 18.5, 17.0, 1.5 Hz, 2H), 3.64 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 2.40 (s, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 149.09, 137.62, 135.35, 133.81, 131.81, 131.72, 124.94, 116.81, 36.62, 20.72; EIMS m/z 176 ([M]$^{+}$).

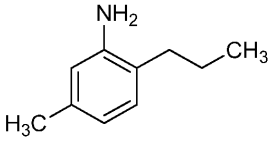
[0137] 하기 화합물을 실시예 8에서의 절차에 따라 제조하였다:

[0138] 4-메틸-2-니트로-1-비닐벤젠 (C10)

[0139] 

[0140] 표제 화합물을 1-클로로-4-메틸-2-니트로벤젠 및 트리부틸(비닐)스탄난을 사용하여 실시예 8에 기재된 바와 같이 제조하고, 플래쉬 칼럼 크로마토그래피 및 역상 크로마토그래피에 의해 추가로 정제하고, 황색 액체로서 단리하였다 (1.26 g, 65%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.73 (d, J = 0.8 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.46 - 7.35 (m, 1H), 7.13 (dd, J = 17.3, 11.0 Hz, 1H), 5.71 (dd, J = 17.3, 0.9 Hz, 1H), 5.43 (dd, J = 11.0, 0.9 Hz, 1H), 2.42 (s, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 147.71, 138.91, 133.92, 132.31, 130.52, 128.22, 124.63, 118.10, 20.88; EIMS m/z 163 ([M]$^{+}$).

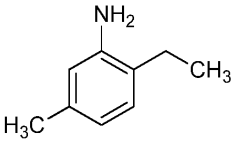
[0141] 실시예 9: 5-메틸-2-프로필아닐린 (C11)의 제조

[0142] 

[0143] 에틸 아세테이트 (49 mL) 중 1-알릴-4-메틸-2-니트로벤젠 (C9) (1.75 g, 9.87 mmol) 및 탄소 상 팔라듐 (10%, 1.05 g, 0.990 mmol)을 함유하는 둥근-바닥 플라스크를 진공 하에 배기시키고, 질소 (2x)로 다시 채우고, 이어서 진공 하에 배기시키고, 풍선에 의해 수소로 채웠다. 반응물을 2일 밤 동안 실온에서 교반하였다. 반응 혼합물을 셀라이트®를 통해 여과하고, 에틸 아세테이트로 농축시켰다. 액체를 진공 오븐에서 건조시켜 표제 화합물을 황색 액체로서 수득하였다 (1.39 g, 93%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 6.92 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 6.55 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 6.51 (s, 1H), 3.55 (s, 2H), 2.47 - 2.37 (m, 2H), 2.24 (s, 3H), 1.69 - 1.53 (m, 2H), 0.99 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 143.91, 136.52, 129.46, 123.83, 119.49, 116.29, 33.05, 22.10, 21.05, 14.19; EIMS m/z 149 ($[M]^+$).

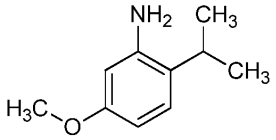
[0144] 하기 화합물을 실시예 9에서의 절차에 따라 제조하였다:

[0145] 2-에틸-5-메틸아닐린 (C12)

[0146] 

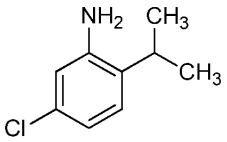
[0147] 표제 화합물을 4-메틸-2-니트로-1-비닐벤젠 (C10)을 사용하여 실시예 9에 기재된 바와 같이 제조하고, 황색 액체로서 단리하였다 (0.926 g, 88%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 6.95 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 6.57 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 6.52 (s, 1H), 3.56 (s, 2H), 2.48 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.25 (s, 3H), 1.23 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 143.80, 136.48, 128.32, 125.22, 119.59, 116.15, 23.67, 21.03, 13.24; EIMS m/z 135 ($[M]^+$).

[0148] 2-이소프로필-5-메톡시아닐린 (C13)

[0149] 

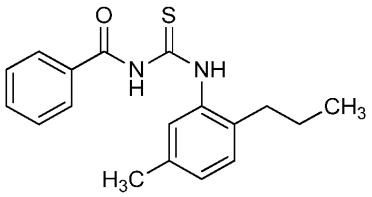
[0150] 표제 화합물을 4-메톡시-2-니트로-1-(프로프-1-엔-2-일)벤젠 (C7)을 사용하여 실시예 9에 기재된 바와 같이 제조하고, 황색 액체로서 단리하였다 (2.23 g, 95%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.03 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.35 (dd, J = 8.5, 2.6 Hz, 1H), 6.25 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.65 (s, 2H), 2.83 (p, J = 6.8 Hz, 1H), 1.24 (d, J = 6.8 Hz, 6H); EIMS m/z 165 ($[M]^+$).

[0151] 5-클로로-2-이소프로필아닐린 (C14)

[0152] 

[0153] 표제 화합물을 4-클로로-2-니트로-1-(프로프-1-엔-2-일)벤젠 (C8)을 사용하여 실시예 9에 기재된 바와 같이 제조하고, 갈색 액체로서 단리하였다 (1.82 g, 84%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.38 - 7.31 (m, 1H), 7.22 - 7.16 (m, 1H), 7.07 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.83 - 6.77 (m, 2H), 2.90 (p, J = 6.8 Hz, 1H), 1.25 (d, J = 6.8 Hz, 6H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 126.91, 126.83, 126.51, 121.34, 120.07, 116.37, 27.44, 22.34; EIMS m/z 169 ($[M]^+$).

[0154] 실시예 10: N-((5-메틸-2-프로필페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (C15)의 제조

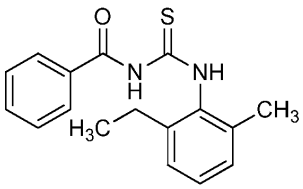


[0155]

[0156] 5-메틸-2-프로필아닐린 (C11) (1.38 g, 9.22 mmol) 및 벤조일 이소티오시아네이트 (1.24 mL, 9.22 mmol)에 아세톤 (13 mL)을 첨가하였다. 반응물을 60℃에서 4시간 동안 가열하였다. 반응물을 냉각시키고, 농축시켰다. 생성된 오일을 진공 오븐에서 밤새 건조시켜 표제 화합물을 갈색 오일로서 수득하였다 (3.26 g, 100%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 12.20 (s, 1H), 9.15 (s, 1H), 7.92 (dt, J = 8.5, 1.7 Hz, 2H), 7.71 - 7.60 (m, 1H), 7.55 (m, 3H), 7.18 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.09 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 2.66 - 2.55 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.72 - 1.57 (m, 2H), 0.97 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 179.64, 166.90, 136.22, 135.72, 134.57, 133.74, 131.68, 129.79, 129.22, 128.64, 127.55, 127.24, 33.28, 23.58, 21.01, 13.98; ESIMS m/z 313 ($[M+H]^+$).

[0157] 하기 화합물을 실시예 10에서의 절차에 따라 제조하였다:

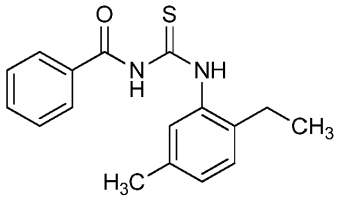
[0158] N-((2-에틸-6-메틸페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (C16)



[0159]

[0160] 표제 화합물을 2-에틸-6-메틸아닐린을 사용하여 실시예 10에 기재된 바와 같이 제조하고, 황색 액체로서 단리하였다 (6.41 g, 100%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 11.88 (s, 1H), 9.21 (s, 1H), 8.02 - 7.85 (m, 2H), 7.73 - 7.63 (m, 1H), 7.62 - 7.50 (m, 2H), 7.29 - 7.23 (m, 1H), 7.20 - 7.14 (m, 2H), 2.75 - 2.57 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.25 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ESIMS m/z 299 ($[M+H]^+$).

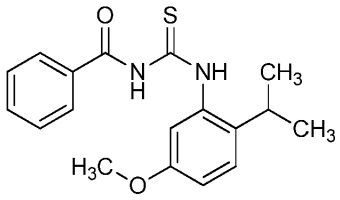
[0161] N-((2-에틸-5-메틸페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (C17)



[0162]

[0163] 표제 화합물을 2-에틸-5-메틸아닐린 (C12)을 사용하여 실시예 10에 기재된 바와 같이 제조하고, 오렌지색 고체로서 단리하였다 (2.10 g, 97%): mp 105-107℃; ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 12.18 (s, 1H), 9.14 (s, 1H), 7.92 (dt, J = 8.6, 1.7 Hz, 2H), 7.73 - 7.60 (m, 1H), 7.59 - 7.53 (m, 2H), 7.50 (s, 1H), 7.21 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.11 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 2.71 - 2.59 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.24 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 179.72, 166.94, 136.22, 136.13, 135.53, 133.75, 131.65, 129.23, 128.88, 128.86, 127.53, 127.23, 24.26, 20.98, 14.56; ESIMS m/z 299 ($[M+H]^+$).

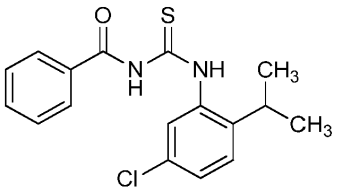
[0164] N-((2-이소프로필-5-메톡시페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (C18)



[0165]

[0166] 표제 화합물을 2-이소프로필-5-메톡시아닐린 (C13)을 사용하여 실시예 10에 기재된 바와 같이 제조하고, 황색 액체로서 단리하였다 (4.63 g, 100%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 12.23 (s, 1H), 9.13 (s, 1H), 7.98 - 7.82 (m, 2H), 7.74 - 7.61 (m, 1H), 7.61 - 7.51 (m, 2H), 7.32 - 7.26 (m, 2H), 6.89 (dd, J = 8.7, 2.7 Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.10 (p, J = 6.9 Hz, 1H), 1.26 (d, J = 6.8 Hz, 6H); ESIMS m/z 329 ($[M+H]^+$).

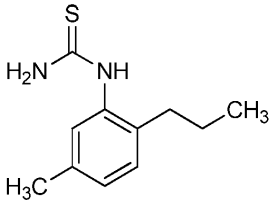
[0167] N-((5-클로로-2-이소프로필페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (C19)



[0168]

[0169] 표제 화합물을 5-클로로-2-이소프로필아닐린 (C14)을 사용하여 실시예 10에 기재된 바와 같이 제조한 후에 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하고, 담황색 고체로서 단리하였다 (16.3 g, 98%): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 12.32 (s, 1H), 11.76 (s, 1H), 8.07 - 7.95 (m, 2H), 7.72 - 7.63 (m, 1H), 7.60 - 7.50 (m, 3H), 7.42 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 8.5, 2.2 Hz, 1H), 3.08 (hept, J = 6.9 Hz, 1H), 1.19 (d, J = 6.8 Hz, 6H); ^{13}C NMR (101 MHz, DMSO) δ 181.12, 168.37, 142.95, 137.03, 133.18, 131.93, 129.67, 128.75, 128.40, 127.61, 127.55, 127.52, 27.63, 22.84; ESIMS m/z 333 ($[M+H]^+$).

[0170] 실시예 11: 1-(5-메틸-2-프로필페닐)티오우레아 (C20)의 제조

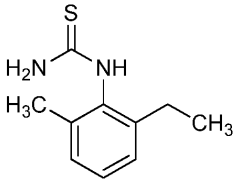


[0171]

[0172] 메탄올 (80 mL) 중 N-((5-메틸-2-프로필페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (C15) (3.21 g, 10.3 mmol)에 수산화나트륨 (2 N, 10.3 mL, 20.5 mmol)을 첨가하고, 50℃에서 2시간 동안 가열하고, 이어서 실온에서 주말 동안 교반하였다. 반응물을 농축시키고, 물로 희석하고, 디클로로메탄으로 추출하고, 상 분리기를 통해 여과하고, 농축시키고, 진공 오븐에서 건조시켜 표제 화합물을 황갈색 고체로서 수득하였다 (1.80 g, 83%): mp 143-145℃; ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.84 (s, 1H), 7.20 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.12 (dd, J = 7.8, 1.2 Hz, 1H), 7.04 (s, 1H), 5.99 (d, J = 254.5 Hz, 2H), 2.57 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.59 (dq, J = 14.8, 7.4 Hz, 2H), 0.95 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 181.96, 137.53, 136.74, 134.00, 130.69, 129.72, 127.85, 32.90, 23.66, 20.80, 13.93; ESIMS m/z 209 ($[M+H]^+$).

[0173] 하기 화합물을 실시예 11에서의 절차에 따라 제조하였다:

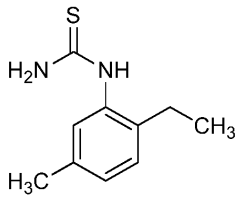
[0174] 1-(2-에틸-6-메틸페닐)티오우레아 (C21)



[0175]

[0176] 표제 화합물을 N-((2-에틸-6-메틸페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (C16)를 사용하여 실시예 11에 기재된 바와 같이 제조하고, 물로의 연화처리에 의해 추가로 정제하고, 백색 고체로서 단리하였다 (3.46 g, 83%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.63 (s, 1H), 7.25 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.22 - 7.11 (m, 2H), 6.13 (bs, 1H), 5.33 (bs, 1H), 2.77 - 2.55 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.21 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ESIMS m/z 195 ($[M+H]^+$).

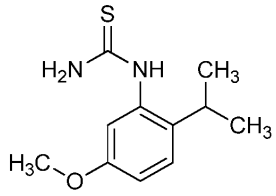
[0177] 1-(2-에틸-5-메틸페닐)티오우레아 (C22)



[0178]

[0179] 표제 화합물을 N-((2-에틸-5-메틸페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (C17)를 사용하여 실시예 11에 기재된 바와 같이 제조하고, 연한 오렌지색 고체로서 단리하였다 (1.26 g, 94%): mp 143-147℃; ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.48 (s, 1H), 7.23 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.04 (s, 1H), 5.86 (s, 2H), 2.61 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.19 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 182.13, 138.27, 137.53, 133.74, 129.95, 129.93, 127.84, 24.00, 20.79, 14.77; ESIMS m/z 195 ($[M+H]^+$).

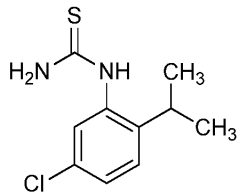
[0180] 1-(2-이소프로필-5-메톡시페닐)티오우레아 (C23)



[0181]

[0182] 표제 화합물을 N-((2-이소프로필-5-메톡시페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (C18)를 사용하여 실시예 11에 기재된 바와 같이 제조하고, 오렌지색 고체로서 단리하였다 (2.65 g, 83%): mp 134-139℃; ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.60 (s, 1H), 7.30 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 8.7, 2.7 Hz, 1H), 6.75 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 5.88 (s, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.10 (p, J = 6.9 Hz, 1H), 1.19 (d, J = 6.9 Hz, 6H); ESIMS m/z 225 ($[M+H]^+$).

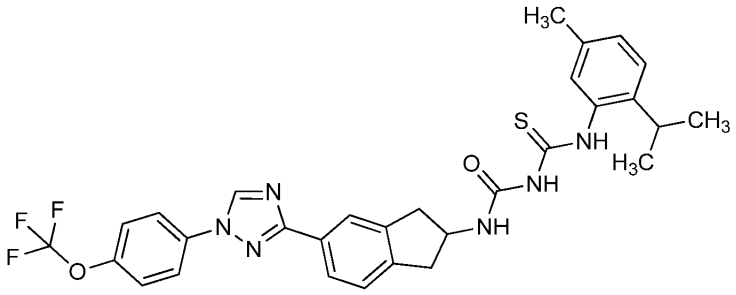
[0183] 1-(5-클로로-2-이소프로필페닐)티오우레아 (C24)



[0184]

[0185] 표제 화합물을 N-((5-클로로-2-이소프로필페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (C19)를 사용하여 실시예 69에 기재된 바와 같이 제조하고, 갈색 점착성 검으로서 단리하였다 (1.38 g, 93%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.96 (s, 1H), 7.34 (d, J = 1.4 Hz, 2H), 7.24 (t, J = 1.3 Hz, 1H), 5.97 (s, 2H), 3.27 - 3.10 (m, 1H), 1.21 (d, J = 6.8 Hz, 6H); ESIMS m/z 229 ($[M+H]^+$).

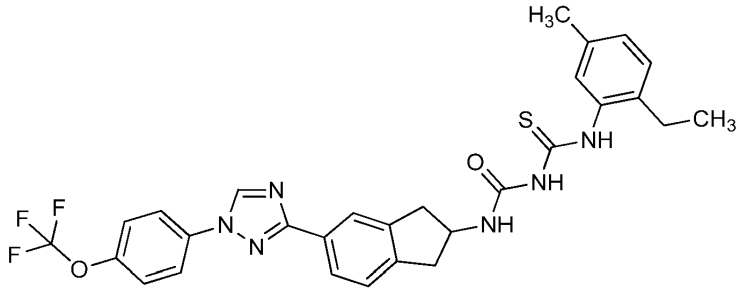
[0186] 실시예 12: 1-[(2-이소프로필-5-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F1)의 제조

[0187] 

[0188] 교반 막대 및 질소가 장착된 바이알 (25 mL) 중의 5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민 디히드로클로라이드 (C3) (0.279 g, 0.645 mmol)에 디클로로메탄 (4 mL), 물 (2 mL), 및 중탄산나트륨 (0.271 g, 3.22 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 빙수조에서 냉각시켰다. 트리포스겐 (0.0770 g, 0.258 mmol)을 한 번에 첨가하고, 반응물을 출발 물질의 전환이 LCMS에 의해 관찰될 때까지 격렬하게 교반하였다. 반응 혼합물을 분리 깔때기에 붓고, 디클로로메탄으로 희석하였다. 층을 분리하고, 수성 층을 디클로로메탄으로 추출하였다. 유기 층을 상 분리기를 통해 붓고, 농축시켰다. 생성된 고체를 교반 막대 및 질소가 장착된 둥근-바닥 플라스크 (100 mL) 중의 아세토니트릴 (6 mL)에 현탁시켰다. 여기에 탄산세슘 (0.231 g, 0.709 mmol) 및 1-(2-이소프로필-5-메틸페닐)티오우레아 (0.134 g, 0.645 mmol)를 첨가하였다. 반응물을 밤새 실온에서 교반하였다. 혼합물을 에틸 아세테이트로 희석하고, 절반 포화 염수로 세척하였다. 수성 층을 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 층을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 0-30% 에틸 아세테이트/B (여기서 B = 1:1 디클로로메탄/헥산)를 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 백색 고체로서 수득하였다 (0.148 g, 39%).

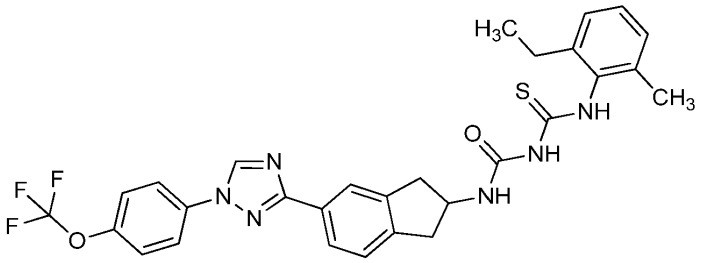
[0189] 하기 화합물을 실시예 12에 개시된 절차에 따라 제조하였다:

[0190] 1-[(2-에틸-5-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F5)

[0191] 

[0192] 5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민 2,2,2-트리플루오로아세테이트 (C4) 및 1-(2-에틸-5-메틸페닐)티오우레아 (C22)를 사용하여 백색 고체로서 단리하였다 (0.077 g, 32%).

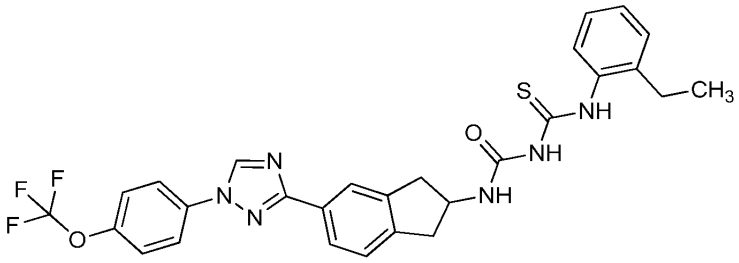
[0193] 1-[(2-에틸-6-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F6)



[0194]

[0195] 5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민 2,2,2-트리플루오로아세테이트 (C4) 및 1-(2-에틸-6-메틸페닐)티오우레아 (C21)를 사용하여 백색 고체로서 단리하였다 (0.110 g, 45%).

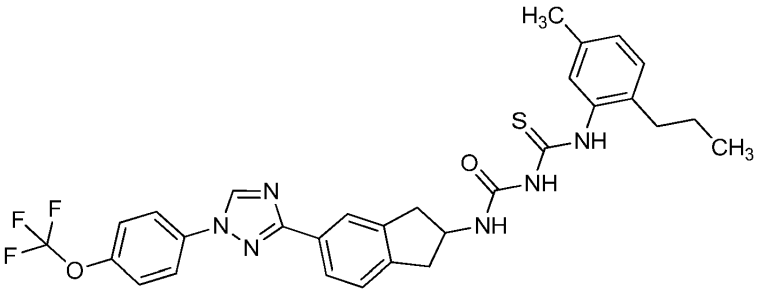
[0196] 1-[(2-에틸페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F7)



[0197]

[0198] 5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민 (C5) 및 1-(2-에틸페닐)티오우레아를 사용하여 백색 고체로서 단리하였다 (0.108 g, 44%).

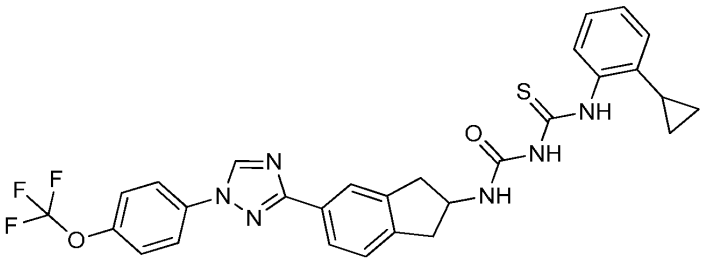
[0199] 1-[(5-메틸-2-프로필-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F8)



[0200]

[0201] 5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민 (C5) 및 1-(5-메틸-2-프로필페닐)티오우레아 (C20)를 사용하여 백색 고체로서 단리하였다 (0.103 g, 40%).

[0202] 1-[(2-시클로프로필페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F11)

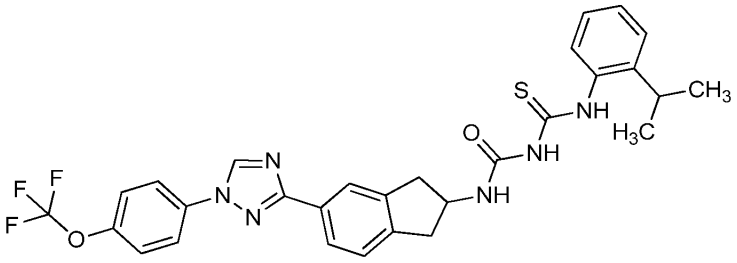


[0203]

[0204] 5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민 (C5) 및 1-(2-시클

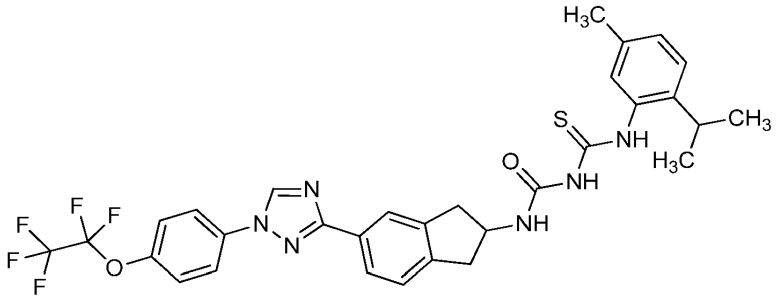
로프로필페닐)티오우레아를 사용하여 백색 고체로서 단리하였다 (0.106 g, 42%).

[0205] 1-[(2-이소프로필페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F14)

[0206] 

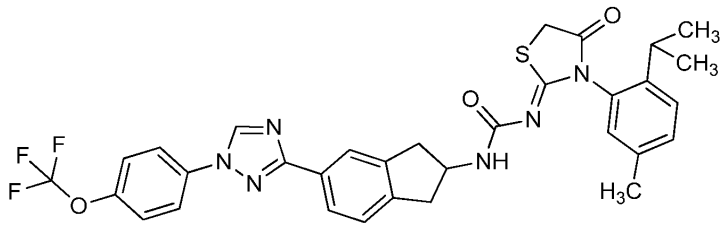
[0207] 5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민 (C5) 및 1-(2-이소프로필페닐)티오우레아를 사용하여 백색 고체로서 단리하였다 (0.106 g, 42%).

[0208] 실시예 13: 1-[(2-이소프로필-5-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(1,1,2,2,2-펜타플루오로에톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F3)의 제조

[0209] 

[0210] 교반 막대 및 질소가 장착된 둥근-바닥 플라스크 (100 mL) 중의 5-(1-(4-(퍼플루오로에톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민 (C6) (0.245 g, 0.597 mmol)에 중탄산나트륨 (0.150 g, 1.79 mmol)에 이어 디클로로메탄 (4 mL) 및 물 (2 mL)을 첨가하였다. 트리포스겐 (0.0710 g, 0.239 mmol)을 한 번에 첨가하고, 반응물을 격렬하게 교반하였다. LCMS에 의해 이소시아네이트로의 전환이 관찰된 후에, 반응 혼합물을 상 분리기를 통해 붓고, 둥근-바닥 플라스크 (100 mL)에서 농축시켰다. 교반 막대 및 질소를 플라스크에 추가하고, 고체를 아세토니트릴 (6 mL)에 녹였다. 탄산세슘 (0.214 g, 0.657 mmol)에 이어 1-(2-이소프로필-5-메틸페닐)티오우레아 (0.124 g, 0.597 mmol)를 첨가하고, 반응물을 밤새 실온에서 교반하였다. 반응 혼합물을 에틸 아세테이트로 희석하고, 물로 세척하였다. 수성 층을 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 0-30% 에틸 아세테이트/B (여기서 B = 1:1 디클로로메탄/헥산)를 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제한 후에 생성된 고체를 디에틸 에테르로 연화처리하여 표제 화합물을 황색 고체로서 수득하였다 (0.141 g, 37%).

[0211] 실시예 14: (Z)-1-(3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (F2)의 제조

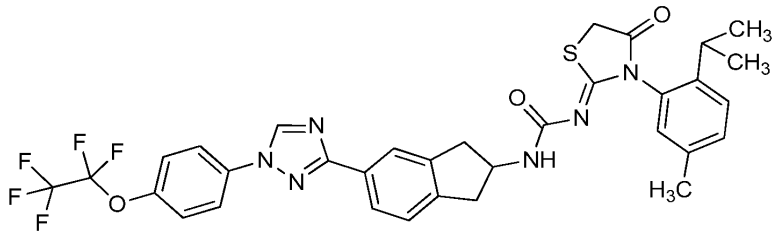
[0212] 

[0213] 교반 막대 및 비그럭스 칼럼이 장착된 바이알 (25 mL) 중의 1-[(2-이소프로필-5-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F1) (0.100 g, 0.168 mmol)에 에탄올 (3 mL)에 이어 아세트산나트륨 (0.0550 g, 0.673 mmol) 및 메틸 브로모아세테이트 (0.0230 mL, 0.252 mmol)를 첨가하였다. 반응물을 70℃로 밤새 가열하였다. 반응물을 실온으로 냉각시키고, 에틸 아세테이트로

희석하였다. 수성 층을 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 0-30% 에틸 아세테이트/B (여기서 B = 1:1 디클로로메탄/헥산)를 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제한 후에 50℃에서 약 25 in. Hg에서 밤새 건조시켜 표제 화합물을 백색 고체로서 수득하였다 (0.0839 g, 79%).

[0214] 하기 화합물을 실시예 14에 개시된 절차에 따라 제조하였다:

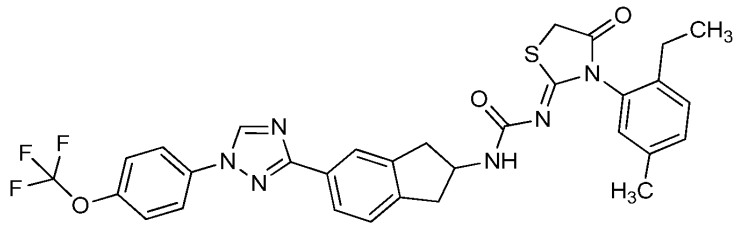
[0215] (Z)-1-(3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(퍼플루오로에톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (F4)



[0216]

[0217] 1-[(2-이소프로필-5-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(1,1,2,2,2-펜타플루오로에톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F3)를 사용하여 백색 고체로서 단리하였다 (0.078 g, 66%).

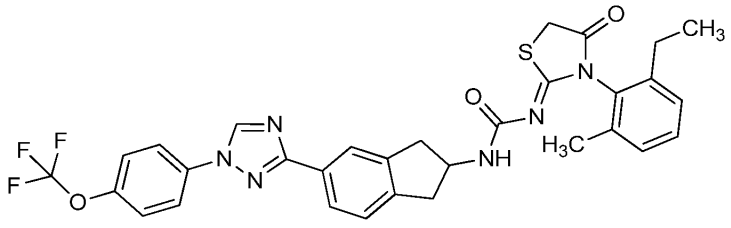
[0218] (Z)-1-(3-(2-에틸-5-메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (F9)



[0219]

[0220] 1-[(2-에틸-5-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F5)를 사용하여 백색 고체로서 단리하였다 (0.050 g, 72%).

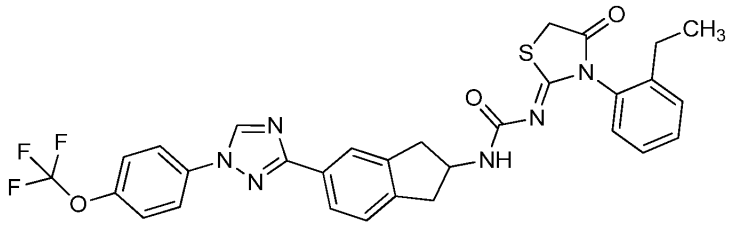
[0221] (Z)-1-(3-(2-에틸-6-메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (F10)



[0222]

[0223] 1-[(2-에틸-6-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F6)를 사용하여 백색 고체로서 단리하였다 (0.047 g, 46%).

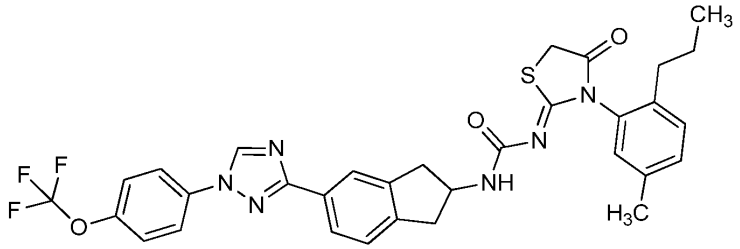
[0224] (Z)-1-(3-(2-에틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (F12)



[0225]

[0226] 1-[(2-에틸페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F7)를 사용하여 백색 고체로서 단리하였다 (0.083 g, 81%).

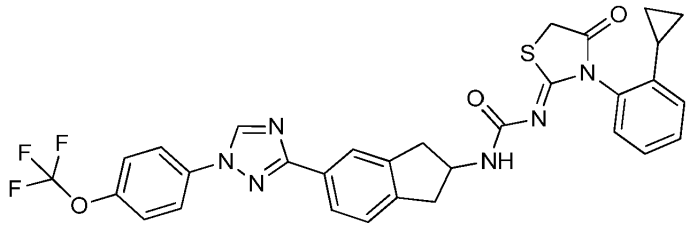
[0227] (Z)-1-(3-(5-메틸-2-프로필페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (F13)



[0228]

[0229] 1-[(5-메틸-2-프로필-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F8)를 사용하여 백색 고체로서 단리하였다 (0.079 g, 81%).

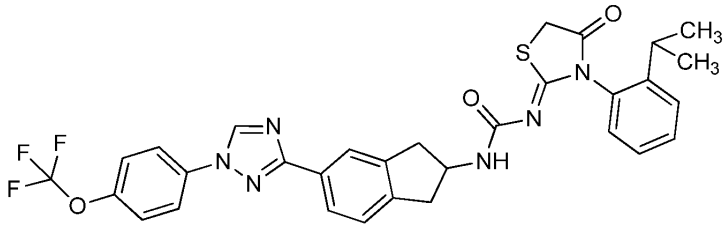
[0230] (Z)-1-(3-(2-시클로프로필페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (F15)



[0231]

[0232] 1-[(2-시클로프로필페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F11)를 사용하여 백색 고체로서 단리하였다 (0.097 g, 83%).

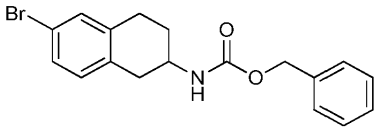
[0233] (Z)-1-(3-(2-이소프로필페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (F16)



[0234]

[0235] 1-[(2-이소프로필페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F14)를 사용하여 백색 고체로서 단리하였다 (0.079 g, 78%).

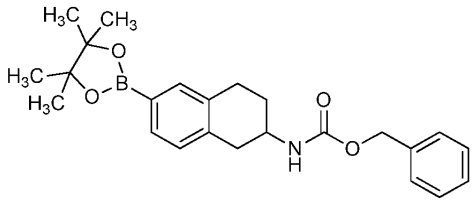
[0236] 실시예 15: 벤질 (6-브로모-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)카르바메이트 (C25)의 제조



[0237]

[0238] 테트라히드로푸란/물 (2.4 mL, 1:1) 중 6-브로모-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-아민 (0.14 g, 0.62 mmol) 및 수산화나트륨 (0.099 g, 2.5 mmol)을 실온에서 교반하였다. 벤질 클로로포르메이트 (0.10 mL, 0.68 mmol)를 첨가하였다. 반응물을 1시간 동안 교반하였다. 반응물을 염수로 켄칭하고, 에틸 아세테이트로 희석하였다. 유기 층을 분리하고, 농축시켜 표제 화합물을 오렌지색 고체로서 수득하였으며, 이를 추가로 정제하지 않고 사용하였다 (0.28 g, 125%): ESIMS m/z 360, 362 ($[M+H]^+$).

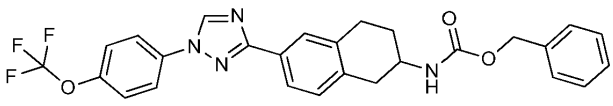
[0239] 실시예 16: 벤질 (6-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-디옥사보롤란-2-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)카르바메이트 (C26)의 제조



[0240]

[0241] 디옥산 (3.4 mL) 중 벤질 (6-브로모-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)카르바메이트 (C25) (0.28 g, 0.85 mmol), [1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센]디클로로팔라듐(II) (0.038 g, 0.052 mmol), 비스(피나콜레이토)디보론 (0.26 mg, 1.0 mmol), 및 아세트산칼륨 (0.17 g, 1.7 mmol)을 75℃에서 밤새 가열하였다. 반응물을 냉각시키고, 물로 켄칭하고, 에틸 아세테이트로 추출하였다. 유기 층을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 0-100% 에틸 아세테이트/헥산을 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 투명한 오일로서 수득하였다 (0.11 g, 35%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.54 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 7.40 - 7.29 (m, 5H), 7.07 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.10 (s, 2H), 4.78 (s, 1H), 4.06 (s, 1H), 3.15 (dd, J = 16.5, 5.1 Hz, 1H), 2.89 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 2.67 (dd, J = 16.7, 8.2 Hz, 1H), 2.09 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 1.79 (d, J = 11.6 Hz, 1H), 1.33 (s, 12H); ^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 155.70, 137.44, 136.50, 135.36, 134.77, 132.18, 128.96, 128.53, 128.13, 126.99, 83.72, 66.63, 60.40, 46.68, 36.20, 25.03, 24.83; ESIMS m/z 408 ($[M+H]^+$).

[0242] 실시예 17: 벤질 (6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)카르바메이트 (C27)의 제조

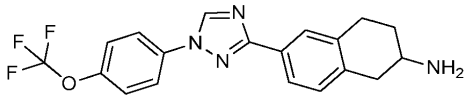


[0243]

[0244] 디옥산 (1.3 mL) 및 물 (0.4 mL) 중 3-브로모-1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸 (0.088 g, 0.29 mmol), 벤질 (6-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-디옥사보롤란-2-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)카르바메이트 (C26) (0.12 g, 0.26 mmol), 디클로로[1,1-비스(디-tert-부틸포스피노)페로센]팔라듐(II) (0.015 g, 0.023 mmol), 및 인산칼륨 (0.16 g, 0.75 mmol)을 75℃에서 6시간 동안 가열하였다. 반응물을 냉각시키고, 에틸 아세테이트로 희석하고, 염수로 세척하였다. 염수 층을 에틸 아세테이트로 추출하였다. 유기 층을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 0-100% 에틸 아세테이트/B (여기서 B는 1:1 디클로로메탄/헥산임)를 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 백색 고체로서 수득하였다 (0.088 g, 65%): mp 138-139℃; ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (s, 1H), 7.93 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 7.83 - 7.76 (m, 2H), 7.42 - 7.29 (m, 7H), 7.17 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 5.12 (s, 2H), 4.83 (d, J =

8.0 Hz, 1H), 4.10 (s, 1H), 3.20 (d, J = 18.6 Hz, 1H), 2.98 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 2.72 (dd, J = 16.5, 8.2 Hz, 1H), 2.12 (s, 1H), 1.84 (d, J = 12.7 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.03; ESIMS m/z 509 ($[M+H]^+$).

[0245] 실시예 18: 6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-아민 (C28)의 제조

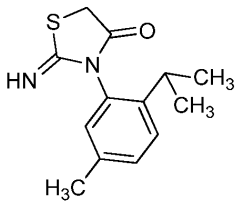
[0246] 

[0247] 에틸 아세테이트 (1.7 mL) 중 벤질 (6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)카르바메이트 (C27) (0.088 g, 0.17 mmol) 및 탄소 상 팔라듐 (10 wt%, 0.018 g, 0.017 mmol)을 수소 (풍선) 하에 6시간 동안 교반하였다. 반응물을 셀라이트®를 통해 여과하고, 에틸 아세테이트로 세척하고, 농축시켜 표제 화합물을 흑색 고체로서 수득하였다 (0.060 g, 91%): mp 112-116℃; ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (s, 1H), 7.92 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 7.84 - 7.76 (m, 2H), 7.38 (dq, J = 7.8, 1.0 Hz, 2H), 7.19 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 3.29 - 3.18 (m, 1H), 3.09 - 2.91 (m, 3H), 2.61 (dd, J = 16.3, 9.3 Hz, 1H), 2.09 - 2.00 (m, 1H), 1.64 (dtd, J = 12.8, 10.3, 6.0 Hz, 1H), 1.43 (s, 2H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.04; EIMS m/z 373 ($[M]^+$).

[0248] 6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-아민 (C28)의 대안적 제조

[0249] 디클로로메탄 (225 mL) 중 tert-부틸 (6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)카르바메이트 (CA38) (15.0 g, 32.6 mmol)의 용액에 3,3,3-트리플루오로아세트산 (27.0 mL, 359 mmol)을 한 번에 0℃에서 첨가하였다. 첨가 후에, 빙조를 제거하고, 반응 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 하에 농축시키고, 잔류물을 디에틸 에테르/헥산으로 연화처리하였다. 생성된 3,3,3-트리플루오로아세테이트 염을 디클로로메탄에 용해시키고, 수산화나트륨 (1 N)으로 세척하였다. 유기 층을 분리하고, 농축시켜 표제 화합물을 회백색 고체로서 수득하였다 (7.50 g, 64%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 1H), 7.91 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 7.79 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.37 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.18 (d, J = 8 Hz, 1H), 3.26 - 3.19 (m, 1H), 3.08 - 2.93 (m, 3H), 2.64 - 2.57 (m, 1H), 2.06 - 2.02 (m, 1H), 1.68 - 1.59 (m, 1H); ESIMS m/z 375 ($[M+H]^+$).

[0250] 실시예 19: 2-이미노-3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)티아졸리딘-4-온 (C29)의 제조

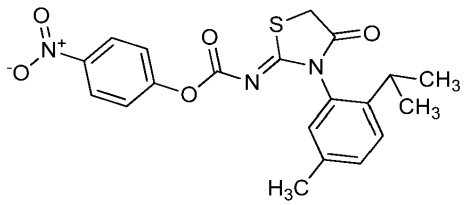
[0251] 

[0252] 단계 1. 2-이소프로필-5-메틸아닐린 (286 g, 1.91 mol) 및 중탄산나트륨 (270 g, 3.22 mol)을 둥근 바닥 플라스크에 질소 분위기 하에 교반하면서 충전시키고, 0 - 5℃로 냉각시켰다. 2-클로로아세틸 클로라이드 (218 g,1.93 mol)를 0 - 5℃에서 1시간의 기간에 걸쳐 적가하였다. 반응물을 0 - 5℃에서 1시간 동안 교반하였다. 반응 완료 후에, 정제수 (2.86 L)를 첨가하고, 25 - 30℃에서 15분 동안 교반하였다. 이어서 층을 분리하였다. 유기 층을 물 (2 x 2.86 L) 및 염수 (1.43 L)로 세척하였다. 수성 층을 합하고, 에틸 아세테이트 (1.43 L)로 추출하였다. 유기 층을 황산나트륨으로 건조시키고, 여과하고, 50 - 55℃에서 진공 하에 (500 - 600 mm Hg) 2/5 부피로 농축시켰다. 헥산 (2.86 L)을 첨가하고, 혼합물을 25 - 30℃에서 1시간 동안 교반하였다. 고체를 여과하고, 헥산 (1.43 L)으로 세척하고, 45 - 50℃에서 진공 하에 (500 - 600 mm Hg) 건조시켜 2-클로로-N-(2-이소프로필-5-메틸페닐)아세트아미드를 회백색 고체로서 수득하였다 (270 g, 66%): mp 97-99℃; ^{1}H NMR (300

MHz, $CDCl_3$) δ 8.27 (s, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.20 (d, J = 7.95 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 7.89 Hz, 1H), 4.25 (s, 2H), 2.99 (q, J = 6.78 Hz, 1H), 2.34 (s, 3H), 1.26 (d, J = 6.84 Hz, 6H); ^{13}C NMR (100 MHz, $CDCl_3$) δ 164.07, 137.28, 136.33, 132.95, 127.35, 125.62, 124.46, 43.21, 27.86, 22.98, 21.00; ESIMS m/z 226 ($[M+H]^+$).

[0253] 단계 2. 2-클로로-N-(2-이소프로필-5-메틸페닐)아세트아미드 (290 g, 1.28 mol) 및 아세톤 (1.60 L)을 둥근 바닥 플라스크에 질소 분위기 하에 교반하면서 충전시켰다. 티오시안산칼륨 (250 g, 2.57 mol)을 온도를 15 - 20℃에서 유지하면서 30분의 기간에 걸쳐 부분으로 나누어 첨가하였다. 반응물을 15 - 20℃에서 10분 동안 교반한 후에 온도를 서서히 53 - 55℃로 올리고, 53 - 55℃에서 3시간 동안 유지하였다. 이어서 반응물을 20 - 25℃로 냉각시키고, 탄산세슘 (20.9 g, 0.0641 mol)을 첨가하고, 반응 혼합물을 20 - 25℃에서 30분 동안 교반하였다. 완료 후에, 반응 혼합물을 셀라이트®를 통해 여과하고, 아세톤 (1.45 L)으로 세척하고, 여과물을 수집하였다. 여과물을 40 - 45℃에서 진공 하에 (500 - 600 mm Hg) 농축시켜 시럽을 수득하였다. 시럽을 에틸 아세테이트 (2.90 L)에 용해시키고, 물 (2 x 2.90 L) 및 염수 (1.45 L)로 세척하였다. 유기 층을 황산나트륨으로 건조시키고, 여과하고, 50 - 55℃에서 진공 하에 (500 - 600 mm Hg) 농축시켜 표제 화합물을 암갈색 시럽으로서 수득하였다 (345 g, 99%): ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.64 (s, 1H), 7.44 - 7.38 (m, 1H), 7.21 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.12 - 7.02 (m, 1H), 3.88 (s, 2H), 3.04 (tp, J = 13.7, 6.9 Hz, 1H), 2.38 - 2.31 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.25 (d, J = 6.8 Hz, 6H); ESIMS m/z 248 ($[M]^+$).

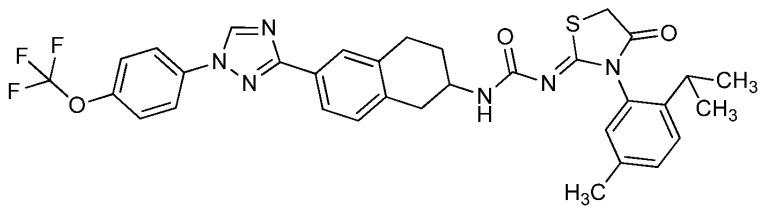
[0254] 실시예 20: (Z)-4-니트로페닐 (3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)카르바메이트 (C30)의 제조



[0255]

[0256] 아세토니트릴 (9.8 mL) 중 2-이미노-3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)티아졸리딘-4-온 (C29) (0.97 g, 3.9 mmol), 4-니트로페닐 클로로포르메이트 (0.83 g, 4.1 mmol), 및 탄산세슘 (1.3 g, 4.1 mmol)을 실온에서 30분 동안 교반하였다. 반응물을 디클로로메탄으로 희석하고, 실리카 겔 상에 흡착시켰다. 용리액으로서 0-100% 에틸 아세테이트/헥산을 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 오렌지색 발포체로서 수득하였다 (1.4 g, 87%): ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.22 (d, J = 9.2 Hz, 2H), 7.35 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.32 - 7.27 (m, 3H), 6.90 - 6.85 (m, 1H), 4.06 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 2.61 (p, J = 6.8 Hz, 1H), 2.36 (d, J = 0.8 Hz, 3H), 1.25 - 1.12 (m, 6H); ESIMS m/z 414 ($[M+H]^+$).

[0257] 실시예 21: (Z)-1-(3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)우레아 (F17)의 제조

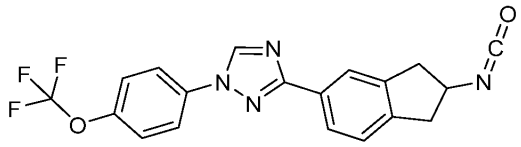


[0258]

[0259] 아세토니트릴 (1.6 mL) 중 6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-아민 (C28) (0.060 g, 0.16 mmol), (Z)-4-니트로페닐 (3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)카르바메이트 (C30) (0.080 g, 0.19 mmol), 및 탄산세슘 (0.026 g, 0.080 mmol)을 실온에서 4시간 동안 교반하였다. 반응물을 물 및 디클로로메탄으로 희석하고, 상 분리기를 통해 여과하였다. 용액을 농축시키고, 셀라이트 카트리지 상에 로딩하였다. 용리액으로서 0-100% 에틸 아세테이트/B (여기서 B는 1:1 디클로

로메탄/헥산임)를 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 황갈색 고체로서 수득하였다 (0.083 g, 79%).

[0260] 실시예 22: 3-(2-이소시아네이토-2,3-디히드로-1H-인덴-5-일)-1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸 (CA1)의 제조

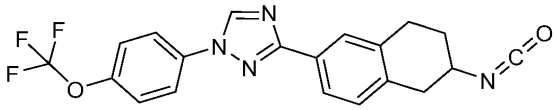


[0261]

[0262] 디클로로메탄 및 물 (15:7.5 mL) 중 5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-아민 (C5) (3.00 g, 8.33 mmol)의 용액에 질소 분위기 하에 중탄산나트륨 (2.10 g, 25.0 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 빙수조에서 냉각시키고, 디클로로메탄 중 트리포스겐 (1.20 g, 4.17 mmol)을 서서히 첨가하고; 반응 혼합물을 2시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 디클로로메탄으로 희석하고, 층을 분리하고; 수성 층을 디클로로메탄으로 추출하였다. 합한 유기 층을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켜 표제 화합물을 백색 고체로서 수득하였으며, 이를 추가로 정제하거나 특징화하지 않고 다음 단계에 사용하였다 (2.60 g, 81%).

[0263] 하기 화합물을 실시예 22에서의 절차에 따라 제조하였다:

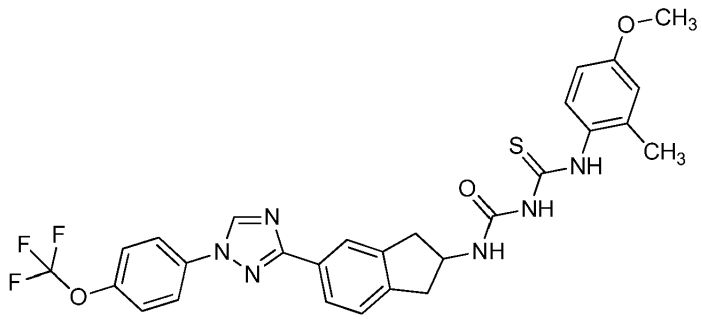
[0264] 3-(6-이소시아네이토-5,6,7,8-테트라히드로나프탈렌-2-일)-1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸 (CA2)



[0265]

[0266] 표제 화합물을 6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-아민 (C28)을 사용하여 실시예 22에 기재된 바와 같이 제조하고, 백색 고체로서 단리하였다 (2.6 g, 78%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (s, 1H), 8.56 (s, 1H), 7.95 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 7.81 - 7.78 (m, 2H), 7.38 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.18 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.02 - 3.94 (bs, 1H), 3.20 - 3.15 (m, 1H), 3.10 - 3.03 (m, 1H), 2.98 - 2.90 (m, 1H), 2.17 - 2.12 (m, 1H), 2.04 - 1.97 (m, 1H); ESIMS m/z 402 ($[M+H]^+$).

[0267] 실시예 23: 3-(2-이소시아네이토-2,3-디히드로-1H-인덴-5-일)-1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸 (P1)의 제조

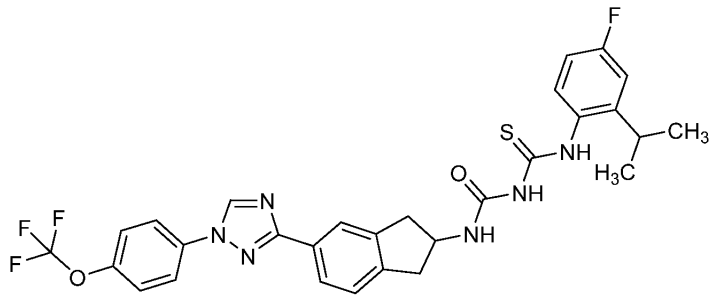


[0268]

[0269] 아세토니트릴 (5.0 mL) 중 3-(2-이소시아네이토-2,3-디히드로-1H-인덴-5-일)-1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸 (CA1) (0.40 g, 1.0 mmol)의 용액에 탄산세슘 (0.37 g, 1.1 mmol) 및 1-(4-메톡시-2-메틸페닐)티오우레아 (CA3) (0.203 g, 1.03 mmol)를 첨가하고, 반응 혼합물을 16시간 동안 실온에서 교반하였다. 반응 혼합물을 에틸 아세테이트로 희석하고, 염수로 세척하였다. 수성 층을 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 층을 Na2SO4 상에서 건조시키고, 여과하고, 감압 하에 농축시켰다. 조 생성물을 40%의 에틸 아세테이트/헥산으로 용리하는 칼럼 크로마토그래피 (100-200 메쉬 실리카)에 의해 정제하여 화합물 10a (0.08 g, 13%)

를 백색 고체로서 수득하였다. 하기 화합물을 실시예 23에서의 절차에 따라 제조하였다:

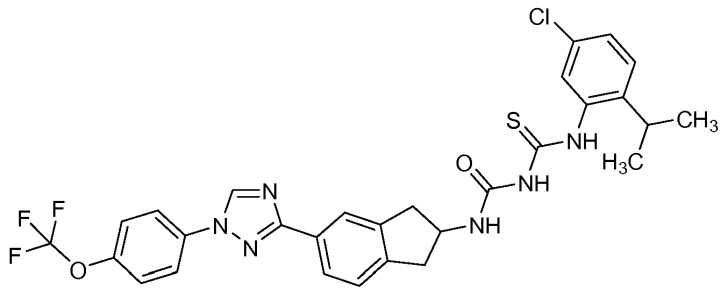
[0270] 1-[(4-플루오로-2-이소프로필-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (P2)



[0271]

[0272] 표제 화합물을 1-(4-플루오로-2-이소프로필페닐)티오우레아 (CA5)를 사용하여 실시예 23에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.070 g, 13%).

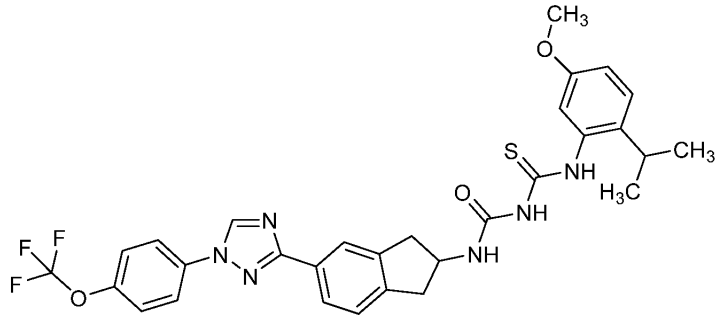
[0273] 1-[(5-클로로-2-이소프로필-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (P3)



[0274]

[0275] 표제 화합물을 1-(5-클로로-2-이소프로필페닐)티오우레아 (C24)를 사용하여 실시예 23에 기재된 바와 같이 제조하고, 백색 고체로서 단리하였다 (0.110 g, 18%).

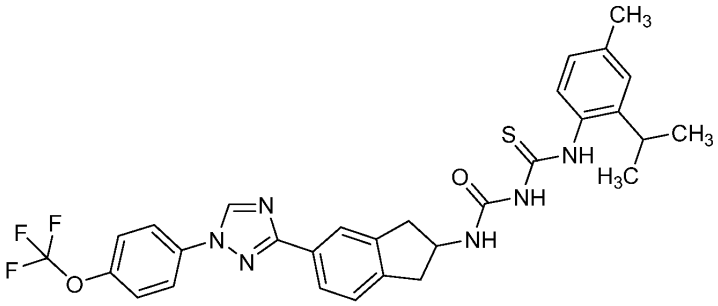
[0276] 1-[(2-이소프로필-5-메톡시-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (P4)



[0277]

[0278] 표제 화합물을 1-(2-이소프로필-5-메톡시페닐)티오우레아 (C23)를 사용하여 실시예 23에 기재된 바와 같이 제조하고, 백색 고체로서 단리하였다 (0.050 g, 8%).

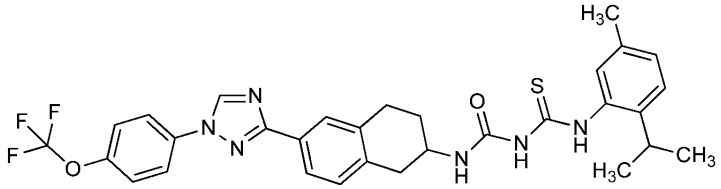
[0279] 1-[(2-이소프로필-4-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (P5)



[0280]

[0281] 표제 화합물을 1-(2-이소프로필-4-메틸페닐)티오우레아 (CA4)를 사용하여 실시예 23에 기재된 바와 같이 제조하고, 연녹색 고체로서 단리하였다 (0.040 g, 7%).

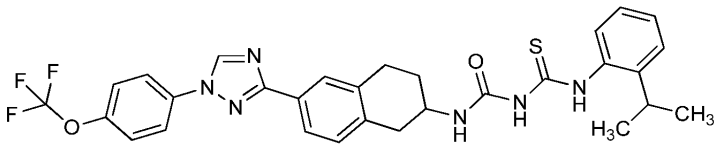
[0282] 1-[(2-이소프로필-5-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[6-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]테트랄린-2-일]우레아 (P21)



[0283]

[0284] 표제 화합물을 1-(2-이소프로필-5-메틸페닐)티오우레아를 사용하여 실시예 23에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.1 g, 26%).

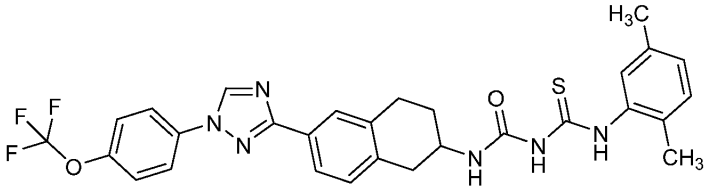
[0285] 1-[(2-이소프로필페닐)카르바모티오일]-3-[6-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]테트랄린-2-일]우레아 (P22)



[0286]

[0287] 표제 화합물을 1-(2-이소프로필페닐)티오우레아를 사용하여 실시예 23에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.090 g, 22%).

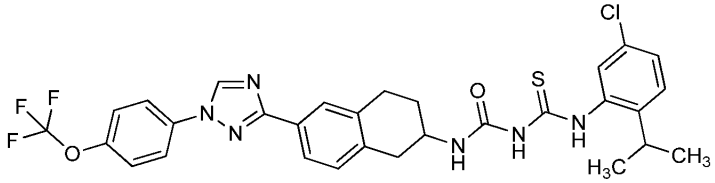
[0288] 1-[(2,5-디메틸페닐)카르바모티오일]-3-[6-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]테트랄린-2-일]우레아 (P25)



[0289]

[0290] 표제 화합물을 1-(2,5-디메틸페닐)티오우레아를 사용하여 실시예 23에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.060 g, 17%).

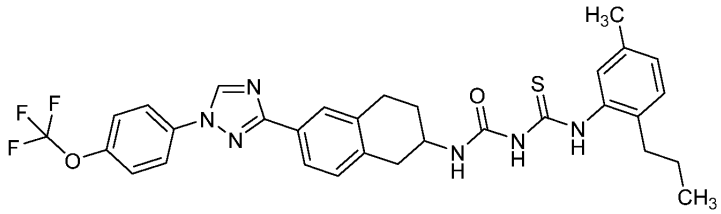
[0291] 1-[(5-클로로-2-이소프로필-페닐)카르바모티오일]-3-[6-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]테트랄린-2-일]우레아 (P26)



[0292]

[0293] 표제 화합물을 1-(5-클로로-2-이소프로필페닐)티오우레아 (C24)를 사용하여 실시예 23에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.090 g, 23%).

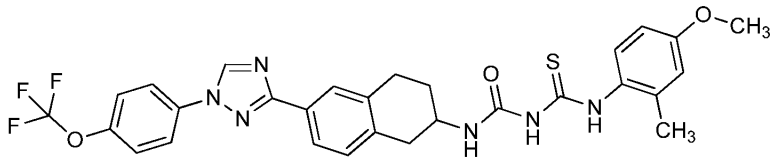
[0294] 1-[(5-메틸-2-프로필-페닐)카르바모티오일]-3-[6-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]테트랄린-2-일]우레아 (P27)



[0295]

[0296] 표제 화합물을 1-(5-메틸-2-프로필페닐)티오우레아 (C20)를 사용하여 실시예 23에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.095 g, 25%).

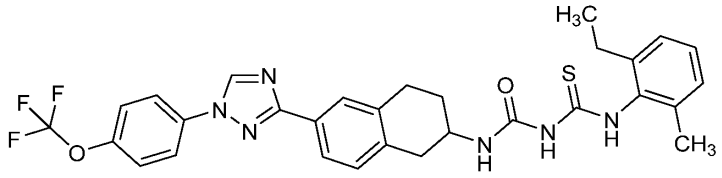
[0297] 1-[(4-메톡시-2-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[6-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]테트랄린-2-일]우레아 (P28)



[0298]

[0299] 표제 화합물을 1-(4-메톡시-2-메틸페닐)티오우레아 (CA3)를 사용하여 실시예 23에 기재된 바와 같이 제조하고, 백색 고체로서 단리하였다 (0.064 g, 10%).

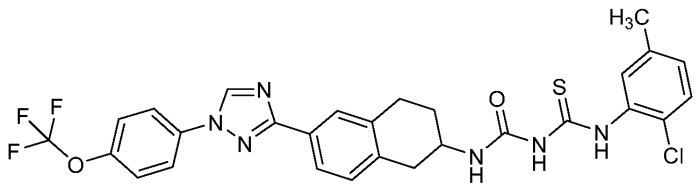
[0300] 1-[(2-에틸-6-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[6-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]테트랄린-2-일]우레아 (P29)



[0301]

[0302] 표제 화합물을 1-(2-에틸-6-메틸페닐)티오우레아 (C21)를 사용하여 실시예 23에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.120 g, 32%).

[0303] 1-[(2-클로로-5-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[6-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]테트랄린-2-일]우레아 (P30)

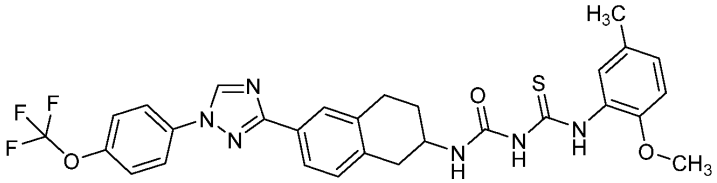


[0304]

[0305] 표제 화합물을 1-(2-클로로-5-메틸페닐)티오우레아를 사용하여 실시예 23에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색

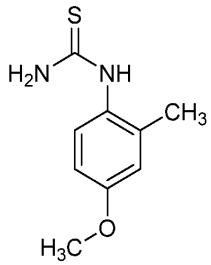
고체로서 단리하였다 (0.060 g, 16%).

[0306] 1-[(2-메톡시-5-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[6-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]테트랄린-2-일]우레아 (P31)

[0307] 

[0308] 표제 화합물을 1-(2-메톡시-5-메틸페닐)티오우레아를 사용하여 실시예 23에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.065 g, 18%).

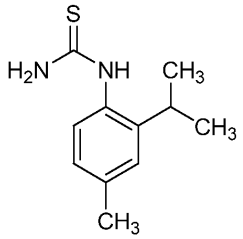
[0309] 실시예 24: 1-(4-메톡시-2-메틸페닐)티오우레아 (CA3)의 제조

[0310] 

[0311] 메탄올 (40 mL) 중 N-((4-메톡시-2-메틸페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (CA6) (4.0 g, 13 mmol)의 용액에 수산화나트륨 (2 N, 12 mL, 27 mmol)을 첨가하고, 반응 혼합물을 50℃에서 6시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고, 농축시켰다. 수성 층을 디클로로메탄으로 추출하였다. 합한 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켜 표제 화합물을 회색 고체로서 수득하였다 (1.4 g, 54%): mp 198-200℃; ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 9.06 (s, 1H), 7.50 (bs, 1H), 7.03 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 6.74 (dd, J = 9.0, 8.4 Hz, 1H), 3.73 (s, 3H), 2.14 (s, 3H); ESIMS m/z 197 ([M+H]$^+$).

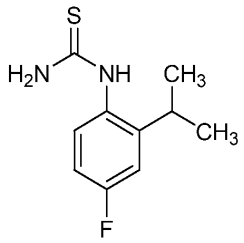
[0312] 하기 화합물을 실시예 24에서의 절차에 따라 제조하였다:

[0313] 1-(2-이소프로필-4-메틸페닐)티오우레아 (CA4)

[0314] 

[0315] 표제 화합물을 N-((2-이소프로필-4-메틸페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (CA7)를 사용하여 실시예 24에 기재된 바와 같이 제조하고, 연황색 고체로서 단리하였다 (3.0 g, 91%): mp 142-145℃; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 9.14 (s, 1H), 7.50 (bs, 1H), 7.13 (s, 1H), 6.98 (s, 2H), 6.50 (bs, 1H), 3.04 - 2.99 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.13 (d, J = 7.6 Hz, 6H); ESIMS m/z 209 ([M+H]$^+$).

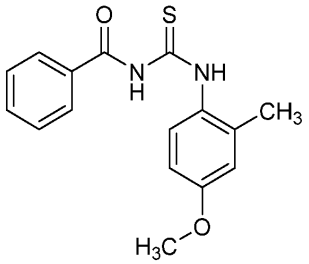
[0316] 1-(4-플루오로-2-이소프로필페닐)티오우레아 (CA5)



[0317]

[0318] 표제 화합물을 N-((4-플루오로-2-이소프로필페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (CA8)를 사용하여 실시예 24에 기재된 바와 같이 제조하고, 백색 고체로서 단리하였다 (2.8 g, 93%): mp 168-172℃; ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 9.16 (s, 1H), 7.55 (bs, 1H), 7.15 - 7.11 (m, 2H), 7.05 - 6.97 (m, 1H), 6.50 (bs, 1H), 3.05 - 3.00 (m, 1H), 1.13 (d, J = 6.8 Hz, 6H); ESIMS m/z 209 ($[M+H]^+$).

[0319] 실시예 25: N-((4-메톡시-2-메틸페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (CA6)의 제조

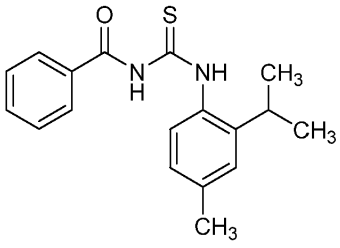


[0320]

[0321] 아세톤 (70 mL) 중 4-메톡시-2-메틸아닐린 (2.0 g, 15 mmol)의 용액에 벤조일 이소티오시아네이트 (2.0 mL, 15 mmol)를 첨가하고, 반응 혼합물을 50℃에서 16시간 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 농축시켜 표제 화합물을 회백색 고체로서 수득하였다 (4.0 g, 91%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 12.1 (s, 1H), 9.13 (s, 1H), 7.92 - 7.89 (m, 2H), 7.68 - 7.64 (m, 1H), 7.57 - 7.50 (m, 3H), 6.82 - 6.80 (m, 2H), 3.82 - 3.80 (s, 3H), 2.33 (s, 3H).

[0322] 하기 화합물을 실시예 25에서의 절차에 따라 제조하였다:

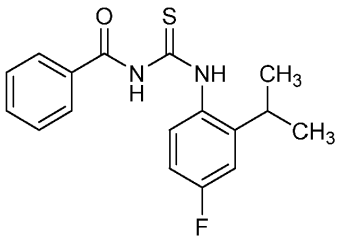
[0323] N-((2-이소프로필-4-메틸페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (CA7)



[0324]

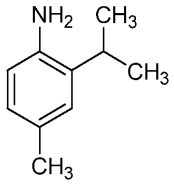
[0325] 표제 화합물을 2-이소프로필-4-메틸아닐린 (CA9)을 사용하여 실시예 25에 기재된 바와 같이 제조하고, 연황색 고체로서 단리하였다 (5.0 g, 76%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 12.1 (s, 1H), 9.15 (s, 1H), 7.92 - 7.90 (m, 2H), 7.68 - 7.64 (m, 1H), 7.58 - 7.53 (m, 2H), 7.45 - 7.43 (m, 1H), 7.17 (s, 1H), 7.08 (dd, J = 8.4, 1.6 Hz, 1H), 3.15 - 3.08 (m, 1H), 2.38 (s, 3H), 1.27 (d, J = 6.8 Hz, 6H); ESIMS m/z 313 ($[M+H]^+$).

[0326] N-((4-플루오로-2-이소프로필페닐)카르바모티오일)벤즈아미드 (CA8)

[0327] 

[0328] 표제 화합물을 4-플루오로-2-이소프로필아닐린 (CA10)을 사용하여 실시예 25에 기재된 바와 같이 제조하고, 연황색 고체로서 단리하였다 (4.5 g, 88%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 12.1 (s, 1H), 9.18 (s, 1H), 7.93 - 7.90 (m, 2H), 7.69 - 7.64 (m, 1H), 7.58 - 7.52 (m, 3H), 7.06 (dd, J = 8.4, 1.6 Hz, 1H), 6.99 - 6.94 (m, 1H), 3.15 - 3.11 (m, 1H), 1.26 (d, J = 6.8 Hz, 6H); ESIMS m/z 317 ($[M+H]^+$).

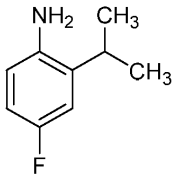
[0329] 실시예 26: 2-이소프로필-4-메틸아닐린 (CA9)의 제조

[0330] 

[0331] 에틸 아세테이트 (40 mL) 중 4-메틸-1-니트로-2-(프로프-1-엔-2-일)벤젠 (CA11) (3.6 g, 20 mmol)의 용액에 탄소 상 팔라듐 (10%, 0.50 g)을 첨가하고, 반응 혼합물을 배기시키고, 수소로 퍼징하였다. 반응 혼합물을 수소 (50 psi) 하에 24시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 셀라이트®의 패드 상에서 여과하고, 에틸 아세테이트로 세척하고, 농축시켰다. 조 생성물을 디에틸 에테르로 연화처리하여 표제 화합물을 연황색 액체로서 수득하였다 (2.8 g, 93%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 6.95 (s, 1H), 6.83 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.60 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.50 (bs, 2H), 2.93 - 2.85 (m, 1H), 2.25 (s, 3H), 1.25 (d, J = 6.9 Hz, 6H); ESIMS m/z 150 ($[M+H]^+$).

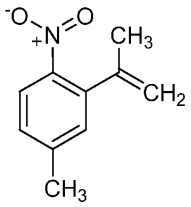
[0332] 하기 화합물을 실시예 26에서의 절차에 따라 제조하였다:

[0333] 4-플루오로-2-이소프로필아닐린 (CA10)

[0334] 

[0335] 표제 화합물을 4-플루오로-1-니트로-2-(프로프-1-엔-2-일)벤젠 (CA12)을 사용하여 실시예 26에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (2.5 g, 90%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 6.85 (dd, J = 10.5, 2.4 Hz, 1H), 6.75 - 6.69 (m, 1H), 6.63 - 6.58 (m, 1H), 3.44 (bs, 2H), 2.93 - 2.84 (m, 1H), 1.24 (d, J = 6.0 Hz, 6H); ESIMS m/z 154 ($[M+H]^+$).

[0336] 실시예 27: 4-메틸-1-니트로-2-(프로프-1-엔-2-일)벤젠 (CA11)의 제조

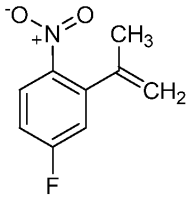


[0337]

[0338] 1,4-디옥산 및 물 (30:10 mL) 중 2-클로로-4-메틸-1-니트로벤젠 (5.0 g, 29 mmol) 및 4,4,5,5-테트라메틸-2-(프로프-1-엔-2-일)-1,3,2-디옥사보롤란 (5.9 g, 35 mmol)의 교반된 용액에 탄산나트륨 (3.7 g, 35 mmol)을 첨가하고; 반응 혼합물을 아르곤으로 10분 동안 탈기시켰다. 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II) 디클로라이드 (1.6 g, 2.3 mmol)를 반응 혼합물에 첨가하고 (추가의 5분 동안 탈기시킴), 반응 혼합물을 100℃로 16시간 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고, 물 (30 mL)로 희석하고, 에틸 아세테이트 (2 x 100 mL)로 추출하였다. 합한 유기 층을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 20-80% 에틸 아세테이트/헥산을 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 연황색 고체로서 수득하였다 (3.6 g, 73%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.81 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.10 (s, 1H), 5.15 (t, J = 1.5 Hz, 1H), 4.90 (s, 1H), 2.42 (s, 3H), 2.07 (s, 3H); ESIMS m/z 178 ($[M+H]^+$).

[0339] 하기 화합물을 실시예 27에서의 절차에 따라 제조하였다:

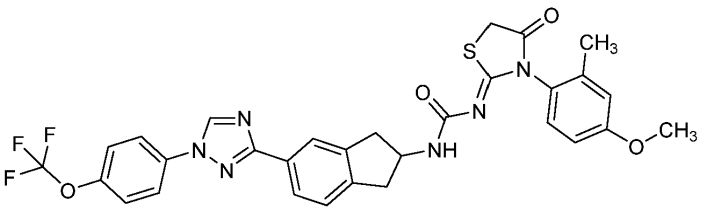
[0340] 4-플루오로-1-니트로-2-(프로프-1-엔-2-일)벤젠 (CA12)



[0341]

[0342] 표제 화합물을 2-클로로-4-플루오로-1-니트로벤젠을 사용하여 실시예 27에 기재된 바와 같이 제조하고, 연황색 액체로서 단리하였다 (2.6 g, 84%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.97 - 7.93 (m, 1H), 7.10 - 7.06 (m, 1H), 7.01 (dd, J = 8.8, 2.8 Hz 1H), 5.19 (t, J = 1.6 Hz, 1H), 4.96 (s, 1H), 2.08 (s, 3H); ESIMS m/z 182 ($[M+H]^+$).

[0343] 실시예 28: (Z)-1-(3-(4-메톡시-2-메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (P6)의 제조

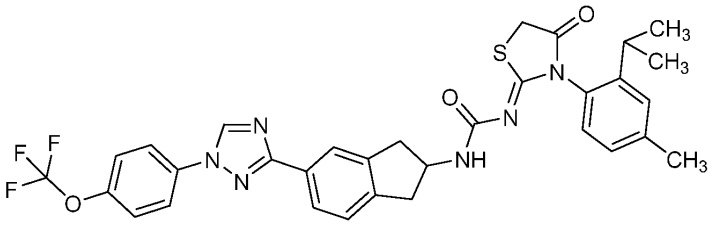


[0344]

[0345] 에탄올 (5 mL) 중 3-(2-이소시아네이토-2,3-디히드로-1H-인덴-5-일)-1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸 (P1) (0.40 g, 0.69 mmol)의 용액에 아세트산나트륨 (0.12 g, 1.4 mmol) 및 메틸 2-브로모아세테이트 (0.10 mL, 1.0 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 70℃로 밤새 가열하고, 실온으로 냉각시키고, 에틸 아세테이트로 희석하였다. 수성 층을 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 70-80% 아세토니트릴/0.1% 포름산/물을 사용하여 역상 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 연황색 고체로서 수득하였다 (0.12 g, 28%).

[0346] 하기 화합물을 실시예 28에서의 절차에 따라 제조하였다:

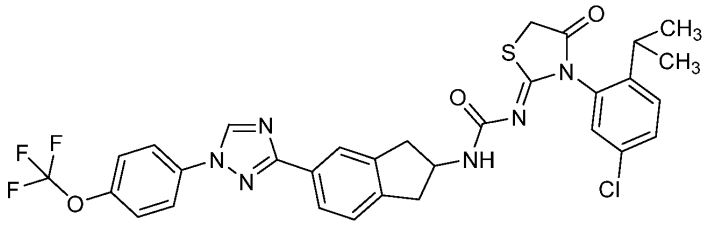
[0347] (Z)-1-(3-(2-이소프로필-4-메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (P7)



[0348]

[0349] 표제 화합물을 1-[(2-이소프로필-4-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (P5)를 사용하여 실시예 28에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.090 g, 14%).

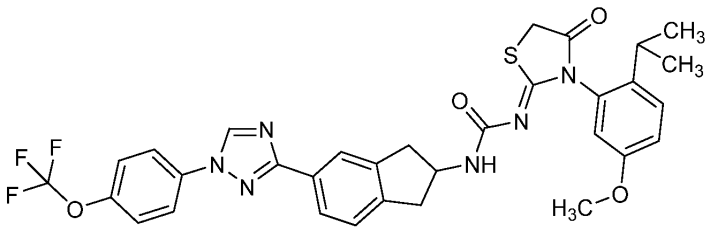
[0350] (Z)-1-(3-(5-클로로-2-이소프로필페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (P8)



[0351]

[0352] 표제 화합물을 1-[(5-클로로-2-이소프로필-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (P3)를 사용하여 실시예 28에 기재된 바와 같이 제조하고, 연황색 액체로서 단리하였다 (0.060 g, 23%).

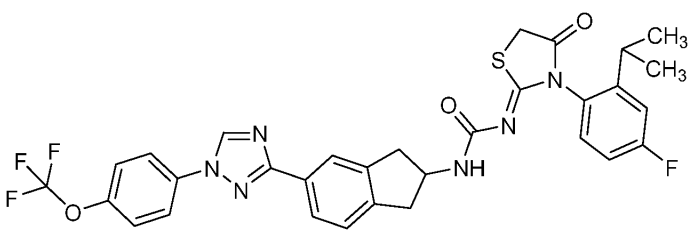
[0353] (Z)-1-(3-(2-이소프로필-5-메톡시페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (P9)



[0354]

[0355] 표제 화합물을 1-[(2-이소프로필-5-메톡시-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (P4)를 사용하여 실시예 28에 기재된 바와 같이 제조하고, 연황색 고체로서 단리하였다 (0.095 g, 15%).

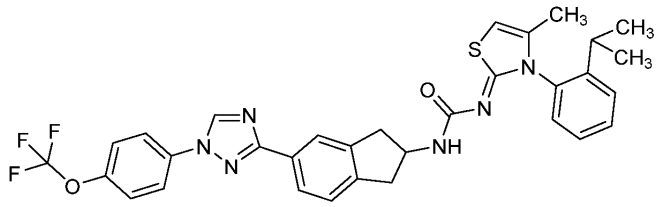
[0356] (Z)-1-(3-(4-플루오로-2-이소프로필페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (P10)



[0357]

[0358] 표제 화합물을 1-[(4-플루오로-2-이소프로필-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (P2)를 사용하여 실시예 28에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.190 g, 35%).

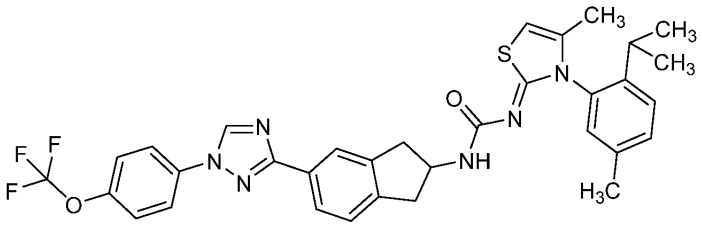
[0359] 실시예 29: (Z)-1-(3-(2-이소프로필페닐)-4-메틸티아졸-2(3H)-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (FA1)의 제조

[0360] 

[0361] 2-부타논 (5 mL) 중 1-[(2-이소프로필페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F14) (0.30 g, 0.52 mmol)의 용액에 트리에틸아민 (0.080 mL, 0.57 mmol)에 이어 클로로아세톤 (0.047 mL, 0.57 mmol)을 첨가하고, 반응 혼합물을 80℃에서 16시간 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고, 물로 희석하였다. 수성 층을 디클로로메탄 (2 x 25 mL)으로 추출하고, 분리하였다. 합한 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 정제용 고압 액체 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 연갈색 고체로서 수득하였다 (0.055 g, 19%).

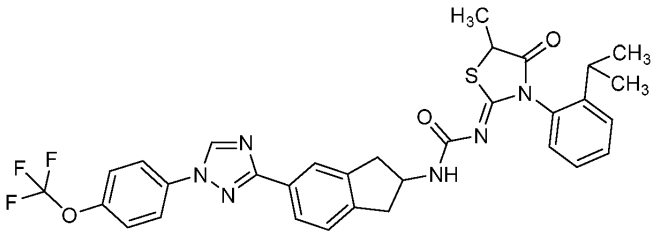
[0362] 하기 화합물을 실시예 29에서의 절차에 따라 제조하였다:

[0363] (Z)-1-(3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-4-메틸티아졸-2(3H)-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (P12)

[0364] 

[0365] 표제 화합물을 1-[(2-이소프로필-5-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F1)를 사용하여 실시예 29에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.030 g, 11%).

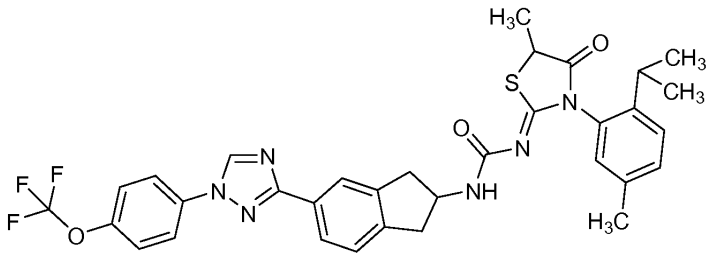
[0366] 실시예 30: (Z)-1-(3-(2-이소프로필페닐)-5-메틸-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (FA2)의 제조

[0367] 

[0368] 에탄올 (2 mL) 중 1-[(2-이소프로필페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F14) (0.25 g, 0.43 mmol)의 용액에 아세트산나트륨 (0.078 g, 0.83 mmol) 및 메틸 2-브롬프로파노에이트 (0.072 mL, 0.65 mmol)를 첨가하고, 60℃로 16시간 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고, 물로 희석하였다. 수성 층을 에틸 아세테이트 (2 x 25 mL)로 추출하였다. 합한 유기 층을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 70-80% 아세토니트릴/0.1% 포름산/물을 사용하여 역상 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 연황색 고체로서 수득하였다 (0.11 g, 37%).

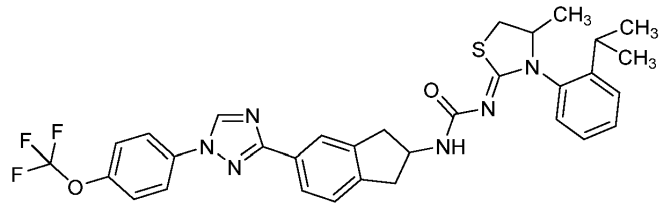
[0369] 하기 화합물을 실시예 30에서의 절차에 따라 제조하였다:

[0370] (Z)-1-(3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-5-메틸-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (P13)

[0371] 

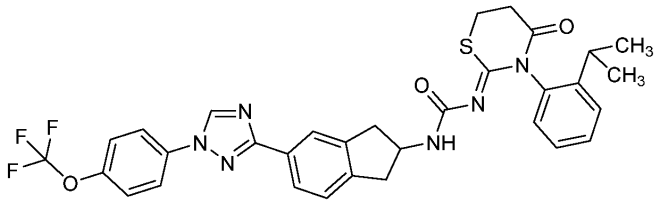
[0372] 표제 화합물을 1-[(2-이소프로필-5-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F1)를 사용하여 실시예 30에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.095 g, 35%).

[0373] 실시예 31: (Z)-1-(3-(2-이소프로필페닐)-4-메틸티아졸리딘-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (FA3)의 제조

[0374] 

[0375] 2-부타논 (3 mL) 중 1-[(2-이소프로필페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F14) (0.20 g, 0.33 mmol)의 용액에 탄산칼륨 (0.096 g, 0.52 mmol), 1,2-디브로모프로판 (0.050 mL, 0.52 mmol)을 첨가하고, 반응 혼합물을 80℃로 16시간 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고, 물로 희석하였다. 수성 층을 디클로로메탄으로 2회 추출하였다. 합한 유기 층을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 70-80% 아세토니트릴/0.1% 포름산/물을 사용하여 역상 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 연황색 고체로서 수득하였다 (0.030 g, 14%).

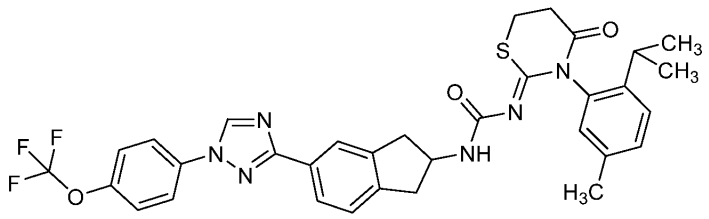
[0376] 실시예 32: (Z)-1-(3-(2-이소프로필페닐)-4-옥소-1,3-티아지난-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (FA4)의 제조

[0377] 

[0378] 2-부타논 (2 mL) 중 1-[(2-이소프로필-5-메틸-페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F1) (0.30 g, 0.52 mmol)의 용액에 아크릴로일 클로라이드 (0.050 mL, 0.62 mmol)를 첨가하고, 40℃에서 4시간 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고, 농축시켰다. 용리액으로서 70-80% 아세토니트릴/0.1% 포름산/물을 사용하여 역상 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 회백색 고체로서 수득하였다 (0.016 g, 5%).

[0379] 하기 화합물을 실시예 32에서의 절차에 따라 제조하였다:

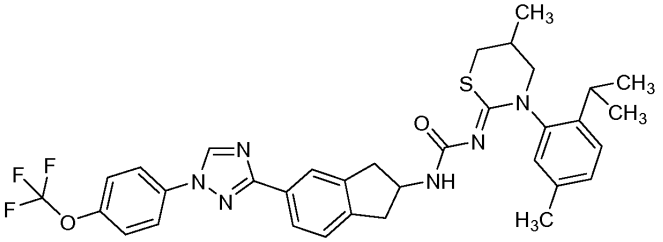
[0380] (Z)-1-(3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-4-옥소-1,3-티아지난-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (P17)



[0381]

[0382] 표제 화합물을 1-[(2-이소프로필페닐)카르바모티오일]-3-[5-[1-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1,2,4-트리아졸-3-일]인단-2-일]우레아 (F14)를 사용하여 실시예 32에 기재된 바와 같이 제조하고, 황색 고체로서 단리하였다 (0.015 g, 7%).

[0383] 실시예 33: (Z)-1-(3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-5-메틸-1,3-티아지난-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (P18)의 제조

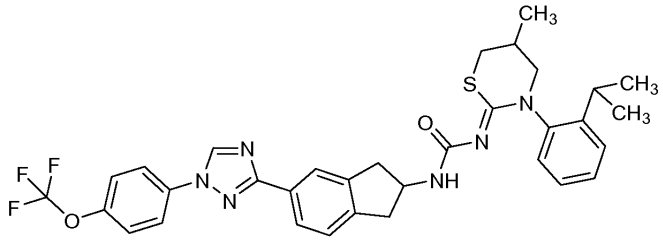


[0384]

[0385] 아세토니트릴 (10 mL) 중 3-(2-이소시아네이토-2,3-디히드로-1H-인덴-5-일)-1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸 (CA1) (0.35 g, 0.92 mmol)의 용액에 탄산세슘 (0.60 g, 1.8 mmol) 및 3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-5-메틸-1,3-티아지난-2-이민 (CA13) (0.24 g, 0.92 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 에틸 아세테이트로 희석하고, 50% 포화 염수로 세척하였다. 수성 층을 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 층을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 70-80% 아세토니트릴/0.1% 포름산/물을 사용하여 역상 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 회백색 고체로서 수득하였다 (0.10 g, 17%).

[0386] 하기 화합물을 실시예 33에서의 절차에 따라 제조하였다:

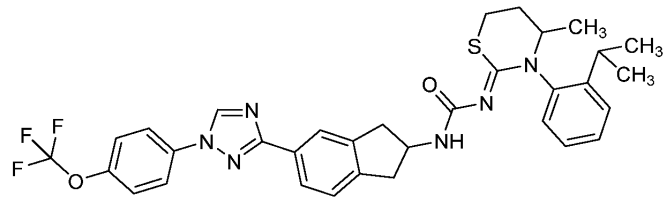
[0387] (Z)-1-(3-(2-이소프로필페닐)-5-메틸-1,3-티아지난-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (FA5)



[0388]

[0389] 표제 화합물을 3-(2-이소프로필페닐)-5-메틸-1,3-티아지난-2-이민 (CA14)을 사용하여 실시예 33에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.140 g, 28%).

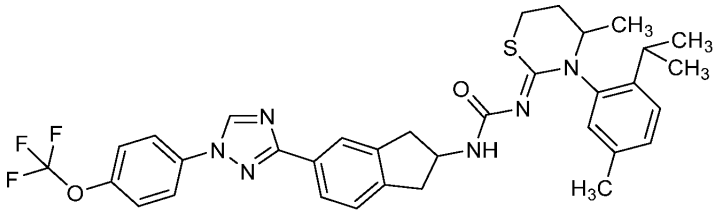
[0390] (Z)-1-(3-(2-이소프로필페닐)-4-메틸-1,3-티아지난-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (FA6)



[0391]

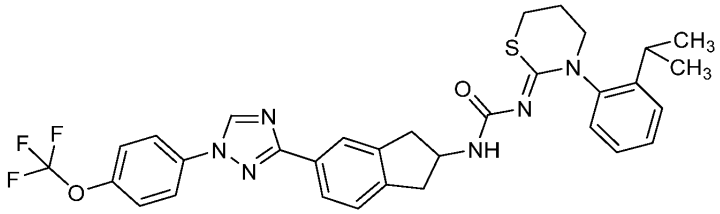
[0392] 표제 화합물을 3-(2-이소프로필페닐)-4-메틸-1,3-티아지난-2-이민 (CA16)을 사용하여 실시예 33에 기재된 바와 같이 제조하고, 연황색 고체로서 단리하였다 (0.050 g, 10%).

[0393] (Z)-1-(3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-4-메틸-1,3-티아지난-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (P16)

[0394] 

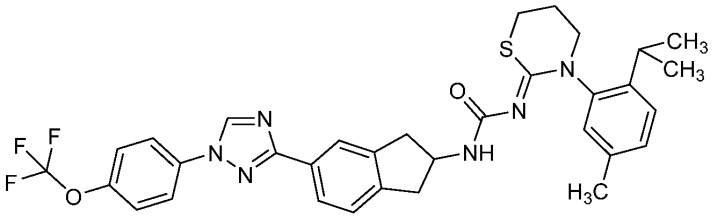
[0395] 표제 화합물을 3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-4-메틸-1,3-티아지난-2-이민 (CA15)을 사용하여 실시예 33에 기재된 바와 같이 제조하고, 황녹색 액체로서 단리하였다 (0.013 g, 3%).

[0396] (Z)-1-(3-(2-이소프로필페닐)-1,3-티아지난-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (P19)

[0397] 

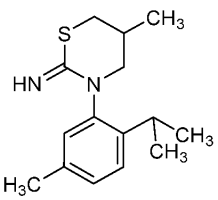
[0398] 표제 화합물을 3-(2-이소프로필페닐)-1,3-티아지난-2-이민 (CA18)을 사용하여 실시예 33에 기재된 바와 같이 제조하고, 연황색 고체로서 단리하였다 (0.060 g, 15%).

[0399] (Z)-1-(3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-1,3-티아지난-2-일리덴)-3-(5-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-2,3-디히드로-1H-인덴-2-일)우레아 (P20)

[0400] 

[0401] 표제 화합물을 3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-1,3-티아지난-2-이민 (CA17)을 사용하여 실시예 33에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.053 g, 6%).

[0402] 실시예 34: 3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-5-메틸-1,3-티아지난-2-이민 (CA13)의 제조

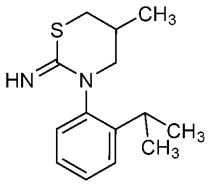
[0403] 

[0404] 2-부타논 (13 mL) 중 1-(2-이소프로필-5-메틸페닐)티오우레아 (0.50 g, 2.6 mmol)의 용액에 칼륨 (0.71 g, 5.1 mmol), 1,3-디브로모부탄 (0.46 mL, 3.9 mmol)을 첨가하고, 반응 혼합물을 60℃에서 16시간 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시켰다. 반응 혼합물을 물로 희석하고, 에틸 아세테이트로 추출하였다. 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켜 표제 화합물을 점성 오일로서 수득하

였으며, 이를 정제하지 않고 다음 단계에 사용하였다 (0.30 g, 74%): EIMS m/z 263 ($[M]^+$).

[0405] 하기 화합물을 실시예 34에서의 절차에 따라 제조하였다:

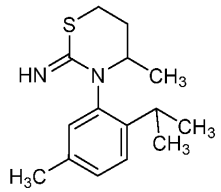
[0406] 3-(2-이소프로필페닐)-5-메틸-1,3-티아지난-2-이민 (CA14)



[0407]

[0408] 표제 화합물을 1-(2-이소프로필페닐)티오우레아를 사용하여 실시예 34에 기재된 바와 같이 제조하고, 점성 오일로서 단리하였다: ESIMS m/z 249 ($[M+H]^+$).

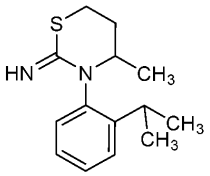
[0409] 3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-4-메틸-1,3-티아지난-2-이민 (CA15)



[0410]

[0411] 표제 화합물을 1-브로모-3-클로로-2-메틸프로판을 사용하여 실시예 34에 기재된 바와 같이 제조하고, 황갈색 오일로서 단리하였다 (0.24 g, 89%).

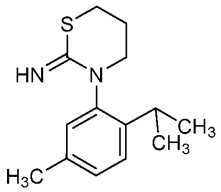
[0412] 3-(2-이소프로필페닐)-4-메틸-1,3-티아지난-2-이민 (CA16)



[0413]

[0414] 표제 화합물을 1-(2-이소프로필페닐)티오우레아 및 1-브로모-3-클로로-2-메틸프로판을 사용하여 실시예 34에 기재된 바와 같이 제조하고, 점성 오일로서 단리하였다: ESIMS m/z 249 ($[M+H]^+$).

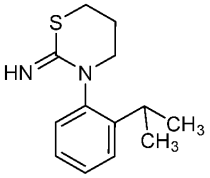
[0415] 3-(2-이소프로필-5-메틸페닐)-1,3-티아지난-2-이민 (CA17)



[0416]

[0417] 표제 화합물을 1,3-디브로모부탄을 사용하여 실시예 34에 기재된 바와 같이 제조하였다: ESIMS m/z 249 ($[M+H]^+$).

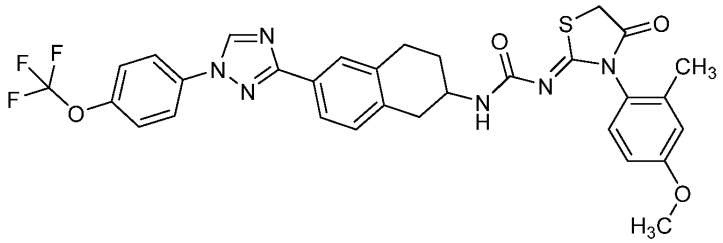
[0418] 3-(2-이소프로필페닐)-1,3-티아지난-2-이민 (CA18)



[0419]

[0420] 표제 화합물을 1-(2-이소프로필페닐)티오우레아 및 1,3-디브로모부탄을 사용하여 실시예 34에 기재된 바와 같이 제조하였다: ESIMS m/z 235 ($[M+H]^+$).

[0421] 실시예 35: (Z)-1-(3-(4-메톡시-2-메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)우레아 (P35)의 제조

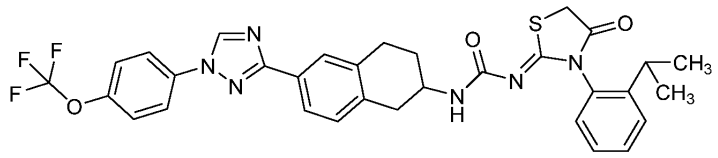


[0422]

[0423] 아세토니트릴 중 6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-아민 (C28) (0.25 g, 0.66 mmol)의 교반된 용액에 4-니트로페닐클로로포르메이트 (0.16 g, 0.80 mmol)를 실온에서 아르곤 분위기 하에 첨가하고, 1시간 동안 교반하였다. 2-이미노-3-(4-메톡시-2-메틸페닐)티아졸리딘-4-온 (CA19) (0.17 g, 0.73 mmol)에 이어 탄산세슘 (0.43 g, 1.3 mmol) 및 디이소프로필에틸아민 (0.28 g, 2.0 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 셀라이트®를 통해 여과하고, 여과물을 농축시켰다. 정제용 고압 액체 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 회백색 고체로서 수득하였다 (0.075 g, 19%).

[0424] 하기 화합물을 실시예 35에서의 절차에 따라 제조하였다:

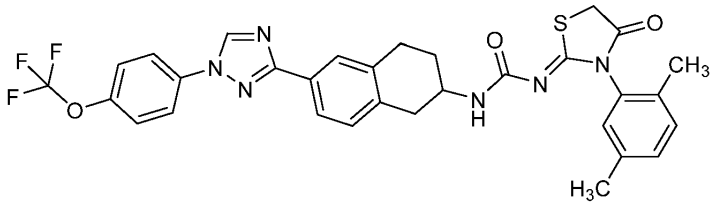
[0425] (Z)-1-(3-(2-이소프로필페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)우레아 (P24)



[0426]

[0427] 표제 화합물을 2-이미노-3-(2-이소프로필페닐)티아졸리딘-4-온 (CA24)을 사용하여 실시예 35에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.190 g, 28%).

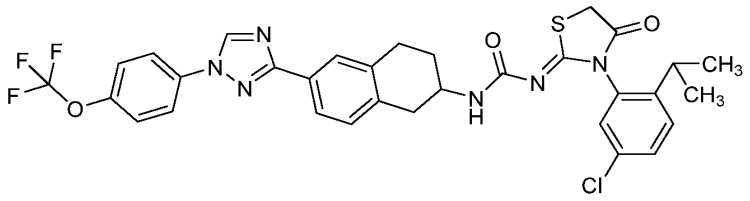
[0428] (Z)-1-(3-(2,5-디메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)우레아 (P32)



[0429]

[0430] 표제 화합물을 3-(2,5-디메틸페닐)-2-이미노티아졸리딘-4-온 (CA20)을 사용하여 실시예 35에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.090 g, 20%).

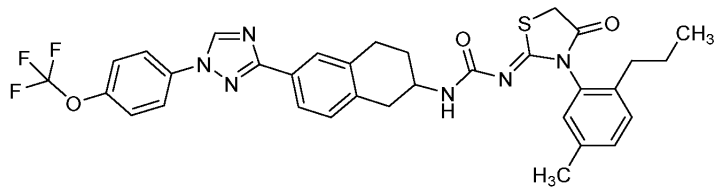
[0431] (Z)-1-(3-(5-클로로-2-이소프로필페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)우레아 (P33)



[0432]

[0433] 표제 화합물을 3-(5-클로로-2-이소프로필페닐)-2-이미노티아졸리딘-4-온 (CA22)을 사용하여 실시예 35에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.030 g, 8%).

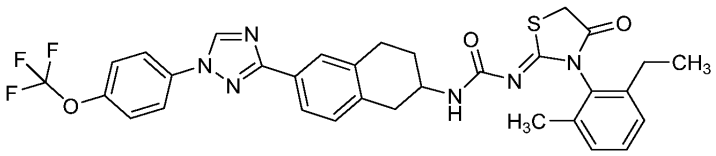
[0434] (Z)-1-(3-(5-메틸-2-프로필페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)우레아 (P34)



[0435]

[0436] 표제 화합물을 2-이미노-3-(5-메틸-2-프로필페닐)티아졸리딘-4-온 (CA25)을 사용하여 실시예 35에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.055 g, 14%).

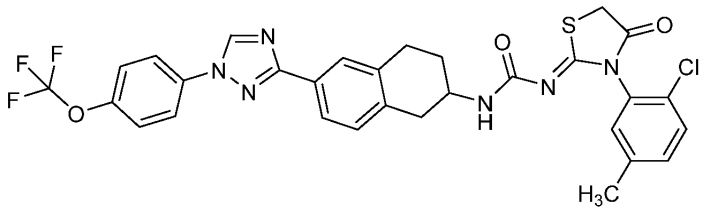
[0437] (Z)-1-(3-(2-에틸-6-메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)우레아 (P36)



[0438]

[0439] 표제 화합물을 3-(2-에틸-6-메틸페닐)-2-이미노티아졸리딘-4-온 (CA21)을 사용하여 실시예 35에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.100 g, 25%).

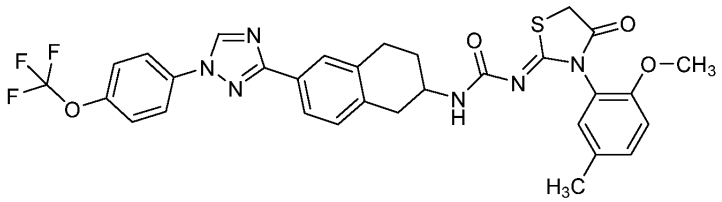
[0440] (Z)-1-(3-(2-클로로-5-메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)우레아 (P37)



[0441]

[0442] 표제 화합물을 3-(2-클로로-5-메틸페닐)-2-이미노티아졸리딘-4-온 (CA23)을 사용하여 실시예 35에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.050 g, 10%).

[0443] (Z)-1-(3-(2-메톡시-5-메틸페닐)-4-옥소티아졸리딘-2-일리덴)-3-(6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)우레아 (P38)

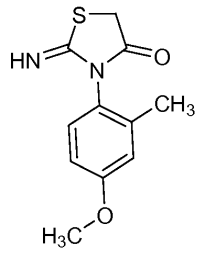


[0444]

[0445] 표제 화합물을 2-이미노-3-(2-메톡시-5-메틸페닐)티아졸리딘-4-온 (CA26)을 사용하여 실시예 35에 기재된 바와

같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.120 g, 30%).

[0446] 실시예 36: 2-이미노-3-(4-메톡시-2-메틸페닐)티아졸리딘-4-온 (CA19)의 제조

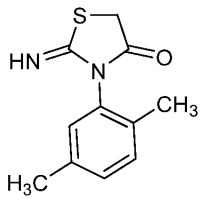


[0447]

[0448] 아세톤 (15 mL) 및 티오시안산칼륨 (0.636 g, 6.55 mmol) 중 N-카르바모티오일-2-클로로-N-(4-메톡시-2-메틸페닐)아세트아미드 (CA27) (0.700 g, 3.27 mmol)의 용액을 환류 하에 5시간 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시킨 후에 탄산세슘 (0.0550 g, 0.160 mmol)을 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 5시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 농축시키고, 잔류물을 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 회백색 고체로서 수득하였으며, 이를 추가로 정제하지 않고 사용하였다 (0.650 g, 84%): ESIMS m/z 237 ($[M+H]^+$).

[0449] 하기 화합물을 실시예 36에서의 절차에 따라 제조하였다:

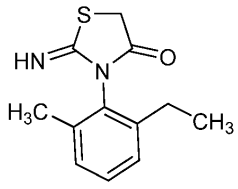
[0450] 3-(2,5-디메틸페닐)-2-이미노티아졸리딘-4-온 (CA20)



[0451]

[0452] 표제 화합물을 N-카르바모티오일-2-클로로-N-(2,5-디메틸페닐)아세트아미드 (CA28)를 사용하여 실시예 36에 기재된 바와 같이 제조하고, 갈색 액체로서 단리하였다 (0.800 g, 44%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.84 (br s, 1H), 7.23 - 7.19 (m, 2H), 6.94 (s, 1H), 4.08 (s, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.12 (s, 3H); ESIMS m/z 221 ($[M+H]^+$).

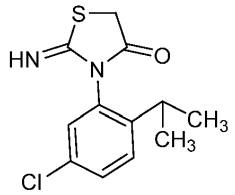
[0453] 3-(2-에틸-6-메틸페닐)-2-이미노티아졸리딘-4-온 (CA21)



[0454]

[0455] 표제 화합물을 N-카르바모티오일-2-클로로-N-(2-에틸-6-메틸페닐)아세트아미드 (CA29)를 사용하여 실시예 36에 기재된 바와 같이 제조하고, 연갈색 고체로서 단리하였다 (1.3 g, 81%): mp 120-123℃; ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.83 (br s, 1H), 7.31 - 7.19 (m, 3H), 4.18 - 4.03 (m, 2H), 2.47 (q , J = 7.2 Hz, 2H), 2.21 - 2.03 (s, 3H), 1.18 (t, J = 6.8 Hz, 3H); ESIMS m/z 235 ($[M+H]^+$).

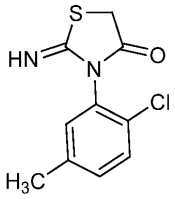
[0456] 3-(5-클로로-2-이소프로필페닐)-2-이미노티아졸리딘-4-온 (CA22)



[0457]

[0458] 표제 화합물을 N-카르바모티오일-2-클로로-N-(5-클로로-2-이소프로필페닐)아세트아미드 (CA30)를 사용하여 실시예 36에 기재된 바와 같이 제조하고, 연황색 액체로서 단리하였다 (0.450 g, 40%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.89 (br s, 1H), 7.41 (br s, 1H), 7.11 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 4.10 (br s, 2H), 2.70 (m, 1H), 1.24 - 1.19 (m, 6H); ESIMS m/z 269 ($[M+H]^+$).

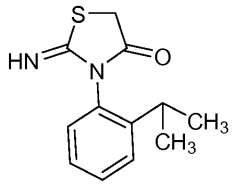
[0459] 3-(2-클로로-5-메틸페닐)-2-이미노티아졸리딘-4-온 (CA23)



[0460]

[0461] 표제 화합물을 N-카르바모티오일-2-클로로-N-(2-클로로-5-메틸페닐)아세트아미드 (CA31)를 사용하여 실시예 36에 기재된 바와 같이 제조하고, 연갈색 고체로서 단리하였다 (0.700 g, 45%): mp 128-129℃; ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.87 (br s, 1H), 7.44 (br d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.24 (br s, 1H), 7.11 (s, 1H), 4.17 - 4.04 (m, 4H), 2.38 (s, 3H); ESIMS m/z 241 ($[M+H]^+$).

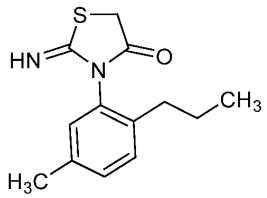
[0462] 2-이미노-3-(2-이소프로필페닐)티아졸리딘-4-온 (CA24)



[0463]

[0464] 표제 화합물을 N-카르바모티오일-2-클로로-N-(2-이소프로필페닐)아세트아미드 (CA32)를 사용하여 실시예 36에 기재된 바와 같이 제조하고, 갈색 액체로서 단리하였다 (2.1 g, 63%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.48 (m, 2H), 7.37 - 7.29 (m, 1H), 7.08 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 4.09 (s, 2H), 2.65 - 2.78 (m, 1H), 1.20 (dd, J = 6.6, 2.2 Hz, 6H); ESIMS m/z 235 ($[M+H]^+$).

[0465] 2-이미노-3-(5-메틸-2-프로필페닐)티아졸리딘-4-온 (CA25)

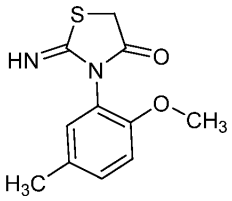


[0466]

[0467] 표제 화합물을 N-카르바모티오일-2-클로로-N-(5-메틸-2-프로필페닐)아세트아미드 (CA33)를 사용하여 실시예 36에 기재된 바와 같이 제조하고, 갈색 액체로서 단리하였다 (0.600 g, 34%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.84

(br s, 1H), 7.29 (m, 2H), 6.92 (s, 1H), 4.10 - 4.08 (m, 2H), 2.40 - 2.35 (m, 3H), 1.60 - 1.53 (m, 2H), 0.95 - 0.89 (m, 3H); ESIMS m/z 249 ($[M+H]^+$).

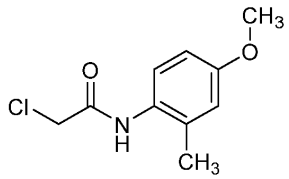
[0468] 2-이미노-3-(2-메톡시-5-메틸페닐)티아졸리딘-4-온 (CA26)



[0469]

[0470] 표제 화합물을 N-카르바모티오일-2-클로로-N-(2-메톡시-5-메틸페닐)아세트아미드 (CA34)를 사용하여 실시예 36에 기재된 바와 같이 제조하고, 연갈색 고체로서 단리하였다 (0.650 g, 37%): mp 118-121℃; ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.22 (s, 1H), 7.00 - 6.92 (m, 2H), 4.15 - 3.94 (m, 2H), 3.79 (s, 3H), 2.32 (s, 3H); ESIMS m/z 237 ($[M+H]^+$).

[0471] 실시예 37: 2-클로로-N-(4-메톡시-2-메틸페닐)아세트아미드 (CA27)의 제조

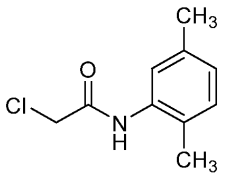


[0472]

[0473] 에틸 아세테이트 (25 mL) 중 4-메톡시-2-메틸아닐린 (0.500 g, 4.00 mmol) 및 중탄산나트륨 (0.600 g, 7.21 mmol)의 용액에 2-클로로아세틸 클로라이드 (0.490 g, 4.40 mmol)를 실온에서 적가하였다. 반응 혼합물을 6시간 동안 교반하였다. 반응물을 농축시키고, n-펜탄으로 연화처리하고, 여과하고, 건조시켜 표제 화합물을 회백색 고체로서 수득하였다 (0.650 g, 76%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.05 (s, 1H), 7.62 - 7.58 (m, 1H), 6.77 - 6.74 (dd, J = 7.6, 4.2 Hz, 1H), 4.22 (s, 2H), 3.79 (s, 3H), 2.26 (s, 3H); ESIMS m/z 212 ($[M+H]^+$).

[0474] 하기 화합물을 실시예 37에서의 절차에 따라 제조하였다:

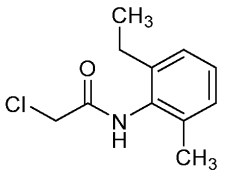
[0475] 2-클로로-N-(2,5-디메틸페닐)아세트아미드 (CA28)



[0476]

[0477] 표제 화합물을 2,5-디메틸아닐린을 사용하여 실시예 37에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (1.6 g, 98%): ESIMS m/z 198 ($[M+H]^+$).

[0478] 2-클로로-N-(2-에틸-6-메틸페닐)아세트아미드 (CA29)

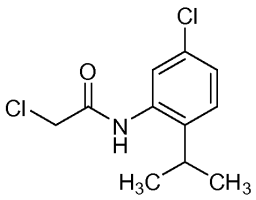


[0479]

[0480] 표제 화합물을 2-에틸-6-메틸아닐린을 사용하여 실시예 37에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리

하였다 (1.5 g, 96%): ESIMS m/z 212 ([M+H]$^+$).

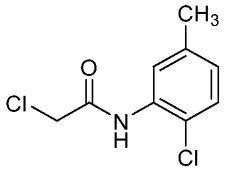
[0481] 2-클로로-N-(5-클로로-2-이소프로필페닐)아세트아미드 (CA30)



[0482]

[0483] 표제 화합물을 5-클로로-2-이소프로필아닐린 (C14)을 사용하여 실시예 37에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (1.0 g, 40%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.34 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.26 (m, 1H), 7.13 - 7.16 (m, 1H), 4.24 (s, 2H), 3.02 - 2.95 (m, 1H), 1.27 (d, J = 6.8 Hz, 6H); ESIMS m/z 246 ([M+H]$^+$).

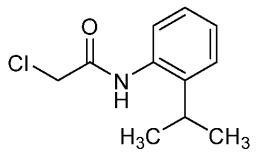
[0484] 2-클로로-N-(2-클로로-5-메틸페닐)아세트아미드 (CA31)



[0485]

[0486] 표제 화합물을 2-클로로-5-메틸아닐린을 사용하여 실시예 37에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (1.4 g, 90%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.85 (bs, 1H), 8.85 (s, 1H), 7.88 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.4 Hz, 2 Hz, 1H), 4.22 (s, 2H), 2.35 (s, 3H); ESIMS m/z 218 ([M+H]$^+$).

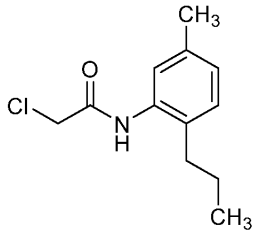
[0487] 2-클로로-N-(2-이소프로필페닐)아세트아미드 (CA32)



[0488]

[0489] 표제 화합물을 2-이소프로필아닐린을 사용하여 실시예 37에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (0.700 g, 88%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.31 (s, 1H), 7.79 - 7.76 (m, 1H), 7.33 - 7.29 (m, 1H), 7.25 - 7.19 (m, 2H), 4.25 (s, 2H), 3.07 - 3.00 (m, 1H), 1.27 (d, J = 6.8 Hz, 6H); ESIMS m/z 212 ([M+H]$^+$).

[0490] 2-클로로-N-(5-메틸-2-프로필페닐)아세트아미드 (CA33)

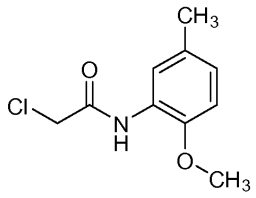


[0491]

[0492] 표제 화합물을 5-메틸-2-프로필아닐린 (C11)을 사용하여 실시예 37에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (1.7 g, 75%): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.26 (bs, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.08 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.95 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 4.23 (s, 2H), 2.54 (t, J = 7.2 Hz, 2H) 1.66 - 1.57 (m, 2H), 0.97

(t, J = 7.2 Hz, 3H); ESIMS m/z 226 ($[M+H]^+$).

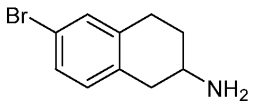
[0493] 2-클로로-N-(2-메톡시-5-메틸페닐)아세트아미드 (CA34)



[0494]

[0495] 표제 화합물을 2-메톡시-5-메틸아닐린을 사용하여 실시예 36에 기재된 바와 같이 제조하고, 회백색 고체로서 단리하였다 (1.4 g, 90%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.90 (s, 1H), 8.16 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 6.90 - 6.87 (m, 1H), 6.79 (d, J = 7.8, Hz, 1H), 4.19 (s, 2H), 3.88 (s, 3H); ESIMS m/z 214 ($[M+H]^+$).

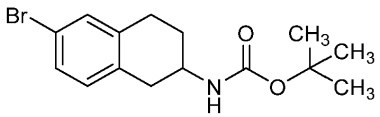
[0496] 실시예 38: 6-브로모-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-아민 (CA35)의 제조



[0497]

[0498] 메탄올 (450 mL) 중 6-브로모-3,4-디히드로나프탈렌-2(1H)-온 (25.0 g, 111 mmol), 아세트산암모늄 (5.58 g, 72.5 mmol)의 용액에 소듐 시아노보로히드라이드 (7.75 g, 123 mmol)를 4Å 분자체의 존재 하에 실온에서 첨가하였다. 반응 혼합물을 밤새 실온에서 교반하였다. 반응 혼합물을 염산 (2 N)으로 산성화시키고, 10분 동안 교반하고, 농축시켰다. 잔류물을 물에 용해시키고, 디클로로메탄 (2 x 200 mL)으로 세척하였다. 수성 층을 수산화나트륨 (2 N)으로 염기화하고, 디클로로메탄 (3 x 300 mL)으로 추출하였다. 유기 층을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켜 표제 화합물을 갈색 고체로서 수득하였다 (12.3 g, 49%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.24 (d, J = 10.8 Hz, 1H), 7.19 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.19 - 3.13 (m, 1H), 2.96 - 2.80 (m, 3H), 2.51 - 2.43 (m, 1H), 2.02 - 1.93 (m, 1H), 1.62 - 1.44 (m, 2H); ESIMS m/z 228 ($[M+H]^+$).

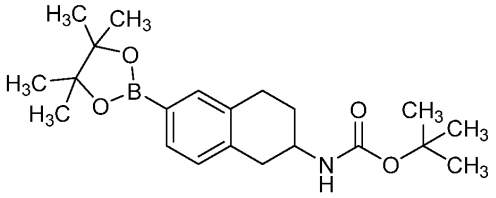
[0499] 실시예 39: tert-부틸 (6-브로모-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)카르바메이트 (CA36)의 제조



[0500]

[0501] 디클로로메탄 (90 mL) 중 6-브로모-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-아민 (CA35) (10.0 g, 44.2 mmol), 트리에틸아민 (8.95 g, 88.5 mmol)의 용액에 디-tert-부틸 디카르보네이트 (11.6 g, 53.1 mmol)를 실온에서 적가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 염수로 켄칭하고, 디클로로메탄으로 희석하였다. 분리된 유기 층을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켜 표제 화합물을 갈색 고체로서 수득하였다 (11.3 g, 77%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.26 - 7.21 (m, 2H), 6.92 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 4.54 (bs, 1H), 3.94 (bs, 1H), 3.08 - 3.01 (m, 1H), 2.87 - 2.82 (m, 2H), 2.59 - 2.51 (m, 1H), 2.07 - 2.02 (m, 1H), 1.77 - 1.67 (m, 1H), 1.45 (s, 9H); ESIMS m/z 326 ($[M+H]^+$).

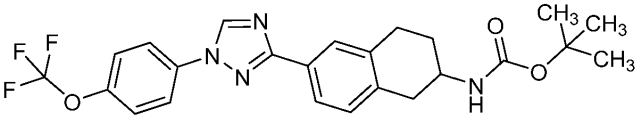
[0502] 실시예 40: tert-부틸 (6-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-디옥사보롤란-2-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)카르바메이트 (CA37)의 제조



[0503]

[0504] 디옥산 (150 mL) 중 tert-부틸 (6-브로모-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)카르바메이트 (CA36) (11.2 g, 34.3 mmol), [1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센]디클로로팔라듐(II) (1.70 g, 2.05 mmol), 비스(피나콜레이토)디보론 (10.6 g, 41.2 mmol), 및 아세트산칼륨 (6.73 g, 68.7 mmol)을 100℃에서 밤새 가열하였다. 반응물을 냉각시키고, 물로 켄칭하고, 에틸 아세테이트로 추출하였다. 유기 층을 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 30-100% 에틸 아세테이트/헥산을 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 연갈색 고체로서 수득하였다 (15.0 g, 90%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.54 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 4.65 (s, 1H), 4.05 (s, 1H), 3.10 (s, 1H), 2.90 - 2.85 (m, 2H), 2.67 - 2.62 (m, 1H), 2.05 (br s, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.33 (s, 12H); ESIMS m/z 375 ($[M+H]^+$).

[0505] 실시예 41: tert-부틸 (6-(1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)카르바메이트 (CA38)의 제조

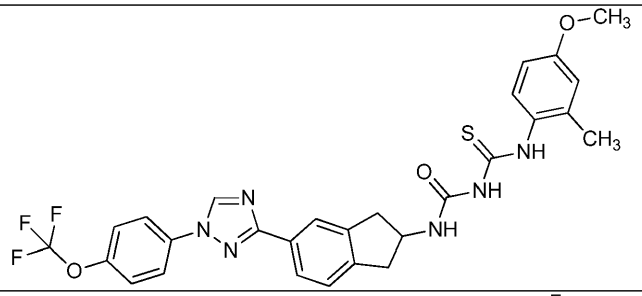
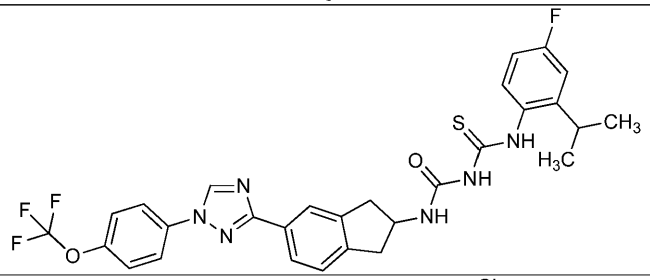
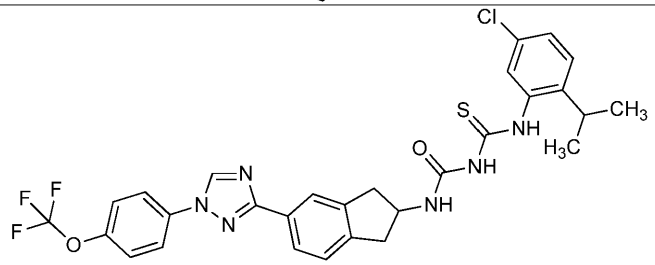
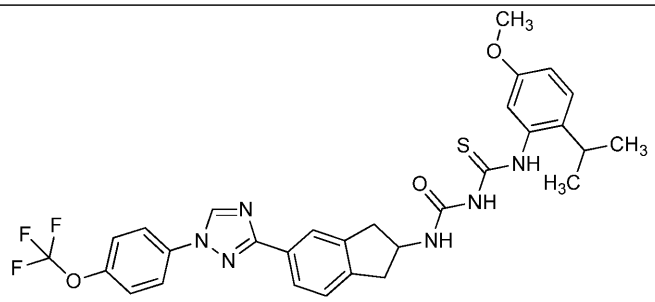


[0506]

[0507] 디옥산:물 (3:1, 420 mL) 중 3-브로모-1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,4-트리아졸 (12.0 g, 39.0 mmol)의 용액에 tert-부틸 (6-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-디옥사보롤란-2-일)-1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-2-일)카르바메이트 (CA37) (16.0 g, 42.9 mmol), 인산칼륨 (23.8 g, 112 mmol), 및 [1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센]디클로로팔라듐(II), 디클로로메탄 착물 (2.80 g, 3.42 mmol)을 첨가하였다. 반응물을 배기시키고, 질소로 퍼징하고, 100℃에서 밤새 가열하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고, 에틸 아세테이트 및 물로 희석하였다. 분리된 수성 층을 에틸 아세테이트로 추출하였다. 합한 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 용리액으로서 20-40% 에틸 아세테이트/헥산을 사용하여 플래쉬 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하여 표제 화합물을 연갈색 고체로서 수득하였다 (15.0 g, 80%): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 1H), 7.92 (m, 2H), 7.80 (dd, J =6.9, 2.1 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.17 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.17 (dd, J = 16.8 Hz, 5.1, 1H), 2.97 (t, J = 7.2, 2H), 2.72 - 2.63 (m, 1H), 2.13 - 2.08 (bs, 1H), 1.92 (s, 1H), 1.82 - 1.75 (m, 1H), 1.48 (s, 9H); ESIMS m/z 476 ($[M+H]^+$).

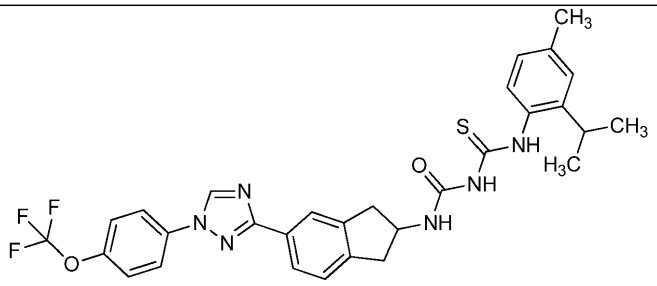
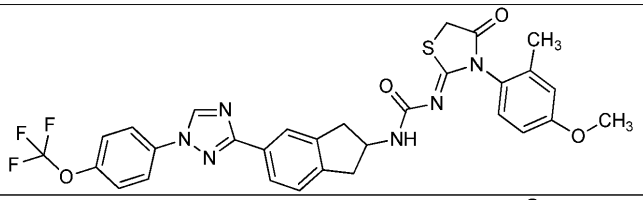
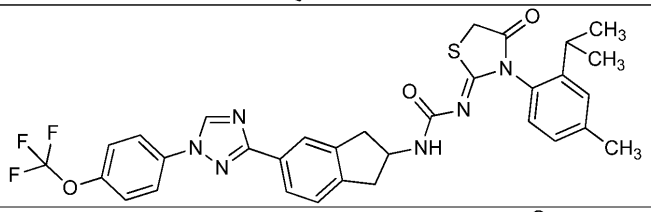
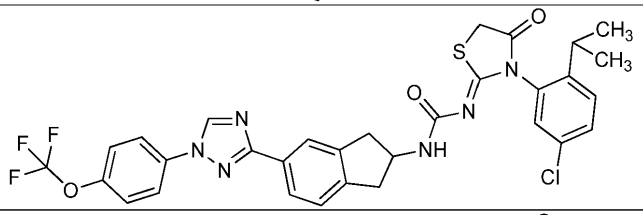
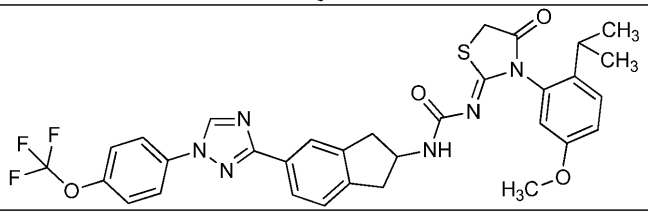
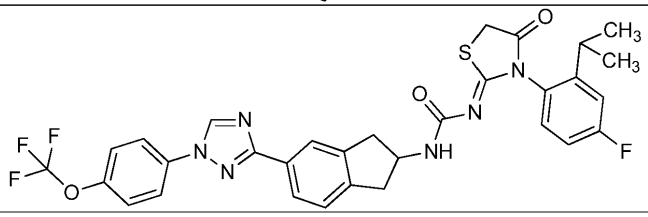
[0508] 하기 예상 분자를 상기 개시된 반응식 또는 실시예에 따라 제조할 수 있다:

[0509] [표 1] P 시리즈 화합물에 대한 구조 및 제조 방법

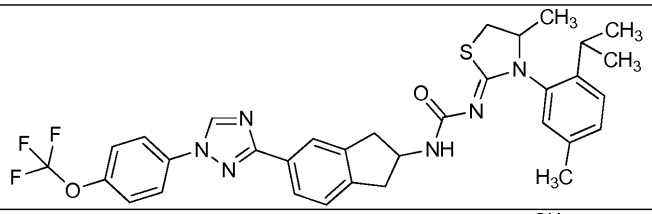
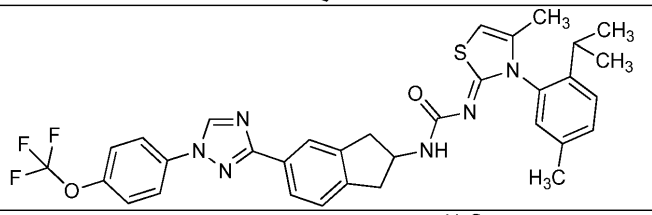
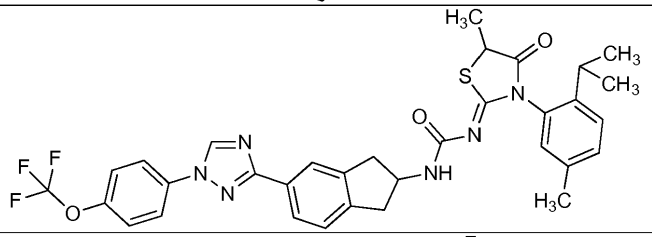
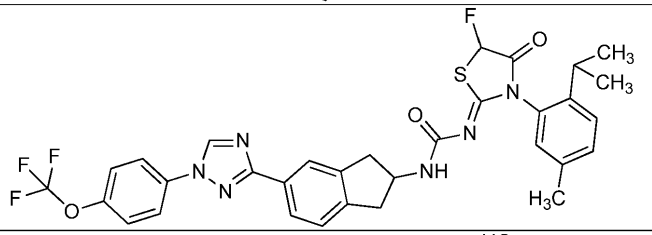
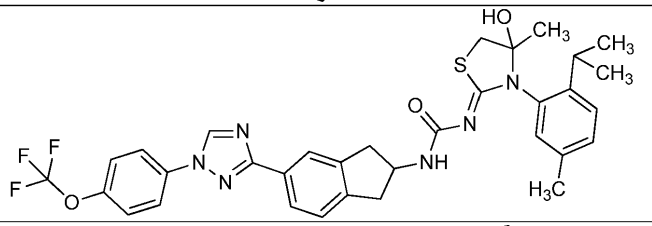
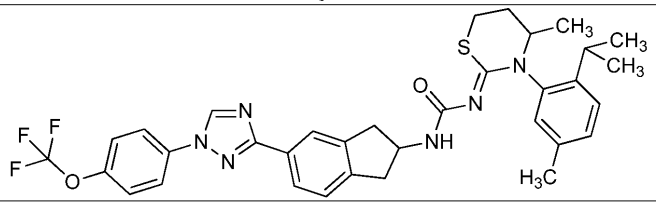
번호	구조	다음에 따라 제조될 수 있음
P1		실시예 12
P2		실시예 12
P3		실시예 12
P4		실시예 12

[0510]

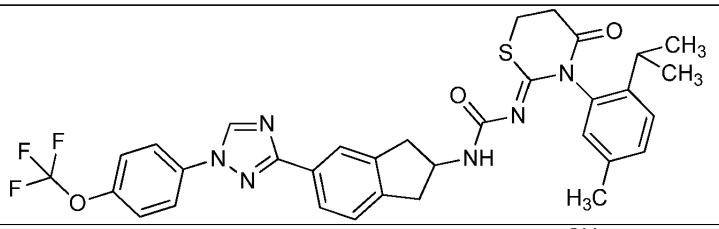
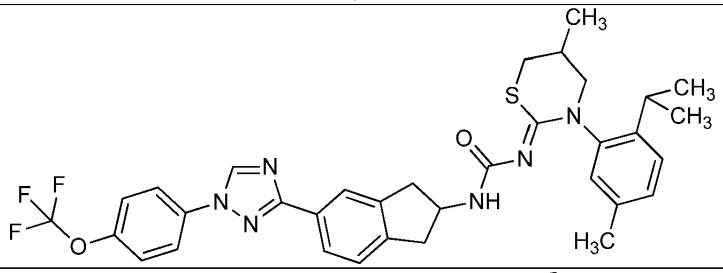
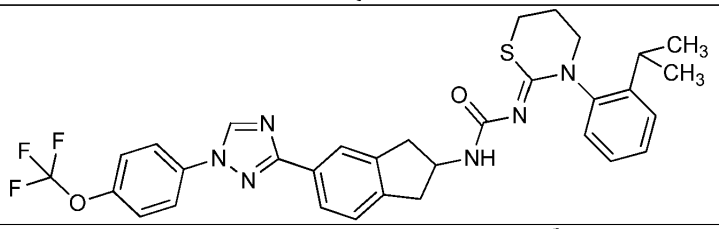
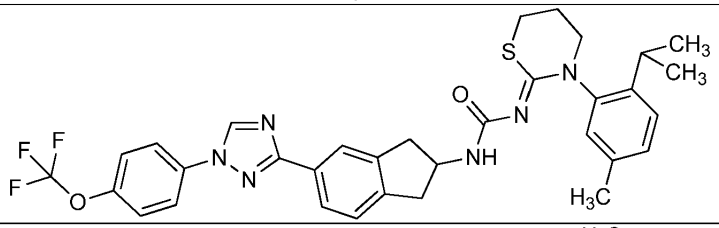
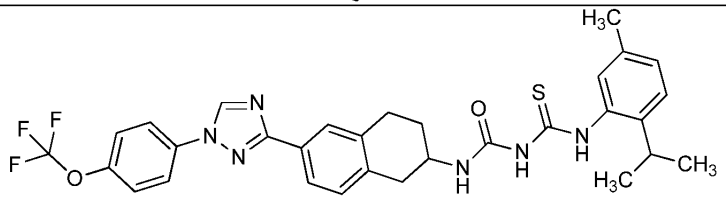
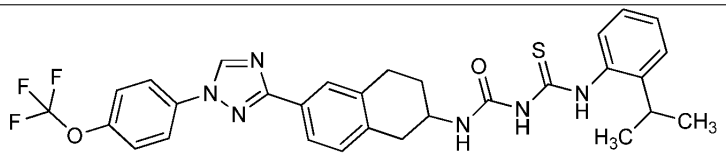
[0511]

P5		실시예 12
P6		실시예 14
P7		실시예 14
P8		실시예 14
P9		실시예 14
P10		실시예 14

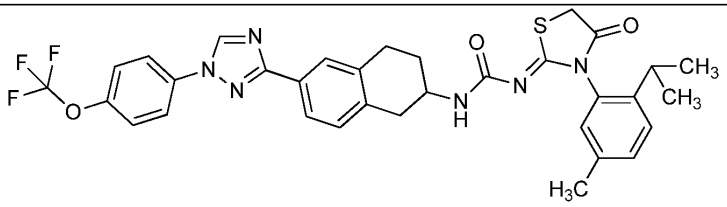
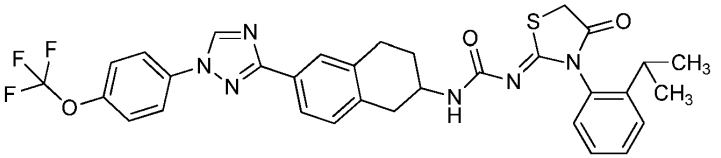
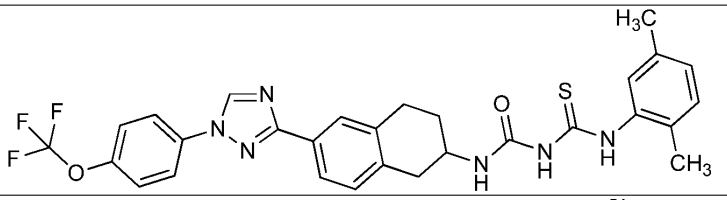
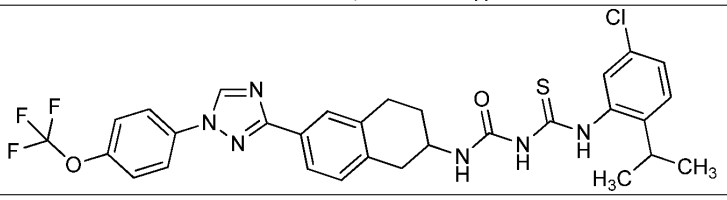
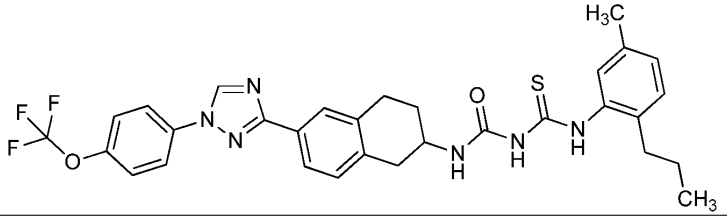
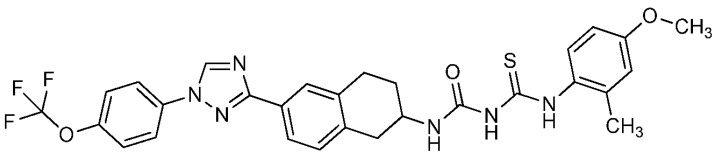
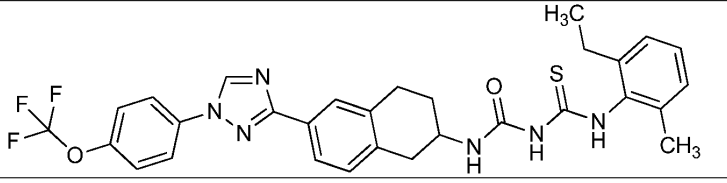
[0512]

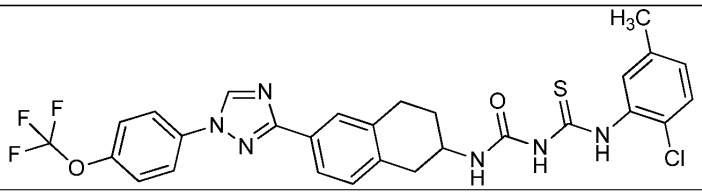
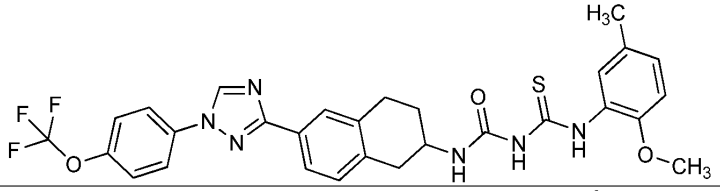
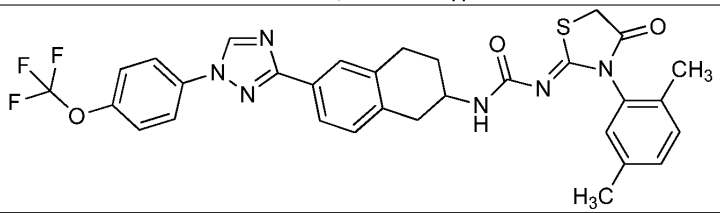
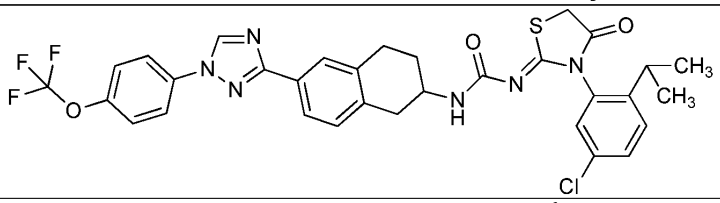
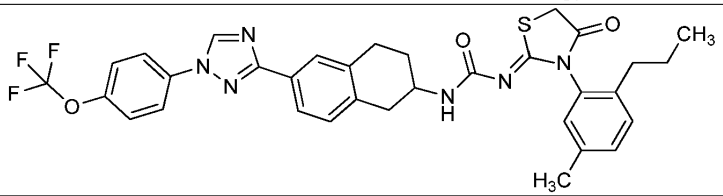
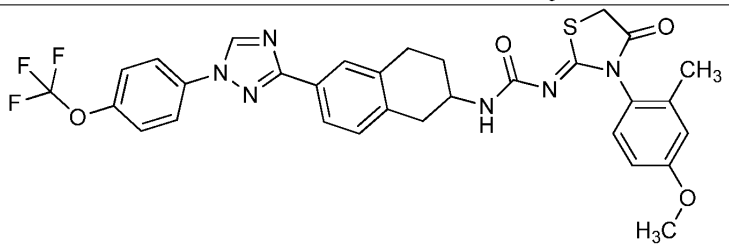
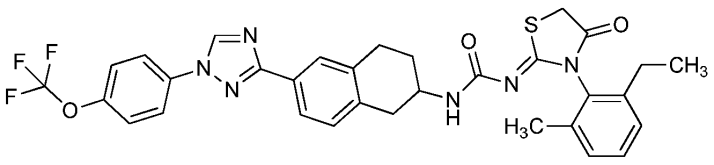
P11		반응식 3
P12		반응식 3
P13		실시예 14
P14		반응식 7
P15		반응식 3
P16		반응식 3

[0513]

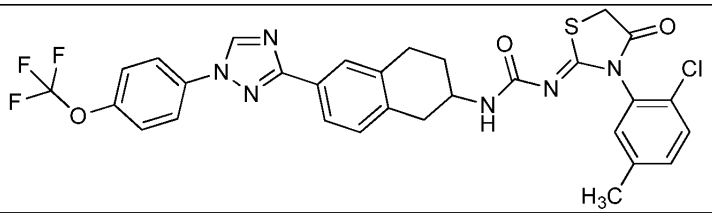
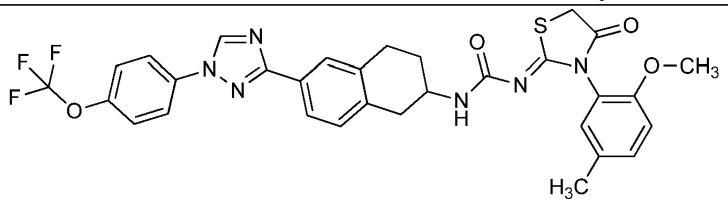
P17		반응식 3
P18		반응식 3
P19		반응식 3
P20		반응식 3
P21		실시예 12
P22		실시예 12

[0514]

P23		실시예 14
P24		실시예 14
P25		실시예 12
P26		실시예 12
P27		실시예 12
P28		실시예 12
P29		실시예 12

P30		실시예 12
P31		실시예 12
P32		실시예 14
P33		실시예 14
P34		실시예 14
P35		실시예 14
P36		실시예 14

[0515]

P37		실시예 14
P38		실시예 14

[0516]

[0517] 실시예 A: 비트 거염벌레 ("BAW") 및 양배추 자벌레 ("CL")에 대한 생물검정

[0518] BAW는 그의 집단을 감소시키는데 효과적인 기생충, 질병 또는 포식자가 거의 없다. BAW는 많은 잡초, 나무, 잔디, 콩과식물 및 재배지 작물에 침입한다. 다양한 장소에서, 다른 식물 중에서도, 아스파라거스, 목화, 옥수수, 대두, 담배, 알팔파, 사탕무, 페퍼, 토마토, 감자, 양파, 완두콩, 해바라기 및 시트러스가 경제적 관심사이다. CL은 매우 다양한 재배 식물 및 잡초를 섭식한다. 이는 크루시퍼를 용이하게 섭식하고, 브로콜리, 양배추, 콜리플라워, 배추, 콜라드, 케일, 머스타드, 무, 루타바가, 순무 및 워터크레스에 피해를 주는 것으로 보고된 바 있다. 손상되는 다른 채소 작물은 비트, 칸탈루프, 셀러리, 오이, 리마콩, 상추, 파스닙, 완두콩, 페퍼, 감자, 강낭콩, 시금치, 스쿼시, 고구마, 토마토 및 수박을 포함한다. CL은 또한 특정 살곤충제에 저항성이 있는 것으로 공지되어 있다. 결과적으로, 상기한 요인 때문에 이들 해충의 방제는 중요하다. 또한, 이들 해충을 방제하는 분자는 다른 해충을 방제하는데 유용하다.

[0519] 본원에 개시된 특정 분자를 하기 실시예에 기재된 절차를 사용하여 BAW 및 CL에 대해 시험하였다. 결과의 보고에서, "BAW & CL 등급 표"를 사용하였다 (표 섹션 참조).

[0520] BAW (스포도프테라 엑시구아(*Spodoptera exigua*))에 대한 생물검정

[0521] BAW에 대한 생물검정을 128-웰 먹이 트레이 검정을 사용하여 수행하였다. 1 내지 5마리의 제2령 BAW 유충을 1 mL의 인공 먹이로 미리 채우고 여기에 50 μg/cm^{2}의 시험 화합물 (50 μL의 90:10 아세톤-물 혼합물에 용해됨)을 (8개 웰의 각각에) 적용하고 이어서 건조시킨 먹이 트레이의 각 웰 (3 mL)에 넣었다. 트레이를 투명한 자기-접착성 커버로 덮고, 5 내지 7일 동안 14:10의 명기-암기로 25℃에서 유지하였다. 사멸률 퍼센트를 각 웰 내의 유충에 대해 기록하였고; 이어서 8개 웰에서의 활성의 평균을 구하였다. 결과는 "표 ABC: 검정 결과" 및 "표 ABCD: 검정 결과"의 제목의 표에 나타낸다 (표 섹션 참조).

[0522] CL (트리코플루시아 니(*Trichoplusia ni*))에 대한 생물검정

[0523] CL에 대한 생물검정을 128-웰 먹이 트레이 검정을 사용하여 수행하였다. 1 내지 5마리의 제2령 CL 유충을 1 mL의 인공 먹이로 미리 채우고 여기에 50 μg/cm^{2}의 시험 화합물 (50 μL의 90:10 아세톤-물 혼합물에 용해됨)을 (8개 웰의 각각에) 적용하고 이어서 건조시킨 먹이 트레이의 각 웰 (3 mL)에 넣었다. 트레이를 투명한 자기-접착성 커버로 덮고, 5 내지 7일 동안 14:10의 명기-암기로 25℃에서 유지하였다. 사멸률 퍼센트를 각 웰 내의 유충에 대해 기록하였고; 이어서 8개 웰에서의 활성의 평균을 구하였다. 결과는 "표 ABC: 검정 결과" 및 "표 ABCD: 검정 결과"의 제목의 표에 나타낸다 (표 섹션 참조).

[0524] 실시예 B: 복숭아 혹 진딧물 ("GPA") (미주스 페르시카에(*Myzus persicae*))에 대한 생물검정.

[0525] GPA는 감소된 성장, 잎의 시듦 및 다양한 조직의 사멸을 유발하는 복숭아 나무의 가장 중요한 진딧물 해충이다. 또한, 이는 식물 바이러스, 예컨대 가지/감자 솔라나세아에(*Solanaceae*) 과의 구성원에 대한 감자 바이러스 Y 및 감자 잎마름병 바이러스, 및 많은 다른 식품 작물에 대한 다양한 모자이크 바이러스의 수송을 위한 매개체로서 작용하기 때문에 유해하다. GPA는 다른 식물 중에서도, 브로콜리, 우엉, 양배추, 당근, 콜리플라워, 무, 가지, 녹색 콩, 상추, 마카다미아, 파파야, 페퍼, 고구마, 토마토, 워터크레스 및 주키니와 같은 식물을 공격한다. GPA는 또한 많은 관상 작물, 예컨대 카네이션, 국화, 흰꽃양배추, 포인세티아 및 장미를 공격한다.

GPA는 많은 살충제에 대한 저항성이 발생하였다.

[0526] 본원에 개시된 특정 분자를 하기 실시예에 기재된 절차를 사용하여 GPA에 대해 시험하였다. 결과의 보고에서, "GPA & YFM 등급 표"를 사용하였다 (표 섹션 참조).

[0527] 2-3개의 작은 (3-5 cm) 본엽을 갖는, 3-인치 화분에서 성장한 양배추 모종을 시험 물질로 사용하였다. 모종에 화학물질 적용 1일 전에 20-50 마리의 GPA (날개 없는 성체기 및 약충기)를 침입시켰다. 각 처리에 대해 개별 모종을 갖는 4개의 화분을 사용하였다. 시험 화합물 (2 mg)을 2 mL의 아세톤/MeOH (1:1) 용매 중에 용해시켜 1000 ppm 시험 화합물의 원액을 형성하였다. 원액을 물 중 0.025% 트윈(Tween) 20으로 5X 희석하여 200 ppm 시험 화합물의 용액을 수득하였다. 휴대용 흡인기-유형 분무기를 사용하여 용액이 양배추 잎의 양면으로 흘러 넘칠 때까지 분무하였다. 참조 식물 (용매 체크)에는 단지 20 부피%의 아세톤/MeOH (1:1) 용매를 함유하는 희석제를 분무하였다. 등급을 매기기 이전에, 처리한 식물을 3일 동안 대략 25℃ 및 주위 상대 습도 (RH)에서 유지실에서 유지하였다. 식물당 살아있는 진딧물의 수를 현미경 하에서 계수함으로써 평가를 수행하였다. 하기와 같은 애보트(Abbott)의 보정식 (W.S. Abbott, "A Method of Computing the Effectiveness of an Insecticide" J. Econ. Entomol. 18 (1925), pp.265-267)을 사용하여 방제 퍼센트를 측정하였다. 보정된 % 방제 = 100 * (X - Y) / X (여기서 X는 용매 체크 식물 상의 살아있는 진딧물의 수이고, Y는 처리된 식물 상의 살아있는 진딧물의 수이다). 결과는 "표 ABC: 검정 결과" 및 "표 ABCD: 검정 결과"의 제목의 표에 나타낸다 (표 섹션 참조).

[0528] 실시예 C: 황열 모기 "YFM" (아에데스 아에깁티(*Aedes aegypti*))에 대한 생물검정.

[0529] YFM은 주간 동안 인간을 무는 것을 선호하며, 인간 거주지 내에서 또는 그 근처에서 가장 빈번하게 발견된다. YFM은 여러 질병을 전염시키는 매개체이다. 이것은 뎅기열 및 황열 바이러스를 확산시킬 수 있는 모기이다. 황열은 말라리아 다음으로 두번째로 가장 위험한 모기-매개 질병이다. 황열은 급성 바이러스 출혈성 질병이며, 치료받지 않은 심각하게 감염된 사람의 50% 이하는 황열로 사망할 것이다. 전세계적으로 매년 200,000개 사례의 황열이 존재하는 것으로 추정되며, 이는 30,000명의 사망을 유발한다. 뎅기열은 심각한 바이러스성 질병이고; 이것이 발생시킬 수 있는 극심한 통증 때문에 이것은 종종 "브레이크본(breakbone) 열" 또는 "브레이크-하트(break-heart) 열"로 불린다. 뎅기열로 인해 매년 약 20,000명의 사람이 사망한다. 결과적으로, 상기 요인 때문에 이 해충의 방제가 중요하다. 또한, 흡즙 해충으로 공지된 이 해충 (YFM)을 방제하는 분자는 인간 및 동물에게 고통을 유발하는 다른 해충의 방제에 유용하다.

[0530] 본원에 개시된 특정 분자를 하기 단락에 기재된 절차를 사용하여 YFM에 대해 시험하였다. 결과의 보고에서, "GPA & YFM 등급 표"를 사용하였다 (표 섹션 참조). 100 μL의 디메틸 술폭시드 (DMSO) 중에 용해된 400 μg의 분자를 함유 (4000 ppm 용액과 동등함)하는 마스터 플레이트를 사용한다. 조립된 분자의 마스터 플레이트는 웰당 15 μL를 함유한다. 이 플레이트에, 각각의 웰에 90:10 물:아세톤 혼합물 135 μL를 첨가한다. 로봇 (바이오멕(Biomek)® NXP 래보러토리 오토메이션 워크스테이션(NXP Laboratory Automation Workstation))은 마스터 플레이트로부터 비어 있는 96-웰 얕은 플레이트 ("딸" 플레이트)에 흡인물 15 μL를 분배하도록 프로그램되어 있다. 마스터당 6개의 복제물 ("딸" 플레이트)이 생성된다. 이어서, 생성된 딸 플레이트에 즉시 YFM 유충을 침입시킨다.

[0531] 플레이트를 처리하기 전날, 간 분말을 함유하는 밀리포어수 중에 모기 알을 넣어 부화가 시작되도록 한다 (400 mL에 4 g). 로봇을 사용하여 딸 플레이트를 생성시킨 후, 이들에 간 분말/모기 유충 혼합물 (약 1일령 유충) 220 μL를 침입시킨다. 플레이트에 모기 유충을 침입시킨 후, 비-증발성 뚜껑을 사용하여 플레이트를 덮어 건조를 감소시킨다. 플레이트를 실온에서 3일 동안 유지한 후 등급을 매긴다. 3일 후, 각각의 웰을 관찰하고, 사멸률에 기초하여 점수를 매긴다.

[0532] 결과는 "표 ABC: 검정 결과" 및 "표 ABCD: 검정 결과"의 제목의 표에 나타낸다 (표 섹션 참조).

[0533] 농업상 허용되는 산 부가염, 염 유도체, 용매화물, 에스테르 유도체, 다형체, 동위원소 및 방사성핵종

[0534] 화학식 1의 분자는 살충용으로 허용되는 산 부가염으로 제제화될 수 있다. 비제한적 예로서, 아민 관능기는 염산, 브로민화수소산, 황산, 인산, 아세트산, 벤조산, 시트르산, 말론산, 살리실산, 말산, 푸마르산, 옥살산, 숙신산, 타르타르산, 락트산, 글루콘산, 아스코르브산, 말레산, 아스파르트산, 벤젠술폰산, 메탄술폰산, 에탄술폰산, 히드록시메탄술폰산 및 히드록시에탄술폰산과의 염을 형성할 수 있다. 추가적으로, 비제한적 예로서, 산 관능기는 알칼리 금속 또는 알칼리 토금속으로부터 유래된 것 및 암모니아 및 아민으로부터 유래된 것을 포함하는 염을 형성할 수 있다. 바람직한 양이온의 예는 나트륨, 칼륨 및 마그네슘을 포함한다.

[0535] 화학식 1의 분자는 염 유도체로 제제화될 수 있다. 비제한적 예로서, 염 유도체는 유리 염기를 염이 제조되기에 충분한 양의 목적하는 산과 접촉시킴으로써 제조될 수 있다. 유리 염기는 염을 적합한 묽은 염기 수용액, 예컨대 묽은 수성 수산화나트륨 (NaOH), 탄산칼륨, 암모니아 및 중탄산나트륨으로 처리함으로써 재생될 수 있다. 한 예로서, 다수의 경우에, 살충제, 예컨대 2,4-D는 그를 그의 디메틸아민 염으로 전환시킴으로써 보다 수용성이 되도록 만든다.

[0536] 화학식 1의 분자는 비착물화 용매의 제거 후에 착물이 무손상으로 남아 있도록, 용매와의 안정한 착물로 제제화될 수 있다. 이들 착물은 종종 "용매화물"로서 지칭된다. 그러나, 용매로서 물과 안정한 수화물을 형성하는 것이 특히 바람직하다.

[0537] 화학식 1의 분자는 에스테르 유도체로 제조될 수 있다. 이어서, 이들 에스테르 유도체는 본원에 개시된 본 발명이 적용되는 것과 동일한 방식으로 적용될 수 있다.

[0538] 화학식 1의 분자는 다양한 결정 다형체로서 제조될 수 있다. 다형성은 동일한 분자의 상이한 결정 다형체 또는 구조가 매우 상이한 물리적 특성 및 생물학적 성능을 가질 수 있기 때문에 농약의 개발에 중요하다.

[0539] 화학식 1의 분자는 상이한 동위원소를 사용하여 제조될 수 있다. ^{1}H 대신에 ^{2}H (중수소로 또한 공지됨)를 갖는 분자가 특히 중요하다.

[0540] 화학식 1의 분자는 상이한 방사성핵종을 사용하여 제조될 수 있다. ^{14}C를 갖는 분자가 특히 중요하다.

[0541] 입체이성질체

[0542] 화학식 1의 분자는 1종 이상의 입체이성질체로서 존재할 수 있다. 따라서, 특정 분자는 라세미 혼합물로서 제조될 수 있다. 관련 기술분야의 통상의 기술자는 1종의 입체이성질체가 다른 입체이성질체보다 더 활성일 수 있음을 인지할 것이다. 개별 입체이성질체는 공지된 선택적 합성 절차에 의해, 분할된 출발 물질을 사용하는 통상적인 합성 절차에 의해, 또는 통상적인 분해 절차에 의해 수득될 수 있다. 본원에 개시된 특정 분자는 2종 이상의 이성질체로서 존재할 수 있다. 다양한 이성질체는 기하 이성질체, 부분입체이성질체 및 거울상이성질체를 포함한다. 따라서, 본원에 개시된 분자는 기하 이성질체, 라세미 혼합물, 개별 입체이성질체 및 광학 활성 혼합물을 포함한다. 관련 기술분야의 통상의 기술자는 1종의 이성질체가 다른 것보다 더 활성일 수 있음을 인지할 것이다. 본 개시내용에 개시된 구조는 명료성을 위해 단지 하나의 기하학적 형태로 도시되지만, 분자의 모든 기하학적 형태를 나타내는 것으로 의도된다.

[0543] 조합

[0544] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 각각 화학식 1의 분자의 작용 방식 ("MoA")과 동일하거나, 유사하거나, 또는 상이한 작용 방식을 각각 갖는 1종 이상의 화합물과 조합되어 (예컨대, 조성 혼합물로, 또는 동시 또는 순차적 적용으로) 사용될 수 있다. 작용 방식은 예를 들어 하기: 아세틸콜린에스테라제 (AChE) 억제제; GABA-게이팅 클로라이드 채널 길항제; 나트륨 채널 조정제; 니코틴산 아세틸콜린 (nAChR) 효능제; 니코틴성 아세틸콜린 수용체 (nAChR) 알로스테릭 활성화제; 클로라이드 채널 활성화제; 유충 호르몬 모방체; 기타 비-특이적 (다중-부위) 억제제; 선택적 동시류 섭식 차단제; 응애 성장 억제제; 곤충 중장 막의 미생물 파괴제; 미토콘드리아 ATP 신타제의 억제제; 양성자 구배의 붕괴를 통한 산화성 인산화의 탈커플링제; 니코틴성 아세틸콜린 수용체 (nAChR) 채널 차단제; 키틴 생합성 억제제, 유형 0; 키틴 생합성 억제제, 유형 1; 탈피 교란제, 쌍시류; 엑디손 수용체 효능제; 옥토파민 수용체 효능제; 미토콘드리아 복합체 III 전자 수송 억제제; 미토콘드리아 복합체 I 전자 수송 억제제; 전압-의존성 나트륨 채널 차단제; 아세틸 CoA 카르복실라제의 억제제; 미토콘드리아 복합체 IV 전자 수송 억제제; 미토콘드리아 복합체 II 전자 수송 억제제; 및 리아노딘 수용체 조정제를 포함한다.

[0545] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 살진드기, 살조, 살금, 살박테리아, 살진균, 제초, 살곤충, 살연체동물, 살선충, 살서 및/또는 살바이러스 특성을 갖는 1종 이상의 화합물과 조합하여 (예컨대 조성 혼합물로, 또는 동시 또는 순차적 적용으로) 사용될 수 있다.

[0546] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 항섭식제, 조류 기피제, 화학불임제, 제초체 완화제, 곤충 유인제, 곤충 기피제, 포유동물 기피제, 교미 교란제, 식물 활성화제, 식물 성장 조절제 및/또는 상승작용제인 1종 이상의 화합물과 조합하여 (예컨대 조성 혼합물로, 또는 동시 또는 순차적 적용으로) 사용될 수 있다.

[0547] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 "또 다른 화합물", 예컨대 하기 화합물 중 1종 이상과 조합하여 (예

컨대 조성 혼합물로, 또는 동시 또는 순차적 적용으로) 사용될 수 있다 - (3-에톡시프로필)수은 브로마이드, 1,2-디클로로프로판, 1,3-디클로로프로펜, 1-메틸시클로프로펜, 1-나프톨, 2-(옥틸티오)에탄올, 2,3,5-트리-아이오도벤조산, 2,3,6-TBA, 2,3,6-TBA-디메틸암모늄, 2,3,6-TBA-리튬, 2,3,6-TBA-포타슘, 2,3,6-TBA-소듐, 2,4,5-T, 2,4,5-T-2-부톡시프로필, 2,4,5-T-2-에틸헥실, 2,4,5-T-3-부톡시프로필, 2,4,5-TB, 2,4,5-T-부토메틸, 2,4,5-T-부토틸, 2,4,5-T-부틸, 2,4,5-T-이소부틸, 2,4,5-T-이속틸, 2,4,5-T-이소프로필, 2,4,5-T-메틸, 2,4,5-T-펜틸, 2,4,5-T-소듐, 2,4,5-T-트리에틸암모늄, 2,4,5-T-트롤아민, 2,4-D, 2,4-D-2-부톡시프로필, 2,4-D-2-에틸헥실, 2,4-D-3-부톡시프로필, 2,4-D-암모늄, 2,4-DB, 2,4-DB-부틸, 2,4-DB-디메틸암모늄, 2,4-DB-이속틸, 2,4-DB-포타슘, 2,4-DB-소듐, 2,4-D-부토틸, 2,4-D-부틸, 2,4-D-디에틸암모늄, 2,4-D-디메틸암모늄, 2,4-D-디올아민, 2,4-D-도데실암모늄, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 2,4-D-에틸, 2,4-D-헵틸암모늄, 2,4-D-이소부틸, 2,4-D-이속틸, 2,4-D-이소프로필, 2,4-D-이소프로필암모늄, 2,4-D-리튬, 2,4-D-멥틸, 2,4-D-메틸, 2,4-D-옥틸, 2,4-D-펜틸, 2,4-D-포타슘, 2,4-D-프로필, 2,4-D-소듐, 2,4-D-테푸릴, 2,4-D-테트라데실암모늄, 2,4-D-트리에틸암모늄, 2,4-D-트리스(2-히드록시프로필)암모늄, 2,4-D-트롤아민, 2iP, 2-메톡시에틸수은 클로라이드, 2-페닐페놀, 3,4-DA, 3,4-DB, 3,4-DP, 4-아미노피리딘, 4-CPA, 4-CPA-디올아민, 4-CPA-포타슘, 4-CPA-소듐, 4-CPB, 4-CPP, 4-히드록시페네틸 알콜, 8-히드록시퀴놀린 술페이트, 8-페닐머큐리옥시퀴놀린, 아바멕틴, 아브시스산, ACC, 아세페이트, 아세퀴노실, 아세타미프리드, 아세티온, 아세토클로르, 아세토포스, 아세토프롤, 아시벤졸라르, 아시벤졸라르-S-메틸, 아시플루오르펜, 아시플루오르펜-메틸, 아시플루오르펜-소듐, 아클로니펜, 아크렙, 아크리나트린, 아크롤레인, 아크릴로니트릴, 아시페탁스, 아시페탁스-구리, 아시페탁스-아연, 아피도피로펜, 아폭솔라너, 알라클로르, 알라니카르브, 알벤다졸, 알디카르브, 알디모르프, 알독시카르브, 알드린, 알레트린, 알리신, 알리도클로르, 알로사미딘, 알록시딤, 알록시딤-소듐, 알릴 알콜, 알릭시카르브, 알로락, 알파-시페르메트린, 알파-엔도술판, 아메톡트라딘, 아메트리디온, 아메트린, 아미부진, 아미카르바존, 아미카르티아졸, 아미디티온, 아미도플루메트, 아미도술푸론, 아미노카르브, 아미노시클로피라클로르, 아미노시클로피라클로르-메틸, 아미노시클로피라클로르-포타슘, 아미노피랄리드, 아미노피랄리드-포타슘, 아미노피랄리드-트리스(2-히드록시프로필)암모늄, 아미프로포스-메틸, 아미프로포스, 아미술브롬, 아미톤, 아미톤 옥살레이트, 아미트라즈, 아미트롤, 술팜산암모늄, 암모늄 α-나프탈렌아세테이트, 아모밤, 암프로필포스, 아나바신, 아나바신 술페이트, 안시미돌, 아닐라진, 아닐로포스, 아니수론, 안트라퀴논, 안투, 아폴레이트, 아라마이트, 삼산화비소, 아소메이트, 아스피린, 아술람, 아술람-포타슘, 아술람-소듐, 아티다티온, 아트라톤, 아트라진, 아우레오펀진, 아비글리신, 아비글리신 히드로클로라이드, 아자코나졸, 아자디라크틴, 아자페니딘, 아자메티포스, 아짐술푸론, 아진포스-에틸, 아진포스-메틸, 아지프로트린, 아지티람, 아조벤젠, 아조시클로틴, 아조토에이트, 아족시스트로빈, 바크메데쉬, 바르반, 바륨 헥사플루오로실리케이트, 바륨 폴리술피드, 바르트린, BCPC, 베플루부타미드, 베날락실, 베날락실-M, 베나졸린, 베나졸린-디메틸암모늄, 베나졸린-에틸, 베나졸린-포타슘, 벤카르바존, 벤클로티아즈, 벤디오카르브, 벤플루랄린, 벤푸라카르브, 벤푸레세이트, 베노다닐, 베노밀, 베녹사코르, 베녹사포스, 벤퀴녹스, 벤술푸론, 벤술푸론-메틸, 벤술리드, 벤술탑, 벤탈루론, 벤타존, 벤타존-소듐, 벤티아발리카르브, 벤티아발리카르브-이소프로필, 벤티아졸, 벤트라닐, 벤자독스, 벤자독스-암모늄, 벤즈알코늄 클로라이드, 벤자마크릴, 벤자마크릴-이소부틸, 벤자모르프, 벤즈펜디존, 벤지프람, 벤조비시클론, 벤조페납, 벤조플루오르, 벤조히드록삼산, 벤조빈디플루피르, 벤족시메이트, 벤조일프로프, 벤조일프로프-에틸, 벤즈티아주론, 벤질 벤조에이트, 벤질아데닌, 베르베린, 베르베린 클로라이드, 베타-시플루트린, 베타-시페르메트린, 베톡사진, 비시클로피론, 비페나제이트, 비페녹스, 비펜트린, 비푸준치, 빌라나포스, 빌라나포스-소듐, 비나파크릴, 빙큉시아오, 비오알레트린, 비오에타노메트린, 비오페르메트린, 비오레스메트린, 비페닐, 비스아지르, 비스메르티아졸, 비스피리박, 비스피리박-소듐, 비스트리플루론, 비테르타놀, 비티오놀, 빅사펜, 블라스티시딘-S, 보락스, 보르도 혼합물, 붕산, 보스칼리드, 브라시놀리드, 브라시놀리드-에틸, 브레비코민, 브로디파쿰, 브로펜발레레이트, 브로플라닐리드, 브로플루트리네이트, 브로마실, 브로마실-리튬, 브로마실-소듐, 브로마디올론, 브로메탈린, 브로메트린, 브롬펜빈포스, 브로모아세트아미드, 브로모보닐, 브로모부티드, 브로모시클렌, 브로모-DDT, 브로모페녹심, 브로모포스, 브로모포스-에틸, 브로모프로필레이트, 브로모탈로닐, 브로목시닐, 브로목시닐 부티레이트, 브로목시닐 헵타노에이트, 브로목시닐 옥타노에이트, 브로목시닐-포타슘, 브롬피라존, 브로무코나졸, 브로노폴, 부카르폴레이트, 부펜카르브, 부미나포스, 부피리메이트, 부프로페진, 버건디 혼합물, 부술판, 부타카르브, 부타클로르, 부타페나실, 부타미포스, 부타티오포스, 부테나클로르, 부테트린, 부티다졸, 부티오베이트, 부티우론, 부토카르복심, 부토네이트, 부토피로녹실, 부톡시카르복심, 부트랄린, 부트록시딤, 부투론, 부틸아민, 부틸레이트, 카코딜산, 카두사포스, 카펜스트롤, 비산칼슘, 염소산칼슘, 칼슘 시안아미드, 칼슘 폴리술피드, 칼빈포스, 캄벤디클로르, 캄페클로르, 캄포르, 캅타폴, 캅탄, 카르바모르프, 카르바놀레이트, 카르바릴, 카르바술람, 카르벤다짐, 카르벤다짐 벤젠술포네이트, 카르벤다짐 술파이트, 카르베타미드, 카르보푸란, 이황화탄소, 사염화탄소, 카르보페노티온, 카르보술판, 카르복사졸, 카르복시드, 카르복신, 카르펜트라존, 카르펜트라존-에틸,

카르프로파미드, 카르탑, 카르탑 히드로클로라이드, 카르바크롤, 카르본, CDEA, 셀로시딘, CEPC, 세랄루레, 체스헌트 혼합물, 키노메티오나트, 키토산, 클로벤티아존, 클로메톡시펜, 클로랄로스, 클로람벤, 클로람벤-암모늄, 클로람벤-디올아민, 클로람벤-메틸, 클로람벤-메틸암모늄, 클로람벤-소듐, 클로라민 인, 클로람페니콜, 클로라니포르메탄, 클로라닐, 클로라노크릴, 클로란트라닐리프롤, 클로라지포프, 클로라지포프-프로파르길, 클로라진, 클로르벤시드, 클로르벤주론, 클로르비시클렌, 클로르브로무론, 클로르부팜, 클로르단, 클로르데콘, 클로르디메포름, 클로르디메포름 히드로클로라이드, 클로렘펜트린, 클로르에톡시포스, 클로레투론, 클로르페낙, 클로르페낙-암모늄, 클로르페낙-소듐, 클로르페나피르, 클로르페나졸, 클로르페네톨, 클로르펜프로프, 클로르펜손, 클로르펜술피드, 클로르펜빈포스, 클로르플루아주론, 클로르플루라졸, 클로르플루렌, 클로르플루렌-메틸, 클로르플루레놀, 클로르플루레놀-메틸, 클로리다존, 클로리무론, 클로리무론-에틸, 클로르메포스, 클로르메쿼트, 클로르메쿼트 클로라이드, 클로르니딘, 클로르니트로펜, 클로로벤질레이트, 클로로디니트로나프탈렌, 클로로포름, 클로로메부포름, 클로로메티우론, 클로로네브, 클로로파시논, 클로로파시논-소듐, 클로로피크린, 클로로폰, 클로로프랄레트린, 클로로프로필레이트, 클로로탈로닐, 클로로톨루론, 클로록수론, 클로록시닐, 클로르포늄, 클로르포늄 클로라이드, 클로르폭심, 클로르프라조포스, 클로르프로카르브, 클로르프로팜, 클로르피리포스, 클로르피리포스-메틸, 클로르퀴녹스, 클로르술푸론, 클로르탈, 클로르탈-디메틸, 클로르탈-모노메틸, 클로르티아미드, 클로르티오포스, 클로졸리네이트, 염화콜린, 콜레칼시페롤, 크로마페노지드, 시네린 I, 시네린 II, 시네린, 시니돈-에틸, 신메틸린, 시노술푸론, 시오부티드, 시스아닐리드, 시스메트린, 클라시포스, 클레토딤, 클림바졸, 클리오디네이트, 클로디나포프, 클로디나포프-프로파르길, 클로에토카르브, 클로펜세트, 클로펜세트-포타슘, 클로펜테진, 클로피브르산, 클로포프, 클로포프-이소부틸, 클로마존, 클로메프로프, 클로프로프, 클로프록시딤, 클로피랄리드, 클로피랄리드-메틸, 클로피랄리드-올라민, 클로피랄리드-포타슘, 클로피랄리드-트리스(2-히드록시프로필)암모늄, 클로퀸토세트, 클로퀸토세트-멕실, 클로란술람, 클로란술람-메틸, 클로산텔, 클로티아니딘, 클로트리마졸, 클록시포낙, 클록시포낙-소듐, CMA, 코들렐루레, 콜로포네이트, 아세트산구리, 아세토아비산구리, 비산구리, 탄산구리, 염기성, 수산화구리, 나프텐산구리, 올레산구리, 옥시염화구리, 규산구리, 황산구리, 구리 아연 크로메이트, 쿠마클로르, 쿠마푸릴, 쿠마포스, 쿠마테트랄릴, 쿠미토에이트, 쿠목시스트로빈, 쿠목시스트로빈, CPMC, CPMF, CPPC, 크레다진, 크레졸, 크리미딘, 크로타미톤, 크로톡시포스, 크루포메이트, 크리올라이트, 큐-루어, 쿠프라네브, 쿠밀루론, 쿠프로밤, 산화제1구리, 쿠르쿠메놀, 시안아미드, 시아나트린, 시아나진, 시아노펜포스, 시아노포스, 시안토에이트, 시안트라닐리프롤, 시아조파미드, 시부트린, 시클라푸라미드, 시클라닐리드, 시클라닐리프롤, 시클레트린, 시클로에이트, 시클로헥시미드, 시클로프레이트, 시클로프로트린, 시클로피리모레이트, 시클로술파무론, 시클록사프리드, 시클록시딤, 시클루론, 시에노피라펜, 시플루페나미드, 시플루메토펜, 시플루트린, 시할로디아미드, 시할로포프, 시할로포프-부틸, 시할로트린, 시헥사틴, 시미아졸, 시미아졸 히드로클로라이드, 시목사닐, 시오메트리닐, 시펜다졸, 시페르메트린, 시페르퀴트, 시페르퀴트 클로라이드, 시페노트린, 시프라진, 시프라졸, 시프로코나졸, 시프로디닐, 시프로푸람, 시프로미드, 시프로술파미드, 시로마진, 시티오에이트, 다이무론, 달라폰, 달라폰-칼슘, 달라폰-마그네슘, 달라폰-소듐, 다미노지드, 다요우통, 다조메트, 다조메트-소듐, DBCP, d-캄포르, DCIP, DCPTA, DDT, 데바카르브, 데카펜틴, 데카르보푸란, 데히드로아세트산, 델라클로르, 델타메트린, 데메피온, 데메피온-O, 데메피온-S, 데메톤, 데메톤-메틸, 데메톤-O, 데메톤-O-메틸, 데메톤-S, 데메톤-S-메틸, 데메톤-S-메틸술폰, 데스메디팜, 데스메트린, d-판실루퀘빙주치, 디아펜티우론, 디알리포스, 디-알레이트, 디아미다포스, 규조토, 디아지논, 디부틸 프탈레이트, 디부틸 숙시네이트, 디캄바, 디캄바-디글리콜아민, 디캄바-디메틸암모늄, 디캄바-디올아민, 디캄바-이소프로필암모늄, 디캄바-메틸, 디캄바-올라민, 디캄바-포타슘, 디캄바-소듐, 디캄바-트롤아민, 디캅톤, 디클로베닐, 디클로펜티온, 디클로플루아니드, 디클론, 디클로랄우레아, 디클로르벤주론, 디클로르플루레놀, 디클로르플루레놀-메틸, 디클로르메이트, 디클로르미드, 디클로로메조티아즈, 디클로로펜, 디클로르프로프, 디클로르프로프-2-에틸헥실, 디클로르프로프-부토틸, 디클로르프로프-디메틸암모늄, 디클로르프로프-에틸암모늄, 디클로르프로프-이속틸, 디클로르프로프-메틸, 디클로르프로프-P, 디클로르프로프-P-2-에틸헥실, 디클로르프로프-P-디메틸암모늄, 디클로르프로프-포타슘, 디클로르프로프-P-포타슘, 디클로르프로프-P-소듐, 디클로르프로프-소듐, 디클로르보스, 디클로졸린, 디클로부트라졸, 디클로시메트, 디클로포프, 디클로포프-메틸, 디클로메진, 디클로메진-소듐, 디클로란, 디클로술람, 디코폴, 디쿠마롤, 디크레실, 디크로토포스, 디시클라닐, 디시클로논, 디엘드린, 디에노클로르, 디에탐쿼트, 디에탐쿼트 디클로라이드, 디에타틸, 디에타틸-에틸, 디에토펜카르브, 디에톨레이트, 디에틸 피로카르보네이트, 디에틸톨루아미드, 디페나쿰, 디페노코나졸, 디페노펜텐, 디페노펜텐-에틸, 디페녹수론, 디펜조퀵트, 디펜조퀵트 메틸술페이트, 디페티알론, 디플로비다진, 디플루벤주론, 디플루페니칸, 디플루펜조피르, 디플루펜조피르-소듐, 디플루메토림, 디케굴락, 디케굴락-소듐, 딜로르, 디마티프, 디메플루트린, 디메폭스, 디메푸론, 디메피페레이트, 디메타클론, 디메탄, 디메타카르브, 디메타클로르, 디메타메트린, 디메테나미드, 디메테나미드-P, 디메티퓐, 디메티리몰, 디메토

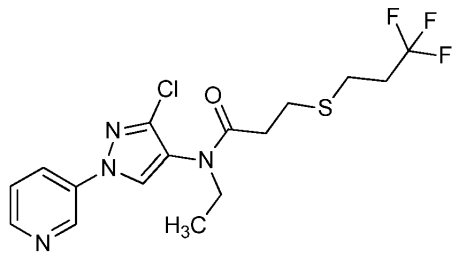
에이트, 디메토모르프, 디메트린, 디메틸 카르베이트, 디메틸 프탈레이트, 디메틸빈포스, 디메틸란, 디멕사노, 디미다존, 디목시스트로빈, 디넥스, 디넥스-디클렉신, 딩주네주오, 디니코나졸, 디니코나졸-M, 디니트라민, 디노부톤, 디노캅, 디노캅-4, 디노캅-6, 디녹톤, 디노페네이트, 디노펜톤, 디노프로프, 디노삼, 디노세브, 디노세브 아세테이트, 디노세브-암모늄, 디노세브-디올아민, 디노세브-소듐, 디노세브-트롤아민, 디노술폰, 디노테푸란, 디노테르브, 디노테르브 아세테이트, 디노테르본, 디오페놀란, 디옥사벤조포스, 디옥사카르브, 디옥사티온, 디파시논, 디파시논-소듐, 디페나미드, 디페닐 술폰, 디페닐아민, 디프로팔린, 디프로페트린, 디피메티트론, 디피리티온, 디퀴트, 디퀴트 디브로마이드, 디스파를루레, 디술, 디술피람, 디술포톤, 디술-소듐, 디탈림포스, 디티아논, 디티크로포스, 디티오에테르, 디티오피르, 디우론, d-리모넨, DMPA, DNOC, DNOC-암모늄, DNOC-포타슘, DNOC-소듐, 도데모르프, 도데모르프 아세테이트, 도데모르프 벤조에이트, 도디신, 도디신 히드로클로라이드, 도디신-소듐, 도딘, 도페나핀, 도미니칼루레, 도라멕틴, 드라족솔론, DSMA, 두풀린, EBEP, EBP, 엑디스테론, 에디펜포스, 에글리나진, 에글리나진-에틸, 에마멕틴, 에마멕틴 벤조에이트, EMPC, 엠펜트린, 엔도술판, 엔도탈, 엔도탈-디암모늄, 엔도탈-디포타슘, 엔도탈-디소듐, 엔도티온, 엔드린, 에네스트로부린, 에녹사스트로빈, EPN, 에포콜레온, 에포페놀난, 에폭시코나졸, 에프리노멕틴, 에프로나즈, 엡실론-메토플루트린, 엡실론-몸플루오로트린, EPTC, 에르본, 에르고칼시페롤, 에를루지시안카오안, 에스테팔레트린, 에스펜발레레이트, 에스프로카르브, 에타셀라실, 에타코나졸, 에타포스, 에템, 에타복삼, 에타클로르, 에탈플루랄린, 에타메트술푸론, 에타메트술푸론-메틸, 에타프로클로르, 에테폰, 에티디무론, 에티오펜카르브, 에티올레이트, 에티온, 에티오진, 에티프롤, 에티리몰, 에토에이트-메틸, 에토푸메세이트, 에토헥사디올, 에토프로포스, 에톡시펜, 에톡시펜-에틸, 에톡시퀸, 에톡시술푸론, 에티클로제이트, 에틸 포르메이트, 에틸 α-나프탈렌아세테이트, 에틸-DDD, 에틸렌, 에틸렌 디브로마이드, 에틸렌 디클로라이드, 에틸렌 옥시드, 에틸리신, 에틸수은 2,3-디히드록시프로필 메르캅티드, 에틸수은 아세테이트, 에틸수은 브로마이드, 에틸수은 클로라이드, 에틸수은 포스페이트, 에티노펜, 에트니프로미드, 에토벤자니드, 에토펜프록스, 에톡사졸, 에트리디아졸, 에트림포스, 유게놀, EXD, 파목사돈, 팜푸르, 페나미돈, 페나미노술프, 페나민스트로빈, 페나미포스, 페나파닐, 페나리몰, 페나술람, 페나자플로르, 페나자퀸, 펜부코나졸, 펜부타틴 옥시드, 펜클로라졸, 펜클로라졸-에틸, 펜클로르포스, 펜클로림, 페네타카르브, 펜플루트린, 펜푸람, 펜헥사미드, 페니트로판, 페니트로티온, 펜쥰통, 페노부카르브, 페노프로프, 페노프로프-3-부톡시프로필, 페노프로프-부토메틸, 페노프로프-부토틸, 페노프로프-부틸, 페노프로프-이속틸, 페노프로프-메틸, 페노프로프-포타슘, 페노티오카르브, 페녹사크림, 페녹사닐, 페녹사프로프, 페녹사프로프-에틸, 페녹사프로프-P, 페녹사프로프-P-에틸, 페녹사술폰, 페녹시카르브, 펜피클로닐, 펜피리트린, 펜프로파트린, 펜프로피딘, 펜프로피모르프, 펜피라자민, 펜피록시메이트, 펜퀴노트리온, 펜리다존, 펜리다존-포타슘, 펜리다존-프로필, 펜손, 펜술포티온, 펜테라콜, 펜티아프로프, 펜티아프로프-에틸, 펜티온, 펜티온-에틸, 펜틴, 펜틴 아세테이트, 펜틴 클로라이드, 펜틴 히드록시드, 펜트라자미드, 펜트리파닐, 페누론, 페누론 TCA, 펜발레레이트, 페르밤, 페림존, 황산제1철, 피프로닐, 플람프로프, 플람프로프-이소프로필, 플람프로프-M, 플람프로프-메틸, 플람프로프-M-이소프로필, 플람프로프-M-메틸, 플라자술푸론, 플로쿠마펜, 플로메토퀸, 플로니카미드, 플로라술람, 플루아크리피림, 플루아자인돌리진, 플루아지포프, 플루아지포프-부틸, 플루아지포프-메틸, 플루아지포프-P, 플루아지포프-P-부틸, 플루아지남, 플루아졸레이트, 플루아주론, 플루벤디아미드, 플루벤즈이민, 플루카르바존, 플루카르바존-소듐, 플루세토술푸론, 플루클로랄린, 플루코푸론, 플루시클록수론, 플루시트리네이트, 플루디옥소닐, 플루에네틸, 플루엔술폰, 플루페나세트, 플루페네림, 플루페니칸, 플루페녹수론, 플루페녹시스트로빈, 플루펜프록스, 플루펜피르, 플루펜피르-에틸, 플루피프롤, 플루헥사폰, 플루메트린, 플루메토베르, 플루메트랄린, 플루메트술람, 플루메진, 플루미클로락, 플루미클로락-펜틸, 플루미옥사진, 플루미프로핀, 플루모르프, 플루오메투론, 플루오피콜리드, 플루오피람, 플루오르벤시드, 플루오리다미드, 플루오로아세트아미드, 플루오로디펜, 플루오로글리코펜, 플루오로글리코펜-에틸, 플루오로이미드, 플루오로미딘, 플루오로니트로펜, 플루오티우론, 플루오트리마졸, 플루옥사스트로빈, 플루폭삼, 플루프로파실, 플루프로파딘, 플루프로파네이트, 플루프로파네이트-소듐, 플루피라디푸론, 플루피르술푸론, 플루피르술푸론-메틸, 플루피르술푸론-메틸-소듐, 플루퀸코나졸, 플루랄라너, 플루라졸, 플루레놀, 플루레놀-부틸, 플루레놀-메틸, 플루리돈, 플루로클로리돈, 플루록시피르, 플루록시피르-부토메틸, 플루록시피르-멥틸, 플루르프리미돌, 플루르술라미드, 플루르타몬, 플루실라졸, 플루술파미드, 플루티아세트, 플루티아세트-메틸, 플루티아닐, 플루톨라닐, 플루트리아폴, 플루발리네이트, 플룩사피록사드, 플룩소페님, 폴페트, 포메사펜, 포메사펜-소듐, 포노포스, 포람술푸론, 포르클로르페누론, 포름알데히드, 포르메타네이트, 포르메타네이트 히드로클로라이드, 포르모티온, 포름파라네이트, 포름파라네이트 히드로클로라이드, 포사민, 포사민-암모늄, 포세틸, 포세틸-알루미늄, 포스메틸란, 포스피레이트, 포스티아제이트, 포스티에탄, 프론탈린, 푸베리다졸, 푸카오징, 푸카오미, 푸나이헤카울링, 푸펜티오우레아, 푸랄란, 푸랄락실, 푸라메트린, 푸라메트피르, 푸라티오카르브, 푸르카르바닐, 푸르코나졸, 푸르코나졸-시스, 푸레트린, 푸르푸랄, 푸릴라졸, 푸르메시클록스, 푸로파네이트,

푸릴옥시펜, 감마-시할로트린, 감마-HCH, 게니트, 지베렐산, 지베렐린, 글리프토르, 글루포시네이트, 글루포시네이트-암모늄, 글루포시네이트-P, 글루포시네이트-P-암모늄, 글루포시네이트-P-소듐, 글리오딘, 글리옥심, 글리포세이트, 글리포세이트-디암모늄, 글리포세이트-디메틸암모늄, 글리포세이트-이소프로필암모늄, 글리포세이트-모노암모늄, 글리포세이트-포타슘, 글리포세이트-세스퀴소듐, 글리포세이트-트리메슘, 글리포신, 고시플루레, 그란들루레, 그리세오풀빈, 구아자틴, 구아자틴 아세테이트, 할라크리네이트, 할라욱시펜, 할라욱시펜-메틸, 할펜프록스, 할로페노지드, 할로사펜, 할로술푸론, 할로술푸론-메틸, 할록시딘, 할록시포프, 할록시포프-에토틸, 할록시포프-메틸, 할록시포프-P, 할록시포프-P-에토틸, 할록시포프-P-메틸, 할록시포프-소듐, HCH, 헤멜, 헴파, HEOD, 헵타클로르, 헵타플루트린, 헵테노포스, 헵토파르길, 헤르비마이신, 헤테로포스, 헥사클로로아세톤, 헥사클로로벤젠, 헥사클로로부타디엔, 헥사클로로펜, 헥사코나졸, 헥사플루무론, 헥사플루레이트, 헥살루레, 헥사미드, 헥사지논, 헥실티오포스, 헥시티아족스, HHDN, 홀로술프, 후안카이워, 후앙카올링, 후안준주오, 히드라메틸논, 히드라르가펜, 수화 석회, 시안화수소, 히드로프렌, 히멕사졸, 히퀸카르브, IAA, IBA, 이카리딘, 이마잘릴, 이마잘릴 니트레이트, 이마잘릴 술페이트, 이마자메타벤즈, 이마자메타벤즈-메틸, 이마자목스, 이마자목스-암모늄, 이마자픽, 이마자픽-암모늄, 이마자피르, 이마자피르-이소프로필암모늄, 이마자퀸, 이마자퀸-암모늄, 이마자퀸-메틸, 이마자퀸-소듐, 이마제타피르, 이마제타피르-암모늄, 이마조술푸론, 이미벤코나졸, 이미시아포스, 이미다클로프리드, 이미다클로티즈, 이미녹타딘, 이미녹타딘 트리아세테이트, 이미녹타딘 트리알베실레이트, 이미프로트린, 이나벤피드, 인다노판, 인다지플람, 인독사카르브, 이네진, 아이오도보닐, 아이오도카르브, 아이오도메탄, 아이오도술푸론, 아이오도술푸론-메틸, 아이오도술푸론-메틸-소듐, 이오펜술푸론, 이오펜술푸론-소듐, 이옥시닐, 이옥시닐 옥타노에이트, 이옥시닐-리튬, 이옥시닐-소듐, 이파진, 이프코나졸, 이프펜카르바존, 이프로벤포스, 이프로디온, 이프로발리카르브, 이프리미담, 입스디엔올, 입센올, IPSP, 이사미도포스, 이사조포스, 이소벤잔, 이소카르바미드, 이소카르보포스, 이소실, 이소드린, 이소펜포스, 이소펜포스-메틸, 이소페타미드, 이솔란, 이소메티오진, 이소노루론, 이소폴리네이트, 이소프로카르브, 이소프로팔린, 이소프로티올란, 이소프로투론, 이소피라잠, 이소피리몰, 이소티오네이트, 이소티아닐, 이소우론, 이소발레디온, 이속사벤, 이속사클로르톨, 이속사디펜, 이속사디펜-에틸, 이속사플루톨, 이속사피리포프, 이속사티온, 이베르멕틴, 이조팜포스, 자포닐루레, 자포트린스, 자스몰린 I, 자스몰린 II, 자스몬산, 지아후앙총종, 지아지젱시아올린, 지아시앙준치, 지에카오완, 지에카옥시, 조드펜포스, 유충 호르몬 I, 유충 호르몬 II, 유충 호르몬 III, 카데트린, 카파-비펜트린, 카파-테플루트린, 카르부틸레이트, 카레타잔, 카레타잔-포타슘, 카수가마이신, 카수가마이신 히드로클로라이드, 케준린, 켈레반, 케토스피라독스, 케토스피라독스-포타슘, 키네틴, 키노프렌, 크레속심-메틸, 쿠이카옥시, 락토펜, 람다-시할로트린, 라틸루레, 비산납, 레나실, 레피멕틴, 렙토포스, 린단, 리네아틴, 리누론, 리림포스, 리틀루레, 루플루레, 루페누론, 르브딩준치, 르브시안카올린, 리티다티온, MAA, 말라티온, 말레산 히드라지드, 말로노벤, 말토덱스트린, MAMA, 만코퍼, 만코제브, 만디프로파미드, 만데스트로빈, 마네브, 마트린, 마지독스, MCPA, MCPA-2-에틸헥실, MCPA-부토틸, MCPA-부틸, MCPA-디메틸암모늄, MCPA-디올아민, MCPA-에틸, MCPA-이소부틸, MCPA-이속틸, MCPA-이소프로필, MCPA-메틸, MCPA-올라민, MCPA-포타슘, MCPA-소듐, MCPA-티오에틸, MCPA-트롤아민, MCPB, MCPB-에틸, MCPB-메틸, MCPB-소듐, 메베닐, 메카르밤, 메카르빈지드, 메카르폰, 메코프로프, 메코프로프-2-에틸헥실, 메코프로프-디메틸암모늄, 메코프로프-디올아민, 메코프로프-에타딜, 메코프로프-이속틸, 메코프로프-메틸, 메코프로프-P, 메코프로프-P-2-에틸헥실, 메코프로프-P-디메틸암모늄, 메코프로프-P-이소부틸, 메코프로프-포타슘, 메코프로프-P-포타슘, 메코프로프-소듐, 메코프로프-트롤아민, 메디메포름, 메디노테르브, 메디노테르브 아세테이트, 메들루레, 메페나세트, 메펜피르, 메펜피르-디에틸, 메플루이디드, 메플루이디드-디올아민, 메플루이디드-포타슘, 메가톰산, 메나존, 메파니피림, 메페르플루트린, 메페네이트, 메포스폴란, 메피쿼트, 메피쿼트 클로라이드, 메피쿼트 펜타보레이트, 메프로닐, 멥틸디노캅, 염화제2수은, 산화제2수은, 염화제1수은, 메르포스, 메소프라진, 메소술푸론, 메소술푸론-메틸, 메소트리온, 메술펜, 메술펜포스, 메타플루미존, 메탈락실, 메탈락실-M, 메타알데히드, 메탐, 메탐-암모늄, 메타미포프, 메타미트론, 메탐-포타슘, 메탐-소듐, 메타자클로르, 메타조술푸론, 메타족솔론, 메트코나졸, 메테파, 메트플루라존, 메타벤즈티아주론, 메타크리포스, 메탈프로팔린, 메타미도포스, 메타술포카르브, 메타졸, 메트푸록삼, 메티다티온, 메티오벤카르브, 메티오카르브, 메티오피리술푸론, 메티오테파, 메티오졸린, 메티우론, 메토크로토포스, 메토메톤, 메토밀, 메토프렌, 메토프로트린, 메토퀸-부틸, 메토트린, 메톡시클로르, 메톡시페노지드, 메톡시페논, 메틸 아폴레이트, 메틸 브로마이드, 메틸 유게놀, 메틸 아이오다이드, 메틸 이소티오시아네이트, 메틸아세토포스, 메틸클로로포름, 메틸딤론, 메틸렌 클로라이드, 메틸수은 벤조에이트, 메틸수은 디시안디아미드, 메틸수은 펜타클로로페녹시드, 메틸네오데칸아미드, 메티람, 메토벤주론, 메토브로무론, 메토플루트린, 메톨라클로르, 메톨카르브, 메토미노스트로빈, 메토술람, 메톡사디아존, 메톡수론, 메트라페논, 메트리부진, 메트술포박스, 메트술푸론, 메트술푸론-메틸, 메빈포스, 멕사카르베이트, 미에슈안, 밀베멕틴, 밀베마이신 옥심, 밀네브, 미파폭스, 미렉스, MNAF, 모구춘, 몰리네이트, 몰

로술탑, 몸플루오로트린, 모날리드, 모니소우론, 모노클로로아세트산, 모노크로토포스, 모노리누론, 모노술푸론, 모노술푸론-에스테르, 모누론, 모누론 TCA, 모르팜퀴트, 모르팜퀴트 디클로라이드, 모록시딘, 모록시딘 히드로클로라이드, 모르포티온, 모르지드, 목시덱틴, MSMA, 무스칼루레, 미클로부타닐, 미클로졸린, N-(에틸수은)-p-톨루엔술폰아닐리드, 나밤, 나프탈로포스, 날레드, 나프탈렌, 나프탈렌아세트아미드, 나프탈산 무수물, 나프톡시아세트산, 나프로아닐리드, 나프로파미드, 나프로파미드-M, 나프탈람, 나프탈람-소듐, 나타마이신, 네부론, 니클로사미드, 니클로사미드-올라민, 니코술푸론, 니코틴, 니플루리디드, 니피라클로펜, 니텐피람, 니티아진, 니트랄린, 니트라피린, 니트릴라카르브, 니트로펜, 니트로플루오르펜, 니트로스티렌, 니트로탈-이소프로필, 노르보르미드, 노르플루라존, 노르니코틴, 노루론, 노발루론, 노비플루무론, 누아리몰, OCH, 옥타클로로디프로필 에테르, 옥틸리논, 오푸레이스, 오메토에이트, 오르벤카르브, 오르프랄루레, 오르토-디클로로벤젠, 오르토술파무론, 오릭탈루레, 오리사스트로빈, 오리잘린, 오스톨, 오스트라몬, 옥사베트리닐, 옥사디아르길, 옥사디아존, 옥사딕실, 옥사메이트, 옥사밀, 옥사피라존, 옥사피라존-디몰아민, 옥사피라존-소듐, 옥사술푸론, 옥사티아피프롤린, 옥사지클로메폰, 옥신-구리, 옥솔린산, 옥스포코나졸, 옥스포코나졸 푸마레이트, 옥시카르복신, 오시데메톤-메틸, 옥시데프로포스, 옥시디술포톤, 옥시플루오르펜, 옥시마트린, 옥시테트라시클린, 옥시테트라시클린 히드로클로라이드, 파클로부트라졸, 파이총딩, 파라-디클로로벤젠, 파라플루론, 파라쿼트, 파라쿼트 디클로라이드, 파라쿼트 디메틸술페이트, 파라티온, 파라티온-메틸, 파리놀, 페불레이트, 페푸라조에이트, 펠라르곤산, 펜코나졸, 펜시쿠론, 펜디메탈린, 펜플루펜, 펜플루론, 페녹스술람, 펜타클로로페놀, 펜타클로로페닐 라우레이트, 펜타노클로르, 펜티오피라드, 펜트메트린, 펜톡사존, 퍼플루이돈, 페르메트린, 페톡사미드, 페나마크릴, 페나진 옥시드, 펜이소팜, 펜캅톤, 펜메디팜, 펜메디팜-에틸, 페노벤주론, 페노트린, 펜프록시드, 펜토에이트, 페닐머큐리우레아, 페닐수은 아세테이트, 페닐수은 클로라이드, 피로카테콜의 페닐수은 유도체, 페닐수은 니트레이트, 페닐수은 살리실레이트, 포레이트, 포스아세팀, 포살론, 포스디펜, 포스폴란, 포스폴란-메틸, 포스글리신, 포스메트, 포스니클로르, 포스파미돈, 포스핀, 포스포카르브, 인, 포스틴, 폭심, 폭심-메틸, 프탈리드, 피카르부트라족스, 피클로람, 피클로람-2-에틸헥실, 피클로람-이속틸, 피클로람-메틸, 피클로람-올라민, 피클로람-포타슘, 피클로람-트리에틸암모늄, 피클로람-트리스(2-히드록시프로필)암모늄, 피콜리나펜, 피콕시스트로빈, 핀돈, 핀돈-소듐, 피녹사덴, 피페랄린, 피페로닐 부톡시드, 피페로닐 시클로넨, 피페로포스, 피프록타닐, 피프록타닐 브로마이드, 피프로탈, 피리메타포스, 피리미카르브, 피리미옥시포스, 피리미포스-에틸, 피리미포스-메틸, 플리페네이트, 폴리카르바메이트, 폴리옥신, 폴리옥소림, 폴리옥소림-아연, 폴리티알란, 아비산칼륨, 아지드화칼륨, 시안산칼륨, 포타슘 지베렐레이트, 나프텐산칼륨, 포타슘 폴리술피드, 티오시안산칼륨, 포타슘 α-나프탈렌아세테이트, pp'-DDT, 프랄레트린, 프레코센 I, 프레코센 II, 프레코센 III, 프레틸라클로르, 프리미도포스, 프리미술푸론, 프리미술푸론-메틸, 프로베나졸, 프로클로라즈, 프로클로라즈-망가니즈, 프로클로놀, 프로시아진, 프로시미돈, 프로디아민, 프로페노포스, 프로플루아졸, 프로플루랄린, 프로플루트린, 프로폭시딤, 프로글리나진, 프로글리나진-에틸, 프로헥사디온, 프로헥사디온-칼슘, 프로히드로자스몬, 프로마실, 프로메카르브, 프로메톤, 프로메트린, 프로무리트, 프로파클로르, 프로파미딘, 프로파미딘 디히드로클로라이드, 프로파모카르브, 프로파모카르브 히드로클로라이드, 프로파닐, 프로파포스, 프로파퀴자포프, 프로파르기트, 프로파르트린, 프로파진, 프로페탐포스, 프로팜, 프로피코나졸, 프로피네브, 프로피소클로르, 프로폭수르, 프로폭시카르바존, 프로폭시카르바존-소듐, 프로필 이솜, 프로피리술푸론, 프로피자미드, 프로퀴나지드, 프로술레르, 프로술팔린, 프로술포카르브, 프로술푸론, 프로티다티온, 프로티오카르브, 프로티오카르브 히드로클로라이드, 프로티오코나졸, 프로티오포스, 프로토에이트, 프로트리펜부트, 프록산, 프록산-소듐, 프리나클로르, 피다논, 피디플루메토펜, 피플루부미드, 피메트로진, 피라카르볼리드, 피라클로포스, 피라클로닐, 피라클로스트로빈, 피라플루펜, 피라플루펜-에틸, 피라플루프롤, 피라마트, 피라메토스트로빈, 피라옥시스트로빈, 피라술포톨, 피라지플루미드, 피라졸리네이트, 피라조포스, 피라조술푸론, 피라조술푸론-에틸, 피라조티온, 피라족시펜, 피레스메트린, 피레트린 I, 피레트린 II, 피레트린, 피리밤벤즈-이소프로필, 피리밤벤즈-프로필, 피리벤카르브, 피리벤족심, 피리부티카르브, 피리클로르, 피리다벤, 피리다폴, 피리달릴, 피리다펜티온, 피리데이트, 피리디니트릴, 피리페녹스, 피리플루퀴나존, 피리프탈리드, 피리메타닐, 피리미디펜, 피리미노박, 피리미노박-메틸, 피리미노스트로빈, 피리미술판, 피리미테이트, 피리누론, 피리오페논, 피리프롤, 피리프로판올, 피리프록시펜, 피르이속사졸, 피리티오박, 피리티오박-소듐, 피롤란, 피로퀼론, 피록사술폰, 피록스술람, 피록시클로르, 피록시푸르, 콰시아, 퀴나세톨, 퀴나세톨 술페이트, 퀴날포스, 퀴날포스-메틸, 퀴나자미드, 퀸클로락, 퀸코나졸, 퀸메락, 퀴노클라민, 퀴논아미드, 퀴노티온, 퀴녹시펜, 퀸티오포스, 퀸토젠, 퀴잘로포프, 퀴잘로포프-에틸, 퀴잘로포프-P, 퀴잘로포프-P-에틸, 퀴잘로포프-P-테푸릴, 쿠웬치, 쿠잉딩, 라벤자졸, 라폭사니드, 레베미드, 레스칼루레, 레스메트린, 로데타닐, 로도자포닌-III, 리바비린, 림술푸론, 로테논, 리아니아, 사플루페나실, 사이준마오, 사이센통, 살리실아닐리드, 상귀나린, 산토닌, 쉬라단, 실리로시드, 세부틸라진, 세크부메톤, 세닥산, 셀라멕틴, 세미아미트라즈, 세미아미트라즈 클로라이드, 세사멕스, 세사몰린, 세톡시딤, 슈앙지아안카올린, 시두론, 시클

루레, 실라플루오펜, 실라트란, 실리카 겔, 실티오팜, 시마진, 시메코나졸, 시메톤, 시메트린, 신토펜, SMA, S-메톨라클로르, 아비산나트륨, 아지드화나트륨, 염소산나트륨, 플루오린화나트륨, 소듐 플루오로아세테이트, 소듐 헥사플루오로실리케이트, 나프텐산나트륨, 소듐 오르토페닐페녹시드, 소듐 펜타클로로페녹시드, 소듐 폴리술피드, 티오시안산나트륨, 소듐 α-나프탈렌아세테이트, 소파미드, 스피네토람, 스피노사드, 스피로디클로펜, 스피로메시펜, 스피로테트라마트, 스피록사민, 스트렙토마이신, 스트렙토마이신 세스퀴술페이트, 스트리크닌, 술카톨, 술코푸론, 술코푸론-소듐, 술코트리온, 술팔레이트, 술펜트라존, 술피람, 술플루라미드, 술포메투론, 술포메투론-메틸, 술포술푸론, 술포텝, 술폭사플로르, 술폭시드, 술폭심, 황, 황산, 술푸릴 플루오라이드, 술글리카핀, 술프로포스, 술트로펜, 스웨프, 타우-플루발리네이트, 타브론, 타짐카르브, TCA, TCA-암모늄, TCA-칼슘, TCA-에타딜, TCA-마그네슘, TCA-소듐, TDE, 테부코나졸, 테부페노지드, 테부펜피라드, 테부플로퀸, 테부피림포스, 테부탐, 테부티우론, 테클로프탈람, 테크나젠, 테코람, 테플루벤주론, 테플루트린, 테푸릴트리온, 템보트리온, 테메포스, 테파, TEPP, 테프랄록시딤, 테랄레트린, 테르바실, 테르부카르브, 테르부클로르, 테르부포스, 테르부메톤, 테르부틸라진, 테르부트린, 테트시클라시스, 테트라클로로에탄, 테트라클로르빈포스, 테트라코나졸, 테트라디폰, 테트라플루론, 테트라메트린, 테트라메틸플루트린, 테트라민, 테트라낙틴, 테트라닐리프롤, 테트라술, 탈륨 술페이트, 테닐클로르, 세타-시페르메트린, 티아벤다졸, 티아클로프리드, 티아디플루오르, 티아메톡삼, 티아프로닐, 티아자플루론, 티아조피르, 티크로포스, 티시오펜, 티디아지민, 티디아주론, 티엔카르바존, 티엔카르바존-메틸, 티펜술푸론, 티펜술푸론-메틸, 티플루자미드, 티오벤카르브, 티오카르복심, 티오클로르펜핌, 티오시클람, 티오시클람 히드로클로라이드, 티오시클람 옥살레이트, 티오디아졸-구리, 티오디카르브, 티오파녹스, 티오플루옥시메이트, 티오헴파, 티오메르살, 티오메톤, 티오나진, 티오파네이트, 티오파네이트-메틸, 티오퀴녹스, 티오세미카르바지드, 티오술탑, 티오술탑-디암모늄, 티오술탑-디소듐, 티오술탑-모노소듐, 티오테파, 티람, 투린기엔신, 티아디닐, 티아페나실, 티아오지에안, 티오카르바질, 티오클로림, 티옥사자펜, 티옥시미드, 티르페이트, 톨클로포스-메틸, 톨펜피라드, 톨프로카르브, 톨피랄레이트, 톨릴플루아니드, 톨릴수은 아세테이트, 토프라메존, 트랄콕시딤, 트랄로시트린, 트랄로메트린, 트랄로피릴, 트랜스플루트린, 트랜스페르메트린, 트레타민, 트리아콘탄올, 트리아디메폰, 트리아디메놀, 트리아파몬, 트리-알레이트, 트리아미포스, 트리아펜테놀, 트리아라텐, 트리아리몰, 트리아술푸론, 트리아자메이트, 트리아즈부틸, 트리아지플람, 트리아조포스, 트리아족시드, 트리베누론, 트리베누론-메틸, 트리부포스, 트리부틸주석 옥시드, 트리캄바, 트리클라미드, 트리클로르폰, 트리클로르메타포스-3, 트리클로로나트, 트리클로피르, 트리클로피르-부토틸, 트리클로피르-에틸, 트리클로피리카르브, 트리클로피르-트리에틸암모늄, 트리시클라졸, 트리데모르프, 트리디판, 트리에타진, 트리펜모르프, 트리페노포스, 트리플록시스트로빈, 트리플록시술푸론, 트리플록시술푸론-소듐, 트리플루디목사진, 트리플루메조피림, 트리플루미졸, 트리플루무론, 트리플루랄린, 트리플루술푸론, 트리플루술푸론-메틸, 트리포프, 트리포프-메틸, 트리포프심, 트리포린, 트리히드록시트리아진, 트리메들루레, 트리메타카르브, 트리메투론, 트리넥사팍, 트리넥사팍-에틸, 트리프렌, 트리프로핀단, 트리프톨리드, 트리탁, 트리티코나졸, 트리토술푸론, 트룬크-칼, 유니코나졸, 유니코나졸-P, 우르바시드, 우레데파, 발레레이트, 발리다마이신, 발리페날레이트, 발론, 바미도티온, 반가르드, 바닐리프롤, 베르놀레이트, 빈클로졸린, 와파린, 와파린-포타슘, 와파린-소듐, 시아오총리울린, 신주난, 시워주난, XMC, 크실라클로르, 크실레놀, 크실릴카르브, 이시징, 자릴아미드, 제아틴, 젱시아오안, 제타-시페르메트린, 나프텐산아연, 아연 포스피드, 아연 티아졸, 지네브, 지람, 졸라프로포스, 족사미드, 주오미후앙롱, α-클로로히드린, α-엑디손, α-멀티스트리아틴, 및 α-나프탈렌아세트산. 보다 많은 정보에 대해 alanwood.net에 위치한 ["Compendium of Pesticide Common Names"]을 참조한다. 또한 문헌 ["The Pesticide Manual" 15th Edition, edited by C D S Tomlin, copyright 2009 by British Crop Production Council], 또는 그의 이전 또는 보다 최근의 간행물을 참조한다.

[0548] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 또한 하기 화합물과 조합되어 (예컨대, 조성 혼합물로, 또는 동시 또는 순차적 적용으로) 사용될 수 있다.



[0549]

[0550] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 또한 1종 이상의 생물살충제와 조합되어 (예컨대, 조성 혼합물로, 또

는 동시 또는 순차적 적용으로) 사용될 수 있다. 용어 "생물살충제"는 화학 살충제와 유사한 방식으로 적용되는 미생물 생물학적 해충 방제제에 대해 사용된다. 통상적으로 이들은 박테리아이지만, 또한 트리코더마 종(*Trichoderma spp.*) 및 암펠로미세스 퀴스쿠알리스(*Ampelomyces quisqualis*) (포도 흰가루병의 방제제)를 비롯한, 진균 방제제의 예가 있다. 바실루스 서브틸리스(*Bacillus subtilis*)가 식물 병원체를 방제하기 위해 사용된다. 잡초 및 설치류가 또한 미생물제를 사용하여 방제되어 왔다. 널리-공지된 살곤충제의 한 예는 인시목, 딱정벌레목 및 파리목의 박테리아성 질병인 바실루스 투린기엔시스(*Bacillus thuringiensis*)이다. 이는 다른 유기체에 대해서는 효과가 거의 없기 때문에, 합성 살충제보다 더 친환경적인 것으로 간주된다. 생물학적 살곤충제는 다음을 기재로 하는 제품을 포함한다: 곤충병원성 진균 (예를 들어 메타리지움 아니소플리아에(*Metarhizium anisopliae*)); 곤충병원성 선충 (예를 들어 스테이네르네마 펠티아에(*Steinernema feltiae*)); 및 곤충병원성 바이러스 (예를 들어 시디아 포모넬라 그라눌로바이러스(*Cydia pomonella granulovirus*)).

[0551] 곤충병원성 유기체의 다른 예는 바큘로바이러스, 박테리아 및 다른 원핵 유기체, 진균, 원충 및 미포자충을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 생물학적으로 유래된 살곤충제는 로테논, 베라트리딘, 뿐만 아니라 미생물 독소; 곤충 내성 또는 저항성 식물 품종; 및 살곤충제를 생산하거나 유전자 변형된 유기체에 곤충 저항성 특성을 전하도록 재조합 DNA 기술에 의해 변형된 유기체를 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 한 실시양태에서, 화학식 1의 분자를 1종 이상의 생물살충제와 함께 종자 처리 및 토양 개량의 영역에서 사용할 수 있다. 문헌 [The Manual of Biocontrol Agents]은 이용가능한 생물학적 살곤충제 (및 다른 생물학-기반 방제) 제품의 검토를 제공한다. 문헌 [Copping L.G. (ed.) (2004). The Manual of Biocontrol Agents (formerly the Biopesticide Manual) 3rd Edition. British Crop Production Council (BCPC), Farnham, Surrey UK].

[0552] 또 다른 실시양태에서, 상기 가능한 조합은 폭넓게 다양한 중량비로 사용될 수 있다. 예를 들어, 2 성분 혼합물의, 화학식 1의 분자 대 또 다른 화합물의 중량비는 약 100:1 내지 약 1:100일 수 있고; 또 다른 예에서 중량비는 약 50:1 내지 약 1:50일 수 있고; 또 다른 예에서 중량비는 약 20:1 내지 약 1:20일 수 있고; 또 다른 예에서 중량비는 약 10:1 내지 약 1:10일 수 있고; 또 다른 예에서 중량비는 약 5:1 내지 1:5일 수 있고; 또 다른 예에서 중량비는 약 3:1 내지 약 1:3일 수 있고; 또 다른 예에서 중량비는 약 2:1 내지 약 1:2일 수 있고; 최종적인 예에서 중량비는 약 1:1일 수 있다. 그러나, 바람직하게는, 약 10:1 미만 내지 약 1:10의 중량비가 바람직하다. 1종 이상의 화학식 1의 분자 및 상기 가능한 조합으로부터의 1종 이상의 다른 화합물을 포함하는 3 또는 4 성분 혼합물을 사용하는 것이 때때로 또한 바람직하다.

[0553] [표 A]

번호	화학식 1의 분자 대 또 다른 화합물의 중량비의 범위
1	100:1 내지 1:100
2	50:1 내지 1:50
3	20:1 내지 1:20
4	10:1 내지 1:10
5	5:1 내지 1:5
6	3:1 내지 1:3
7	2:1 내지 1:2
8	1:1

[0554]

[0555] 상승작용적 살충 조성물이 되도록 구상되는 화학식 1의 분자 또는 그의 임의의 농업상 허용되는 염 대 또 다른 화합물의 중량비는 X:Y로 표시될 수 있고; 여기서 X는 화학식 1의 분자 또는 그의 임의의 농업상 허용되는 염의 중량부이고, Y는 또 다른 화합물의 중량부이다. 표 B에서 도표로 나타낸 바와 같이 X에 대한 중량부의 수치 범위는 $0 < X \leq 100$이고 Y에 대한 중량부의 수치 범위는 $0 < Y \leq 100$이다. 비제한적 예로서, 살충제 대 또 다른 화합물의 중량비는 약 20:1일 수 있다.

[0556] [표 B]

또 다른 화합물 (Y)중량부

100	*X,Y*		*X,Y*			*X,Y*			
50	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*			*X,Y*	*X,Y*		
20	*X,Y*		*X,Y*	*X,Y*		*X,Y*		*X,Y*	
15	*X,Y*	*X,Y*					*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*
10	*X,Y*		*X,Y*						
5	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*				*X,Y*		
3	*X,Y*	*X,Y*		*X,Y*	*X,Y*		*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*
2	*X,Y*		*X,Y*	*X,Y*		*X,Y*		*X,Y*	
1	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*	*X,Y*
	1	**2**	**3**	**5**	**10**	**15**	**20**	**50**	**100**

화학식 1의 분자
(X) 중량부

[0557]

[0558] 상승작용적 살충 조성물이 되도록 구상되는 화학식 1의 분자 또는 그의 임의의 농업상 허용되는 염 대 또 다른 화합물의 중량비의 범위는 X_1:Y_1 내지 X_2:Y_2로 표시될 수 있고, 여기서 X 및 Y는 상기와 같이 정의된다. 하나의 특정한 실시양태에서, 중량비의 범위는 X_1:Y_1 내지 X_2:Y_2일 수 있고, 여기서 $X_1 > Y_1$ 및 $X_2 < Y_2$이다. 비제한적 예로서, 화학식 1의 분자 또는 그의 임의의 농업상 허용되는 염 대 또 다른 화합물의 중량비의 범위는 약 3:1 내지 약 1:3일 수 있다. 일부 실시양태에서, 중량비의 범위는 X_1:Y_1 내지 X_2:Y_2일 수 있고, 여기서 $X_1 > Y_1$ 및 $X_2 > Y_2$이다. 비제한적 예로서, 화학식 1의 분자 또는 그의 임의의 농업상 허용되는 염 대 또 다른 화합물의 범위는 약 15:1 내지 약 3:1일 수 있다. 추가 실시양태에서, 중량비의 범위는 X_1:Y_1 내지 X_2:Y_2일 수 있으며, 여기서 $X_1 < Y_1$ 및 $X_2 < Y_2$이다. 비제한적 예로서, 화학식 1의 분자 또는 그의 임의의 농업상 허용되는 염 대 또 다른 화합물의 중량비의 범위는 약 1:3 내지 약 1:20일 수 있다.

[0559] 제제

[0560] 살충제는 그의 순수 형태로 적용하기에 별로 적합하지 않다. 통상적으로, 살충제가 적용, 취급, 수송, 저장의 용이성 및 최대 살충제 활성을 허용하는데 요구되는 농도 및 적절한 형태로 사용될 수 있도록 다른 물질을 첨가하는 것이 필요하다. 따라서, 살충제는 예를 들어 미끼, 농축 에멀젼, 분진, 유화성 농축물, 훈증제, 겔, 과립, 마이크로캡슐화제, 종자 처리제, 현탁 농축물, 유현탁액, 정제, 수용성 액체, 수분산성 과립 또는 건조 액상수화제, 습윤성 분말 및 초저부피 용액으로 제제화된다. 제제 유형에 관한 추가 정보에 대해 문헌 ["Catalogue of Pesticide Formulation Types and International Coding System" Technical Monograph n° 2, 5th Edition by CropLife International (2002)]을 참조한다.

[0561] 살충제는 이러한 살충제의 농축 제제로부터 제조된 수성 현탁액 또는 에멀젼으로서 가장 자주 적용된다. 이러한 수용성, 수현탁성 또는 유화성 제제는, 통상적으로 습윤성 분말 또는 수분산성 과립으로 공지된 고체, 또는 통상적으로 유화성 농축물 또는 수성 현탁액으로 공지된 액체이다. 압축되어 수분산성 과립을 형성할 수 있는 습윤성 분말은 살충제, 담체 및 계면활성제의 친밀한 혼합물을 포함한다. 살충제의 농도는 통상적으로 약 10 중량% 내지 약 90 중량%이다. 담체는 통상적으로 아타풀자이트 점토, 몬모릴로나이트 점토, 규조토 또는 정제된 실리케이트 중에서 선택된다. 습윤성 분말의 약 0.5% 내지 약 10%를 구성하는 효과적인 계면활성제는 술폰화 리그닌, 축합 나프탈렌술포네이트, 나프탈렌술포네이트, 알킬벤젠술포네이트, 알킬 술페이트 및 비이온성 계면활성제, 예컨대 알킬 페놀의 에틸렌 옥시드 부가물 중에서 찾을 수 있다.

[0562] 살충제의 유화성 농축물은 살충제의 편리한 농도, 예컨대 수혼화성 용매이거나 또는 수불혼화성 유기 용매와 유화제의 혼합물인 담체 중에 용해된 액체 리터당 약 50 내지 약 500 그램을 포함한다. 유용한 유기 용매는 방향족, 특히 크실렌 및 석유 분획, 특히 중질 방향족 나프타와 같은 석유의 고비점 나프탈렌 및 올레핀 부분을 포

함한다. 다른 유기 용매, 예컨대 로진 유도체를 포함한 테르펜계 용매, 시클로헥산온과 같은 지방족 케톤, 및 2-에톡시에탄올과 같은 복합 알콜이 또한 사용될 수 있다. 유화성 농축물에 적합한 유화제는 통상적인 음이온성 및 비이온성 계면활성제로부터 선택된다.

[0563] 수성 현탁액은 수성 담체에 약 5 중량% 내지 약 50 중량% 범위의 농도로 분산된 수불용성 살충제의 현탁액을 포함한다. 현탁액은 살충제를 미세하게 분쇄하고, 이를 물 및 계면활성제로 구성된 담체에 격렬하게 혼합시킴으로써 제조된다. 또한, 무기 염 및 합성 또는 천연 검과 같은 성분을 첨가하여 수성 담체의 밀도 및 점도를 증가시킬 수 있다. 수성 혼합물을 제조하고 이를 샌드 밀, 볼 밀 또는 피스톤-유형 균질화기와 같은 기기에서 균질화시킴으로써 살충제를 동시에 분쇄 및 혼합하는 것이 종종 가장 효과적이다.

[0564] 또한, 살충제는 토양에 적용하기에 특히 유용한 과립상 조성물로서 적용될 수 있다. 과립상 조성물은 통상적으로, 점토 또는 유사 물질을 포함하는 담체에 분산된 살충제를 약 0.5 중량% 내지 약 10 중량% 함유한다. 이러한 조성물은 통상적으로, 살충제를 적합한 용매 중에 용해시키고, 이를 약 0.5 내지 약 3 ㎜ 범위의 적절한 입자 크기로 예비형성된 과립상 담체에 적용함으로써 제조된다. 이러한 조성물은 또한 담체와 화합물의 도우 또는 페이스트를 제조하고 이를 분쇄 및 건조시켜 목적하는 과립 입자 크기를 얻음으로써 제제화될 수 있다.

[0565] 살충제를 함유하는 분진은, 분말화된 형태의 살충제를 카올린 점토, 분쇄 화산암 등과 같은 적합한 분진성 농업용 담체와 친밀하게 혼합함으로써 제조된다. 분진은 적합하게는 약 1% 내지 약 10%의 살충제를 함유할 수 있다. 이는 분진 송풍 기계를 사용하여 종자 드레싱 또는 경엽 적용으로서 적용될 수 있다.

[0566] 살충제를 농업 화학에 널리 사용되는 적절한 유기 용매, 통상적으로 석유 오일, 예컨대 분무 오일 중 용액의 형태로 적용하는 것이 동등하게 실시가능하다.

[0567] 살충제는 또한 에어로졸 조성물의 형태로 적용될 수 있다. 이러한 조성물에서, 살충제는 압력-발생 추진제 혼합물인 담체 중에 용해되거나 또는 분산된다. 에어로졸 조성물은 상기 혼합물이 무화 밸브를 통해 분배되는 용기에 포장된다.

[0568] 살충제 미끼는 살충제를 식품 또는 유인제 또는 둘 다와 혼합하는 경우에 형성된다. 해충이 미끼를 섭취하는 경우에 해충은 살충제도 소비한다. 미끼는 과립, 겔, 액상수화제 분말, 액체 또는 고체의 형태를 취할 수 있다. 이들은 해충 은신처에 사용될 수 있다.

[0569] 훈증제는 상대적으로 높은 증기압을 갖는 살충제이며, 따라서 토양 또는 폐쇄 공간에서 해충을 사멸시키기에 충분한 농도의 기체로서 존재할 수 있다. 훈증제의 독성은 그의 농도 및 노출 시간에 비례한다. 이들은 우수한 확산 능력을 특징으로 하며, 해충의 호흡계에 침투하거나 또는 해충의 각피를 통해 흡수됨으로써 작용한다. 훈증제는 기체 차단 시트 하에, 기체 밀폐된 방 또는 건물에서, 또는 특수 챔버에서 저장 제품 해충을 방제하기 위해 적용된다.

[0570] 살충제는 살충제 입자 또는 액적을 다양한 유형의 플라스틱 중합체 중에 현탁시킴으로써 마이크로캡슐화될 수 있다. 중합체의 화학을 변경시키거나 또는 가공에서의 인자를 변화시킴으로써 다양한 크기, 용해도, 벽 두께 및 침투도의 마이크로캡슐이 형성될 수 있다. 이들 인자는 활성 성분이 방출되는 속도를 좌우하고, 이는 다시 잔류 성능, 작용 속도 및 제품 냄새에 영향을 미친다.

[0571] 오일 용액 농축물은, 용액 중에 살충제를 보유할 용매 중에 살충제를 용해시킴으로써 제조된다. 통상적으로, 살충제의 오일 용액은 용매 자체가 살충 작용을 갖고 외피의 왁스상 피복을 용해시켜 살충제의 흡수 속도를 증가시키기 때문에 다른 제제보다 더 빠르게 해충에 타격을 주고 사멸시킨다. 오일 용액의 다른 이점은 보다 우수한 저장 안정성, 보다 우수한 틈 침투성 및 지방성 표면에 대한 보다 우수한 접착성을 포함한다.

[0572] 또 다른 실시양태는 수중유 에멀젼이며, 여기서 에멀젼은 층상 액정 코팅이 각각 제공되고 수성 상에 분산되어 있는 유성 구상체를 포함하고, 여기서 각각의 유성 구상체는 농업상 활성인 적어도 1종의 화합물을 포함하고, 개별적으로 (1) 적어도 1종의 비이온성 친지성 표면-활성제, (2) 적어도 1종의 비이온성 친수성 표면-활성제 및 (3) 적어도 1종의 이온성 표면-활성제를 포함하는 단일층상 또는 올리고층상 층으로 코팅되고, 여기서 구상체는 평균 입자 직경이 800 나노미터 미만이다. 이들 실시양태에 관한 추가 정보는 미국 특허 공개 20070027034 (2007년 2월 1일 공개, 특허 출원 일련 번호 11/495,228)에 개시되어 있다. 사용의 용이성을 위해, 이 실시양태는 "OIWE"로서 지칭될 것이다.

[0573] 추가 정보에 대해 문헌 ["Insect Pest Management" 2nd Edition by D. Dent, copyright CAB International (2000)]을 참조한다. 추가적으로, 보다 상세한 정보에 대해 문헌 ["Handbook of Pest Control - The

Behavior, Life History, and Control of Household Pests" by Arnold Mallis, 9th Edition, copyright 2004 by GIE Media Inc.]을 참조한다.

[0574] 다른 제제 성분

[0575] 일반적으로, 화학식 1에 개시된 분자가 제제에 사용되는 경우, 이러한 제제는 또한 다른 성분을 함유할 수 있다. 이들 성분은 습윤제, 확산제, 점착제, 침투제, 완충제, 봉쇄제, 표류 감소제, 상용화제, 소포제, 세정제, 및 유화제를 포함하나 이에 제한되지는 않는다 (이는 비포괄적 및 비-상호 배타적 목록임). 몇몇 성분이 하기에 기재되어 있다.

[0576] 습윤제는 액체에 첨가되었을 때 액체와 그가 확산되는 표면 사이의 계면 장력을 감소시킴으로써 액체의 확산 또는 침투 능력을 증가시키는 물질이다. 습윤제는 농약 제제에서 다음 2가지 주요 기능에 사용된다: 가공 및 제조 동안 분말이 물에 습윤되는 속도를 증가시켜 가용성 액체를 위한 농축물 또는 현탁 농축물을 제조하는 것; 및 제품을 분무 탱크에서 물과 혼합하는 동안 습윤성 분말의 습윤 시간을 감소시키고 물이 수분산성 과립 내로 침투하는 것을 개선시키는 것. 습윤성 분말, 현탁 농축물 및 수분산성 과립 제제에 사용되는 습윤제의 예는 다음과 같다: 소듐 라우릴 술페이트; 소듐 디옥틸 술포숙시네이트; 알킬 페놀 에톡실레이트; 및 지방족 알콜 에톡실레이트.

[0577] 분산제는 입자 표면 상에 흡착되어 입자의 분산 상태를 보존하고 입자의 재응집 방지를 보조하는 물질이다. 제조 동안 분산 및 현탁을 용이하게 하고 분무 탱크에서 입자가 물에 재분산되는 것을 보장하기 위해, 농약 제제에 분산제를 첨가한다. 분산제는 습윤성 분말, 현탁 농축물 및 수분산성 과립에 폭넓게 사용된다. 분산제로서 사용되는 계면활성제는, 입자 표면 상에 강하게 흡착되어 입자의 재응집에 대한 하전 또는 입체 장벽을 제공하는 능력을 갖는다. 가장 통상적으로 사용되는 계면활성제는 음이온성, 비이온성 또는 이들 2가지 유형의 혼합물이다. 습윤성 분말 제제의 경우, 가장 통상적인 분산제는 소듐 리그노술포네이트이다. 현탁 농축물의 경우, 소듐 나프탈렌 술포네이트 포름알데히드 축합물과 같은 다가전해질을 사용하여 매우 우수한 흡착 및 안정화가 달성된다. 트리스티릴페놀 에톡실레이트 포스페이트 에스테르가 또한 사용된다. 알킬아릴에틸렌 옥시드 축합물 및 EO-PO 블록 공중합체와 같은 비이온성 물질은 때때로 현탁 농축물을 위한 분산제로서 음이온성 물질과 조합된다. 최근 수년간, 새로운 유형의 매우 높은 분자량의 중합체 계면활성제가 분산제로서 개발되었다. 이들은 매우 긴 소수성 '백본' 및 다수의 에틸렌 옥시드 쇄를 가져 '콤' 계면활성제의 '이'를 형성한다. 이들 고분자량 중합체는 소수성 백본이 입자 표면 상에 다수의 고정 지점을 갖기 때문에 매우 우수한 장기 안정성을 현탁 농축물에 제공할 수 있다. 농약 제제에 사용된 분산제의 예는 소듐 리그노술포네이트; 소듐 나프탈렌 술포네이트 포름알데히드 축합물; 트리스티릴페놀 에톡실레이트 포스페이트 에스테르; 지방족 알콜 에톡실레이트; 알킬 에톡실레이트; EO-PO 블록 공중합체; 및 그라프트 공중합체이다.

[0578] 유화제는 한 액체 상의 액적의 또 다른 액체 상 중의 현탁을 안정화시키는 물질이다. 유화제가 없다면 2종의 액체는 2종의 불혼화성 액체 상으로 분리될 것이다. 가장 통상적으로 사용되는 유화제 블렌드는 알킬페놀 또는 12개 이상의 에틸렌 옥시드 단위를 갖는 지방족 알콜, 및 도데실벤젠술폰산의 유용성 칼슘 염을 함유한다. 통상적으로, 8 내지 18의 친수성기-친지성기 균형 ("HLB") 값 범위가 우수한 안정한 에멀젼을 제공할 것이다. 에멀젼 안정성은 때때로 소량의 EO-PO 블록 공중합체 계면활성제를 첨가함으로써 개선될 수 있다.

[0579] 가용화제는 임계 미셀 농도 초과의 농도에서 물 중에 미셀을 형성할 계면활성제이다. 이어서, 미셀은 미셀의 소수성 부분 내부의 수불용성 물질을 용해시키거나 가용화시킬 수 있다. 가용화를 위해 통상적으로 사용되는 계면활성제의 유형은 비이온성 물질, 소르비탄 모노올레에이트, 소르비탄 모노올레에이트 에톡실레이트 및 메틸 올레에이트 에스테르이다.

[0580] 계면활성제는 때때로 단독으로, 또는 분무-탱크 믹스에 대한 보조제로서의 미네랄 또는 식물성 오일과 같은 다른 첨가제와 함께 사용되어 표적에 대한 살충제의 생물학적 성능을 개선시킨다. 생물증진을 위해 사용되는 계면활성제의 유형은 일반적으로 살충제의 특성 및 작용 방식에 따라 달라진다. 그러나, 이들은 종종 비이온성 물질, 예컨대 알킬 에톡실레이트; 선형 지방족 알콜 에톡실레이트; 지방족 아민 에톡실레이트이다.

[0581] 농업 제제에서의 담체 또는 희석제는, 살충제에 첨가되어 요구되는 농도의 제품을 제공하는 물질이다. 담체는 통상적으로 흡수 능력이 높은 물질인 반면, 희석제는 통상적으로 흡수 능력이 낮은 물질이다. 담체 및 희석제는 분진, 습윤성 분말, 과립 및 수분산성 과립의 제제에 사용된다.

[0582] 유기 용매는 주로 유화성 농축물, 수중유 에멀젼, 유현탁액, 및 초저부피 제제에, 및 보다 낮은 정도로 과립상 제제에 사용된다. 때때로 용매의 혼합물이 사용된다. 용매의 제1 주요 군은 지방족 파라핀계 오일, 예컨대 케

로센 또는 정제 파라핀이다. 제2 주요 군 (및 가장 통상적인 것)은 방향족 용매, 예컨대 크실렌 및 C9 및 C10 방향족 용매의 보다 고분자량 분획을 포함한다. 제제가 물 중에 유화되는 경우에 살충제의 결정화를 방지하기 위해 염소화 탄화수소가 공용매로서 유용하다. 용해력을 증가시키기 위해 알콜이 때때로 공용매로서 사용된다. 다른 용매는 식물성 오일, 종자 오일, 및 식물성 및 종자 오일의 에스테르를 포함할 수 있다.

[0583] 액체의 레올로지 또는 유동 특성을 변형시키고, 분산된 입자 또는 액적의 분리 및 침강을 방지하기 위해, 현탁 농축물, 에멀젼 및 유현탁액의 제제에서 주로 증점제 또는 겔화제가 사용된다. 증점제, 겔화제 및 침강방지제는 일반적으로 2가지 카테고리, 즉 수불용성 미립자 및 수용성 중합체에 속한다. 점토 및 실리카를 사용하여 현탁 농축물 제제를 제조하는 것이 가능하다. 이들 유형의 물질의 예는 몬모릴로나이트, 벤토나이트, 규산알루미늄마그네슘 및 아타풀자이트를 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 다년간 수용성 폴리사카라이드가 증점제-겔화제로서 사용되어 왔다. 가장 통상적으로 사용되는 폴리사카라이드의 유형은, 종자 및 해초의 천연 추출물, 또는 셀룰로스의 합성 유도체이다. 이들 유형의 물질의 예는 구아 검; 로커스트빈 검; 카라기난; 알기네이트; 메틸 셀룰로스; 소듐 카르복시메틸 셀룰로스 (SCMC); 히드록시에틸 셀룰로스 (HEC)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 다른 유형의 침강방지제는 개질된 전분, 폴리아크릴레이트, 폴리비닐 알콜 및 폴리에틸렌 옥시드를 기재로 하는 것이다. 또 다른 우수한 침강 방지제는 크산탄 검이다.

[0584] 미생물은 제제화된 제품의 변질을 야기할 수 있다. 따라서, 그의 영향을 제거하거나 감소시키기 위해 보존제가 사용된다. 이러한 작용제의 예는 다음을 포함하나 이에 제한되지는 않는다: 프로피온산 및 그의 나트륨 염; 소르브산 및 그의 나트륨 또는 칼륨 염; 벤조산 및 그의 나트륨 염; p-히드록시벤조산 나트륨 염; 메틸 p-히드록시벤조에이트; 및 1,2-벤즈이소티아졸린-3-온 (BIT).

[0585] 계면활성제의 존재는 종종 제조 및 분무 탱크를 통한 적용시에 혼합 작업 동안 수계 제제가 발포되도록 한다. 발포 경향을 감소시키기 위해, 종종 제조 단계 동안 또는 병에 채우기 전에 소포제를 첨가한다. 일반적으로, 2가지 유형의 소포제, 즉 실리콘 및 비-실리콘이 존재한다. 실리콘은 통상적으로 디메틸 폴리실록산의 수성 에멀젼이며, 한편 비-실리콘 소포제는 수불용성 오일, 예컨대 옥탄올 및 노난올, 또는 실리카이다. 둘 다의 경우에서, 소포제의 기능은 공기-물 계면에서 계면활성제를 제거하는 것이다.

[0586] "그린" 작용제 (예를 들어, 보조제, 계면활성제, 용매)는 작물 보호 제제의 전체 환경 발자국을 감소시킬 수 있다. 그린 작용제는 생분해성이며 일반적으로 천연 및/또는 지속가능한 공급원, 예를 들어 식물 및 동물 공급원으로부터 유래된다. 구체적 예는 다음과 같다: 식물성 오일, 종자 오일 및 그의 에스테르, 또한 알콕실화 알킬 폴리글루코시드.

[0587] 추가 정보에 대해, 문헌 ["Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations" edited by D.A. Knowles, copyright 1998 by Kluwer Academic Publishers]을 참조한다. 또한, 문헌 ["Insecticides in Agriculture and Environment - Retrospects and Prospects" by A.S. Perry, I. Yamamoto, I. Ishaaya, and R. Perry, copyright 1998 by Springer-Verlag]을 참조한다.

[0588] 해충

[0589] 일반적으로, 화학식 1의 분자는 해충, 예를 들어 딱정벌레, 집게벌레, 바퀴벌레, 파리, 진딧물, 깍지벌레, 가루이, 매미충, 개미, 말벌, 흰개미, 나방, 나비, 이, 방아깨비, 메뚜기, 귀뚜라미, 벼룩, 총채벌레, 좀, 응애, 진드기, 선충류 및 결합류를 방제하는데 사용될 수 있다.

[0590] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 선형동물문 및/또는 절지동물문의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다.

[0591] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 협각아문, 다지아문 및/또는 육각아문의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다.

[0592] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 거미강, 결합강 및/또는 곤충강의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다.

[0593] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 이아목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 속의 비포괄적 목록은 헤마토피누스 종(*Haematopinus* spp.), 호플로플레우라 종(*Hoplopleura* spp.), 리노그나투스 종(*Linognathus* spp.), 페디쿨루스 종(*Pediculus* spp.), 및 폴리플락스 종(*Polyplax* spp.)을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 헤마토피누스 아시니(*Haematopinus asini*), 헤마토피누스 수이스(*Haematopinus suis*), 리노그나투스 세토수스(*Linognathus setosus*), 리노그나투스 오빌루스(*Linognathus*

ovillus), 페디쿨루스 휴마누스 카피티스(*Pediculus humanus capitis*), 페디쿨루스 휴마누스 휴마누스(*Pediculus humanus humanus*), 및 프티루스 푸비스(*Pthirus pubis*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0594] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 딱정벌레목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 속의 비포괄적 목록은 아칸토셀리데스 종(*Acanthoscelides* spp.), 아그리오테스 종(*Agriotes* spp.), 안토노무스 종(*Anthonomus* spp.), 아피온 종(*Apion* spp.), 아포고니아 종(*Apogonia* spp.), 아울라코포라 종(*Aulacophora* spp.), 브루쿠스 종(*Bruchus* spp.), 세로스테르나 종(*Cerosterna* spp.), 세로토마 종(*Cerotoma* spp.), 세우토린쿠스 종(*Ceutorhynchus* spp.), 카에톡네마 종(*Chaetocnema* spp.), 콜라스피스 종(*Colaspis* spp.), 크테니세라 종(*Ctenicera* spp.), 쿠르쿨리오 종(*Curculio* spp.), 시클로세팔라 종(*Cyclocephala* spp.), 디아브로티카 종(*Diabrotica* spp.), 히페라 종(*Hypera* spp.), 입스 종(*Ips* spp.), 릭투스 종(*Lyctus* spp.), 메가셀리스 종(*Megascelis* spp.), 멜리게테스 종(*Meligethes* spp.), 오티오린쿠스 종(*Otiorhynchus* spp.), 판토모루스 종(*Pantomorus* spp.), 필로파가 종(*Phyllophaga* spp.), 필로트레타 종(*Phyllotreta* spp.), 리조트로구스 종(*Rhizotrogus* spp.), 린키테스 종(*Rhynchites* spp.), 린코포루스 종(*Rhynchophorus* spp.), 스콜리투스 종(*Scolytus* spp.), 스페노포루스 종(*Sphenophorus* spp.), 시토필루스 종(*Sitophilus* spp.), 및 트리볼리움 종(*Tribolium* spp.)을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 아칸토셀리데스 오브텍투스(*Acanthoscelides obtectus*), 아그릴루스 플라니펜니스(*Agrilus planipennis*), 아노플로포라 글라브리펜니스(*Anoplophora glabripennis*), 안토노무스 그란디스(*Anthonomus grandis*), 아타에니우스 스프레툴루스(*Ataenius spretulus*), 아토마리아 리네아리스(*Atomaria linearis*), 보티노데레스 푼크티벤트리스(*Bothynoderes punctiventris*), 브루쿠스 피소룸(*Bruchus pisorum*), 칼로소브루쿠스 마쿨라투스(*Callosobruchus maculatus*), 카르포필루스 헤미프테루스(*Carpophilus hemipterus*), 카시다 비타타(*Cassida vittata*), 세로토마 트리푸르카타(*Cerotoma trifurcata*), 세우토린쿠스 아시밀리스(*Ceutorhynchus assimilis*), 세우토린쿠스 나피(*Ceutorhynchus napi*), 코노데루스 스칼라리스(*Conoderus scalaris*), 코노데루스 스티그모수스(*Conoderus stigmosus*), 코노트라켈루스 네누파르(*Conotrachelus nenuphar*), 코티니스 니티다(*Cotinis nitida*), 크리오세리스 아스파라기(*Crioceris asparagi*), 크립토레스테스 페루기네우스(*Cryptolestes ferrugineus*), 크립토레스테스 푸실루스(*Cryptolestes pusillus*), 크립토레스테스 투르시쿠스(*Cryptolestes turcicus*), 실린드로코프투루스 아드스페르수스(*Cylindrocopturus adspersus*), 데포라우스 마르기나투스(*Deporaus marginatus*), 데르메스테스 라르다리우스(*Dermestes lardarius*), 데르메스테스 마쿨라투스(*Dermestes maculatus*), 에필라크나 바리베스티스(*Epilachna varivestis*), 파우스티누스 쿠바에(*Faustinus cubae*), 힐로비우스 팔레스(*Hylobius pales*), 히페라 포스티카(*Hypera postica*), 히포테네무스 함페이(*Hypothenemus hampei*), 라시오더마 세리코르네(*Lasioderma serricorne*), 렙티노타르사 데셈리네아타(*Leptinotarsa decemlineata*), 리오게니스 푸스쿠스(*Liogenys fuscus*), 리오게니스 수투랄리스(*Liogenys suturalis*), 리소로프트루스 오리조필루스(*Lissorhoptrus oryzophilus*), 마에콜라스피스 졸리베티(*Maecolaspis joliveti*), 멜라노투스 콤뮤니스(*Melanotus communis*), 멜리게테스 아에네우스(*Meligethes aeneus*), 멜로론타 멜로론타(*Melolontha melolontha*), 오베레아 브레비스(*Oberea brevis*), 오베레아 리네아리스(*Oberea linearis*), 오릭테스 리노세로스(*Oryctes rhinoceros*), 오리자에필루스 메르카토르(*Oryzaephilus mercator*), 오리자에필루스 수리나멘시스(*Oryzaephilus surinamensis*), 오울레마 멜라노푸스(*Oulema melanopus*), 오울레마 오리자에(*Oulema oryzae*), 필로파가 쿠야바나(*Phyllophaga cuyabana*), 포필리아 자포니카(*Popillia japonica*), 프로스테파누스 트룬카투스(*Prostephanus truncatus*), 리조페르타 도미니카(*Rhyzopertha dominica*), 시토나 리네아투스(*Sitona lineatus*), 시토필루스 그라나리우스(*Sitophilus granarius*), 시토필루스 오리자에(*Sitophilus oryzae*), 시토필루스 제아마이스(*Sitophilus zeamais*), 스테고비움 파니세움(*Stegobium paniceum*), 트리볼리움 카스타네움(*Tribolium castaneum*), 트리볼리움 콘푸숨(*Tribolium confusum*), 트로고더마 바리아빌레(*Trogoderma variabile*), 및 자브루스 테네브리오이데스(*Zabrus tenebrioides*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0595] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 집게벌레목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다.

[0596] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 바퀴목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 블라텔라 게르마니카(*Blattella germanica*), 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*), 파르코블라타 펜실바니카(*Parcoblatta pennsylvanica*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 페리플라네타 아우스트랄라시아에(*Periplaneta australasiae*), 페리플라네타 브룬네아(*Periplaneta brunnea*), 페리플라네타 풀리기노사(*Periplaneta fuliginosa*), 피크노셀루스 수리나멘시스(*Pycnoscelus surinamensis*) 및 수펠라 롱기팔파(*Supella longipalpa*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0597] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 파리목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 속의 비포괄적

목록은 아에데스 종(*Aedes* spp.), 아그로미자 종(*Agromyza* spp.), 아나스트레파 종(*Anastrepha* spp.), 아노펠레스 종(*Anopheles* spp.), 박트로세라 종(*Bactrocera* spp.), 세라티티스 종(*Ceratitis* spp.), 크리솝스 종(*Chrysops* spp.), 코클리오미이아 종(*Cochliomyia* spp.), 콘타리니아 종(*Contarinia* spp.), 쿨렉스 종(*Culex* spp.), 다시네우라 종(*Dasineura* spp.), 델리아 종(*Delia* spp.), 드로소필라 종(*Drosophila* spp.), 판니아 종(*Fannia* spp.), 힐레미이아 종(*Hylemyia* spp.), 리리오미자 종(*Liriomyza* spp.), 무스카 종(*Musca* spp.), 포르비아 종(*Phorbia* spp.), 타바누스 종(*Tabanus* spp.), 및 티풀라 종(*Tipula* spp.)을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 아그로미자 프론텔라(*Agromyza frontella*), 아나스트레파 수스펜사(*Anastrepha suspensa*), 아나스트레파 루덴스(*Anastrepha ludens*), 아나스트레파 오블리카(*Anastrepha obliqa*), 박트로세라 쿠쿠르비타에(*Bactrocera cucurbitae*), 박트로세라 도르살리스(*Bactrocera dorsalis*), 박트로세라 인바덴스(*Bactrocera invadens*), 박트로세라 조나타(*Bactrocera zonata*), 세라티티스 카피타타(*Ceratitis capitata*), 다시네우라 브라시카에(*Dasineura brassicae*), 델리아 플라투라(*Delia platura*), 판니아 카니쿨라리스(*Fannia canicularis*), 판니아 스칼라리스(*Fannia scalaris*), 가스테로필루스 인테스티날리스(*Gasterophilus intestinalis*), 그라실리아 페르세아에(*Gracillia perseae*), 헤마토비아 이리탄스(*Haematobia irritans*), 히포더마 리네아툼(*Hypoderma lineatum*), 리리오미자 브라시카에(*Liriomyza brassicae*), 멜로파구스 오비누스(*Melophagus ovinus*), 무스카 아우툼날리스(*Musca autumnalis*), 무스카 도메스티카(*Musca domestica*), 오에스트루스 오비스(*Oestrus ovis*), 오시넬라 프리트(*Oscinella frit*), 페고미아 베타에(*Pegomya betae*), 프실라 로사에(*Psila rosae*), 라골레티스 세라시(*Rhagoletis cerasi*), 라골레티스 포모넬라(*Rhagoletis pomonella*), 라골레티스 멘닥스(*Rhagoletis mendax*), 시토디플로시스 모셀라나(*Sitodiplosis mosellana*), 및 스토목시스 칼시트란스(*Stomoxys calcitrans*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0598] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 노린재목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 속의 비포괄적 목록은 아델게스 종(*Adelges* spp.), 아울라카스피스 종(*Aulacaspis* spp.), 아프로포라 종(*Aphrophora* spp.), 아피스 종(*Aphis* spp.), 베미시아 종(*Bemisia* spp.), 세로플라스테스 종(*Ceroplastes* spp.), 키오나스피스 종(*Chionaspis* spp.), 크리솜팔루스 종(*Chrysomphalus* spp.), 코쿠스 종(*Coccus* spp.), 엠포아스카 종(*Empoasca* spp.), 레피도사페스 종(*Lepidosaphes* spp.), 라기노토무스 종(*Lagynotomus* spp.), 리구스 종(*Lygus* spp.), 마크로시품 종(*Macrosiphum* spp.), 네포테틱스 종(*Nephotettix* spp.), 네자라 종(*Nezara* spp.), 필라에누스 종(*Philaenus* spp.), 피토코리스 종(*Phytocoris* spp.), 피에조도루스 종(*Piezodorus* spp.), 플라노코쿠스 종(*Planococcus* spp.), 슈도코쿠스 종(*Pseudococcus* spp.), 로팔로시품 종(*Rhopalosiphum* spp.), 사이세티아 종(*Saissetia* spp.), 테리오아피스 종(*Therioaphis* spp.), 토우메옐라 종(*Toumeyella* spp.), 톡소프테라 종(*Toxoptera* spp.), 트리알레우로데스 종(*Trialeurodes* spp.), 트리아토마 종(*Triatoma* spp.) 및 우나스피스 종(*Unaspis* spp.)을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 아크로스테르눔 힐라레(*Acrosternum hilare*), 아시르토시폰 피숨(*Acyrthosiphon pisum*), 알레이로데스 프롤레텔라(*Aleyrodes proletella*), 알레우로디쿠스 디스페르수스(*Aleurodicus dispersus*), 알레우로트릭수스 플록코수스(*Aleurothrixus floccosus*), 암라스카 비구툴라 비구툴라(*Amrasca biguttula biguttula*), 아오니디엘라 아우란티이(*Aonidiella aurantii*), 아피스 고시피이(*Aphis gossypii*), 아피스 글리시네스(*Aphis glycines*), 아피스 포미(*Aphis pomi*), 아울라코르툼 솔라니(*Aulacorthum solani*), 베미시아 아르겐티폴리이(*Bemisia argentifolii*), 베미시아 타바시(*Bemisia tabaci*), 블리수스 류코프테루스(*Blissus leucopterus*), 브라키코리넬라 아스파라기(*Brachycorynella asparagi*), 브레베니아 레히(*Brevennia rehi*), 브레비코리네 브라시카에(*Brevicoryne brassicae*), 칼로코리스 노르베기쿠스(*Calocoris norvegicus*), 세로플라스테스 루벤스(*Ceroplastes rubens*), 시멕스 헤미프테루스(*Cimex hemipterus*), 시멕스 렉툴라리우스(*Cimex lectularius*), 다그베르투스 파시아투스(*Dagbertus fasciatus*), 디켈롭스 푸르카투스(*Dichelops furcatus*), 디우라피스 녹시아(*Diuraphis noxia*), 디아포리나 시트리(*Diaphorina citri*), 디사피스 플란타기네아(*Dysaphis plantaginea*), 디스데르쿠스 수투렐루스(*Dysdercus suturellus*), 에데사 메디타분다(*Edessa meditabunda*), 에리오소마 라니게룸(*Eriosoma lanigerum*), 유리가스터 마우라(*Eurygaster maura*), 유쉬스투스 헤로스(*Euschistus heros*), 유쉬스투스 세르부스(*Euschistus servus*), 헬로펠티스 안토니이(*Helopeltis antonii*), 헬로펠티스 테이보라(*Helopeltis theivora*), 이세리아 푸르카시(*Icerya purchasi*), 이디오스코푸스 니티둘루스(*Idioscopus nitidulus*), 라오델팍스 스트리아텔루스(*Laodelphax striatellus*), 렙토코리사 오라토리우스(*Leptocorisa oratorius*), 렙토코리사 바리코르니스(*Leptocorisa varicornis*), 리구스 헤스페루스(*Lygus hesperus*), 마코넬리코쿠스 히르수투스(*Maconellicoccus hirsutus*), 마크로시품 유포르비아에(*Macrosiphum euphorbiae*), 마크로시품 그라나리움(*Macrosiphum granarium*), 마크로시품 로사에(*Macrosiphum rosae*), 마크로스텔레스 퀴드릴리네아투스(*Macrosteles quadrilineatus*), 마하나르바 프림비올라타(*Mahanarva frimbiolata*), 메토폴로피움 디로둠

(*Metopolophium dirhodum*), 믹티스 롱기코르니스(*Mictis longicornis*), 미주스 페르시카에(*Myzus persicae*), 네포테틱스 신크티페스(*Nephotettix cinctipes*), 뉴로콜푸스 롱기로스트리스(*Neurocolpus longirostris*), 네자라 비리둘라(*Nezara viridula*), 닐라파르바타 루겐스(*Nilaparvata lugens*), 파를라토리아 페르간디이(*Parlatoria pergandii*), 파를라토리아 지지피(*Parlatoria ziziphi*), 페레그리누스 마이디스(*Peregrinus maidis*), 필록세라 비티폴리아에(*Phylloxera vitifoliae*), 피소케르메스 피세아에(*Physokermes piceae*), 피토코리스 칼리포르니쿠스(*Phytocoris californicus*), 피토코리스 렐라티부스(*Phytocoris relativus*), 피에조도루스 구일디니이(*Piezodorus guildinii*), 포에실로캅수스 리네아투스(*Poecilocapsus lineatus*), 프살루스 바시니콜라(*Psallus vaccinicola*), 슈다시스타 페르세아에(*Pseudacysta perseae*), 슈도코쿠스 브레비페스(*Pseudococcus brevipes*), 쿼드라스피디오투스 페르니시오수스(*Quadraspidiotus perniciosus*), 로팔로시품 마이디스(*Rhopalosiphum maidis*), 로팔로시품 파디(*Rhopalosiphum padi*), 사이세티아 올레아에(*Saissetia oleae*), 스캅토코리스 카스타네아(*Scaptocoris castanea*), 쉬자피스 그라미눔(*Schizaphis graminum*), 시토비온 아베나에(*Sitobion avenae*), 소가텔라 푸르시페라(*Sogatella furcifera*), 트리알레우로데스 바포라리오룸(*Trialeurodes vaporariorum*), 트리알레우로데스 아부틸로네우스(*Trialeurodes abutiloneus*), 우나스피스 야노넨시스(*Unaspis yanonensis*), 및 줄리아 엔트레리아나(*Zulia entrerriana*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0599] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 막시목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 속의 비포괄적 목록은 아크로미르멕스 종(*Acromyrmex* spp.), 아타 종(*Atta* spp.), 캄포노투스 종(*Camponotus* spp.), 디프리온 종(*Diprion* spp.), 포르미카 종(*Formica* spp.), 모노모리움 종(*Monomorium* spp.), 네오디프리온 종(*Neodiprion* spp.), 포고노미르멕스 종(*Pogonomyrmex* spp.), 폴리스테스 종(*Polistes* spp.), 솔레놉시스 종(*Solenopsis* spp.), 베스풀라 종(*Vespula* spp.), 및 크실로코파 종(*Xylocopa* spp.)을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 아탈리아 로사에(*Athalia rosae*), 아타 텍사나(*Atta texana*), 이리도미르멕스 휴밀리스(*Iridomyrmex humilis*), 모노모리움 미니뭄(*Monomorium minimum*), 모노모리움 파라오니스(*Monomorium pharaonis*), 솔레놉시스 인빅타(*Solenopsis invicta*), 솔레놉시스 게미나타(*Solenopsis geminata*), 솔레놉시스 몰레스타(*Solenopsis molesta*), 솔레놉시스 리크테리(*Solenopsis richtery*), 솔레놉시스 크실로니(*Solenopsis xyloni*), 및 타피노마 세실레(*Tapinoma sessile*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0600] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 흰개미목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 속의 비포괄적 목록은 코프토테르메스 종(*Coptotermes* spp.), 코르니테르메스 종(*Cornitermes* spp.), 크립토테르메스 종(*Cryptotermes* spp.), 헤테로테르메스 종(*Heterotermes* spp.), 칼로테르메스 종(*Kalotermes* spp.), 인시시테르메스 종(*Incisitermes* spp.), 마크로테르메스 종(*Macrotermes* spp.), 마르기니테르메스 종(*Marginitermes* spp.), 미크로세로테르메스 종(*Microcerotermes* spp.), 프로코르니테르메스 종(*Procornitermes* spp.), 레티쿨리테르메스 종(*Reticulitermes* spp.), 쉐도리노테르메스 종(*Schedorhinotermes* spp.), 및 주테르몹시스 종(*Zootermopsis* spp.)을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 코프토테르메스 쿠르비그나투스(*Coptotermes curvignathus*), 코프토테르메스 프렌키(*Coptotermes frenchi*), 코프토테르메스 포르모사누스(*Coptotermes formosanus*), 헤테로테르메스 아우레우스(*Heterotermes aureus*), 미크로테르메스 오베시(*Microtermes obesi*), 레티쿨리테르메스 바니울렌시스(*Reticulitermes banyulensis*), 레티쿨리테르메스 그라세이(*Reticulitermes grassei*), 레티쿨리테르메스 플라비페스(*Reticulitermes flavipes*), 레티쿨리테르메스 하게니(*Reticulitermes hageni*), 레티쿨리테르메스 헤스페루스(*Reticulitermes hesperus*), 레티쿨리테르메스 산토넨시스(*Reticulitermes santonensis*), 레티쿨리테르메스 스페라투스(*Reticulitermes speratus*), 레티쿨리테르메스 티비알리스(*Reticulitermes tibialis*), 및 레티쿨리테르메스 비르기니쿠스(*Reticulitermes virginicus*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0601] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 인시목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 속의 비포괄적 목록은 아독소피에스 종(*Adoxophyes* spp.), 아그로티스 종(*Agrotis* spp.), 아르기로타에니아 종(*Argyrotaenia* spp.), 카코에시아 종(*Cacoecia* spp.), 칼로프틸리아 종(*Caloptilia* spp.), 킬로 종(*Chilo* spp.), 크리소데익시스 종(*Chrysodeixis* spp.), 콜리아스 종(*Colias* spp.), 크람부스 종(*Crambus* spp.), 디아파니아 종(*Diaphania* spp.), 디아트라에아 종(*Diatraea* spp.), 에아리아스 종(*Earias* spp.), 에페스티아 종(*Ephestia* spp.), 에피메시스 종(*Epimecis* spp.), 펠티아 종(*Feltia* spp.), 고르티나 종(*Gortyna* spp.), 헬리코베르파 종(*Helicoverpa* spp.), 헬리오티스 종(*Heliothis* spp.), 인다르벨라 종(*Indarbela* spp.), 리토콜레티스 종(*Lithocolletis* spp.), 록사그로티스 종(*Loxagrotis* spp.), 말라코소마 종(*Malacosoma* spp.), 페리드로마 종(*Peridroma* spp.), 필로노릭테르 종(*Phyllonorycter* spp.), 슈달레티아 종(*Pseudaletia* spp.), 세사미아 종(*Sesamia* spp.), 스포도프테라 종(*Spodoptera* spp.), 시난테돈 종(*Synanthedon* spp.), 및 이포노메우타 종

(*Yponomeuta* spp.)을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 아카에아 자나타(*Achaea janata*), 아독소피에스 오라나(*Adoxophyes orana*), 아그로티스 입실론(*Agrotis ipsilon*), 알라바마 아르길라세아(*Alabama argillacea*), 아모르비아 쿠네아나(*Amorbia cuneana*), 아미엘로이스 트란시텔라(*Amyelois transitella*), 아나캄프토데스 데펙타리아(*Anacamptodes defectaria*), 아나르시아 리네아텔라(*Anarsia lineatella*), 아노미스 사불리페라(*Anomis sabulifera*), 안티카르시아 겜마탈리스(*Anticarsia gemmatalis*), 아르킵스 아르기로스필라(*Archips argyrospila*), 아르킵스 로사나(*Archips rosana*), 아르기로타에니아 시트라나(*Argyrotaenia citrana*), 아우토그라파 감마(*Autographa gamma*), 보나고타 크라나오데스(*Bonagota cranaodes*), 보르보 신나라(*Borbo cinnara*), 부쿨라트릭스 투르베리엘라(*Bucculatrix thurberiella*), 카푸아 레티쿨라나(*Capua reticulana*), 카르포시나 니포넨시스(*Carposina niponensis*), 킬로 서프레살리스(*Chilo suppressalis*), 킬로 폴리크리수스(*Chilo polychrysus*), 클루메티아 트란스베르사(*Chlumetia transversa*), 코리스토네우라 로사세아나(*Choristoneura rosaceana*), 크나팔로크로시스 메디날리스(*Cnaphalocrocis medinalis*), 코노포모르파 크라메렐라(*Conopomorpha cramerella*), 코수스 코수스(*Cossus cossus*), 시디아 카리아나(*Cydia caryana*), 시디아 푸네브라나(*Cydia funebrana*), 시디아 몰레스타(*Cydia molesta*), 시디아 니그리카나(*Cydia nigricana*), 시디아 포모넬라(*Cydia pomonella*), 다르나 디둑타(*Darna diducta*), 디아트라에아 사카랄리스(*Diatraea saccharalis*), 디아트라에아 그란디오셀라(*Diatraea grandiosella*), 에아리아스 인술라나(*Earias insulana*), 에아리아스 비텔라(*Earias vittella*), 엑디톨로파 아우란티아눔(*Ecdytolopha aurantianum*), 엘라스모팔푸스 리그노셀루스(*Elasmopalpus lignosellus*), 에페스티아 카우텔라(*Ephestia cautella*), 에페스티아 엘루텔라(*Ephestia elutella*), 에페스티아 쿠에니엘라(*Ephestia kuehniella*), 에피노티아 아포레마(*Epinotia aporema*), 에피피아스 포스트비타나(*Epiphyas postvittana*), 에리오노타 트락스(*Erionota thrax*), 유포에실리아 암비구엘라(*Eupoecilia ambiguella*), 육소아 아욱실리아리스(*Euxoa auxiliaris*), 그라폴리타 몰레스타(*Grapholita molesta*), 헤딜렙타 인디카타(*Hedylepta indicata*), 헬리코베르파 아르미게라(*Helicoverpa armigera*), 헬리코베르파 제아(*Helicoverpa zea*), 헬리오티스 비레센스(*Heliothis virescens*), 헬룰라 운달리스(*Hellula undalis*), 케이페리아 리코페르시셀라(*Keiferia lycopersicella*), 류시노데스 오르보날리스(*Leucinodes orbonalis*), 류코프테라 코페엘라(*Leucoptera coffeella*), 류코프테라 말리폴리엘라(*Leucoptera malifoliella*), 로베시아 보트라나(*Lobesia botrana*), 록사그로티스 알비코스타(*Loxagrotis albicosta*), 리만트리아 디스파르(*Lymantria dispar*), 리오네티아 클레르켈라(*Lyonetia clerkella*), 마하세나 코르베티(*Mahasena corbetti*), 마메스트라 브라시카에(*Mamestra brassicae*), 마루카 테스툴랄리스(*Maruca testulalis*), 메티사 플라나(*Metisa plana*), 미팀나 우니푼크타(*Mythimna unipuncta*), 네오류시노데스 엘레간탈리스(*Neoleucinodes elegantalis*), 님풀라 데푼크탈리스(*Nymphula depunctalis*), 오페로프테라 브루마타(*Operophtera brumata*), 오스트리니아 누빌랄리스(*Ostrinia nubilalis*), 옥시디아 베술리아(*Oxydia vesulia*), 판데미스 세라사나(*Pandemis cerasana*), 판데미스 헤파라나(*Pandemis heparana*), 파필리오 데모도쿠스(*Papilio demodocus*), 펙티노포라 고시피엘라(*Pectinophora gossypiella*), 페리드로마 사우시아(*Peridroma saucia*), 페리류코프테라 코페엘라(*Perileucoptera coffeella*), 프토리마에아 오페르쿨렐라(*Phthorimaea operculella*), 필록니스티스 시트렐라(*Phyllocnistis citrella*), 피에리스 라파에(*Pieris rapae*), 플라티페나 스카브라(*Plathypena scabra*), 플로디아 인테르푼크텔라(*Plodia interpunctella*), 플루텔라 크실로스텔라(*Plutella xylostella*), 폴리크로시스 비테아나(*Polychrosis viteana*), 프라이스 엔도카르파(*Prays endocarpa*), 프라이스 올레아에(*Prays oleae*), 슈달레티아 우니푼크타(*Pseudaletia unipuncta*), 슈도플루시아 인클루덴스(*Pseudoplusia includens*), 라키플루시아 누(*Rachiplusia nu*), 시르포파가 인세르툴라스(*Scirpophaga incertulas*), 세사미아 인페렌스(*Sesamia inferens*), 세사미아 노나그리오이데스(*Sesamia nonagrioides*), 세토라 니텐스(*Setora nitens*), 시토트로가 세레알렐라(*Sitotroga cerealella*), 스파르가노티스 필레리아나(*Sparganothis pilleriana*), 스포도프테라 엑시구아(*Spodoptera exigua*), 스포도프테라 프루기페르다(*Spodoptera frugiperda*), 스포도프테라 에리다니아(*Spodoptera eridania*), 테클라 바실리데스(*Thecla basilides*), 티네올라 비셀리엘라(*Tineola bisselliella*), 트리코플루시아 니(*Trichoplusia ni*), 투타 압솔루타(*Tuta absoluta*), 제우제라 코페아에(*Zeuzera coffeae*), 및 제우제라 피리나(*Zeuzera pyrina*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0602] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 털이목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 속의 비포괄적 목록은 아나티콜라 종(*Anaticola* spp.), 보비콜라 종(*Bovicola* spp.), 켈로피스테스 종(*Chelopistes* spp.), 고니오데스 종(*Goniodes* spp.), 메나칸투스 종(*Menacanthus* spp.), 및 트리코덱테스 종(*Trichodectes* spp.)을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 보비콜라 보비스(*Bovicola bovis*), 보비콜라 카프라에(*Bovicola caprae*), 보비콜라 오비스(*Bovicola ovis*), 켈로피스테스 멜레아그리디스(*Chelopistes*

meleagridis), 고니오데스 디시밀리스(*Goniodes dissimilis*), 고니오데스 기가스(*Goniodes gigas*), 메나칸투스 스트라미네우스(*Menacanthus stramineus*), 메노폰 갈리나에(*Menopon gallinae*) 및 트리코덱테스 카니스(*Trichodectes canis*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0603] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 메뚜기목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 속의 비포괄적 목록은 멜라노플루스 종(*Melanoplus* spp.) 및 프테로필라 종(*Pterophylla* spp.)을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 아나브루스 심플렉스(*Anabrus simplex*), 그릴로탈파 아프리카나(*Gryllotalpa africana*), 그릴로탈파 아우스트랄리스(*Gryllotalpa australis*), 그릴로탈파 브라키프레타(*Gryllotalpa brachyptera*), 그릴로탈파 헥사닥틸라(*Gryllotalpa hexadactyla*), 로쿠스타 미그라토리아(*Locusta migratoria*), 미크로센트룸 레티네르베(*Microcentrum retinerve*), 쉬스토세르카 그레가리아(*Schistocerca gregaria*) 및 스쿠데리아 푸르카타(*Scudderia furcata*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0604] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 벼룩목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 세라토필루스 갈리나에(*Ceratophyllus gallinae*), 세라토필루스 니거(*Ceratophyllus niger*), 크테노세팔리데스 카니스(*Ctenocephalides canis*), 크테노세팔리데스 펠리스(*Ctenocephalides felis*) 및 풀렉스 이리탄스(*Pulex irritans*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0605] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 총채벌레목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 속의 비포괄적 목록은 칼리오트립스 종(*Caliothrips* spp.), 프란클리니엘라 종(*Frankliniella* spp.), 시르토트립스 종(*Scirtothrips* spp.), 및 트립스 종(*Thrips* spp.)을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 프란클리니엘라 푸스카(*Frankliniella fusca*), 프란클리니엘라 옥시덴탈리스(*Frankliniella occidentalis*), 프란클리니엘라 슐체이(*Frankliniella schultzei*), 프란클리니엘라 윌리암시(*Frankliniella williamsi*), 헬리오트립스 헤모로이달리스(*Heliothrips haemorrhoidalis*), 리피포로트립스 크루엔타투스(*Rhipiphorothrips cruentatus*), 시르토트립스 시트리(*Scirtothrips citri*), 시르토트립스 도르살리스(*Scirtothrips dorsalis*), 및 타에니오트립스 로팔란텐날리스(*Taeniothrips rhopalantennalis*), 트립스 하와이이엔시스(*Thrips hawaiiensis*), 트립스 니그로필로수스(*Thrips nigropilosus*), 트립스 오리엔탈리스(*Thrips orientalis*), 트립스 타바시(*Thrips tabaci*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0606] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 좀목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 속의 비포괄적 목록은 레피스마 종(*Lepisma* spp.) 및 테르모비아 종(*Thermobia* spp.)을 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0607] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 응애목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 속의 비포괄적 목록은 아카루스 종(*Acarus* spp.), 아쿨롭스 종(*Aculops* spp.), 부필루스 종(*Boophilus* spp.), 데모덱스 종(*Demodex* spp.), 더마센토르 종(*Dermacentor* spp.), 에피트리메루스 종(*Epitrimerus* spp.), 에리오피에스 종(*Eriophyes* spp.), 익소데스 종(*Ixodes* spp.), 올리고니쿠스 종(*Oligonychus* spp.), 파노니쿠스 종(*Panonychus* spp.), 리조글리푸스 종(*Rhizoglyphus* spp.), 및 테트라니쿠스 종(*Tetranychus* spp.)을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 아카라피스 우디(*Acarapis woodi*), 아카루스 시로(*Acarus siro*), 아세리아 만기페라에(*Aceria mangiferae*), 아쿨롭스 리코페르시시(*Aculops lycopersici*), 아쿨루스 펠레카시(*Aculus pelekassi*), 아쿨루스 스클레크텐달리(*Aculus schlechtendali*), 암블리옴마 아메리카눔(*Amblyomma americanum*), 브레비팔푸스 오보바투스(*Brevipalpus obovatus*), 브레비팔푸스 포에니시스(*Brevipalpus phoenicis*), 더마센토르 바리아빌리스(*Dermacentor variabilis*), 더마토파고이데스 프테로니시누스(*Dermatophagoides pteronyssinus*), 에오테트라니쿠스 카르피니(*Eotetranychus carpini*), 노토에드레스 카티(*Notoedres cati*), 올리고니쿠스 코페아에(*Oligonychus coffeae*), 올리고니쿠스 일리시스(*Oligonychus ilicis*), 파노니쿠스 시트리(*Panonychus citri*), 파노니쿠스 울미(*Panonychus ulmi*), 필로코프트루타 올레이보라(*Phyllocoptruta oleivora*), 폴리파고타르소네무스 라투스(*Polyphagotarsonemus latus*), 리피세팔루스 산구이네우스(*Rhipicephalus sanguineus*), 사르코프테스 스카비에이(*Sarcoptes scabiei*), 테골로푸스 페르세아플로라에(*Tegolophus perseaflorae*), 테트라니쿠스 우르티카에(*Tetranychus urticae*), 및 바로아 데스트룩토르(*Varroa destructor*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0608] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 홈작은지네목의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 스쿠티게렐라 임마쿨라타(*Scutigerella immaculata*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0609] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 선형동물문의 해충을 방제하는데 사용될 수 있다. 특정한 속의 비포괄적 목록은 아펠렌코이데스 종(*Aphelenchoides* spp.), 벨로놀라이무스 종(*Belonolaimus* spp.), 크리코네멜라 종(*Criconemella* spp.), 디틸렌쿠스 종(*Ditylenchus* spp.), 헤테로데라 종(*Heterodera* spp.), 히르쉬만니엘라

종(*Hirschmanniella* spp.), 호플롤라이무스 종(*Hoplolaimus* spp.), 멜로이도기네 종(*Meloidogyne* spp.), 프라틸렌쿠스 종(*Pratylenchus* spp.), 및 라도폴루스 종(*Radopholus* spp.)을 포함하나 이에 제한되지는 않는다. 특정한 종의 비포괄적 목록은 디로필라리아 임미티스(*Dirofilaria immitis*), 헤테로데라 제아에(*Heterodera zeae*), 멜로이도기네 인코그니타(*Meloidogyne incognita*), 멜로이도기네 자바니카(*Meloidogyne javanica*), 온코세르카 볼불루스(*Onchocerca volvulus*), 라도폴루스 시밀리스(*Radopholus similis*), 및 로틸렌쿨루스 레니포르미스(*Rotylenchulus reniformis*)를 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0610] 추가의 정보에 대해 문헌 ["Handbook of Pest Control - The Behavior, Life History, and Control of Household Pests" by Arnold Mallis, 9th Edition, copyright 2004 by GIE Media Inc.]을 참조한다.

[0611] 적용

[0612] 선형동물문, 절지동물문 및/또는 연체동물문의 해충을 방제하는 것은 일반적으로 생육지에서 해충 집단, 해충 활성, 또는 둘 다를 감소시키는 것을 의미한다. 이는 하기 경우에 발생할 수 있다:

[0613] (a) 해충 집단이 생육지로부터 격퇴된 경우;

[0614] (b) 해충이 생육지 내에서 또는 그 주변에서 무력화된 경우; 또는

[0615] (c) 해충이 생육지 내에서 또는 그 주변에서 근절된 경우.

[0616] 물론, 이들 결과의 조합이 일어날 수 있다. 일반적으로, 해충 집단, 활성 또는 둘 다는 바람직하게는 50 퍼센트 초과, 바람직하게는 90 퍼센트 초과, 가장 바람직하게는 98 퍼센트 초과로 감소된다. 일반적으로, 생육지는 인간 내의 것 또는 인간 상의 것이 아니며; 결과적으로 생육지는 일반적으로 비인간 생육지이다.

[0617] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자가 적용되는 생육지는 선형동물문, 절지동물문 및/또는 연체동물문의 해충이 서식하거나, 또는 서식하게 될 수 있거나, 또는 횡단할 수 있는 임의의 생육지일 수 있다. 예를 들어, 생육지는 하기일 수 있다:

[0618] (a) 작물, 나무, 과일, 곡류, 사료 종, 포도나무, 잔디 및/또는 관상 식물이 성장하는 곳;

[0619] (b) 가축이 거주하는 곳;

[0620] (c) 건물 (예컨대 곡물이 저장되는 장소)의 내부 또는 외부 표면;

[0621] (d) 건물에 사용되는 건축 자재 (예컨대 주입 목재); 및

[0622] (e) 건물 주위 토양.

[0623] 화학식 1의 분자를 사용하는 특정한 작물 영역은 사과, 옥수수, 해바라기, 목화, 대두, 카놀라, 밀, 벼, 수수, 보리, 귀리, 감자, 오렌지, 알팔파, 상추, 딸기, 토마토, 페퍼, 크루시퍼, 배, 담배, 아몬드, 사탕무, 콩 및 다른 가치있는 작물이 성장하거나 그의 종자가 식재될 영역을 포함한다. 또한, 다양한 식물의 성장시 황산암모늄을 화학식 1의 분자와 함께 사용하는 것이 유리하다.

[0624] 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 방제를 제공하기 위해 일반적으로 헥타르당 약 0.1 그램 내지 헥타르당 약 5000 그램의 양으로 사용된다. 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 헥타르당 약 0.1 그램 내지 헥타르당 약 500 그램의 양으로 사용되는 것이 바람직하다. 또 다른 실시양태에서, 화학식 1의 분자는 헥타르당 약 0.01 그램 내지 헥타르당 약 50 그램의 양으로 사용되는 것이 보다 바람직하다.

[0625] 화학식 1의 분자는 혼합물로 사용될 수 있고, 동시에 또는 순차적으로, 단독으로 또는 다른 화합물과 함께 적용되어 식물 활력을 증진시킬 수 있다 (예를 들어 보다 우수한 뿌리계로 성장시키고, 스트레스성 성장 조건에 보다 잘 견디게 함). 이러한 다른 화합물은, 예를 들어 식물 에틸렌 수용체를 조절하는 화합물, 가장 주목할만하게는 1-메틸시클로프로펜 (1-MCP로도 공지됨)이다. 또한, 이러한 분자는 해충 활성이 낮은 시기 동안에, 예컨대 성장하는 식물이 가치있는 농산물을 생산하기 시작하기 전에, 사용될 수 있다. 이러한 시기는 해충 압박이 통상적으로 낮은 초기 식재 시즌을 포함한다.

[0626] 화학식 1의 분자를 식물의 잎 및 열매 부분에 적용하여 해충을 방제할 수 있다. 분자는 해충에 직접 접촉하게 되거나, 또는 해충은 살충제를 함유하는 잎, 과일 덩어리, 또는 추출 수액을 섭식하는 경우에 살충제를 소비하게 될 것이다. 화학식 1의 분자는 또한 토양에 적용될 수 있고, 이러한 방식으로 적용될 경우 뿌리 및 줄기를 섭식하는 해충을 방제할 수 있다. 뿌리는 분자를 흡수하여 이를 식물의 잎 부분으로 끌어올림으로써, 지상에서

저작하고 수액을 섭식하는 해충을 방제할 수 있다.

[0627] 일반적으로, 미끼를 사용시에 미끼는 지면에, 예를 들어 흰개미가 미끼와 접촉할 수 있고/거나 미끼에 유인될 수 있는 지면에 배치된다. 미끼는 또한, 예를 들어 개미, 흰개미, 바퀴벌레 및 파리가 미끼와 접촉할 수 있고/거나 미끼에 유인될 수 있는 건물의 표면 (수평, 수직 또는 경사 표면)에 적용될 수 있다. 미끼는 화학식 1의 분자를 포함할 수 있다.

[0628] 화학식 1의 분자는 캡슐의 내부로 캡슐화되거나, 또는 캡슐의 표면 상에 배치될 수 있다. 캡슐의 크기는 나노미터 크기 (약 100-900 나노미터 직경) 내지 마이크로미터 크기 (약 10-900 마이크로미터 직경)의 범위일 수 있다.

[0629] 특정 살충제에 저항하는 일부 해충 알의 특유의 능력 때문에, 새롭게 출현된 유충을 방제하기 위해 화학식 1의 분자의 반복된 적용이 바람직할 수 있다.

[0630] 식물의 한 부분 상의 해충을 방제하기 위해, 식물의 다른 부분에 화학식 1의 분자를 적용함으로써 (예를 들어, 영역에 분무함으로써) 식물에서의 살충제의 침투성 이동을 이용할 수 있다. 예를 들어, 잎-섭식 곤충의 방제는 점적 관개 또는 고랑 적용에 의해, 예를 들어 식재 전 또는 후의 토양 관주로 토양을 처리함으로써, 또는 식재 전에 식물의 종자를 처리함으로써 달성될 수 있다.

[0631] 종자 처리는, 특수화 형질을 발현하도록 유전자 변형된 식물이 발아될 종자를 포함한 모든 유형의 종자에 적용될 수 있다. 대표적인 예는, 무척추동물 해충, 예컨대 바실루스 투린기엔시스에 대해 독성인 단백질 또는 다른 살곤충 독소를 발현하는 것, 제초제 저항성을 발현하는 것, 예컨대 "라운드업 레디(Roundup Ready)" 종자, 또는 살곤충 독소, 제초제 저항성, 영양-증진, 가뭄 저항성 또는 임의의 다른 유익한 형질을 발현하는 "스택킹된" 외래 유전자를 갖는 것을 포함한다. 또한, 화학식 1의 분자를 사용한 이러한 종자 처리는, 식물이 스트레스성 성장 조건을 보다 잘 견디는 능력을 추가로 증진시킬 수 있다. 이 결과, 보다 건강하고 보다 활력있는 식물이 생성되며, 이는 수확 시기에 보다 높은 수확량을 유도할 수 있다. 일반적으로, 100,000개 종자당 화학식 1의 분자 약 1 그램 내지 약 500 그램이 우수한 이익을 제공할 것으로 예상되고, 100,000개 종자당 약 10 그램 내지 약 100 그램의 양이 보다 우수한 이익을 제공할 것으로 예상되고, 100,000개 종자당 약 25 그램 내지 약 75 그램의 양이 훨씬 더 우수한 이익을 제공할 것으로 예상된다.

[0632] 화학식 1의 분자가 바실루스 투린기엔시스 또는 다른 살곤충 독소와 같은 특수화 형질을 발현하도록 유전자 변형된 식물, 또는 제초제 저항성을 발현하는 것, 또는 살곤충 독소, 제초제 저항성, 영양-증진, 또는 임의의 다른 유익한 형질을 발현하는 "스택킹된" 외래 유전자를 갖는 것 상에, 그 내부에 또는 그 주위에 사용될 수 있음이 용이하게 명백해야 한다.

[0633] 화학식 1의 분자는 수의학 부문 또는 비인간 동물 사육 분야에서 내부기생충 및 외부기생충을 방제하는데 사용될 수 있다. 화학식 1의 분자는 예컨대 예를 들어 정제, 캡슐, 드링크, 과립의 형태로 경구 투여에 의해, 예를 들어 침지, 분무, 붓기, 점적 및 살분의 형태로 피부 적용에 의해, 및 예를 들어 주사의 형태로 비경구 투여에 의해 적용된다.

[0634] 또한, 화학식 1의 분자는 가축, 예를 들어 소, 양, 돼지, 닭 및 거위를 사육하는데 유리하게 사용될 수 있다. 이들은 또한 애완동물, 예컨대 말, 개 및 고양이에 유리하게 사용될 수 있다. 방제하기 위한 특정한 해충은 이러한 동물에 유해한 벼룩 및 진드기일 것이다. 적합한 제제가 음용수 또는 사료와 함께 동물에게 경구로 투여된다. 적합한 투여량 및 제제는 종에 따라 달라진다.

[0635] 화학식 1의 분자는 또한 상기 열거된 동물에서, 특히 장내 기생충을 방제하는데 사용할 수 있다.

[0636] 화학식 1의 분자는 또한 인간 건강 관리를 위한 치료 방법에서 사용될 수 있다. 이러한 방법은, 예를 들어 정제, 캡슐, 드링크, 과립의 형태로의 경구 투여, 및 피부 적용에 의한 것을 포함하나 이에 제한되지는 않는다.

[0637] 전세계의 해충은 (이러한 해충에 대한) 새로운 환경으로 이동하고 있고 그 후에 이러한 새로운 환경에서 새로운 침습 종이 되고 있다. 화학식 1의 분자는 또한 이러한 새로운 침습 종에 대해 사용되어 이러한 새로운 환경에서 이들을 방제할 수 있다.

[0638] 화학식 1의 분자는 또한 식물, 예컨대 작물이 성장하는 (예를 들어 식재전, 식재, 수확전) 영역에서 및 이러한 식물을 상업적으로 피해를 줄 수 있는 해충이 낮은 수준으로 존재하는 (심지어 실제 존재하지 않는) 영역에서 사용될 수 있다. 이러한 영역에서의 이러한 분자의 사용은 그 영역에서 성장하는 식물에게 이익을 제공하기 위한 것이다. 이러한 이익은 식물 건강의 개선, 식물 수확량의 개선 (예를 들어 바이오매스의 증가 및/또는 가치

있는 성분 함량의 증가), 식물 활력의 개선 (예를 들어 개선된 식물 성장 및/또는 보다 푸른 잎), 식물 품질의 개선 (예를 들어 특정 성분의 함량 또는 조성의 개선), 및 식물의 비생물적 및/또는 생물적 스트레스에 대한 내성의 개선을 포함할 수 있으나, 이에 제한되지는 않는다.

[0639] 살충제가 상업적으로 사용 또는 시판될 수 있기 전에, 이러한 살충제는 다양한 정부 기관 (지역, 지방, 주, 국가 및 국제)에 의해 긴 평가 과정을 거친다. 방대한 데이터 요건은 규제 기관에 의해 명시되어 있으며, 종종 월드 와이드 웹에 연결되는 컴퓨터를 사용하여 제품 등록자 또는 제품 등록자를 대신하는 제3자에 의한 데이터 생성 및 제출을 통해 다루어져야 한다. 이어서, 이들 정부 기관은 이러한 데이터를 검토하고, 안정성의 결정이 결론이 나면, 잠재적 사용자 또는 판매자에게 제품 등록을 승인한다. 그 후, 제품 등록이 승인 및 지지되는 그 지역에서, 이러한 사용자 또는 판매자는 이러한 살충제를 사용 또는 판매할 수 있다.

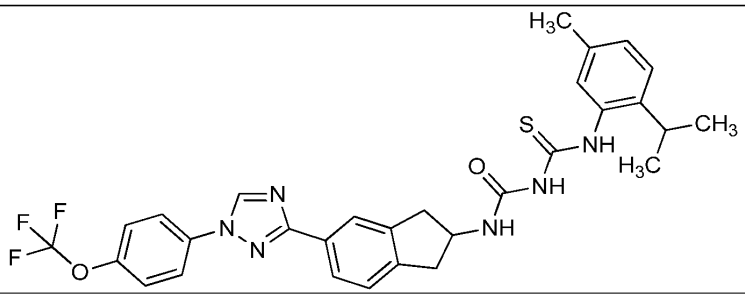
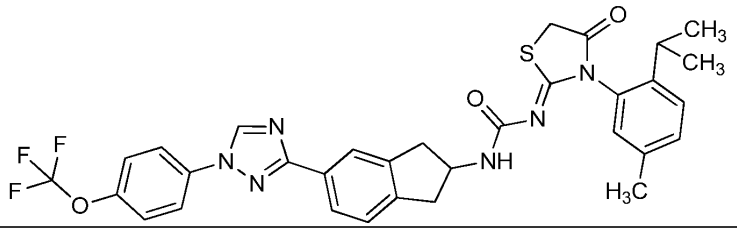
[0640] 화학식 1에 따른 분자는 해충에 대한 그의 효능을 결정하기 위해 시험될 수 있다. 또한, 작용 방식 연구를 수행하여 상기 분자가 다른 살충제와 상이한 작용 방식을 갖는지를 결정할 수 있다. 그 후, 이러한 획득된 데이터는, 예컨대 인터넷에 의해 제3자에게 전파될 수 있다.

[0641] 본원에서 제목은 단지 편의를 위한 것이고, 그의 임의의 부분을 해석하는데 사용되어서는 안된다.

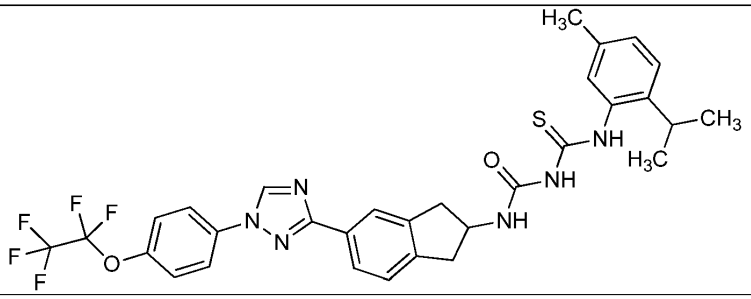
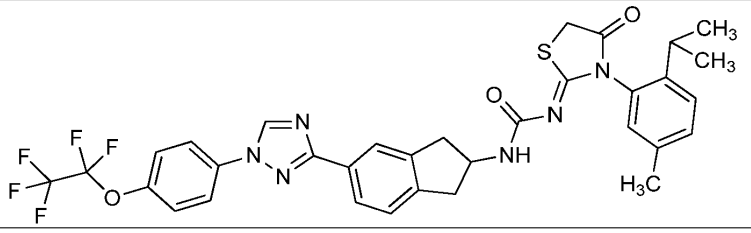
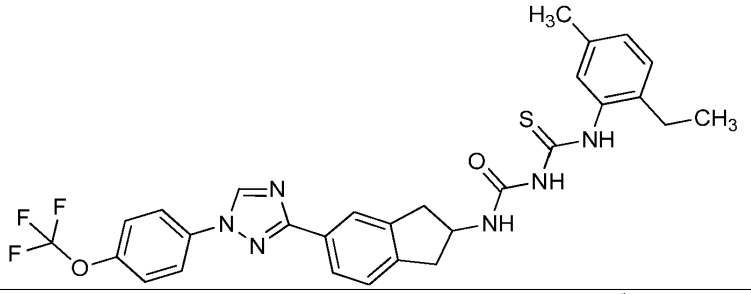
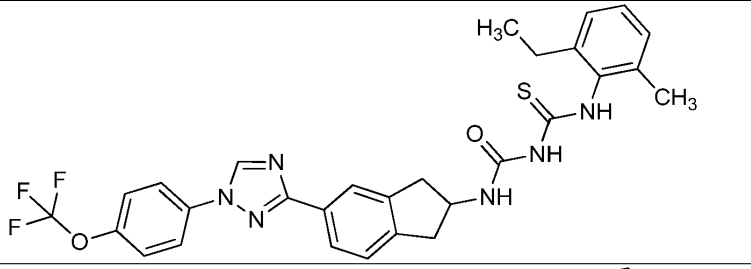
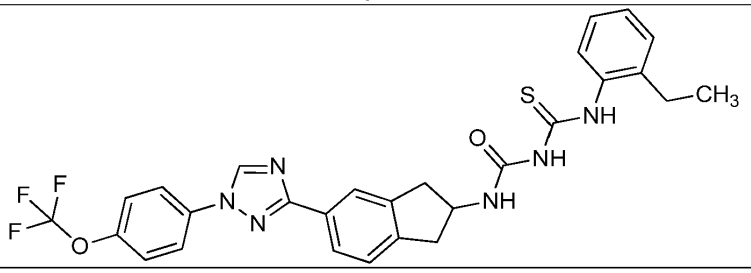
[0642] 표 섹션

[0643] [표 2] F 시리즈 화합물에 대한 구조 및 제조 방법

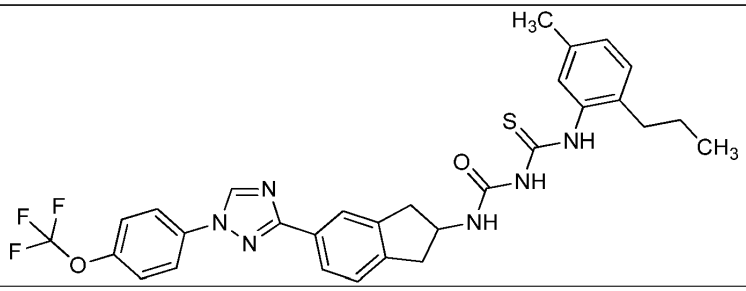
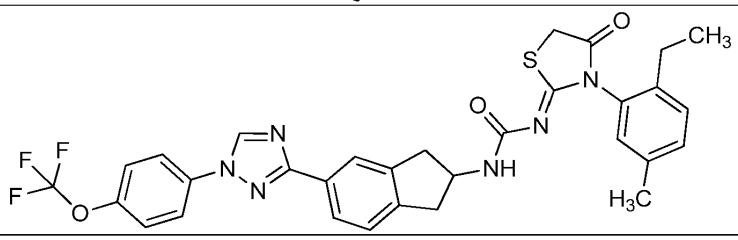
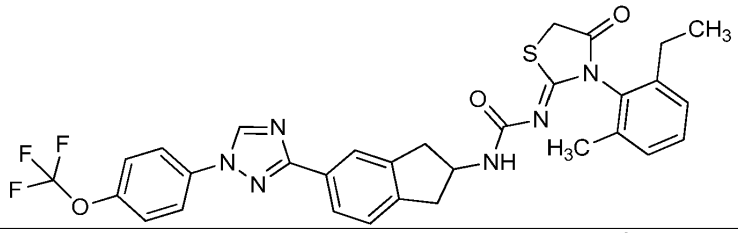
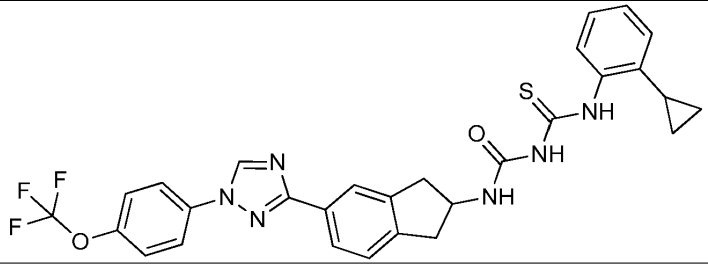
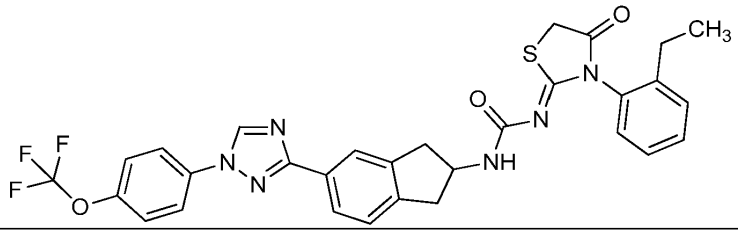
[0644]

번호	구조	다음 실시예에 따라 제조됨
F1		12
F2		14

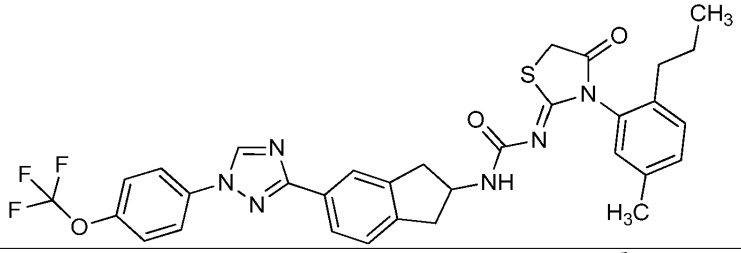
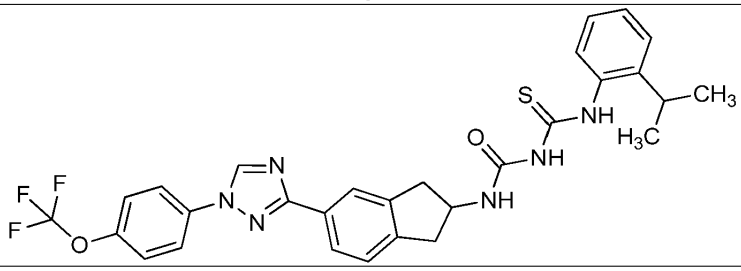
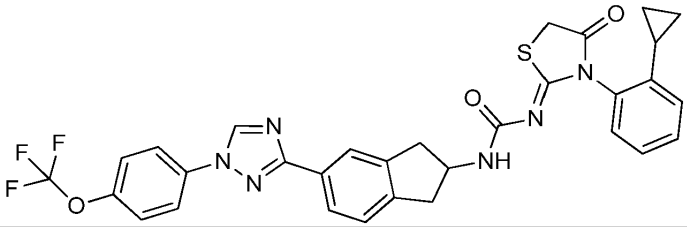
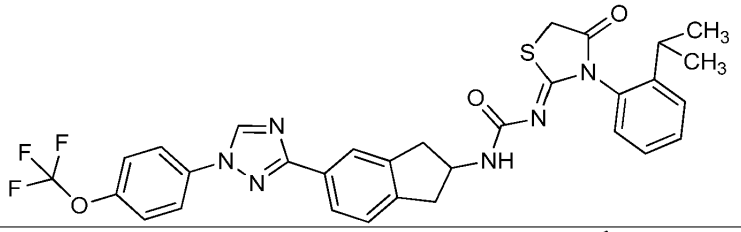
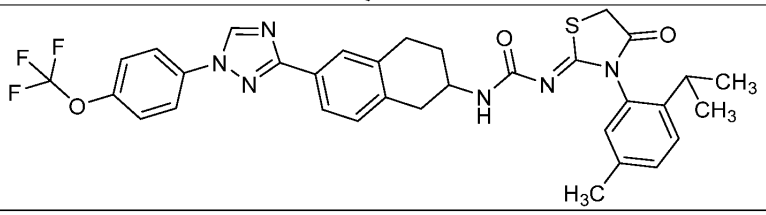
[0645]

F3		13
F4		14
F5		12
F6		12
F7		12

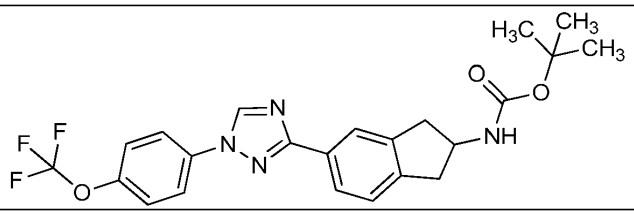
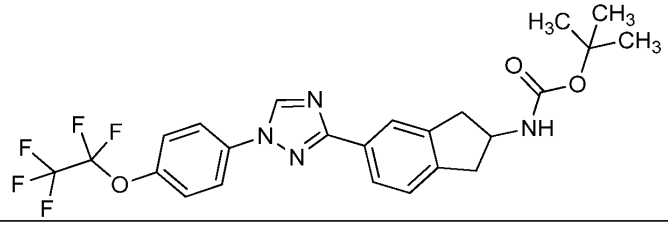
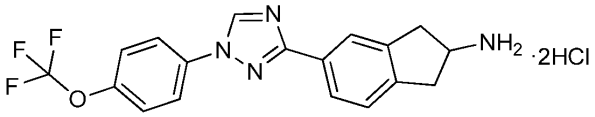
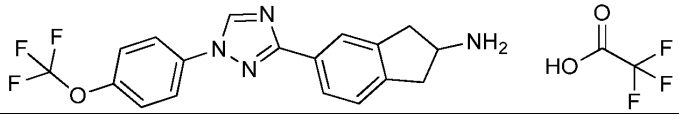
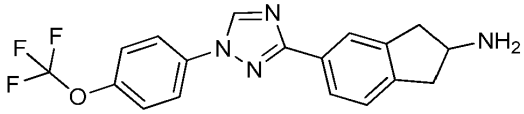
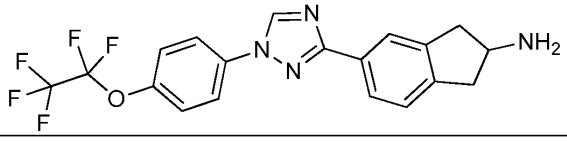
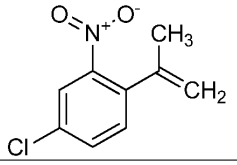
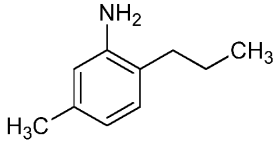
[0646]

F8		12
F9		14
F10		14
F11		12
F12		12

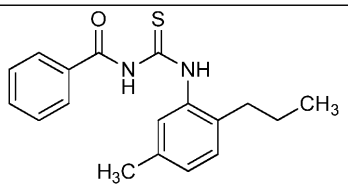
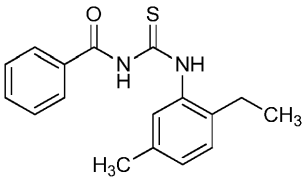
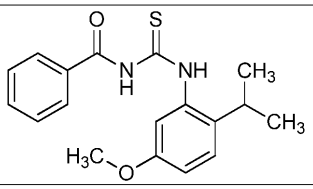
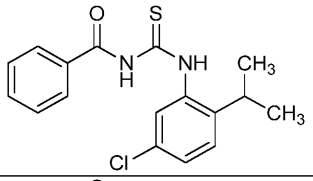
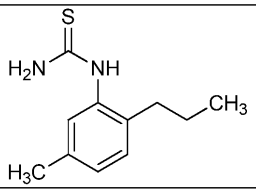
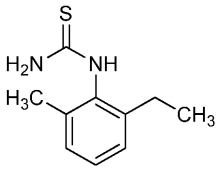
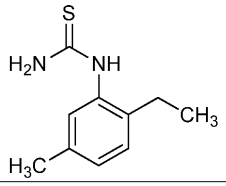
[0647]

F13		14
F14		12
F15		14
F16		14
F17		21

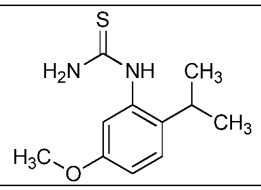
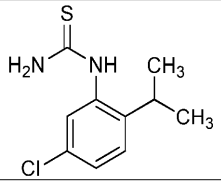
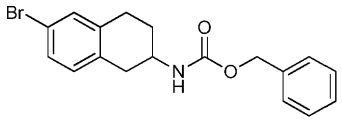
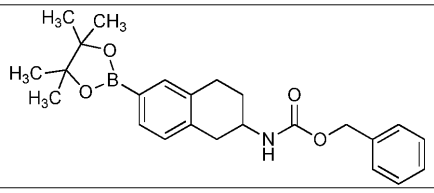
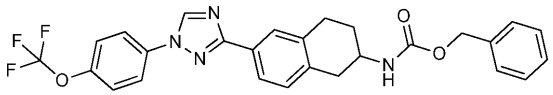
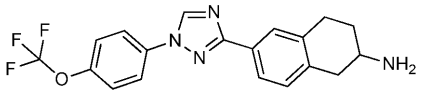
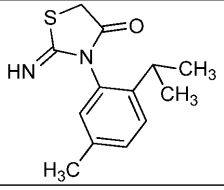
[0648] [표 3] C 시리즈 화합물에 대한 구조 및 제조 방법

번호	구조	다음 실시예에 따라 제조됨
C1		1
C2		2
C3		3
C4		4
C5		5
C6		6
C8		7
C11		9

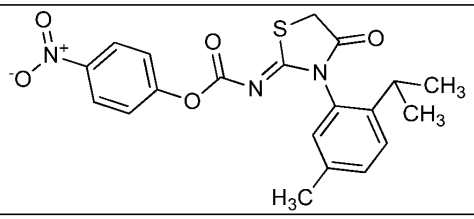
[0649]

C15		10
C17		10
C18		10
C19		10
C20		11
C21		11
C22		11

[0650]

C23		11
C24		11
C25		15
C26		16
C27		17
C28		18
C29		19

[0651]

C30		20

[0652]

[0653] [표 4] 표 2의 화합물에 대한 분석 데이터

번호	Mp (°C)	IR (cm^{-1})	질량 (*m/z*)	^{1}H NMR	^{13}CNMR; ^{19}F NMR
F1	134 (dec.)		ESIMS *m/z* 595 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9.63 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 7.99 (d, *J* = 8.7 Hz, 2H), 7.83 - 7.74 (m, 2H), 7.38 (d, *J* = 8.6 Hz, 2H), 7.26 (s, 5H), 7.14 (s, 1H), 4.65 - 4.60 (m, 1H), 3.36 (td, *J* = 18.5, 17.7, 7.3 Hz, 2H), 3.05 (d, *J* = 8.7 Hz, 1H), 2.84 (s, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.22 (d, *J* = 6.8 Hz, 6H)	^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.02

[0654]

F2	171 (dec.)		ESIMS *m/z* 635 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 9.36 (s, 1H), 8.11 - 8.02 (m, 2H), 7.93 (d, *J* = 7.1 Hz, 1H), 7.88 (d, *J* = 7.8 Hz, 2H), 7.66 - 7.57 (m, 2H), 7.34 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.29 (d, *J* = 7.7 Hz, 1H), 7.25 - 7.19 (m, 1H), 6.99 (dd, *J* = 1.8, 0.9 Hz, 1H), 4.41 (q, *J* = 7.4 Hz, 1H), 4.13 (d, *J* = 18.0 Hz, 1H), 4.01 (d, *J* = 18.0 Hz, 1H), 3.25 - 3.06 (m, 2H), 2.93 - 2.82 (m, 2H), 2.62 (hept, *J* = 6.8 Hz, 1H), 2.30 - 2.23 (m, 3H), 1.11 (dd, *J* = 6.8, 1.4 Hz, 3H), 1.07 (d, *J* = 6.8 Hz, 3H)	^{19}F NMR (376 MHz, DMSO-d_6) δ -56.96
F3			ESIMS *m/z* 645 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11.87 (s, 1H), 9.83 (s, 1H), 9.40 (s, 1H), 8.12 - 8.06 (m, 2H), 8.02 (s, 1H), 7.96 (dd, *J* = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.63 (d, *J* = 9.1 Hz, 2H), 7.43 (t, *J* = 6.9 Hz, 2H), 7.23 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.21 (d, *J* = 1.8 Hz, 1H), 7.09 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 4.50 (d, *J* = 6.4 Hz, 1H), 3.44 - 3.34 (m, 1H), 3.05 - 2.80 (m, 4H), 2.27 (s, 3H), 1.16 (d, *J* = 6.9 Hz, 6H)	^{19}F NMR (376 MHz, DMSO-d_6) δ -85.19, -86.91

[0655]

F4	131-141		ESIMS *m/z* 685 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (s, 1H), 8.04 - 7.96 (m, 2H), 7.85 - 7.76 (m, 2H), 7.45 - 7.37 (m, 2H), 7.30 (t, *J* = 7.6 Hz, 3H), 6.86 - 6.81 (m, 1H), 5.69 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 4.74 - 4.59 (m, 1H), 4.04 - 3.83 (m, 2H), 3.46 - 3.27 (m, 2H), 3.00 - 2.76 (m, 2H), 2.62 (hept, *J* = 6.7 Hz, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.21 - 1.08 (m, 6H)	
F5			ESIMS *m/z* 581 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11.94 (s, 1H), 9.82 (s, 1H), 9.39 (d, *J* = 2.4 Hz, 1H), 8.11 - 8.05 (m, 2H), 8.02 (d, *J* = 1.5 Hz, 1H), 7.96 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.67 - 7.59 (m, 2H), 7.43 (t, *J* = 7.5 Hz, 2H), 7.40 - 7.32 (m, 1H), 7.17 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.04 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 4.50 (d, *J* = 6.6 Hz, 1H), 3.33 (s, 4H), 2.97 - 2.81 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.12 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H)	^{19}F NMR (376 MHz, DMSO-d_6) δ -56.96
F6			ESIMS *m/z* 579 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11.56 (s, 1H), 9.84 (s, 1H), 9.39 (s, 1H), 8.13 - 8.05 (m, 2H), 8.02 (s, 1H), 8.00 - 7.93 (m, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 7.42 (d, *J* = 7.9 Hz, 2H), 7.17 (d, *J* = 7.4 Hz, 1H), 7.15 - 7.07 (m, 2H), 4.51 (d, *J* = 7.1 Hz, 1H), 3.33 (s, 4H), 2.97 - 2.77 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.14 (t, *J* = 7.6 Hz, 3H)	^{19}F NMR (376 MHz, DMSO-d_6) δ -56.96

[0656]

F7			ESIMS *m/z* 567 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11.99 (s, 1H), 9.84 (s, 1H), 9.39 (s, 1H), 8.12 - 8.05 (m, 2H), 8.02 (d, *J* = 1.5 Hz, 1H), 7.96 (dd, *J* = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.66 - 7.59 (m, 2H), 7.55 (dd, *J* = 5.6, 3.7 Hz, 1H), 7.44 (dd, *J* = 11.0, 7.5 Hz, 2H), 7.32 - 7.27 (m, 1H), 7.26 - 7.20 (m, 2H), 4.62 - 4.41 (m, 1H), 3.33 (s, 2H), 2.89 (ddd, *J* = 17.1, 13.2, 4.8 Hz, 2H), 2.67 - 2.51 (m, 2H), 1.15 (t, *J* = 7.6 Hz, 3H)	^{19}F NMR (376 MHz, DMSO-d_6) δ -56.96
F8			ESIMS *m/z* 595 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11.97 (s, 1H), 9.81 (s, 1H), 9.39 (s, 1H), 8.12 - 8.05 (m, 2H), 8.02 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.96 (d, *J* = 7.7 Hz, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.8 Hz, 2H), 7.43 (t, *J* = 7.1 Hz, 2H), 7.38 (s, 1H), 7.15 (d, *J* = 7.7 Hz, 1H), 7.03 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 4.49 (d, *J* = 7.4 Hz, 1H), 3.33 (s, 2H), 3.00 - 2.78 (m, 2H), 2.50 (p, *J* = 1.9 Hz, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.51 (dt, *J* = 14.9, 7.5 Hz, 2H), 0.89 (t, *J* = 7.3 Hz, 3H)	^{19}F NMR (376 MHz, DMSO-d_6) δ -56.96

[0657]

F9	125-131		ESIMS *m/z* 621 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 1H), 8.03 - 7.94 (m, 2H), 7.83 - 7.75 (m, 2H), 7.38 (dd, *J* = 8.9, 1.2 Hz, 2H), 7.26 (s, 3H), 6.87 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 5.69 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 4.76 - 4.53 (m, 1H), 4.00 - 3.81 (m, 2H), 3.35 (dt, *J* = 16.5, 8.0 Hz, 2H), 2.87 (dtd, *J* = 15.0, 10.0, 9.5, 4.6 Hz, 2H), 2.39 (q, *J* = 7.6 Hz, 2H), 2.33 (d, *J* = 1.3 Hz, 3H), 1.13 (td, *J* = 7.6, 0.6 Hz, 3H)	^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.03
F10	152 (dec.)		ESIMS *m/z* 621 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 1H), 8.05 - 7.95 (m, 2H), 7.85 - 7.75 (m, 2H), 7.44 - 7.36 (m, 2H), 7.30 (t, *J* = 7.6 Hz, 2H), 7.23 - 7.11 (m, 2H), 5.68 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 4.76 - 4.59 (m, 1H), 3.94 (s, 2H), 3.44 - 3.22 (m, 2H), 2.86 (ddt, *J* = 15.9, 9.9, 4.7 Hz, 2H), 2.41 (q, *J* = 7.6 Hz, 2H), 2.10 (s, 3H), 1.15 (td, *J* = 7.6, 0.7 Hz, 3H	^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.03

[0658]

F11			ESIMS *m/z* 579 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 12.27 (s, 1H), 9.83 (s, 1H), 9.39 (s, 1H), 8.11 - 8.04 (m, 2H), 8.02 (s, 1H), 7.99 - 7.93 (m, 1H), 7.81 - 7.76 (m, 1H), 7.66 - 7.59 (m, 2H), 7.49 - 7.39 (m, 2H), 7.25 - 7.13 (m, 2H), 7.05 (dd, *J* = 7.3, 1.9 Hz, 1H), 4.57 - 4.43 (m, 1H), 3.46 - 3.24 (m, 2H), 2.98 - 2.79 (m, 2H), 1.96 - 1.77 (m, 1H), 1.02 - 0.91 (m, 2H), 0.74 - 0.56 (m, 2H)	^{19}F NMR (376 MHz, DMSO-d_6) δ -56.96
F12	146 (dec.)		ESIMS *m/z* 607 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 1H), 8.03 - 7.96 (m, 2H), 7.84 - 7.75 (m, 2H), 7.45 - 7.34 (m, 4H), 7.34 - 7.27 (m, 2H), 7.06 (dd, *J* = 7.8, 1.3 Hz, 1H), 5.66 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 4.74 - 4.59 (m, 1H), 4.00 - 3.86 (m, 2H), 3.35 (dt, *J* = 16.6, 8.3 Hz, 2H), 2.87 (ddd, *J* = 16.2, 10.8, 5.0 Hz, 2H), 2.44 (q, *J* = 7.6 Hz, 2H), 1.16 (dd, *J* = 7.8, 7.3 Hz, 3H)	^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.03

[0659]

F13	136 (dec.)		ESIMS *m/z* 633 ([M-H]$^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 1H), 8.05 - 7.95 (m, 2H), 7.83 - 7.75 (m, 2H), 7.42 - 7.35 (m, 2H), 7.29 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.25 - 7.13 (m, 2H), 6.90 - 6.85 (m, 1H), 5.68 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 4.74 - 4.57 (m, 1H), 4.03 - 3.78 (m, 2H), 3.35 (dt, *J* = 16.5, 8.1 Hz, 2H), 2.87 (dtd, *J* = 14.6, 10.3, 9.6, 4.6 Hz, 2H), 2.40 - 2.23 (m, 5H), 1.55 (s, 2H), 0.89 (t, *J* = 7.3 Hz, 3H)	^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.03
F14			ESIMS *m/z* 581 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11.93 (s, 1H), 9.85 (s, 1H), 9.39 (s, 1H), 8.12 - 8.05 (m, 2H), 8.02 (s, 1H), 7.96 (dd, *J* = 7.7, 1.6 Hz, 1H), 7.63 (dd, *J* = 9.2, 1.0 Hz, 2H), 7.49 - 7.39 (m, 3H), 7.36 (dd, *J* = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.28 (td, *J* = 7.5, 1.5 Hz, 1H), 7.21 (td, *J* = 7.5, 1.7 Hz, 1H), 4.60 - 4.38 (m, 1H), 3.42 - 3.26 (m, 2H), 3.02 (hept, *J* = 6.9 Hz, 1H), 2.89 (ddd, *J* = 17.1, 13.2, 4.8 Hz, 2H), 1.18 (d, *J* = 6.9 Hz, 6H)	^{19}F NMR (376 MHz, DMSO-d_6) δ -56.96

[0660]

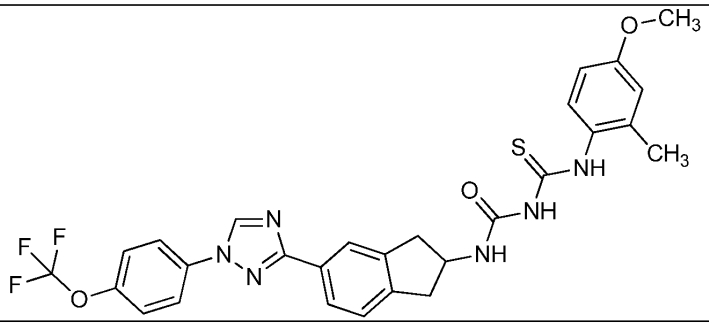
F15	141 (dec.)		ESIMS *m/z* 619 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 1H), 8.04 - 7.97 (m, 2H), 7.82 - 7.76 (m, 2H), 7.43 - 7.33 (m, 3H), 7.29 (dd, *J* = 7.7, 1.3 Hz, 2H), 7.15 (dd, *J* = 7.7, 1.6 Hz, 1H), 7.09 (dd, *J* = 7.7, 1.4 Hz, 1H), 5.68 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 4.66 (ddt, *J* = 11.8, 7.3, 3.6 Hz, 1H), 4.04 - 3.85 (m, 2H), 3.44 - 3.26 (m, 2H), 2.87 (ddt, *J* = 15.9, 9.7, 5.1 Hz, 2H), 1.68 (ddd, *J* = 13.9, 8.6, 5.4 Hz, 1H), 0.93 - 0.77 (m, 2H), 0.71 - 0.61 (m, 1H), 0.57 (ddt, *J* = 11.0, 6.8, 2.4 Hz, 1H)	^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.03
F16	239-243		ESIMS *m/z* 621 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 1H), 8.04 - 7.96 (m, 2H), 7.82 - 7.75 (m, 2H), 7.46 - 7.41 (m, 2H), 7.41 - 7.35 (m, 2H), 7.33 - 7.27 (m, 2H), 7.03 (dt, *J* = 8.0, 0.9 Hz, 1H), 5.65 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 4.71 - 4.60 (m, 1H), 4.01 - 3.86 (m, 2H), 3.43 - 3.23 (m, 2H), 2.95 - 2.76 (m, 2H), 2.67 (hept, *J* = 6.9 Hz, 1H), 1.16 (ddd, *J* = 10.1, 6.9, 1.1 Hz, 6H)	^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.03

[0661]

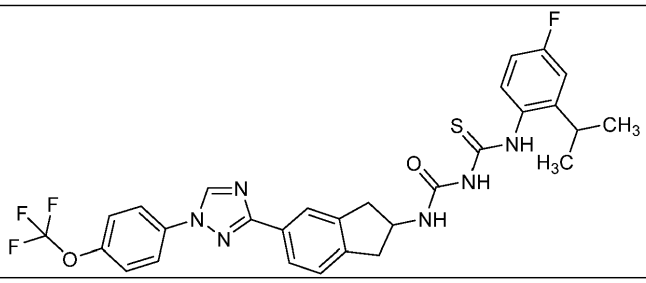
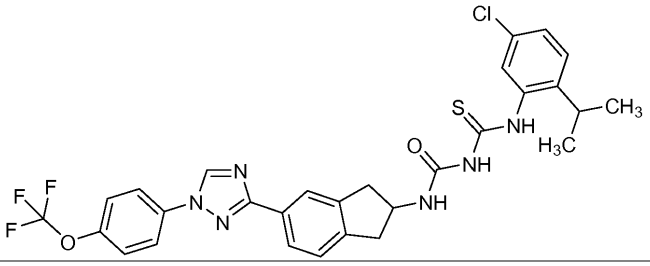
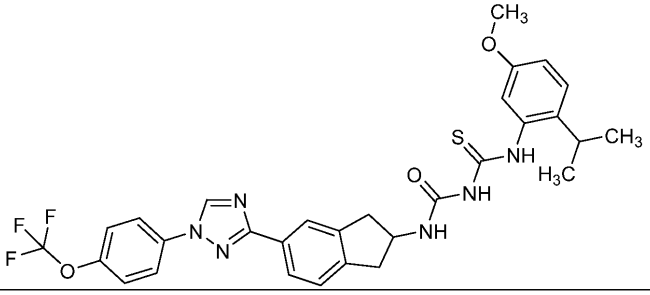
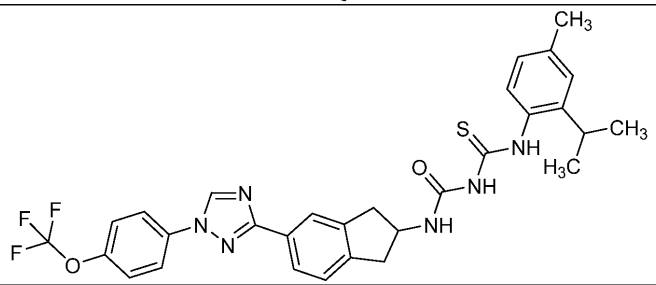
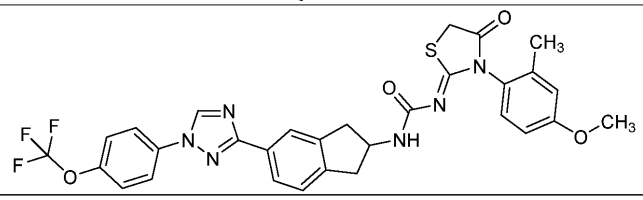
F17	169-175		ESIMS *m/z* 649 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 1H), 7.93 - 7.88 (m, 2H), 7.81 - 7.77 (m, 2H), 7.41 - 7.35 (m, 2H), 7.33 (dd, *J* = 8.0, 1.9 Hz, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.14 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.87 (s, 1H), 5.57 - 5.47 (m, 1H), 4.18 (s, 1H), 3.92 (d, *J* = 2.2 Hz, 2H), 3.17 (dt, *J* = 16.6, 5.2 Hz, 1H), 2.93 (dd, *J* = 11.4, 5.9 Hz, 2H), 2.75 - 2.58 (m, 2H), 2.34 (t, *J* = 0.9 Hz, 3H), 2.18 - 2.01 (m, 1H), 1.79 (s, 1H), 1.19 - 1.09 (m, 6H)	^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.03

[0662]

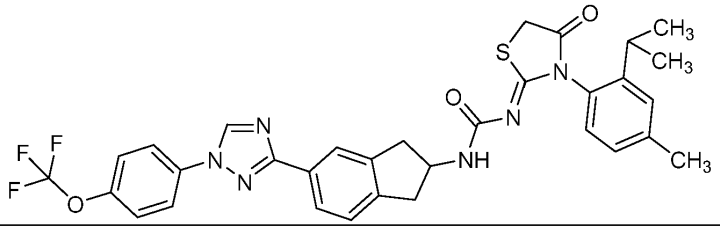
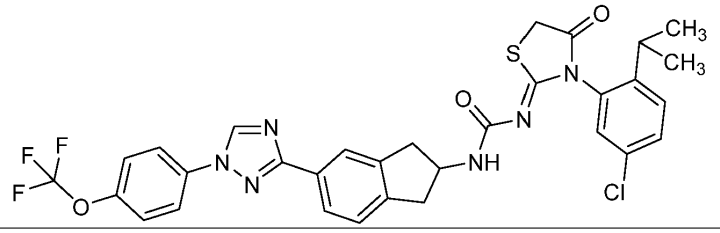
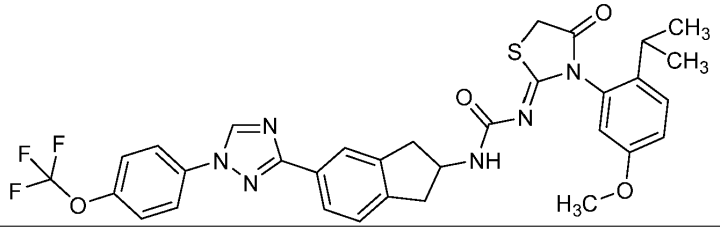
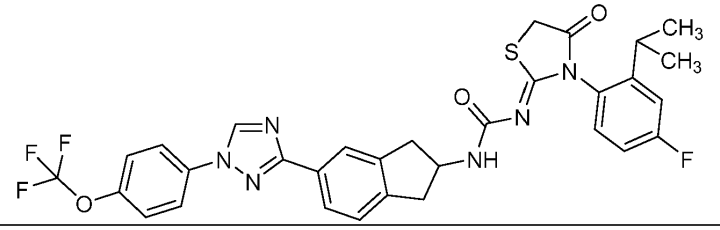
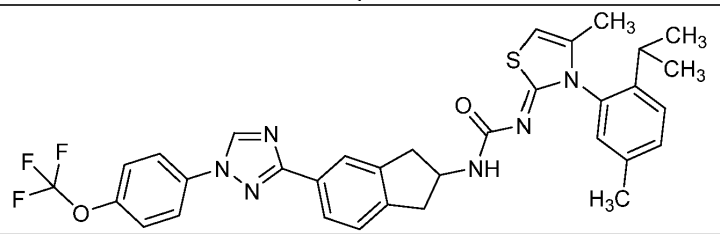
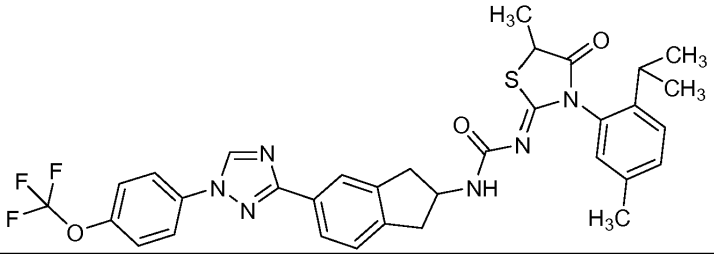
[0663] [표 5] 예시된 P 시리즈 화합물에 대한 구조 및 제조 방법

번호	구조	다음 실시예에 따라 제조됨
P1		23

[0664]

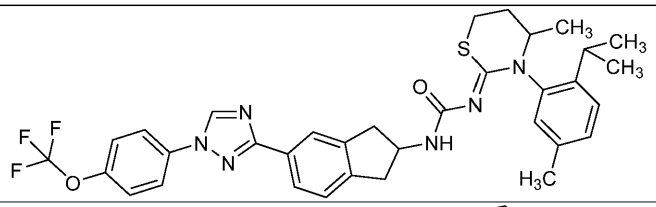
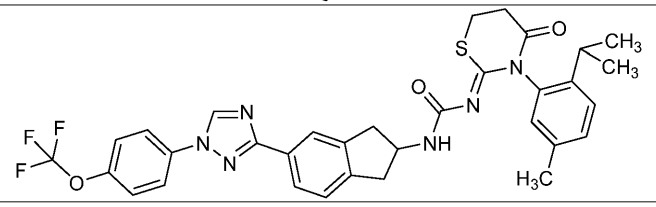
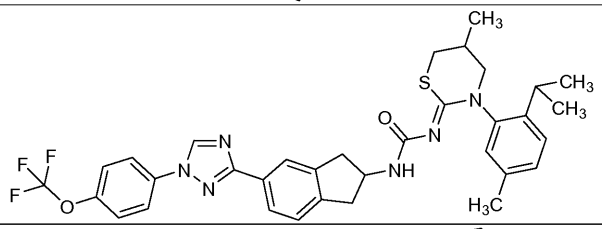
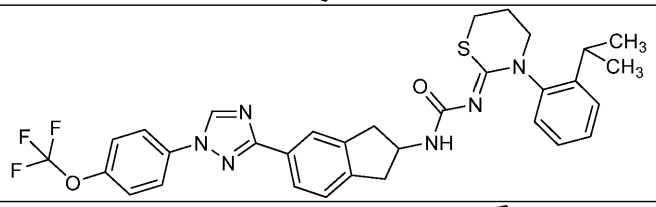
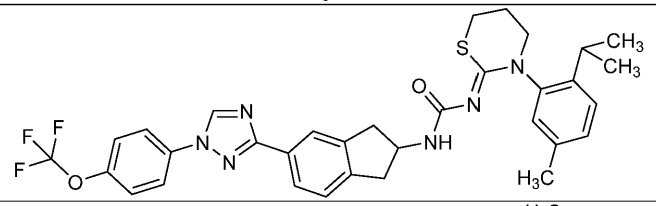
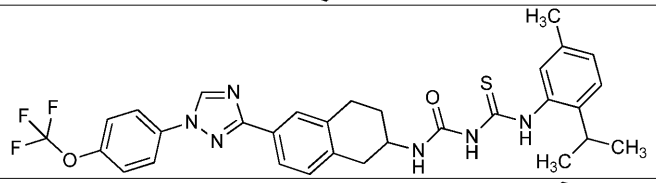
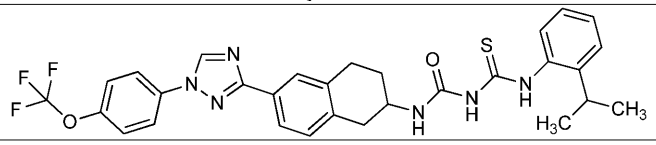
P2		23
P3		23
P4		23
P5		23
P6		28

[0665]

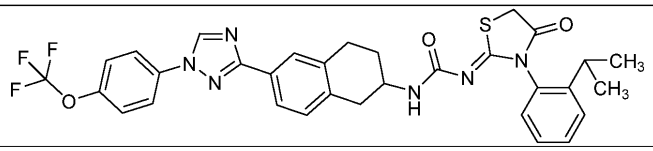
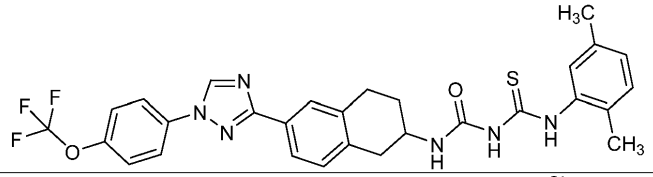
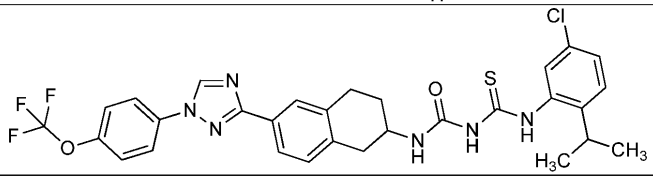
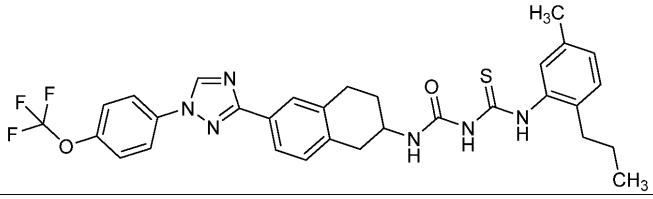
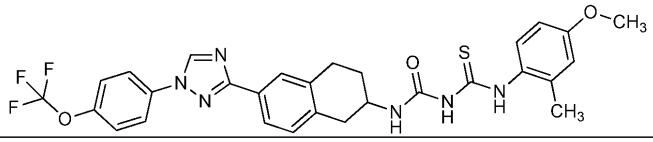
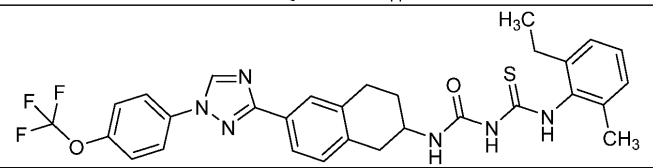
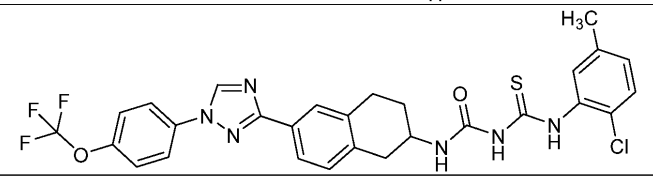
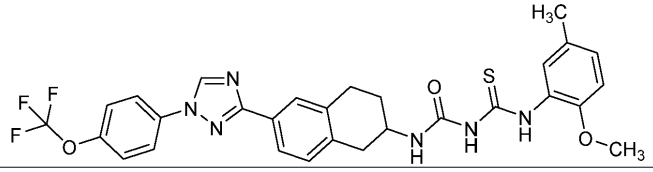
P7		28
P8		28
P9		28
P10		28
P12		29
P13		30

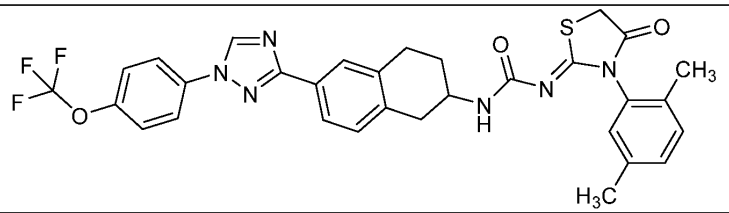
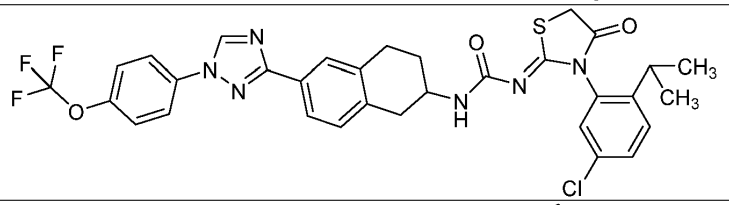
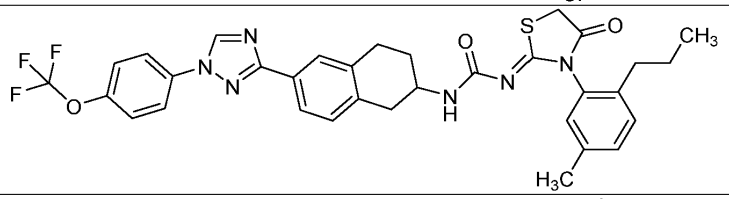
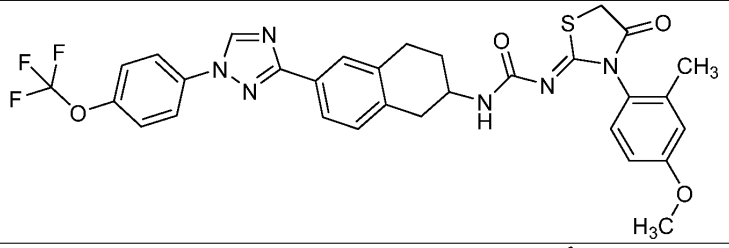
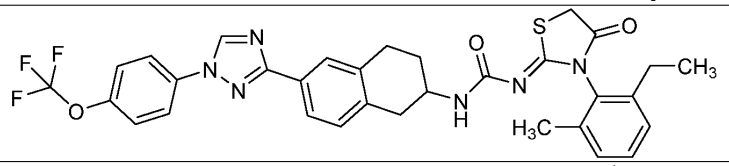
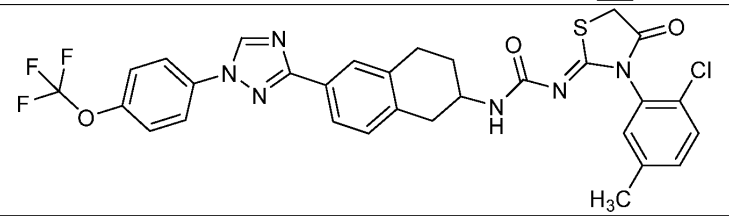
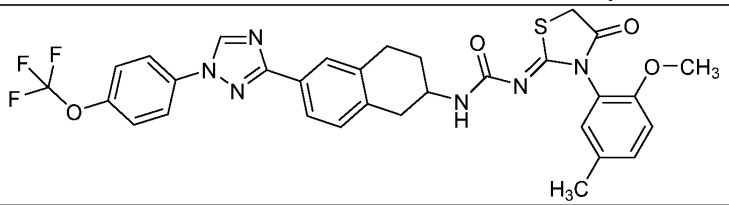
[0666]

[0667]

P16		33
P17		32
P18		33
P19		33
P20		33
P21		23
P22		23

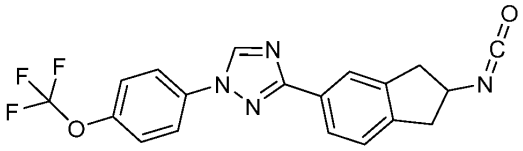
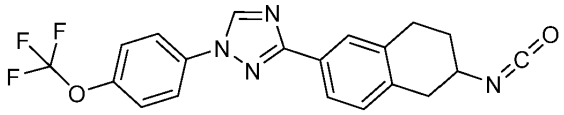
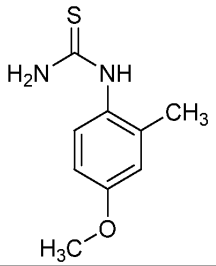
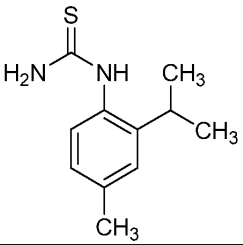
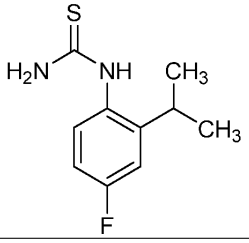
[0668]

P24		35
P25		23
P26		23
P27		23
P28		23
P29		23
P30		23
P31		23

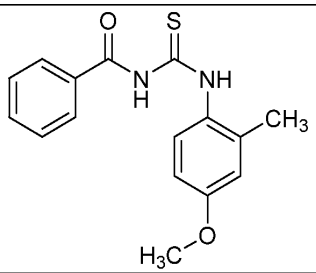
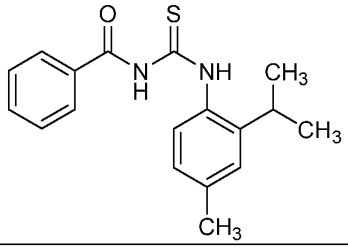
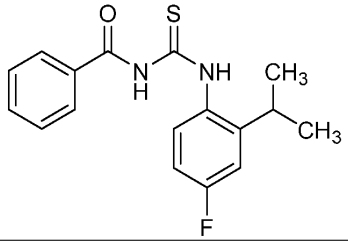
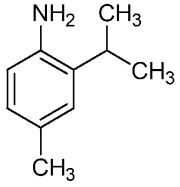
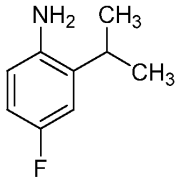
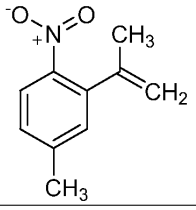
P32		35
P33		35
P34		35
P35		35
P36		35
P37		35
P38		35

[0669]

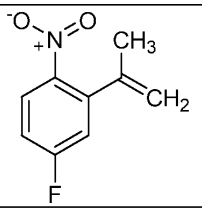
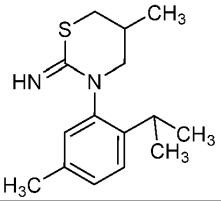
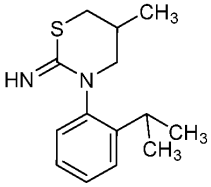
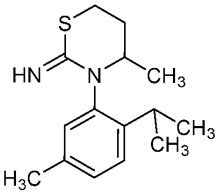
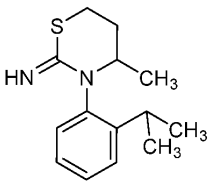
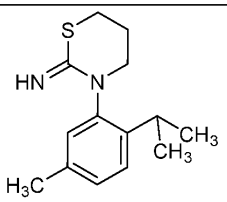
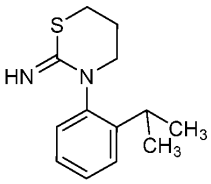
[0670] [표 6] CA 시리즈 화합물에 대한 구조 및 제조 방법

번호	구조	다음 실시예에 따라 제조됨
CA1		22
CA2		22
CA3		24
CA4		24
CA5		24

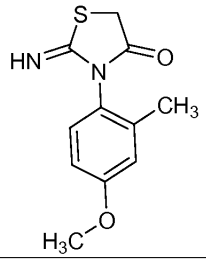
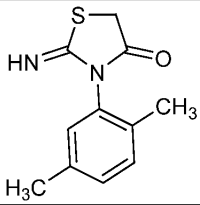
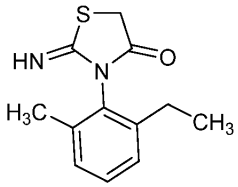
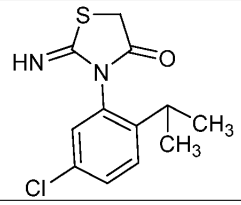
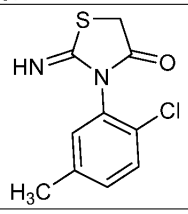
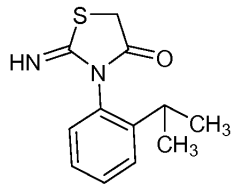
[0671]

CA6		25
CA7		25
CA8		25
CA9		26
CA10		26
CA11		27

[0672]

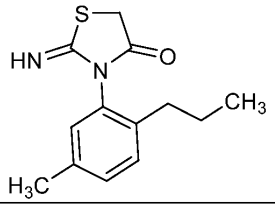
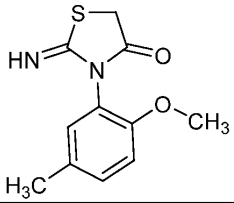
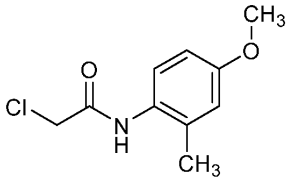
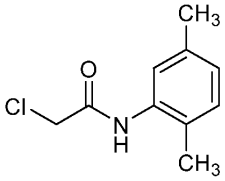
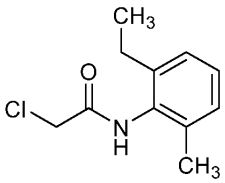
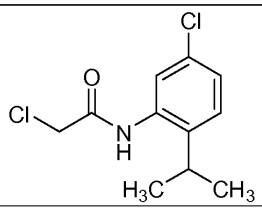
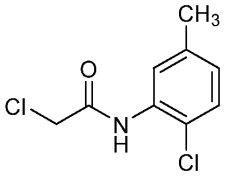
CA12		27
CA13		34
CA14		34
CA15		34
CA16		34
CA17		34
CA18		34

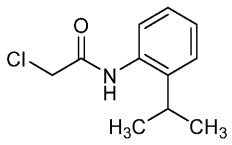
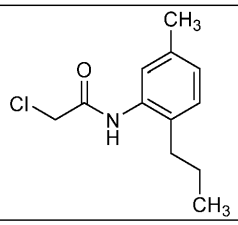
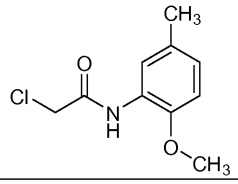
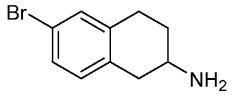
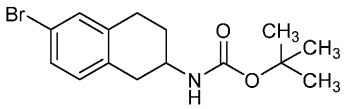
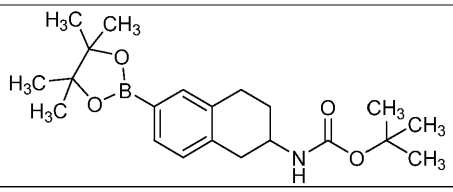
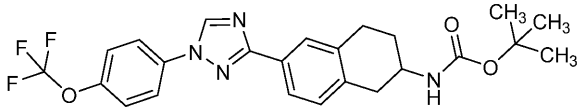
[0673]

CA19		36
CA20		36
CA21		36
CA22		36
CA23		36
CA24		36

[0674]

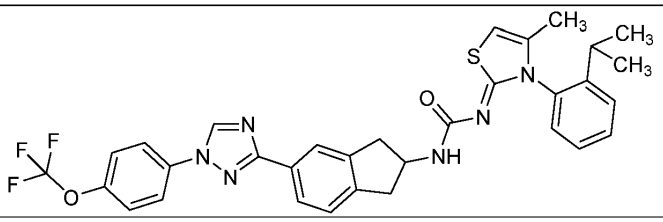
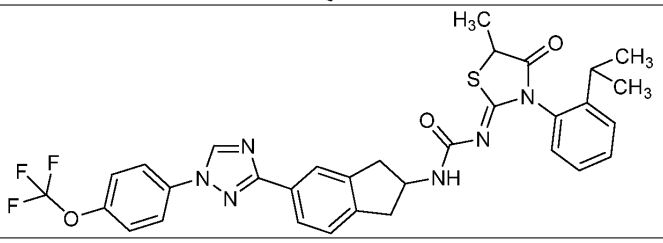
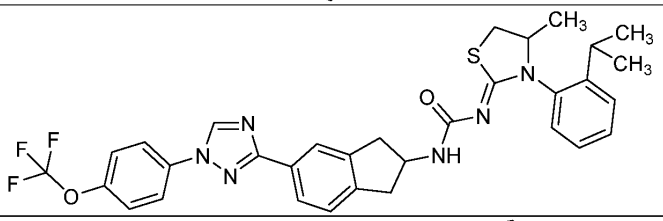
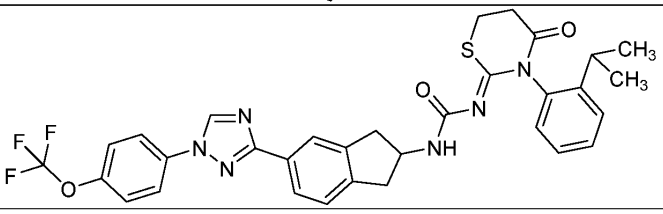
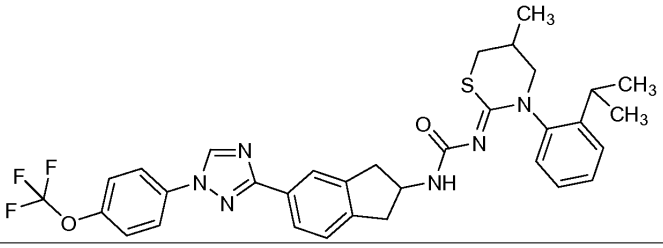
[0675]

CA25		36
CA26		36
CA27		37
CA28		37
CA29		37
CA30		37
CA31		37

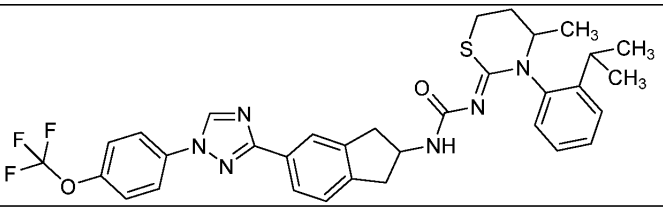
CA32		37
CA33		37
CA34		37
CA35		38
CA36		39
CA37		40
CA38		41

[0676]

[0677] [표 7] FA 시리즈 화합물에 대한 구조 및 제조 방법

번호	구조	다음 실시예에 따라 제조됨
FA1		29
FA2		30
FA3		31
FA4		32
FA5		33

[0678]

FA6		33

[0679]

[0680] [표 8] 표 5의 화합물에 대한 분석 데이터

번호	Mp (°C)	IR (cm^{-1})	질량 (*m/z*)	^{1}H NMR	^{13}CNMR; ^{19}F NMR
P1	166-168		ESIMS *m/z* 583 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 11.5 (bs, 1H), 9.38 (bs, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.05 - 8.00 (m, 2H), 7.79 (d, *J* = 8.8 Hz, 2H), 7.37 (d, *J* = 8.8 Hz, 2H), 7.31 (d, *J* = 8.0 Hz, 2H), 6.76 - 6.74 (m, 2H), 4.63 (bs, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.42 - 3.32 (m, 2H), 2.94 - 2.80 (m, 2H), 2.25 (s, 3H)	
P2	186-188		ESIMS *m/z* 599 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 11.81 (s, 1H), 9.87 (s, 1H), 9.39 (s, 1H), 8.09 - 7.94 (m, 4H), 7.62 (d, *J* = 8.7 Hz, 2H), 7.45 - 7.36 (m, 3H), 7.16 (dd, *J* = 10.5, 3.0 Hz, 1H), 7.08 – 7.01 (m, 1H), 4.52 - 4.47 (m, 1H), 3.38 - 3.27 (m, 2H), 3.01 - 2.83 (m, 3H), 1.17 (d, *J* = 6.6 Hz, 6H)	

[0681]

P3	167-169		ESIMS *m/z* 615 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11.81 (s, 1H), 9.93 (s, 1H), 9.38 (s, 1H), 8.09 - 8.06 (m, 2H), 8.02 (s, 1H), 7.96 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.8 Hz, 2H), 7.57 (d, *J* = 2.0 Hz, 1H), 7.45 - 7.31 (m, 4H), 4.52 - 4.47 (m, 1H), 3.37 - 3.28 (m, 2H), 3.03 - 2.96 (m, 1H), 2.93 - 2.84 (m, 2H), 1.17 (d, *J* = 6.8 Hz, 6H)	
P4	170-172		ESIMS *m/z* 611 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 11.91 (s, 1H), 9.84 (s, 1H), 9.38 (s, 1H), 8.07 (d, *J* = 9.2 Hz, 2H), 8.02 (s, 1H), 7.96 (d, *J* = 8.0 Hz, 2H), 7.62 (d, *J* = 8.8 Hz, 2H), 7.43 (t, *J* = 10.0 Hz, 2H), 7.25 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.10 (d, *J* = 2.4 Hz, 1H), 6.85 (dd, *J* = 8.8, 2.4 Hz, 1H), 4.52 - 4.48 (m, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.37 - 3.28 (m, 2H), 2.98 - 2.85 (m, 3H), 1.15 (d, *J* = 6.8 Hz, 6H)	
P5	120-122		ESIMS *m/z* 595 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 11.82 (s, 1H), 9.81 (s, 1H), 9.39 (s, 1H), 8.09 - 8.06 (m, 2H), 8.01 (s, 1H), 7.95 (d, *J* = 9.0 Hz, 1H), 7.62 (d, *J* = 9.0 Hz, 2H), 7.44 - 7.40 (m, 2H), 7.25 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.01 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 4.50 - 4.47 (m, 1H), 3.38 - 3.35 (m, 2H), 3.02 - 2.83 (m, 3H), 2.30 (s, 3H), 1.16 (d, *J* = 6.9 Hz, 6H)	

[0682]

[0683]

P6	133-136		ESIMS *m/z* 632 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 9.36 (s, 1H), 8.07 - 8.03 (m, 2H), 7.90 - 7.87 (m, 3H), 7.61 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 7.30 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.11 (d, *J* = 9.0 Hz, 1H), 6.90 - 6.81 (m, 2H), 4.44 - 4.40 (m, 1H), 4.13 - 4.02 (m, 2H), 3.75 (s, 3H), 3.22 - 3.10 (m, 2H), 2.96 - 2.85 (m, 2H), 2.03 (s, 3H)	
P7	141-144		ESIMS *m/z* 635 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 9.36 (s, 1H), 8.07 (d, *J* = 9.2 Hz, 2H), 7.89 - 7.87 (m, 3H), 7.62 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 7.30 - 7.24 (m, 2H), 7.09 - 7.02 (m, 2H), 4.42 - 4.39 (m, 1H), 4.12 (d, *J* = 17.7 Hz, 1H), 4.00 (d, *J* = 17.7 Hz, 1H), 3.18 - 3.08 (m, 2H), 2.90 - 2.83 (m, 2H), 2.64 - 2.60 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.13 - 1.07 (m, 6H)	
P8	153-155		ESIMS *m/z* 655 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 9.36 (s, 1H), 8.05 (d, *J* = 8.8 Hz, 2H), 7.95 (d, *J* = 7.2 Hz, 1H), 7.89 - 7.87 (m, 2H), 7.60 (d, *J* = 8.0 Hz, 2H), 7.49 - 7.42 (m, 3H), 7.30 (d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 4.42 - 4.39 (m, 1H), 4.14 (d, *J* = 18.0 Hz, 1H), 3.96 (d, *J* = 18.0 Hz, 1H), 3.28 – 3.12 (m, 2H), 2.90 - 2.84 (m, 2H), 2.69 - 2.65 (m, 1H), 1.13 - 1.07 (m, 6H)	

[0684]

P9	137-140		ESIMS *m/z* 651 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 9.36 (s, 1H), 8.05 (d, *J* = 9.2 Hz, 2H), 7.94 - 7.87 (m, 3H), 7.60 (d, *J* = 8.8 Hz, 2H), 7.35 (d, *J* = 9.2 Hz, 1H), 7.29 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 6.98 (dd, *J* = 8.8, 2.4 Hz, 1H), 6.80 (d, *J* = 2.4 Hz, 1H), 4.42 - 4.39 (m, 1H), 4.12 (d, *J* = 17.6 Hz, 1H), 3.98 (d, *J* = 17.6 Hz, 1H), 3.20 - 3.11 (m, 2H), 2.90 - 2.85 (m, 2H), 2.61 - 2.58 (m, 1H), 1.11 - 1.06 (m, 6H)	
P10	222-224		ESIMS *m/z* 639 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 9.36 (s, 1H), 8.05 (d, *J* = 8.7 Hz, 2H), 7.91 - 7.87 (m, 3H), 7.61 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 7.32 - 7.25 (m, 3H), 7.15 - 7.10 (m, 1H), 4.42 - 4.39 (m, 1H), 4.14 (d, *J* = 18.0 Hz, 1H), 4.00 (d, *J* = 18.0 Hz, 1H), 3.18 - 3.10 (m, 2H), 2.90 - 2.83 (m, 2H), 2.68 - 2.64 (m, 1H), 1.17 - 1.07 (m, 6H)	

[0685]

P12	122-124		ESIMS *m/z* 633 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 9.30 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 9.0 Hz, 2H), 7.95 - 7.90 (m, 2H), 7.61 (d, *J* = 8.7 Hz, 2H), 7.39 - 7.34 (m, 2H), 7.27 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.00 (s, 1H), 6.64 (s, 1H), 4.61 - 4.59 (m, 1H), 3.28 - 3.23 (m, 2H), 2.99 - 2.91 (m, 2H), 2.67 - 2.63 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.10 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H), 1.01 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H)	
P13	140-142		ESIMS *m/z* 649 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 9.36 (s, 1H), 8.09 - 8.04 (m, 2H), 7.95 - 7.87 (m, 3H), 7.61 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 7.35 - 7.28 (m, 2H), 7.21 (d, *J* = 7.2 Hz, 1H), 7.05 (s, 1H), 4.42 - 4.36 (m, 1H), 3.17 - 3.08 (m, 2H), 2.91 - 2.83 (m, 2H), 2.64 - 2.55 (m, 1H), 2.27 (s, 3H), 1.60 - 1.55 (m, 3H), 1.14 - 1.04 (m, 6H)	
P16			ESIMS *m/z* 650 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, CD_3OD) δ 9.11 (s, 1H), 8.01 - 7.92 (m, 4H), 7.50 - 7.30 (m, 5H), 7.19 - 7.10 (m, 1H), 4.47 (bs, 2H), 3.80 (bs, 1H), 3.52 - 3.47 (m, 2H), 3.27 - 3.22 (m, 2H), 2.86 - 2.72 (m, 3H), 2.43 - 2.35 (m, 5H), 1.43 - 1.10 (m, 9H)	

P17	170-172		ESIMS *m/z* 667 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 - 8.54 (m, 1H), 8.06 - 7.96 (m, 2H), 7.80 (d, *J* = 8.8 Hz, 2H), 7.54 (s, 1H), 7.44 - 7.32 (m, 4H), 7.16 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.01 - 6.98 (m, 1H), 4.70 (s, 1H), 3.43 - 3.14 (m, 6H), 3.15 (d, *J* = 6.0, 1H), 2.96 - 2.92 (m, 1H), 2.75 (t, *J* = 6.4, 1H), 2.30 (s, 3H), 1.23 - 1.10 (m, 6H)	
P18	156-158		ESIMS *m/z* 650 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.53 (s, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.78 (d, *J* = 9.2 Hz, 2H), 7.37 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 7.26 (s, 1H), 7.19 (dd, *J* = 8.4, 4.0 Hz, 1H), 7.08 (d, *J* = 8.4, 1H), 6.84 (s, 1H), 5.08 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 4.59 (d, *J* = 7.2 Hz, 1H), 3.59 (s, 1H), 3.38 (d, *J* = 6.8 Hz, 1H), 3.33 - 3.24 (m, 2H), 3.00 - 2.73 (m, 4H), 2.49 (bs, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.18 - 1.12 (m, 9H)	
P19	105-107		ESIMS *m/z* 621 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.52 (s, 1H), 7.96 - 7.93 (m, 2H), 7.77 (d, *J* = 8.7 Hz, 2H), 7.38 - 7.28 (m, 4H), 7.21 - 7.02 (m, 3H), 5.05 (d, *J* = 7.5 Hz, 1H), 4.62 - 4.54 (m, 1H), 3.72 - 3.64 (m, 1H), 3.54 - 3.46 (m, 1H), 3.34 - 3.22 (m, 2H), 3.10 - 2.92 (m, 3H), 2.84 - 2.70 (m, 2H), 2.35 - 2.29 (m, 2H), 1.24 - 1.14 (m, 6H)	

[0686]

P20	220-222		ESIMS *m/z* 636 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.53 (s, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.79 (d, *J* = 8.7 Hz, 2H), 7.37 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 7.24 - 7.19 (m, 2H), 7.08 (d, *J* = 7.5 Hz, 1H), 6.86 (s, 1H), 5.08 - 5.06 (m, 1H), 4.60 (m, 1H), 3.71 - 3.65 (m, 1H), 3.53 - 3.47 (m, 1H), 3.33 - 3.26 (m, 2H), 3.09 - 3.05 (m, 2H), 2.93 - 2.72 (m, 3H), 2.35 - 2.25 (m, 5H), 1.21 - 1.13 (m, 6H)	
P21	147-151		ESIMS *m/z* 609 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 11.84 (s, 1H), 9.86 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 7.90 (d, *J* = 5.0 Hz, 2H), 7.83 - 7.78 (m, 2H), 7.38 (d, *J* = 8.6 Hz, 2H), 7.26 - 7.09 (m, 4H), 5.97 (s, 1H), 4.15 (s, 1H), 3.24 – 2.92 (m, 4H), 2.68 (s, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.17 (d, *J* = 11.8 Hz, 1H), 1.76 (s, 1H), 1.23 (d, *J* = 6.9 Hz, 6H)	
P22	171-174		ESIMS *m/z* 595 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 11.85 (s, 1H), 9.50 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 7.92 (d, *J* = 5.5 Hz, 2H), 7.83 - 7.77 (m, 2H), 7.36 (dd, *J* = 18.0, 10.6 Hz, 3H), 7.16 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 5.70 (s, 1H), 4.18 (s, 1H), 3.14 (ddd, *J* = 28.8, 15.1, 6.0 Hz, 2H), 3.00 (t, *J* = 6.6 Hz, 2H), 2.71 (s, 1H), 2.15 (s, 1H), 1.80 (s, 1H), 1.25 (d, *J* = 6.8 Hz, 6H)	

[0687]

P24	128-132		ESIMS *m/z* 635 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 - 8.58 (m, 1H), 7.91 - 7.93 (m, 2H), 7.80 - 7.82 (dd, *J* = 6.6, 2Hz, 2H), 7.46 (m, 2H), 7.40-7.41 (d, *J*=8.4Hz, 2H), 7.32 (m, 1H), 7.15 (d, *J*= 8.7Hz, 1H), 7.07 - 7.08 (d, *J*= 7.8Hz, 1H), 5.51 - 5.52 (m, 1H), 4.19 - 4.20 (m, 1H), 3.93 - 3.94 (s, 2H), 3.20 (m, 1H), 2.95 - 2.97 (m, 2H), 2.71 (m, 2H), 2.12 - 2.14 (br, s, 1H), 1.81 - 1.83 (br, s, 1H), 1.19 - 1.21 (m, 6H)	
P25	188-191		ESIMS *m/z* 581 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 11.95 (s, 1H), 9.89 (s, 1H), 9.38 (s, 1H), 8.10 - 8.05 (m, 2H), 7.92 - 7.83 (m, 2H), 7.68 - 7.58 (m, 2H), 7.42 (s, 1H), 7.25 (t, *J* = 8.1 Hz, 2H), 7.15 (d, *J* = 7.7 Hz, 1H), 7.00 (dd, *J* = 7.4, 1.7 Hz, 1H), 4.05 (d, *J* = 8.7 Hz, 1H), 3.13 (dd, *J* = 16.9, 5.0 Hz, 1H), 2.95 (t, *J* = 6.6 Hz, 2H), 2.74 (dd, *J* = 16.8, 7.2 Hz, 1H), 2.27 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.03 (d, *J* = 11.4 Hz, 1H), 1.83 (dt, *J* = 13.5, 7.1 Hz, 1H)	

[0688]

P26	179-183		ESIMS *m/z* 629 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 11.96 (s, 1H), 9.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 7.91 (d, *J* = 5.2 Hz, 2H), 7.83 - 7.77 (m, 2H), 7.50 (s, 1H), 7.38 (d, *J* = 8.6 Hz, 2H), 7.28 (d, *J* = 1.3 Hz, 3H), 7.16 (d, *J* = 8.5 Hz, 1H), 5.77 (s, 1H) 4.17 (s, 1H), 3.23 - 2.93 (m, 4H), 2.69 (dd, *J* = 16.6, 8.6 Hz, 1H), 2.15 (s, 1H), 1.88 - 1.73 (m, 1H), 1.23 (d, *J* = 6.8 Hz, 6H)	
P27	152-156		ESIMS *m/z* 609 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 11.81 (s, 1H), 9.57 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 7.91 (d, *J* = 5.1 Hz, 2H), 7.84 - 7.75 (m, 2H), 7.42 - 7.34 (m, 2H), 7.30 (s, 1H), 7.19 - 7.12 (m, 2H), 7.07 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 4.17 (s, 1H), 3.18 (dd, *J* = 16.6, 5.2 Hz, 1H), 3.00 (t, *J* = 6.7 Hz, 2H), 2.70 (s, 1H), 2.55 (t, *J* = 7.7 Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.15 (s, 1H), 1.80 (s, 1H), 1.64 - 1.56 (m, 5H), 0.95 (t, *J* = 7.3 Hz, 3H)	

[0689]

[0690]

P28	173-176		ESIMS *m/z* 597 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 11.56 (s, 1H), 9.50 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 7.92 (d, *J* = 5.8 Hz, 2H), 7.80 (d, *J* = 9.0 Hz, 2H), 7.41 - 7.31 (m, 4H), 7.16 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 6.78 (d, *J* = 7.2 Hz, 2H), 5.87 (s, 1H), 4.17 (s, 1H), 3.79 (s, 3H), 3.17 (d, *J* = 16.3 Hz, 1H), 2.99 (s, 2H), 2.72 (s, 1H), 2.27 (s, 3H), 2.14 (s, 1H), 1.81 (s, 1H)	
P29	192-195		ESIMS *m/z* 596 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 11.46 (s, 1H), 9.85 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 7.92 (d, *J* = 5.3 Hz, 2H), 7.80 (d, *J* = 8.9 Hz, 2H), 7.38 (d, *J* = 8.6 Hz, 2H), 7.21 (d, *J* = 7.5 Hz, 1H), 7.17 - 7.09 (m, 3H), 5.82 (s, 1H), 4.16 (s, 1H), 3.17 (dd, *J* = 16.7, 5.2 Hz, 1H), 2.98 (t, *J* = 6.6 Hz, 2H), 2.66 (dq, *J* = 23.2, 8.1 Hz, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.15 (s, 1H), 1.86 - 1.72 (m, 1H), 1.23 (t, *J* = 7.6 Hz, 3H)	

P30	188-191		ESIMS *m/z* 602 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 12.34 (s, 1H), 10.05 (s, 1H), 9.38 (s, 1H), 8.11 - 8.00 (m, 2H), 7.93 - 7.81 (m, 3H), 7.66 - 7.55 (m, 2H), 7.42 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.26 (d, *J* = 7.8 Hz, 2H), 7.14 - 7.05 (m, 1H), 4.07 (s, 1H), 3.13 (dd, *J* = 16.8, 5.0 Hz, 1H), 2.95 (t, *J* = 6.6 Hz, 2H), 2.75 (dd, *J* = 16.8, 7.1 Hz, 1H), 2.30 (s, 3H), 2.04 (d, *J* = 13.7 Hz, 1H), 1.83 (dt, *J* = 13.4, 7.1 Hz, 1H)	
P31	171-175		ESIMS *m/z* 597 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 12.11 (s, 1H), 9.23 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.90 (dd, *J* = 4.2, 2.6 Hz, 2H), 7.85 - 7.73 (m, 2H), 7.38 (d, *J* = 8.6 Hz, 2H), 7.12 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 6.99 (d, *J* = 8.6 Hz, 1H), 6.82 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 6.08 (s, 1H), 4.17 (s, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.15 (dd, *J* = 16.7, 5.2 Hz, 1H), 2.97 (t, *J* = 6.6 Hz, 2H), 2.66 (dd, *J* = 16.7, 8.5 Hz, 1H), 2.31 (s, 3H), 2.21 - 2.06 (m, 1H), 1.78 (q, *J* = 11.9, 9.9 Hz, 1H), 1.57 (s, 3H)	

[0691]

P32	160-162		ESIMS *m/z* 621 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 1H), 7.89 - 7.93 (m, 2H), 7.77 - 7.82 (d, *J* = 8.8 Hz, 2H), 7.38 (d, *J* = 8.80 Hz, 2H), 7.20 - 7.24 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.17 (br d, *J* = 9.78 Hz, 2H), 6.91 (s, 1H), 5.53 (d, *J* = 7.6Hz,, 1H), 4.18 (br s, 1H), 3.91 (s, 2H), 3.18 (br dd, *J* = 16.63, 5.38 Hz, 1H), 2.94 (m, 2H), 2.69 (br dd, *J* = 16.8, 8.4, Hz, 1H), 2.35 (s, 3H), 2.08 - 2.14 (m, 4H), 1.74 - 1.87 (m, 1H)	
P33	146-148		ESIMS *m/z* 669 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (s, 1H), 7.91 (d, *J* = 4.89 Hz, 2H), 7.75 - 7.82 (dd, *J* = 6.8, 2Hz, 2H), 7.34 - 7.45 (m, 4H), 7.12 - 7.18 (m, 1H), 7.07 (t, *J* = 2.45 Hz, 1H), 5.48 - 5.54 (dd, *J* = 8, 3.6HZ, 1H), 4.15 - 4.22 (m, 1H), 3.91 - 3.98 (s, 2H), 3.15 - 3.27 (m, 1H), 2.86 - 3.00 (m, 2H), 2.57 - 2.75 (m, 2H), 2.12 (br s, 1H), 1.74 - 1.87 (m, 1H), 1.12 - 1.20 (m, 6H)	

[0692]

P34	140-142		ESIMS *m/z* 650 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 1H), 7.89 - 7.95 (m, 2H), 7.79 (dd, *J* = 6.8, 2.0 Hz, 2H), 7.39 (d, *J* = 8.8 Hz, 1H), 7.21 (d, *J* = 8.31 Hz, 2H), 7.14 (d, *J* = 8Hz, 1H), 6.89 - 6.97 (m, 2H), 5.52 (dd, *J* = 8.1, 4.5 Hz, 1H), 4.19 (br s, 1H), 3.90 (d, *J* = 2.0 HZ, 2H), 3.18 (dd, *J* = 16.6, 5.2 Hz, 1H), 2.93 - 2.96 (m, 2H), 2.70 - 2.62 (m, 1H), 2.34 (m, 5H), 2.1 (br, s, 1H), 1.79 (m, 1H), 1.5 (s, 2H), 0.94 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H)	
P35	173-180		ESIMS *m/z* 637 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.53 (s, 1H), 7.89 (d, *J* = 5.0 Hz, 2H), 7.80 - 7.75 (m, 2H), 7.37 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 7.13 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.99 (dd, *J* = 7.8, 4.3 Hz, 1H), 6.82 (d, *J* = 8.6 Hz, 2H), 5.57 - 5.50 (m, 1H), 4.18 (s, 1H), 4.12 - 3.88 (m, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.16 (dd, *J* = 16.6, 5.4 Hz, 1H), 2.93 (d, *J* = 7.3 Hz, 2H), 2.73 - 2.63 (m, 1H), 2.10 (d, *J* = 1.9 Hz, 4H), 1.81 (s, 1H)	

[0693]

P36	128-130		ESIMS *m/z* 635 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 - 8.53 (m, 1H), 7.90 (d, *J* = 4.4 Hz, 2H), 7.82 - 7.77 (dd, *J* = 6.8, 2.0 Hz, 2H), 7.38 (d, *J* = 8.3 Hz, 2H), 7.31 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.13 - 7.23 (m, 3H), 5.53 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 4.17 (br s, 1H), 3.94 (s, 2H), 3.21 - 3.16 (dd, *J* = 16.4, 5.2 Hz, 1H), 2.99 - 2.93 (m, 2H), 2.69 (m 1H), 2.43 (q, *J* = 7.66 Hz, 2H), 2.13 (m , 4H), 1.85 - 1.75 (m, 1H), 1.23 - 1.15 (m, 3H)	
P37	152-154		ESIMS *m/z* 641 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 1H), 7.96 - 7.90 (m, 2H), 7.82 - 7.76 (dd, *J* = 6.8, 2.0 Hz, 2H), 7.43 - 7.37 (m, 3H), 7.22 (d, *J* = 6.8 Hz, 1H), 7.18 - 7.13 (dd, *J* = 8.4, 2.4 Hz, 1H), 7.06 (br s, 1H), 5.50 (dd, *J* = 8.0, 4.0 Hz, 1H), 4.20 (br s, 1H), 3.95 (m, 2H), 3.19 (m, 1H), 3.00 - 2.92 (m, 2H), 2.76 - 2.66 (m, 1H), 2.38 (s, 3H), 2.16 - 2.10 (m, 1H), 1.84 (br d, *J* = 7.8 Hz, 1H)	

[0694]

P38	165-168		ESIMS *m/z* 637 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 1H), 7.93 - 7.89 (m, 2H), 7.79 (dd, *J*= 6.8, 2.0 Hz, 2H), 7.38 (d, *J* = 8.8 Hz, 2H), 7.21 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.14 (dd, *J* = 8.4, 3.2 Hz, 1H), 6.97 - 6.89 (m, 2H), 5.52 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 4.19 (br s, 1H), 3.96 - 3.91 (m, 2H), 3.77 (d, *J* = 2.0 Hz, 3H), 3.23 - 3.13 (m, 1H), 2.95 (m, 2H), 2.72 - 2.65 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.17 - 2.06 (m, 1H), 1.86 - 1.75 (m, 1H)	

[0695]

[0696] [표 9] 표 6의 화합물에 대한 분석 데이터

번호	Mp (°C)	IR (cm^{-1})	질량 (*m/z*)	^{1}H NMR	^{13}CNMR; ^{19}F NMR
FA1	124-126		ESIMS *m/z* 619 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 9.35 (s, 1H), 8.07 - 8.04 (m, 2H), 7.88 - 7.86 (m, 2H), 7.60 (d, *J* = 9.0 Hz, 2H), 7.53 - 7.42 (m, 2H), 7.34 - 7.29 (m, 2H), 7.20 (d, *J* = 7.5 Hz, 1H), 7.13 (d, *J* = 7.5 Hz, 1H), 6.50 (s, 1H), 4.46 - 4.38 (m, 1H), 3.18 - 3.05 (m, 2H), 2.88 - 2.80 (m, 2H), 2.45 (d, *J* = 6.6 Hz, 1H), 2.30 (s, 3H), 1.13 (t, *J* = 6.9 Hz, 6H)	

[0697]

FA2	130-132		ESIMS *m/z* 635 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 9.36 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 9.6 Hz, 2H), 7.93 - 7.87 (m, 3H), 7.60 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 7.47 - 7.39 (m, 2H), 7.30 - 7.26 (m, 2H), 7.22 - 7.20 (m, 1H), 4.42 - 4.27 (m, 1H), 3.19 - 3.10 (m, 2H), 2.70 - 2.62 (m, 1H), 1.59 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 2.30 (s, 3H), 1.17 - 1.10 (m, 3H), 1.09 (t, *J* = 6.8 Hz, 3H)	
FA3	94-96		ESIMS *m/z* 622 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 9.85 (d, *J* = 6.6 Hz, 1H), 9.35 (s, 1H), 8.05 (d, *J* = 8.7 Hz, 3H), 7.96 (s, 1H), 7.90 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.61 (d, *J* = 8.4 Hz, 3H), 7.37 - 7.35 (m, 1H), 7.17 (d, *J* = 7.2 Hz, 1H), 7.12-7.01 (m, 2H), 6.77 (d, *J* = 7.2 Hz, 1H), 4.49 (t, *J* = 6.6 Hz, 1H), 4.59 (bs, 1H), 3.45 - 3.41 (m, 1H), 2.87 (d, *J* = 11.1 Hz, 3H), 2.73 - 2.68 (m, 1H), 1.36 - 1.23 (m, 3H), 0.97 - 0.92 (m, 6H)	
FA4	190-192		ESIMS *m/z* 653 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (s, 1H), 8.06 - 8.02 (m, 2H), 7.95 (bs, 1H) , 7.80 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.61 (bs, 1H), 7.40 - 7.33 (m, 4H), 7.20 - 7.19 (m, 2H), 4.47 (bs, 1H), 3.49 - 3.37 (m, 2H), 3.28 - 3.26 (m, 2H), 3.15 (bs, 1H), 2.99 - 2.96 (m, 2H), 2.78 - 2.76 (m, 2H), 1.22 (d, J = 6.4 Hz, 6H)	

[0698]

FA5	103-106		ESIMS *m/z* 636 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.53 (s, 1H), 7.97 - 7.94 (m, 2H), 7.78 (d, *J* = 9.2 Hz, 2H), 7.37 (d, *J* = 8.8 Hz, 2H), 7.33 - 7.30 (m, 1H), 7.26 - 7.17 (m, 2H), 7.03 - 7.00 (m, 2H), 5.05 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 4.61 - 4.56 (m, 1H), 3.60 - 3.56 (m, 1H), 3.40 - 3.20 (m, 4H), 3.01 - 2.90 (m, 2H), 2.88 - 2.70 (m, 3H), 2.55 - 2.45 (m, 2H), 1.40 - 1.10 (m, 6H)	
FA6	146-148		ESIMS *m/z* 636 ([M+H]$^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.52 (s, 1H), 7.95 - 7.93 (m, 2H), 7.77 (d, *J* = 9.0 Hz, 2H), 7.60 - 7.32 (m, 5H), 7.22 - 7.13 (m, 2H), 4.42 - 4.39 (m, 1H), 3.90 - 3.66 (m, 1H), 3.40 - 3.20 (m, 3H), 3.16 - 2.90 (m, 3H), 2.50 - 2.30 (m, 3H), 1.46 - 1.40 (m, 3H), 1.30 - 1.20 (m, 6H)	

[0699]

BAW & CL 등급 표	
방제% (또는 사멸률)	**등급**
50-100	A
0 초과 - 50 미만	B
시험되지 않음	C
본 생물검정에서 활성이 인지되지 않음	D

[0700]

GPA & YFM 등급 표	
방제% (또는 사멸률)	**등급**
80-100	A
0 초과 - 80 미만	B
시험되지 않음	C
본 생물검정에서 활성이 인지되지 않음	D

[0701]

[0702] [표 ABC] 생물학적 결과

번호	곤충 종			
	BAW	**CL**	**GPA**	**YFM**
F1	A	A	C	A
F2	A	A	B	A
F3	A	A	C	A
F4	A	A	B	A
F5	A	A	C	C
F6	A	A	C	C
F7	A	A	C	C
F8	A	A	C	C
F9	A	A	C	A
F10	A	A	C	A
F11	A	A	C	A

[0703]

F12	A	A	D	A
F13	A	A	B	A
F14	A	A	C	C
F15	A	A	B	A
F16	A	A	C	A
F17	A	A	C	A
P1	A	A	C	A
P2	A	A	C	A
P3	A	A	C	A
P4	A	A	C	A
P5	A	A	C	A
P6	A	A	C	A
P7	A	A	C	A
P8	A	A	C	A
P9	A	A	C	A
P10	A	A	C	A
P12	A	A	C	A
P13	A	A	C	B
P16	A	A	C	C
P17	A	A	C	C
P18	A	A	C	A
P19	A	A	C	A
P20	A	A	C	A
P21	A	A	C	A
P22	A	A	C	A
P23	A	A	C	A
P24	A	A	C	A
P25	A	A	C	A

[0704]

[0705]

P26	A	A	C	A
P27	A	A	C	A
P28	A	A	C	A
P29	A	A	C	A
P30	A	A	C	A
P31	A	A	C	A
P32	A	A	C	B
P33	A	A	C	A
P34	A	A	C	D
P35	A	A	C	A
P36	A	A	C	A
P37	A	A	C	D
P38	A	A	C	A
FA1	A	A	C	A
FA2	A	A	B	A
FA3	A	D	C	B
FA4	A	A	C	C
FA5	A	A	C	A
FA6	A	A	C	A

[0706] [표 ABCD] 생물학적 결과

번호	곤충 종			
	BAW	CL	GPA	YFM
C1	A	A	B	A
C2	A	A	C	C
C3	A	A	C	A
C4	C	C	C	D
C5	C	C	C	C
C6	C	C	C	C
C8	C	C	C	D
C15	C	C	C	C
C17	C	C	C	D
C18	C	C	C	D
C19	C	C	C	C
C20	C	C	C	D
C21	C	C	C	C
C22	C	C	C	D
C23	C	C	C	C
C24	C	C	C	C
C25	C	C	C	C
C26	C	C	C	C
C27	C	C	C	C
C28	C	C	C	C
C29	B	A	C	B
C30	D	C	C	D

[0707]