



(19) 대한민국특허청(KR)

(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2019년01월22일

(11) 등록번호 10-1941300

(24) 등록일자 2019년01월16일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
C07D 487/04 (2006.01) A01N 43/54 (2006.01)
A01N 43/60 (2006.01) A01P 5/00 (2006.01)

(21) 출원번호 10-2013-7012604

(22) 출원일자(국제) 2011년10월05일

심사청구일자 2016년10월05일

(85) 번역문제출일자 2013년05월16일

(65) 공개번호 10-2013-0132440

(43) 공개일자 2013년12월04일

(86) 국제출원번호 PCT/US2011/054868

(87) 국제공개번호 WO 2012/054233

국제공개일자 2012년04월26일

(30) 우선권주장

61/394,080 2010년10월18일 미국(US)

(56) 선행기술조사문헌

EP0244166 A

WO2010087294 A1

WO2010129500 A1

(73) 특허권자

이 아이 듀폰 디 네모아 앤드 캄파니

미국 19805 델라웨어주 윌밍톤 피.오. 박스 2915
센터 로드 974 체스트넛 런 플라자

(72) 발명자

람, 조지, 피.

미국 19808 델라웨어주 윌밍톤 페어힐 드라이브
148

파허츠키 주니어, 토마스, 프란시스

미국 21921 메릴랜드주 엘크톤 고머 코트 50

(74) 대리인

양영준, 김영

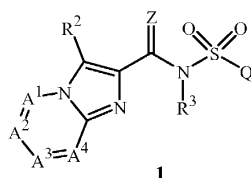
전체 청구항 수 : 총 7 항

심사관 : 김용원

(54) 발명의 명칭 살선훈성 설폰아미드

(57) 요약

화학식 1의 화합물, 이의 N-옥사이드, 및 이의 염이 개시되어 있다:



상기 식에서,

Z는 O 또는 S이고;

A¹, A², A³ 및 A⁴는 독립적으로 N 또는 CR¹이되, 단, A¹, A², A³ 및 A⁴ 중 단 하나만 N이며;

R¹, R², R³ 및 Q는 본 명세서 및 특허청구범위에 정의한 바와 같다.

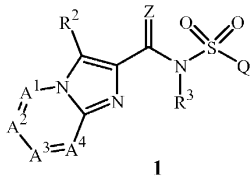
화학식 1의 화합물을 함유하는 조성물, 및 기생 선충 또는 이의 환경을 본 발명의 화합물 또는 조성물의 생물학적 유효량과 접촉시키는 것을 포함하는, 기생 선충을 구제하는 방법도 개시되어 있다.

명세서

청구범위

청구항 1

화학식 1로부터 선택되는 화합물, 이의 *N*-옥사이드, 또는 이의 염:



상기 식에서,

Z는 O이고;

A¹, A³ 및 A⁴는 독립적으로 N 또는 CR¹이되, 단, 각 화합물에서 A¹, A³ 및 A⁴ 중 단 하나만 N이며;

A²는 C-CF₃이고;

각 R¹은 독립적으로 H, 할로젠, 또는 트라이플루오로메틸이고;

R²는 H이고;

R³는 H이며;

Q는 할로젠, 시아노, 니트로, C₁-C₆ 알콕시, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알키닐 및 C₂-C₆ 할로알키닐로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐 또는 3-메틸-2-티에닐이다.

청구항 2

삭제

청구항 3

삭제

청구항 4

제 1 항에 있어서,

N-[(2-클로로-5-메톡시페닐)설포닐]-6-(트라이플루오로메틸)이미다조[1,2-*a*]피라진-2-카르복스아미드; 및

N-[[2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페닐]설포닐]-6-(트라이플루오로메틸)이미다조[1,2-*a*]피리미딘-2-카르복스아미드로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 화합물.

청구항 5

제 1 항의 화합물과, 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물.

청구항 6

삭제

청구항 7

삭제

청구항 8

삭제

청구항 9

기생 선충 또는 이의 환경을 생물학적 유효량의 제 1 항의 화합물과 접촉시키는 것을 포함하는, 기생 선충을 구제하는 방법이며, 단, 상기 방법은 요법에 의한 인체 또는 동물체의 의학적 치료 방법이 아닌 방법.

청구항 10

제 9 항에 있어서, 환경은 식물인 방법.

청구항 11

제 9 항에 있어서, 환경은 종자인 방법.

청구항 12

제 11 항에 있어서, 종자를 필름 형성제 또는 고착제 (adhesive agent)를 포함하는 조성물로서 제형화된, 화학식 1의 화합물, 이의 *N*-옥사이드 또는 이의 염으로 코팅하는 방법.

청구항 13

삭제

청구항 14

삭제

발명의 설명

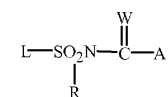
기술 분야

[0001] 본 발명은 농경학적 및 비농경학적 용도에 적합한 특정한 설폰아미드, 이의 *N*-옥사이드, 이의 염 및 이의 조성물, 및 농경학적 및 비농경학적 환경에서 기생 선충을 구제하기 위한 이들의 사용 방법에 관한 것이다.

배경 기술

[0002] 식물 기생 선충의 구제는 높은 작물 효율의 달성에 있어서 매우 중요하다. 선충에 의해 유도된 뿌리 손상은 현저한 작물 수확량 및 품질 저하를 야기하므로, 소비자에게 가격 상승을 전가할 수 있다. 기생 선충류의 구충제에 대한 광범위한 내성 발현으로 인해, 입수가능한 화학요법제에도 불구하고, 선충은 계속해서 가축에서 문제를 일으킨다. 더욱 효과적이고, 보다 저렴하며, 독성이 낮고, 환경적으로 보다 안전하거나 작용 모드가 상이한 신규 화합물이 계속해서 요구되고 있다.

[0003] 유럽 특허 출원 공개 제0 244 166 A2호는 제초제로서의 하기 화학식 i의 화합물을 개시하고 있다:



i

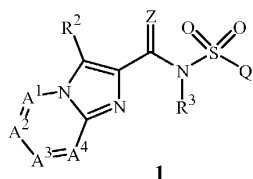
[0004]
[0005] 상기 식에서, 특히, R은 H 또는 유기 치환기이고, W는 O 또는 S이며, L은 아릴 또는 헤테로아릴 부분이고, A는 이환식, 삼환식 및 사환식 (quadricyclic) 복소환기의 리스트 중에서 선택된다.

[0006] 본 발명의 화합물은 상기 공보에 개시되어 있지 않다.

발명의 내용

[0007] (발명의 요약)

[0008] 본 발명은 화학식 1의 화합물 (모든 입체 이성질체 포함), 이의 *N*-옥사이드 및 이의 염, 이들을 함유하는 조성물 및 기생 선충을 구제하기 위한 이들의 용도에 관한 것이다:



[0009]

[0010] 상기 식에서,

[0011] Z는 O 또는 S이고;

[0012] A¹, A², A³ 및 A⁴는 독립적으로 N 또는 CR¹이되, 단, A¹, A², A³ 및 A⁴ 중 단 하나만 N이며;

[0013] 각 R¹은 독립적으로 H, 할로젠, 시아노, 니트로, OR⁴, NR⁵⁶, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알키닐, C₂-C₆ 할로알키닐, C₃-C₇ 사이클로알킬, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹¹², S(O)ₘR⁹ 또는 S(O)₂NR¹¹¹²; 또는 각각 할로젠, 시아노, 니트로, OR⁴, NR⁵⁶, C₁-C₄ 알킬, C₂-C₄ 알케닐, C₂-C₄ 알키닐, C₁-C₄ 할로알킬, C₂-C₄ 할로알케닐, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹¹², S(O)ₘR⁹ 및 S(O)₂NR¹¹¹²로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐, 나프탈레닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환이고;

[0014] R²는 H, 할로젠, 시아노, 니트로, OR⁴, NR⁵⁶, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알키닐, C₂-C₆ 할로알키닐, C₃-C₇ 사이클로알킬, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹¹², S(O)ₘR⁹ 또는 S(O)₂NR¹¹¹²; 또는 각각 할로젠, 시아노, 니트로, OR⁴, NR⁵⁶, C₁-C₄ 알킬, C₂-C₄ 알케닐, C₂-C₄ 알키닐, C₁-C₄ 할로알킬, C₂-C₄ 할로알케닐, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹¹², S(O)ₘR⁹ 및 S(O)₂NR¹¹¹²로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐, 나프탈레닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환이며;

[0015] R³는 H, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹¹², S(O)ₘR⁹ 또는 S(O)₂NR¹¹¹²; 각각 할로젠, 시아노, 니트로, OR⁴, NR⁵⁶, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹¹², S(O)ₘR⁹ 및 S(O)₂NR¹¹¹²로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐, C₃-C₇ 사이클로알킬, C₄-C₈ 사이클로알킬알킬 또는 C₅-C₇ 사이클로알케닐; 각각 할로젠, 시아노, 니트로, OR⁴, NR⁵⁶, C₁-C₄ 알킬, C₂-C₄ 알케닐, C₂-C₄ 알키닐, C₁-C₄ 할로알킬, C₂-C₄ 할로알케닐, C₂-C₆ 알콕시알킬, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹¹², S(O)ₘR⁹ 및 S(O)₂NR¹¹¹²로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환으로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 C₁-C₆ 알킬이고;

[0016] Q는 각각 할로젠, 시아노, 니트로, OR⁴, NR⁵⁶, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알키닐, C₂-C₆ 할로알키닐, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(X)NR¹¹¹², S(O)ₘR⁹, S(O)₂NR¹¹¹², OC(O)R⁷, OC(O)OR⁸, OC(O)NR¹¹¹², OS(O)₂R⁹, OS(O)₂NR¹¹¹², N(R¹⁰)C(O)R⁷, N(R¹⁰)C(O)NR¹¹¹², N(R¹⁰)S(O)₂R⁹, N(R¹⁰)S(O)₂NR¹¹¹² 및 R¹⁴로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐, 나프탈레닐, 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환 또는 8원 내지 10원 방향족 이환계 방향족 이환계 (aromatic bicyclic ring

system)이며;

[0017] 각 X는 독립적으로 0 또는 S이고;

[0018] 각 R^4 는 독립적으로 H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 할로알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_2-C_6 할로알키닐, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$ 또는 $S(O)_mR^9$; 각각 할로젠, 시아노, 니트로, C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 할로알킬, OR^{4a} 및 $S(O)_mR^{9a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C_3-C_7 사이클로알킬, C_4-C_8 사이클로알킬알킬, C_6-C_{14} 사이클로알킬사이클로알킬 또는 C_5-C_7 사이클로알케닐; 또는 할로젠, 시아노, 니트로, C_1-C_4 알킬, C_2-C_4 알케닐, C_2-C_4 알키닐, C_1-C_4 할로알킬, C_2-C_4 할로알케닐, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 알콕시알킬, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ 및 $N(R^{10})C(O)R^{7a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐이며;

[0019] 각 R^{4a} 는 독립적으로 H, C_1-C_6 알킬 또는 C_1-C_6 할로알킬이고;

[0020] 각 R^5 는 독립적으로 H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 할로알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_2-C_6 할로알키닐, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ 또는 $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; 각각 할로젠, 시아노, 니트로, C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 할로알킬, OR^{4a} 및 $S(O)_mR^{9a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C_3-C_7 사이클로알킬, C_4-C_8 사이클로알킬알킬, C_6-C_{14} 사이클로알킬사이클로알킬 또는 C_5-C_7 사이클로알케닐; 또는 할로젠, 시아노, 니트로, C_1-C_4 알킬, C_2-C_4 알케닐, C_2-C_4 알키닐, C_1-C_4 할로알킬, C_2-C_4 할로알케닐, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 알콕시알킬, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ 및 $N(R^{10})C(O)R^{7a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐이며;

[0021] 각 R^{5a} 는 독립적으로 H 또는 C_1-C_6 알킬이고;

[0022] 각 R^6 는 독립적으로 H, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 할로알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_2-C_6 할로알키닐, C_3-C_7 사이클로알킬, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ 또는 $S(O)_2NR^{11}R^{12}$ 이며;

[0023] 각 R^{6a} 는 독립적으로 H, C_1-C_6 알킬, $C(O)R^{13}$ 또는 $C(O)OR^{13}$ 이고;

[0024] 각 R^7 는 독립적으로 H, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 할로알케닐, C_2-C_6 알키닐 또는 C_2-C_6 할로알키닐; 각각 할로젠, 시아노, 니트로, C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 할로알킬, OR^{4a} 및 $S(O)_mR^{9a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C_3-C_7 사이클로알킬, C_4-C_8 사이클로알킬알킬, C_6-C_{14} 사이클로알킬사이클로알킬 또는 C_5-C_7 사이클로알케닐; 또는 할로젠, 시아노, 니트로, C_1-C_4 알킬, C_2-C_4 알케닐, C_2-C_4 알키닐, C_1-C_4 할로알킬, C_2-C_4 할로알케닐, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, OR^{4a} , C_2-C_6 알콕시알킬, $S(O)_mR^{9a}$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $NR^{5a}R^{6a}$, $OC(O)R^{7a}$ 및 $N(R^{10})C(O)R^{7a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐이며;

[0025] 각 R^{7a} 는 독립적으로 C_1-C_6 알킬 또는 C_1-C_6 할로알킬이고;

[0026] 각 R^8 는 독립적으로 H, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 할로알케닐, C_2-C_6 알키닐 또는 C_2-C_6 할

로알킬닐; 각각 할로젠, 시아노, 니트로, C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 할로알킬, OR^{4a} 및 S(O)_mR^{9a}로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C₃-C₇ 사이클로알킬, C₄-C₈ 사이클로알킬알킬, C₆-C₁₄ 사이클로알킬사이클로알킬 또는 C₅-C₇ 사이클로알케닐; 또는 할로젠, 시아노, 니트로, C₁-C₄ 알킬, C₂-C₄ 알케닐, C₂-C₄ 알킬닐, C₁-C₄ 할로알킬, C₂-C₄ 할로알케닐, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR^{11,12}, OR^{4a}, C₂-C₆ 알콕시알킬, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR^{11,12}, NR^{5a,6a}, OC(O)R^{7a} 및 N(R¹⁰)C(O)R^{7a}로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐이며;

[0027] 각 R^{8a}는 독립적으로 C₁-C₆ 알킬 또는 C₁-C₆ 할로알킬이고;

[0028] 각 R⁹은 독립적으로 H, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알킬닐 또는 C₂-C₆ 할로알킬닐; 각각 할로젠, 시아노, 니트로, C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 할로알킬, OR^{4a} 및 S(O)_mR^{9a}로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C₃-C₇ 사이클로알킬, C₄-C₈ 사이클로알킬알킬, C₆-C₁₄ 사이클로알킬사이클로알킬 또는 C₅-C₇ 사이클로알케닐; 또는 할로젠, 시아노, 니트로, C₁-C₄ 알킬, C₂-C₄ 알케닐, C₂-C₄ 알킬닐, C₁-C₄ 할로알킬, C₂-C₄ 할로알케닐, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR^{11,12}, OR^{4a}, C₂-C₆ 알콕시알킬, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR^{11,12}, NR^{5a,6a}, OC(O)R^{7a} 및 N(R¹⁰)C(O)R^{7a}로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐이며;

[0029] 각 R^{9a}는 독립적으로 C₁-C₆ 알킬 또는 C₁-C₆ 할로알킬이고;

[0030] 각 R¹⁰은 독립적으로 H, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알킬닐, C₂-C₆ 할로알킬닐, C₃-C₇ 사이클로알킬, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR^{11,12}, S(O)_mR^{9a} 또는 S(O)₂NR^{11,12}이며;

[0031] 각 R¹¹은 독립적으로 H, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알킬닐 또는 C₂-C₆ 할로알킬닐; 각각 할로젠, 시아노, 니트로, C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 할로알킬, OR^{4a} 및 S(O)_mR^{9a}로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C₃-C₇ 사이클로알킬, C₄-C₈ 사이클로알킬알킬, C₆-C₁₄ 사이클로알킬사이클로알킬 또는 C₅-C₇ 사이클로알케닐; 또는 할로젠, 시아노, 니트로, C₁-C₄ 알킬, C₂-C₄ 알케닐, C₂-C₄ 알킬닐, C₁-C₄ 할로알킬, C₂-C₄ 할로알케닐, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR^{11a,12}, OR^{4a}, C₂-C₆ 알콕시알킬, S(O)_mR^{9a}, S(O)₂NR^{11a,12}, NR^{5a,6a}, OC(O)R^{7a} 및 N(R¹⁰)C(O)R^{7a}로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐이고;

[0032] 각 R^{11a}는 독립적으로 H, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐 또는 C₂-C₆ 알킬닐이며;

[0033] 각 R¹²는 독립적으로 H, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알킬닐, C₂-C₆ 할로알킬닐 또는 C₃-C₇ 사이클로알킬이고;

[0034] 각 R¹³은 독립적으로 H, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알킬닐 또는 C₂-C₆ 할로알킬닐; 각각 할로젠, 시아노, 니트로, C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 할로알킬, OR^{4a} 및 S(O)_mR^{9a}로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C₃-C₇ 사이클로알킬, C₄-C₈ 사이클로알킬알킬, C₆-C₁₄ 사이클로알킬사이클로알킬 또는 C₅-C₇ 사이클로알케닐이며;

[0035] 각 R¹⁴은 독립적으로, 각각 할로젠, 시아노, 니트로, C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 할로알킬, OR^{4a} 및 S(O)_mR^{9a}로 구성되는 그

룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C_3-C_7 사이클로알킬, C_4-C_8 사이클로알킬알킬, C_6-C_{14} 사이클로알킬사이클로알킬 또는 C_5-C_7 사이클로알케닐; 각각 시아노, 니트로, OR^4 , $NR^{5,6}$, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11,12}$, $S(O)_mR^9$ 및 $S(O)_2NR^{11,12}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 치환되는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐 또는 C_2-C_6 알키닐; 또는 각각 할로젠, 시아노, 니트로, OR^4 , $NR^{5,6}$, C_1-C_4 알킬, C_2-C_4 알케닐, C_2-C_4 알키닐, C_1-C_4 할로알킬, C_2-C_4 할로알케닐, C_2-C_6 알콕시알킬, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11,12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11,12}$, $OC(O)R^{7a}$ 및 $N(R^{10})C(O)R^{7a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐, 나프탈레닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환이고;

[0036] 각 m 은 독립적으로 0, 1 또는 2이다.

[0037] 본 발명은 또한 화학식 1의 화합물, 이의 N -옥사이드 또는 이의 염과, 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물을 제공한다. 일 실시 형태에서, 본 발명은 또한 화학식 1의 화합물, 이의 N -옥사이드 또는 이의 염과, 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하며, 임의로 적어도 하나의 추가의 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제를 추가로 포함하는, 기생 선충을 구제하기 위한 조성물을 제공한다.

[0038] 본 발명은 기생 선충 또는 이의 환경을 생물학적 유효량의 화학식 1의 화합물, 이의 N -옥사이드 또는 이의 염 (예를 들어, 본 명세서에 기재된 조성물로서)과 접촉시키는 것을 포함하는, 기생 선충을 구제하는 방법을 제공한다. 본 발명은 또한 기생 선충 또는 이의 환경을, 생물학적 유효량의 화학식 1의 화합물, 이의 N -옥사이드 또는 이의 염과, 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하며, 임의로 생물학적 유효량의 적어도 하나의 추가의 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제를 추가로 포함하는 조성물과 접촉시키는 그러한 방법에 관한 것이다.

[0039] 본 발명은 또한 종자를 생물학적 유효량의 화학식 1의 화합물, 이의 N -옥사이드 또는 이의 염 (예를 들어, 본 명세서에 개시된 조성물로서)과 접촉시키는 것을 포함하는, 기생 선충으로부터 종자를 보호하는 방법을 제공한다. 본 발명은 또한 처리된 종자에 관한 것이다.

[0040] (발명의 상세한 설명)

[0041] 본 명세서에서 사용되는 용어 "구성하다", "구성하는", "포함하다", "포함하는", "가지다", "갖는", "함유하다", "함유하는", "특징으로 하는" 또는 임의의 이들의 기타 변형체는 명시적으로 제한되는 배타적인 포함 사항을 망라하는 것으로 의도된다. 예를 들어, 요소들의 목록을 포함하는 조성물, 혼합물, 공정 또는 방법은 반드시 그러한 요소만으로 제한되지는 않고, 명확하게 열거되지 않거나 그러한 조성물, 혼합물, 공정 또는 방법에 내재적인 다른 요소를 포함할 수도 있다.

[0042] 연결구 "이루어지는"은 명시되지 않은 임의의 요소, 단계, 또는 성분을 제외한다. 특허청구범위 중에서는, 그러한 것은 통상적으로 관련된 불순물을 제외하고는 열거된 것 이외의 물질을 포함하는 것으로 특허청구범위를 축소시킬 것이다. 어구 "이루어지는"이 전문 직후보다는 특허청구범위의 본문 절에 나타나 있는 경우에는, 그러한 절에 나타난 요소만을 제한하며; 다른 요소는 전체적으로 특허청구범위에서 배제되지 않는다.

[0043] 연결구 "실질적으로 이루어지는"은 문자 그대로 개시된 것 이외에도, 물질, 단계, 특성, 성분, 또는 요소를 포함하는 조성물 또는 방법을 정의하는데 사용되나, 단, 이들 추가의 물질, 단계, 특성, 성분 또는 요소는 청구된 발명의 기본적인 신규한 특성(들)에 실질적으로 영향을 미치지 않는다. 용어 "실질적으로 이루어지는"은 "구성하는"과 "이루어지는" 사이의 중간 입장을 차지한다.

[0044] 본 발명자가 무제한 용어, 예컨대 "구성하는"으로 발명 또는 이의 부분을 정의하는 경우에는, 또한 (달리 언급되지 않는 한) 용어 "실질적으로 이루어지는" 또는 "이루어지는"을 사용하여 이러한 발명을 기술하는 것으로 해석되어야 한다는 것을 용이하게 이해할 것이다.

[0045] 더욱이, 명백히 반대로 기술되지 않는다면, "또는"은 포괄적인 '또는'을 말하며 배타적인 '또는'을 말하는 것은 아니다. 예를 들어, 조건 A 또는 B는 하기 중 어느 하나에 의해 만족된다: A는 참 (또는 존재함)이고 B는 거짓 (또는 존재하지 않음), A는 거짓 (또는 존재하지 않음)이고 B는 참 (또는 존재함), A 및 B가 모두가 참 (또는 존재함)이다.

- [0046] 또한, 본 발명의 요소 또는 성분 앞의 부정 관사 ("a" 및 "an")는 요소 또는 성분의 경우 (즉, 존재)의 수에 관해서는 비제한적인 것으로 의도된다. 따라서, 부정관사 ("a" 또는 "an")는 하나 또는 적어도 하나를 포함하는 것으로 파악되어야 하며, 당해 요소 또는 성분의 단수형은 그 수가 명백하게 단수임을 의미하는 것이 아니라면 복수형을 또한 포함한다.
- [0047] 본 명세서 및 특허청구범위에 사용되는 용어 "선충"은 선형동물문 (Phylum Nematoda)의 생물 (living organism)을 말한다. 통상 정의되는 바와 같이, "기생충"은 "숙주"로서 기재된 다른 생물 (예컨대, 식물, 동물 또는 인간) 내에서 생존 또는 성장하거나 이를 먹고 산다. 본 명세서 및 특허청구범위에 언급되는 "기생 선충"은 특히 조직을 해치거나 손상시키거나, 식물, 동물 (특히 척추동물) 또는 인간에서 기타 형태의 질환을 일으키는 선충이다.
- [0048] 기생충 "침입"은 식물, 인간 또는 동물에게 위협을 가져오는 기생충이 다수로 존재하는 것을 말한다. 환경, 예를 들어, 인간 또는 동물 사육, 또는 주위 건물 또는 구조물에, 농작물 또는 다른 종류의 식물에, 동물 잠자리에, 동물 등의 피부 또는 털에 존재할 수 있다. 언급된 침입이 동물 내, 예를 들어, 혈액 또는 다른 내부 조직에 있는 경우에는, 용어 "침입"은 또한 달리 언급하지 않는 한, 용어 "감염"과 동의어로 쓰여지는데, 그 용어가 당업계에서 일반적으로 이해되기 때문이다.
- [0049] 본 명세서 및 특허청구범위에 언급되는 용어 "구충의 (parasitocidal)" 및 "구충적으로 (parasitocidally)"는 선충으로부터 식물, 동물 또는 인간을 보호하는 기생 선충에 대한 관찰가능한 효과를 말한다. 구충 효과는 전형적으로 표적 기생 선충의 출현 또는 활성을 감소시키는 것에 관련된다. 선충에 대한 그러한 효과는 피사, 사멸, 성장 지연, 이동성 감소, 또는 숙주 식물, 동물 또는 인간에게, 또는 숙주 식물, 동물 또는 인간 내에 남아 있는 능력의 감소, 섭식 감소 및 번식 억제를 포함한다. 기생 선충에 대한 이러한 효과는 식물, 동물 또는 인간의 기생충 침입 또는 기생충 감염의 구제 (예방, 감소 또는 제거)를 제공한다. 따라서, 기생 선충의 "구제"는 선충에 대한 구충 효과를 달성하는 것을 의미한다. 기생 선충을 구제하기 위한 화학적 화합물의 적용과 관련하여, 어구 "구충적 유효량" 및 "생물학적 유효량"은 기생 선충을 구제하기에 충분한 화합물의 양을 말한다.
- [0050] 용어 "농경학적"은 식품과 섬유와 같은 농작물의 생산을 말하며, 대두 및 기타 콩류, 곡류 (예를 들어, 밀, 귀리, 보리, 호밀, 쌀, 옥수수/corn), 열매류 (예를 들어, 상추, 양배추, 및 기타 평지 작물 (cole crop)), 과채류 (예를 들어, 토마토, 후추, 가지, 십자화과 식물 및 조롱박), 감자, 고구마, 포도, 목화, 나무 열매류 (예를 들어, 인과류 (pome), 핵과류 (stone) 및 감귤류), 작은 과실 (베리류, 체리류) 및 기타 특수 작물 (예를 들어, 카놀라, 해바라기, 올리브)를 포함한다.
- [0051] 용어 "비농경학적"은 농작물 이외의 것, 예컨대 원예 작물 (예를 들어, 경작지에서 재배되지 않는 온실, 묘상 또는 관상용 식물), 주거지용, 농업용, 상업용 및 산업용 구조체, 땃장 (예를 들어, 잔디 농장 (sod farm), 목초지, 골프 코스, 잔디밭, 운동장 등), 목제품, 저장 제품, 산림 농업 및 초목 관리, 공중 보건 (즉, 인간) 및 동물 건강 (예를 들어, 길들여진 동물, 예컨대 애완동물, 가축 및 가금류, 길들여지지 않은 동물, 예컨대 야생 생물) 응용을 말한다.
- [0052] 비농경학적 응용은 전형적으로 수의학적 용도를 위해 제형화된 조성물 형태의 본 발명의 화합물의 구충적 유효량 (즉, 생물학적 유효량)을 보호할 동물에게 투여함으로써 기생 선충으로부터 동물을 보호하는 것을 포함한다.
- [0053] 상기 설명에서, 단독으로 또는 "할로알킬"과 같은 복합어에 사용되는 용어 "알킬"은 직쇄상 또는 분지상 알킬, 예컨대 메틸, 에틸, *n*-프로필, *i*-프로필, 또는 다른 부틸, 펜틸 또는 헥실 이성질체를 포함한다. "알케닐"은 직쇄상 또는 분지상 알켄, 예컨대 에틸렌, 1-프로펜, 2-프로펜, 및 다른 부텐, 펜텐 및 헥센 이성질체를 포함한다. "알케닐"은 또한 폴리엔, 예컨대 1,2-프로파디엔 및 2,4-헥사디엔을 포함한다. "알키닐"은 직쇄상 또는 분지상 알킨, 예컨대 에틸, 1-프로핀, 2-프로핀 및 다른 부틴, 펜틴 및 헥신 이성질체를 포함한다. "알키닐"은 또한 다수의 삼중 결합으로 구성되는 부분, 예컨대 2,5-헥사디이닐을 포함할 수 있다.
- [0054] "알콕시"는 예를 들어, 메톡시, 에톡시, *n*-프로필옥시, 아이소프로필옥시 및 다른 부톡시, 펜톡시 및 헥실옥시 이성질체를 포함한다. "알콕시알킬"은 알킬이 알콕시 치환된 것을 나타낸다. "알콕시알킬"의 예로는 CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 및 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 를 들 수 있다.
- [0055] "사이클로알킬"은 예를 들어, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸 및 사이클로헥실을 포함한다. 용어 "사이클로알킬알킬"은 알킬 부분이 사이클로알킬 치환된 것을 나타낸다. "사이클로알킬알킬"의 예로는 사이클

로프로필메틸, 사이클로펜틸에틸, 및 직쇄상 또는 분지상 알킬기에 결합된 다른 사이클로알킬 부분을 들 수 있다. "사이클로알케닐"은 사이클로펜테닐 및 사이클로헥세닐과 같은 기, 및 1,3- 및 1,4-사이클로헥사디에닐과 같은 2개 이상의 이중 결합을 갖는 기를 포함한다. 용어 "사이클로알킬사이클로알킬"은 다른 사이클로알킬 환이 사이클로알킬 치환된 것을 나타내며, 각 사이클로알킬 환은 독립적으로 3개 내지 7개의 탄소 원자 환 구성원을 갖는다. 사이클로알킬사이클로알킬의 예로는 사이클로프로필사이클로프로필 (예를 들어, 1,1'-바이사이클로프로필-1-일, 1,1'-바이사이클로프로필-2-일), 사이클로헥실사이클로펜틸 (예를 들어, 4-사이클로펜틸사이클로헥실) 및 사이클로헥실사이클로헥실 (예를 들어, 1,1'-바이사이클로헥실-1-일), 및 다른 *시스*- 및 *트랜스*-사이클로알킬사이클로알킬 이성질체 (예를 들어, (1*R*,2*S*)-1,1'-바이사이클로프로필-2-일 및 (1*R*,2*R*)-1,1'-바이사이클로프로필-2-일)를 들 수 있다.

[0056] 단독의 또는 "할로알킬"과 같은 복합어에서의, 또는 "할로겐으로 치환된 알킬"과 같은 설명에서 사용될 때의 용어 "할로겐"은 불소, 염소, 브롬 또는 요오드를 포함한다. 또한, "할로알킬"과 같은 복합어에서의, 또는 "할로겐으로 치환된 알킬"과 같은 설명에서 사용될 때, 상기 알킬은 동일하거나 상이할 수 있는 할로겐 원자로 부분적으로 또는 완전히 치환될 수 있다. "할로알킬" 또는 "할로겐으로 치환된 알킬"의 예로는 F_3C , $ClCH_2$, CF_3CH_2 및 CF_3CCl_2 를 들 수 있다. 용어 "할로알콕시", "할로알케닐", "할로알키닐" 등은 용어 "할로알킬"과 유사하게 정의된다. "할로알콕시"의 예로는 CF_3O , CCl_3CH_2O , $HCF_2CH_2CH_2O$ 및 CF_3CH_2O 를 들 수 있다. "할로알케닐"의 예로는 $(Cl)_2C=CHCH_2$ 및 $CF_3CH_2CH=CHCH_2$ 를 들 수 있다. "할로알키닐"의 예로는 $HC\equiv CCHCl$, $CF_3C\equiv C$, $CCl_3C\equiv C$ 및 $FCH_2C\equiv CCH_2$ 를 들 수 있다.

[0057] 본 명세서에 사용되는 화학 약어 C(O)는 카르보닐 부분을 나타낸다. 예를 들어, $C(O)CH_3$ 는 아세틸기를 나타낸다. 본 명세서에 사용되는 화학 약어 CO_2 및 C(O)O는 에스테르 부분을 나타낸다. 예를 들어, CO_2Me 및 C(O)OMe는 메틸 에스테르를 나타낸다.

[0058] "OCN"은 $-O-C\equiv N$ 을 의미하고, "SCN"은 $-S-C\equiv N$ 을 의미한다.

[0059] 정의 " A^1 , A^2 , A^3 및 A^4 는 독립적으로 N 또는 CR^1 이되, 단, A^1 , A^2 , A^3 및 A^4 중 단 하나만 N이다"는 변수 A^1 , A^2 , A^3 및 A^4 가 네 가지의 가능한 조합, 즉, " A^1 은 N이고 A^2 , A^3 및 A^4 는 독립적으로 CR^1 이거나, A^2 는 N이고 A^1 , A^3 및 A^4 는 독립적으로 CR^1 이거나, A^3 는 N이고 A^1 , A^2 및 A^4 는 독립적으로 CR^1 이거나, A^4 는 N이고 A^1 , A^2 및 A^3 는 독립적으로 CR^1 이다"으로 존재할 수 있음을 의미한다.

[0060] 치환기 중 탄소 원자의 총수는 " C_i-C_j " 접두사로 나타내어지며, 여기서 i 및 j는 1 내지 14의 수이다. C_2 알콕시알킬은 CH_3OCH_2 를 나타내고; C_3 알콕시알킬은, 예를 들어 $CH_3CH(OCH_3)$, $CH_3OCH_2CH_2$ 또는 $CH_3CH_2OCH_2$ 를 나타내며; C_4 알콕시알킬은 총 4개의 탄소 원자를 포함하는 알콕시기로 치환된 알킬기의 다양한 이성질체를 나타내며, 이의 예로는 $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ 및 $CH_3CH_2OCH_2CH_2$ 를 들 수 있다.

[0061] 화합물이 상기 치환기의 수가 1을 초과할 수 있는 것을 나타내는 아래 첨자를 갖는 치환기로 치환되는 경우에는, 상기 치환기 (1개를 초과하는 경우)는 정의된 치환기, 예를 들어, R^1 (여기서, n은 0, 1, 2, 3 또는 4이다) 그룹 중에서 독립적으로 선택된다. 기가 수소일 수 있는 치환기, 예를 들어, R^2 또는 R^3 를 포함하면, 이러한 치환기가 수소로서 취해지는 경우, 이는 비치환된 상기 기와 동등한 것으로 인식된다. 가변 기 (variable group)가 어느 한 위치, 예를 들어 증거 1의 U-29의 $(R^v)_r$ (여기서, r은 0일 수 있다)에 임의로 결합되는 것으로 보여지면, 수소는 가변 기 정의에서 인용되지 않더라도 그 위치에 있을 수 있다. 기의 하나 이상의 위치가 "치환되지 않은" 또는 "비치환된"이라고 하면, 수소 원자는 임의의 자유 원자기를 차지하도록 결합된다.

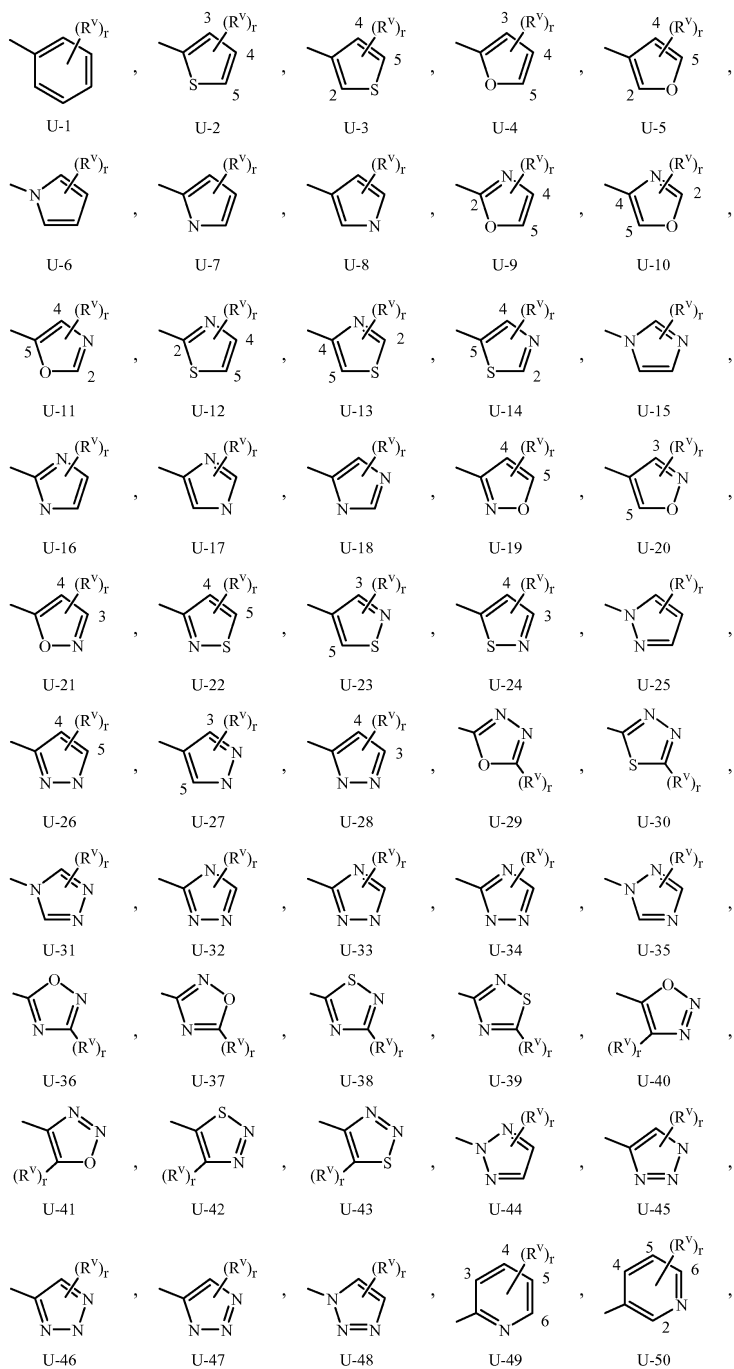
[0062] 달리 명시되지 않는 한, 화학식 1의 성분 (예를 들어, 치환기 Q)으로서의 "환" 또는 "환계"는 탄소환 또는 복소환이다. 용어 "환계"는 2개 이상의 융합 환을 나타낸다. 용어 "복소환"은 환 골격을 형성하는 적어도 하나의 원자가 탄소가 아닌, 예를 들어, 질소, 산소 또는 황인 환을 나타낸다. 전형적으로, 복소환은 4개 이하의 질소, 2개 이하의 산소 및 2개 이하의 황을 포함한다. 달리 명시되지 않는 한, 복소환은 포화, 부분 불포화 또는 완전 불포화 환일 수 있다. 용어 "복소환계"는 환계의 적어도 하나의 환이 복소환인 환계를 나타낸다. 달리 명시되지 않는 한, 복소환 및 복소환계는 탄소 또는 질소 상에서의 수소 치환에 의해 임의의 이용가능한 탄

소 또는 질소를 통해 부착될 수 있다.

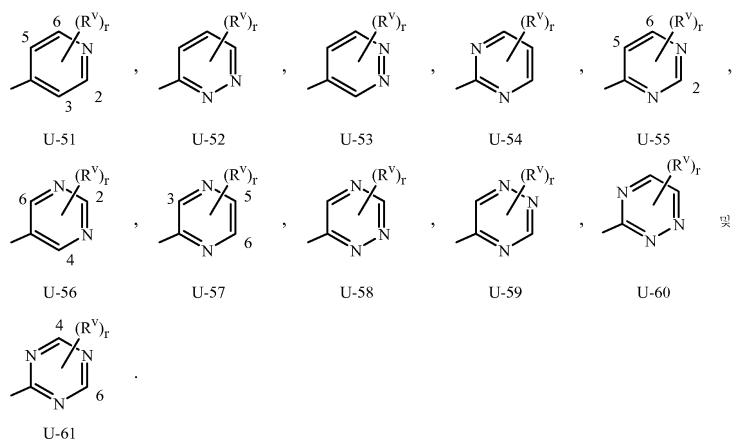
- [0063] "방향족"은 각각의 환 원자가 실질적으로 동일 평면에 있고, 환 평면에 수직인 p -오비탈을 가지며, $(4n + 2) \pi$ 전자 (여기서, n 은 양의 정수이다)가 휘켈 규칙 (Hückel's rule)에 따르도록 환에 결합되어 있는 것을 나타낸다. 완전 불포화 복소환이 휘켈 규칙을 만족시키면, 상기 환은 또한 "헤테로 방향족 환"으로 명명된다. 용어 "방향족 복소환계"는 환계의 적어도 하나의 환이 방향족인 복소환계를 나타낸다.
- [0064] 달리 명시되지 않는 한, 본 명세서에서 사용되는 하기 정의가 적용될 것이다. 용어 "임의로 치환된"은 어구 "치환되거나 비치환된" 또는 용어 "(비)치환된"과 교호적으로 사용된다. 어구 "1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는"은 치환기가 존재하지 않거나 (즉, 비치환된), 1개, 2개, 3개 또는 4개의 치환기가 존재하는 (이용가능한 결합 위치의 수에 의해 한정되는) 것을 의미한다. 달리 명시되지 않는 한, 임의로 치환된 기는 기의 각 치환가능한 위치에서 치환기를 가질 수 있으며, 각 치환은 다른 것과 관계가 없다.
- [0065] 치환기가 5원 또는 6원 질소 함유 헤테로 방향족 환인 경우에는, 달리 기재되지 않는 한, 임의의 이용가능한 탄소 또는 질소 환 원자를 통해 화학식 1의 나머지 부분에 부착될 수 있다.
- [0066] 1개 내지 5개의 치환기로 임의로 치환된 페닐의 예로는 증거 1의 U-1 (여기서, R^v 는 R^1 , R^2 , R^3 또는 Q에 관하여 발명의 요약에 정의된 바와 같고, r 은 0 내지 5의 정수이다)로서 예시된 환이다.
- [0067] 임의로 치환된 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환의 예로는 증거 1에 예시된 환 U-2 내지 U-61 (여기서, R^v 는 R^1 , R^2 , R^3 또는 Q에 관하여 발명의 요약에 정의된 임의의 치환기이고, r 은 각 U 기의 이용가능한 위치의 수로 제한되는 0 내지 4의 정수이다)을 들 수 있다. U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 및 U-43이 단 하나의 이용가능한 위치를 갖기 때문에, 이들 U 기에 있어서의 r 은 0 또는 1의 정수로 제한되며, r 이 0인 것은 U 기가 비치환되고, 수소가 $(R^v)_r$ 로 나타내는 위치에 존재한다는 것을 의미한다.

[0068]

증거 1



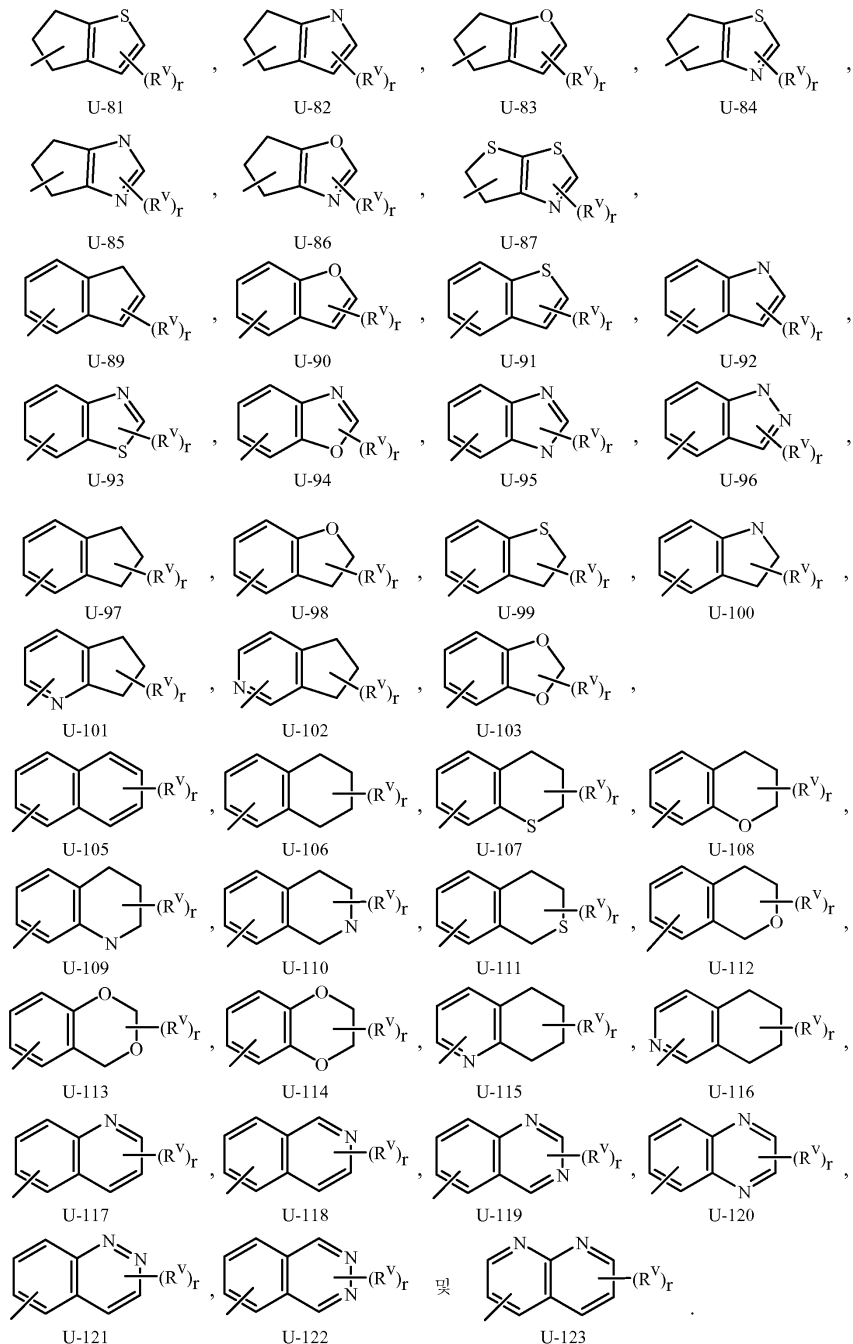
[0069]



[0070]

[0071] 상술한 바와 같이, Q는 발명의 요약에 정의된 치환기의 그룹 중에서 선택되는 치환기로 임의로 치환된 (그 중에서도) 8원 내지 10원 방향족 이환계일 수 있다. 임의로 치환된 8원, 9원 또는 10원 방향족 이환계의 예로는 증거 3에 예시된 환 U-81 내지 U-123 (여기서, R^V 는 Q에 관하여 발명의 요약에 정의된 임의의 치환기이고, r은 전형적으로 0 내지 4의 정수이다)을 들 수 있다.

[0072] 증거 3



[0073]

[0074] R^V 기가 구조 U-1 내지 U-123에 나타나 있지만, 이들이 임의의 치환기이기 때문에, 이들이 존재할 필요가 없다는 것에 주목한다. 이들의 원자가를 채우도록 치환을 요하는 질소 원자는 H 또는 R^V 로 치환된다. $(R^V)_r$ 와 U 기 사이의 부착점이 유동적인 것으로 예시되는 경우에는, $(R^V)_r$ 은 U 기의 임의의 이용가능한 탄소 원자 또는 질소 원자에 부착될 수 있음에 주목한다. U 기의 부착점이 유동적인 것으로 예시되는 경우에는, U 기는 수소 원자의 치환에 의해 U 기의 임의의 이용가능한 탄소 또는 질소를 통해 화학식 1의 나머지 부분에 부착될 수 있음에 주

목한다. 일부의 U 기가 다만 4개 미만의 R^y 기 (예를 들어, U-2 내지 U-5, U-7 내지 U-48, 및 U-52 내지 U-61)로 치환될 수 있음에 주목한다.

[0075] 방향족 및 비방향족 복소환 및 복소환계를 제조할 수 있는 다양한 합성 방법이 당업계에 공지되어 있으며; 광범위한 검토를 위해서는 문헌 [*Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984]의 총 8권 및 문헌 [*Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996]의 총 12권을 참조한다.

[0076] 본 발명의 화합물은 하나 이상의 입체 이성질체로서 존재할 수 있다. 다양한 입체 이성질체는 에난티오머, 다이아스테레오머, 아트로프 이성질체 (atropisomer) 및 기타 이성질체를 포함한다. 당업자는 하나의 입체 이성질체가 다른 이성질체(들)에 비하여 풍부할 때 또는 다른 입체 이성질체(들)로부터 분리될 때 활성이 더 클 수 있고/있거나 유익한 효과를 나타낼 수 있음을 이해할 것이다. 부가적으로, 당업자는 상기 입체 이성체를 분리, 농축, 및/또는 선택적으로 제조하는 방법을 안다. 본 발명의 화합물은 입체 이성질체들의 혼합물, 개별 입체 이성질체 또는 광학 활성 형태로서 존재할 수 있다.

[0077] 화학식 1로부터 선택된 화합물 (이의 모든 입체 이성질체, N-옥사이드 및 염 포함)은 2개 이상의 형태로 존재하므로, 화학식 1은 화학식 1이 나타내는 화합물의 모든 결정질 형태 및 비결정질 형태를 포함한다. 비결정질 형태는 왁스 및 검과 같은 고체인 실시 형태뿐만 아니라, 용액 및 용융물과 같은 액체인 실시 형태도 포함한다. 결정질 형태는 기본적으로 단결정 타입을 나타내는 실시 형태 및 다형체 (즉, 상이한 결정질 타입)의 혼합물을 나타내는 실시 형태를 포함한다. 용어 "다형체"는 상이한 결정질 형태 - 이들 형태는 결정 격자 내에 분자의 상이한 배열 및/또는 배좌를 가짐 - 로 결정화될 수 있는 화학적 화합물의 특정 결정질 형태를 말한다. 다형체는 동일한 화학 조성을 가질 수 있지만, 이는 또한 격자 내에서 약하게 또는 강하게 결합될 수 있는 공결정화된 (co-crystallized) 물 또는 기타 분자의 존재 또는 부재로 인하여 조성이 다를 수 있다. 다형체는 결정의 형상, 밀도, 경도, 색상, 화학적 안정성, 용점, 흡습성, 현탁성, 용해 속도 및 생물학적 이용성과 같은 화학적, 물리적 및 생물학적 특성이 상이할 수 있다. 당업자는 화학식 1로 나타내는 화합물의 다형체가 다른 다형체 또는 화학식 1로 나타내는 동일한 화합물의 다형체의 혼합물에 비해, 유익한 효과 (예를 들어, 유용한 제형의 제조에 대한 적합성, 생물학적 성능 개선)를 나타낼 수 있음을 인지할 것이다. 화학식 1로 나타내는 화합물의 특정 다형체의 제조 및 분리는 예를 들어, 선택된 용매 및 온도를 이용한 결정화를 비롯하여, 당업자에게 공지된 방법에 의해 달성될 수 있다.

[0078] 당업자는 질소가 산화물로의 산화를 위해 이용가능한 고립 전자쌍을 필요로 하므로, 모든 질소 함유 복소환이 N-옥사이드를 형성할 수 있는 것은 아님을 인지할 것이며; 당업자라면 N-옥사이드를 형성할 수 있는 그러한 질소 함유 복소환을 인식할 것이다. 또한, 당업자라면 삼차 아민이 N-옥사이드를 형성할 수 있음을 인식할 것이다. 복소환 및 삼차 아민의 N-옥사이드의 제조에 관한 합성 방법은 퍼옥시산, 예컨대 퍼아세트산 및 3-클로로 퍼벤조산 (MCPBA), 과산화수소, 알킬 하이드로퍼옥사이드, 예컨대 t-부틸 하이드로퍼옥사이드, 과불산나트륨, 및 다이옥시란, 예컨대 다이메틸다이옥시란을 사용한 복소환 및 삼차 아민의 산화를 비롯하여, 당업자에게 공지되어 있다. 이러한 N-옥사이드의 제조 방법은 문헌에 광범위하게 설명 및 검토되어 있으며, 예를 들어, 문헌 [T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press]; 문헌 [M. Tisler and B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press]; 문헌 [M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press]; 문헌 [M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press]; 및 문헌 [G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press]을 참조한다.

[0079] 당업자라면, 당해 환경에서 그리고 생리학적 조건 하에서 화학적 화합물의 염이 이의 대응하는 비염 형태 (nonsalt form)와 평형 상태에 있기 때문에, 염은 비염 형태의 생물학적 유용성을 공유한다는 것을 인지한다. 따라서, 다양한 화학식 1의 화합물의 염은 기생 선충의 구제에 유용하다. 화학식 1의 화합물의 염은 무기 또는 유기 산, 예를 들어 브롬화수소산, 염화수소산, 질산, 인산, 황산, 아세트산, 부티르산, 푸마르산, 락트산, 말레산, 말론산, 옥살산, 프로피온산, 살리실산, 타르타르산, 4-톨루엔설폰산 또는 발레르산과의 산부가염을 포함한다. 화학식 1의 화합물이 산 부분, 예컨대 카르복실산 또는 페놀 또는 설포닐아미드 (예를 들어, R³가 H인

경우)를 함유하는 경우에는, 염은 또한 유기 또는 무기 염기, 예컨대 피리딘, 트라이에틸아민 또는 암모니아와 함께 형성된 염, 또는 나트륨, 칼륨, 리튬, 칼슘, 마그네슘 또는 바륨의 아미드, 수소화물, 수산화물 또는 탄산 염을 포함한다. 따라서, 본 발명은 화학식 1로부터 선택된 화합물, 이의 *N*-옥사이드 및 이의 염을 포함한다.

- [0080] 발명의 요약에 기재된 본 발명의 실시 형태는 하기에 기재된 것을 포함한다. 하기 실시 형태에서, 화학식 1은 이들의 입체 이성질체, *N*-옥사이드 및 염을 포함하며, "화학식 1의 화합물"에 대한 언급은 실시 형태에서 추가로 정의되지 않는 한, 발명의 요약에 규정된 치환기의 정의를 포함한다.
- [0081] 실시 형태 1. Z가 0인 화학식 1의 화합물.
- [0082] 실시 형태 2. Z가 S인 화학식 1의 화합물.
- [0083] 실시 형태 2a. A¹이 N인 화학식 1의 화합물.
- [0084] 실시 형태 2b. A²가 N인 화학식 1의 화합물.
- [0085] 실시 형태 2c. A³가 N인 화학식 1의 화합물.
- [0086] 실시 형태 2d. A⁴가 N인 화학식 1의 화합물.
- [0087] 실시 형태 3. 각 R¹이 독립적으로 할로젠, 시아노, 니트로, OR⁴, C₁-C₆ 알킬 또는 C₁-C₆ 할로알킬인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 2d 중 어느 하나의 화합물.
- [0088] 실시 형태 3a. 각 R¹이 독립적으로 할로젠, C₁-C₆ 할로알킬 또는 C₁-C₆ 할로알콕시 (즉, OR⁴ 및 R⁴가 C₁-C₆ 할로알킬)인 실시 형태 3의 화합물.
- [0089] 실시 형태 3b. 각 R¹이 독립적으로 할로젠 또는 C₁-C₂ 할로알킬인 실시 형태 3a의 화합물.
- [0090] 실시 형태 3c. 각 R¹이 독립적으로 F, Cl, Br 또는 CF₃인 실시 형태 3b의 화합물.
- [0091] 실시 형태 4. Q가 각각 할로젠, 시아노, 니트로, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₄ 알킬, C₂-C₄ 알케닐, C₂-C₄ 알키닐, C₁-C₄ 할로알킬, C₂-C₄ 할로알케닐, C₂-C₆ 알콕시알킬, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(X)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} 및 N(R¹⁰)C(O)R^{7a}로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 3c 중 어느 하나의 화합물.
- [0092] 실시 형태 4a. Q가 각각 할로젠, 시아노, OR^{4a}, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 할로알킬 및 C(O)R^{7b}로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환이고;
- [0093] 각 R^{4a}가 독립적으로 C₁-C₃ 알킬 또는 C₁-C₃ 할로알킬이며;
- [0094] 각 R^{7b}가 독립적으로 C₁-C₃ 알킬인 실시 형태 4의 화합물.
- [0095] 실시 형태 4b. Q가 각각 할로젠, 시아노, 니트로, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₄ 알킬, C₂-C₄ 알케닐, C₂-C₄ 알키닐, C₁-C₄ 할로알킬, C₂-C₄ 할로알케닐, C₂-C₆ 알콕시알킬, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(X)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R^{7a} 및 N(R¹⁰)C(O)R^{7a}로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐, 피리디닐, 피라졸릴, 옥사졸릴, 티아졸릴, 아이속사졸릴, 아이소티아졸릴, 푸라닐 또는 티에닐인 실시 형태 4의 화합물.
- [0096] 실시 형태 4c. Q가 각각 할로젠, 시아노, OR^{4a}, C₁-C₃ 알킬 및 C₁-C₃ 할로알킬로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐, 피리디닐, 피라졸릴, 옥사졸릴, 티아졸릴, 아이속사졸릴, 아이소티아졸릴, 푸라닐 또는 티에닐이고;

- [0097] 각 R^{4a} 가 독립적으로 C_1-C_3 알킬 또는 C_1-C_3 할로알킬인 실시 형태 4b의 화합물.
- [0098] 실시 형태 4d. Q가 할로젠, 시아노, 니트로, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 알킬, C_2-C_4 알케닐, C_2-C_4 알키닐, C_1-C_4 할로알킬, C_2-C_4 할로알케닐, C_2-C_6 알콕시알킬, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ 및 $N(R^{10})C(O)R^{7a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐인 실시 형태 4b의 화합물.
- [0099] 실시 형태 4e. Q가 할로젠, 시아노, OR^{4a} , C_1-C_3 알킬, C_1-C_3 할로알킬 및 $C(O)R^{7b}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐이고;
- [0100] 각 R^{4a} 가 독립적으로 C_1-C_3 알킬 또는 C_1-C_3 할로알킬이며;
- [0101] 각 R^{7b} 가 독립적으로 C_1-C_3 알킬인 실시 형태 4d의 화합물.
- [0102] 실시 형태 4f. Q가 할로젠, 시아노, 니트로, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 알킬, C_2-C_4 알케닐, C_2-C_4 알키닐, C_1-C_4 할로알킬, C_2-C_4 할로알케닐, C_2-C_6 알콕시알킬, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ 및 $N(R^{10})C(O)R^{7a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 피리디닐인 실시 형태 4b의 화합물.
- [0103] 실시 형태 4g. Q가 할로젠, 시아노, OR^{4a} , C_1-C_3 알킬 및 C_1-C_3 할로알킬로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 피리디닐이고;
- [0104] 각 R^{4a} 가 독립적으로 C_1-C_3 알킬 또는 C_1-C_3 할로알킬인 실시 형태 4f의 화합물.
- [0105] 실시 형태 4h. Q가 할로젠, 시아노, 니트로, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 알킬, C_2-C_4 알케닐, C_2-C_4 알키닐, C_1-C_4 할로알킬, C_2-C_4 할로알케닐, C_2-C_6 알콕시알킬, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ 및 $N(R^{10})C(O)R^{7a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 임의로 치환되는 피라졸릴인 실시 형태 4b의 화합물.
- [0106] 실시 형태 4i. Q가 할로젠, 시아노, OR^{4a} , C_1-C_3 알킬 및 C_1-C_3 할로알킬로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 임의로 치환되는 피라졸릴이고;
- [0107] 각 R^{4a} 가 독립적으로 C_1-C_3 알킬 또는 C_1-C_3 할로알킬인 실시 형태 4h의 화합물.
- [0108] 실시 형태 4j. Q가 할로젠, 시아노, 니트로, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 알킬, C_2-C_4 알케닐, C_2-C_4 알키닐, C_1-C_4 할로알킬, C_2-C_4 할로알케닐, C_2-C_6 알콕시알킬, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ 및 $N(R^{10})C(O)R^{7a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 임의로 치환되는 옥사졸릴인 실시 형태 4b의 화합물.
- [0109] 실시 형태 4k. Q가 할로젠, 시아노, OR^{4a} , C_1-C_3 알킬 및 C_1-C_3 할로알킬로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 임의로 치환되는 옥사졸릴이고;
- [0110] 각 R^{4a} 가 독립적으로 C_1-C_3 알킬 또는 C_1-C_3 할로알킬인 실시 형태 4j의 화합물.
- [0111] 실시 형태 4l. Q가 할로젠, 시아노, 니트로, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 알킬, C_2-C_4 알케닐, C_2-C_4 알키닐, C_1-C_4 할로알

킬, C_2-C_4 할로알케닐, C_2-C_6 알콕시알킬, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ 및 $N(R^{10})C(O)R^{7a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 임의로 치환되는 티아졸릴인 실시 형태 4b의 화합물.

[0112] 실시 형태 4m. Q가 할로젠, 시아노, OR^{4a} , C_1-C_3 알킬 및 C_1-C_3 할로알킬로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 임의로 치환되는 티아졸릴이고;

[0113] 각 R^{4a} 가 독립적으로 C_1-C_3 알킬 또는 C_1-C_3 할로알킬인 실시 형태 4l의 화합물.

[0114] 실시 형태 4n. Q가 할로젠, 시아노, 니트로, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 알킬, C_2-C_4 알케닐, C_2-C_4 알키닐, C_1-C_4 할로알킬, C_2-C_4 할로알케닐, C_2-C_6 알콕시알킬, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ 및 $N(R^{10})C(O)R^{7a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 임의로 치환되는 아이속사졸릴인 실시 형태 4b의 화합물.

[0115] 실시 형태 4o. Q가 할로젠, 시아노, OR^{4a} , C_1-C_3 알킬 및 C_1-C_3 할로알킬로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 임의로 치환되는 아이속사졸릴이고;

[0116] 각 R^{4a} 가 독립적으로 C_1-C_3 알킬 또는 C_1-C_3 할로알킬인 실시 형태 4n의 화합물.

[0117] 실시 형태 4p. Q가 할로젠, 시아노, 니트로, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 알킬, C_2-C_4 알케닐, C_2-C_4 알키닐, C_1-C_4 할로알킬, C_2-C_4 할로알케닐, C_2-C_6 알콕시알킬, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ 및 $N(R^{10})C(O)R^{7a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 임의로 치환되는 아이소티아졸릴인 실시 형태 4b의 화합물.

[0118] 실시 형태 4q. Q가 할로젠, 시아노, OR^{4a} , C_1-C_3 알킬 및 C_1-C_3 할로알킬로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 임의로 치환되는 아이소티아졸릴이고;

[0119] 각 R^{4a} 가 독립적으로 C_1-C_3 알킬 또는 C_1-C_3 할로알킬인 실시 형태 4p의 화합물.

[0120] 실시 형태 4r. Q가 할로젠, 시아노, 니트로, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 알킬, C_2-C_4 알케닐, C_2-C_4 알키닐, C_1-C_4 할로알킬, C_2-C_4 할로알케닐, C_2-C_6 알콕시알킬, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ 및 $N(R^{10})C(O)R^{7a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 푸라닐인 실시 형태 4b의 화합물.

[0121] 실시 형태 4s. Q가 할로젠, 시아노, OR^{4a} , C_1-C_3 알킬 및 C_1-C_3 할로알킬로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 푸라닐이고;

[0122] 각 R^{4a} 가 독립적으로 C_1-C_3 알킬 또는 C_1-C_3 할로알킬인 실시 형태 4r의 화합물.

[0123] 실시 형태 4t. Q가 할로젠, 시아노, 니트로, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 알킬, C_2-C_4 알케닐, C_2-C_4 알키닐, C_1-C_4 할로알킬, C_2-C_4 할로알케닐, C_2-C_6 알콕시알킬, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^{7a}$ 및 $N(R^{10})C(O)R^{7a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 티에닐인 실시 형태 4b의 화합물.

[0124] 실시 형태 4u. Q가 할로젠, 시아노, OR^{4a} , C_1-C_3 알킬 및 C_1-C_3 할로알킬로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 임의로 치환되는 티아졸릴인 실시 형태 4b의 화합물.

택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 티에닐이고;

- [0125] 각 R^{4a} 가 독립적으로 C_1-C_3 알킬 또는 C_1-C_3 할로알킬인 실시 형태 4t의 화합물.
- [0126] 실시 형태 4v. Q가 할로젠, 시아노, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 할로알킬, $C(X)R^7$ 및 $C(O)OR^8$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐인 실시 형태 4b의 화합물.
- [0127] 실시 형태 4w. Q가 할로젠, 시아노, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 할로알킬, $C(X)R^7$ 및 $C(O)OR^8$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 피리디닐인 실시 형태 4b의 화합물.
- [0128] 실시 형태 4x. Q가 할로젠, 시아노, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 할로알킬, $C(X)R^7$ 및 $C(O)OR^8$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 푸라닐인 실시 형태 4b의 화합물.
- [0129] 실시 형태 5. R^2 가 H, 할로젠 또는 C_1-C_6 알킬인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 4x 중 어느 하나의 화합물.
- [0130] 실시 형태 5a. R^2 가 H, F, Cl, Br 또는 C_1-C_2 알킬인 실시 형태 5의 화합물.
- [0131] 실시 형태 5b. R^2 가 H, Cl, Br 또는 CH_3 인 실시 형태 5a의 화합물.
- [0132] 실시 형태 5c. R^2 가 H인 실시 형태 5a의 화합물.
- [0133] 실시 형태 6. R^3 가 H, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$ 또는 $S(O)_mR^9$; 또는 1개 또는 2개의 OR^4 로 치환되는 C_1-C_6 알킬인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 5c 중 어느 하나의 화합물.
- [0134] 실시 형태 6a. R^3 가 H 또는 C_1-C_6 알킬인 실시 형태 6의 화합물.
- [0135] 실시 형태 6b. R^3 가 H인 실시 형태 6a의 화합물.
- [0136] 실시 형태 7. R^4 가 H, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 할로알케닐, C_2-C_6 알키닐 또는 C_2-C_6 할로알키닐; 또는 각각 할로젠, 시아노, 니트로, OR^{4a} , $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 할로알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_2-C_6 할로알키닐, $C(X)R^{7a}$, $C(O)OR^{8a}$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^{9a}$ 및 $S(O)_2NR^{11}R^{12}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 치환되는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐 또는 C_2-C_6 알키닐인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 6b 중 어느 하나의 화합물.
- [0137] 실시 형태 8. R^5 가 H, $NR^{5a}R^{6a}$, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 할로알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_2-C_6 할로알키닐, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(O)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$ 또는 $S(O)_2NR^{11}R^{12}$; 또는 각각 할로젠, 시아노, 니트로, C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 할로알킬, OR^{4a} 및 $S(O)_mR^{9a}$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C_3-C_7 사이클로알킬, C_4-C_8 사이클로알킬알킬, C_6-C_{14} 사이클로알킬사이클로알킬 또는 C_5-C_7 사이클로알케닐인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 7 중 어느 하나의 화합물.
- [0138] 실시 형태 9. R^6 가 H, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_2-C_6 알케닐 또는 C_2-C_6 알키닐; 또는 각각 할로젠, 시아노, C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 할로알킬 및 OR^{4a} 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 임의로 치환되는 C_3-C_7 사이클로알킬 또는 C_4-C_8 사이클로알킬알킬인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 8 중 어느 하나의 화합물.
- [0139] 실시 형태 10. R^7 이 H, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 할로알케닐, C_2-C_6 알키닐 또는 C_2-C_6 할

로알킬닐; 또는 각각 할로젠, 시아노, 니트로, C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 할로알킬, OR^{4a} 및 S(O)_mR^{9a}로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C₃-C₇ 사이클로알킬, C₄-C₈ 사이클로알킬알킬, C₆-C₁₄ 사이클로알킬사이클로알킬 또는 C₅-C₇ 사이클로알케닐인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 9 중 어느 하나의 화합물.

[0140] 실시 형태 11. R⁸이 H, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알키닐 또는 C₂-C₆ 할로알킬닐; 각각 할로젠, 시아노, 니트로, C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 할로알킬, OR^{4a} 및 S(O)_mR^{9a}로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C₃-C₇ 사이클로알킬, C₄-C₈ 사이클로알킬알킬, C₆-C₁₄ 사이클로알킬사이클로알킬 또는 C₅-C₇ 사이클로알케닐; 또는 할로젠, 시아노, 니트로, OR^{4a}, NR^{5a}R^{6a}, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알키닐, C₂-C₆ 할로알킬닐, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR^{9a} 및 S(O)₂NR¹¹R¹²로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 치환되는 C₁-C₆ 알킬인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 10 중 어느 하나의 화합물.

[0141] 실시 형태 12. R⁹이 H, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알키닐 또는 C₂-C₆ 할로알킬닐; 또는 할로젠, 시아노, 니트로, OR^{4a}, NR^{5a}R^{6a}, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알키닐, C₂-C₆ 할로알킬닐, C(X)R^{7a}, C(O)OR^{8a}, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR^{9a} 및 S(O)₂NR¹¹R¹²로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 치환되는 C₁-C₆ 알킬인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 11 중 어느 하나의 화합물.

[0142] 실시 형태 13. R¹⁰이 H, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐 또는 C₂-C₆ 알키닐인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 12 중 어느 하나의 화합물.

[0143] 실시 형태 14. R¹⁴이 각각 할로젠, 시아노, 니트로, C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 할로알킬, OR^{4a} 및 S(O)_mR^{9a}로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C₃-C₇ 사이클로알킬, C₄-C₈ 사이클로알킬알킬 또는 C₅-C₇ 사이클로알케닐; 또는 할로젠, 시아노, 니트로, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알키닐, C₂-C₆ 할로알킬닐, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(O)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹ 및 S(O)₂NR¹¹R¹²로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 치환되는 C₁-C₆ 알킬인 화학식 1 또는 실시 형태 1 내지 13 중 어느 하나의 화합물.

[0144] 상기 실시 형태 1 내지 실시 형태 14 및 본 명세서에 기재된 임의의 다른 실시 형태를 비롯한 본 발명의 실시 형태는 임의의 방식으로 조합될 수 있으며, 실시 형태의 변수에 대한 설명은 화학식 1의 화합물에 관한 것일 뿐만 아니라 화학식 1의 화합물의 제조에 유용한 출발 화합물 및 중간 화합물에 관한 것이기도 하다. 게다가, 상기 실시 형태 1 내지 14 및 본 명세서에 기재된 임의의 다른 실시 형태를 비롯한 본 발명의 실시 형태, 및 이들의 임의의 조합은 본 발명의 조성물 및 방법에 관한 것이다.

[0145] 실시 형태 1 내지 14의 조합들이 하기로 예시된다:

[0146] 실시 형태 A1.

[0147] Z가 O이고;

[0148] Q가 각각 할로젠, 시아노, 니트로, OR⁴, NR⁵R⁶, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 할로알케닐, C₂-C₆ 알키닐, C₂-C₆ 할로알킬닐, C(X)R⁷, C(O)OR⁸, C(X)NR¹¹R¹², S(O)_mR⁹, S(O)₂NR¹¹R¹², OC(O)R⁷ 및 N(R¹⁰)C(O)R⁷로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐 또는 5원 또는 6원 헤

테로 방향족 환인 화학식 1의 화합물.

[0149] 실시 형태 A2.

[0150] Q가 각각 할로젠, 시아노, 니트로, OR^4 , NR^5R^6 , C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 할로알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_2-C_6 할로알키닐, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$, $C(X)NR^{11}R^{12}$, $S(O)_mR^9$, $S(O)_2NR^{11}R^{12}$, $OC(O)R^7$ 및 $N(R^{10})C(O)R^7$ 로 구성되는 그룹 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 3개의 치환기로 임의로 치환되는 페닐, 피리디닐, 피라졸릴, 옥사졸릴, 티아졸릴, 아이속사졸릴, 아이소티아졸릴, 푸라닐 또는 티에닐인 실시 형태 A1의 화합물.

[0151] 실시 형태 A3.

[0152] 각 R^1 이 독립적으로 할로젠, 시아노, 니트로, OR^4 , C_1-C_6 알킬 또는 C_1-C_6 할로알킬이고;

[0153] R^2 가 H, 할로젠 또는 C_1-C_6 알킬이며;

[0154] R^3 가 H, $C(X)R^7$, $C(O)OR^8$ 또는 $S(O)_mR^9$; 또는 할로젠 중에서 독립적으로 선택되는 1개 내지 4개의 치환기로 임의로 치환되는 C_1-C_6 알킬인 실시 형태 A2의 화합물.

[0155] 구체적 실시 형태는 하기로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 화학식 1의 화합물을 포함한다:

[0156] N-[(2-클로로-5-메톡시페닐)설폰일]-6-(트라이플루오로메틸)이미다조[1,2-a]피라진-2-카르복사미드;

[0157] 6-브로모-N-[[2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페닐]설폰일]이미다조[1,2-a]피리미딘-2-카르복사미드; 및

[0158] N-[[2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페닐]설폰일]-6-(트라이플루오로메틸)이미다조[1,2-a]피리미딘-2-카르복사미드.

[0159] 본 발명의 화합물이 유리한 대사 및/또는 토양 잔류 패턴을 특징으로 하며, 광범위한 농경학적 및 비농경학적 기생 선충 구제 활성을 나타냄이 주목된다.

[0160] 기생 선충 구제 범위와 경제적 중요성을 이유로, 기생 선충의 구제에 의해 기생 선충으로 인한 피해 또는 손상으로 부터 농경학적 작물을 보호하는 것이 본 발명의 실시 형태임이 특히 주목된다. 본 발명의 화합물은 또한 식물에서의 그의 유리한 전좌(translocation) 특성 또는 조직성(systemicity) 때문에, 화학식 1의 화합물 또는 상기 화합물을 포함하는 조성물과 직접 접촉하지 않는 경엽 또는 다른 식물 부분을 보호한다.

[0161] 상술한 실시 형태 중 임의의 것, 본 명세서에 개시된 임의의 다른 실시 형태, 및 이들의 임의의 조합의 화합물과, 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하며, 임의로 추가로 적어도 하나의 추가의 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제를 포함하는 조성물이 또한 본 발명의 실시 형태로서 주목할 만하다.

[0162] 또한 상술한 실시 형태 중 임의의 것, 본 명세서에 개시된 임의의 다른 실시 형태, 및 이들의 임의의 조합의 화합물과, 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하며, 임의로 추가로 적어도 하나의 추가의 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제를 포함하는 기생 선충 구제용 조성물이 또한 본 발명의 실시 형태로서 주목할 만하다. 본 발명의 실시 형태는 또한 기생 선충 또는 이의 환경을, 상술한 임의의 실시 형태의 화합물(예를 들어, 본 명세서에 기재된 조성물로서)의 생물학적 유효량과 접촉시키는 것을 포함하는 기생 선충 구제 방법을 포함한다.

[0163] 본 발명의 실시 형태는 또한 토양 관주용 액체 제형 형태의 상술한 임의의 실시 형태의 화합물을 포함하는 조성물을 포함한다. 본 발명의 실시 형태는 상술한 임의의 실시 형태의 화합물의 생물학적 유효량을 포함하는 토양 관주액으로서의 액체 조성물과 토양을 접촉시키는 것을 포함하는 기생 선충 구제 방법을 추가로 포함한다.

[0164] 본 발명의 실시 형태는 또한 상술한 임의의 실시 형태의 화합물의 생물학적 유효량 및 추진제를 포함하는 기생 선충 구제용 분무 조성물을 포함한다. 본 발명의 실시 형태는 상술한 임의의 실시 형태의 화합물의 생물학적 유효량, 하나 이상의 식품 재료, 임의로 유인 물질, 및 임의로 습윤제를 포함하는 기생 선충의 구제를 위한 미끼 조성물을 추가로 포함한다.

[0165] 본 발명의 실시 형태는 또한 종자를 상술한 임의의 실시 형태의 화합물의 생물학적 유효량과 접촉시키는 것을

포함하는, 기생 선충으로부터 종자를 보호하는 방법을 포함한다.

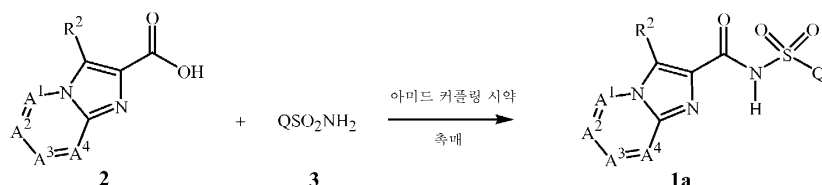
[0166] 본 발명의 실시 형태는 또한 기생 선충 또는 이의 환경을 생물학적 유효량의 화학식 1의 화합물, 이의 *N*-옥사이드 또는 이의 염 (예를 들어, 본 명세서에 기재된 조성물로서)과 접촉시키는 것을 포함하는 기생 선충 구제 방법을 포함하되, 단, 상기 방법은 요법에 의한 인체 또는 동물체의 의학적 치료 방법이 아니다.

[0167] 본 발명은 또한 기생 선충 또는 이의 환경을, 생물학적 유효량의 화학식 1의 화합물, 이의 *N*-옥사이드 또는 이의 염, 및 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가의 성분을 포함하며, 임의로 추가로 생물학적 유효량의 적어도 하나의 추가의 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제를 포함하는 조성물과 접촉시키는 그러한 방법에 관한 것이되, 단, 상기 방법은 요법에 의한 인체 또는 동물체의 의학적 치료 방법이 아니다.

[0168] 반응 도식 1 내지 8에 기재된 하나 이상의 하기 방법 및 변형법이 화학식 1의 화합물을 제조하는데 사용될 수 있다. 하기 화학식 1 내지 10의 화합물에서의 Z, Q, R¹, R² 및 R³의 정의는 달리 언급하지 않는 한, 발명의 요약에 상기에서 정의한 바와 같다. 화학식 1a 내지 1c는 다양한 화학식 1의 서브세트이고, 화학식 2a 내지 2d는 다양한 화학식 2의 서브세트이며, 화학식 4a 내지 4d는 다양한 화학식 4의 서브세트이고, 화학식 5a 내지 5d는 다양한 화학식 5의 서브세트이며, 화학식 7a 내지 7d는 다양한 화학식 7의 서브세트이며, 화학식 1a 내지 1c, 2a 내지 2d, 4a 내지 4d, 5a 내지 5d 및 7a 내지 7d에 대한 모든 치환기는 달리 명시되지 않는 한, 각각 화학식 1, 2, 4, 5 및 7에 대하여 상기에서 정의한 바와 같다. 실온은 약 20 내지 25℃이다.

[0169] 화학식 1a (즉, Z가 산소이고, R³가 H인 화학식 1)의 화합물은 반응 도식 1에 나타난 바와 같이, 화학식 2의 카르복실산과 화학식 3의 아릴 또는 헤테로아릴 설폰아미드의 반응에 의해 제조될 수 있다. 전형적으로, 아미드 커플링 시약 및 촉매, 예컨대 *N,N*-다이메틸아미노피리딘 (DMAP)이 사용된다. 아미드 커플링 시약으로는 1-에틸-3-(3-다이메틸아미노프로필)카르보다이이미드 하이드로클로라이드 (EDC), *N,N'*-다이사이클로헥실카르보다이이미드 (DCC) 및 1,1'-카르보닐다이이미다졸 (CDI)을 들 수 있다. 반응은 실온 내지 용매의 환류 온도의 범위의 온도에서 행해질 수 있다. 전형적인 용매로는 알코올, 에테르, 에스테르, 아미드 및 할로젠화 탄화수소를 들 수 있다. 합성에 1 및 합성에 3의 단계 C는 *t*-부탄올과 다이클로로메탄의 용매 혼합물 중에서 EDC/DMAP를 사용한 조건 중 특히 유용한 세트를 기재하고 있다.

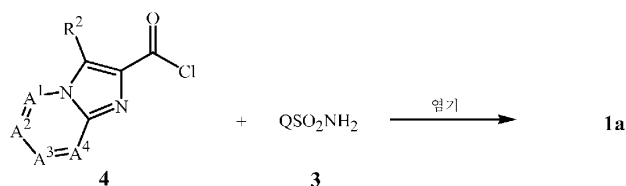
[0170] 반응 도식 1



[0171]

[0172] 화학식 1a의 화합물은 또한 반응 도식 2에 나타난 바와 같이, 화학식 4의 카르복실산 클로라이드와 화학식 3의 아릴 또는 헤테로아릴 설폰아미드의 반응에 의해 제조될 수 있다. 상기 반응은 전형적으로 용매의 존재하에서의 염기, 예컨대 트라이알킬아민 또는 피리딘 및 임의로 촉매, 예컨대 DMAP의 사용을 포함한다. 반응은 실온 내지 용매의 환류 온도의 범위의 온도에서 행해질 수 있다. 전형적인 용매로는 아세트니트릴, 테트라하이드로푸란, 다이에틸 에테르, 아세트산에틸, 톨루엔, 염화메틸렌 및 클로로포름을 들 수 있다.

[0173] 반응 도식 2

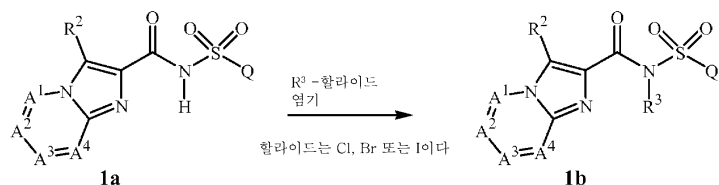


[0174]

[0175] R³가 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 알키닐 또는 사이클로알킬인 화학식 1b의 화합물은 반응 도식 3에 나타난 바와 같이, 화학식 1a의 화합물과 적절히 치환된 알킬, 알케닐, 알키닐 또는 사이클로알킬 할라이드 및 염기의 반응에 의해 제조될 수 있다. 전형적인 반응 조건은 실온 내지 100℃의 범위의 온도에서 염기로서의 탄산칼륨 및

용매로서의 *N,N*-다이메틸포름아미드 (DMF)를 포함한다.

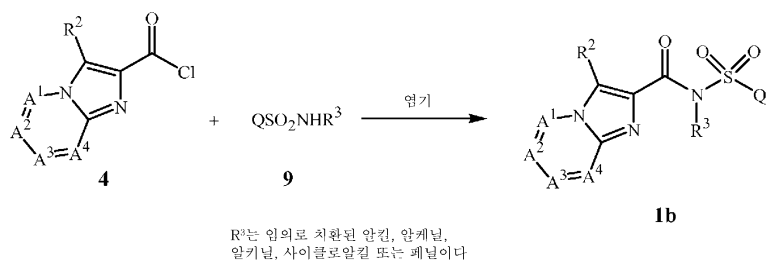
반응 도식 3



R^3 가 C(X)R^7 , C(O)OR^8 , $\text{C(O)NR}^{11,12}$, $\text{S(O)}_2\text{R}^9$ 또는 $\text{S(O)}_2\text{NR}^{11,12}$ 인 화학식 1b의 화합물은 당업계에 공지된 아실화 또는 설폰화 방법에 의해 화학식 1a의 화합물과 아실 또는 설폰 할라이드 (예를 들어, ClC(X)R^7 , ClC(O)OR^8 , $\text{ClC(O)NR}^{11,12}$, $\text{ClS(O)}_2\text{R}^9$ 또는 $\text{ClS(O)}_2\text{NR}^{11,12}$)의 반응에 의해 제조될 수 있다.

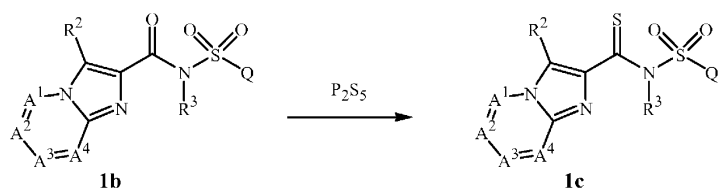
R^3 가 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 알키닐, 사이클로알킬 또는 페닐인 화학식 1b의 화합물은 반응 도식 4에 나타낸 바와 같이, 화학식 4의 산염화물과 화학식 9의 설폰아미드의 반응에 의해 제조될 수 있다. 대안적으로, R^3 가 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 알키닐, 사이클로알킬 또는 페닐인 화학식 1b의 화합물은 반응 도식 1의 방법에 의해, 화학식 2의 카르복실산과 화학식 9의 설폰아미드의 반응에 의해 제조될 수 있다.

반응 도식 4



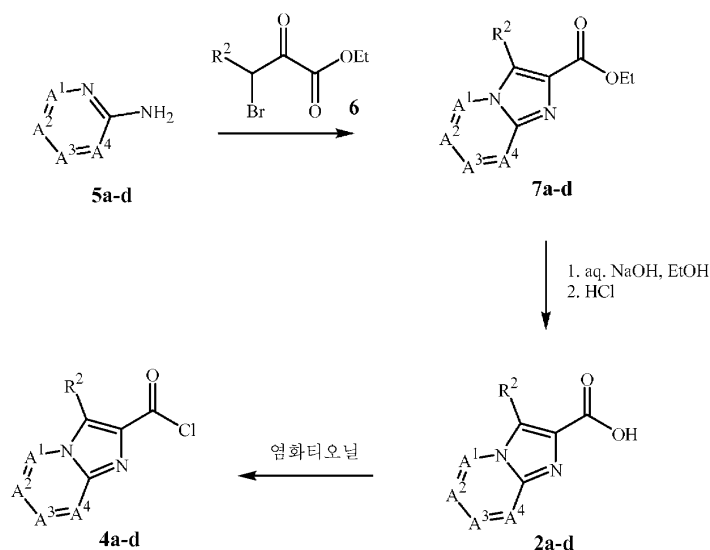
화학식 1c (즉, Z가 황인 화학식 1)의 티오아미드는 반응 도식 5에 나타낸 바와 같이, 화학식 1b (즉, X가 O인 화학식 1)의 화합물과 티오네이션 시약, 예컨대 오황화인 또는 로손 시약 (Lawesson's reagent)의 반응에 의해 제조될 수 있다.

반응 도식 5



화학식 2a-d의 카르복실산 및 화학식 4a-d의 산염화물은 반응 도식 6에 나타낸 방법에 의해 제조될 수 있다. 실온 내지 용매의 비점의 범위의 온도에서의 화학식 5a-d의 적절히 치환된 2-아미노다이아진과, 화학식 6 (여기서, R^2 는 H, 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 알키닐, C(O)R^7 , C(O)OR^8 또는 $\text{C(O)NR}^{11,12}$, 또는 임의로 치환된 페닐, 나프탈레닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환이다)의 2-브로모피루베이트의 반응에 의해, 화학식 7a-d의 카르복실산 에스테르가 얻어진다.

[0186] 반응 도식 6



화학식 2a, 4a, 5a 및 7a의 화합물의 경우: A⁴는 N이고, A¹, A² 및 A³는 CR¹이다.
 화학식 2b, 4b, 5b 및 7b의 화합물의 경우: A³는 N이고, A¹, A² 및 A⁴는 CR¹이다.
 화학식 2c, 4c, 5c 및 7c의 화합물의 경우: A²는 N이고, A¹, A³ 및 A⁴는 CR¹이다.
 화학식 2d, 4d, 5d 및 7d의 화합물의 경우: A¹은 N이고, A², A³ 및 A⁴는 CR¹이다.

[0187]

[0188]

화학식 7a-d의 에스테르를 수산화물 염기, 예컨대 수산화나트륨 수용액 및 수혼화성 용매, 예컨대 에탄올로 처리한 후에, 염산과 같은 산으로 산성화시키면, 화학식 2a-d의 카르복실산으로 가수분해된다. 화학식 2a-d의 카르복실산은 공지된 통상적인 방법, 예컨대 다이클로로메탄, 다이클로로에탄, 톨루엔 및 아세트산에틸을 포함한 약간 극성인 비프로톤성 용매 중에서 촉매량의 *N,N*-다이메틸포름아미드 (DMF)와 함께 염화티오닐 또는 염화옥살릴로 처리하여, 화학식 4a-d의 산염화물로 전환될 수 있다.

[0189]

화학식 6의 브로모피루베이트는 시판 중이거나 임의로 치환된 피루베이트 또는 락테이트 (알파-하이드록시 에스테르)의 브로마를 비롯한 다양한 공지의 합성 방법에 의해 제조될 수 있다. 전형적인 반응 조건은 브롬 (예를 들어, 문헌 [JACS 1944, 66, 1656-1659] 참조) 또는 아세트산에틸/클로로포름 중에서의 CuBr₂ (예를 들어, 문헌 [JOC 2002, 67(4), 1102-1108] 참조)를 이용한 직접 브로마, 또는 CCl₄ 중에서의 락테이트와 *N*-브로모석신이미드의 반응 (예를 들어, 문헌 [JACS 1954, 76, 5796-5797] 참조)을 포함한다. R²가 H 이외의 것인 화학식 6의 브로모피루베이트는 또한 당업계에 공지된 방법 (예를 들어, 친전자성 방법, 예컨대 각각, 브로미기 또는 니트로기를 도입하기 위한 브로마 또는 니트로화, 및 필요에 따라, 이들 치환기의 추가의 정교화 (elaboration))에 의해 제조될 수 있다.

[0190]

화학식 7a의 화합물의 제조에 관한 대표적인 절차는 하기 참고문헌에 개시되어 있다: 문헌 [Organic Letters 2010, 12(3), 412-415]; 문헌 [Journal of Combinatorial Chemistry 2006, 8(5), 659-663]; 문헌 [European Journal of Medicinal Chemistry 1991, 26(1), 13-18]; 및 문헌 [J Med. Chem. 1991, 34, 2020-2067].

[0191]

화학식 7b의 화합물의 제조에 관한 대표적인 절차는 하기 참고문헌에 개시되어 있다: 문헌 [European Journal of Medicinal Chemistry 1983, 18(5), 413-417]; 및 문헌 [Farmaco, Edizione Scientifica 1981, 36(1), 61-80].

[0192]

화학식 7c의 화합물의 제조에 관한 대표적인 절차는 하기 참고문헌에 개시되어 있다: 문헌 [Bioorganic and Medicinal Chemistry 2009, 17(13), 4448-4458]; 및 문헌 [Farmaco, Edizione Scientifica 1980, 35(8), 654-673].

[0193]

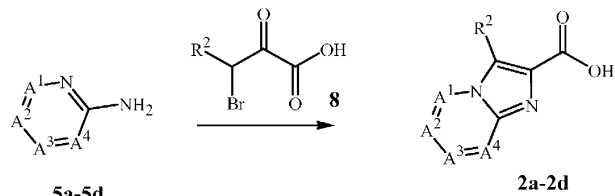
화학식 7d의 화합물의 제조에 관한 대표적인 절차는 하기 참고문헌에 개시되어 있다: 문헌 [J. Het Chem. 2002, 39(4), 737-742]; 및 문헌 [J. Het Chem. 1968, 5(1), 35-39].

[0194]

대안적으로, 화학식 2a-d의 카르복실산은 반응 도식 7에 나타난 반응에 의해 직접 제조될 수 있다. 실은 내지

용매의 비점의 범위의 온도에서의 화학식 5a-d의 적절히 치환된 2-아미노다리아진과, 화학식 8 (여기서, R²는 H, 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 알키닐, C(O)R⁷, C(O)OR⁸ 또는 C(O)NR¹¹R¹², 또는 임의로 치환된 페닐, 나프탈레닐 또는 5원 또는 6원 헤테로 방향족 환이다)의 2-브로모피루베이트의 반응에 의해, 화학식 2a-d의 카르복실산이 얻어지며, 초기에 하이드로브로마이드 염으로서 분리될 수 있다.

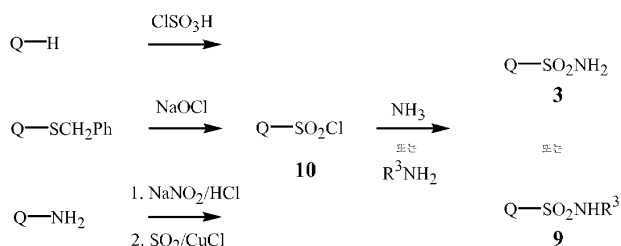
[0195] 반응 도식 7



[0196]

[0197] 다수의 화학식 3 및 9의 설폰아미드는 화학 문헌에 공지되어 있거나 시판 중이다. 반응 도식 8에 나타난 바와 같이, 화학식 3의 설폰아미드는 화학식 10의 대응하는 설폰일 클로라이드로부터 암모니아와의 반응에 의해 용이하게 제조되지만, 화학식 9의 설폰아미드는 화학식 10의 대응하는 설폰일 클로라이드로부터 R³NH₂와의 반응에 의해 용이하게 제조된다. 설폰일 클로라이드 중간체는 시판 중이거나, 문헌에 공지된 다양한 방법에 의해 제조될 수 있다. 가장 통상적인 제조 방법 중 세가지는 반응 도식 8에 나타나 있으며, (a) 클로로설폰산을 사용한 방향족 및 헤테로 방향족계의 직접 클로로설폰화, (b) 염산 존재하에서의 황화물의 산화 (예를 들어, 차아염소산나트륨을 사용함), 및 (c) 방향족 및 헤테로 방향족 아민의 다이아조화 및 클로로설폰화를 포함한다. 이들 세가지 방법은 다만 예시하기 위한 것으로; 설폰일 클로라이드 및 설폰아미드의 제조를 위해 다양한 기타 합성 방법이 이용가능하다.

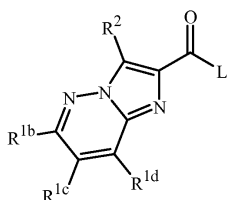
[0198] 반응 도식 8



[0199]

[0200] 본 발명의 화합물의 제조에 유용한 중간체의 예는 표 I-1 내지 I-4에 나타난다. 하기 약어는 하기 표에 사용된다: Me는 메틸을 의미하고, Et는 에틸을 의미하며, *i*-Pr은 아이소프로필을 의미하고, *n*-Pr은 노르말 프로필을 의미하며, OMe는 메톡시를 의미하고, SMe는 티오메톡시를 의미한다.

[0201] [표 I-1]



R^{1c}는 H이다.

R ^{1b}	R ^{1d}	R ²	L	R ^{1b}	R ^{1d}	R ²	L
H	H	H	Cl	CF ₃	H	H	Cl
H	H	H	OH	CF ₃	H	H	OH
H	H	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃
H	H	CH ₃	Cl	CF ₃	H	CH ₃	Cl

[0202]

<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>
H	H	CH ₃	OH	CF ₃	H	CH ₃	OH
H	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	H	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl	Cl
H	H	Cl	OH	CF ₃	H	Cl	OH
H	H	Cl	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
H	H	Br	Cl	CF ₃	H	Br	Cl
H	H	Br	OH	CF ₃	H	Br	OH
H	H	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	Br	OCH ₂ CH ₃
H	F	H	Cl	CF ₃	F	H	Cl
H	F	H	OH	CF ₃	F	H	OH
H	F	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	F	H	OCH ₂ CH ₃
H	F	CH ₃	Cl	CF ₃	F	CH ₃	Cl
H	F	CH ₃	OH	CF ₃	F	CH ₃	OH
H	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	F	Cl	Cl	CF ₃	F	Cl	Cl
H	F	Cl	OH	CF ₃	F	Cl	OH
H	F	Cl	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	F	Cl	OCH ₂ CH ₃
H	F	Br	Cl	CF ₃	F	Br	Cl
H	F	Br	OH	CF ₃	F	Br	OH
H	F	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	F	Br	OCH ₂ CH ₃
H	Cl	H	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl
H	Cl	H	OH	CF ₃	Cl	H	OH
H	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Cl	H	OCH ₂ CH ₃
H	Cl	CH ₃	Cl	CF ₃	Cl	CH ₃	Cl
H	Cl	CH ₃	OH	CF ₃	Cl	CH ₃	OH
H	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	Cl	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Cl	Cl
H	Cl	Cl	OH	CF ₃	Cl	Cl	OH
H	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
H	Cl	Br	Cl	CF ₃	Cl	Br	Cl
H	Cl	Br	OH	CF ₃	Cl	Br	OH
H	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃
H	Br	H	Cl	CF ₃	Br	H	Cl
H	Br	H	OH	CF ₃	Br	H	OH
H	Br	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Br	H	OCH ₂ CH ₃
H	Br	CH ₃	Cl	CF ₃	Br	CH ₃	Cl
H	Br	CH ₃	OH	CF ₃	Br	CH ₃	OH

[0203]

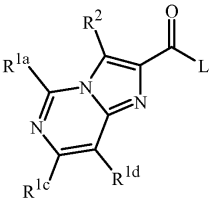
<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>
H	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	Br	Cl	Cl	CF ₃	Br	Cl	Cl
H	Br	Cl	OH	CF ₃	Br	Cl	OH
H	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃
H	Br	Br	Cl	CF ₃	Br	Br	Cl
H	Br	Br	OH	CF ₃	Br	Br	OH
H	Br	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Br	Br	OCH ₂ CH ₃
Cl	H	H	Cl	Br	H	H	Cl
Cl	H	H	OH	Br	H	H	OH
Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	Br	H	H	OCH ₂ CH ₃
Cl	H	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₃	Cl
Cl	H	CH ₃	OH	Br	H	CH ₃	OH
Cl	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	Br	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Cl	H	Cl	Cl	Br	H	Cl	Cl
Cl	H	Cl	OH	Br	H	Cl	OH
Cl	H	Cl	OCH ₂ CH ₃	Br	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
Cl	H	Br	Cl	Br	H	Br	Cl
Cl	H	Br	OH	Br	H	Br	OH
Cl	H	Br	OCH ₂ CH ₃	Br	H	Br	OCH ₂ CH ₃
Cl	F	H	Cl	Br	F	H	Cl
Cl	F	H	OH	Br	F	H	OH
Cl	F	H	OCH ₂ CH ₃	Br	F	H	OCH ₂ CH ₃
Cl	F	CH ₃	Cl	Br	F	CH ₃	Cl
Cl	F	CH ₃	OH	Br	F	CH ₃	OH
Cl	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	Br	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Cl	F	Cl	Cl	Br	F	Cl	Cl
Cl	F	Cl	OH	Br	F	Cl	OH
Cl	F	Cl	OCH ₂ CH ₃	Br	F	Cl	OCH ₂ CH ₃
Cl	F	Br	Cl	Br	F	Br	Cl
Cl	F	Br	OH	Br	F	Br	OH
Cl	F	Br	OCH ₂ CH ₃	Br	F	Br	OCH ₂ CH ₃
Cl	Cl	H	Cl	Br	Cl	H	Cl
Cl	Cl	H	OH	Br	Cl	H	OH
Cl	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	Br	Cl	H	OCH ₂ CH ₃
Cl	Cl	CH ₃	Cl	Br	Cl	CH ₃	Cl
Cl	Cl	CH ₃	OH	Br	Cl	CH ₃	OH
Cl	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	Br	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃

[0204]

<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>
Cl	Cl	Cl	Cl	Br	Cl	Cl	Cl
Cl	Cl	Cl	OH	Br	Cl	Cl	OH
Cl	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃	Br	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
Cl	Cl	Br	Cl	Br	Cl	Br	Cl
Cl	Cl	Br	OH	Br	Cl	Br	OH
Cl	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃	Br	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃
Cl	Br	H	Cl	Br	Br	H	Cl
Cl	Br	H	OH	Br	Br	H	OH
Cl	Br	H	OCH ₂ CH ₃	Br	Br	H	OCH ₂ CH ₃
Cl	Br	CH ₃	Cl	Br	Br	CH ₃	Cl
Cl	Br	CH ₃	OH	Br	Br	CH ₃	OH
Cl	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	Br	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Cl	Br	Cl	Cl	Br	Br	Cl	Cl
Cl	Br	Cl	OH	Br	Br	Cl	OH
Cl	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃	Br	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃
Cl	Br	Br	Cl	Br	Br	Br	Cl
Cl	Br	Br	OH	Br	Br	Br	OH
Cl	Br	Br	OCH ₂ CH ₃	Br	Br	Br	OCH ₂ CH ₃

[0205]

[0206] [표 I-2]

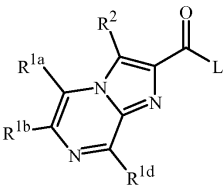


R^{1a}는 H이고; R^{1d}는 H이다.

<u>R^{1c}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>	<u>R^{1c}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>
H	H	Cl	Cl	H	Cl
H	H	OH	Cl	H	OH
H	H	OCH ₂ CH ₃	Cl	H	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃	Cl
H	CH ₃	OH	Cl	CH ₃	OH
H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
H	Cl	OH	Cl	Cl	OH
H	Cl	OCH ₂ CH ₃	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
H	Br	Cl	Cl	Br	Cl
H	Br	OH	Cl	Br	OH
H	Br	OCH ₂ CH ₃	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃
Br	H	Cl			
Br	H	OH			
Br	H	OCH ₂ CH ₃			
Br	CH ₃	Cl			
Br	CH ₃	OH			
Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃			
Br	Cl	Cl			
Br	Cl	OH			
Br	Cl	OCH ₂ CH ₃			
Br	Br	Cl			
Br	Br	OH			
Br	Br	OCH ₂ CH ₃			

[0207]

[0208] [표 I-3]



R^{1a}는 H이다.

<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>
H	H	H	Cl	CF ₃	H	H	Cl
H	H	H	OH	CF ₃	H	H	OH
H	H	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃
H	H	CH ₃	Cl	CF ₃	H	CH ₃	Cl
H	H	CH ₃	OH	CF ₃	H	CH ₃	OH
H	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	H	Cl	Cl	CF ₃	H	Cl	Cl
H	H	Cl	OH	CF ₃	H	Cl	OH

[0209]

<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>
H	H	Cl	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
H	H	Br	Cl	CF ₃	H	Br	Cl
H	H	Br	OH	CF ₃	H	Br	OH
H	H	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	Br	OCH ₂ CH ₃
H	F	H	Cl	CF ₃	F	H	Cl
H	F	H	OH	CF ₃	F	H	OH
H	F	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	F	H	OCH ₂ CH ₃
H	F	CH ₃	Cl	CF ₃	F	CH ₃	Cl
H	F	CH ₃	OH	CF ₃	F	CH ₃	OH
H	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	F	Cl	Cl	CF ₃	F	Cl	Cl
H	F	Cl	OH	CF ₃	F	Cl	OH
H	F	Cl	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	F	Cl	OCH ₂ CH ₃
H	F	Br	Cl	CF ₃	F	Br	Cl
H	F	Br	OH	CF ₃	F	Br	OH
H	F	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	F	Br	OCH ₂ CH ₃
H	Cl	H	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl
H	Cl	H	OH	CF ₃	Cl	H	OH
H	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Cl	H	OCH ₂ CH ₃
H	Cl	CH ₃	Cl	CF ₃	Cl	CH ₃	Cl
H	Cl	CH ₃	OH	CF ₃	Cl	CH ₃	OH
H	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	Cl	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Cl	Cl
H	Cl	Cl	OH	CF ₃	Cl	Cl	OH
H	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
H	Cl	Br	Cl	CF ₃	Cl	Br	Cl
H	Cl	Br	OH	CF ₃	Cl	Br	OH
H	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃
H	Br	H	Cl	CF ₃	Br	H	Cl
H	Br	H	OH	CF ₃	Br	H	OH
H	Br	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Br	H	OCH ₂ CH ₃
H	Br	CH ₃	Cl	CF ₃	Br	CH ₃	Cl
H	Br	CH ₃	OH	CF ₃	Br	CH ₃	OH
H	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	Br	Cl	Cl	CF ₃	Br	Cl	Cl
H	Br	Cl	OH	CF ₃	Br	Cl	OH
H	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃

[0210]

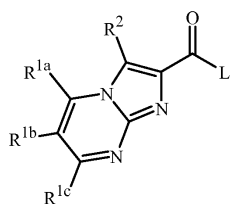
<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>
H	Br	Br	Cl	CF ₃	Br	Br	Cl
H	Br	Br	OH	CF ₃	Br	Br	OH
H	Br	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Br	Br	OCH ₂ CH ₃
Cl	H	H	Cl	Br	H	H	Cl
Cl	H	H	OH	Br	H	H	OH
Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	Br	H	H	OCH ₂ CH ₃
Cl	H	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₃	Cl
Cl	H	CH ₃	OH	Br	H	CH ₃	OH
Cl	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	Br	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Cl	H	Cl	Cl	Br	H	Cl	Cl
Cl	H	Cl	OH	Br	H	Cl	OH
Cl	H	Cl	OCH ₂ CH ₃	Br	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
Cl	H	Br	Cl	Br	H	Br	Cl
Cl	H	Br	OH	Br	H	Br	OH
Cl	H	Br	OCH ₂ CH ₃	Br	H	Br	OCH ₂ CH ₃
Cl	F	H	Cl	Br	F	H	Cl
Cl	F	H	OH	Br	F	H	OH
Cl	F	H	OCH ₂ CH ₃	Br	F	H	OCH ₂ CH ₃
Cl	F	CH ₃	Cl	Br	F	CH ₃	Cl
Cl	F	CH ₃	OH	Br	F	CH ₃	OH
Cl	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	Br	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Cl	F	Cl	Cl	Br	F	Cl	Cl
Cl	F	Cl	OH	Br	F	Cl	OH
Cl	F	Cl	OCH ₂ CH ₃	Br	F	Cl	OCH ₂ CH ₃
Cl	F	Br	Cl	Br	F	Br	Cl
Cl	F	Br	OH	Br	F	Br	OH
Cl	F	Br	OCH ₂ CH ₃	Br	F	Br	OCH ₂ CH ₃
Cl	Cl	H	Cl	Br	Cl	H	Cl
Cl	Cl	H	OH	Br	Cl	H	OH
Cl	Cl	H	OCH ₂ CH ₃	Br	Cl	H	OCH ₂ CH ₃
Cl	Cl	CH ₃	Cl	Br	Cl	CH ₃	Cl
Cl	Cl	CH ₃	OH	Br	Cl	CH ₃	OH
Cl	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	Br	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Cl	Cl	Cl	Cl	Br	Cl	Cl	Cl
Cl	Cl	Cl	OH	Br	Cl	Cl	OH
Cl	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃	Br	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
Cl	Cl	Br	Cl	Br	Cl	Br	Cl

[0211]

<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R^{1d}</u>	<u>R²</u>	<u>L</u>
Cl	Cl	Br	OH	Br	Cl	Br	OH
Cl	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃	Br	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃
Cl	Br	H	Cl	Br	Br	H	Cl
Cl	Br	H	OH	Br	Br	H	OH
Cl	Br	H	OCH ₂ CH ₃	Br	Br	H	OCH ₂ CH ₃
Cl	Br	CH ₃	Cl	Br	Br	CH ₃	Cl
Cl	Br	CH ₃	OH	Br	Br	CH ₃	OH
Cl	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	Br	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Cl	Br	Cl	Cl	Br	Br	Cl	Cl
Cl	Br	Cl	OH	Br	Br	Cl	OH
Cl	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃	Br	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃
Cl	Br	Br	Cl	Br	Br	Br	Cl
Cl	Br	Br	OH	Br	Br	Br	OH
Cl	Br	Br	OCH ₂ CH ₃	Br	Br	Br	OCH ₂ CH ₃

[0212]

[0213] [표 I-4]



R^{1a} 는 H이고; R^{1c} 는 H이다.

R^{1b}	R^2	L	R^{1b}	R^2	L
H	H	Cl	Cl	H	Cl
H	H	OH	Cl	H	OH
H	H	OCH ₂ CH ₃	Cl	H	OCH ₂ CH ₃
H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃	Cl
H	CH ₃	OH	Cl	CH ₃	OH
H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
H	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
H	Cl	OH	Cl	Cl	OH
H	Cl	OCH ₂ CH ₃	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
H	Br	Cl	Cl	Br	Cl
H	Br	OH	Cl	Br	OH
H	Br	OCH ₂ CH ₃	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃
Br	H	Cl	CF ₃	H	Cl
Br	H	OH	CF ₃	H	OH
Br	H	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	OCH ₂ CH ₃
Br	CH ₃	Cl	CF ₃	CH ₃	Cl
Br	CH ₃	OH	CF ₃	CH ₃	OH
Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃
Br	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Cl
Br	Cl	OH	CF ₃	Cl	OH
Br	Cl	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Cl	OCH ₂ CH ₃
Br	Br	Cl	CF ₃	Br	Cl
Br	Br	OH	CF ₃	Br	OH
Br	Br	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Br	OCH ₂ CH ₃

[0214]

[0215]

화학식 1의 화합물을 제조하기 위해 상술한 일부의 시약 및 반응 조건이 중간체에 존재하는 특정한 작용기에 적합하지 않을 수 있는 것으로 인지된다. 이러한 경우에, 합성에 보호/탈보호 시퀀스 또는 작용기 상호 변환을 포함시키는 것이 원하는 생성물을 얻는데 도움이 될 것이다. 보호기의 사용 및 선택은 화학 합성에서의 당업자에게 자명할 것이다 (예를 들어, 문헌 [Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991] 참조). 당업자는 경우에 따라서는, 각각의 반응 도식에 나타낸 바와 같이, 화학식 1의 화합물의 합성을 완료하기 위해, 소정 시약의 도입 후에, 상세히 기재되어 있지 않은 추가의 통상적인 합성 단계를 행할 필요가 있을 수 있음을 인지할 것이다. 당업자는 또한 화학식 1의 화합물을 제조하기 위해 제시된 특정 시퀀스로 나타낸 것과는 다른 순서로 상기 반응 도식에 예시된 단계의 조합을 행할 필요가 있음을 인지할 것이다.

[0216]

당업자는 또한 본 명세서에 기재된 화학식 1의 화합물 및 중간체에 대하여, 치환기를 추가하거나 존재하는 치환기를 변경하도록 다양한 친전자성, 친핵성, 라디칼, 유기 금속, 산화, 및 환원 반응이 행해질 수 있음을 인지할 것이다.

[0217]

더 이상 상술하지 않고도, 상술한 설명을 이용하는 당업자라면 본 발명을 최대한으로 이용할 수 있을 것으로 여겨진다. 그러므로, 하기 합성예는 단순히 예시적인 것으로 그리고 어떠한 임의의 방식으로든 본 개시 내용을 한정하지 않는 것으로 해석되어야 한다. 하기 합성예에서의 단계들은 전체 합성 변환에서의 각각의 단계에 있어서의 절차를 예시하며, 각각의 단계에 있어서의 출발 물질은 그 절차가 다른 실시예 또는 단계에서 설명되는 특정 예비 실행에 의해 제조될 필요는 없을 수도 있다. ¹H NMR 스펙트럼은 테트라메틸실란으로부터의 다운필드 (ppm)로 나타내며; "s"는 싱글렛 (singlet)을 의미하고, "d"는 더블렛 (doublet)을 의미하며, "dd"는 더블렛 오브 더블렛 (doublet of doublets)을 의미하고, "br s"는 브로드 싱글렛을 의미한다. 실온은 약 20 내지 25

℃이다. 화합물 번호는 인덱스 표 A의 화합물을 말한다.

[0218] 합성예 1

[0219] 6-브로모-N-[[2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페닐]설폰닐]이미다조[1,2-a]피리미딘-2-카르복스아미드 (화합물 4)의 제조

[0220] 1,2-다이메톡시에탄 (200 mL) 중의 2-아미노-5-브로모피리미딘 (3.79 g, 21.8 mmol)의 용액에, 브로모피루브산 (3.63 g, 21.8 mmol)을 적가하였다. 반응 혼합물을 30분간 교반한 다음에, 가열하여 환류시켜 18시간 동안 교반하였다. 그 다음에, 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고, 감압하에 농축시켜, 고체를 얻었다. 이 고체를 다이에틸 에테르에 현탁시켜, 현탁액을 여과하여, 1:1 혼합물로서의 6-브로모이미다조[1,2-a]피리미딘-2-카르복실산 하이드로브로마이드 및 6-브로모이미다조[1,2-a]피리미딘-3-카르복실산 하이드로브로마이드를 분리하였다. 이러한 카르복실산 (1.30 g, 5.37 mmol)의 혼합물에, *t*-부탄올 (5 mL) 및 다이클로로메탄 (15 mL) 중의 4-(다이메틸아미노)피리딘 (1.966 g, 16.12 mmol) 및 1-(3-다이메틸아미노프로필)-3-에틸카르보다이이미드 하이드로클로라이드 (3.095 g, 16.12 mmol)의 용액을 첨가하였다. 반응 혼합물을 5분간 교반하고, 2-클로로-5-트라이플루오로메틸벤젠설폰아미드 (1.394 g, 5.374 mmol)를 첨가하여, 반응 혼합물을 실온에서 하룻밤 동안 교반하였다. 그 다음에, 다이클로로메탄 (200 mL)을 첨가하여, 혼합물을 1 N 염산 (1 x 100 mL)으로 추출하고, 분리된 유기상을 황산마그네슘으로 건조시키고, 감압하에 농축시켜, 조고체 (crude solid)를 얻었다. 조고체를 메탄올/다이클로로메탄 그라디언트로 용리하는 실리카 겔 상의 크로마토그래피로 정제하여, 표제 화합물, 본 발명의 화합물인 백색 고체 (m.p. >250℃)로서의 첫번째 용리 이성질체 59.9 mg로서 얻었다. ¹H NMR (CDCl₃) δ 10.10 (br s, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.86 (d, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.09 (dd, 1H), 3.91 (s, 3H).

[0221] 합성예 2

[0222] N-[[2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페닐]설폰닐]-6-(트라이플루오로메틸)이미다조[1,2-a]피리미딘-2-카르복스아미드 (화합물 6)의 제조

[0223] 단계 A: 2-아미노-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘의 제조

[0224] 드라이아이스 냉각기 및 첨가용 깔때기를 갖춘 2-L 플라스크에, 다이메틸설포사이드 (500 mL) 및 다이메틸설포사이드 (400 mL) 중의 0.5 M 황산 용액을 주입한 후에, 2-아미노피리미딘 (20.0 g, 211 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 5분간 격렬하게 교반한 다음에, 물 (60 mL) 중의 1 M 황산철(II) 용액을 첨가하였다. 트라이플루오로메틸 아이오다이드 (200 g, 1.02 mol)를 실온에서 반응 혼합물의 표면 아래에 첨가하였다. 그 다음에 반응 혼합물을 0℃로 냉각시켜, 50% 과산화수소수 (20 mL, 294 mmol)를 1시간에 걸쳐서 적가하였다. 그 다음에, 빙욕을 제거하여, 반응 혼합물을 3시간에 걸쳐서 실온으로 가온시켰다. 그 다음에, 반응 혼합물을 조심스럽게 탄산나트륨 수용액으로 pH 6.5로 중화하였다. 그 후에 반응 혼합물을 아세트산에틸 (3 x 300 mL)로 추출하여, 합한 유기 추출물을 황산마그네슘으로 건조시켜 감압하에 농축시켰다. 생성된 오일을 헥산/아세트산에틸 그라디언트로 용리하는 실리카 겔 상의 크로마토그래피로 정제하여, 회색을 띤 백색 고체로서의 표제 화합물 4.51 g을 얻었다. ¹H NMR (CDCl₃) δ 8.51 (s, 2H), 5.55 (br s, 2H).

[0225] 단계 B: 6-(트라이플루오로메틸)이미다조[1,2-a]피리미딘-2-카르복실산의 HBr 염의 제조

[0226] 단계 A의 생성물 (1.0 g, 6.1 mmol)을 다이옥산 (30 mL) 중의 브로모피루브산 (1.025 g, 6.134 mmol)의 용액에 첨가하여, 반응 혼합물을 24시간 동안 환류하에 가열하였다. 다이옥산을 감압하에 제거하여, 표제 화합물 798 mg을 얻었다. ¹H NMR ((CD₃)₂SO) δ 9.67 (s, 1H), 8.99 (s, 1H), 8.49 (s, 1H), 5.98 (br s, 2H).

[0227] 단계 C: N-[[2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)페닐]설폰닐]-6-(트라이플루오로메틸)이미다조[1,2-a]피리미딘-2-카르복스아미드의 제조

[0228] 단계 B의 생성물 (230 mg, 0.737 mmol)에, *t*-부탄올 (5 mL) 및 다이클로로메탄 (15 mL) 중의 4-(다이메틸아미노)피리딘 (180 mg, 1.47 mmol) 및 1-(3-다이메틸아미노프로필)-3-에틸카르보다이이미드 하이드로클로라이드 (424 mg, 2.21 mmol)의 용액을 첨가하였다. 반응 혼합물을 5분간 교반하고, 2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)벤젠설폰아미드 (191 mg, 0.737 mmol)를 첨가하여, 반응 혼합물을 실온에서 하룻밤 동안 교반하였다. 그 다음에, 다이클로로메탄 (200 mL)을 첨가하여, 혼합물을 1 N 염산 (1 x 100 mL)으로 추출하고, 분리된 유기상을 황

산마그네슘으로 건조시키고, 감압하에 농축시켜, 조고체 (crude solid)를 얻었다. 조고체를 메탄올/다이클로로메탄 그라데이션으로 용리하는 실리카 겔 상의 크로마토그래피로 정제하여, 백색 고체 (m.p. 211-212℃)로서의 표제 화합물, 본 발명의 화합물 27.7 mg을 얻었다. ^1H NMR (CD_3OD) δ 9.50 (s, 1H), 8.79 (s, 1H), 8.37-8.41 (m, 2H), 7.73 (d, 1H), 7.63 (d, 1H).

[0229] 합성예 3

[0230] *N*-(2-클로로-5-메톡시페닐)설폰닐]-6-(트라이플루오로메틸)이미다조[1,2-*a*]피라진-2-카르복사미드 (화합물 1)의 제조

[0231] 단계 A: 6-(트라이플루오로메틸)이미다조[1,2-*a*]피라진-2-카르복실산 에틸 에스테르의 제조

[0232] 1,2-다이메톡시에탄 (10 mL) 중의 2-아미노-5-(트라이플루오로메틸)피라진 (500 mg, 3.07 mmol)의 용액에, 에틸 브로모피루베이트 (0.5 mL, 4.0 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 72시간 동안 60℃로 가온하였다. 그 다음에 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고, 물을 첨가하여 (10 mL), 고체를 침전시켰다. 현탁액을 10분간 교반하고, 여과하여, 분리된 고체를 수세하여, 원하는 에스테르를 얻어, 추가의 건조없이 다음 단계에서 사용하였다. ^1H NMR (CDCl_3) δ 9.22 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 4.50 (q, 2H), 1.47 (t, 3H).

[0233] 단계 B: 6-(트라이플루오로메틸)이미다조[1,2-*a*]피라진-2-카르복실산의 제조

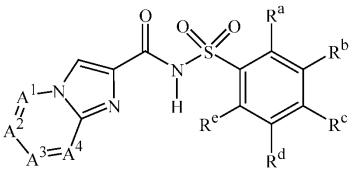
[0234] 단계 A의 생성물을 테트라하이드로푸란 (10 mL)에 용해시키고, 물 (5 mL) 중의 수산화리튬 일수화물 (97 mg, 8.3 mmol)의 용액을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 1시간 동안 교반한 후에 테트라하이드로푸란을 감압하에 회전식 증발기에서 제거하여, 물을 첨가 (5 mL)한 다음에, 1 N HCl (5 mL)을 첨가하였다. 얻어진 현탁액을 유리 프리트 필터 깔때기를 통해 여과하여, 분리된 고체를 수세하여, 질소로 건조시켜, 고체로서의 표제 화합물을 451 mg 얻었다. ^1H NMR ($(\text{CD}_3)_2\text{SO}$) δ 9.33 (s, 1H), 9.30 (s, 1H), 8.69 (s, 1H).

[0235] 단계 C: *N*-(2-클로로-5-메톡시페닐)설폰닐]-6-(트라이플루오로메틸)이미다조[1,2-*a*]피라진-2-카르복사미드의 제조

[0236] 단계 B의 생성물 (120 mg, 0.52 mmol)에, *t*-부탄올 (5 mL) 및 다이클로로메탄 (5 mL) 중의 4-(다이메틸아미노)피리딘 (183 mg, 1.5 mmol) 및 1-(3-다이메틸아미노프로필)-3-에틸카르보다이이미드 하이드로클로라이드 (248 mg, 1.3 mmol)의 용액을 첨가하였다. 반응 혼합물을 15 분간 교반하고, 2-클로로-5-메톡시벤젠설폰아미드 (92 mg, 0.41 mmol)를 첨가하여, 실온에서 하룻밤 동안 연속 교반하였다. 그 다음에, 다이클로로메탄 (100 mL)을 첨가하여, 혼합물을 1 N 염산 (3 x 100 mL)으로 세정하고, 합한 유기상을 황산마그네슘으로 건조시키고 감압하에 농축시켜, 고체를 얻었다. 고체를 다이에틸 에테르로 린스하여, 건조시켜, 백색 고체 (m.p. 236-237℃)로서의 표제 화합물, 본 발명의 화합물 89 mg을 얻었다. ^1H NMR (CDCl_3) δ 9.99 (br s, 1H), 9.23 (s, 1H), 8.56 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.37(d,1H), 7.10 (dd, 1H) 3.91 (s, 3H).

[0237] 당업계에 공지된 방법과 함께 본 명세서에 기재된 절차에 의해, 표 1 내지 22의 하기 화합물이 제조될 수 있다. 하기 약어가 하기 표에 사용된다: Me는 메틸을 의미하고, Et는 에틸을 의미하며, OMe는 메톡시를 의미하고, SMe는 메틸티오를 의미하며, NMe₂는 다이메틸아미노를 의미한다.

[0238] [표 1]



A¹은 N이고, A²는 CCF₃이며, A³ 및 A⁴는 CH이다.

R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	Me	H	H	H	Me	Me	H	H	H
H	Et	H	H	H	Me	Et	H	H	H
H	F	H	H	H	Me	F	H	H	H
H	Cl	H	H	H	Me	Cl	H	H	H
H	Br	H	H	H	Me	Br	H	H	H
H	CF ₃	H	H	H	Me	CF ₃	H	H	H
H	시아노	H	H	H	Me	시아노	H	H	H
H	OMe	H	H	H	Me	OMe	H	H	H
H	SMe	H	H	H	Me	SMe	H	H	H
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	Me	H	H	H	Cl	Me	H	H	H
F	Et	H	H	H	Cl	Et	H	H	H
F	F	H	H	H	Cl	F	H	H	H
F	Cl	H	H	H	Cl	Cl	H	H	H
F	Br	H	H	H	Cl	Br	H	H	H
F	CF ₃	H	H	H	Cl	CF ₃	H	H	H
F	시아노	H	H	H	Cl	시아노	H	H	H
F	OMe	H	H	H	Cl	OMe	H	H	H
F	SMe	H	H	H	Cl	SMe	H	H	H
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	Me	H	H	H	CF ₃	Me	H	H	H
Br	Et	H	H	H	CF ₃	Et	H	H	H
Br	F	H	H	H	CF ₃	F	H	H	H
Br	Cl	H	H	H	CF ₃	Cl	H	H	H

[0239]

Br	Br	H	H	H	CF ₃	Br	H	H	H
Br	CF ₃	H	H	H	CF ₃	CF ₃	H	H	H
Br	시아노	H	H	H	CF ₃	시아노	H	H	H
Br	OMe	H	H	H	CF ₃	OMe	H	H	H
Br	SMe	H	H	H	CF ₃	SMe	H	H	H
시아노	H	H	H	H	시아노	Br	H	H	H
시아노	Me	H	H	H	시아노	CF ₃	H	H	H
시아노	Et	H	H	H	시아노	시아노	H	H	H
시아노	F	H	H	H	시아노	OMe	H	H	H
시아노	Cl	H	H	H	시아노	SMe	H	H	H
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	H	Me	H	H	Me	H	Me	H	H
H	H	Et	H	H	Me	H	Et	H	H
H	H	F	H	H	Me	H	F	H	H
H	H	Cl	H	H	Me	H	Cl	H	H
H	H	Br	H	H	Me	H	Br	H	H
H	H	CF ₃	H	H	Me	H	CF ₃	H	H
H	H	시아노	H	H	Me	H	시아노	H	H
H	H	OMe	H	H	Me	H	OMe	H	H
H	H	SMe	H	H	Me	H	SMe	H	H
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	H	Me	H	H	Cl	H	Me	H	H
F	H	Et	H	H	Cl	H	Et	H	H
F	H	F	H	H	Cl	H	F	H	H
F	H	Cl	H	H	Cl	H	Cl	H	H
F	H	Br	H	H	Cl	H	Br	H	H
F	H	CF ₃	H	H	Cl	H	CF ₃	H	H
F	H	시아노	H	H	Cl	H	시아노	H	H
F	H	OMe	H	H	Cl	H	OMe	H	H
F	H	SMe	H	H	Cl	H	SMe	H	H
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	H	Me	H	H	CF ₃	H	Me	H	H
Br	H	Et	H	H	CF ₃	H	Et	H	H
Br	H	F	H	H	CF ₃	H	F	H	H

[0240]

Br	H	Cl	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H
Br	H	Br	H	H	CF ₃	H	Br	H	H
Br	H	CF ₃	H	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H
Br	H	시아노	H	H	CF ₃	H	시아노	H	H
Br	H	OMe	H	H	CF ₃	H	OMe	H	H
Br	H	SMe	H	H	CF ₃	H	SMe	H	H
시아노	H	H	H	H	시아노	H	Br	H	H
시아노	H	Me	H	H	시아노	H	CF ₃	H	H
시아노	H	Et	H	H	시아노	H	시아노	H	H
시아노	H	F	H	H	시아노	H	OMe	H	H
시아노	H	Cl	H	H	시아노	H	SMe	H	H
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	H	H	Me	H	Me	H	H	Me	H
H	H	H	Et	H	Me	H	H	Et	H
H	H	H	F	H	Me	H	H	F	H
H	H	H	Cl	H	Me	H	H	Cl	H
H	H	H	Br	H	Me	H	H	Br	H
H	H	H	CF ₃	H	Me	H	H	CF ₃	H
H	H	H	시아노	H	Me	H	H	시아노	H
H	H	H	OMe	H	Me	H	H	OMe	H
H	H	H	SMe	H	Me	H	H	SMe	H
H	H	H	CO ₂ Me	H	Me	H	H	CO ₂ Me	H
H	H	H	C(O)Me	H	Me	H	H	C(O)Me	H
H	H	H	NMe ₂	H	Me	H	H	NMe ₂	H
H	H	H	니트로	H	Me	H	H	니트로	H
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	H	H	Me	H	Cl	H	H	Me	H
F	H	H	Et	H	Cl	H	H	Et	H
F	H	H	F	H	Cl	H	H	F	H
F	H	H	Cl	H	Cl	H	H	Cl	H
F	H	H	Br	H	Cl	H	H	Br	H
F	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H	CF ₃	H
F	H	H	시아노	H	Cl	H	H	시아노	H
F	H	H	OMe	H	Cl	H	H	OMe	H

[0241]

F	H	H	SMe	H	Cl	H	H	SMe	H
F	H	H	CO ₂ Me	H	Cl	H	H	CO ₂ Me	H
F	H	H	C(O)Me	H	Cl	H	H	C(O)Me	H
F	H	H	NMe ₂	H	Cl	H	H	NMe ₂	H
F	H	H	니트로	H	Cl	H	H	니트로	H
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	H	H	Me	H	CF ₃	H	H	Me	H
Br	H	H	Et	H	CF ₃	H	H	Et	H
Br	H	H	F	H	CF ₃	H	H	F	H
Br	H	H	Cl	H	CF ₃	H	H	Cl	H
Br	H	H	Br	H	CF ₃	H	H	Br	H
Br	H	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	CF ₃	H
Br	H	H	시아노	H	CF ₃	H	H	시아노	H
Br	H	H	OMe	H	CF ₃	H	H	OMe	H
Br	H	H	SMe	H	CF ₃	H	H	SMe	H
Br	H	H	CO ₂ Me	H	CF ₃	H	H	CO ₂ Me	H
Br	H	H	C(O)Me	H	CF ₃	H	H	C(O)Me	H
Br	H	H	NMe ₂	H	CF ₃	H	H	NMe ₂	H
Br	H	H	니트로	H	CF ₃	H	H	니트로	H
시아노	H	H	H	H	시아노	H	H	시아노	H
시아노	H	H	Me	H	시아노	H	H	OMe	H
시아노	H	H	Et	H	시아노	H	H	SMe	H
시아노	H	H	F	H	시아노	H	H	CO ₂ Me	H
시아노	H	H	Cl	H	시아노	H	H	C(O)Me	H
시아노	H	H	Br	H	시아노	H	H	NMe ₂	H
시아노	H	H	CF ₃	H	시아노	H	H	니트로	H
H	H	Me	H	H	Me	H	Me	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	H	Me	Me	H
H	H	Me	Et	H	Me	H	Me	Et	H
H	H	Me	F	H	Me	H	Me	F	H
H	H	Me	Cl	H	Me	H	Me	Cl	H
H	H	Me	Br	H	Me	H	Me	Br	H
H	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	CF ₃	H
H	H	Me	시아노	H	Me	H	Me	시아노	H

[0242]

H	H	Me	OMe	H	Me	H	Me	OMe	H
H	H	Me	SMe	H	Me	H	Me	SMe	H
H	H	Me	CO ₂ Me	H	Me	H	Me	CO ₂ Me	H
H	H	Me	C(O)Me	H	Me	H	Me	C(O)Me	H
H	H	Me	NMe ₂	H	Me	H	Me	NMe ₂	H
H	H	Me	니트로	H	Me	H	Me	니트로	H
F	H	Me	H	H	Cl	H	Me	H	H
F	H	Me	Me	H	Cl	H	Me	Me	H
F	H	Me	Et	H	Cl	H	Me	Et	H
F	H	Me	F	H	Cl	H	Me	F	H
F	H	Me	Cl	H	Cl	H	Me	Cl	H
F	H	Me	Br	H	Cl	H	Me	Br	H
F	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	CF ₃	H
F	H	Me	시아노	H	Cl	H	Me	시아노	H
F	H	Me	OMe	H	Cl	H	Me	OMe	H
F	H	Me	SMe	H	Cl	H	Me	SMe	H
F	H	Me	CO ₂ Me	H	Cl	H	Me	CO ₂ Me	H
F	H	Me	C(O)Me	H	Cl	H	Me	C(O)Me	H
F	H	Me	NMe ₂	H	Cl	H	Me	NMe ₂	H
F	H	Me	니트로	H	Cl	H	Me	니트로	H
Br	H	Me	H	H	CF ₃	H	Me	H	H
Br	H	Me	Me	H	CF ₃	H	Me	Me	H
Br	H	Me	Et	H	CF ₃	H	Me	Et	H
Br	H	Me	F	H	CF ₃	H	Me	F	H
Br	H	Me	Cl	H	CF ₃	H	Me	Cl	H
Br	H	Me	Br	H	CF ₃	H	Me	Br	H
Br	H	Me	CF ₃	H	CF ₃	H	Me	CF ₃	H
Br	H	Me	시아노	H	CF ₃	H	Me	시아노	H
Br	H	Me	OMe	H	CF ₃	H	Me	OMe	H
Br	H	Me	SMe	H	CF ₃	H	Me	SMe	H
Br	H	Me	CO ₂ Me	H	CF ₃	H	Me	CO ₂ Me	H
Br	H	Me	C(O)Me	H	CF ₃	H	Me	C(O)Me	H
Br	H	Me	NMe ₂	H	CF ₃	H	Me	NMe ₂	H
Br	H	Me	니트로	H	CF ₃	H	Me	니트로	H

[0243]

시아노	H	Me	H	H	시아노	H	Me	시아노	H
시아노	H	Me	Me	H	시아노	H	Me	OMe	H
시아노	H	Me	Et	H	시아노	H	Me	SMe	H
시아노	H	Me	F	H	시아노	H	Me	CO ₂ Me	H
시아노	H	Me	Cl	H	시아노	H	Me	C(O)Me	H
시아노	H	Me	Br	H	시아노	H	Me	NMe ₂	H
시아노	H	Me	CF ₃	H	시아노	H	Me	니트로	H
H	H	Cl	H	H	Me	H	Cl	H	H
H	H	Cl	Me	H	Me	H	Cl	Me	H
H	H	Cl	Et	H	Me	H	Cl	Et	H
H	H	Cl	F	H	Me	H	Cl	F	H
H	H	Cl	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H
H	H	Cl	Br	H	Me	H	Cl	Br	H
H	H	Cl	CF ₃	H	Me	H	Cl	CF ₃	H
H	H	Cl	시아노	H	Me	H	Cl	시아노	H
H	H	Cl	OMe	H	Me	H	Cl	OMe	H
H	H	Cl	SMe	H	Me	H	Cl	SMe	H
H	H	Cl	CO ₂ Me	H	Me	H	Cl	CO ₂ Me	H
H	H	Cl	C(O)Me	H	Me	H	Cl	C(O)Me	H
H	H	Cl	NMe ₂	H	Me	H	Cl	NMe ₂	H
H	H	Cl	니트로	H	Me	H	Cl	니트로	H
F	H	Cl	H	H	Cl	H	Cl	H	H
F	H	Cl	Me	H	Cl	H	Cl	Me	H
F	H	Cl	Et	H	Cl	H	Cl	Et	H
F	H	Cl	F	H	Cl	H	Cl	F	H
F	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H
F	H	Cl	Br	H	Cl	H	Cl	Br	H
F	H	Cl	CF ₃	H	Cl	H	Cl	CF ₃	H
F	H	Cl	시아노	H	Cl	H	Cl	시아노	H
F	H	Cl	OMe	H	Cl	H	Cl	OMe	H
F	H	Cl	SMe	H	Cl	H	Cl	SMe	H
F	H	Cl	CO ₂ Me	H	Cl	H	Cl	CO ₂ Me	H
F	H	Cl	C(O)Me	H	Cl	H	Cl	C(O)Me	H
F	H	Cl	NMe ₂	H	Cl	H	Cl	NMe ₂	H

[0244]

F	H	Cl	니트로	H	Cl	H	Cl	니트로	H
Br	H	Cl	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H
Br	H	Cl	Me	H	CF ₃	H	Cl	Me	H
Br	H	Cl	Et	H	CF ₃	H	Cl	Et	H
Br	H	Cl	F	H	CF ₃	H	Cl	F	H
Br	H	Cl	Cl	H	CF ₃	H	Cl	Cl	H
Br	H	Cl	Br	H	CF ₃	H	Cl	Br	H
Br	H	Cl	CF ₃	H	CF ₃	H	Cl	CF ₃	H
Br	H	Cl	시아노	H	CF ₃	H	Cl	시아노	H
Br	H	Cl	OMe	H	CF ₃	H	Cl	OMe	H
Br	H	Cl	SMe	H	CF ₃	H	Cl	SMe	H
Br	H	Cl	CO ₂ Me	H	CF ₃	H	Cl	CO ₂ Me	H
Br	H	Cl	C(O)Me	H	CF ₃	H	Cl	C(O)Me	H
Br	H	Cl	NMe ₂	H	CF ₃	H	Cl	NMe ₂	H
Br	H	Cl	니트로	H	CF ₃	H	Cl	니트로	H
시아노	H	Cl	H	H	시아노	H	Cl	시아노	H
시아노	H	Cl	Me	H	시아노	H	Cl	OMe	H
시아노	H	Cl	Et	H	시아노	H	Cl	SMe	H
시아노	H	Cl	F	H	시아노	H	Cl	CO ₂ Me	H
시아노	H	Cl	Cl	H	시아노	H	Cl	C(O)Me	H
시아노	H	Cl	Br	H	시아노	H	Cl	NMe ₂	H
시아노	H	Cl	CF ₃	H	시아노	H	Cl	니트로	H
H	H	시아노	H	H	Me	H	시아노	H	H
H	H	시아노	Me	H	Me	H	시아노	Me	H
H	H	시아노	Et	H	Me	H	시아노	Et	H
H	H	시아노	F	H	Me	H	시아노	F	H
H	H	시아노	Cl	H	Me	H	시아노	Cl	H
H	H	시아노	Br	H	Me	H	시아노	Br	H
H	H	시아노	CF ₃	H	Me	H	시아노	CF ₃	H
H	H	시아노	시아노	H	Me	H	시아노	시아노	H
H	H	시아노	OMe	H	Me	H	시아노	OMe	H
H	H	시아노	SMe	H	Me	H	시아노	SMe	H
H	H	시아노	CO ₂ Me	H	Me	H	시아노	CO ₂ Me	H
H	H	시아노	C(O)Me	H	Me	H	시아노	C(O)Me	H

[0245]

H	H	시아노	NMe ₂	H	Me	H	시아노	NMe ₂	H
H	H	시아노	니트로	H	Me	H	시아노	니트로	H
F	H	시아노	H	H	Cl	H	시아노	H	H
F	H	시아노	Me	H	Cl	H	시아노	Me	H
F	H	시아노	Et	H	Cl	H	시아노	Et	H
F	H	시아노	F	H	Cl	H	시아노	F	H
F	H	시아노	Cl	H	Cl	H	시아노	Cl	H
F	H	시아노	Br	H	Cl	H	시아노	Br	H
F	H	시아노	CF ₃	H	Cl	H	시아노	CF ₃	H
F	H	시아노	시아노	H	Cl	H	시아노	시아노	H
F	H	시아노	OMe	H	Cl	H	시아노	OMe	H
F	H	시아노	SMe	H	Cl	H	시아노	SMe	H
F	H	시아노	CO ₂ Me	H	Cl	H	시아노	CO ₂ Me	H
F	H	시아노	C(O)Me	H	Cl	H	시아노	C(O)Me	H
F	H	시아노	NMe ₂	H	Cl	H	시아노	NMe ₂	H
F	H	시아노	니트로	H	Cl	H	시아노	니트로	H
Br	H	시아노	H	H	CF ₃	H	시아노	H	H
Br	H	시아노	Me	H	CF ₃	H	시아노	Me	H
Br	H	시아노	Et	H	CF ₃	H	시아노	Et	H
Br	H	시아노	F	H	CF ₃	H	시아노	F	H
Br	H	시아노	Cl	H	CF ₃	H	시아노	Cl	H
Br	H	시아노	Br	H	CF ₃	H	시아노	Br	H
Br	H	시아노	CF ₃	H	CF ₃	H	시아노	CF ₃	H
Br	H	시아노	시아노	H	CF ₃	H	시아노	시아노	H
Br	H	시아노	OMe	H	CF ₃	H	시아노	OMe	H
Br	H	시아노	SMe	H	CF ₃	H	시아노	SMe	H
Br	H	시아노	CO ₂ Me	H	CF ₃	H	시아노	CO ₂ Me	H
Br	H	시아노	C(O)Me	H	CF ₃	H	시아노	C(O)Me	H
Br	H	시아노	NMe ₂	H	CF ₃	H	시아노	NMe ₂	H
Br	H	시아노	니트로	H	CF ₃	H	시아노	니트로	H
시아노	H	시아노	H	H	시아노	H	시아노	시아노	H
시아노	H	시아노	Me	H	시아노	H	시아노	OMe	H
시아노	H	시아노	Et	H	시아노	H	시아노	SMe	H
시아노	H	시아노	F	H	시아노	H	시아노	CO ₂ Me	H

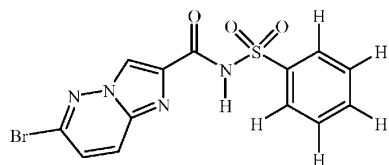
[0246]

시아노	H	시아노	Cl	H	시아노	H	시아노	C(O)Me	H
시아노	H	시아노	Br	H	시아노	H	시아노	NMe ₂	H
시아노	H	시아노	CF ₃	H	시아노	H	시아노	니트로	H
H	H	H	H	H	Me	H	H	H	H
H	H	H	H	Me	Me	H	H	H	Me
H	H	H	H	F	Me	H	H	H	F
H	H	H	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
H	H	H	H	Br	Me	H	H	H	Br
F	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H
F	H	H	H	Me	Cl	H	H	H	Me
F	H	H	H	F	Cl	H	H	H	F
F	H	H	H	Cl	Cl	H	H	H	Cl
F	H	H	H	Br	Cl	H	H	H	Br
Br	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H
Br	H	H	H	Me	CF ₃	H	H	H	Me
Br	H	H	H	F	CF ₃	H	H	H	F
Br	H	H	H	Cl	CF ₃	H	H	H	Cl
Br	H	H	H	Br	CF ₃	H	H	H	Br
시아노	H	H	H	H	시아노	H	H	H	F
시아노	H	H	H	Me	시아노	H	H	H	Cl
Cl	H	H	OCF ₃	H	시아노	H	H	H	Br
OCF ₃	H	H	Cl	H					

[0247]

[0248] [표 2]

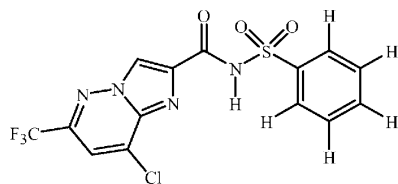
[0249] 표 2는 A²가 CBr인 것을 제외하고는, 표 1과 동일하게 구성된다. 예를 들어, A¹이 N이고, A²가 CBr이며, A³ 및 A⁴가 CH이고, R^a 내지 R^e가 H인 표 2의 첫번째 화합물은 바로 아래에 나타난 구조이다.



[0250]

[0251] [표 3]

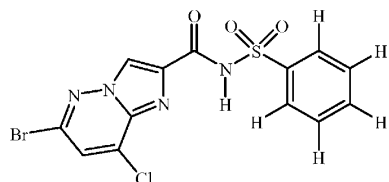
[0252] 표 3은 A²가 CCF₃이고, A⁴가 CCl인 것을 제외하고는, 표 1과 동일하게 구성된다. 예를 들어, A¹이 N이고, A²가 CCF₃이며, A³가 CH이고, A⁴가 CCl이며, R^a 내지 R^e가 H인 표 3의 첫번째 화합물은 바로 아래에 나타난 구조이다.



[0253]

[0254] [표 4]

[0255] 표 4는 A²가 CBr이고 A⁴가 CCl인 것을 제외하고는, 표 1과 동일하게 구성된다. 예를 들어, A¹이 N이고, A²가 CBr이며, A³가 CH이고, A⁴가 CCl이며, R^a 내지 R^e가 H인 표 4의 첫번째 화합물은 바로 아래에 나타난 구조이다.



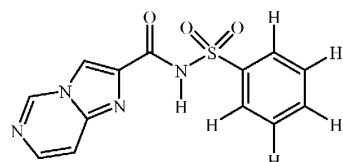
[0256]

[0257]

[표 5]

[0258]

표 5는 A^1 이 CH이고, A^2 가 N인 것을 제외하고는, 표 1과 동일하게 구성된다. 예를 들어, A^1 이 CH이고, A^2 가 N이며, A^3 가 CH이고, A^4 가 CH이며, R^a 내지 R^e 가 H인 표 5의 첫번째 화합물은 바로 아래에 나타낸 구조이다.



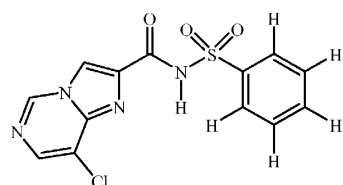
[0259]

[0260]

[표 6]

[0261]

표 6은 A^1 이 CH이고, A^2 가 N이며, A^4 가 CC1인 것을 제외하고는, 표 1과 동일하게 구성된다. 예를 들어, A^1 이 CH이고, A^2 가 N이며, A^3 가 CH이고, A^4 가 CC1이며, R^a 내지 R^e 가 H인 표 6의 첫번째 화합물은 바로 아래에 나타낸 구조이다.



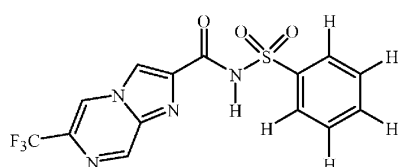
[0262]

[0263]

[표 7]

[0264]

표 7은 A^1 이 CH이고, A^3 가 N인 것을 제외하고는, 표 1과 동일하게 구성된다. 예를 들어, A^1 이 CH이고, A^2 가 CCF₃이며, A^3 가 N이고, A^4 가 CH이며, R^a 내지 R^e 가 H인 표 7의 첫번째 화합물은 바로 아래에 나타낸 구조이다.



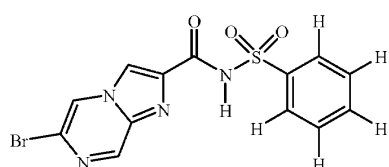
[0265]

[0266]

[표 8]

[0267]

표 8은 A^1 이 CH이고, A^2 가 CBr이며, A^3 가 N인 것을 제외하고는, 표 1과 동일하게 구성된다. 예를 들어, A^1 이 CH이고, A^2 가 CBr이며, A^3 가 N이고, A^4 가 CH이며, R^a 내지 R^e 가 H인 표 8의 첫번째 화합물은 바로 아래에 나타낸 구조이다.

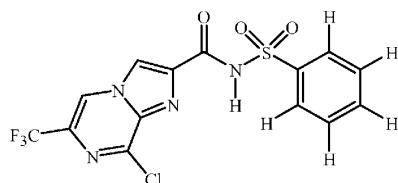


[0268]

[0269]

[표 9]

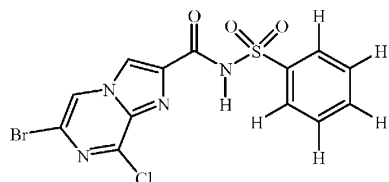
[0270] 표 9는 A^1 이 CH이고, A^3 가 N이며, A^4 가 CC1인 것을 제외하고는, 표 1과 동일하게 구성된다. 예를 들어, A^1 이 CH이고, A^2 가 CCF₃이며, A^3 가 N이고, A^4 가 CC1이며, R^a 내지 R^e가 H인 표 9의 첫번째 화합물은 바로 아래에 나타난 구조이다.



[0271]

[0272] [표 10]

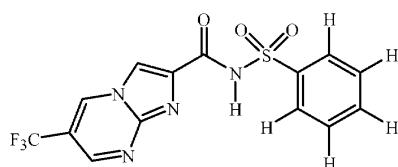
[0273] 표 10은 A^1 이 CH이고, A^2 가 CBr이며, A^3 가 N이고, A^4 가 CC1인 것을 제외하고는, 표 1과 동일하게 구성된다. 예를 들어, A^1 이 CH이고, A^2 가 CBr이며, A^3 가 N이고, A^4 가 CC1이며, R^a 내지 R^e가 H인 표 10의 첫번째 화합물은 바로 아래에 나타난 구조이다.



[0274]

[0275] [표 11]

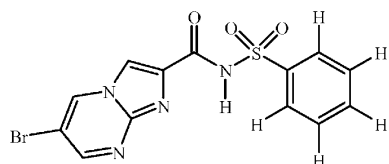
[0276] 표 11은 A^1 이 CH이고, A^4 가 N인 것을 제외하고는, 표 1과 동일하게 구성된다. 예를 들어, A^1 이 CH이고, A^2 가 CCF₃이며, A^3 가 CH이고, A^4 가 N이며, R^a 내지 R^e가 H인 표 11의 첫번째 화합물은 바로 아래에 나타난 구조이다.



[0277]

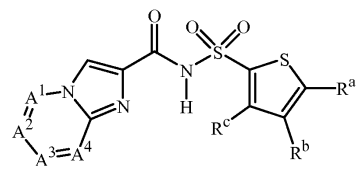
[0278] [표 12]

[0279] 표 12는 A^1 이 CH이고, A^2 가 CBr이며, A^4 가 N인 것을 제외하고는, 표 1과 동일하게 구성된다. 예를 들어, A^1 이 CH이고, A^2 가 CBr이며, A^3 가 CH이고, A^4 가 N이며, R^a 내지 R^e가 H인 표 12의 첫번째 화합물은 바로 아래에 나타난 구조이다.



[0280]

[0281] [표 13]



A¹은 CH이고, A²는 CCF₃이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	H	Me	H	H	Cl	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Cl	Me	H	Cl	Cl	H	Cl
H	H	Br	Me	H	Br	Cl	H	Br
H	Me	H	Me	Me	H	Cl	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Me	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Me	Cl
H	Me	Br	Me	Me	Br	Cl	Me	Br
H	Et	H	Me	Et	H	Cl	Et	H
H	Et	Me	Me	Et	Me	Cl	Et	Me
H	Et	Cl	Me	Et	Cl	Cl	Et	Cl
H	Et	Br	Me	Et	Br	Cl	Et	Br

[0282]

H	Cl	H	Me	Cl	H	Cl	Cl	H
H	Cl	Me	Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me
H	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
H	Cl	Br	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Br
Br	H	H	Et	H	H			
Br	H	Me	Et	H	Me			
Br	H	Cl	Et	H	Cl			
Br	H	Br	Et	H	Br			
Br	Me	H	Et	Me	H			
Br	Me	Me	Et	Me	Me			
Br	Me	Cl	Et	Me	Cl			
Br	Me	Br	Et	Me	Br			
Br	Et	H	Et	Et	H			
Br	Et	Me	Et	Et	Me			
Br	Et	Cl	Et	Et	Cl			
Br	Et	Br	Et	Et	Br			
Br	Cl	H	Et	Cl	H			
Br	Cl	Me	Et	Cl	Me			
Br	Cl	Cl	Et	Cl	Cl			
Br	Cl	Br	Et	Cl	Br			

A¹은 CH이고, A²는 CBr이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

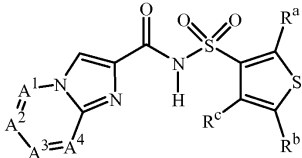
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	H	Me	H	H	Cl	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Cl	Me	H	Cl	Cl	H	Cl
H	H	Br	Me	H	Br	Cl	H	Br
H	Me	H	Me	Me	H	Cl	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Me	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Me	Cl
H	Me	Br	Me	Me	Br	Cl	Me	Br
H	Et	H	Me	Et	H	Cl	Et	H
H	Et	Me	Me	Et	Me	Cl	Et	Me
H	Et	Cl	Me	Et	Cl	Cl	Et	Cl
H	Et	Br	Me	Et	Br	Cl	Et	Br
H	Cl	H	Me	Cl	H	Cl	Cl	H
H	Cl	Me	Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me
H	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl

[0283]

H	Cl	Br	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Br
Br	H	H	Et	H	H			
Br	H	Me	Et	H	Me			
Br	H	Cl	Et	H	Cl			
Br	H	Br	Et	H	Br			
Br	Me	H	Et	Me	H			
Br	Me	Me	Et	Me	Me			
Br	Me	Cl	Et	Me	Cl			
Br	Me	Br	Et	Me	Br			
Br	Et	H	Et	Et	H			
Br	Et	Me	Et	Et	Me			
Br	Et	Cl	Et	Et	Cl			
Br	Et	Br	Et	Et	Br			
Br	Cl	H	Et	Cl	H			
Br	Cl	Me	Et	Cl	Me			
Br	Cl	Cl	Et	Cl	Cl			
Br	Cl	Br	Et	Cl	Br			

[0284]

[0285] [표 14]



A¹은 CH이고, A²는 CCF₃이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c	R ^a	R ^b	R ^c
H	H	H	Me	H	H	Cl	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Cl	Me	H	Cl	Cl	H	Cl
H	Me	H	Me	Me	H	Cl	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Me	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Me	Cl
H	Et	H	Me	Et	H	Cl	Et	H
H	Et	Me	Me	Et	Me	Cl	Et	Me
H	Et	Cl	Me	Et	Cl	Cl	Et	Cl
Et	H	H	Br	H	H			
Et	H	Me	Br	H	Me			

[0286]

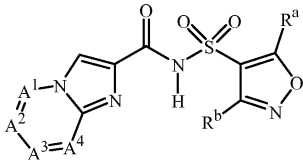
Et	H	Cl	Br	H	Cl
Et	Me	H	Br	Me	H
Et	Me	Me	Br	Me	Me
Et	Me	Cl	Br	Me	Cl
Et	Et	H	Br	Et	H
Et	Et	Me	Br	Et	Me
Et	Et	Cl	Br	Et	Cl

A¹은 CH이고, A²는 CBr이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	H	Me	H	H	Cl	H	H
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Cl	Me	H	Cl	Cl	H	Cl
H	Me	H	Me	Me	H	Cl	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Me	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Me	Cl
H	Et	H	Me	Et	H	Cl	Et	H
H	Et	Me	Me	Et	Me	Cl	Et	Me
H	Et	Cl	Me	Et	Cl	Cl	Et	Cl
Et	H	H	Br	H	H			
Et	H	Me	Br	H	Me			
Et	H	Cl	Br	H	Cl			
Et	Me	H	Br	Me	H			
Et	Me	Me	Br	Me	Me			
Et	Me	Cl	Br	Me	Cl			
Et	Et	H	Br	Et	H			
Et	Et	Me	Br	Et	Me			
Et	Et	Cl	Br	Et	Cl			

[0287]

[0288] [표 15]



A¹은 CH이고, A²는 CCF₃이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

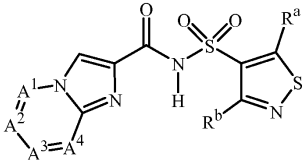
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>
H	H	Me	H	Cl	H
H	Me	Me	Me	Cl	Me
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl

A¹은 CH이고, A²는 CBr이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>
H	H	Me	H	Cl	H
H	Me	Me	Me	Cl	Me
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl

[0289]

[0290] [표 16]



A¹은 CH이고, A²는 CCF₃이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

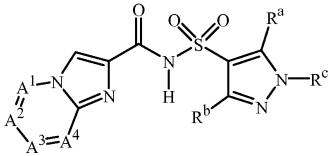
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>
H	H	Me	H	Cl	H
H	Me	Me	Me	Cl	Me
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl

A¹은 CH이고, A²는 CBr이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>
H	H	Me	H	Cl	H
H	Me	Me	Me	Cl	Me
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl

[0291]

[0292] [표 17]



A¹은 CH이고, A²는 CCF₃이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr
Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

A¹은 CH이고, A²는 CBr이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

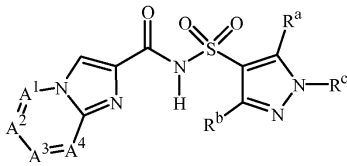
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr

[0293]

Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

[0294]

[0295] [표 17a]



A¹은 CH이고, A²는 CCF₃이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr
Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr

[0296]

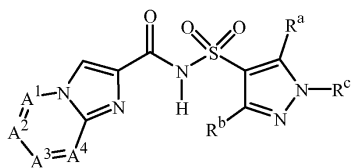
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

A¹은 CH이고, A²는 CBr이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr
Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

[0297]

[0298] [丑 17b]



A¹은 CH이고, A²는 CCF₃이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr
Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

A¹은 CH이고, A²는 CBr이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

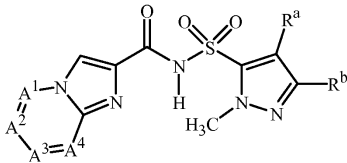
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et

[0299]

H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr
Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

[0300]

[0301] [표 18]



A¹은 CH이고, A²는 CCF₃이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

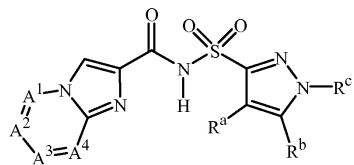
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>
H	H	Me	H	Cl	H	Br	H
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Me	Me	Cl	Me	Br	Me
H	Et	Me	Et	Cl	Et	Br	Et
H	<i>i</i> -Pr	Me	<i>i</i> -Pr	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	<i>i</i> -Pr
H	<i>n</i> -Pr	Me	<i>n</i> -Pr	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	<i>n</i> -Pr
H	OMe	Me	OMe	Cl	OMe	Br	OMe

A¹은 CH이고, A²는 CBr이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>
H	H	Me	H	Cl	H	Br	H
H	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Me	Me	Cl	Me	Br	Me
H	Et	Me	Et	Cl	Et	Br	Et
H	<i>i</i> -Pr	Me	<i>i</i> -Pr	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	<i>i</i> -Pr
H	<i>n</i> -Pr	Me	<i>n</i> -Pr	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	<i>n</i> -Pr
H	OMe	Me	OMe	Cl	OMe	Br	OMe

[0302]

[0303] [표 19]



A¹은 CH이고, A²는 CCF₃이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr
Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et

[0304]

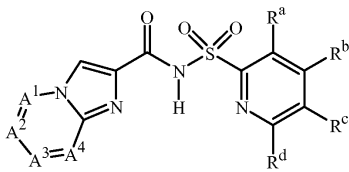
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

A¹은 CH이고, A²는 CBr이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>
H	H	Me	Me	H	Me	Cl	H	Me
H	H	Et	Me	H	Et	Cl	H	Et
H	H	<i>i</i> -Pr	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	H	<i>i</i> -Pr
H	H	<i>n</i> -Pr	Me	H	<i>n</i> -Pr	Cl	H	<i>n</i> -Pr
Br	H	Me	H	Me	Me	Me	Me	Me
Br	H	Et	H	Me	Et	Me	Me	Et
Br	H	<i>i</i> -Pr	H	Me	<i>i</i> -Pr	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Br	H	<i>n</i> -Pr	H	Me	<i>n</i> -Pr	Me	Me	<i>n</i> -Pr
Cl	Me	Me	Br	Me	Me	H	Cl	Me
Cl	Me	Et	Br	Me	Et	H	Cl	Et
Cl	Me	<i>i</i> -Pr	Br	Me	<i>i</i> -Pr	H	Cl	<i>i</i> -Pr
Cl	Me	<i>n</i> -Pr	Br	Me	<i>n</i> -Pr	H	Cl	<i>n</i> -Pr
Me	Cl	Me	Cl	Cl	Me	Br	Cl	Me
Me	Cl	Et	Cl	Cl	Et	Br	Cl	Et
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	Cl	<i>i</i> -Pr
Me	Cl	<i>n</i> -Pr	Cl	Cl	<i>n</i> -Pr	Br	Cl	<i>n</i> -Pr
H	Br	Me	Me	Br	Me	Cl	Br	Me
H	Br	Et	Me	Br	Et	Cl	Br	Et
H	Br	<i>i</i> -Pr	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	<i>i</i> -Pr
H	Br	<i>n</i> -Pr	Me	Br	<i>n</i> -Pr	Cl	Br	<i>n</i> -Pr
Br	Br	Me						
Br	Br	Et						
Br	Br	<i>i</i> -Pr						
Br	Br	<i>n</i> -Pr						

[0305]

[0306] [표 20]



A¹은 CH이고, A²는 CCF_y이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d
Me	H	H	H	Cl	H	H	H
Me	H	H	Me	Cl	H	H	Me
Me	H	H	OMe	Cl	H	H	OMe
Me	OMe	H	H	Cl	OMe	H	H
Me	OMe	H	Me	Cl	OMe	H	Me
Me	OMe	H	OMe	Cl	OMe	H	OMe
Me	H	Me	H	Cl	H	Me	H
Me	H	Me	Me	Cl	H	Me	Me
Me	H	Me	OMe	Cl	H	Me	OMe
Me	OMe	Me	H	Cl	OMe	Me	H
Me	OMe	Me	Me	Cl	OMe	Me	Me
Me	OMe	Me	OMe	Cl	OMe	Me	OMe
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	H
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Me
Me	Me	H	OMe	Cl	Me	H	OMe
Me	Me	Me	H	Cl	Me	Me	H
Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me	Me
Me	Me	Me	OMe	Cl	Me	Me	OMe
Br	H	H	H	Br	OMe	Me	H
Br	H	H	Me	Br	OMe	Me	Me
Br	H	H	OMe	Br	OMe	Me	OMe
Br	OMe	H	H	Br	Me	H	H
Br	OMe	H	Me	Br	Me	H	Me
Br	OMe	H	OMe	Br	Me	H	OMe
Br	H	Me	H	Br	Me	Me	H
Br	H	Me	Me	Br	Me	Me	Me
Br	H	Me	OMe	Br	Me	Me	OMe

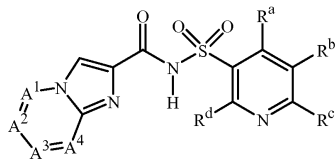
[0307]

A¹은 CH이고, A²는 CBr이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>
Me	H	H	H	Cl	H	H	H
Me	H	H	Me	Cl	H	H	Me
Me	H	H	OMe	Cl	H	H	OMe
Me	OMe	H	H	Cl	OMe	H	H
Me	OMe	H	Me	Cl	OMe	H	Me
Me	OMe	H	OMe	Cl	OMe	H	OMe
Me	H	Me	H	Cl	H	Me	H
Me	H	Me	Me	Cl	H	Me	Me
Me	H	Me	OMe	Cl	H	Me	OMe
Me	OMe	Me	H	Cl	OMe	Me	H
Me	OMe	Me	Me	Cl	OMe	Me	Me
Me	OMe	Me	OMe	Cl	OMe	Me	OMe
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	H
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Me
Me	Me	H	OMe	Cl	Me	H	OMe
Me	Me	Me	H	Cl	Me	Me	H
Me	Me	Me	Me	Cl	Me	Me	Me
Me	Me	Me	OMe	Cl	Me	Me	OMe
Br	H	H	H	Br	OMe	Me	H
Br	H	H	Me	Br	OMe	Me	Me
Br	H	H	OMe	Br	OMe	Me	OMe
Br	OMe	H	H	Br	Me	H	H
Br	OMe	H	Me	Br	Me	H	Me
Br	OMe	H	OMe	Br	Me	H	OMe
Br	H	Me	H	Br	Me	Me	H
Br	H	Me	Me	Br	Me	Me	Me
Br	H	Me	OMe	Br	Me	Me	OMe

[0308]

[0309] [표 21]



A¹은 CH이고, A²는 CCF₃이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d
H	H	H	H	Me	H	H	H
H	H	H	Me	Me	H	H	Me
H	H	H	CF ₃	Me	H	H	CF ₃
H	H	H	Cl	Me	H	H	Cl
H	H	H	Br	Me	H	H	Br
H	H	Me	H	Me	H	Me	H
H	H	Me	Me	Me	H	Me	Me
H	H	Me	CF ₃	Me	H	Me	CF ₃
H	H	Me	Cl	Me	H	Me	Cl
H	H	Me	Br	Me	H	Me	Br
H	Cl	H	H	Me	Cl	H	H
H	Cl	H	Me	Me	Cl	H	Me
H	Cl	H	CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃
H	Cl	H	Cl	Me	Cl	H	Cl
H	Cl	H	Br	Me	Cl	H	Br
H	Cl	Me	H	Me	Cl	Me	H
H	Cl	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Me	CF ₃
H	Cl	Me	Cl	Me	Cl	Me	Cl
H	Cl	Me	Br	Me	Cl	Me	Br
H	Me	H	H	Me	Me	H	H
H	Me	H	Me	Me	Me	H	Me
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	CF ₃
H	Me	H	Cl	Me	Me	H	Cl
H	Me	H	Br	Me	Me	H	Br
H	Me	Me	H	Me	Me	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Me	Me
H	Me	Me	CF ₃	Me	Me	Me	CF ₃
H	Me	Me	Cl	Me	Me	Me	Cl
H	Me	Me	Br	Me	Me	Me	Br
H	CF ₃	H	H	Me	CF ₃	H	H
H	CF ₃	H	Me	Me	CF ₃	H	Me
H	CF ₃	H	CF ₃	Me	CF ₃	H	CF ₃
H	CF ₃	H	Cl	Me	CF ₃	H	Cl
H	CF ₃	H	Br	Me	CF ₃	H	Br
H	CF ₃	Me	H	Me	CF ₃	Me	H

[0310]

H	CF ₃	Me	Me	Me	CF ₃	Me	Me
H	CF ₃	Me	CF ₃	Me	CF ₃	Me	CF ₃
H	CF ₃	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl
H	CF ₃	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Br
H	OMe	H	H	Me	OMe	H	H
H	OMe	H	Me	Me	OMe	H	Me
H	OMe	H	CF ₃	Me	OMe	H	CF ₃
H	OMe	H	Cl	Me	OMe	H	Cl
H	OMe	H	Br	Me	OMe	H	Br
H	OMe	Me	H	Me	OMe	Me	H
H	OMe	Me	Me	Me	OMe	Me	Me
H	OMe	Me	CF ₃	Me	OMe	Me	CF ₃
H	OMe	Me	Cl	Me	OMe	Me	Cl
H	OMe	Me	Br	Me	OMe	Me	Br

A¹은 CH이고, A²는 CBr이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

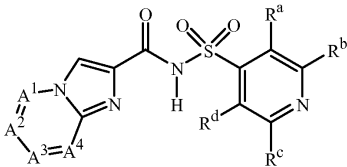
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>
H	H	H	H	Me	H	H	H
H	H	H	Me	Me	H	H	Me
H	H	H	CF ₃	Me	H	H	CF ₃
H	H	H	Cl	Me	H	H	Cl
H	H	H	Br	Me	H	H	Br
H	H	Me	H	Me	H	Me	H
H	H	Me	Me	Me	H	Me	Me
H	H	Me	CF ₃	Me	H	Me	CF ₃
H	H	Me	Cl	Me	H	Me	Cl
H	H	Me	Br	Me	H	Me	Br
H	Cl	H	H	Me	Cl	H	H
H	Cl	H	Me	Me	Cl	H	Me
H	Cl	H	CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃
H	Cl	H	Cl	Me	Cl	H	Cl
H	Cl	H	Br	Me	Cl	H	Br
H	Cl	Me	H	Me	Cl	Me	H
H	Cl	Me	Me	Me	Cl	Me	Me
H	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Me	CF ₃
H	Cl	Me	Cl	Me	Cl	Me	Cl
H	Cl	Me	Br	Me	Cl	Me	Br
H	Me	H	H	Me	Me	H	H

[0311]

H	Me	H	Me	Me	Me	H	Me
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	CF ₃
H	Me	H	Cl	Me	Me	H	Cl
H	Me	H	Br	Me	Me	H	Br
H	Me	Me	H	Me	Me	Me	H
H	Me	Me	Me	Me	Me	Me	Me
H	Me	Me	CF ₃	Me	Me	Me	CF ₃
H	Me	Me	Cl	Me	Me	Me	Cl
H	Me	Me	Br	Me	Me	Me	Br
H	CF ₃	H	H	Me	CF ₃	H	H
H	CF ₃	H	Me	Me	CF ₃	H	Me
H	CF ₃	H	CF ₃	Me	CF ₃	H	CF ₃
H	CF ₃	H	Cl	Me	CF ₃	H	Cl
H	CF ₃	H	Br	Me	CF ₃	H	Br
H	CF ₃	Me	H	Me	CF ₃	Me	H
H	CF ₃	Me	Me	Me	CF ₃	Me	Me
H	CF ₃	Me	CF ₃	Me	CF ₃	Me	CF ₃
H	CF ₃	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl
H	CF ₃	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Br
H	OMe	H	H	Me	OMe	H	H
H	OMe	H	Me	Me	OMe	H	Me
H	OMe	H	CF ₃	Me	OMe	H	CF ₃
H	OMe	H	Cl	Me	OMe	H	Cl
H	OMe	H	Br	Me	OMe	H	Br
H	OMe	Me	H	Me	OMe	Me	H
H	OMe	Me	Me	Me	OMe	Me	Me
H	OMe	Me	CF ₃	Me	OMe	Me	CF ₃
H	OMe	Me	Cl	Me	OMe	Me	Cl
H	OMe	Me	Br	Me	OMe	Me	Br

[0312]

[0313] [표 22]



A¹은 CH이고, A²는 CCF₃이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>
H	H	H	H	Me	H	H	H
H	H	H	Me	Me	H	H	Me
H	H	H	Cl	Me	H	H	Cl
H	H	Me	H	Me	H	Me	H
H	H	Me	Me	Me	H	Me	Me
H	H	Me	Cl	Me	H	Me	Cl

A¹은 CH이고, A²는 CBr이며, A³는 N이고, A⁴는 CH이다.

<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^c</u>	<u>R^d</u>
H	H	H	H	Me	H	H	H
H	H	H	Me	Me	H	H	Me
H	H	H	Cl	Me	H	H	Cl
H	H	Me	H	Me	H	Me	H
H	H	Me	Me	Me	H	Me	Me
H	H	Me	Cl	Me	H	Me	Cl

[0314]

[0315] 본 발명의 화합물은 일반적으로 담체로서 작용하는 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 구성되는 그룹 중에서 선택되는 적어도 하나의 추가 성분과 함께, 조성물, 즉, 제형 중의 기생 선충 구제 활성 성분으로서 사용될 것이다. 제형 또는 조성물 성분은 활성 성분의 물리적 특성, 적용 방식 및 환경 인자, 예를 들어, 토양형, 수분 및 온도와 상응하도록 선택된다.

[0316] 유용한 제형은 액체 조성물 및 고체 조성물을 포함한다. 액체 조성물은 용액 (유제 (emulsifiable concentrate) 포함), 현탁제, 에멀전 (마이크로에멀전 및/또는 유현탁제 (suspoemulsion) 포함) 등을 포함하며, 이들은 임의로 겔로 증점될 수 있다. 수성 액체 조성물의 일반적인 유형은 액체 (soluble concentrate), 액상 수화제 (suspension concentrate), 캡슐 현탁제, 농축 에멀전, 마이크로에멀전 및 유현탁제이다. 비수성 액체 조성물의 일반적인 유형은 유제, 마이크로유제 (microemulsifiable concentrate), 분산성 액체 (dispersible concentrate) 및 오일 분산액이다.

[0317] 고체 조성물의 일반적인 유형은 분체 (dust), 분말, 과립, 펠릿, 환약, 향정 (pastille), 정제, 충전 필름 (종자 코팅 포함) 등이 있으며, 이들은 수분산성 ("습윤성") 또는 수용성일 수 있다. 필름 형성 용액 또는 유동성 현탁제로 형성되는 필름 및 코팅이 종자 처리에 특히 유용하다. 활성 성분은 (마이크로)캡슐화될 수 있으며, 추가로 현탁 제형 또는 고체 제형으로 형성될 수 있거나; 활성 성분의 전체 제형은 캡슐화 (또는 "오버코팅")될 수 있다. 캡슐화는 활성 성분의 방출을 제어하거나 지연시킬 수 있다. 유화성 (emulsifiable) 과립은 유제 제형과 건조 과립 제형의 이점을 모두 갖추고 있다. 고강도 조성물은 주로 추가 제형화를 위한 중간체로서 사용된다.

[0318] 분무형 제형은 전형적으로 분무 전에 적절한 매질에서 증량된다. 그러한 액체 및 고체 제형은 보통 물인 분무 매질에서 용이하게 희석되도록 제형화된다. 분무량 (spray volume)은 헥타르 당 약 1 내지 수천 리터 범위일 수 있으나, 보다 전형적으로는 헥타르 당 약 10 내지 수백 리터 범위이다. 분무형 제형은 공중 또는 지상 적용에 의한 경엽 처리를 위해, 또는 식물의 생육 배지에로의 적용을 위해 물 또는 다른 적절한 매질과 탱크 혼합될 수 있다. 액체 및 건조 제형은 식재 동안에 점적 관개 시스템 내로 직접 계량되거나 도랑 내로 계량될 수 있다. 액체 및 고체 제형은 전신 흡수 (systemic uptake)를 통해 발육 중인 뿌리 및 다른 지하 식물 부분 및/또는 경엽을 보호하기 위해 식재 이전에 종자 처리로서 작물 종자 및 다른 원하는 초목 상에 적용될 수 있다.

[0319] 제형은 전형적으로 총 100 중량%가 되는 하기의 근사적인 범위 내에서 유효량의 활성 성분, 희석제 및 계면활성제를 함유할 것이다.

	중량%		
	활성 성분	희석제	계면활성제
수분산성 및 수용성 과립, 정제 및 분말	0.001-90	0-99.999	0-15
오일 분산액, 현탁제, 에멀전, 용액 (유제 포함)	1-50	40-99	0-50
분체	1-25	70-99	0-5
과립 및 펠릿	0.001-95	5-99.999	0-15
고강도 조성물	90-99	0-10	0-2

[0320]

[0321] 고체 희석제는 예를 들어, 클레이, 예컨대 벤토나이트, 몬트모릴로나이트, 애터필사이트 및 카올린, 석고, 셀룰로오스, 이산화티탄, 산화아연, 전분, 텍스트린, 당 (예를 들어, 락토스, 수크로스), 실리카, 톨크, 운모, 규조토, 우레아, 탄산칼슘, 탄산나트륨 및 중탄산나트륨, 및 황산나트륨을 포함한다. 전형적인 고체 희석제는 문헌 [참조: Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey]에 기재되어 있다.

[0322] 액체 희석제는 예를 들어, 물, *N,N*-다이메틸알칸아미드 (예를 들어, *N,N*-다이메틸포름아미드), 리모넨, 다이메틸 설폭사이드, *N*-알킬피롤리돈 (예를 들어, *N*-메틸피롤리디논), 에틸렌 글리콜, 트라이에틸렌 글리콜, 프로필렌 글리콜, 다이프로필렌 글리콜, 폴리프로필렌 글리콜, 프로필렌 카르보네이트, 부틸렌 카르보네이트, 파라핀 (예를 들어, 백색 광유, 노르말 파라핀, 아이소파라핀), 알킬벤젠, 알킬나프탈렌, 글리세린, 글리세롤 트리아세테이트, 소르비톨, 트리아세틴, 방향족 탄화수소, 탈방향족 (dearomatized) 지방족 화합물, 알킬벤젠, 알킬나프탈렌, 케톤, 예컨대 사이클로헥사논, 2-헵타논, 아이소포론 및 4-하이드록시-4-메틸-2-펜타논, 아세테이트, 예컨대 아이소아밀 아세테이트, 헥실 아세테이트, 헵틸 아세테이트, 옥틸 아세테이트, 노닐 아세테이트, 트라이

데실 아세테이트 및 아이소보르닐 아세테이트, 기타 에스테르, 예컨대 알킬화 락테이트 에스테르, 이염기성 에스테르 및 γ -부티로락톤, 및 직쇄상, 분지상, 포화 또는 불포화될 수 있는 알코올, 예컨대 메탄올, 에탄올, n -프로판올, 아이소프로필 알코올, n -부탄올, 아이소부틸 알코올, n -헥산올, 2-에틸헥산올, n -옥탄올, 데칸올, 아이소데실 알코올, 아이소옥타데칸올, 세틸 알코올, 라우릴 알코올, 트라이데실 알코올, 올레일 알코올, 사이클로헥산올, 테트라하이드로푸르푸릴 알코올, 다이아세톤 알코올 및 벤질 알코올을 포함한다. 액체 희석제는 또한 포화 및 불포화 지방산의 글리세롤 에스테르 (전형적으로 C_6 - C_{22}), 예컨대 식물 종자 및 과일유 (예를 들어, 올리브유, 피마자유, 아마인유, 참기름, 콘유 (옥수수 기름), 낙화생유, 해바라기씨유, 포도씨유, 홍화유, 면실유, 대두유, 평지씨유, 코코넛유 및 팜핵유), 동물성 지방 (예를 들어, 우지, 돈지, 라드, 간유, 어유), 및 이들의 혼합물을 포함한다. 액체 희석제는 또한 알킬화 지방산 (예를 들어, 메틸화, 에틸화, 부틸화)을 포함하며, 여기서 지방산은 식물원 및 동물원으로부터의 글리세롤 에스테르의 가수분해에 의해 얻어질 수 있으며, 증류에 의해 정제될 수 있다. 전형적인 액체 희석제는 문헌 [참조: Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950]에 기재되어 있다.

[0323] 본 발명의 고체 및 액체 조성물은 종종 하나 이상의 계면활성제를 포함한다. 액체에 첨가될 때, 계면활성제 ("표면활성제"로도 공지됨)는 일반적으로 액체의 표면 장력을 변경시키며, 가장 흔히 감소시킨다. 계면활성제 분자 내의 친수성 및 친유성 기의 성질에 따라, 계면활성제는 습윤제, 분산제, 유화제 또는 소포제로서 유용할 수 있다.

[0324] 계면활성제는 비이온성, 음이온성 또는 양이온성으로 분류될 수 있다. 본 발명의 조성물에 유용한 비이온성 계면활성제로는 알코올 알콕실레이트, 예컨대 천연 및 합성 알코올 (분지상 또는 직쇄상일 수 있음) 계이며, 알코올 및 에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드, 부틸렌 옥사이드 또는 이들의 혼합물로부터 제조된 알코올 알콕실레이트; 아민 에톡실레이트, 알칸올아미드 및 에톡실화 알칸올아미드; 알콕실화 트라이글리세라이드, 예를 들어 에톡실화 대두유, 피마자유 및 평지씨유; 알킬페놀 알콕실레이트, 예를 들어 옥틸페놀 에톡실레이트, 노닐페놀 에톡실레이트, 다이노닐 페놀 에톡실레이트 및 도데실 페놀 에톡실레이트 (페놀과 에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드, 부틸렌 옥사이드 또는 이들의 혼합물로부터 제조됨); 에틸렌 옥사이드 또는 프로필렌 옥사이드로부터 제조된 블록 중합체 및 역 블록 중합체 (말단 블록이 프로필렌 옥사이드로부터 제조됨); 에톡실화 지방산; 에톡실화 지방 에스테르 및 오일; 에톡실화 메틸 에스테르; 에톡실화 트라이스티릴페놀 (에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드, 부틸렌 옥사이드 또는 이들의 혼합물로부터 제조된 것들을 포함); 지방산 에스테르, 글리세롤 에스테르, 라놀린계 유도체, 폴리에톡실레이트 에스테르, 예컨대 폴리에톡실화 소르비탄 지방산 에스테르, 폴리에톡실화 소르비톨 지방산 에스테르 및 폴리에톡실화 글리세롤 지방산 에스테르; 기타 소르비탄 유도체, 예컨대 소르비탄 에스테르; 폴리머 계면활성제, 예컨대 랜덤 공중합체, 블록 공중합체, 알키드 peg (폴리에틸렌 글리콜) 수지, 그래프트 또는 콤 (comb) 중합체 및 스타 중합체; 폴리에틸렌 글리콜 (peg); 폴리에틸렌 글리콜 지방산 에스테르; 실리콘계 계면활성제; 및 당 유도체, 예컨대 수크로스 에스테르, 알킬 폴리글리코사이드 및 알킬 폴리사카라이드를 들 수 있으나, 이들에 한정되지 않는다.

[0325] 유용한 음이온성 계면활성제로는 알킬아릴 설폰산 및 이의 염; 카르복실화 알코올 또는 알킬페놀 에톡실레이트; 다이페닐 설포네이트 유도체; 리그닌 및 리그닌 유도체, 예컨대 리그노설포네이트; 말레산 또는 석신산 또는 이들의 무수물; 올레핀 설포네이트; 포스페이트 에스테르, 예컨대 알코올 알콕실레이트의 포스페이트 에스테르, 알킬페놀 알콕실레이트의 포스페이트 에스테르 및 스티릴 페놀 에톡실레이트의 포스페이트 에스테르; 단백질계 계면활성제; 사르코신 유도체; 스티릴 페놀 에테르 설페이트; 오일 및 지방산의 설페이트 및 설포네이트; 에톡실화 알킬페놀의 설페이트 및 설포네이트; 알코올의 설페이트; 에톡실화 알코올의 설페이트; 아민 및 아미드의 설포네이트, 예컨대 N,N -알킬타우레이트; 벤젠, 쿠멘, 톨루엔, 자일렌, 및 도데실벤젠 및 트라이데실벤젠의 설포네이트; 축합 나프탈렌의 설포네이트; 나프탈렌 및 알킬 나프탈렌의 설포네이트; 분별 증류된 (fractionated) 석유의 설포네이트; 설포석시나메이트; 및 설포석시네이트 및 이들의 유도체, 예컨대 다이알킬 설포석시네이트 염을 들 수 있으나, 이들에 한정되지 않는다.

[0326] 유용한 양이온성 계면활성제로는 아미드 및 에톡실화 아미드; 아민, 예컨대 N -알킬 프로판다이아민, 트라이프로필렌트라이아민 및 다이프로필렌테트라민, 및 에톡실화 아민, 에톡실화 다이아민 및 프로폭실화 아민 (아민과 에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드, 부틸렌 옥사이드 또는 이들의 혼합물로부터 제조됨); 아민 염, 예컨대 아민 아세테이트 및 다이아민 염; 사차 암모늄 염, 예컨대 사차 염, 에톡실화 사차 염 및 이중사차 (diquaternary) 염; 및 아민 옥사이드, 예컨대 알킬다이메틸아민 옥사이드 및 비스-(2-하이드록시에틸)-알킬아민 옥사이드를 들 수 있으나, 이들에 한정되지 않는다.

- [0327] 비이온성 계면활성제와 음이온성 계면활성제의 혼합물, 또는 비이온성 계면활성제와 양이온성 계면활성제의 혼합물도 본 발명의 조성물에 유용하다. 비이온성, 음이온성 및 양이온성 계면활성제 및 이들의 추천 용도는 문헌 [참조: *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.]; 문헌 [참조: Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964]; 및 문헌 [참조: A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987]을 비롯한 다양한 간행된 참고문헌에 개시되어 있다.
- [0328] 본 발명의 조성물은 또한 제형 조제로서 당업자에게 알려진 제형 보조제 및 첨가제를 함유할 수 있다 (이들 중 일부는 또한 고체 희석제, 액체 희석제 또는 계면활성제로 기능하는 것으로 간주될 수 있음). 그러한 제형 보조제 및 첨가제는 pH (완충제), 가공 중의 발포 (소포제, 예를 들어, 폴리오르가노실록산), 활성 성분의 침강 (현탁화제), 점도 (요변성 증점제), 용기내 (in-container) 미생물 생장 (항균제), 제품 동결 (부동제), 색상 (염료/안료 분산액), 워시-오프 (필름 형성제 또는 스티커), 증발 (증발 지연제), 및 다른 제형 속성을 제어할 수 있다. 필름 형성제는 예를 들어, 폴리비닐 아세테이트, 폴리비닐 아세테이트 공중합체, 폴리비닐피롤리돈-비닐 아세테이트 공중합체, 폴리비닐 알코올, 폴리비닐 알코올 공중합체 및 왁스를 포함한다. 제형 보조제 및 첨가제의 예로는 문헌 [참조: *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.]; 및 국제 특허 출원 공개 제W0 03/024222호에 열거된 것들을 들 수 있다.
- [0329] 화학식 1의 화합물 및 임의의 다른 활성 성분은 전형적으로 활성 성분을 용매에 용해시키거나 액체 또는 건조 희석제에서 분쇄함으로써 본 발명의 조성물 내로 혼입된다. 유제를 비롯한 용액은 성분들을 단순히 혼합함으로써 제조될 수 있다. 유제로서 사용하려는 액체 조성물의 용매가 수불혼화성인 경우에는, 물로 희석시에 활성제 함유 용매를 유화시키기 위하여 유화제가 전형적으로 첨가된다. 2,000 μm 이하의 입경을 가진 활성 성분 슬러리는 매체 밀을 이용하여 습식 밀링하여, 평균 직경이 3 μm 미만인 입자를 얻을 수 있다. 수성 슬러리는 완성된 액상 수화제로 제조되거나 (예를 들어, 미국 특허 제3,060,084호 참조) 또는 분무 건조에 의해 추가로 가공되어 수분산성 과립을 형성할 수 있다. 건조 제형은 통상 건식 밀링 공정을 필요로 하며, 이것에 의해 2 내지 10 μm 범위의 평균 입경이 형성된다. 분제 및 분말은 블렌딩 및 통상 분쇄 (예를 들어, 해머 밀 또는 유체 에너지 밀을 이용)에 의해 제조될 수 있다. 과립 및 펠릿은 활성 물질을 미리 형성된 과립 담체 상에 분무함으로써 또는 응집 기술에 의해 제조될 수 있다. 문헌 [Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147-48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 및 그 이하] 및 국제 특허 출원 공개 제W0 91/13546호를 참조한다. 펠릿은 미국 특허 제4,172,714호에 기재된 바와 같이 제조될 수 있다. 수분산성 및 수용성 과립은 미국 특허 제4,144,050호, 제3,920,442호 및 독일 특허 제3,246,493호에 교시된 바와 같이 제조될 수 있다. 정제는 미국 특허 제5,180,587호, 제5,232,701호 및 제5,208,030호에 교시된 바와 같이 제조될 수 있다. 필름은 영국 특허 제2,095,558호 및 미국 특허 제3,299,566호에 교시된 바와 같이 제조될 수 있다.
- [0330] 제형화 분야에 관한 추가의 정보에 대해서는, 문헌 [T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133]을 참조한다. 또한 미국 특허 제3,235,361호, 컬럼 6, 16행 내지 컬럼 7, 19행 및 실시예 10 내지 41; 미국 특허 제3,309,192호, 컬럼 5, 43행 내지 컬럼 7, 62행 및 실시예 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138 내지 140, 162 내지 164, 166, 167 및 169 내지 182; 미국 특허 제2,891,855호, 컬럼 3, 66행 내지 컬럼 5, 17행 및 실시예 1 내지 4; 문헌 [Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96]; 문헌 [Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989]; 및 문헌 [Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000]을 참조한다.
- [0331] 하기 실시예에서, 모든 제형은 통상적인 방법으로 제조된다. 화합물 번호는 인덱스 표 A 및 B의 화합물을 말한다. 더 이상 상술하지 않고도, 상술한 설명을 이용하는 당업자라면 본 발명을 최대한으로 이용할 수 있을 것으로 여겨진다. 그러므로, 하기 실시예는 단순히 예시적인 것으로 그리고 어떠한 임의의 방식으로든 본 개시 내용을 한정하지 않는 것으로 해석되어야 한다. 달리 표시되는 경우를 제외하고는, 백분율은 중량 기준이다.

[0332]	<u>실시예 A</u>	
	고강도 농축물	
	화합물 1	98.5%
	실리카 에어로겔	0.5%
	합성 비결정질 미세 실리카	1.0%

[0333]

[0334]	<u>실시예 B</u>	
	습윤성 분말	
	화합물 4	65.0%
	노테실페놀 폴리에틸렌 글리콜 에테르	2.0%
	소듐 리그닌설포네이트	4.0%
	소듐 실리코알루미네이트	6.0%
	몬트모릴로나이트 (소성됨)	23.0%

[0335]

[0336]	<u>실시예 C</u>	
	과립	
	화합물 6	10.0%
	에터펄자이트 과립 (저 휘발성 물질, 0.71/0.30 mm; U.S.S. No. 25-50 시브 (sieve))	90.0%

[0337]

[0338]	<u>실시예 D</u>	
	압출 펠릿	
	화합물 1	25.0%
	무수 황산나트륨	10.0%
	조제의 칼슘 리그닌설포네이트	5.0%
	소듐 알킬나프탈렌설포네이트	1.0%
	칼슘/마그네슘 벤토나이트	59.0%

[0339]

[0340]	<u>실시예 E</u>	
	유제	
	화합물 4	10.0%
	폴리옥시에틸렌 소르비톨 헥사올레이트	20.0%
	C ₆ -C ₁₀ 지방산 메틸에스테르	70.0%

[0341]

[0342]	<u>실시예 F</u>	
	마이크로에멀전	
	화합물 6	5.0%
	폴리비닐피롤리돈-비닐 아세테이트 공중합체	30.0%
	알킬폴리글리코사이드	30.0%
	글리세릴 모노올레이트	15.0%
	물	20.0%

[0343]

[0344] 실시예 G

종자 처리	
화합물 1	20.00%
폴리비닐피롤리돈-비닐 아세테이트 공중합체	5.00%
몬탄산 왁스	5.00%
칼슘 리그닌설포네이트	1.00%
폴리옥시에틸렌/폴리옥시프로필렌 블록 공중합체	1.00%
스테아릴 알코올 (POE 20)	2.00%
폴리오르가노실란	0.20%
착색제 적색 염료	0.05%
물	65.75%

[0345]

[0346] 실시예 H

비료 스틱	
화합물 4	2.50%
피롤리돈-스티렌 공중합체	4.80%
트라이스티릴페닐 16-에톡실레이트	2.30%
벨크	0.80%
옥수수 전분	5.00%
서방성 비료	36.00%
카올린	38.00%
물	10.60%

[0347]

[0348] 실시예 I

액상 수화제	
화합물 6	35%
부틸 폴리옥시에틸렌/폴리프로필렌 블록 공중합체	4.0%
스테아르산/폴리에틸렌 글리콜 공중합체	1.0%
스티렌 아크릴 중합체	1.0%
잔탄검	0.1%
프로필렌 글리콜	5.0%
실리콘계 소포제	0.1%
1,2-벤즈아이소티아졸린-3-온	0.1%
물	53.7%

[0349]

[0350] 실시예 J

수중 에멀전	
화합물 1	10.0%
부틸 폴리옥시에틸렌/폴리프로필렌 블록 공중합체	4.0%
스테아르산/폴리에틸렌 글리콜 공중합체	1.0%
스티렌 아크릴 중합체	1.0%
잔탄검	0.1%
프로필렌 글리콜	5.0%
실리콘계 소포제	0.1%
1,2-벤즈아이소티아졸린-3-온	0.1%
방향족 석유계 탄화수소	20.0
물	58.7%

[0351]

[0352] 실시예 K

오일 분산액	
화합물 4	25%
폴리옥시에틸렌 소르비톨 헥사올레이트	15%
유기 변성된 벤토나이트 클레이	2.5%
지방산 메틸 에스테르	57.5%

[0353]

[0354] 실시예 L

유현탁제	
화합물 6	10.0%
이미다클로프리드	5.0%
부틸 폴리옥시에틸렌/폴리프로필렌 블록 공중합체	4.0%
스테아르산/폴리에틸렌 글리콜 공중합체	1.0%
스티렌 아크릴 중합체	1.0%
잔탄검	0.1%
프로필렌 글리콜	5.0%
실리콘계 소포제	0.1%
1,2-벤즈아이스티아졸린-3-온	0.1%
방향족 석유계 탄화수소	20.0%
물	53.7%

[0355]

[0356]

따라서, 이들 본 발명의 화합물과 조성물은 기생 선충으로부터 농작물을 보호하는데 농경학적으로 유용하며, 또한 초식성 기생 선충으로부터 다른 원예 작물 및 식물을 보호하는데 비농경학적으로 유용하다. 이러한 유용성은 유리한 형질을 제공하기 위하여 유전 공학에 의해 도입되거나 (즉, 트랜스제닉 (transgenic)) 또는 돌연변이 유발에 의해 변형된 유전 물질을 함유하는 작물 및 기타 식물 (즉, 농경학적 및 비농경학적 둘 모두)을 보호하는 것을 포함한다. 그러한 형질의 예는 제초제에 대한 내성, 식물 기생 해충 (예를 들어, 곤충, 좀진드기, 진딧물, 거미, 선충류, 달팽이, 식물 병원성 진균, 세균 및 바이러스)에 대한 내성, 개선된 식물 성장, 고온 또는 저온, 낮거나 높은 토양 수분, 및 높은 염도와 같은 불리한 성장 조건에 대한 내성 증가, 증가된 개화 또는 결실, 보다 높은 수확 수율, 더 신속한 성숙, 수확된 생성물의 보다 높은 품질 및/또는 영양가, 또는 수확된 생성물의 개선된 저장 또는 가공 특성을 포함한다. 트랜스제닉 식물은 다수의 형질을 발현하도록 변형될 수 있다. 유전 공학 또는 돌연변이 유발에 의해 제공되는 형질을 포함하는 식물의 예에는 일드 가드 (YIELD GARD)[®], 녹아웃 (KNOCKOUT)[®], 스타링크 (STARLINK)[®], 불가드 (BOLLGARD)[®], 누코튼 (NuCOTN)[®] 및 뉴리프 (NEWLEAF)[®]와 같은 살충성 바실러스 투린지엔시스 (*Bacillus thuringiensis*) 독소를 발현하는 콩, 목화, 대두 및 감자의 변종, 및 라운드업 레디 (ROUNDUP READY)[®], 리버티 링크 (LIBERTY LINK)[®], IMI[®], STS[®] 및 클리어필드 (CLEARFIELD)[®]와 같은 콩, 목화, 대두 및 평지씨의 제초제 내성 변종과, 글리포세이트 제초제에 대한 내성을 제공하는 *N*-아세틸 트랜스퍼라아제 (GAT)를 발현하는 작물, 또는 아세트락테이트 신타아제 (ALS)를 억제하는 제초제에 대한 내성을 제공하는 HRA 유전자를 함유한 작물이 포함된다. 본 발명의 화합물과 조성물은 유전 공학에 의해 도입되거나 돌연변이 유발에 의해 변형된 형질들과 상승적으로 상호작용하고, 그에 따라 형질의 표현형 발현 또는 유효성을 향상시키거나 본 발명의 화합물 및 조성물의 기생 선충 구제 유효성을 증가시킬 수 있다. 특히, 본 발명의 화합물 및 조성물은 기생 선충에 대해 유독한 단백질 또는 기타 천연산물의 표현형 발현과 상승적으로 상호작용하여, 상가 작용 이상 (greater-than-additive)의 이들 해충의 구제를 제공할 수 있다.

[0357]

본 발명의 조성물은 또한 임의로 식물 영양소, 예를 들어, 질소, 인, 칼륨, 황, 칼슘, 마그네슘, 철, 구리, 붕소, 망간, 아연 및 몰리브덴 중에서 선택되는 적어도 하나의 식물 영양소를 포함하는 비료 조성물을 포함할 수 있다. 질소, 인, 칼륨, 황, 칼슘 및 마그네슘 중에서 선택되는 적어도 하나의 식물 영양소를 포함하는 적어도 하나의 비료 조성물을 포함하는 조성물이 주목된다. 적어도 하나의 식물 영양소를 추가로 포함하는 본 발명의 조성물은 액체 또는 고체 형태일 수 있다. 과립, 작은 스틱 또는 정제 형태의 고체 제형이 주목된다. 비료 조성물을 포함하는 고체 제형은 본 발명의 화합물 또는 조성물을 제형화 성분과 함께 비료 조성물과 혼합하고 이어서 과립화 또는 압출과 같은 방법에 의해 제형을 제조함으로써 제조될 수 있다. 대안적으로는 고체 제형은 휘발성 용매 중의 본 발명의 화합물 또는 조성물의 용액 또는 현탁액을 치수 안정성 혼합물, 예를 들어, 과립, 작은 스틱 또는 정제 형태의 앞서 제조된 비료 조성물 상에 분무하고, 이어서 용매를 증발시켜 제조될 수 있다.

- [0358] 본 발명의 화합물은 식물 (예를 들어, 경엽, 열매, 줄기, 뿌리 또는 종자) 또는 동물 및 인간 (예를 들어, 혈관 또는 소화기 계통 또는 기타 조직) 내에서 생식 또는 증식하거나 이들을 섭식하므로, 재배 중이거나 저장된 농경학적 작물, 숲, 온실 작물, 관상용 및 묘상 작물을 손상시키거나, 동물 및 인간 건강에 피해를 입히는 광범위한 기생 선충에 대하여 활성을 나타낼 수 있다. 특히 중요한 작물로는 열매 야채 (fruiting vegetable), 예컨대 가지과 및 박과 (cucurbit) 작물, 플랜테이션 작물, 예컨대 바나나 및 커피, 근채류, 예컨대 감자, 양파 및 당근, 및 농작물, 예컨대 담배, 땅콩, 목화, 사탕수수 및 대두가 있다.
- [0359] 본 발명의 화합물은 촌충강 (Cestoda) (촌충) 및 흡충강 (Trematoda) (흡충)을 비롯한 편형동물문 (Phylum Platyhelminthes), 구두충강 (Archiacanthocephala) 및 고구두충강 (Palaeacanthocephala)을 비롯한 구두동물문 (phylum Acanthocephala) (구두충), 쌍기충강 (Aphasmidae) 및 쌍선충강 (Plasmidae)을 비롯한 선형동물문 (Phylum Nematoda), 및 유침목 (Enoplida) (편충), 창선충목 (Dorylaimida), 봉선충목 (Rhabditida) (자유 생활 벌레), 원선충목 (Strongylida) (구충 및 폐선충), 회충목 (Ascaridia) (장관내 회충), 요충목 (Oxyurida) (요충), 선미선충목 (Spirurida) (사상선충), 식물선충목 (Tylenchida), 등근꼬리선충목 (Aphelenchida), 디플로가스테리다목 (Diplogasterida), 램디아시다목 (Rhabdiasida) 및 카말라니다목 (Camallanida)의 기생 연충에 대하여 활성을 나타낼 수 있다.
- [0360] 본 발명의 화합물은 멜로이도기네 (*Meloidogyne*) 속의 뿌리혹 선충류, 헤테로테라 (*Heterodera*) 속 및 글로보테라 (*Globodera*) 속의 시스트 선충류, 프라틸렌쿠스 (*Pratylenchus*) 속의 썩이 선충류, 로틸렌쿨루스 (*Rotylenchulus*) 속의 콩팥모양 선충류, 라도폴루스 (*Radopholus*) 속의 굴파기 선충류, 벨로놀라이머스 (*Belonolaimus*) 속의 침선충류, 헬리코틸렌쿠스 (*Helicotylenchus*) 속 및 스쿠텔로네마 (*Scutellonema*) 속의 나선 선충류, 티렌쿨루스 (*Tylenchulus*) 속의 감귤 선충류, 트리코도루스 (*Trichodorus*) 속 및 파라트리코도루스 (*Paratrichodorus*) 속의 궁침 선충류, 자이피네마 (*Xiphinema*) 속의 검선충류, 티렌코린쿠스 (*Tylenchorhynchus*) 속의 위충 선충류, 롱지도루스 (*Longidorus*) 속 및 파라롱지도루스 (*Paralongidorus*) 속의 바늘 선충류, 호플로라이머스 (*Hoplolaimus*) 속의 작살 선충류, 주름 선충과 (family Criconematidae)의 주름 선충류, 디틸렌쿠스 (*Ditylenchus*) 속 및 앙구이나 (*Anguina*) 속의 줄기 선충류, 및 아펠렌코이테스 (*Aphelenchoides*) 속 및 라디나펠렌쿠스 (*Rhadinaphelenchus*) 속의 잎/줄기 (foliar/stem) 선충류를 들 수 있으나, 이에 한정되지 않는 경제적으로 중요한 기생 선충에 대하여 활성을 나타낼 수 있다.
- [0361] 본 발명의 화합물은 또한 회충, 예컨대 말의 보통 원충 (*Strongylus vulgaris*), 개회충 (*Toxocara canis*), 양의 염전위충 (*Haemonchus contortus*) 및 개의 심장사상충 (*Dirofilaria immitis*), 및 흡충 및 촌충, 예컨대 말의 엽상조충 (*Anoplocephala perfoliata*) 및 반추동물의 간질 (*Fasciola hepatica*)을 들 수 있으나, 이에 한정되지 않는 동물 및 인간 건강 기생충에 대하여 활성을 나타낼 수 있다.
- [0362] 고구마 뿌리혹 선충 (*Meloidogyne incognita*)을 구제하기 위한 본 발명의 화합물의 용도가 주목된다. 당업자는 모든 화합물이 모든 선충의 모든 성장 단계에 대해 동일하게 효과적이지는 않음을 이해할 것이다.
- [0363] 본 발명의 화합물은 또한 살충제, 살진균제, 살선충제, 살세균제 (bactericide), 진드기 구충제, 제초제, 제초제 완화제, 생장 조절제, 예컨대 곤충 탈피 억제제 (insect molting inhibitor) 및 발근 촉진제 (rooting stimulant), 불임화제, 신호 화합물질 (semiochemical), 방충제, 유인 물질, 페로몬, 섭식 촉진 물질, 다른 생물 활성 화합물 또는 곤충병원성 세균, 곤충병원성 바이러스 또는 곤충병원성 진균을 비롯한 하나 이상의 다른 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제와 혼합되어, 훨씬 더 광범위한 농경학적 및 비농경학적 유용성을 부여하는 다성분 농약을 형성할 수 있다. 따라서, 본 발명은 또한 화학식 1의 화합물, 이의 *N*-옥사이드 또는 이의 염과, 유효량의 적어도 하나의 추가의 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제를 포함하는 조성물에 관한 것으로, 추가로 계면활성제, 고체 희석제 또는 액체 희석제 중 적어도 하나를 포함할 수 있다. 본 발명의 혼합물의 경우, 다른 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제는 화학식 1의 화합물을 비롯한 본 발명의 화합물과 함께 제형화되어 프리믹스 (premix)를 형성할 수 있거나, 다른 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제는 화학식 1의 화합물을 비롯한 본 발명의 화합물과 별도로 제형화되고 적용 전에 두 제형이 (예를 들어, 분무 탱크에서) 함께 배합되거나, 대안적으로는 연속하여 적용된다.
- [0364] 본 발명의 화합물과 함께 제형화될 수 있는 이러한 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제의 예로는 살충제, 예컨대 아바멕틴, 아세페이트, 아세퀴노실, 아세타미프리트, 아크리나트린, 아미도플루메트, 아미트라즈, 아버멕틴, 아자디라크틴, 아진포스-메틸, 비펜트린, 비페나제이트, 비스트리플루론, 보레이트, 부프로페진, 카두사포스, 카바릴, 카르보푸란, 칼탐, 카졸, 클로란트라닐리프롤, 클로르페나피르, 클로르플루아주론, 클로르피리포스, 클로르피리포스-메틸, 크로마페노자이드, 클로펜테진, 클로티아니딘, 시안트라닐리프롤, 사이플루메토펜, 사이플

루트린, 베타-사이플루트린, 사이할로트린, 감마-사이할로트린, 람다-사이할로트린, 사이퍼메트린, 알파-사이퍼메트린, 제타-사이퍼메트린, 사이로마진, 델타메트린, 디아펜티우론, 디아지논, 디엘드린, 디플루벤주론, 디메플루트린, 디메하이포, 디메토에이트, 디노테푸란, 디오페놀란, 에마벡틴, 엔도설판, 에스펜발레레이트, 에티프롤, 에토펙스, 에톡사졸, 펜부타틴 옥사이드, 페노티오카브, 페녹시카브, 펜프로파트린, 펜발레레이트, 피프로닐, 플로니카미드, 플루벤디아미드, 플루사이트리네이트, 플루페넬, 플루페녹수론, 플루발리네이트, 타우-플루발리네이트, 포노포스, 포메타네이트, 포스티아제이트, 할로페노자이드, 헥사플루무론, 헥시티아졸스, 하이드라메틸논, 이미다클로프리드, 인독사카브, 살충 비누, 아이소펜포스, 루페누론, 말라티온, 메타플루미존, 메트알데히드, 메타미도포스, 메티다티온, 메티오디카브, 메토밀, 메토프렌, 메톡시클로르, 메토프루트린, 모노크로토포스, 메톡시페노자이드, 니텐피람, 니티아진, 노발루론, 노비플루무론, 옥사밀, 파라티온, 파라티온-메틸, 페메트린, 포레이트, 포살론, 포스메트, 포스파미돈, 피리미카브, 프로페노포스, 프로플루트린, 프로파자이트, 프로트리펜부트, 피메트로진, 피라플루프롤, 피레트린, 피리다벤, 피리달릴, 피리플루퀴나존, 피리프롤, 피리프록시펜, 로테논, 리아노딘, 스피네토람, 스피노사드, 스피로디클로펜, 스피로메시펜, 스피로테트라마트, 설프로포스, 테부페노자이드, 테부펜피라드, 테플루벤주론, 테플루트린, 티부포스, 테트라클로르빈포스, 테트라메트린, 티아클로프리드, 티아메톡삼, 티오디카브, 티오설판-소듐, 톨펜피라드, 트랄로메트린, 트라이아자메이트, 트라이클로르폰, 트라이플루무론, *바실러스 투린지엔시스* 델타-내독소, 곤충병원성 세균, 곤충병원성 바이러스 및 곤충병원성 진균이 있다.

[0365] 살충제, 예컨대 아바멕틴, 아세타미프리드, 아크리나트린, 아미트라즈, 아버멕틴, 아자디라크틴, 비펜트린, 부프로페진, 카두사포스, 카르바릴, 칼탐, 클로란트라닐리프롤, 클로르페나피르, 클로르피리포스, 클로티아니딘, 시안트라닐리프롤, 사이플루트린, 베타-사이플루트린, 사이할로트린, 감마-사이할로트린, 람다-사이할로트린, 사이퍼메트린, 알파-사이퍼메트린, 제타-사이퍼메트린, 사이로마진, 델타메트린, 디엘드린, 디노테푸란, 디오페놀란, 에마벡틴, 엔도설판, 에스펜발레레이트, 에티프롤, 에토펙스, 에톡사졸, 페노티오카브, 페녹시카브, 펜발레레이트, 피프로닐, 플로니카미드, 플루벤디아미드, 플루페넬, 플루페녹수론, 플루발리네이트, 포메타네이트, 포스티아제이트, 헥사플루무론, 하이드라메틸논, 이미다클로프리드, 인독사카브, 루페누론, 메타플루미존, 메티오디카브, 메토밀, 메토프렌, 메톡시페노자이드, 니텐피람, 니티아진, 노발루론, 옥사밀, 피메트로진, 피레트린, 피리다벤, 피리달릴, 피리프록시펜, 리아노딘, 스피네토람, 스피노사드, 스피로디클로펜, 스피로메시펜, 스피로테트라마트, 테부페노자이드, 테트라메트린, 티아클로프리드, 티아메톡삼, 티오디카브, 티오설판-소듐, 트랄로메트린, 트라이아자메이트, 트라이플루무론, *바실러스 투린지엔시스* 델타-내독소, *바실러스 투린지엔시스*의 모든 균주 및 *해다각체병* 바이러스의 모든 균주가 주목된다.

[0366] 본 발명의 화합물과 혼합하기 위한 생물 작용제의 일 실시 형태는 *바실러스 투린지엔시스*와 같은 곤충병원성 세균, 및 *바실러스 투린지엔시스*의 캡슐화된 델타-내독소, 예컨대 셀캡 (Cellcap)[®] 과정에 의해 제조되는 MPV[®] 및 MPVII[®] 생물살충제 (셀캡[®], MPV[®] 및 MPVII[®]는 Mycogen Corporation (Indianapolis, Indiana, USA 소재)의 상표명임); 곤충병원성 진균, 예컨대 녹강균 (green muscardine fungus); 및 바클로바이러스, 해다각체병 바이러스 (NPV), 예를 들어, *헬리코베르파 제아* (*Helicoverpa zea*) 해다각체병 바이러스 (HzNPV), *아나그라파 팔시페라* (*Anagrapha falcifera*) 해다각체병 바이러스 (AfNPV)를 비롯한 곤충병원성 (자연 발생 및 유전자 변형된 것 둘 모두) 바이러스; 및 과립병 바이러스 (granulosis virus, GV), 예컨대 *시디아 포모넬라* (*Cydia pomonella*) 과립병 바이러스 (CpGV)를 포함한다.

[0367] 다른 무척추 해충 구제 활성 성분이 화학식 1의 화합물과 상이한 화학적 분류에 속하거나 작용 부위가 상이한 그러한 배합물에 특히 주목해야 한다. 경우에 따라서는, 유사한 구제 범위를 갖지만, 작용 부위가 상이한 적어도 하나의 다른 무척추 해충 구제 활성 성분과의 배합물이 저항성 관리에 특히 유리할 것이다. 따라서, 본 발명의 조성물은 유사한 구제 범위를 갖지만 상이한 화학적 분류에 속하거나 작용 부위가 상이한 적어도 하나의 추가의 무척추 해충 구제 활성 성분을 추가로 포함할 수 있다. 이들 추가의 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제는 나트륨 채널 조절제, 예를 들어 비펜트린, 사이퍼메트린, 사이할로트린, 람다-사이할로트린, 사이플루트린, 베타-사이플루트린, 델타메트린, 디메플루트린, 에스펜발레레이트, 펜발레레이트, 인독사카브, 메토프루트린, 프로플루트린, 피레트린 및 트랄로메트린; 콜린에스테라아제 저해제, 예를 들어 클로르피리포스, 메토밀, 옥사밀, 티오디카브 및 트라이아자메이트; 네오니코티노이드, 예를 들어 아세타미프리드, 클로티아니딘, 디노테푸란, 이미다클로프리드, 니텐피람, 니티아진, 티아클로프리드 및 티아메톡삼; 살충성 거대환식 락톤, 예를 들어 스피네토람, 스피노사드, 아바멕틴, 아버멕틴 및 에마벡틴; GABA (γ -아미노부티르산) 의존성 클로라이드 채널 길항제, 예를 들어, 아버멕틴 또는 차단제, 예를 들어, 에티프롤 및 피프로닐; 키틴 합성 저해제, 예를 들어 부프로페진, 사이로마진, 플루페넬, 헥사플루무론, 루페누론, 노발루론, 노비플루무

론 및 트라이플루루론; 유약 호르몬 유사체 (juvenile hormone mimic), 예를 들어 디오페놀란, 페녹시카브, 메토프렌 및 피리프록시펜; 옥토파민 수용체 리간드, 예를 들어 아미트라즈; 탈피 억제제 및 액디손 작용제, 예를 들어 아자디라크틴, 메톡시페노자이드 및 테부페노자이드; 리아노딘 수용체 리간드, 예를 들어 리아노딘, 안트라닐릭 디아미드, 예를 들어 클로란트라닐리프롤, 시안트라닐리프롤 및 플루벤디아미드; 네레이스톡신 유사체, 예를 들어 칼탐; 미토콘드리아 전자 수송 저해제, 예를 들어 클로로페나피르, 하이드라메틸논 및 피리다벤; 지질 생합성 저해제, 예를 들어 스피로디클로펜 및 스피로메시펜; 사이클로다이엔 살충제, 예를 들어 디엘드린 또는 엔도설판; 피레트로이드; 카르바메이트; 살충성 우레아; 및 핵다각체병 바이러스 (NPV), *바실러스 투린지엔시스*의 구성원, *바실러스 투린지엔시스*의 캡슐화된 델타-내독소, 및 기타 자연 발생 또는 유전자 변형된 살충성 바이러스를 비롯한 생물 작용제가 포함되나, 이에 한정되지 않는다.

[0368] 본 발명의 화합물과 함께 제형화될 수 있는 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제의 추가 예로는 살진균제, 예컨대 아시벤졸라, 알디모르프, 아미셀브롬, 아자코나졸, 아족시스트로빈, 베날락실, 베노밀, 벤티아발리카브, 벤티아발리카브-아이소프로필, 비노미알, 비페닐, 비터타놀, 블라스티시딘-S, 보르도액 (Bordeaux mixture) (삼염기성 황산구리), 보스칼리드/니코비펜, 브로무코나졸, 부피리메이트, 부티오베이트, 카르복신, 카르프로파미드, 캅타폴, 캅탄, 카벤다짐, 클로로넵, 클로로탈로닐, 클로줄리네이트, 클로트리마졸, 옥시염화구리, 구리 염, 예컨대 황산구리 및 수산화구리, 시아조파미드, 사이플루나미드, 사이목사닐, 사이프로코나졸, 사이프로디닐, 디클로플루아니드, 디클로사이메트, 디클로메진, 디클로란, 디에토펜카브, 디페노코나졸, 디메토모르프, 디목시스트로빈, 디니코나졸, 디니코나졸-M, 디노캡, 디스코스트로빈, 디티아논, 도데모르프, 도딘, 에코나졸, 에타코나졸, 에디펜포스, 에폭시코나졸, 에타복삼, 에티리몰, 에트리다디아졸, 파목사돈, 페나미돈, 페나리몰, 펜부코나졸, 펜카라미드, 펜푸람, 펜헥사미드, 페녹사닐, 펜피클로닐, 펜프로피딘, 펜프로피모르프, 펜틴 아세테이트, 펜틴 하이드록사이드, 퍼밤, 퍼푸라조에이트, 페림존, 플루아지남, 플루디옥소닐, 플루메토버, 플루피콜라이드, 플루옥사스트로빈, 플루퀸코나졸, 플루퀸코나졸, 플루실라졸, 플루설파미드, 플루톨라닐, 플루트리아폴, 폴페트, 포세틸-알루미늄, 푸베리다졸, 푸랄락실, 푸라메트피르, 헥사코나졸, 하이멕사졸, 구아자틴, 이마잘릴, 이미벤코나졸, 이미녹타딘, 요오도카브, 이프코나졸, 이프로벤포스, 이프로디온, 이프로발리카브, 아이소코나졸, 아이소프로티올란, 카수가마이신, 크레속심-메틸, 만코젠, 만디프로파미드, 마넵, 마파니피림, 메페녹삼, 메프로닐, 메탈락실, 메트코나졸, 메타설포카브, 메티람, 메토미노스트로빈/페노미노스트로빈, 메파니피림, 메트라페논, 미코나졸, 마이클로부터닐, 네오-아소진 (메탄아르손산제이철 (ferric methanearsonate)), 누아리몰, 옥틸리논, 오프레이스, 오리사스트로빈, 옥사딕실, 옥솔린산, 옥스포코나졸, 옥시카르복신, 파클로부트라졸, 펜코나졸, 펜사이쿠론, 펜티오피라드, 퍼푸라조에이트, 포스폰산, 프탈라이드, 피코벤즈아미드, 피콕시스트로빈, 폴리옥신, 프로베나졸, 프로클로라즈, 프로사이미돈, 프로파모카브, 프로파모카브-하이드로클로라이드, 프로피코나졸, 프로피넵, 프로퀴나지드, 프로티오키코나졸, 피라클로스트로빈, 피라조포스, 피리페녹스, 피리메타닐, 피리페녹스, 피롤니트린, 피로퀼론, 퀸코나졸, 퀸독시펜, 퀸토젠, 실티오팜, 시메코나졸, 스피록사민, 스트렙토마이신, 황, 테부코나졸, 테크라젠, 테클로프탈람, 텍나젠, 테트라코나졸, 티아벤다졸, 티플루자미드, 티오파네이트, 티오파네이트-메틸, 티람, 티아디닐, 톨클로포스-메틸, 톨리플루아니드, 트라이아디메폰, 트라이아디메놀, 트라이아리몰, 트리아아족사이드, 트라이데모르프, 트라이모르파미드, 트라이사이클라졸, 트라이플록시스트로빈, 트라이포린, 트라이티코나졸, 유니코나졸, 발리다마이신, 빈클로졸린, 지넵, 지람, 및 족사미드; 살선충제, 예를 들어 알디카브, 이미시아포스, 옥사밀 및 페나미포스; 살세균제, 예컨대 스트렙토마이신; 진드기 구충제, 예컨대 아미트라즈, 키노메티오나트, 클로로벤질레이트, 사이헥사틴, 디코폴, 디에노클로르, 예톡사졸, 페나자퀸, 펜부타틴 옥사이드, 펜프로파트린, 펜피록시메이트, 헥시티아족스, 프로파자이트, 피리다벤 및 테부펜피라드가 있다.

[0369] 경우에 따라서는, 본 발명의 화합물과 다른 생물 활성 (특히 무척추 해충 구제) 화합물 또는 생물 활성제 (즉, 활성 성분)의 배합물은 상가 작용 이상 (즉, 상승) 효과를 가져올 수 있다. 효과적인 해충 구제를 확보하면서 환경에 방출되는 활성 성분의 양을 감소시키는 것이 항상 바람직하다. 무척추 해충 구제 활성 성분의 상승 작용이 농학적으로 만족스러운 레벨의 무척추 해충 구제를 부여하는 적용량으로 일어나는 경우에는, 이러한 배합물은 작물 생산비를 감소시키고 환경 부하를 저감시키는데 유리할 수 있다.

[0370] 본 발명의 화합물 및 이의 조성물은 무척추 해충에 유독한 단백질 (예를 들어, *바실러스 투린지엔시스* 델타-내독소)을 발현하도록 유전적으로 형질전환된 식물에 적용될 수 있다. 그러한 응용은 더 넓은 범위의 식물 보호를 제공할 수 있으며 저항성 관리에 유리할 수 있다. 외부로부터 적용된 본 발명의 화합물의 효과는 발현된 독소 단백질로 상승 작용이 일어날 수 있다.

[0371] 이들 농업용 보호제 (즉, 살충제, 살진균제, 살선충제, 진드기 구충제, 제초제 및 생물 작용제)에 관한 일반적

인 참고문헌으로는 문헌 [*The Pesticide Manual, 13th Edition*, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003] 및 문헌 [*The BioPesticide Manual, 2nd Edition*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001]을 들 수 있다.

[0372] 이들 다양한 혼합 파트너 중 하나 이상을 사용하는 실시 형태의 경우, 화학식 1의 화합물에 대한 이들 다양한 혼합 파트너 (전체)의 중량비는 전형적으로 약 1:3000 내지 약 3000:1이다. 약 1:300 내지 약 300:1 (예를 들어, 약 1:30 내지 약 30:1의 비)의 중량비에 주목해야 한다. 당업자는 원하는 생물학적 활성 범위에 필요한 활성 성분의 생물학적 유효량을 간단한 실험을 통하여 용이하게 결정할 수 있다. 이들 추가의 성분을 포함시키면, 구제되는 기생 선충의 범위를 화학식 1의 화합물 단독에 의해 구제되는 범위 이상으로 확대시킬 수 있음이 명백할 것이다.

[0373] 표 A는 본 발명의 혼합물, 조성물 및 방법을 예시하는 화학식 1의 화합물과 다른 무척추 해충 구제제의 구체적인 배합을 열거하며, 적용량에 있어서의 중량비 범위의 추가의 실시 형태를 포함한다. 표 A의 첫 번째 컬럼은 구체적인 무척추 해충 구제제 (예를 들어, 첫 번째 행의 "아바멕틴")를 열거한다. 표 A의 두 번째 컬럼은 무척추 해충 구제제의 작용 모드 (알려진 경우) 또는 화학적 분류를 열거한다. 표 A의 세 번째 컬럼은 무척추 해충 구제제가 화학식 1의 화합물에 대하여 적용될 수 있는 비율에 있어서의 중량비의 범위의 실시 형태(들) (예를 들어, 중량 기준으로 "50:1 내지 1:50"의 화학식 1의 화합물에 대한 아바멕틴)를 열거한다. 따라서, 예를 들어, 표 A의 첫 번째 행은 구체적으로 화학식 1의 화합물과 아바멕틴의 배합이 50:1 내지 1:50의 중량비로 적용될 수 있음을 개시한다. 표 A의 나머지 행들은 유사하게 해석될 것이다.

[0374] [표 A]

무척추 해충 구제제	작용 모드 또는 화학적 분류	전형적인 중량비
아바멕틴	거대환식 락톤	50:1 내지 1:50
아세타미프리드	네오니코티노이드	150:1 내지 1:200
아미트라즈	옥토팜 수용체 리간드	200:1 내지 1:100
아버멕틴	거대환식 락톤	50:1 내지 1:50
아자디라크틴	엑디손 작용제	100:1 내지 1:120
베타-사이플루트린	나트륨 채널 조절제	150:1 내지 1:200
비펜트린	나트륨 채널 조절제	100:1 내지 1:10
부프로페진	키틴 합성 저해제	500:1 내지 1:50
칼탐	네레이스톡신 유사체	100:1 내지 1:200
클로란트라닐리프롤	리아노딘 수용체 리간드	100:1 내지 1:120
클로르페나피르	미토콘드리아 전자 수송 저해제	300:1 내지 1:200
클로르피리포스	콜린에스테라아제 저해제	500:1 내지 1:200
클로티아니딘	네오니코티노이드	100:1 내지 1:400
시안트라닐리프롤	리아노딘 수용체 리간드	100:1 내지 1:120
사이플루트린	나트륨 채널 조절제	150:1 내지 1:200
사이할로트린	나트륨 채널 조절제	150:1 내지 1:200
사이퍼메트린	나트륨 채널 조절제	150:1 내지 1:200
사이로마진	키틴 합성 저해제	400:1 내지 1:50
델타메트린	나트륨 채널 조절제	50:1 내지 1:400
디엘트린	사이클로다이엔 살충제	200:1 내지 1:100
디노테푸란	네오니코티노이드	150:1 내지 1:200
디오페놀란	탈피 억제제	150:1 내지 1:200
에마멕틴	거대환식 락톤	50:1 내지 1:10
엔도실판	사이클로다이엔 살충제	200:1 내지 1:100
에스펜발레레이트	나트륨 채널 조절제	100:1 내지 1:400
에티프롤	GABA-조절된 클로라이드 채널 차단제	200:1 내지 1:100
페노티오카브		150:1 내지 1:200
페녹시카브	유약 호르몬 유사체	500:1 내지 1:100
펜발레레이트	나트륨 채널 조절제	150:1 내지 1:200

[0375]

무척추 해충 구제제	작용 모드 또는 화학적 분류	전형적인 중량비
피프로닐	GABA-조절된 클로라이드 채널 차단제	150:1 내지 1:100
플로니카미드		200:1 내지 1:100
플루벤디아미드	리아노딘 수용체 리간드	100:1 내지 1:120
플루페녹수론	키틴 합성 저해제	200:1 내지 1:100
헥사플루무론	키틴 합성 저해제	300:1 내지 1:50
하이드라메틸논	미토콘드리아 전자 수송 저해제	150:1 내지 1:250
이미나클로프리드	네오니코티노이드	1000:1 내지 1:1000
인독사카브	나트륨 채널 조절제	200:1 내지 1:50
람다-사이할로트린	나트륨 채널 조절제	50:1 내지 1:250
루페누론	키틴 합성 저해제	500:1 내지 1:250
메타플루비존		200:1 내지 1:200
메토밀	콜린에스테라아제 저해제	500:1 내지 1:100
메토프렌	유약 호르몬 유사체	500:1 내지 1:100
메복시페노자이드	엑디손 작용제	50:1 내지 1:50
니텐피람	네오니코티노이드	150:1 내지 1:200
니티아진	네오니코티노이드	150:1 내지 1:200
노발루론	키틴 합성 저해제	500:1 내지 1:150
옥사밀	콜린에스테라아제 저해제	200:1 내지 1:200
피메트로진		200:1 내지 1:100
피레트린	나트륨 채널 조절제	100:1 내지 1:10
피리다벤	미토콘드리아 전자 수송 저해제	200:1 내지 1:100
피리달릴		200:1 내지 1:100
피리프록시펜	유약 호르몬 유사체	500:1 내지 1:100
리아노딘	리아노딘 수용체 리간드	100:1 내지 1:120
스피네토탐	거대환식 락톤	150:1 내지 1:100
스피노사드	거대환식 락톤	500:1 내지 1:10
스피로디클로펜	지질 생합성 저해제	200:1 내지 1:200
스피로메시펜	지질 생합성 저해제	200:1 내지 1:200
테부페노자이드	엑디손 작용제	500:1 내지 1:250
티아클로프리드	네오니코티노이드	100:1 내지 1:200

[0376]

무척추 해충 구제제	작용 모드 또는 화학적 분류	전형적인 중량비
티아메톡삼	네오니코티노이드	1250:1 내지 1:1000
티오디카브	콜린에스테라아제 저해제	500:1 내지 1:400
티오설파-소듐		150:1 내지 1:100
트랄로메트린	나트륨 채널 조절제	150:1 내지 1:200
트라이아자메이트	콜린에스테라아제 저해제	250:1 내지 1:100
트라이플루무론	키틴 합성 저해제	200:1 내지 1:100
바실러스 투린지엔시스	생물 작용제	50:1 내지 1:10
바실러스 투린지엔시스 델타-내독소	생물 작용제	50:1 내지 1:10
NPV (예를 들어, 겔스타 (Gemstar))	생물 작용제	50:1 내지 1:10

[0377]

[0378]

적어도 하나의 추가의 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제가 상기 표 A에 열거된 무척추 해충 구제제 중에서 선택되는 본 발명의 조성물이 주목된다.

[0379]

추가 무척추 해충 구제제에 대한 화학식 1의 화합물, 이의 N-옥사이드 또는 이의 염의 중량비는 전형적으로 1000:1 내지 1:1000이며, 일 실시 형태에서는 500:1 내지 1:500이고, 다른 실시 형태에서는 250:1 내지 1:200이며, 또 다른 실시 형태에서는 100:1 내지 1:50이다.

[0380]

화학식 1의 화합물 (화합물 번호 (Cmpd. No.)는 인덱스 표 A의 화합물을 말함) 및 추가 무척추 해충 구제제를 포함하는 특정 조성물의 실시 형태가 하기에 표 B에 기재되어 있다.

[0381] [표 B]

혼합물 번호	Cmpd. No.	및	부적주 해충 구제제	혼합물 번호	Cmpd. No.	및	부적주 해충 구제제
B1-1	1	및	아바멕틴	B1-36	1	및	이미다클로프리드
B1-2	1	및	아세타미프리트	B1-37	1	및	인독사카브
B1-3	1	및	아미트라즈	B1-38	1	및	람다-사이할로트린
B1-4	1	및	아버멕틴	B1-39	1	및	루페누론
B1-5	1	및	아자디라크틴	B1-40	1	및	메타플루미존
B1-5a	1	및	벤셀탑	B1-41	1	및	메토밀
B1-6	1	및	베타-사이플루트린	B1-42	1	및	메토프렌
B1-7	1	및	비펜트린	B1-43	1	및	메복시페노자이드
B1-8	1	및	부프로페진	B1-44	1	및	니텐피람
B1-9	1	및	칼탑	B1-45	1	및	니티아진
B1-10	1	및	클로란트라닐리프롤	B1-46	1	및	노발루론
B1-11	1	및	클로르페나피르	B1-47	1	및	옥사밀
B1-12	1	및	클로르피리포스	B1-48	1	및	포스메트
B1-13	1	및	클로티아니딘	B1-49	1	및	피메트로진
B1-14	1	및	시안트라닐리프롤	B1-50	1	및	피레트린
B1-15	1	및	사이플루트린	B1-51	1	및	피리다벤
B1-16	1	및	사이할로트린	B1-52	1	및	피리달릴
B1-17	1	및	사이피메트린	B1-53	1	및	피리프록시펜
B1-18	1	및	사이로마진	B1-54	1	및	리아노딘
B1-19	1	및	델타메트린	B1-55	1	및	스피네토람
B1-20	1	및	디엘드린	B1-56	1	및	스피노사드
B1-21	1	및	디노테푸란	B1-57	1	및	스피로디클로펜
B1-22	1	및	디오페닐란	B1-58	1	및	스피로메시펜
B1-23	1	및	에마멕틴	B1-59	1	및	스피로테트라마트
B1-24	1	및	엔도설판	B1-60	1	및	테부페노자이드
B1-25	1	및	에스펜발레이트	B1-61	1	및	티아클로프리트
B1-26	1	및	에티프롤	B1-62	1	및	티아메복삼
B1-27	1	및	페노티오카브	B1-63	1	및	티오디카브
B1-28	1	및	페녹시카브	B1-64	1	및	티오설판-소듐

[0382]

혼합물 번호	Cmpd. No.	및	무척추 해충 구제제	혼합물 번호	Cmpd. No.	및	무척추 해충 구제제
B1-29	1	및	펜발레레이트	B1-65	1	및	몰펜피라드
B1-30	1	및	피프로닐	B1-66	1	및	트랄로메트린
B1-31	1	및	플로니카미드	B1-67	1	및	트라이아자메이트
B1-32	1	및	플루벤디아미드	B1-68	1	및	트라이플루무론
B1-33	1	및	플루페녹수론	B1-69	1	및	바실러스 투린지엔시스
B1-34	1	및	헥사플루무론	B1-70	1	및	바실러스 투린지엔시스 델타- 내독소
B1-35	1	및	하이드라메틸논	B1-71	1	및	NPV (예를 들어, 깡스타)
B2-1	4	및	아바멕틴	B2-36	4	및	이미다클로프로이드
B2-2	4	및	아세타미프리드	B2-37	4	및	인독사카브
B2-3	4	및	아미트라즈	B2-38	4	및	람다-사이할로트린
B2-4	4	및	아버멕틴	B2-39	4	및	루페누론
B2-5	4	및	아자디라크틴	B2-40	4	및	메타플루미존
B2-5a	4	및	벤셀탑	B2-41	4	및	메토밀
B2-6	4	및	베타-사이플루트린	B2-42	4	및	메토프렌
B2-7	4	및	비펜트린	B2-43	4	및	메톡시페노자이드
B2-8	4	및	부프로페진	B2-44	4	및	니텐피람
B2-9	4	및	칼탑	B2-45	4	및	니티아진
B2-10	4	및	클로란트라닐리프롤	B2-46	4	및	노발루론
B2-11	4	및	클로르페나피르	B2-47	4	및	옥사밀
B2-12	4	및	클로르피리포스	B2-48	4	및	포스메트
B2-13	4	및	클로티아니딘	B2-49	4	및	피메트로진
B2-14	4	및	시안트라닐리프롤	B2-50	4	및	피레트린
B2-15	4	및	사이플루트린	B2-51	4	및	피리다벤
B2-16	4	및	사이할로트린	B2-52	4	및	피리달릴
B2-17	4	및	사이페메트린	B2-53	4	및	피리프록시펜
B2-18	4	및	사이로마진	B2-54	4	및	리아노딘
B2-19	4	및	델타메트린	B2-55	4	및	스피네토람
B2-20	4	및	디엘드린	B2-56	4	및	스피노사드

[0383]

혼합물 번호	Cmpd. No.	및	무착추 해충 구제제	혼합물 번호	Cmpd. No.	및	무착추 해충 구제제
B2-21	4	및	디노테푸란	B2-57	4	및	스피로디클로펜
B2-22	4	및	디오페놀란	B2-58	4	및	스피로메시펜
B2-23	4	및	에마멕틴	B2-59	4	및	스피로테트라마트
B2-24	4	및	엔도설판	B2-60	4	및	테부페노자이드
B2-25	4	및	에스펜발레레이트	B2-61	4	및	티아클로프리드
B2-26	4	및	에티프롤	B2-62	4	및	티아메복삼
B2-27	4	및	페노티오카브	B2-63	4	및	티오디카브
B2-28	4	및	페녹시카브	B2-64	4	및	티오설판-소듐
B2-29	4	및	펜발레레이트	B2-65	4	및	톨펜피라드
B2-30	4	및	피프로닐	B2-66	4	및	트랄로메트린
B2-31	4	및	플로니카미드	B2-67	4	및	트라이아자메이트
B2-32	4	및	플루벤디아미드	B2-68	4	및	트라이폴루무론
B2-33	4	및	플루페녹수론	B2-69	4	및	바실러스 투린지엔시스
B2-34	4	및	헥사폴루무론	B2-70	4	및	바실러스 투린지엔시스 델타- 내독소
B2-35	4	및	하이드라메틸논	B2-71	4	및	NPV (예를 들어, 켄스타)
B3-1	6	및	아바멕틴	B3-36	6	및	이미다클로프리드
B3-2	6	및	아세타미프리트	B3-37	6	및	인독사카브
B3-3	6	및	아미트라즈	B3-38	6	및	람다-사이할로트린
B3-4	6	및	아바멕틴	B3-39	6	및	루페누론
B3-5	6	및	아자디라크틴	B3-40	6	및	메타폴루미존
B3-5a	6	및	벤설판	B3-41	6	및	메토밀
B3-6	6	및	베타-사이플루트린	B3-42	6	및	메토프렌
B3-7	6	및	비펜트린	B3-43	6	및	메독시페노자이드
B3-8	6	및	부프로페진	B3-44	6	및	니텐피람
B3-9	6	및	칼답	B3-45	6	및	니티아진
B3-10	6	및	클로란트라닐리프롤	B3-46	6	및	노발루론
B3-11	6	및	클로르페나피르	B3-47	6	및	옥사밀
B3-12	6	및	클로르피리포스	B3-48	6	및	포스메트

[0384]

혼합물 번호	Cmpd. No.	및	무척추 해충 구제제	혼합물 번호	Cmpd. No.	및	무척추 해충 구제제
B3-13	6	및	클로티아니딘	B3-49	6	및	피메트로진
B3-14	6	및	시안트라닐리프롤	B3-50	6	및	피레트린
B3-15	6	및	사이플루트린	B3-51	6	및	피리다벤
B3-16	6	및	사이할로트린	B3-52	6	및	피리달릴
B3-17	6	및	사이피메트린	B3-53	6	및	피리프록시펜
B3-18	6	및	사이로마진	B3-54	6	및	리아노딘
B3-19	6	및	델타메트린	B3-55	6	및	스피네토람
B3-20	6	및	디엘트린	B3-56	6	및	스피노사드
B3-21	6	및	디노테푸란	B3-57	6	및	스피로디클로펜
B3-22	6	및	디오페놀란	B3-58	6	및	스피로메시펜
B3-23	6	및	에마멕틴	B3-59	6	및	스피로테트라마트
B3-24	6	및	엔도실판	B3-60	6	및	테부페노자이드
B3-25	6	및	에스켈발레레이트	B3-61	6	및	티아클로프리드
B3-26	6	및	에티프롤	B3-62	6	및	티아메독삼
B3-27	6	및	페노티오카브	B3-63	6	및	티오디카브
B3-28	6	및	페녹시카브	B3-64	6	및	티오선탐-소듐
B3-29	6	및	펜탈레레이트	B3-65	6	및	톨펜피라드
B3-30	6	및	피프로닐	B3-66	6	및	트랄로메트린
B3-31	6	및	플로니카미드	B3-67	6	및	트라이아자메이트
B3-32	6	및	플루벤디아미드	B3-68	6	및	트라이플루무론
B3-33	6	및	플루페녹수론	B3-69	6	및	<i>바실러스</i> <i>투린지엔시스</i>
B3-34	6	및	헥사플루무론	B3-70	6	및	<i>바실러스</i> <i>투린지엔시스</i> 델타- 내독소
B3-35	6	및	하이드라메틸논	B3-71	6	및	NPV (예를 들어, 캠스타)

[0385]

[0386]

표 B에 열거된 구체적인 혼합물은 전형적으로 화학식 1의 화합물을 다른 무척추 해충 제제와 표 A에 명시된 비로 배합한다.

[0387]

화학식 1의 화합물 (화합물 번호 (Cmpd. No.)는 인덱스 표 A의 화합물을 말함) 및 추가의 살진균제를 포함하는 특정 조성물의 실시 형태가 하기에 표 C에 기재되어 있다.

[0388] [표 C]

혼합물 번호	Cmpd. No.	및	살진균제	혼합물 번호	Cmpd. No.	및	살진균제
C1-1	1	및	프로베나졸	C1-17	1	및	디페노코나졸
C1-2	1	및	티아디닐	C1-18	1	및	사이프로코나졸
C1-3	1	및	아이소티아닐	C1-19	1	및	프로피코나졸
C1-4	1	및	피로퀼론	C1-20	1	및	페녹사닐
C1-5	1	및	메토미노스트로빈	C1-21	1	및	페림존
C1-6	1	및	플루몰라닐	C1-22	1	및	프탈라이드
C1-7	1	및	발리다마이신	C1-23	1	및	카수가마이신
C1-8	1	및	푸라메트피르	C1-24	1	및	피록시스트로빈
C1-9	1	및	펜사이쿠론	C1-25	1	및	펜티오피라드
C1-10	1	및	시메코나졸	C1-26	1	및	과목사돈
C1-11	1	및	오리사스트로빈	C1-27	1	및	사이목사닐
C1-12	1	및	트라이플록시스트로빈	C1-28	1	및	프로퀴나지드
C1-13	1	및	아이소프로티올란	C1-29	1	및	플루실라졸
C1-14	1	및	아족시스트로빈	C1-30	1	및	만코젯
C1-15	1	및	트라이사이클라졸	C1-31	1	및	수산화구리
C1-16	1	및	헥사코나졸	C1-32	1	및	(a)
C2-1	4	및	프로베나졸	C2-17	4	및	디페노코나졸
C2-2	4	및	티아디닐	C2-18	4	및	사이프로코나졸
C2-3	4	및	아이소티아닐	C2-19	4	및	프로피코나졸
C2-4	4	및	피로퀼론	C2-20	4	및	페녹사닐
C2-5	4	및	메토미노스트로빈	C2-21	4	및	페림존
C2-6	4	및	플루몰라닐	C2-22	4	및	프탈라이드
C2-7	4	및	발리다마이신	C2-23	4	및	카수가마이신
C2-8	4	및	푸라메트피르	C2-24	4	및	피록시스트로빈
C2-9	4	및	펜사이쿠론	C2-25	4	및	펜티오피라드
C2-10	4	및	시메코나졸	C2-26	4	및	과목사돈
C2-11	4	및	오리사스트로빈	C2-27	4	및	사이목사닐
C2-12	4	및	트라이플록시스트로빈	C2-28	4	및	프로퀴나지드
C2-13	4	및	아이소프로티올란	C2-29	4	및	플루실라졸
C2-14	4	및	아족시스트로빈	C2-30	4	및	만코젯
C2-15	4	및	트라이사이클라졸	C2-31	4	및	수산화구리
C2-16	4	및	헥사코나졸	C2-32	4	및	(a)

[0389]

혼합물 번호	Cmpd. No.	및	살진균제	혼합물 번호	Cmpd. No.	및	살진균제
C3-1	6	및	프로베나졸	C3-17	6	및	디페노코나졸
C3-2	6	및	티아디닐	C3-18	6	및	사이프로코나졸
C3-3	6	및	아이소티아닐	C3-19	6	및	프로피코나졸
C3-4	6	및	피로퀼론	C3-20	6	및	페녹사닐
C3-5	6	및	메토미노스트로빈	C3-21	6	및	페림존
C3-6	6	및	플루몰라닐	C3-22	6	및	프탈라이드
C3-7	6	및	발리다마이신	C3-23	6	및	카수가마이신
C3-8	6	및	푸라메트피르	C3-24	6	및	피록시스트로빈
C3-9	6	및	펜사이쿠론	C3-25	6	및	펜티오피라드
C3-10	6	및	시메코나졸	C3-26	6	및	과목사돈
C3-11	6	및	오리사스트로빈	C3-27	6	및	사이목사닐
C3-12	6	및	트라이플록시스트로빈	C3-28	6	및	프로퀴나지드
C3-13	6	및	아이소프로티올란	C3-29	6	및	플루실라졸
C3-14	6	및	아족시스트로빈	C3-30	6	및	만코젯
C3-15	6	및	트라이사이클라졸	C3-31	6	및	수산화구리
C3-16	6	및	헥사코나졸	C3-32	6	및	(a)

(a) 1-[4-[4-[5-(2,6-다이플루오로페닐)-4,5-다이하이드로-3-아이속사졸릴]-2-티아졸릴]-1-피페리디닐]-2-[5-메틸-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에탄온

[0390]

[0391] 기생 선충은 전형적으로 조성물 형태인 하나 이상의 본 발명의 화합물을 생물학적 유효량으로 농경학적 및/또는

비농경학적 침입 장소를 포함하는 해충 환경에, 보호될 영역에, 또는 구제될 해충에 직접적으로 적용함으로써 농경학적 및 비농경학적 응용에서 구제된다.

[0392] 따라서, 본 발명은 기생 선충 또는 이의 환경을 생물학적 유효량의 하나 이상의 본 발명의 화합물, 또는 적어도 하나의 그러한 화합물을 포함하는 조성물 또는 적어도 하나의 그러한 화합물 및 적어도 하나의 추가의 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제를 포함하는 조성물과 접촉시키는 것을 포함하는, 농경학적 및/또는 비농경학적 응용에서 기생 선충을 구제하는 방법을 포함한다. 본 발명의 화합물 및 적어도 하나의 추가의 생물 활성 화합물 또는 생물 활성제를 포함하는 적절한 조성물의 예로는 추가의 활성 화합물이 본 발명의 화합물과 동일한 과립 상에 존재하거나 본 발명의 화합물과 별도의 과립 상에 존재하는 과립형 조성물을 포함한다.

[0393] 기생 선충으로부터 농작물을 보호하기 위하여 본 발명의 화합물 또는 조성물과 접촉시키기 위해서는, 본 화합물 또는 조성물은 전형적으로 식재 전에 작물의 종자에, 작물 식물의 경엽 (예를 들어, 잎, 줄기, 꽃, 과실)에, 또는 작물이 식재되기 전 또는 후에 토양 또는 다른 성장 매질에 적용된다.

[0394] 접촉 방법의 일 실시 형태는 분무에 의한 것이다. 대안적으로, 본 발명의 화합물을 포함하는 과립형 조성물은 식물 경엽 또는 토양에 적용될 수 있다. 본 발명의 화합물은 또한 식물, 액체 제형의 토양 관주액으로서, 토양에의 과립형 제형으로서, 육묘 상자 처리제 또는 이식 침지액으로서 적용되는 본 발명의 화합물을 포함하는 조성물과 접촉시킴으로써 식물 흡수를 통해 효과적으로 전달될 수 있다. 토양 관주용 액체 제형 형태의 본 발명의 조성물이 주목된다. 또한 기생 선충 또는 이의 환경을 생물학적 유효량의 본 발명의 화합물 또는 생물학적 유효량의 본 발명의 화합물을 포함하는 조성물과 접촉시키는 단계를 포함하는 기생 선충의 구제 방법이 주목된다. 추가로, 환경이 토양이고 조성물이 토양 관주 제형으로서 토양에 적용되는 것인 무척추 해충의 구제 방법이 주목된다. 추가로, 본 발명의 화합물이 또한 침입 장소에의 국소 적용에 의해 효과적임이 주목된다. 다른 접촉 방법은 직접 및 잔류 분무, 공기 분무, 젤, 종자 코팅, 마이크로캡슐화, 전신 흡수, 미끼, 귀 태그, 블루스, 연무기, 훈연제, 에어로졸, 분제 및 다수의 다른 것에 의한 본 발명의 화합물 또는 조성물의 적용을 포함한다. 접촉 방법의 일 실시 형태는 본 발명의 화합물 또는 조성물을 포함하는 치수 안정성 비료 과립, 스틱 또는 정제를 포함한다. 본 발명의 화합물은 또한 무척추 동물 구제 장치 (예를 들어, 포충망)를 제작하기 위한 물질 내로 함침될 수 있다.

[0395] 본 발명의 화합물은 또한 기생 선충으로부터 종자를 보호하기 위한 종자 처리에 유용하다. 본 발명의 명세서 및 특허청구범위와 관련하여, 종자 처리는 종자를, 전형적으로는 본 발명의 조성물로 제형화된 생물학적 유효량의 본 발명의 화합물과 접촉시키는 것을 의미한다. 이러한 종자 처리로 인해 무척추 토양 해충으로부터 종자가 보호되며, 일반적으로 발아한 종자로부터 발육된 모종의 토양과 접촉하고 있는 뿌리 및 다른 식물 부분이 또한 보호될 수 있다. 종자 처리는 또한 발육하고 있는 식물 내로의 본 발명의 화합물 또는 제2 활성 성분의 전위에 의해 경엽을 보호할 수 있다. 종자 처리는 특수 형질을 발현하도록 유전적으로 형질전환된 식물이 발아될 종자를 비롯한 모든 유형의 종자에 적용될 수 있다. 유전적으로 형질전환된 식물의 대표적인 예로는 기생 선충에 유해한 단백질을 발현하는 것, 예컨대 *바실러스 투린지엔시스* 독소 또는 제초제 내성을 발현하는 것, 예컨대 글리포세이트 내성을 제공하는 글리포세이트 아세틸트랜스퍼라아제를 들 수 있다.

[0396] 종자 처리의 한 방법은 파종 전에 본 발명의 화합물 (즉, 제형화된 조성물로서)을 종자에 분무하거나 살포함에 의한 것이다. 종자 처리용으로 제형화된 조성물은 일반적으로 필름 형성제 또는 고착제 (adhesive agent)를 포함한다. 따라서, 전형적으로 본 발명의 종자 코팅 조성물은 생물학적 유효량의 화학식 1의 화합물, 이의 *N*-옥사이드 또는 이의 염, 및 필름 형성제 또는 고착제를 포함한다. 종자는 유동성 액상 수화제를 직접적으로 종자의 텀블링층 (tumbling bed) 내로 분무한 다음 종자를 건조시킴으로써 코팅될 수 있다. 대안적으로, 수중에서의 습윤 분말, 용액, 유현탁제, 유제 및 에멀전과 같은 다른 제형 유형이 종자 상에 분무될 수 있다. 이러한 방법은 종자 상에 필름 코팅을 적용하는데 특히 유용하다. 다양한 코팅기 및 코팅 방법은 당업자가 이용가능하다. 적절한 방법에는 문헌 [P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Monograph No. 57] 및 여기에 기재된 참고문헌에 열거된 것들이 포함된다.

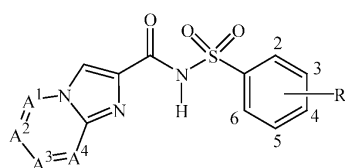
[0397] 처리된 종자는 전형적으로 종자 100 kg 당 약 0.1 g 내지 1 kg (즉, 처리 전 종자의 약 0.0001 내지 1 중량%)의 양의 본 발명의 화합물을 포함한다. 종자 처리용으로 제형화된 유동성 현탁제는 전형적으로 활성 성분 약 0.5 내지 약 70%, 필름 형성 접착제 약 0.5 내지 약 30%, 분산제 약 0.5 내지 약 20%, 증점제 0 내지 약 5%, 안료 및/또는 염료 0 내지 약 5%, 소포제 0 내지 약 2%, 방부제 0 내지 약 1%, 및 휘발성 액체 희석제 0 내지 약 75%를 포함한다.

[0398] 농경학적 응용의 경우, 효과적인 구제에 필요한 적용량 (즉, "생물학적 유효량")은 구제될 선충의 종, 선충의

생활 주기, 생활 단계, 그 크기, 위치, 1년 중 시기, 숙주 작물 또는 동물, 섭식 행동, 교배 행동, 환경 습도, 온도 등과 같은 인자에 의존할 것이다. 통상적인 환경 하에서, 헥타르 당 약 0.01 내지 2 kg의 활성 성분의 적용량이 농경학적 생태계에서 선충을 구제하기에 충분하지만, 0.0001 kg/헥타르만큼 적은 양이 충분할 수 있거나 8 kg/헥타르만큼 많은 양이 요구될 수도 있다. 비농경학적 응용의 경우, 효과적인 사용률은 약 1.0 내지 50 mg/제곱미터의 범위일 것이지만, 0.1 mg/제곱미터만큼 적은 양이 충분할 수 있거나 150 mg/제곱미터만큼 많은 양이 요구될 수도 있다. 당업자는 원하는 기생 선충 구제 레벨에 필요한 생물학적 유효량을 용이하게 결정할 수 있다.

[0399] 본 명세서에 기재된 방법에 의해 제조된 본 발명의 화합물은 인덱스 표 A 및 B에 나타낸다. 하기 약어는 후술하는 인덱스 표에 사용된다: Cmpd는 화합물을 의미한다. 변수 "R"은 인덱스 표에 기재된 하나의 치환기 또는 치환기의 조합을 나타낸다. 약어 "Ex."는 "실시예"를 나타내며, 화합물이 제조되는 합성예를 나타내는 번호가 이어진다.

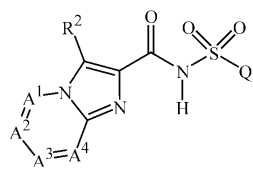
[0400] 인덱스 표 A



Cmpd	A¹	A²	A³	A⁴	R	m.p. (°C)
1 (Ex. 3)	CH	CCF₃	N	CH	2-클로로, 5-메톡시	238-237
2	CH	CH	CH	N	2-클로로, 5-메톡시	213-214
3	CH	CH	CH	N	2-클로로, 5- 트라이플루오로메틸	214-215
4 (Ex. 1)	CH	CBr	CH	N	2-클로로, 5- 트라이플루오로메틸	>250
5	CH	CCF₃	CH	N	2,5-다이메틸, 4-시아노	212-213
6 (Ex. 2)	CH	CCF₃	CH	N	2-클로로, 5- 트라이플루오로메틸	211-212
7	CH	CCF₃	CH	N	2-클로로, 5-메톡시	221-222
8	CH	CBr	CH	N	2-클로로, 5-메톡시	211-212
9	CH	CBr	CH	N	2,5-다이메틸, 4-시아노	>250
10	CH	CBr	CH	N	2-브로모, 5- 트라이플루오로메틸	>250
11	CH	CCF₃	N	CH	2,5-다이메틸	277-280
12	CH	CCF₃	N	CH	2-클로로, 5- 트라이플루오로메틸	217-219
13	CH	CCF₃	N	Cl	2-클로로, 5- 트라이플루오로메틸	125-127
14	CH	CCF₃	N	Cl	2-클로로, 5-메톡시	196-199

[0401]

[0402] 인덱스 표 B



R²는 H이다.

Cmpd	A¹	A²	A³	A⁴	Q	m.p. (°C)
15	CH	CBr	CH	N	3-메틸-2-티에닐	233-234

[0403]

[0404] 하기 시험은 특정 해충에 대한 본 발명의 화합물의 구제 효과를 예증한다. "구제 효과"는 유의하게 감소된 섭식을 야기하는 기생 선충 발생의 억제 (사멸 포함)를 나타낸다. 그러나, 화합물에 의해 주어진 해충 구제 보호는 이들 종류에 한정되지 않는다.

[0405] 본 발명의 생물학적 실시예

[0406] 시험 A

[0407] 접촉 및/또는 침투 수단을 통한 고구마 뿌리혹 선충 (*Meloidogyne incognita*) 구제를 모래흙 혼합물 및 오이 모종으로 채워진 덮개가 열려진 작은 용기로 구성되는 시험 유닛에서 평가하였다.

[0408] 50% 아세톤 및 50% 물을 함유하는 용액을 사용하여, 시험 화합물을 제형화하였다. 시험 화합물을 250 ppm의 활성 성분의 농도로 시험 유닛의 토양에 직접 적용하였다. 각 시험을 3회 반복 실시하였다. 처리 후에, 시험 유닛을 1 시간 동안 건조시킨 후에, 약 250 초간의 유생 시기 (J2)의 유충을 토양으로 피펫으로 옮겼다. 시험 유닛을 27°C로 유지하고, 필요에 따라 7 일간 물을 주었다.

[0409] 미처리 대조군과 비교하여 관찰된 뿌리혹병 (root gall)이 발생된 양에 의해 살선충 효능을 측정하였다. 뿌리혹병이 발생되지 않음은 100% 선충 구제를 나타내었다. 미처리 대조군에 발견된 것에 상당하는 뿌리혹병 발생은 0% 구제를 나타내었다. 유의한 식물 독성을 나타내는 화합물에 대해서는 선충 구제 등급 (control rating)을 평가하지 않았다.

[0410] 250 ppm의 농도로 시험된 화합물 중, 하기 화합물이 우수한 레벨의 식물 보호 (용매 처리된 대조군과 비교하여, 뿌리혹병이 50% 이상 감소됨)를 제공하며, 유의한 식물 독성을 나타내지 않았다: 1, 4, 6, 11 및 12.