



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2018-0098601
(43) 공개일자 2018년09월04일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)

C07D 307/68 (2006.01) A01N 43/08 (2006.01)
A01N 43/10 (2006.01) A01N 43/78 (2006.01)
C07D 277/56 (2006.01) C07D 307/08 (2006.01)
C07D 333/38 (2006.01)

(52) CPC특허분류

C07D 307/68 (2013.01)
A01N 43/08 (2013.01)

(21) 출원번호 10-2018-7021287

(22) 출원일자(국제) 2018년12월08일
심사청구일자 없음

(85) 번역문제출일자 2018년07월24일

(86) 국제출원번호 PCT/US2016/065580

(87) 국제공개번호 WO 2017/116646
국제공개일자 2017년07월06일

(30) 우선권주장

62/272,728 2015년12월30일 미국(US)
62/353,795 2016년06월23일 미국(US)

(71) 출원인

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 필립

미국 19808 델라웨어주 윌밍톤 페어힐 드라이브
148

던젤리스, 앤드류 존

미국 19810 델라웨어주 윌밍톤 보딘 드라이브
2912

캠벨, 매튜 제임스

미국 21911 메릴랜드주 라이징 선 조셉 박스 하이
웨이 791

(74) 대리인

양영준, 심미성

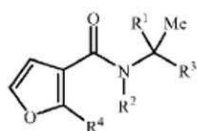
전체 청구항 수 : 총 26 항

(54) 발명의 명칭 살선충성 헤테로환 아미드

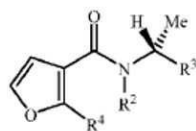
(57) 요약

화학식 1, 1a, 1b 및 2의 화합물이 개시된다(R1, R1a, R1b, R2, R3 및 R4는 본 발명에 정의된 바와 같음). 또한, 화학식 1, 1a 및 1b의 화합물을 함유하는 조성물, 및 기생 선충 또는 그 환경을 화학식 1, 1a, 1b 및 2의 화합물 또는 조성물의 생물학적 유효량과 접촉시키는 단계를 포함하는 기생 선충 방제 방법이 개시된다.

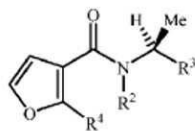
[화학식 1]



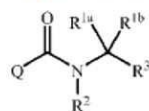
[화학식 1a]



[화학식 1b]



[화학식 2]



(52) CPC특허분류

A01N 43/10 (2013.01)

A01N 43/78 (2013.01)

C07D 277/56 (2013.01)

C07D 307/08 (2013.01)

C07D 333/38 (2013.01)

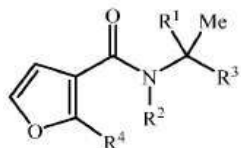
명세서

청구범위

청구항 1

화학식 1로부터 선택되는 화합물로서,

[화학식 1]



R^1 이 H 또는 메틸이고;

R^2 가 H; 또는 C_1 - C_6 알킬, C_2 - C_6 알케닐, C_2 - C_6 알키닐, C_3 - C_6 시클로알킬, C_2 - C_6 알킬카보닐, C_2 - C_6 알콕시카보닐, C_1 - C_6 알킬티오 또는 C_1 - C_6 알킬설폰일이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);

R^3 가 C_2 - C_{16} 알킬, C_2 - C_{16} 알케닐, C_2 - C_{16} 알키닐 또는 C_3 - C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);

R^4 가 Cl 또는 Br이고;

각각의 R^5 가 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1 - C_3 알콕시, C_3 - C_6 시클로알킬, C_1 - C_3 알킬티오, C_1 - C_3 알킬설피닐 또는 C_1 - C_3 알킬설폰일이고;

각각의 R^6 가 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1 - C_3 알콕시, C_3 - C_6 시클로알킬, C_1 - C_3 알킬티오, C_1 - C_3 알킬설피닐, C_1 - C_3 알킬설폰 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;

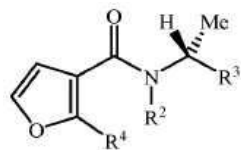
각각의 R^a , R^b 및 R^c 가 독립적으로 C_1 - C_6 알킬이고;

단, (i) R^1 및 R^2 가 H인 경우, R^3 는 C_2 - C_3 알케닐, C_2 - C_3 알키닐, 시클로프로필, $-CH_2OCH_3$, $-CH_2SCH_3$, 비치환 C_2 - C_3 알킬, 또는 Cl 또는 Br로 치환된 C_2 - C_3 알킬이 아니고; (ii) R^1 이 메틸인 경우, R^3 는 에틸이 아니고; (iii) R^1 이 H이고 R^2 가 메틸인 경우, R^3 는 에틸이 아닌 화합물.

청구항 2

화학식 1a로부터 선택되는 화합물로서,

[화학식 1a]



R^2 가 H; 또는 C_1 - C_6 알킬, C_2 - C_6 알케닐, C_2 - C_6 알키닐, C_3 - C_6 시클로알킬, C_2 - C_6 알킬카보닐, C_2 - C_6 알콕시카보닐,

C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설폰일이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);

R^3 가 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);

R^4 가 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;

각각의 R^5 가 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐 또는 C_1-C_3 알킬설폰일이고;

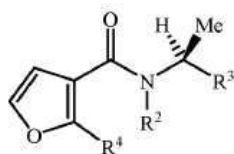
각각의 R^6 가 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐, C_1-C_3 알킬설폰일 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;

각각의 R^a , R^b 및 R^c 가 독립적으로 C_1-C_6 알킬인 화합물.

청구항 3

화학식 1b로부터 선택되는 화합물로서,

[화학식 1b]



R^2 가 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐, C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설폰일이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);

R^3 가 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);

R^4 가 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;

각각의 R^5 가 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐 또는 C_1-C_3 알킬설폰일이고;

각각의 R^6 가 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐, C_1-C_3 알킬설폰일 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;

각각의 R^a , R^b 및 R^c 가 독립적으로 C_1-C_6 알킬인 화합물.

청구항 4

제1항 내지 제3항 중 어느 한 항에 있어서,

R^2 가 H이고;

R^3 가 $-CR^{6a}R^{6b}R^{6c}$ 이고;

R^4 가 Cl 또는 Br이고;

R^{6a} 가 H, C_1-C_3 알킬, C_2-C_3 알케닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고;

R^{6b} 가 C_1-C_3 알킬이고;

R^{6c} 가 H, 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐, C_1-C_3 알킬설폰닐 또는 $-CR^{7a}R^{7b}R^{7c}$ 이고;

R^{7a} 가 H, 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐, C_1-C_3 알킬설폰닐 또는 C_1-C_2 알킬이고;

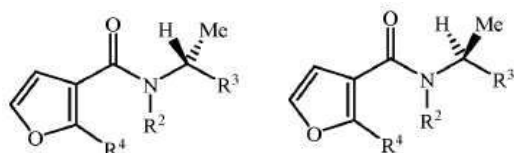
R^{7b} 가 H, 할로젠, 시아노 또는 C_1-C_2 알킬이고;

R^{7c} 가 H, 할로젠, 시아노 또는 C_1-C_2 알킬인 화합물.

청구항 5

(i) 화학식 1a의 화합물 및 화학식 1b의 화합물

[화학식 1a] [화학식 1b]



(여기서 1b 대 1a의 비는 적어도 55:45이고;

R^2 는 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐, C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설폰닐이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);

R^3 는 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);

R^4 는 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;

각각의 R^5 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐 또는 C_1-C_3 알킬설폰닐이고;

각각의 R^6 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐, C_1-C_3 알킬설폰닐 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;

각각의 R^a , R^b 및 R^c 는 독립적으로 C_1-C_6 알킬임); 및

(ii) 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물.

청구항 6

제5항에 있어서, **1b** 대 **1a**의 비가 적어도 65:35인 조성물.

청구항 7

제5항에 있어서, **1b** 대 **1a**의 비가 적어도 75:25인 조성물.

청구항 8

제5항에 있어서, **1b** 대 **1a**의 비가 적어도 85:15인 조성물.

청구항 9

제5항에 있어서, **1b** 대 **1a**의 비가 적어도 95:5인 조성물.

청구항 10

제5항에 있어서, **1b** 대 **1a**의 비가 적어도 97:3인 조성물.

청구항 11

제5항에 있어서, **1b** 대 **1a**의 비가 적어도 99:1인 조성물.

청구항 12

제5항에 있어서, **1b** 대 **1a**의 비가 본질적으로 100:0인 조성물.

청구항 13

제1항 내지 제12항 중 어느 한 항의 화합물 및, 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물로서, 선택적으로 적어도 하나의 추가 생물학적 활성 화합물 또는 제제를 더 포함하는 조성물.

청구항 14

제5항 내지 제12항 중 어느 한 항에 있어서, 화학식 **1b**의 화합물은 살선충성 유효량으로 존재하는 조성물.

청구항 15

제13항에 있어서, 적어도 하나의 추가 생물학적 활성 화합물 또는 제제는 아바멕틴, 아세페이트, 아세퀴노실, 아세타미프리트, 아크리나트린, 아피도피로펜, 아미도플루메트, 아미트라즈, 아버멕틴, 아자디라크틴, 아진포스-메틸, 벤푸라카브, 벤선탭, 비펜트린, 비페나제이트, 비스트리플루론, 보레이트, 부프로페진, 카두사포스, 카바틸, 카보퓨란, 카르타, 카줄, 클로르안트라닐리프롤, 클로르페나피르, 클로르플루아주론, 클로르피리포스, 클로르피리포스-메틸, 크로마페노자이드, 클로펜테진, 클로티아니딘, 사이안트라닐리프롤, 사이클라닐리프롤, 시클로프로트린, 시클록사프리트, 사이플루메토펜, 사이플루트린, 베타-사이플루트린, 사이할로트린, 감마-사이할로트린, 람다-사이할로트린, 사이피메트린, 알파-사이피메트린, 제타-사이피메트린, 사이로마진, 델타메트린, 디아헨테우론, 디아지논, 딜드린, 디플루벤주론, 디메플루트린, 디메히포, 디메토에이트, 디노테퓨란, 디오페놀란, 에마멕틴, 엔도선탭, 에스펜발러레이트, 에티프롤, 에토펜프록스, 에톡사줄, 펜부타틴 옥사이드, 페니트로티온, 페노티오캡, 페녹시캡, 펜프로파트린, 펜발러레이트, 피프로닐, 플로메토퀸, 플로니카미드, 플루벤디아미드, 플루시트리네이트, 플루페네림, 플루페녹수론, 플루페녹시스트로빈, 플루엔셀폰, 플루오피람, 플루피라디퓨론, 플루발리네이트, 타우-플루발리네이트, 포노포스, 포메타네이트, 포스티아제이트, 할로페노자이드, 헵타플루트린, 헥사플루무론, 헥시티아죽스, 히드라메틸논, 이미다클로프리트, 인독사카브, 살충 비누, 이소펜포스, 루페뉴론, 말라티온, 메퍼플루트린, 메타플루미존, 메탈알데히드, 메타미도포스, 메티다티온, 메티오캡, 메토밀, 메토프렌, 메톡시클로르, 메톡시페노자이드, 메토플루트린, 모노크로토프스, 모노플루오로트린, 니코틴, 니텐피람, 니티아진, 노발루론, 노비플루무론, 옥사밀, 파라티온, 파라티온-메틸, 퍼메트린, 포레이트, 포살론, 포스메트, 포스파미돈, 피리미캡, 프로페노포스, 프로플루트린, 프로파자이트, 프로트리헨부트, 피플루부미드, 피메트로진, 피라플루프롤, 피레트린, 피리다벤, 피리달릴, 피리플루퀴나존, 피리미노스트로빈, 피리프롤, 피리프록시펜, 로테논, 리아노딘, 실라플루오펜, 스피네토람, 스피노사드, 스피로디클로펜, 스피로메시펜, 스피로테트라멧, 설프로포스, 설프사플로르, 테부페노자이드, 테부헨피라드, 테플루벤주론, 테플루트린, 터부포스, 테트라클로르빈포스, 테트라메트린, 테트라메틸플루트린, 티아클로프리트, 티아메톡삼, 티오디캡, 티오선탭

-소듐, 티옥사자펜, 톨펜피라드, 트랄로메트린, 트리아자메이트, 트리클로르폰, 트리플루메조피림, 트리플루무론, 바실러스 튜링겐시스 델타-엔도톡신, 곤충병원성 세균, 곤충병원성 바이러스 및 곤충병원성 진균으로 이루어진 군으로부터 선택되는 조성물.

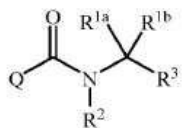
청구항 16

제15항에 있어서, 적어도 하나의 추가 생물학적 활성 화합물 또는 제제는 아바멕틴, 아세타미프리드, 아크리나트린, 아피도피로펜, 아미트라즈, 아버멕틴, 아자디라크틴, 베평라카브, 벤셀담, 비펜트린, 부프로페진, 카두사포스, 카바틸, 카르타, 클로르안트라닐리프롤, 클로르페나피르, 클로르피리포스, 클로티아니딘, 사이안트라닐리프롤, 사이클라닐리프롤, 시클로프로트린, 사이플루트린, 베타-사이플루트린, 사이할로트린, 감마-사이할로트린, 람다-사이할로트린, 사이피메트린, 알파-사이피메트린, 제타-사이피메트린, 사이로마진, 텔타메트린, 딜드린, 디노테푸란, 디오페놀란, 에마멕틴, 엔도셀판, 에스펜발러레이트, 에티프롤, 에토펜프록스, 에톡사졸, 페니트로티온, 페노티오캅, 페녹시캅, 펜발러레이트, 피프로닐, 플로메토퀸, 플로니카미드, 플루벤디아미드, 플루페녹수론, 플루페녹시스트로빈, 플루엔셀폰, 플루피프롤, 플루피라디퓨론, 플루발리네이트, 포메타네이트, 포스티아제이트, 헵타플루트린, 헥사플루무론, 히드라메틸논, 이미다클로프리드, 인독사카브, 루페뉴론, 메페플루트린, 메타플루미존, 메티오캅, 메토밀, 메토프렌, 메톡시페노자이드, 메토플루트린, 모노플루오로트린, 니텐피람, 니티아진, 노발루론, 옥사밀, 피플루부미드, 피메트로진, 피레트린, 피리다벤, 피리달릴, 피리미노스트로빈, 피리프록시펜, 리아노딘, 스피네토람, 스피노사드, 스피로디클로펜, 스피로메시펜, 스피로테트라멧, 설포사폴로르, 테부페노자이드, 테트라메트린, 테트라메틸플루트린, 티아클로프리드, 티아메톡삼, 티오디캅, 티오셀담-소듐, 트랄로메트린, 트리아자메이트, 트리플루메조피림, 트리플루무론, 바실러스 튜링겐시스 델타-엔도톡신, 바실러스 튜링겐시스 모든 균주 및 핵 다각체병 바이러스의 모든 균주로 이루어진 군으로부터 선택되는 조성물.

청구항 17

토양에 사는 선충류 또는 그 환경을 화학식 2로부터 선택되는 화합물의 생물학적 유효량과 접촉시키는 단계를 포함하는, 토양에 사는 선충을 방제하는 방법으로서,

[화학식 2]



Q가 퓨란, 티오펜 또는 티아졸 고리와 화학식 2의 잔기 사이에서 이들을 결합시키는 탄소 원자에 인접한 탄소 원자에서 R로 치환된 퓨란, 티오펜 또는 티아졸 고리이고;

R^{1a}가 C₁-C₆ 알킬 또는 C₃-C₆ 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R⁵로 치환됨);

R^{1b}가 H 또는 C₁-C₃ 알킬이거나;

R^{1a} 및 R^{1b}가 이들이 부착된 탄소 원자와 함께, 비치환이거나 적어도 하나의 R⁵로 치환된 3원 내지 6원의 시클로알킬 고리를 형성하고;

R²가 H; 또는 C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐, C₃-C₆ 시클로알킬, C₂-C₆ 알킬카보닐, C₂-C₆ 알콕시카보닐, C₁-C₆ 알킬티오 또는 C₁-C₆ 알킬설포닐이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R⁵로 치환됨);

R³가 C₂-C₁₆ 알킬, C₂-C₁₆ 알케닐, C₂-C₁₆ 알키닐 또는 C₃-C₆ 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R⁶로 치환됨);

R⁴가 Cl, Br, I, CH₃, CF₃ 또는 시아노이고; 단, R⁴가 Me인 경우, R³는 비치환C₂ 알킬이 아니고;

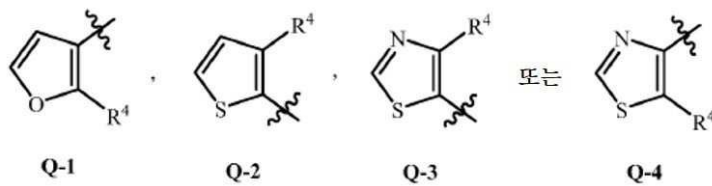
각각의 R^5 가 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐, 또는 C_1-C_3 알킬설폰일이고;

각각의 R^6 가 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐, C_1-C_3 알킬설폰일 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;

각각의 R^a , R^b 및 R^c 가 독립적으로 C_1-C_6 알킬인 방법.

청구항 18

제17항에 있어서, Q는



로 이루어진 군으로부터 선택되는 방법.

청구항 19

제18항에 있어서, Q는 Q-1인 방법.

청구항 20

제17항에 있어서, 환경은 식물인 방법.

청구항 21

제17항에 있어서, 환경은 종자인 방법.

청구항 22

제21항에 있어서, 종자는 필름 형성제 또는 접착제를 포함하는 조성물로서 제형화된 화학식 2의 화합물로 코팅되는 것인 방법.

청구항 23

토양에 사는 선충 또는 그 환경을 제5항 내지 제12항 중 어느 한 항의 조성물의 생물학적 유효량과 접촉시키는 단계를 포함하는, 토양에 사는 선충을 방제하는 방법.

청구항 24

토양에 사는 선충 또는 그 환경을 화학식 1b의 화합물의 생물학적 유효량과 접촉시키는 단계를 포함하는, 토양에 사는 선충을 방제하는 방법.

청구항 25

제5항 내지 제12항 중 어느 한 항의 조성물의 살선충제로서의 용도.

청구항 26

처리 전 종자의 약 0.0001 내지 1 중량%의 양으로 제1항 내지 제4항 중 어느 한 항의 화합물을 포함하는 처리된 종자.

발명의 설명

기술 분야

[0001] 본 발명은 농경학적 용도 및 비농경학적 용도에 적합한 특정 헤테로환 아미드와 이들의 조성물, 및 농경학적 환경 및 비농경학적 환경 모두에서 기생 선충류를 방제하기 위한 이들의 사용 방법에 관한 것이다.

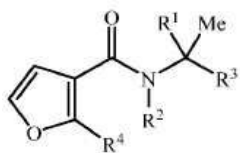
배경 기술

[0002] 식물 기생 선충류의 방제는 높은 작물 효율 달성에 있어 매우 중요하다. 선충에 의한 뿌리 손상은 작물 수확량 및 품질을 현저하게 감소시킴으로써 소비자에게 비용을 증가시킬 수 있다. 선충 기생충에서 구충제에 대한 저항력 발달이 만연해 있기 때문에, 선충류는 이용 가능한 화학 치료제에도 불구하고 가축에 계속 문제를 일으킨다. 보다 효과적이고, 비용이 적게 들고, 독성이 적고, 환경적으로 안전하거나 작용 방식이 다른 새로운 화합물에 대한 요구가 지속되고 있다.

발명의 내용

[0003] 본 발명은 화학식 1의 화합물(모든 입체 이성질체 포함) 및 이들을 함유하는 조성물 및 기생 선충을 방제하기 위한 이들의 용도에 관한 것으로서,

[0004] [화학식 1]



[0005]

[0006] 여기서,

[0007] R^1 은 H 또는 메틸이고;

[0008] R^2 는 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐, C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설폰일이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);

[0009] R^3 는 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);

[0010] R^4 는 Cl 또는 Br이고;

[0011] 각각의 R^5 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐 또는 C_1-C_3 알킬설폰일이고;

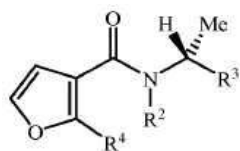
[0012] 각각의 R^6 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐, C_1-C_3 알킬설폰닐 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;

[0013] 각각의 R^a , R^b 및 R^c 는 독립적으로 C_1-C_6 알킬이고;

[0014] 단, (i) R^1 및 R^2 가 H인 경우, R^3 는 C_2-C_3 알케닐, C_2-C_3 알키닐, 시클로프로필, $-CH_2OCH_3$, $-CH_2SCH_3$, 비치환 C_2-C_3 알킬, 또는 Cl 또는 Br로 치환된 C_2-C_3 알킬이 아니고; (ii) R^1 이 메틸인 경우, R^3 는 에틸이 아니고; (iii) R^1 이 H이고 R^2 가 메틸인 경우, R^3 는 에틸이 아니다.

[0015] 본 발명은 또한 화학식 1a의 화합물 및 이들을 함유하는 조성물 및 기생 선충을 방제하기 위한 이들의 용도에 관한 것으로서,

[0016] [화학식 1a]



[0017]

[0018] 여기서,

[0019] R^2 는 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐, C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설폰일이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);

[0020] R^3 는 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);

[0021] R^4 는 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;

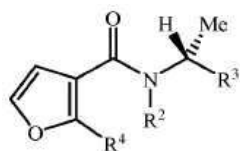
[0022] 각각의 R^5 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐 또는 C_1-C_3 알킬설폰일이고;

[0023] 각각의 R^6 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐, C_1-C_3 알킬설폰 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;

[0024] 각각의 R^a , R^b 및 R^c 는 독립적으로 C_1-C_6 알킬이다.

[0025] 본 발명은 또한 화학식 1a의 화합물 및 이들을 함유하는 조성물 및 기생 선충을 방제하기 위한 이들의 용도에 관한 것으로서,

[0026] [화학식 1a]



[0027]

[0028] 여기서,

[0029] R^2 는 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐, C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설폰일이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);

[0030] R^3 는 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);

[0031] R^4 는 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;

[0032] 각각의 R^5 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐 또는 C_1-C_3 알킬설폰일이고;

[0033] 각각의 R^6 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐,

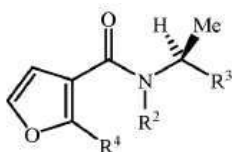
C_1-C_3 알킬설포닐 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;

[0034] 각각의 R^a , R^b 및 R^c 는 독립적으로 C_1-C_6 알킬이고;

[0035] 단, (i) R^2 가 H인 경우, R^3 는 C_2-C_3 알케닐, C_2-C_3 알키닐, 시클로프로필, $-CH_2OCH_3$, $-CH_2SCH_3$, 비치환 C_2-C_3 알킬, 또는 Cl 또는 Br로 치환된 C_2-C_3 알킬이 아니고; (ii) R^2 가 메틸인 경우, R^3 는 에틸이 아니다.

[0036] 본 발명은 또한 화학식 1b의 화합물 및 이들을 함유하는 조성물 및 기생 선충을 방제하기 위한 이들의 용도에 관한 것으로서,

[0037] [화학식 1b]



[0038]

[0039] 여기서,

[0040] R^2 는 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐, C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설포닐이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);

[0041] R^3 는 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);

[0042] R^4 는 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;

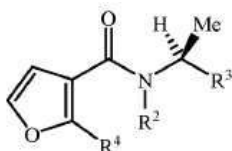
[0043] 각각의 R^5 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐 또는 C_1-C_3 알킬설포닐이고;

[0044] 각각의 R^6 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐, C_1-C_3 알킬설포닐 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;

[0045] 각각의 R^a , R^b 및 R^c 는 독립적으로 C_1-C_6 알킬이다.

[0046] 본 발명은 또한 화학식 1b의 화합물 및 이들을 함유하는 조성물 및 기생 선충을 방제하기 위한 이들의 용도에 관한 것으로서,

[0047] [화학식 1b]



[0048]

[0049] 여기서,

[0050] R^2 는 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐, C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설포닐이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);

[0051] R^3 는 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);

[0052] R^4 는 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;

[0053] 각각의 R^5 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐 또는 C_1-C_3 알킬설폰일이고;

[0054] 각각의 R^6 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐, C_1-C_3 알킬설폰일 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;

[0055] 각각의 R^a , R^b 및 R^c 는 독립적으로 C_1-C_6 알킬이고;

[0056] 단, (i) R^2 가 H인 경우, R^3 는 C_2-C_3 알케닐, C_2-C_3 알키닐, 시클로프로필, $-CH_2OCH_3$, $-CH_2SCH_3$, 비치환 C_2-C_3 알킬, 또는 Cl 또는 Br로 치환된 C_2-C_3 알킬이 아니고; (ii) R^2 가 메틸인 경우, R^3 는 에틸이 아니다.

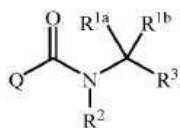
[0057] 본 발명은 또한, 화학식 1, 1a 또는 1b의 화합물 및, 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물을 제공한다. 일 구현예에서, 본 발명은 또한, 화학식 1, 1a 또는 1b의 화합물 및, 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 기생 선충 방제용 조성물을 제공하며, 상기 조성물은 적어도 하나의 추가 생물학적 활성 화합물 또는 제제를 선택적으로 더 포함한다.

[0058] 본 발명은 기생 선충 또는 그 환경을 생물학적 유효량의 화학식 1, 1a 또는 1b의 화합물과(예를 들어, 본원에 기술된 조성물로서) 접촉시키는 단계를 포함하는 기생 선충 방제 방법을 제공한다. 본 발명은 또한, 기생 선충 또는 그 환경이 생물학적 유효량의 화학식 1, 1a 또는 1b의 화합물 및, 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물과 접촉되는 이러한 방법에 관한 것이며, 상기 조성물은 생물학적 유효량의 적어도 하나의 추가 생물학적 활성 화합물 또는 제제를 선택적으로 더 포함한다.

[0059] 본 발명은 또한, 기생 선충으로부터 종자를 보호하는 방법으로서, 종자를 생물학적 유효량의 화학식 1, 1a 또는 1b의 화합물과(예를 들어, 본원에 기술된 조성물로서) 접촉시키는 단계를 포함하는 방법을 제공한다. 본 발명은 또한, 처리된 종자에 관한 것이다.

[0060] 본 발명은 또한 기생 선충 또는 그 환경을 생물학적 유효량의 화학식 2의 화합물과 접촉시키는 단계를 포함하는 기생 선충 방제 방법을 제공한다.

[0061] [화학식 2]



[0062]

[0063] 여기서,

[0064] Q는 퓨란, 티오펜 또는 티아졸 고리와 화학식 2의 잔기 사이에서 이들을 결합시키는 탄소 원자에 인접한 탄소 원자에서 R^4 로 치환된 퓨란, 티오펜 또는 티아졸 고리이고;

[0065] R^{1a} 는 C_1-C_6 알킬 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);

[0066] R^{1b} 는 H 또는 C_1-C_3 알킬이거나;

- [0067] R^{1a} 및 R^{1b} 는 이들이 부착된 탄소 원자와 함께, 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환된 3원 내지 6원의 시클로알킬 고리를 형성하고;
- [0068] R^2 는 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐, C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설폰이이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);
- [0069] R^3 는 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);
- [0070] R^4 는 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고; 단, R^4 가 Me인 경우, R^3 는 비치환 C_2 알킬이 아니고;
- [0071] 각각의 R^5 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐, 또는 C_1-C_3 알킬설폰이이고;
- [0072] 각각의 R^6 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐, C_1-C_3 알킬설폰 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;
- [0073] 각각의 R^a , R^b 및 R^c 는 독립적으로 C_1-C_6 알킬임.
- [0074] 본 발명은 또한, 기생 선충 또는 그 환경이 생물학적 유효량의 화학식 2의 화합물 및, 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물과 접촉되는 이러한 방법에 관한 것이며, 상기 조성물은 생물학적 유효량의 적어도 하나의 추가 생물학적 활성 화합물 또는 제제를 선택적으로 더 포함한다.
- [0075] 본 발명은 또한, 기생 선충으로부터 종자를 보호하는 방법으로서, 종자를 생물학적 유효량의 화학식 2의 화합물과(예를 들어, 본원에 기술된 조성물로서) 접촉시키는 단계를 포함하는 방법을 제공한다. 본 발명은 또한, 처리된 종자에 관한 것이다.
- 발명을 실시하기 위한 구체적인 내용**
- [0076] 본원에 사용된 용어 "포함한다(comprises, includes)", "포함하는(comprising, including)", "가진다", "갖는다", "함유한다", "함유하는", "~을 특징으로 하는" 또는 이들의 임의의 기타 변형 용어는 명시적으로 나타낸 임의의 제한을 조건으로, 비배타적 포함을 망라하고자 하는 것이다. 예를 들어, 요소들의 목록을 포함하는 조성물, 혼합물, 공정 또는 방법은 반드시 그러한 요소만으로 한정되는 것이 아니라, 명시적으로 열거되지 않은 다른 요소들 또는 그러한 조성물, 혼합물, 공정 또는 방법에 고유한 다른 요소들을 포함할 수도 있다.
- [0077] "~로 이루어진"이란 전이구는 명시되지 않은 임의의 요소, 단계, 또는 성분을 제외한다. 청구항의 경우, 이러한 표현에 의해 청구항은 통상적으로 관련된 불순물을 제외하고 인용된 것 이외의 물질을 포함하지 않을 것이다. "~로 이루어진"이란 어구가 전체부 바로 다음에 오는 것이 아니라 청구항의 본체부에 있는 경우, 이는 본체부에 기재된 요소만을 한정하는 것이고, 다른 요소들이 전체적으로 청구항에서 배제되는 것은 아니다.
- [0078] "본질적으로 ~로 이루어진"이란 전이구는 문자 그대로 개시된 것 외에, 물질, 단계, 특징, 성분 또는 요소를 포함하는 조성물 또는 방법을 정의하는 데 사용된다(단, 이러한 추가적인 물질, 단계, 특징, 성분 또는 요소는 청구된 발명의 기본적인 신규한 특성(들)에 실질적으로 영향을 미치지 않음). "본질적으로 ~로 이루어진"이란 용어는 "포함하는"과 "~로 이루어진" 사이의 중간 지점을 차지한다.
- [0079] 본 출원인들이 "포함하는"과 같은 개방형 용어로 발명 또는 발명의 일부를 정의한 경우, (달리 언급되지 않는 한) 이러한 설명이 "본질적으로 ~로 이루어진" 또는 "~로 이루어진"이란 용어를 사용하여 이러한 발명을 기술하는 것으로도 해석되어야 함은 쉽게 이해될 것이다.
- [0080] 또한, 명시적으로 반대로 언급되지 않는 한, "또는"은 포합적 논리합을 나타내는 것이며 배타적 논리합을 나타내는 것이 아니다. 예를 들어, 조건 A 또는 B는 다음 중 임의의 하나에 의해 충족된다: A는 참(또는 존재)이고

B는 거짓(또는 부존재), A는 거짓(또는 부존재)이고 B는 참(또는 존재), 및 A와 B 모두 참(또는 존재).

- [0081] 또한, 본 발명의 요소 또는 성분 앞의 부정 관사("a" 및 "an")는 이러한 요소 또는 성분의 경우(즉, 발생)의 수에 관해서는 비제한적인 것으로 의도된 것이다. 따라서, 단수형("a" 또는 "an")은 하나 또는 적어도 하나를 포함하는 것으로 파악되어야 하며, 요소 또는 성분의 단수형은 그 수가 명백히 단수임을 의미하지 않는 한 복수형도 포함한다.
- [0082] 본 명세서 및 청구범위에 사용된 용어 "선충"은 선형동물문의 생물을 지칭한다. 일반적으로 정의된 바와 같이, "기생충"은 "숙주"로 기술된 다른 생물(예컨대, 식물, 동물 또는 인간) 내에서 살거나 자라거나 그러한 생물을 먹고 산다. 본 명세서 및 청구범위에 언급된 "기생 선충"은 특히, 식물, 동물(특히 척추 동물) 또는 인간에서 조직에 손상 또는 피해를 입히거나 다른 형태의 질병을 일으키는 선충이다.
- [0083] 기생충 "침입"은 식물, 인간 또는 동물에게 위협을 초래하는 다수의 기생충의 존재를 나타낸다. 기생충은 환경, 예를 들어, 인간 또는 동물의 집, 또는 주변 건물 또는 구조물, 농작물 또는 다른 유형의 식물, 동물의 잠자리, 동물의 피부 또는 털 등에 존재할 수 있다. 언급된 침입이 동물 내, 예를 들어 혈액 또는 다른 내부 조직에 있는 경우, 침입이란 용어는, 달리 명시하지 않는 한, 당업계에서 일반적으로 이해되는 용어인 "감염"과 동의어이기도 하다.
- [0084] 본 명세서 및 청구범위에 언급된 용어 "구충(parasitocidal, parasitocidally)"은 기생 선충으로부터 식물, 동물 또는 인간을 보호하기 위한 기생 선충에 대한 관찰 가능한 효과를 나타낸다. 구충 효과는 일반적으로 표적 기생 선충의 발생 또는 활동을 감소시키는 것과 관련이 있다. 이러한 선충에 대한 효과는 피사, 죽음, 성장 지연, 숙주 식물, 동물 또는 인간에서의 이동성 감소 또는 숙주 식물, 동물 또는 인간에 남아 있는 능력 감소, 섭식 감소 및 번식 억제를 포함한다. 기생 선충류에 대한 이러한 효과는 식물, 동물 또는 인간에 대한 기생충 침입 또는 감염의 방제(예방, 감소 또는 제거 포함)를 제공한다. 따라서, 기생 선충의 "방제"는 선충에 대해 구충 효과를 달성하는 것을 의미한다. 기생 선충을 방제하기 위해 화학적 화합물을 적용하는 맥락에서 "구충 유효량" 및 "생물학적 유효량"이란 표현은 기생 선충을 방제하는 데 충분한 화합물의 양을 의미한다.
- [0085] 용어 "농경학적"은, 예컨대 음식 및 섬유를 위한 농작물의 생산을 의미하며, 대두 및 기타 콩류, 곡물(예컨대, 밀, 귀리, 보리, 호밀, 쌀, 옥수수/콘), 잎줄기 채소(예컨대, 양상추, 양배추, 및 기타 양배추류), 과일 채소류(예컨대, 토마토, 고추, 가지, 십자화과 및 박과식물), 감자, 고구마, 포도, 목화, 나무 열매(예컨대, 사과, 씨 및 감귤류), 작은 과일(베리, 체리) 및 기타 특용 작물(예컨대, 카놀라, 해바라기, 올리브)의 재배를 포함한다.
- [0086] 용어 "비농경학적"은 원예 작물(예컨대 밭에서 재배되지 않는 온실 식물, 묘목 또는 관상용 식물), 주거, 농업, 상업 및 산업 구조, 잔디(예컨대, 잔디 농장, 목초지, 골프 코스, 잔디밭, 운동장 등), 목재 제품, 저장 제품, 혼농임업 및 식생 관리, 공중 보건(즉, 인간) 및 동물 보건(예컨대, 애완동물, 가축 및 가금류와 같은 사육 동물, 야생동물과 같은 비사육 동물) 용도와 같은 농작물 이외의 것을 의미한다.
- [0087] 비농경학적 분야는 보호 대상 동물에게 구충 유효량(즉, 생물학적 유효량)의 본 발명의 화합물을 일반적으로 수의학적 사용을 위해 제형화된 조성물 형태로 투여함으로써 기생 선충으로부터 동물을 보호하는 것을 포함한다.
- [0088] 위의 설명에서, 단독으로 사용되거나 "할로알킬"과 같은 복합어에 사용되는 용어 "알킬"은 직쇄 또는 분지형 알킬, 예컨대 메틸, 에틸, *n*-프로필, *i*-프로필, 또는 다른 부틸, 펜틸 또는 헥실 이성질체를 포함한다. "알케닐"은 직쇄 또는 분지형 알켄, 예컨대, 에틸렌, 1-프로펜, 2-프로펜 및 다른 부텐, 펜텐 및 헥세닐 이성질체를 포함한다. "알케닐"은 또한 폴리엔, 예컨대 1,2-프로파디엔 및 2,4-헥사디엔을 포함한다. "알키닐"은 직쇄 또는 분지형 알킨, 예컨대, 에틸린, 1-프로핀, 2-프로핀 및 다른 부티닐, 펜티닐 및 헥시닐 이성질체를 포함한다. "알키닐"은 또한 다수의 삼중 결합으로 이루어진 모이어티, 예컨대 2,5-헥사디이닐을 포함할 수 있다.
- [0089] "알콕시"는 예를 들어, 메톡시, 에톡시, *n*-프로필옥시, 이소프로필옥시 및 다른 부톡시, 펜톡시 및 헥실옥시 이성질체를 포함한다.
- [0090] 예를 들어, "시클로알킬"은 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸 및 시클로헥실을 포함한다. 용어 "시클로알킬알킬"은 알킬 모이어티 상의 시클로알킬 치환을 나타낸다. "시클로알킬알킬"의 예는 시클로프로필메틸, 시클로펜틸메틸, 및 직쇄 또는 분지형 알킬기에 결합된 다른 시클로알킬 모이어티를 포함한다.
- [0091] 단독으로 사용되거나 "할로알킬"과 같은 복합어에 사용되거나, 또는 "할로젠으로 치환된 알킬"과 같은 설명에 사용될 때의 용어 "할로젠"은 불소, 염소, 브롬 또는 요오드를 포함한다. 또한, "할로알킬"과 같은 복합어에서

사용될 때, 또는 "할로젠으로 치환된 알킬"과 같은 설명에서 사용될 때, 상기 알킬은 동일하거나 상이할 수 있는 할로젠 원자들로 부분적으로 또는 완전히 치환될 수 있다. "할로알킬" 또는 "할로젠으로 치환된 알킬"의 예는 F_3C , $ClCH_2$, CF_3CH_2 및 CF_3CCl_2 를 포함한다.

[0092] 용어 "알킬티오"는 직쇄 또는 분지형 알킬티오 모이어티, 예컨대, 메틸티오, 에틸티오, 및 다른 프로필티오, 부틸티오, 펜틸티오 및 헥실티오 이성질체를 포함한다. "알킬설퍼닐"은 알킬설퍼닐기의 두 거울상 이성질체를 모두 포함한다. "알킬설퍼닐"의 예는 $CH_3S(=O)$, $CH_3CH_2S(=O)$, $CH_3CH_2CH_2S(=O)$, $(CH_3)_2CHS(=O)$ 및 다른 부틸설퍼닐, 펜틸설퍼닐 및 헥실설퍼닐 이성질체를 포함한다. "알킬설폰닐"의 예는 $CH_3S(=O)_2$, $CH_3CH_2S(=O)_2$, $CH_3CH_2CH_2S(=O)_2$, $(CH_3)_2CHS(=O)_2$, 및 다른 부틸설폰닐, 펜틸설폰닐 및 헥실설폰닐 이성질체를 포함한다. 본원에 사용된 화학 약자 $S(O)$ 및 $S(=O)$ 는 설퍼닐 모이어티를 나타낸다. 본원에 사용된 화학 약자 SO_2 , $S(O)_2$ 및 $S(=O)_2$ 는 설폰닐 모이어티를 나타낸다.

[0093] "알킬카보닐"은 $C(O)$ 모이어티에 결합된 직쇄 또는 분지형 알킬 모이어티를 나타낸다. 본원에 사용된 화학 약자 $C(O)$ 및 $C(=O)$ 는 카보닐 모이어티를 나타낸다. "알킬카보닐"의 예는 $C(O)CH_3$, $C(O)CH_2CH_2CH_3$ 및 $C(O)CH(CH_3)_2$ 를 포함한다.

[0094] "알콕시카보닐"은 CO_2 모이어티에 결합된 직쇄 또는 분지형 알킬 모이어티를 나타낸다. 본원에 사용된 화학 약자 CO_2 , $C(O)O$ 및 $C(=O)O$ 는 옥시카보닐 모이어티를 나타낸다. "알콕시카보닐"의 예는 $C(O)OCH_3$, $C(O)OCH_2CH_3$, $C(O)OCH_2CH_2CH_3$ 및 $C(O)OCH(CH_3)_2$ 를 포함한다.

[0095] 치환기에서 탄소 원자의 총 수는 " C_i-C_j " 접두사로 표시된다. 예를 들어, C_1-C_6 알킬은 메틸, 에틸, 및 다양한 프로필, 부틸, 펜틸 및 헥실 이성질체를 나타낸다.

[0096] 본원에 사용된 바와 같이, 달리 명시되지 않는 한, 다음의 정의가 적용될 것이다. 용어 "선택적으로 치환된"은 어구 "치환되거나 비치환된" 또는 용어 "(비)치환된"과 상호교환적으로 사용된다. "1 내지 4개의 치환기로 선택적으로 치환된"이란 표현은 치환기가 존재하지 않거나(즉, 비치환), 1, 2, 3 또는 4개의 치환기가 존재함(이용 가능한 결합 위치의 수에 의해 제한됨)을 의미한다. 달리 명시되지 않는 한, 선택적으로 치환된 기는 이러한 기의 각각의 치환 가능한 위치에 치환기를 가질 수 있으며, 각각의 치환은 다른 것과 독립적이다.

[0097] 방향족 및 비방향족 헤테로환 고리 및 고리 시스템을 제조할 수 있는 매우 다양한 합성 방법이 당해 분야에 공지되어 있다; 포괄적인 검토를 위해서는 *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*의 8권 세트(A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984) 및 *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*의 12권 세트(A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996)를 참조.

[0098] 화학식 1, 1a 또는 1b로부터 선택되는 화합물은 한 가지 형태가 아니라 더 많은 형태로 존재하므로, 화학식 1, 1a 또는 1b는 화학식 1, 1a 또는 1b가 나타내는 화합물의 모든 결정질 형태 및 비결정질 형태를 포함한다. 비결정질 형태는 왁스 및 검과 같은 고체인 구현에만 아니라, 용액 및 용융물과 같은 액체인 구현에도 포함한다. 결정질 형태는 본질적으로 단결정 유형을 나타내는 구현에 및 다형체(즉, 상이한 결정질 유형)의 혼합물을 나타내는 구현예를 포함한다. 용어 "다형체"는 결정 격자 내에 분자의 상이한 배열 및/또는 입체구조를 가지는 상이한 결정질 형태로 결정화할 수 있는 화학적 화합물의 특정 결정질 형태를 지칭한다. 다형체는 동일한 화학 조성을 가질 수 있지만, 격자 내에서 약하게 또는 강하게 결합될 수 있는 공동 결정화된 물 또는 기타 분자의 존재 또는 부재로 인하여 조성이 다를 수도 있다. 다형체는 결정의 형상, 밀도, 경도, 색상, 화학적 안정성, 용점, 흡습성, 현탁성, 용해 속도 및 생물학적 이용률과 같은 화학적, 물리적 및 생물학적 성질이 상이할 수 있다. 화학식 1, 1a 또는 1b로 표현되는 화합물의 다형체가 다른 다형체 또는 화학식 1, 1a 또는 1b로 표현되는 동일한 화합물의 다형체의 혼합물에 비해 유익한 효과(예컨대, 유용한 제제의 제조에 대한 적합성, 향상된 생물학적 성능)를 나타낼 수 있다는 것을 당업자는 이해할 것이다. 화학식 1, 1a 또는 1b로 표현되는 화합물의 특정 다형체의 제조 및 분리는, 예를 들어 선택된 용매와 온도를 이용한 결정화를 비롯하여, 당업자에게 알려진 방법에 의해 달성될 수 있다.

[0099] 발명의 내용에 기술된 바와 같은 본 발명의 구현예는 아래에 기술된 것들을 포함한다. 다음의 구현예에서, 화학식 1, 1a 또는 1b의 화합물에 대한 언급은 구현예에서 더 정의되지 않는 한 발명의 내용에 명시된 치환기의 정

의를 포함한다.

- [0100] 구현예 1. 화학식 **1a**의 화합물.
- [0101] 구현예 2. 화학식 **1b**의 화합물.
- [0102] 구현예 3. R^2 가 H인 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0103] 구현예 4. R^3 가 C_2-C_6 알킬 또는 C_3-C_6 시클로알킬인(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨) 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0104] 구현예 4a. R^3 가 C_2-C_6 알킬 또는 C_3-C_6 시클로알킬인 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0105] 구현예 4b. R^3 가 C_3-C_6 알킬 또는 시클로프로필인 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0106] 구현예 4c. R^3 가 이소프로필, s-부틸, t-부틸, $CH_2C(CH_3)_3$ 또는 시클로프로필인 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0107] 구현예 4d. R^3 가 t-부틸 또는 시클로프로필인 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0108] 구현예 4e. R^3 가 이소프로필인 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0109] 구현예 4f. R^3 가 s-부틸인 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0110] 구현예 4g. R^3 가 t-부틸인 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0111] 구현예 4h. R^3 가 $CH_2C(CH_3)_3$ 인 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0112] 구현예 4i. R^3 가 시클로프로필인 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0113] 구현예 5. R^3 가 이소프로필인 화학식 **1**의 화합물.
- [0114] 구현예 5a. R^3 가 s-부틸인 화학식 **1**의 화합물.
- [0115] 구현예 5b. R^3 가 t-부틸인 화학식 **1**의 화합물.
- [0116] 구현예 5c. R^3 가 $CH_2C(CH_3)_3$ 인 화학식 **1**의 화합물.
- [0117] 구현예 5d. R^3 가 시클로프로필인 화학식 **1**의 화합물.
- [0118] 구현예 6. R^3 가 이소프로필인 화학식 **1a**의 화합물.
- [0119] 구현예 6a. R^3 가 s-부틸인 화학식 **1a**의 화합물.
- [0120] 구현예 6b. R^3 가 t-부틸인 화학식 **1a**의 화합물.
- [0121] 구현예 6c. R^3 가 $CH_2C(CH_3)_3$ 인 화학식 **1a**의 화합물.
- [0122] 구현예 6d. R^3 가 시클로프로필인 화학식 **1a**의 화합물.
- [0123] 구현예 7. R^3 가 이소프로필인 화학식 **1b**의 화합물.
- [0124] 구현예 7a. R^3 가 s-부틸인 화학식 **1b**의 화합물.
- [0125] 구현예 7b. R^3 가 t-부틸인 화학식 **1b**의 화합물.

- [0126] 구현예 7c. R^3 가 $CH_2C(CH_3)_3$ 인 화학식 **1b**의 화합물.
- [0127] 구현예 7d. R^3 가 시클로프로필인 화학식 **1b**의 화합물.
- [0128] 구현예 8. R^4 가 Cl 또는 Br인 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0129] 구현예 8a. R^4 가 Cl인 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0130] 구현예 8b. R^4 가 Br인 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물.
- [0131] 구현예 9. R^4 가 Cl 또는 Br인 화학식 **1**의 화합물.
- [0132] 구현예 9a. R^4 가 Cl인 화학식 **1**의 화합물.
- [0133] 구현예 9b. R^4 가 Br인 화학식 **1**의 화합물.
- [0134] 구현예 10. R^4 가 Cl 또는 Br인 화학식 **1a**의 화합물.
- [0135] 구현예 10a. R^4 가 Cl인 화학식 **1a**의 화합물.
- [0136] 구현예 10b. R^4 가 Br인 화학식 **1a**의 화합물.
- [0137] 구현예 11. R^4 가 Cl 또는 Br인 화학식 **1b**의 화합물.
- [0138] 구현예 11a. R^4 가 Cl인 화학식 **1b**의 화합물.
- [0139] 구현예 11b. R^4 가 Br인 화학식 **1b**의 화합물.
- [0140] 상기 구현예 1 내지 11b뿐만 아니라 본원에 기재된 임의의 다른 구현예를 포함하여 본 발명의 구현예는 임의의 방식으로 조합될 수 있고, 구현예에서 변수에 대한 설명은 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물에 관한 것일 뿐만 아니라 화학식 **1**, **1a** 또는 **1b**의 화합물을 제조하는 데 유용한 출발 화합물 및 중간 화합물에 관한 것이다. 또한, 상기 구현예 1 내지 11b뿐만 아니라 본원에 기재된 임의의 다른 구현예를 포함하여 본 발명의 구현예, 및 이들의 임의의 조합은 본 발명의 조성물 및 방법에 관한 것이다.
- [0141] 구현예 1 내지 11b의 조합의 예시는 다음과 같다:
- [0142] 구현예 A. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0143] R^2 가 H이고;
- [0144] R^3 가 C_2-C_6 알킬 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);
- [0145] R^4 가 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;
- [0146] 각각의 R^6 가 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐, C_1-C_3 알킬설폰닐 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;
- [0147] 각각의 R^a , R^b 및 R^c 가 독립적으로 C_1-C_6 알킬인 화합물.
- [0148] 구현예 B. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0149] R^2 가 H이고;
- [0150] R^3 가 C_2-C_6 알킬 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고;

- [0151] R^4 가 Cl 또는 Br인 화합물.
- [0152] 구현예 C. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0153] R^2 가 H이고;
- [0154] R^3 가 C_3-C_6 알킬 또는 시클로프로필이고;
- [0155] R^4 가 Cl 또는 Br인 화합물.
- [0156] 구현예 D. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0157] R^2 가 H이고;
- [0158] R^3 가 t-부틸 또는 시클로프로필이고;
- [0159] R^4 가 Cl 또는 Br인 화합물.
- [0160] 구현예 E. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0161] R^2 가 H이고;
- [0162] R^3 가 이소프로필, s-부틸, t-부틸, $CH_2C(CH_3)_3$ 또는 시클로프로필이고;
- [0163] R^4 가 Cl 또는 Br인 화합물.
- [0164] 구현예 E1. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0165] R^2 가 H이고;
- [0166] R^3 가 이소프로필, s-부틸, t-부틸, $CH_2C(CH_3)_3$ 또는 시클로프로필이고;
- [0167] R^4 가 Cl인 화합물.
- [0168] 구현예 E2. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0169] R^2 가 H이고;
- [0170] R^3 가 이소프로필, s-부틸, t-부틸, $CH_2C(CH_3)_3$ 또는 시클로프로필이고;
- [0171] R^4 가 Br인 화합물.
- [0172] 구현예 F1. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0173] R^2 가 H이고;
- [0174] R^3 가 이소프로필이고;
- [0175] R^4 가 Cl인 화합물.
- [0176] 구현예 F2. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0177] R^2 가 H이고;
- [0178] R^3 가 s-부틸이고;
- [0179] R^4 가 Cl인 화합물.

- [0180] 구현예 F3. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0181] R^2 가 H이고;
- [0182] R^3 가 t-부틸이고;
- [0183] R^4 가 C1인 화합물.
- [0184] 구현예 F4. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0185] R^2 가 H이고;
- [0186] R^3 가 $CH_2C(CH_3)_3$ 이고;
- [0187] R^4 가 C1인 화합물.
- [0188] 구현예 F5. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0189] R^2 가 H이고;
- [0190] R^3 가 시클로프로필이고;
- [0191] R^4 가 C1인 화합물.
- [0192] 구현예 G1. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0193] R^2 가 H이고;
- [0194] R^3 가 이소프로필이고;
- [0195] R^4 가 Br인 화합물.
- [0196] 구현예 G2. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0197] R^2 가 H이고;
- [0198] R^3 가 s-부틸이고;
- [0199] R^4 가 Br인 화합물.
- [0200] 구현예 G3. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0201] R^2 가 H이고;
- [0202] R^3 가 t-부틸이고;
- [0203] R^4 가 Br인 화합물.
- [0204] 구현예 G4. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0205] R^2 가 H이고;
- [0206] R^3 가 $CH_2C(CH_3)_3$ 이고;
- [0207] R^4 가 Br인 화합물.
- [0208] 구현예 G5. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0209] R^2 가 H이고;

- [0210] R^3 가 시클로프로필이고;
- [0211] R^4 가 Br인 화합물.
- [0212] 구현예 H. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0213] R^2 가 H이고;
- [0214] R^3 가 C_2-C_6 알킬 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);
- [0215] R^4 가 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;
- [0216] 각각의 R^6 가 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐, C_1-C_3 알킬설폰닐 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;
- [0217] 각각의 R^a , R^b 및 R^c 가 독립적으로 C_1-C_6 알킬인 화합물.
- [0218] 구현예 I. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0219] R^2 가 H이고;
- [0220] R^3 가 C_2-C_6 알킬 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고;
- [0221] R^4 가 Cl 또는 Br인 화합물.
- [0222] 구현예 J. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0223] R^2 가 H이고;
- [0224] R^3 가 C_3-C_6 알킬 또는 시클로프로필이고;
- [0225] R^4 가 Cl 또는 Br인 화합물.
- [0226] 구현예 K. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0227] R^2 가 H이고;
- [0228] R^3 가 t-부틸 또는 시클로프로필이고;
- [0229] R^4 가 Cl 또는 Br인 화합물.
- [0230] 구현예 L. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0231] R^2 가 H이고;
- [0232] R^3 가 이소프로필, s-부틸, t-부틸, $CH_2C(CH_3)_3$ 또는 시클로프로필이고;
- [0233] R^4 가 Cl 또는 Br인 화합물.
- [0234] 구현예 M1. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0235] R^2 가 H이고;
- [0236] R^3 가 이소프로필, s-부틸, t-부틸, $CH_2C(CH_3)_3$ 또는 시클로프로필이고;

- [0237] R^4 가 C1인 화합물.
- [0238] 구현예 M2. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0239] R^2 가 H이고;
- [0240] R^3 가 이소프로필, s-부틸, t-부틸, $CH_2C(CH_3)_3$ 또는 시클로프로필이고;
- [0241] R^4 가 Br인 화합물.
- [0242] 구현예 N1. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0243] R^2 가 H이고;
- [0244] R^3 가 이소프로필이고;
- [0245] R^4 가 C1인 화합물.
- [0246] 구현예 N2. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0247] R^2 가 H이고;
- [0248] R^3 가 s-부틸이고;
- [0249] R^4 가 C1인 화합물.
- [0250] 구현예 N3. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0251] R^2 가 H이고;
- [0252] R^3 가 t-부틸이고;
- [0253] R^4 가 C1인 화합물.
- [0254] 구현예 N4. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0255] R^2 가 H이고;
- [0256] R^3 가 $CH_2C(CH_3)_3$ 이고;
- [0257] R^4 가 C1인 화합물.
- [0258] 구현예 N5. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0259] R^2 가 H이고;
- [0260] R^3 가 시클로프로필이고;
- [0261] R^4 가 C1인 화합물.
- [0262] 구현예 O1. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0263] R^2 가 H이고;
- [0264] R^3 가 이소프로필이고;
- [0265] R^4 가 Br인 화합물.
- [0266] 구현예 O2. 화학식 **1b**의 화합물로서,

- [0267] R^2 가 H이고;
- [0268] R^3 가 s-부틸이고;
- [0269] R^4 가 Br인 화합물.
- [0270] 구현예 03. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0271] R^2 가 H이고;
- [0272] R^3 가 t-부틸이고;
- [0273] R^4 가 Br인 화합물.
- [0274] 구현예 04. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0275] R^2 가 H이고;
- [0276] R^3 가 $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 이고;
- [0277] R^4 가 Br인 화합물.
- [0278] 구현예 05. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0279] R^2 가 H이고;
- [0280] R^3 가 시클로프로필이고;
- [0281] R^4 가 Br인 화합물.
- [0282] 구현예 P1. 화학식 **1**의 화합물로서,
- [0283] R^2 가 H이고;
- [0284] R^3 가 $-\text{CR}^{6a}\text{R}^{6b}\text{R}^{6c}$ 이고;
- [0285] R^4 가 Cl 또는 Br이고;
- [0286] R^{6a} 가 H, $\text{C}_1\text{-C}_3$ 알킬, $\text{C}_2\text{-C}_3$ 알케닐 또는 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 시클로알킬이고;
- [0287] R^{6b} 가 $\text{C}_1\text{-C}_3$ 알킬이고;
- [0288] R^{6c} 가 H, 할로젠, 시아노, $\text{C}_1\text{-C}_3$ 알콕시, $\text{C}_1\text{-C}_3$ 알킬티오, $\text{C}_1\text{-C}_3$ 알킬설퍼닐, $\text{C}_1\text{-C}_3$ 알킬설폰닐 또는 $-\text{CR}^{7a}\text{R}^{7b}\text{R}^{7c}$ 이고;
- [0289] R^{7a} 가 H, 할로젠, 시아노, $\text{C}_1\text{-C}_3$ 알콕시, $\text{C}_1\text{-C}_3$ 알킬티오, $\text{C}_1\text{-C}_3$ 알킬설퍼닐, $\text{C}_1\text{-C}_3$ 알킬설폰닐 또는 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 알킬이고;
- [0290] R^{7b} 가 H, 할로젠, 시아노 또는 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 알킬이고;
- [0291] R^{7c} 가 H, 할로젠, 시아노 또는 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 알킬인 화합물.
- [0292] 구현예 P2. 화학식 **1a**의 화합물로서,
- [0293] R^2 가 H이고;

- [0294] R^3 가 $-CR^{6a}R^{6b}R^{6c}$ 이고;
- [0295] R^4 가 Cl 또는 Br이고;
- [0296] R^{6a} 가 H, C_1-C_3 알킬, C_2-C_3 알케닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고;
- [0297] R^{6b} 가 C_1-C_3 알킬이고;
- [0298] R^{6c} 가 H, 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐, C_1-C_3 알킬설포닐 또는 $-CR^{7a}R^{7b}R^{7c}$ 이고;
- [0299] R^{7a} 가 H, 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐, C_1-C_3 알킬설포닐 또는 C_1-C_2 알킬이고;
- [0300] R^{7b} 가 H, 할로젠, 시아노 또는 C_1-C_2 알킬이고;
- [0301] R^{7c} 가 H, 할로젠, 시아노 또는 C_1-C_2 알킬인 화합물.
- [0302] 구현예 P3. 화학식 **1b**의 화합물로서,
- [0303] R^2 가 H이고;
- [0304] R^3 가 $-CR^{6a}R^{6b}R^{6c}$ 이고;
- [0305] R^4 가 Cl 또는 Br이고;
- [0306] R^{6a} 가 H, C_1-C_3 알킬, C_2-C_3 알케닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고;
- [0307] R^{6b} 가 C_1-C_3 알킬이고;
- [0308] R^{6c} 가 H, 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐, C_1-C_3 알킬설포닐 또는 $-CR^{7a}R^{7b}R^{7c}$ 이고;
- [0309] R^{7a} 가 H, 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐, C_1-C_3 알킬설포닐 또는 C_1-C_2 알킬이고;
- [0310] R^{7b} 가 H, 할로젠, 시아노 또는 C_1-C_2 알킬이고;
- [0311] R^{7c} 가 H, 할로젠, 시아노 또는 C_1-C_2 알킬인 화합물.
- [0312] 구현예 Q1. (i) 화학식 **1a**의 화합물 및 화학식 **1b**의 화합물(여기서, **1b** 대 **1a**의 비는 적어도 55:45이고;
- [0313] R^2 는 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐, C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설포닐이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);
- [0314] R^3 는 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);
- [0315] R^4 는 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;

- [0316] 각각의 R^5 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐 또는 C_1-C_3 알킬설폰닐이고;
- [0317] 각각의 R^6 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐, C_1-C_3 알킬설폰닐 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;
- [0318] 각각의 R^a , R^b 및 R^c 는 독립적으로 C_1-C_6 알킬임); 및
- [0319] (ii) 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물.
- [0320]
- [0321] 구현예 Q2. (i) 화학식 **1a**의 화합물 및 화학식 **1b**의 화합물(여기서, **1b** 대 **1a**의 비는 적어도 65:35이고;
- [0322] R^2 는 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐, C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설폰닐이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);
- [0323] R^3 는 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);
- [0324] R^4 는 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;
- [0325] 각각의 R^5 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐 또는 C_1-C_3 알킬설폰닐이고;
- [0326] 각각의 R^6 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐, C_1-C_3 알킬설폰닐 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;
- [0327] 각각의 R^a , R^b 및 R^c 는 독립적으로 C_1-C_6 알킬임); 및
- [0328] (ii) 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물.
- [0329]
- [0330] 구현예 Q3. (i) 화학식 **1a**의 화합물 및 화학식 **1b**의 화합물(여기서, **1b** 대 **1a**의 비는 적어도 75:25이고;
- [0331] R^2 는 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐, C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설폰닐이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);
- [0332] R^3 는 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);
- [0333] R^4 는 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;
- [0334] 각각의 R^5 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐 또는 C_1-C_3 알킬설폰닐이고;
- [0335] 각각의 R^6 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설퍼닐,

C₁-C₃ 알킬설폰닐 또는 SiR^aR^bR^c이고;

- [0336] 각각의 R^a, R^b 및 R^c는 독립적으로 C₁-C₆ 알킬임); 및
- [0337] (ii) 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물.
- [0339] 구현예 Q4. (i) 화학식 **1a**의 화합물 및 화학식 **1b**의 화합물(여기서, **1b** 대 **1a**의 비는 적어도 85:15이고;
- [0340] R²는 H; 또는 C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐, C₃-C₆ 시클로알킬, C₂-C₆ 알킬카보닐, C₂-C₆ 알콕시카보닐, C₁-C₆ 알킬티오 또는 C₁-C₆ 알킬설폰닐이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R⁵로 치환됨);
- [0341] R³는 C₂-C₁₆ 알킬, C₂-C₁₆ 알케닐, C₂-C₁₆ 알키닐 또는 C₃-C₆ 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R⁶로 치환됨);
- [0342] R⁴는 Cl, Br, I, CH₃, CF₃ 또는 시아노이고;
- [0343] 각각의 R⁵는 독립적으로 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알콕시, C₃-C₆ 시클로알킬, C₁-C₃ 알킬티오, C₁-C₃ 알킬설피닐 또는 C₁-C₃ 알킬설폰닐이고;
- [0344] 각각의 R⁶는 독립적으로 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알콕시, C₃-C₆ 시클로알킬, C₁-C₃ 알킬티오, C₁-C₃ 알킬설피닐, C₁-C₃ 알킬설폰닐 또는 SiR^aR^bR^c이고;
- [0345] 각각의 R^a, R^b 및 R^c는 독립적으로 C₁-C₆ 알킬임); 및
- [0346] (ii) 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물.
- [0348] 구현예 Q5. (i) 화학식 **1a**의 화합물 및 화학식 **1b**의 화합물(여기서, **1b** 대 **1a**의 비는 적어도 95:5이고;
- [0349] R²는 H; 또는 C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐, C₃-C₆ 시클로알킬, C₂-C₆ 알킬카보닐, C₂-C₆ 알콕시카보닐, C₁-C₆ 알킬티오 또는 C₁-C₆ 알킬설폰닐이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R⁵로 치환됨);
- [0350] R³는 C₂-C₁₆ 알킬, C₂-C₁₆ 알케닐, C₂-C₁₆ 알키닐 또는 C₃-C₆ 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R⁶로 치환됨);
- [0351] R⁴는 Cl, Br, I, CH₃, CF₃ 또는 시아노이고;
- [0352] 각각의 R⁵는 독립적으로 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알콕시, C₃-C₆ 시클로알킬, C₁-C₃ 알킬티오, C₁-C₃ 알킬설피닐 또는 C₁-C₃ 알킬설폰닐이고;
- [0353] 각각의 R⁶는 독립적으로 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알콕시, C₃-C₆ 시클로알킬, C₁-C₃ 알킬티오, C₁-C₃ 알킬설피닐, C₁-C₃ 알킬설폰닐 또는 SiR^aR^bR^c이고;
- [0354] 각각의 R^a, R^b 및 R^c는 독립적으로 C₁-C₆ 알킬임); 및
- [0355] (ii) 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분

- [0356] 을 포함하는 조성물.
- [0357] 구현예 Q6. (i) 화학식 **1a**의 화합물 및 화학식 **1b**의 화합물(여기서, **1b** 대 **1a**의 비는 적어도 97:3이고;
- [0358] R^2 는 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐, C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설폰일이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);
- [0359] R^3 는 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);
- [0360] R^4 는 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;
- [0361] 각각의 R^5 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐 또는 C_1-C_3 알킬설폰일이고;
- [0362] 각각의 R^6 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐, C_1-C_3 알킬설폰 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;
- [0363] 각각의 R^a , R^b 및 R^c 는 독립적으로 C_1-C_6 알킬임); 및
- [0364] (ii) 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분
- [0365] 을 포함하는 조성물.
- [0366] 구현예 Q7. (i) 화학식 **1a**의 화합물 및 화학식 **1b**의 화합물(여기서, **1b** 대 **1a**의 비는 적어도 99:1이고;
- [0367] R^2 는 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐, C_1-C_6 알킬티오 또는 C_1-C_6 알킬설폰일이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^5 로 치환됨);
- [0368] R^3 는 C_2-C_{16} 알킬, C_2-C_{16} 알케닐, C_2-C_{16} 알키닐 또는 C_3-C_6 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R^6 로 치환됨);
- [0369] R^4 는 Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 또는 시아노이고;
- [0370] 각각의 R^5 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐 또는 C_1-C_3 알킬설폰일이고;
- [0371] 각각의 R^6 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐, C_1-C_3 알킬설폰 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;
- [0372] 각각의 R^a , R^b 및 R^c 는 독립적으로 C_1-C_6 알킬임); 및
- [0373] (ii) 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분
- [0374] 을 포함하는 조성물.
- [0375] 구현예 Q8. (i) 화학식 **1a**의 화합물 및 화학식 **1b**의 화합물(여기서, **1b** 대 **1a**의 비는 본질적으로 100:0이고;
- [0376] R^2 는 H; 또는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, C_3-C_6 시클로알킬, C_2-C_6 알킬카보닐, C_2-C_6 알콕시카보닐,

C₁-C₆ 알킬티오 또는 C₁-C₆ 알킬설폰일이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R⁵로 치환됨);

[0377] R³는 C₂-C₁₆ 알킬, C₂-C₁₆ 알케닐, C₂-C₁₆ 알키닐 또는 C₃-C₆ 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R⁶로 치환됨);

[0378] R⁴는 Cl, Br, I, CH₃, CF₃ 또는 시아노이고;

[0379] 각각의 R⁵는 독립적으로 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알콕시, C₃-C₆ 시클로알킬, C₁-C₃ 알킬티오, C₁-C₃ 알킬설피닐 또는 C₁-C₃ 알킬설폰일이고;

[0380] 각각의 R⁶는 독립적으로 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알콕시, C₃-C₆ 시클로알킬, C₁-C₃ 알킬티오, C₁-C₃ 알킬설피닐, C₁-C₃ 알킬설폰일 또는 SiR^aR^bR^c이고;

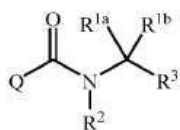
[0381] 각각의 R^a, R^b 및 R^c는 독립적으로 C₁-C₆ 알킬임); 및

[0382] (ii) 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분

[0383] 을 포함하는 조성물.

[0384] 구현예 R1. 도양에 사는 선충류 또는 그 환경을 화학식 2로부터 선택되는 화합물의 생물학적 유효량과 접촉시키는 단계를 포함하는, 도양에 사는 선충을 방제하는 방법으로서,

[0385] [화학식 2]



[0386]

[0387] Q가 퓨란, 티오펜 또는 티아졸 고리와 화학식 2의 잔기 사이에서 이들을 결합시키는 탄소 원자에 인접한 탄소 원자에서 R⁴로 치환된 퓨란, 티오펜 또는 티아졸 고리이고;

[0388] R^{1a}가 C₁-C₆ 알킬 또는 C₃-C₆ 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R⁵로 치환됨);

[0389] R^{1b}가 H 또는 C₁-C₃ 알킬이거나;

[0390] R^{1a} 및 R^{1b}가 이들이 부착된 탄소 원자와 함께, 비치환이거나 적어도 하나의 R⁵로 치환된 3원 내지 6원의 시클로알킬 고리를 형성하고;

[0391] R²가 H; 또는 C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐, C₃-C₆ 시클로알킬, C₂-C₆ 알킬카보닐, C₂-C₆ 알콕시카보닐, C₁-C₆ 알킬티오 또는 C₁-C₆ 알킬설폰일이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R⁵로 치환됨);

[0392] R³가 C₂-C₁₆ 알킬, C₂-C₁₆ 알케닐, C₂-C₁₆ 알키닐 또는 C₃-C₆ 시클로알킬이고(각각은 비치환이거나 적어도 하나의 R⁶로 치환됨);

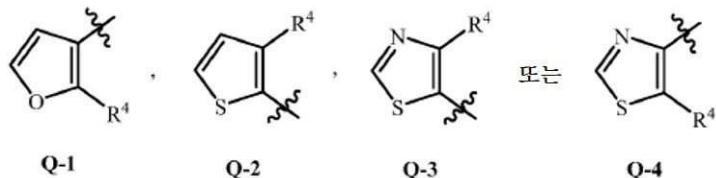
[0393] R⁴가 Cl, Br, I, CH₃, CF₃ 또는 시아노이고; 단, R⁴가 Me인 경우, R³는 비치환C₂ 알킬이 아니고;

[0394] 각각의 R⁵가 독립적으로 할로젠, 시아노, C₁-C₃ 알콕시, C₃-C₆ 시클로알킬, C₁-C₃ 알킬티오, C₁-C₃ 알킬설피닐, 또는 C₁-C₃ 알킬설폰일이고;

[0395] 각각의 R^6 가 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알콕시, C_3-C_6 시클로알킬, C_1-C_3 알킬티오, C_1-C_3 알킬설피닐, C_1-C_3 알킬설폰 또는 $SiR^aR^bR^c$ 이고;

[0396] 각각의 R^a , R^b 및 R^c 가 독립적으로 C_1-C_6 알킬인 방법.

[0397] 구현예 R2. 구현예 R1에 있어서, Q는



[0398] 로 이루어진 군으로부터 선택되는 방법.

[0399] 구현예 R3. 구현예 R1에 있어서, Q는 Q-1인 방법.

[0400] 특정 구현예는 다음 화합물들(화합물 번호는 색인표 A 내지 C2를 참조)로 이루어진 군으로부터 선택되는 화학식 1 및 1b의 화합물을 포함한다:

[0401] 화합물 9;

[0402] 화합물 11;

[0403] 화합물 26;

[0404] 화합물 40;

[0405] 화합물 43;

[0406] 화합물 78;

[0407] 화합물 80; 및

[0408] 화합물 84.

[0409] 특정 구현예는 다음 화합물들(화합물 번호는 색인표 A 내지 C2를 참조)로 이루어진 군으로부터 선택되는 화학식 1b의 화합물을 더 포함한다:

[0410] 화합물 9;

[0411] 화합물 11;

[0412] 화합물 26;

[0413] 화합물 40;

[0414] 화합물 43;

[0415] 화합물 78;

[0416] 화합물 80; 및

[0417] 화합물 84.

[0418] 주목할 것은 본 발명의 화합물은 유리한 신진 대사 및/또는 토양 잔류 패턴을 특징으로 하며, 다양한 농경학적 및 비농경학적 기생 선충류를 방제하는 활성을 나타낸다는 것이다.

[0419] 특히 주목할 것은, 기생 선충 방제 범위 및 경제적 중요성의 이유로, 기생 선충류를 방제하여 기생 선충류에 의한 피해 또는 손상으로부터 농작물을 보호하는 것이 본 발명의 구현예라는 것이다. 본 발명의 화합물은 식물에서 유리한 전이 성질 또는 체계성 때문에, 화학식 1, 1a 또는 1b의 화합물 또는 그 화합물을 포함하는 조성물과 직접 접촉되지 않는 잎 또는 다른 식물 부분도 보호한다.

[0420] 또한, 본 발명의 구현예로서 주목할 만한 것은, 임의의 상기 구현예뿐만 아니라 본원에 기술된 임의의 다른 구현예, 및 이들의 임의의 조합의 화합물, 및 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선

택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물이고, 상기 조성물은 적어도 하나의 추가 생물학적 활성 화합물 또는 제제를 선택적으로 더 포함한다.

[0421] 본 발명의 구현예로서 또한 주목할 만한 것은, 임의의 상기 구현예뿐만 아니라 본원에 기술된 임의의 다른 구현예, 및 이들의 임의의 조합의 화합물, 및 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 기생 선충 방제용 조성물이고, 상기 조성물은 적어도 하나의 추가 생물학적 활성 화합물 또는 제제를 선택적으로 더 포함한다. 본 발명의 구현예는 기생 선충 또는 그 환경을 생물학적 유효량의 임의의 상기 구현예의 화합물과(예를 들어, 본원에 기술된 조성물로서) 접촉시키는 단계를 포함하는 기생 선충 방제 방법을 더 포함한다.

[0422] 본 발명의 구현예는 임의의 상기 구현예의 화합물을 포함하는 토양 관주 액체 제형 형태의 조성물을 또한 포함한다. 본 발명의 구현예는 토양을 생물학적 유효량의 임의의 상기 구현예의 화합물을 포함하는 토양 관주로서의 액체 조성물과 접촉시키는 단계를 포함하는 기생 선충 방제 방법을 더 포함한다.

[0423] 본 발명의 구현예는 생물학적 유효량의 임의의 상기 구현예의 화합물 및 추진제를 포함하는 기생 선충 방제용 스프레이 조성물을 또한 포함한다. 본 발명의 구현예는 생물학적 유효량의 임의의 상기 구현예의 화합물, 하나 이상의 식품 재료, 선택적으로 유인제, 및 선택적으로 습윤제를 포함하는 기생 선충 방제용 미끼 조성물을 또한 포함한다.

[0424] 본 발명의 구현예는 종자를 생물학적 유효량의 임의의 상기 구현예의 화합물과 접촉시키는 단계를 포함하는, 기생 선충으로부터 종자를 보호하는 방법을 또한 포함한다.

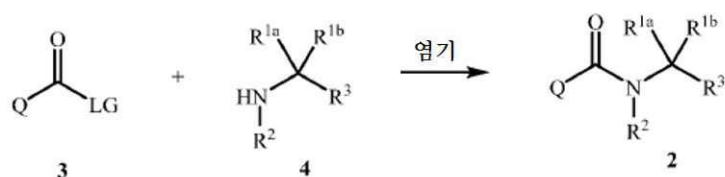
[0425] 본 발명의 구현예는 기생 선충 또는 그 환경을 생물학적 유효량의 화학식 1, 1a, 1b 또는 2의 화합물(예를 들어, 본원에 기술된 조성물로서) 접촉시키는 단계를 포함하는 기생 선충 방제 방법을 또한 포함한다(단, 이 방법은 요법에 의한 인간 또는 동물 신체의 의학적 치료 방법이 아님).

[0426] 본 발명은 또한, 기생 선충 또는 그 환경이 생물학적 유효량의 화학식 1, 1a, 1b 또는 2의 화합물 및, 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 포함하는 조성물과 접촉되는 이러한 방법에 관한 것이며, 상기 조성물은 생물학적 유효량의 적어도 하나의 추가 생물학적 활성 화합물 또는 제제를 선택적으로 더 포함한다(단, 이 방법은 요법에 의한 인간 또는 동물 신체의 의학적 치료 방법이 아님).

[0427] 반응 도식 1 내지 3에 기술된 다음의 방법 및 변형에 중 하나 이상을 이용하여 화학식 1, 1a, 1b 및 2의 화합물을 제조할 수 있다. 달리 명시하지 않는 한, 이하 화학식 2 내지 8b의 화합물에서 Q, R^{1a}, R^{1b}, R², R³ 및 R⁴의 정의는 발명의 내용에서 앞서 정의된 바와 같다. 실온은 약 20 내지 25°C이다.

[0428] 화학식 2의 화합물은 반응 도식 1에 도시된 바와 같이 화학식 3(LG는 할로젠과 같은 이탈기임)의 화합물과 화학식 4의 아민의 반응에 의해 제조될 수 있다. LG가 할로젠인 경우, 반응은 일반적으로 염기의 존재 하에 적절한 용매에서 수행된다. 적절한 염기는 아민, 예컨대 트리에틸아민, 피리딘 및 피콜린, 무기 금속염, 예컨대 탄산나트륨 및 탄산칼륨, 중탄산나트륨 및 중탄산칼륨, 수산화나트륨 및 나트륨에톡시드를 비롯한 탄산염, 중탄산염, 수산화물 및 알콕시드를 포함한다. 적절한 용매의 선택은 LG의 특성, 염기, 및 선택된 반응 조건에 따라 달라진다. 일반적인 용매는 지방족 탄화수소, 예컨대 헥산, 시클로헥산 및 헵탄, 방향족 탄화수소, 예컨대 톨루엔 및 자일렌, 할로젠화 탄화수소, 예컨대 디클로로메탄, 디클로로에탄 및 클로로벤젠, 에테르, 예컨대 디에틸 에테르, 테트라하이드로퓨란, 디옥산 및 디메톡시에탄, 에스테르, 예컨대 에틸 아세테이트, 아마이드, 예컨대 DMF, DMAC 및 N-메틸피롤리돈, 니트릴, 예컨대 아세토니트릴, 케톤, 예컨대 아세톤 및 MEK, 및 극성 양성자성 용매, 예컨대 에탄올 및 물을 포함한다.

[0429] 반응 도식 1

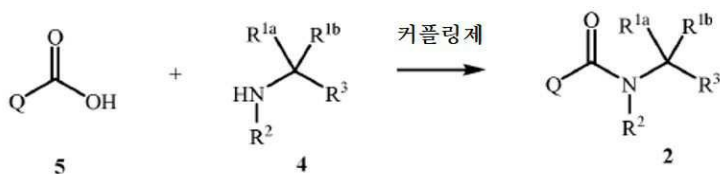


[0430]

[0431] 화학식 2의 화합물은 반응 도식 2에 도시된 바와 같이 화학식 5의 화합물과 화학식 4의 아민의 반응에 의해 또

한 제조될 수 있다. 이 방법에서, HATU (1-[비스(디메틸아미노)메틸렌]-1*H*-1,2,3-트리아졸로[4,5-*b*]피리디늄 3-옥시드 헥사플루오로포스페이트), EDC (1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)카보디이미드)와 같은 아미드 커플링제가 사용된다. 이러한 아미드 커플링에 대한 반응 조건은 당업계에 알려져 있다.

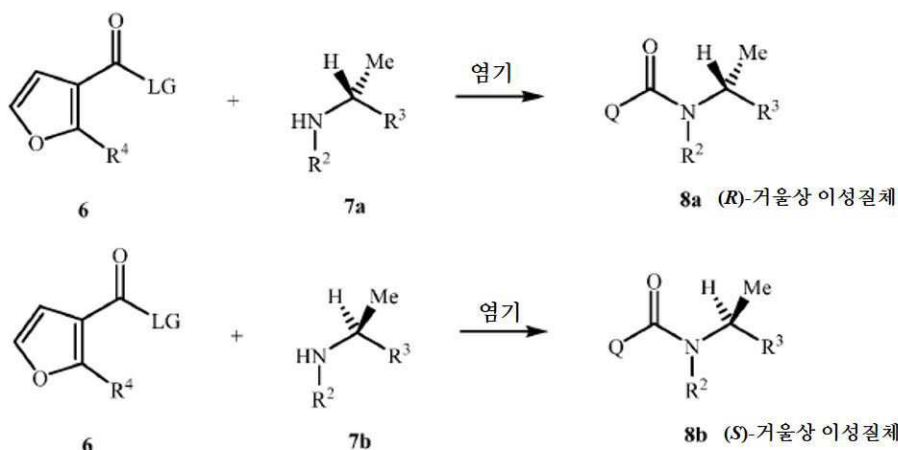
반응 도식 2



화학식 1의 화합물은 화학식 2의 화합물의 부분 집합이고, 화학식 2의 화합물 제조에 대해 전술한 방식으로 제조될 수 있다.

화합식 **1a** 및 **1b**의 거울상 이성질체 구조는 반응 도식 1 및 2에 기술된 것과 유사한 방법 및 조건에 의해 반응 도식 3에 도시된 바와 같이 제조될 수 있다. 예를 들어, 반응 도식 3에 도시된 바와 같이, 화합식 **6**의 퓨란과 화합식 **7a** 또는 **7b**의 키랄 아민의 커플링은 화합식 **8a** 또는 **8b**의 화합물을 각각 생성한다. 화합식 **7a** 및 **7b**의 아민은 상업적으로 입수 가능하거나, 공지된 방법에 의해 해당 라세미 아민의 키랄 분해에 의해 제조될 수 있다.

반응 도식 3



대안적으로, 화학식 1의 화합물은 라세미 혼합물로서 제조될 수 있고, 화학식 1a 및 1b의 화합물은 키랄 컬럼 크로마토그래피에 의해 각각의 거울상 이성질체로 분리될 수 있다. 이러한 유형의 분리를 위한 다양한 키랄 컬럼이 존재한다.

R^2 가 H가 아닌 화학식 **1**, **1a**, **1b** 및 **2**의 화합물은 적절히 치환된 알킬, 아실 또는 다른 시약과의 반응에 의해 R^2 가 H인 각각의 유사체로부터 또한 제조될 수 있다.

화학식 **1**, **1a**, **1b** 또는 **2**의 화합물을 제조하기 위해 전술한 일부 시약 및 반응 조건은 중간물질에 존재하는 특정 작용기와 적합하지 않을 수 있는 것으로 인정된다. 이러한 경우, 보호/탈보호 시퀀스 또는 작용기 상호 전환을 합성에 도입하는 것은 원하는 생성물을 수득하는 데 도움을 줄 것이다. 보호기의 사용 및 선택은 화학 합성 분야 당업자에게 명백할 것이다(예를 들어, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991 참조). 일부 경우에, 임의의 개별 반응 도식에 나타난 바와 같이 주어진 시약의 도입 후, 화학식 **1**의 화합물의 합성을 완료하기 위해서는 상세히 설명하지 않은 추가의 통상적인 합성 단계를 수행할 필요가 있을 수 있음은 당업자라면 인지할 것이다. 화학식 **1**, **1a**, **1b** 또는 **2**의 화합물을 제조하기 위해 제시된 특정 시퀀스에 의해 암시되는 것과 다른 순서로 상기 반응 도식에 예시된 단계의 조합을 수행할 필요가 있을 수 있다는 것 또한 당업자라면 인지할 것이다.

치환기를 추가하거나 기존의 치환기를 변경하기 위해 화학식 1, 1a, 1b 또는 2의 화합물 및 본 설명에 기술된 중간물질이 다양한 치환기 반응, 친핵 반응, 라디칼 반응, 유기금속 반응, 산화 반응 및 환원 반응의 대상이 될

수 있다는 것도 당업자라면 인지할 것이다.

[0442] 추가적인 상세한 기술 없이도, 전술한 설명을 이용하는 당업자라면 본 발명을 최대한으로 활용할 수 있을 것으로 여겨진다. 따라서, 다음의 합성에는 단지 예시적인 것으로서, 어떤 방식으로든 본 발명을 제한하지 않는 것으로 해석된다. 다음의 합성예에서의 단계들은 전체 합성 변환에서 각 단계에 대한 절차를 예시하며, 각 단계에 대한 출발 물질은 반드시 특정 제조 작업(그 절차는 다른 실시예 또는 단계에서 설명됨)에 의해 제조되지 않았을 수도 있다. ^1H NMR 스펙트럼은 테트라메틸실란으로부터 다운필드에 ppm으로 보고되며; "s"는 단일선을 의미하고, "d"는 이중선을 의미하고, "dd"는 이중선의 이중선을 의미하고, "br s"는 넓은 단일선을 의미한다. 실온은 약 20 내지 25°C이다. "DMF"는 *N,N*-디메틸포름아미드이다.

[0443] 합성예 1

[0444] 2-클로로-*N*-[(1*S*)-1-시클로프로필에틸]-3-퓨란카복사미드 및 2-클로로-*N*-[(1*R*)-1-시클로프로필에틸]-3-퓨란카복사미드(화합물 11, 44 및 45)의 제조

[0445] 단계 A: 2-클로로-3-퓨란카복실산의 제조

[0446] THF(20 mL) 중의 디이소프로필아민(10.3 g, 102 mmol) 용액에 헥산 중의 2.5 M *n*-BuLi(6.5 g, 102 mmol)를 -78°C에서 첨가하고, 반응 혼합물을 -40°C까지 서서히 가온시켰다. 이어서, THF(20 mL) 중의 3-퓨란카복실산(5 g, 41 mmol)을 첨가하고, 반응 혼합물을 30분 동안 교반하였다. THF(20 mL) 중의 헥사클로로에탄(10.60 g, 45.68 mmol)을 -78°C에서 서서히 첨가하고, 반응 혼합물을 16시간 동안 교반하였다. TLC 분석(DCM 중의 5% MeOH)은 반응의 완료를 보여주었다. 반응 혼합물을 0°C까지 냉각하고, 1 N HCl로 키펅칭하고, 에틸 아세테이트로(3x) 추출하였다. 합쳐진 유기층을 염수로 세척하고 Na_2SO_4 위에서 건조시켰다. 감압 하에서 용매를 증발시키고, 얻어진 미정제 생성물을 용매 세척에 의해 정제하여 2.8 g의 표제 생성물을 갈색 고체로서 얻었다. ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz): δ 10.2 (br s, 1H), 7.33 (d, 1H), 6.81 (d, 1H). 질량 스펙트럼: (M-1) = 145.

[0447] 단계 B: 2-클로로-*N*-[(1*S*)-1-시클로프로필에틸]-3-퓨란카복사미드 및 2-클로로-*N*-[(1*R*)-1-시클로프로필에틸]-3-퓨란카복사미드의 제조

[0448] DCM(25 mL) 중의 2-클로로-3-퓨란카복실산(1 g, 6.84 mmol) 용액에 α -메틸시클로프로판메탄아민 염산염(1:1)(0.75 g, 6.16 mmol), EDC-HCl(2 g, 10.27 mmol), DMAP(0.83 g 6.84 mmol)를 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 6시간 동안 교반한 후, TLC 분석(석유 에테르 중의 50% 에틸 아세테이트)은 반응의 완료를 보여주었다. 반응 혼합물을 물로 키펅칭하고, 에틸 아세테이트로(3x) 추출하였다. 합쳐진 유기층을 물, 염수로 세척한 다음 Na_2SO_4 위에서 건조시켰다. 감압 하에서 용매를 증발시키고, 20% 에틸 아세테이트/석유 에테르로 용리되는 실리카겔 컬럼 상에서 미정제 생성물을 정제하여 0.7 g의 표제 화합물을 백색 고체로서 얻었다. ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz): δ 7.31 (d, 1H), 6.82 (d, 1H), 6.19 (br s, 1H), 3.6 (m, 1H), 1.57 (d, 3H), 0.93 (m, 1H), 0.53 (m, 2H), 0.49 (m, 1H), 0.27 (m, 1H). 질량 스펙트럼: (M+1) = 214.

[0449] 키랄 분취 HPLC에 의해 1*S* 이성질체와 1*R* 이성질체를 분리하여 -21.5 및 +21.2(c 0.5, 클로로포름)의 선광도 [α]_D를 갖는 2개의 입체 이성질체를 얻었다.

[0450] 합성예 2

[0451] 2-클로로-*N*-(1,2,2-트리메틸프로필)-3-퓨란카복사미드(화합물 27)의 제조

[0452] 단계 A: 2-클로로-3-퓨란카보닐 클로라이드의 제조

[0453] 질소 분위기 하에서, 2-클로로-3-퓨란카복실산(1.0 g, 6.8 mmol)을 100 mL의 무수 디클로로메탄에 현탁시켰다. 이어서, 염화옥살릴(0.98 mL, 11.4 mmol)을 첨가한 후 1 방울의 DMF를 첨가하였다. 반응 혼합물을 밤새 교반하고, 이어서 감압 하에서 용매를 제거하여 852 mg(76%)의 황갈색 오일을 얻었다. ^1H NMR (CDCl_3 , 500 MHz): δ 7.37 (d, *J*=2.4 Hz, 1H), 6.89 ppm (d, *J*=2.2 Hz, 1H).

[0454] 디클로로메탄에서 원액을 제조하여[75 mg/5 mL] 추가 반응에 사용하였다.

[0455] 단계 B: 2-클로로-*N*-(1,2,2-트리메틸프로필)-3-퓨란카복사미드의 제조

[0456] 질소 분위기 하에서 무수 디클로로메탄 6.6 mL 중의 2-클로로-3-퓨란카보닐 클로라이드(100 mg, 0.61 mmol) 용액에 3-아미노-2,2-디메틸부탄(90 μ L, 0.67 mmol)을 첨가하였다. 이어서, 트리에틸아민(136 μ L, 0.98 mmol)을 첨가하고, 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. 이어서, 용액을 물로 세척하고, Celite®의 존재 하에 농축시키고, 크로마토그래피(0~20% EtOAc:헥산)로 정제하여 60 mg(46%)의 표제 화합물을 황갈색 오일로서 얻었다. ^1H NMR (CDCl_3 , 500MHz): δ 7.32 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 6.85 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 6.12-6.20 (m, 1H), 4.05 (dq, $J=9.5$, 6.8 Hz, 1H), 1.15 (d, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.84-1.06 ppm (s, 9H). LC/MS m/z $[\text{M}+\text{H}]^+$: 230.3.

[0457] 합성예 2a

[0458] 2-클로로-*N*-[(1*S*)-1,2,2-트리메틸프로필]-3-퓨란카복사미드(화합물 40)의 제조

[0459] 단계 A: 2-클로로-*N*-[(1*S*)-1,2,2-트리메틸프로필]-3-퓨란카복사미드의 제조

[0460] 질소 분위기 하에서 무수 디클로로메탄 5 mL 중의 2-클로로-3-퓨란카보닐 클로라이드(75 mg, 0.46 mmol) 용액에 (*S*)-(+)-3-아미노-2,2-디메틸부탄(67 μ L, 0.50 mmol)을 첨가하였다. 이어서, 트리에틸아민(188 μ L, 1.35 mmol)을 첨가하고, 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. 이어서, 용액을 물로 세척하고, Celite®의 존재 하에 농축시키고, 크로마토그래피(0~20% EtOAc:헥산)로 정제하여 33 mg(31%)의 표제 화합물을 백색 고체로서 얻었다. ^1H NMR (CDCl_3 , 500MHz): δ 7.32 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 6.85 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 6.12-6.20 (m, 1H), 4.05 (dq, $J=9.5$, 6.8 Hz, 1H), 1.15 (d, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.84-1.06 ppm (s, 9H). LC/MS m/z $[\text{M}+\text{H}]^+$: 230.4. $[\alpha] +10.7^\circ$ (c 3.65, 메탄올).

[0461] 합성예 2b

[0462] 2-클로로-*N*-[(1*R*)-1,2,2-트리메틸프로필]-3-퓨란카복사미드(화합물 41)의 제조

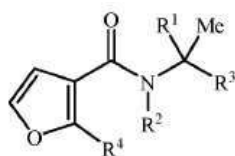
[0463] 단계 A: 2-클로로-*N*-[(1*R*)-1,2,2-트리메틸프로필]-3-퓨란카복사미드의 제조

[0464] 질소 분위기 하에서 무수 디클로로메탄 5 mL 중의 2-클로로-3-퓨란카보닐 클로라이드(75 mg, 0.46 mmol) 용액에 (*R*)-(+)-3-아미노-2,2-디메틸부탄(67 μ L, 0.50 mmol)을 첨가하였다. 이어서, 트리에틸아민(188 μ L, 1.35 mmol)을 첨가하고, 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. 이어서, 용액을 물로 세척하고, Celite®의 존재 하에 농축시키고, 크로마토그래피(0~20% EtOAc:헥산)로 정제하여 38 mg(36%)의 표제 화합물을 백색 고체로서 얻었다. ^1H NMR (CDCl_3 , 500MHz): δ 7.32 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 6.85 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 6.12-6.20 (m, 1H), 4.05 (dq, $J=9.5$, 6.8 Hz, 1H), 1.15 (d, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.84-1.06 ppm (s, 9H). LC/MS m/z $[\text{M}+\text{H}]^+$: 230.3. $[\alpha] -9.09^\circ$ (c 3.85, 메탄올).

[0465] 상기 반응 도식 1 내지 3 및 합성예 1, 2, 2a 및 2b에 기술된 방법 및 변형예에 의해 제조된 화학식 1, 1a, 1b 또는 2의 특정 화합물들을 아래 색인표에 나타내었다. 다음과 같은 약어가 사용될 수 있다: Cmpd는 화합물을 의미하고, *t*는 3차이고, Me는 메틸이고, Et는 에틸이다. 구조 단편에서 "-"는 분자의 잔기에 대한 단편의 부착점을 나타낸다. 약어 "Ex."는 "실시예"를 나타내고, 뒤에 오는 숫자는 그 화합물이 제조되는 합성예를 나타낸다.

[0466] 제목이 "MS"인 열은 질량 스펙트럼 데이터를 포함한다. 제목이 "MP"인 열은 융점 범위 데이터를 포함한다. 단일 열의 제목이 "MS/MP"인 경우, 범위(예를 들어, 120~122)로 이루어진 이 열의 항목은 융점 범위를 나타내는 한편, 하나의 숫자(예를 들어, 208.1)로 이루어진 이 열의 항목은 질량 스펙트럼 데이터를 나타낸다. 질량 스펙트럼 데이터의 경우, 보고된 수치는 가장 큰 동위 원소 존재비를 갖는 분자(즉, M)에 H^+ (1의 분자량)를 첨가하여 형성된 관찰 분자 이온의 분자량이다. 보고된 질량 스펙트럼 피크는 대기압 화학적 이온화(AP $^+$)를 이용한 질량 분석기에 의해 관찰되었다.

[0467] 색인표 A



[0468]

R⁴는 Me

Cmpd. No.	R ¹	R ²	R ³	MS	MP
1	H	H	-CH(Me)Et		75~78
2	H	Me	시클로프로필	208.1	
3	H	H	메틸		80~83
4	H	H	이소프로필		68~71
5	H	H	프로필	*	*
6	H	H	시클로프로필		64~68
7	Me	H	시클로프로필		78~82
80	H	H	-CH ₂ C(Me) ₃		104~108

[0469]

R⁴는 Cl

Cmpd. No.	R ¹	R ²	R ³	MS	MP
8	Me	H	시클로프로필		62~63
9	H	H	-CH ₂ CH ₂ (시클로프로필)	242.1	
10	Me	H	이소프로필	230.3	
11 (Ex. 1)	H	H	시클로프로필		82~86
12	Me	H	-CH ₂ OMe	*	*
13	H	H	-CH ₂ OMe		55~56
14	Me	H	-CH ₂ SMe		59~60
15	Me	H	-CH ₂ SO ₂ Me		100~101
16	H	H	에틸		85~86
17	H	H	프로필	*	*
18	Me	H	-CH ₂ C(Me) ₃	*	*
19	H	H	-CH ₂ CH(Me) ₂	230.3	
20	H	H	시클로펜틸	242.4	
21	H	H	시클로헥실	256.4	
22	H	H	1-메틸시클로프로필	228.3	
23	H	H	시클로부틸	228.3	
24	H	H	-CF ₃	242.3	
25	Me	H	-CH ₂ S(O)Me		134~135
26	H	H	이소프로필		81~84
27 (Ex. 2)	H	H	<i>t</i> -부틸	230.4	
28	H	H	-CH ₂ SMe	234.3	
29	H	H	펜틸	244.4	
30	H	H	4-메틸펜틸	258.4	
31	H	Me	시클로프로필	229.2	
78	H	H	-CH ₂ C(Me) ₃	244.3	

[0470]

R⁴는 Br

Cmpd. No.	R ¹	R ²	R ³	MS	MP
32	H	H	시클로프로필		54~57
33	H	H	이소프로필		58~59
34	H	H	프로필	*	*
35	H	H	<i>t</i> -부틸	*	*

R⁴는 CN

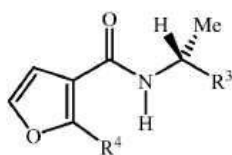
Cmpd. No.	R ¹	R ²	R ³	MS
79	H	H	-C(Me) ₂ Et	235.2
97	H	H	-CH ₂ C(Me) ₃	*
98	H	H	-CH ₂ CH(Me) ₂	*

R⁴는 I

Cmpd. No.	R ¹	R ²	R ³	MS	MP
83	H	H	-CH ₂ C(Me) ₃		68~72
88	H	H	<i>t</i> -부틸	322.4	

* ¹H NMR 데이터는 색인표 D를 참조.

색인표 B-1



R⁴는 Me

Cmpd. No.	R ³	MP	선광도
36	시클로프로필	70~73	
39	<i>t</i> -부틸	63~64	
84	-CH ₂ C(Me) ₃	130~134	-30.35 (c 0.1, 클로로포름)
96	이소프로필	51~55	

R⁴는 Cl

Cmpd. No.	R ³	MS	MP	선광도
41 (Ex. 2b)	<i>t</i> -부틸	230.3		-9.09 (c 3.85, 메탄올)
45 (Ex. 1)	시클로프로필		144~148	-21.5 (c 0.1, 클로로포름)
75	이소프로필	216.1		-20.0 (c 0.1, 클로로포름)
76	에틸		64~65	

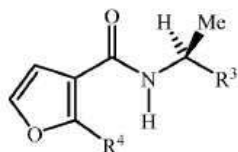
R⁴는 Br

Cmpd. No.	R ³	MP	선광도
38	<i>t</i> -부틸	89~90	
74	시클로프로필	70~73	

R⁴는 I

Cmpd. No.	R ³	MS	MP	선광도
86	<i>t</i> -부틸	322.1		-12.66 (c 0.4, 클로로포름)
102	-CH ₂ C(Me) ₃		94~98	-22.8 (c 0.25, 클로로포름)

[0475] 색인표 B-2



[0476]

R^4 는 Me

Cmpd. No.	R^3	MS	MP	선광도
37	시클로프로필		70~73	
85	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})_3$		132~136	+23.62 (<i>c</i> 0.25, 클로로포름)
94	<i>t</i> -부틸	213.4		
101	이소프로필		53~54	

R^4 는 Cl

Cmpd. No.	R^3	MS	MP	선광도
40 (Ex. 2a)	<i>t</i> -부틸	230.4		+10.7 (<i>c</i> 3.65, 메탄올)
43	이소프로필	*	*	+22.0 (<i>c</i> 0.1, 클로로포름)
44 (Ex. 1)	시클로프로필		81~85	+21.2 (<i>c</i> 0.1, 클로로포름)
77	에틸		64~65	

R^4 는 Br

Cmpd. No.	R^3	MP	선광도
42	<i>t</i> -부틸	90~91	
73	시클로프로필	71~75	

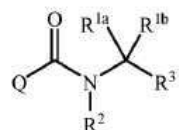
R^4 는 I

Cmpd. No.	R^3	MS	MP	선광도
87	<i>t</i> -부틸	322.1		+19.2 (<i>c</i> 0.5, 클로로포름)
103	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})_3$		92~96	+11.2 (<i>c</i> 0.25, 클로로포름)

* ^1H NMR 데이터는 색인표 D 를 참조.

[0477]

[0478] 색인표 C-1



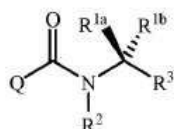
[0479]

R²는 H

Cmpd. No.	Q	R ^{1a}	R ^{1b}	R ³	MS/MP
46	2-메틸-3-푸라닐	시클로프로필	H	시클로프로필	110~115
47	2-메틸-3-푸라닐	-CH ₂ CH ₂ -		시클로프로필	*
48	3-메틸-2-티에닐	Me	H	이소프로필	84~88
49	3-플루오로-2-티에닐	Me	H	시클로프로필	72~76
50	3-브로모-2-티에닐	Me	H	시클로프로필	41~44
51	2-클로로-3-푸라닐	-CH ₂ CH ₂ -		시클로프로필	82~83
52	3-메틸-2-티에닐	시클로프로필	H	시클로프로필	121~125
53	2-클로로-3-푸라닐	에틸	H	시클로프로필	74~77
54	2-클로로-3-푸라닐	에틸	H	-CH ₂ OMe	54~55
55	5-요오도-2-메틸-4-티아졸릴	메틸	H	시클로프로필	337.3
56	5-요오도-4-티아졸릴	메틸	H	시클로프로필	323.3
57	2-클로로-4-요오도-5-티아졸릴	메틸	H	시클로프로필	357.2
58	3-메틸티오-2-티에닐	메틸	H	시클로프로필	242.3
59	2-브로모-5-티아졸릴	메틸	H	시클로프로필	277.2
60	2-메틸-5-티아졸릴	메틸	H	시클로프로필	211.3
61	5-티아졸릴	메틸	H	시클로프로필	197.3
62	5-클로로-4-티아졸릴	메틸	H	시클로프로필	231.3
63	5-브로모-4-티아졸릴	메틸	H	시클로프로필	275.2
64	3-메톡시-2-티에닐	메틸	H	시클로프로필	60~62
65	3-(트리플루오로메틸)-2-티에닐	메틸	H	시클로프로필	65~68
66	2-클로로-3-푸라닐	시클로프로필	H	트리플루오로메틸	101~106
67	2-메틸-3-푸라닐	에틸	H	시클로프로필	76~80
68	3-클로로-2-티에닐	시클로프로필	H	시클로프로필	160~164
69	2-티에닐	메틸	H	시클로프로필	143~146
70	4-메틸-5-티아졸릴	메틸	H	시클로프로필	211.4
71	4-티아졸릴	메틸	H	시클로프로필	197.3
72	5-(트리플루오로메틸)-4-티아졸릴	메틸	H	시클로프로필	265.3
82	4-메틸-5-티아졸릴	메틸	H	<i>t</i> -부틸	114~118
89	3-(1,1-디메틸에틸)-2-티에닐	메틸	H	이소프로필	67~68
90	3-(1,1-디메틸에틸)-2-티에닐	메틸	H	<i>t</i> -부틸	68~69
93	5-브로모-4-티아졸릴	메틸	메틸	-CH ₂ OMe	293.2
99	2-메틸-3-푸라닐	<i>t</i> -부틸	H	<i>t</i> -부틸	285.1

* ¹H NMR 데이터는 색인표 D를 참조.

색인표 C-2



R²는 H

Cmpd. No.	Q	R ^{1a}	R ^{1b}	R ³	MS/MP	선광도
81	4-메틸-5-티아졸릴	Me	H	<i>t</i> -부틸	125~129	+33.9 (<i>c</i> 0.1, 클로로포름)
91	3-(1,1-디메틸에틸)-2-티에닐	H	Me	<i>t</i> -부틸	42~43	-33.1 (<i>c</i> 0.8, 클로로포름)
92	3-(1,1-디메틸에틸)-2-티에닐	Me	H	<i>t</i> -부틸	54~55	+17.3 (<i>c</i> 0.79, 클로로포름)
95	3-시아노-2-티에닐	Me	H	<i>t</i> -부틸	237.3	+26.4 (<i>c</i> 0.78, 클로로포름)
100	4-메틸-3-티에닐	Me	H	<i>t</i> -부틸	210.3	-35.1 (<i>c</i> 0.77, 클로로포름)

[0484] 색인표 D

Cmpd. No.	¹ H NMR 데이터 ^a
5	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 7.26 (s, 1H), 6.41 (s, 1H), 5.44 (br s, 1H), 4.15 (m, 1H), 2.58 (s, 3H), 1.50 (m, 2H), 1.30 (m, 2H), 1.20 (d, 3H), 0.93 (t, 3H).
12	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 7.29 (d, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.50 (br s, 1H), 3.41 (s, 3H), 3.41 (s, 2H), 1.45 (s, 6H).
17	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 7.31 (s, 1H), 6.82 (s, 1H), 6.00 (br s, 1H), 4.18 (m, 1H), 1.5 (m, 2H), 1.30 (m, 2H), 1.22 (d, 1H), 0.95 (t, 3H).
18	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 7.31 (s, 1H), 6.82 (s, 1H), 6.20 (br s, 1H), 1.85 (s, 2H), 1.50 (s, 6H), 1.02 (s, 9H).
34	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 7.45 (s, 1H), 6.80 (s, 1H), 6.05 (br s, 1H), 4.18 (m, 1H), 1.50 (m, 2H), 1.30 (m, 2H), 1.23 (d, 3H), 0.95 (t, 3H).
35	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 7.46 (s, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.22 (br s, 1H), 4.07 (m, 1H), 1.17 (d, 3H), 0.97 (d, 6H).
43	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 7.32 (s, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.25 (br s, 1H), 4.06 (m, 1H), 1.79 (m, 1H), 1.17 (d, 3H), 0.96 (d, 6H).
47	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 7.08 (s, 1H), 6.23 (s, 1H), 6.00 (br s, 1H), 2.42 (s, 3H), 1.35 (m, 1H), 0.60 (m, 2H), 0.50 (m, 2H), 0.28 (m, 2H), 0.02 (m, 2H).
97	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 7.46 (s, 1H), 6.47 (s, 1H), 5.24 (br s, 1H), 4.13 (m, 1H), 1.49-1.42 (m, 2H), 1.24-1.19 (m, 3H), 0.95 (s, 9H).
98	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 7.42 (s, 1H), 6.59 (br s, 1H), 4.24-4.20 (m, 1H), 1.63 (m, 1H), 1.55-1.44 (m, 1H), 1.35-1.28 (m, 1H), 1.21 (d, 3H), 0.92-0.91 (m, 6H).

^a ¹H NMR 데이터는 테트라메틸실란으로부터 다운필드에서의 ppm 이다. 커플링은 (s)-단일선, (br s)-넓은 단일선, (d)-이중선, (t)-삼중선, (m)-다중선, (dd)-이중선의 이중선, (dt)-삼중선의 이중선, (br)-넓은선으로 표기된다.

[0485]

[0486]

일반적으로 본 발명의 화합물은 계면활성제, 담체 역할을 하는 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택되는 적어도 하나의 추가 성분을 가진 조성물, 즉 제형에서 기생 선충 방제 활성 성분으로서 사용될 것이다. 제형 또는 조성물 성분은 활성 성분의 물리적 성질, 토양 유형, 수분 및 온도와 같은 환경 요인 및 적용 방식과 일치하도록 선택된다.

[0487]

유용한 제형은 액체 조성물과 고체 조성물을 모두 포함한다. 액체 조성물은 용액(유제 포함), 현탁액, 에멀전(마이크로에멀전 및/또는 유현탁액 포함) 등을 포함하며, 선택적으로 겔로 농화될 수 있다. 수성 액체 조성물의 일반적인 유형은 수용제, 현탁제, 캡슐 현탁제, 농축 에멀전, 마이크로에멀전 및 유현탁액이다. 비수성 액체 조성물의 일반적인 유형은 유제, 마이크로유제, 분산성 액제 및 오일 분산액이다.

[0488]

고체 조성물의 일반적인 유형은 분제, 분말, 입제, 펠렛, 프릴, 패스틸, 정제, 충전 필름(종자 코팅 포함) 등이고, 수분산성("습윤성") 또는 수용성일 수 있다. 필름 형성 용액 또는 플로우어블 현탁액으로부터 형성된 필름 및 코팅이 종자 처리에 특히 유용하다. 활성 성분은 (마이크로)캡슐화될 수 있고 추가로 현탁액 또는 고체 제형으로 형성될 수 있다; 대안적으로, 활성 성분의 전체 제형이 캡슐화(또는 "오버코팅")될 수 있다. 캡슐화는 활성 성분의 방출을 제어하거나 지연시킬 수 있다. 유화성 입제는 유제 제형과 건조 입상 제형 모두의 장점을 겸비한다. 고강도 조성물은 추가 제형을 위한 중간물질로서 주로 사용된다.

[0489]

분무 가능한 제형은 일반적으로 분무 전에 적절한 매질에 희석된다. 이러한 액체 및 고체 제형은 분무 매질, 일반적으로는 물에 쉽게 희석되도록 제형화된다. 분무량은 헥타르 당 약 1 리터 내지 수천 리터의 범위일 수 있지만, 더 일반적으로는 헥타르 당 약 10 내지 수백 리터의 범위이다. 분무 가능한 제형은 공중 또는 지상 적용에 의한 잎 처리를 위해, 또는 식물의 성장 매체에 적용하기 위해 물 또는 다른 적절한 매체와 탱크 혼합될 수 있다. 액체 및 건조 제형은 점적 관개 시스템에 직접 계량되거나 식재 중에 고랑에 계량될 수 있다. 액체 및 고체 제형은 뿌리 및 다른 땅속 식물 부분 발육을 보호하기 위해 식재 전에 종자 처리로서 작물의 종자 및 다른 바람

직한 초목에 적용되고/되거나 전신 흡수를 통해 군엽에 적용될 수 있다.

[0490] 일반적으로 제형은 총 100 중량%가 되는 다음의 대략적 범위 내에서 활성 성분, 희석제 및 계면활성제의 유효량을 함유할 것이다.

	중량%		
	활성 성분	희석제	계면활성제
수분산성 및 수용성 입제, 정제 및 분말	0.001~90	0~99.999	0~15
오일 분산액, 현탁액, 에멀전, 용액(유제 포함)	1~50	40~99	0~50
분제	1~25	70~99	0~5
입제 및 펠렛	0.001~95	5~99.999	0~15
고강도 조성물	90~99	0~10	0~2

[0491]

[0492] 고체 희석제는 예를 들어, 벤토나이트, 몬모릴로나이트, 애터필사이트 및 카올린과 같은 점토, 석고, 셀룰로스, 이산화티타늄, 산화아연, 진분, 텍스트린, 당(예컨대, 락토스, 수크로스), 실리카, 탈크, 운모, 규조토, 요소, 탄산칼슘, 탄산나트륨 및 중탄산나트륨, 및 황산나트륨을 포함한다. 일반적인 고체 희석제는 문헌[Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey]에 기재되어 있다.

[0493]

액체 희석제는 예를 들어, 물, *N,N*-디메틸알칸아미드(예컨대, *N,N*-디메틸포름아미드), 리모넨, 디메틸 설폭시드, *N*-알킬피롤리돈(예컨대, *N*-메틸피롤리돈), 에틸렌 글리콜, 트리에틸렌 글리콜, 프로필렌 글리콜, 디프로필렌 글리콜, 폴리프로필렌 글리콜, 프로필렌 카보네이트, 부틸렌 카보네이트, 파라핀(예컨대, 백색 광유, 노멀 파라핀, 이소파라핀), 알킬벤젠, 알킬나프탈렌, 글리세린, 글리세롤 트리아세테이트, 소르비톨, 트리아세틴, 방향족 탄화수소, 탈방향족화 지방족, 알킬벤젠, 알킬나프탈렌, 케톤, 예컨대 시클로헥사논, 2-헵타논, 이소포론 및 4-하이드록시-4-메틸-2-펜타논, 아세테이트, 예컨대 이소아밀 아세테이트, 헥실 아세테이트, 헵틸 아세테이트, 옥틸 아세테이트, 노닐 아세테이트, 트리데실 아세테이트 및 이소보닐 아세테이트, 기타 에스테르, 예컨대 알킬화 락테이트 에스테르, 이염기성 에스테르 및 γ -부티로락톤, 및 선형, 분지형, 포화 또는 불포화일 수 있는 알코올, 예컨대 메탄올, 에탄올, *n*-프로판올, 이소프로필 알코올, *n*-부탄올, 이소부틸 알코올, *n*-헥산올, 2-에틸헥산올, *n*-옥탄올, 데칸올, 이소데실 알코올, 이소옥타데칸올, 세틸 알코올, 라우릴 알코올, 트리데실 알코올, 올레일 알코올, 시클로헥산올, 테트라하이드로푸르푸릴 알코올, 디아세톤 알코올 및 벤질 알코올을 포함한다. 액체 희석제는 또한, 포화 또는 불포화 지방산(일반적으로 C₆-C₂₂)의 글리세롤 에스테르, 예컨대 식물 종자 및 열매 오일(예컨대, 올리브, 피마자, 아마인, 참깨, 콘(옥수수), 땅콩, 해바라기, 포도씨, 홍화, 목화씨, 대두, 유채, 코코넛 및 팜핵의 오일), 동물성 지방(예컨대, 우지, 돈지, 라드, 대구간유, 어유), 및 이들의 혼합물을 포함한다. 액체 희석제는 또한, 알킬화(예컨대, 메틸화, 에틸화, 부틸화) 지방산을 포함할 수 있고, 지방산은 식물 및 동물 공급원으로부터의 글리세롤 에스테르의 가수분해에 의해 얻을 수 있고, 증류에 의해 정제될 수 있다. 일반적인 액체 희석제는 문헌[Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950]에 기재되어 있다.

[0494]

본 발명의 고체 조성물 및 액체 조성물은 대개 하나 이상의 계면활성제를 포함한다. 액체에 첨가되는 경우, 계면활성제("계면-활성 제제"로도 알려짐)는 일반적으로 액체의 표면 장력을 변경, 대부분의 경우 감소시킨다. 계면활성제 분자의 친수성기 및 친유성기의 성질에 따라, 계면활성제는 습윤제, 분산제, 유화제 또는 소포제로서 유용할 수 있다.

[0495]

계면활성제는 비이온성, 음이온성 또는 양이온성으로 분류될 수 있다. 본 조성물에 유용한 비이온성 계면활성제는 알코올 알콕실레이트, 예컨대 천연 및 합성 알코올(분지형 또는 선형일 수 있음)을 기반으로 하고 알코올 및 에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드, 부틸렌 옥사이드 또는 이들의 혼합물로부터 제조되는 알코올 알콕실레이트; 아민 에톡실레이트, 알카놀아미드 및 에톡실화 알카놀아미드; 알콕실화 트리글리세리드, 예컨대 에톡실화 대두, 피마자 및 유채 오일; 알킬페놀 알콕실레이트, 예컨대 옥틸페놀 에톡실레이트, 노닐페놀 에톡실레이트, 디노닐 페놀 에톡실레이트 및 도데실 페놀 에톡실레이트(페놀 및 에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드, 부틸렌 옥사이드 또는 이들의 혼합물로부터 제조); 에틸렌 옥사이드 또는 프로필렌 옥사이드로부터 제조되는 블록 중합

체 및 말단 블록이 프로필렌 옥사이드로부터 제조되는 리버스 블록 중합체; 에톡실화 지방산; 에톡실화 지방 에스테르 및 오일; 에톡실화 메틸 에스테르; 에톡실화 트리스티릴페놀(에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드, 부틸렌 옥사이드 또는 이들의 혼합물로부터 제조되는 것을 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; 고분자 계면활성제, 예컨대 랜덤 공중합체, 블록 공중합체, 알키드 peg(폴리에틸렌 글리콜) 수지, 그 래프트 또는 빗살형 중합체 및 성형(star) 중합체; 폴리에틸렌 글리콜(peg); 폴리에틸렌 글리콜 지방산 에스테르; 실리콘계 계면활성제; 및 당-유도체, 예컨대 수크로스 에스테르, 알킬 폴리글리코시드 및 알킬 폴리사카라이드를 포함하나, 이들로 한정되는 것은 아니다.

[0496] 유용한 음이온성 계면활성제는 알킬아릴 설포산 및 이들의 염; 카복실화 알코올 또는 알킬페놀 에톡실레이트; 디페닐 설포네이트 유도체; 리그닌 및 리그닌 유도체, 예컨대 리그노설포네이트; 말레인 또는 숙신산 또는 이들의 무수물; 올레핀 설포네이트; 포스페이트 에스테르, 예컨대 알코올 알콕실레이트의 포스페이트 에스테르, 알킬페놀 알콕실레이트의 포스페이트 에스테르 및 스티릴 페놀 에톡실레이트의 포스페이트 에스테르; 단백질을 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 도데실 및 트리데실벤젠의 설포네이트; 축합 나프탈렌의 설포네이트; 나프탈렌 및 알킬 나프탈렌의 설포네이트; 분별 석유의 설포네이트; 설포숙시나메이트; 및 설포숙시네이트 및 이들의 유도체, 예컨대 디알킬 설포숙시네이트 염을 포함하나, 이들로 한정되는 것은 아니다.

[0497] 유용한 양이온성 계면활성제는 아미드 및 에톡실화 아미드; 아민, 예컨대 *N*-알킬 프로판디아민, 트리프로필렌트리아민 및 디프로필렌테트라민, 및 에톡실화 아민, 에톡실화 디아민 및 프로폭실화 아민(아민 및 에틸렌 옥사이드, 프로필렌 옥사이드, 부틸렌 옥사이드 또는 이들의 혼합물로부터 제조); 아민 염, 예컨대 아민 아세테이트 및 디아민 염; 4차 암모늄 염, 예컨대 4차 염, 에톡실화 4차 염 및 디쿼터너리 염; 및 아민 옥사이드, 예컨대 알킬디메틸아민 옥사이드 및 비스-(2-하이드록시에틸)-알킬아민 옥사이드를 포함하나, 이들로 한정되는 것은 아니다.

[0498] 비이온성 계면활성제와 음이온성 계면활성제의 혼합물 또는 비이온성 계면활성제와 양이온성 계면활성제의 혼합물 또한 본 조성물에 유용하다. 비이온성, 음이온성 및 양이온성 계면활성제 및 이들의 권장 용도는 *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; 및 A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987을 비롯한 다양한 공개 참고문헌에 개시되어 있다.

[0499] 본 발명의 조성물은 제형 조제로서 당업자에게 알려진 제형 보조제 및 첨가제를 함유할 수도 있다(이들 중 일부는 고체 희석제, 액체 희석제 또는 계면활성제로서도 기능하는 것으로 간주될 수 있음). 이러한 제형 보조제 및 첨가제는 pH(완충액), 공정 중 발포(폴리오가노실록산과 같은 소포제), 활성 성분의 침강(현탁제), 점도(요변성 증점제), 용기 내 미생물 성장(항미생물제), 제품 동결(동결 방지제), 색상(염료/안료 분산액), 위시-오프(필름 형성제 또는 스티커), 증발(증발 지연제) 및 기타 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 예는 *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; 및 PCT 공개 WO 03/024222에 열거된 것들을 포함한다.

[0500] 화학식 1, 1a, 1b 또는 2의 화합물 및 임의의 기타 활성 성분은 일반적으로 활성 성분을 용매에 용해시키거나 또는 액체 또는 건조 희석제에서 분쇄하여 본 조성물에 혼입된다. 유제를 포함하는 용액은 성분을 단순히 혼합하여 제조될 수 있다. 유제로서 사용하고자 하는 액체 조성물의 용매가 물과 섞이지 않을 경우, 물로 희석할 때 활성-함유 용매를 유화시키기 위해 유화제가 일반적으로 첨가된다. 2,000 μm 이내의 입경을 갖는 활성 성분 슬러리는 매질 분쇄기를 이용하여 습식 분쇄되어 3 μm 미만의 평균 직경을 갖는 입자를 얻을 수 있다. 수성 슬러리는 최종 현탁제제로 제조되거나(예를 들어, U.S. 3,060,084 참조), 또는 분무 건조에 의해 추가 처리되어 수분산성 입제를 형성할 수 있다. 건조 제형은 보통 건식 밀링 공정을 필요로 하며, 이는 2 내지 10 μm 범위의

평균 입경을 생성한다. 분제 및 분말은 블렌딩 및 보통은 그라인딩(예컨대, 해머 밀 또는 유체-에너지 밀을 이용)에 의해 제조될 수 있다. 입제 및 펠렛은 미리 형성된 과립 담체 위에 활성 물질을 분무하여 제조되거나 응집 기술에 의해 제조될 수 있다. Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp. 147-48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pp. 8-57 및 이후, 및 WO 91/13546 참조. 펠렛은 U.S. 4,172,714에 기재된 바와 같이 제조될 수 있다. 수분산성 및 수용성 입제는 U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 및 DE 3,246,493에 교시된 바와 같이 제조될 수 있다. 정제는 U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 및 U.S. 5,208,030에 교시된 바와 같이 제조될 수 있다. 필름은 GB 2,095,558 및 U.S. 3,299,566에 교시된 바와 같이 제조될 수 있다.

[0501] 제형 기술에 관한 추가 정보는 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 참조. 또한, U.S. 3,235,361, 6란, 16줄 내지 7란, 19줄 및 실시예 10~41; U.S. 3,309,192, 5란, 43줄 내지 7란, 62줄 및 실시예 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138~140, 162~164, 166, 167 및 169~182; U.S. 2,891,855, 3란, 66줄 내지 5란, 17줄 및 실시예 1~4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; 및 *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000 참조.

[0502] 다음의 실시예에서, 모든 제형은 종래의 방식으로 제조된다. 화합물 번호는 색인표의 화합물을 참조한다. 추가적인 상세한 기술 없이도, 전술한 설명을 이용하는 당업자라면 본 발명을 최대한으로 활용할 수 있을 것으로 여겨진다. 따라서, 다음의 실시예는 단지 예시적인 것으로서, 어떤 방식으로든 본 발명을 제한하지 않는 것으로 해석된다. 달리 나타낸 경우를 제외하고 백분율은 중량 기준이다.

실시예 A

고강도 농축액

화합물 9	98.5%
실리카에어로졸	0.5%
합성 비경질 미세 실리카	1.0%

실시예 B

수화제(Wettable Powder)

화합물 11	65.0%
도데실페놀 폴리에틸렌 글리콜 에테르	2.0%
리그닌설폰산나트륨	4.0%
실리코알루미늄산나트륨	6.0%
몬모릴로나이트(하소)	23.0%

실시예 C

입제

화합물 26	10.0%
매터필자이트 입제(낮은 휘발성 물질, 0.71/0.30 mm; U.S.S. No. 25-50 시브)	90.0%

실시예 D

압출 펠렛

화합물 40	25.0%
무수 황산나트륨	10.0%
미정제 리그닌설폰산칼슘	5.0%
알킬 나프탈렌설폰산 나트륨	1.0%
칼슘/마그네슘 벤토나이트	59.0%

실시예 E

유제

화합물 43	10.0%
폴리옥시에틸렌 소르비톨 헥사올리에이트	20.0%
C ₆ -C ₁₀ 지방산 메틸 에스테르	70.0%

실시예 F

마이크로에멀전

화합물 78	5.0%
폴리비닐피롤리돈-비닐 아세테이트 공중합체	30.0%
알킬 폴리글리코시드	30.0%
글리세릴 모노올리에이트	15.0%
물	20.0%

[0503]

실시예 G

중화 처리

화합물 80	20.00%
폴리비닐피롤리돈-비닐 아세테이트 공중합체	5.00%
몬탄산 왁스	5.00%
리그닌설폰산칼슘	1.00%
폴리옥시에틸렌/폴리옥시프로필렌 블록 공중합체	1.00%
스테아릴 알코올(POE 20)	2.00%
폴리오가노실란	0.20%
착색제 적색 염료	0.05%
물	65.75%

실시예 H

비료 스택

화합물 84	2.5%
피롤리돈-스티렌 공중합체	4.8%
트리스티릴페닐 16-에톡실레이트	2.3%
탈크	0.8%
콘 전분	5.0%
완효성 비료	36.0%
카올린	38.0%
물	10.6%

실시예 I

현탁제제

화합물 9	35%
부틸 폴리옥시에틸렌/폴리프로필렌 블록 공중합체	4.0%
스테아르산/폴리에틸렌 글리콜 공중합체	1.0%
스티렌 아크릴계 중합체	1.0%
잔탄검	0.1%
프로필렌 글리콜	5.0%
실리콘계 소포제	0.1%
1,2-벤즈이소티아졸린-3-온	0.1%
물	53.7%

[0504]

실시예 J

유탕제

화합물 11	10.0%
부틸 폴리옥시에틸렌/폴리 프로필렌 블록 공중합체	4.0%
스테아르산/폴리에틸렌 글리콜 공중합체	1.0%
스티렌 아크릴계 중합체	1.0%
잔탄검	0.1%
프로필렌 글리콜	5.0%
실리콘계 소포제	0.1%
1,2-벤즈이소티아졸린-3-온	0.1%
방향족 석유계 탄화수소	20.0
물	58.7%

실시예 K

오일 분산액

화합물 26	25%
폴리옥시에틸렌 소르비톨 헥사올리레이트	15%
유기 변성 벤토나이트 점토	2.5%
지방산 메틸 에스테르	57.5%

실시예 L

유현탁액

화합물 40	10.0%
이미다클로프리드	5.0%
부틸 폴리옥시에틸렌/폴리 프로필렌 블록 공중합체	4.0%
스테아르산/폴리에틸렌 글리콜 공중합체	1.0%
스티렌 아크릴계 중합체	1.0%
잔탄검	0.1%
프로필렌 글리콜	5.0%
실리콘계 소포제	0.1%
1,2-벤즈이소티아졸린-3-온	0.1%
방향족 석유계 탄화수소	20.0%
물	53.7%

[0505]

[0506]

따라서, 본 화합물 및 조성물은 기생 선충류로부터 농작물을 보호하는 데 농경학적으로 유용하고, 또한 초식성 기생 선충류로부터 기타 원예 작물 및 식물을 보호하는 데 비농경학적으로 유용하다. 이러한 효용은 유익한 특성을 제공하기 위해 유전자 조작(즉, 유전자 이식)에 의해 도입되거나 돌연변이유발에 의해 변형된 유전 물질을 포함하는 작물 및 기타 식물(즉, 농경학적과 비농경학적 모두)의 보호를 포함한다. 이러한 특성의 예는 제초제에 대한 내성, 초식성 해충(예컨대, 곤충, 진드기, 진딧물, 거미, 선충류, 달팽이, 식물병원성 진균, 세균 및 바이러스)에 대한 저항성, 식물 성장 개선, 높거나 낮은 온도, 낮거나 높은 토양 수분, 및 높은 염분과 같은 불리한 재배 조건의 내성 증가, 개화 또는 결실 증가, 더 많은 수확량, 더 빠른 성숙, 수확 제품의 더 높은 품질 및/또는 영양가, 또는 수확 제품의 저장 또는 가공 특성 개선을 포함한다. 유전자 이식 식물은 여러 특성을 발현하도록 변형될 수 있다. 유전자 조작 또는 돌연변이유발에 의해 제공되는 특성을 포함하는 식물의 예는, 살충성 바실러스 튜링겐시스(*Bacillus thuringiensis*) 독소를 발현하는 콩, 목화, 대두 및 감자 품종, 예컨대 YIELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® 및 NEWLEAF®, INVICTA RR2 PRO™, 및 콩, 목화, 대두 및 유채의 제초제-내성 품종, 예컨대 ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® 및 CLEARFIELD®, 뿐만 아니라 *N*-아세틸트랜스퍼라제(GAT)를 발현하여 글리포세이트 제초제에 대한 저항성을 제공하는 작물, 또는 아세트락테이트 신타제(ALS)를 억제하는 제초제에 대한 저항성을 제공하는 HRA 유전자를 함유하는 작물을 포함한다. 본 화합물 및 조성물은 유전자 조작에 의해 도입되거나 돌연변이유발에 의해 변형된 특성과 상승적 상호작용을 할 수 있으므로, 특성의 표현형 발현 또는 효율성을 향상시키거나 본 화합물 및 조성물의 기생 선충 방제 효율성을 증가시킨다. 특히, 본 화합물 및 조성물은 기생 선충류에 독성을 가지는 단백질 또는 다른 천연물의 표현형 발현과 상승적 상호작용을 하여 이러한 해충에 대해 상가작용 이상의 방제효과를 제공할 수 있다.

[0507]

본 발명의 조성물은 또한 선택적으로, 식물 영양소, 예를 들어, 질소, 인, 칼륨, 황, 칼슘, 마그네슘, 철, 구리, 붕소, 망간, 아연, 및 몰리브덴으로부터 선택되는 적어도 하나의 식물 영양소를 포함하는 비료 조성물을 포함할 수 있다. 주목할 것은 질소, 인, 칼륨, 황, 칼슘 및 마그네슘으로부터 선택되는 적어도 하나의 식물 영

양소를 포함하는 적어도 하나의 비료 조성물을 포함하는 조성물들이다. 적어도 하나의 식물 영양소를 더 포함하는 본 발명의 조성물은 액체 또는 고체 형태일 수 있다. 주목할 것은 입제, 작은 스틱 또는 정제 형태의 고체 제형이다. 비료 조성물을 포함하는 고체 제형은 본 발명의 화합물 또는 조성물을 배합 성분과 함께 비료 조성물과 혼합한 후 과립화 또는 압출과 같은 방법에 의해 제형을 제조함으로써 제조될 수 있다. 대안적으로, 고체 제형은 휘발성 용매 중의 본 발명의 화합물 또는 조성물의 용액 또는 현탁액을 치수 안정적인 혼합물, 예컨대 입제, 작은 스틱 또는 정제 형태의 미리 제조된 비료 조성물 위에 분무한 후 용매를 증발시켜 제조될 수 있다.

[0508] 본 발명의 화합물은, 식물(예를 들어, 군엽, 열매, 줄기, 뿌리 또는 종자) 또는 동물 및 인간(예를 들어, 혈관 또는 소화 기관 또는 다른 조직) 내에 살거나 자라거나 이들을 먹고 살고 그로 인해 재배 농작물 및 저장 농작물, 삼림, 온실 작물, 관상용 식물 및 묘작물을 해치거나 동물 및 인간 건강에 피해를 입히는 넓은 범위의 기생 선충류에 대해 활성을 나타낼 수 있다. 특히 관심 있는 작물은 가지과 및 박과 작물과 같은 과일 채소류, 바나나 및 커피와 같은 재배 작물, 감자, 양파 및 당근과 같은 뿌리 작물, 및 담배, 땅콩, 목화, 사탕수수 및 대두와 같은 농작물이다.

[0509] 본 발명의 화합물은 유침목(Enoplida), 창선충목(Dorylaimida), 봉선충목(Rhabditida), 원선충목(Strongylida), 회충목(Ascaridia), 요충목(Oxyurida), 선미선충목(Spirurida), 식물선충목(Tylenchida) 및 둥근꼬리선충목(Aphelenchida)의 경제적으로 중요한 구성원을 비롯한, 선형동물문(Phylum Nematoda)의 쌍기충강(Adenophorea) 및 쌍선충강(Secernentea) 모두의 구성원, 예컨대, 이에 한정되는 것은 아니지만, 경제적으로 중요한 농해충, 예컨대 멜로이도기네속(genus *Meloidogyne*)의 뿌리혹 선충류, 헤테로테라속(genus *Heterodera*) 및 글로보테라속(genus *Globodera*)의 시스트 선충류, 프라틸렌처스속(genus *Pratylenchus*)의 썩이 선충류, 로틸렌쿨루스속(genus *Rotylenchulus*)의 콩팥모양 선충류, 라도폴러스속(genus *Radopholus*)의 굴파기 선충류, 벨로놀라이머스속(genus *Belonolaimus*)의 침선충류, 헬리코틸렌쿠스속(genus *Helicotylenchus*) 및 스쿠텔로네마속(genus *Scutellonema*)의 나선 선충류, 티렌쿨루스속(genus *Tylenchulus*)의 감글 선충류, 트리코도러스속(genus *Trichodorus*) 및 파라트리코도러스속(genus *Paratrichodorus*)의 궁침 선충류, 자이피네마속(genus *Xiphinema*)의 검선충류, 티렌코린커스속(genus *Tylenchorhynchus*)의 위축 선충류, 롱지도루스속(genus *Longidorus*) 및 파라롱지도루스속(genus *Paralongidorus*)의 바늘 선충류, 호플로라이머스속(genus *Hoplolaimus*)의 작살 선충류, 주름 선충과(family Criconematidae)의 주름 선충류, 디틸렌쿠스속(genus *Ditylenchus*) 및 앙구이나속(genus *Anguina*)의 줄기 선충류, 아펠렌코이데스속(genus *Aphelenchoides*) 및 라디나펠렌쿠스속(genus *Rhadinaphelenchus*)의 잎/줄기(foliar/stem) 선충류; 및 동물 및 인간 건강 기생충(즉, 경제적으로 중요한 회충, 예컨대 말의 보통 원충(*Strongylus vulgaris*), 개의 개회충(*Toxocara canis*), 양의 염전위충(*Haemonchus contortus*), 개의 심장사상충(*Dirofilaria immitis*) 등)에 대해 활성을 가질 수 있다.

[0510] 주목할 것은 뿌리혹 선충(고구마뿌리혹선충(*Meloidogyne incognita*))의 방제를 위한 본 발명의 화합물의 용도이다. 모든 화합물이 모든 선충류의 모든 성장 단계에 대해 동등하게 효과적이지는 않다는 것을 당업자는 이해할 것이다.

[0511] 본 발명의 화합물은 또한, 동물 및 인간 건강에 피해를 입히는 기생충(즉, 경제적으로 중요한 흡충 및 촌충)(예를 들어, 말의 엽상조충(*Anoplocephala perfoliata*), 반추동물의 간질(*Fasciola hepatica*) 등)을 비롯하여, 편형동물문(Phylum Platyhelminthes), 촌충강(Cestoda)(촌충) 및 흡충강(Trematoda)(흡충)의 구성원에 대해 활성을 나타낼 수 있다.

[0512] 본 발명의 화합물은 또한 살균제, 살진균제, 살선충제, 살균제(bactericide), 살비제, 제초제, 제초제 완화제, 성장 조절제, 예컨대 곤충 탈피 저해제(insect molting inhibitor) 및 발근 촉진제(rooting stimulant), 화학 불임제, 신호 화합물질(semiochemicals), 방충제, 유인제, 페로몬, 섭식 촉진 물질, 기타 생물학적 활성 화합물 또는 곤충병원성 세균, 바이러스 또는 진균을 비롯한 하나 이상의 다른 생물학적 활성 화합물 또는 제제와 혼합되어, 훨씬 더 넓은 범위의 농경학적 및 비농경학적 유용성을 제공하는 다성분 살충제를 형성할 수 있다. 따라서, 본 발명은 또한, 화학식 1, 1a 또는 1b의 화합물 및 유효량의 적어도 하나의 추가 생물학적 활성 화합물 또는 제제를 포함하는 조성물에 관한 것으로, 계면활성제, 고체 희석제 또는 액체 희석제 중 적어도 하나를 더 포함할 수 있다. 본 발명의 혼합물의 경우, 다른 생물학적 활성 화합물 또는 제제는 화학식 1, 1a 또는 1b의 화합물을 비롯한 본 발명의 화합물과 함께 제형화되어 프리믹스(premix)를 형성할 수 있거나, 또는 다른 생물학적 활성 화합물 또는 제제가 화학식 1, 1a 또는 1b의 화합물을 비롯한 본 발명의 화합물과 별도로 제형화되고 적용 전에 두 제형이 (예를 들어, 분무 탱크에서) 함께 배합되거나, 대안적으로는 연속적으로 적용될 수 있다.

[0513]

본 발명의 화합물과 함께 제형화될 수 있는 이러한 생물학적 활성 화합물 또는 제제의 예로는 살곤충제, 예컨대 아바멕틴, 아세페이트, 아세퀴노실, 아세타미프리트, 아크리나트린, 아피도피로펜 ([(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(시클로프로필카보닐)옥시]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-데카하이드로-6,12-디하이드록시-4,6a,12b-트리메틸-11-옥소-9-(3-피리디닐)-2H,11H-나프토[2,1-b]피라노[3,4-e]피란-4-일]메틸 시클로프로판카복실레이트), 아미도플루메트, 아미트라즈, 아버멕틴, 아자디라크틴, 아진포스-메틸, 벤푸라카브, 벤선탐, 비펜트린, 비페나제이트, 비스트리플루론, 보레이트, 부프로페진, 카두사포스, 카바릴, 카보퓨란, 카르탐, 카줄, 클로르안트라닐리프롤, 클로르페나피르, 클로르플루아주론, 클로르피리포스, 클로르피리포스-메틸, 크로마페노자이드, 클로펜테진, 클로티아니딘, 사이안트라닐리프롤 (3-브로모-1-(3-클로로-2-피리디닐)-N-[4-시아노-2-메틸-6-[(메틸아미노)카보닐]페닐]-1H-피라졸-5-카복사미드), 사이클라닐리프롤 (3-브로모-N-[2-브로모-4-클로로-6-[(1-시클로프로필에틸)아미노]카보닐]페닐]-1-(3-클로로-2-피리디닐)-1H-피라졸-5-카복사미드), 시클로프로트린, 시클록사프리트 ((5S,8R)-1-[(6-클로로-3-피리디닐)메틸]-2,3,5,6,7,8-헥사하이드로-9-니트로-5,8-에폭시-1H-이미다조[1,2-a]아제핀) 사이플루메토펜, 사이플루트린, 베타-사이플루트린, 사이할로트린, 감마-사이할로트린, 람다-사이할로트린, 사이피메트린, 알파-사이피메트린, 제타-사이피메트린, 사이로마진, 델타메트린, 디아펜티우론, 디아지논, 딜드린, 디플루벤주론, 디메플루트린, 디메히포, 디메토에이트, 디노테퓨란, 디오페놀란, 에마멕틴, 엔도선탐, 에스펜발러레이트, 에티프롤, 에토펜프로क्स, 예톡사줄, 펜부타틴 옥사이드, 페니트로티온, 페노티오캅, 페녹시캅, 펜프로파트린, 펜발러레이트, 피프로닐, 플로메토퀸 (2-에틸-3,7-디메틸-6-[4-(트리플루오로메톡시)페녹시]-4-퀴놀리닐 메틸 카보네이트), 플로로니카미드, 플루벤디아미드, 플루시트리네이트, 플루페네림, 플루페녹수론, 플루페녹시스트로빈 (메틸 (αE)-2-[[2-클로로-4-(트리플루오로메틸)페녹시]메틸]-α-(메톡시메틸렌)벤젠아세테이트), 플루엔선폰 (5-클로로-2-[(3,4,4-트리플루오로-3-부텐-1-일)설폰일]티아졸), 플루헥사폰, 플루오피람, 플루피프롤 (1-[2,6-디클로로-4-(트리플루오로메틸)페닐]-5-[(2-메틸-2-프로펜-1-일)아미노]-4-[(트리플루오로메틸)설폰일]-1H-피라졸-3-카보나이트), 플루피라디퓨론 (4-[[[(6-클로로-3-피리디닐)메틸](2,2-디플루오로에틸)아미노]-2(5H)-퓨란]), 플루발리네이트, 타우-플루발리네이트, 포노포스, 포메타네이트, 포스티아제이트, 할로페노자이드, 헵타플루트린 ([2,3,5,6-테트라플루오로-4-(메톡시메틸)페닐]메틸 2,2-디메틸-3-[(1Z)-3,3,3-트리플루오로-1-프로펜-1-일]시클로프로판카복실레이트), 헥사플루무론, 헥시티아족스, 히드라메틸논, 이미다클로프리트, 인독사카브, 살충 비누, 이소펜포스, 루페뉴론, 말라티온, 메퍼플루트린 ([2,3,5,6-테트라플루오로-4-(메톡시메틸)페닐]메틸 (1R,3S)-3-(2,2-디클로로에테닐)-2,2-디메틸시클로프로판카복실레이트), 메타플루미존, 메트알데히드, 메타미도포스, 메티다티온, 메티오캅, 메토밀, 메토펜, 메톡시클로르, 메톡시페노자이드, 메토플루트린, 모노크로토포스, 모노플루오로트린 ([2,3,5,6-테트라플루오로-4-(메톡시메틸)페닐]메틸 3-(2-시아노-1-프로펜-1-일)-2,2-디메틸시클로프로판카복실레이트), 니코틴, 니텐피람, 니티아진, 노발루론, 노비플루무론, 옥사밀, 파라티온, 파라티온-메틸, 퍼메트린, 포레이트, 포살론, 포스메트, 포스파미돈, 피리미캅, 프로페노포스, 프로플루트린, 프로파자이트, 프로트리헨부트, 피플루부미드 (1,3,5-트리메틸-N-(2-메틸-1-옥소프로필)-N-[3-(2-메틸프로필)-4-[2,2,2-트리플루오로-1-메톡시-1-(트리플루오로메틸)에틸]페닐]-1H-피라졸-4-카복사미드), 피메트로진, 피라플루프롤, 피레트린, 피리다벤, 피리달릴, 피리플루퀴나존, 피리미노스트로빈 (메틸 (αE)-2-[[[2-[(2,4-디클로로페닐)아미노]-6-(트리플루오로메틸)-4-피리미디닐]옥시]메틸]-α-(메톡시메틸렌)벤젠아세테이트), 피리프롤, 피리프록시펜, 로테논, 리아노딘, 실라플루오펜, 스피네토람, 스피노사드, 스피로디클로펜, 스피로메시펜, 스피로테트라멧, 설프로포스, 설프oks아플로르 (N-[메틸옥시도[1-[6-(트리플루오로메틸)-3-피리디닐]에틸]-λ⁴-설프라닐리덴]시아나미드), 테부페노자이드, 테부펜피라드, 테플루벤주론, 테플루트린, 터부포스, 테트라클로르빈포스, 테트라메트린, 테트라메틸플루트린 ([2,3,5,6-테트라플루오로-4-(메톡시메틸)페닐]메틸 2,2,3,3-테트라메틸시클로프로판카복실레이트), 테트라닐리프롤, 티아클로프리트, 티아메톡삼, 티오디캅, 티오선탐-소듐, 티옥사자펜 (3-페닐-5-(2-티에닐)-1,2,4-옥사디아졸), 톨펜피라드, 트랄로메트린, 트리아자메이트, 트리클로르폰, 트리플루메조피림 (2,4-디옥소-1-(5-피리미디닐메틸)-3-[3-(트리플루오로메틸)페닐]-2H-피리도[1,2-a]피리미디늄 분자 내염), 트리플루무론, 바실러스 튜링겐시스 델타-엔도톡신, 곤충병원성 세균, 곤충병원성 바이러스 및 곤충병원성 진균이 있다.

[0514]

주목할 것은 살곤충제, 예컨대 아바멕틴, 아세타미프리트, 아크리나트린, 아피도피로펜, 아미트라즈, 아버멕틴, 아자디라크틴, 벤푸라카브, 벤선탐, 비펜트린, 부프로페진, 카두사포스, 카바릴, 카르탐, 클로르안트라닐리프롤, 클로르페나피르, 클로르피리포스, 클로티아니딘, 사이안트라닐리프롤, 사이클라닐리프롤, 시클로프로트린, 사이플루트린, 베타-사이플루트린, 사이할로트린, 감마-사이할로트린, 람다-사이할로트린, 사이피메트린, 알파-사이피메트린, 제타-사이피메트린, 사이로마진, 델타메트린, 딜드린, 디노테퓨란, 디오페놀란, 에마멕틴, 엔도선탐, 에스펜발러레이트, 에티프롤, 에토펜프로क्स, 예톡사줄,

페니트로티온, 페노티오캅, 페녹시캅, 펜발러레이트, 피프로닐, 플로메토킨, 플로니카미드, 플루벤디아미드, 플루페녹수론, 플루페녹시스트로빈, 플루엔설파, 플루피프로플, 플루피라디퓨론, 플루발리네이트, 포메타네이트, 포스티아제이트, 헵타플루트린, 핵사플루무론, 히드라메틸논, 이미다클로프리드, 인독사카브, 루페뉴론, 메페플루트린, 메타플루미존, 메티오캅, 메토밀, 메토프렌, 메톡시페노자이드, 메토플루트린, 모노플루오로트린, 니텐피람, 니티아진, 노발루론, 옥사밀, 피플루부미드, 피메트로진, 피레트린, 피리다벤, 피리달릴, 피리미노스트로빈, 피리프록시펜, 리아노딘, 스피네토람, 스피노사드, 스피로디클로펜, 스피로메시펜, 스피로테트라멧, 설펡사플로르, 테부페노자이드, 테트라메트린, 테트라메틸플루트린, 티아클로프리드, 티아메톡삼, 티오디캅, 티오설파-소듐, 트랄로메트린, 트리아자메이트, 트리플루메조피람, 트리플루무론, 바실러스 튜링겐시스 델타-엔도톡신, 바실러스 튜링겐시스의 모든 균주 및 핵 다각체병 바이러스의 모든 균주이다.

[0515] 본 발명의 화합물과 혼합하기 위한 생물학적 제제의 일 구현에는 곤충병원성 세균, 예컨대 바실러스 튜링겐시스, 및 바실러스 튜링겐시스의 캡슐화된 델타-엔도톡신, 예컨대 CellCap® 공정에 의해 제조된 MVP® 및 MVP II® 생물학적 살곤충제(CellCap®, MVP® 및 MVP II®은 미국 인디애나주 인디애나 폴리스 소재 Mycogen 사의 상표임); 곤충병원성 진균, 예컨대 녹강 병균(*green muscardine fungus*); 및 바콜로바이러스, 핵다각체병 바이러스(NPV), 예컨대 헬리코베르파 제아 핵다각체병바이러스(*Helicoverpa zea nucleopolyhedrovirus* (HzNPV)), 아나그라파 팔시페라 핵다각체병바이러스(*Anagrapha falcifera nucleopolyhedrovirus* (AfNPV))를 비롯한 곤충병원성(자연 발생 및 유전자 변형 모두) 바이러스; 및 사이디아 포모넬라 과립병 바이러스(*Cydia pomonella granulosus virus* (CpGV))와 같은 과립병 바이러스(GV)를 포함한다.

[0516] 특히 주목할 것은 다른 무척추 해충 방제 활성 성분이 화학식 1, 1a 또는 1b의 화합물과는 상이한 화학적 분류에 속하거나 상이한 작용 부위를 갖는 그러한 조합이다. 어떤 경우에는, 방제 범위가 유사하지만 작용 부위가 상이한 적어도 하나의 다른 무척추 해충 방제 활성 성분과의 조합이 저항성 관리에 특히 유리할 것이다. 따라서, 본 발명의 조성물은 방제 범위가 유사하지만 상이한 화학적 분류에 속하거나 상이한 작용 부위를 갖는 적어도 하나의 추가 무척추 해충 방제 활성 성분을 더 포함할 수 있다. 이러한 추가 생물학적 활성 화합물 또는 제제는 아세틸콜린에스테라제(AChE) 저해제, 예컨대 카바메이트 메토밀, 옥사밀, 티오디캅, 트리아자메이트, 및 유기인산염 클로르피리포스; GABA-개폐성 클로라이드 채널 길항제, 예컨대 시클로디엔 딜드린 및 엔도설파, 및 페닐피라졸 에티프롤 및 피프로닐; 나트륨 채널 조절제, 예컨대 피레트로이드 비펜트린, 사이플루트린, 베타-사이플루트린, 사이할로트린, 람다-사이할로트린, 사이피메트린, 델타메트린, 디메플루트린, 에스펜발러레이트, 메토플루트린 및 프로플루트린; 니코틴성 아세틸콜린 수용체(nAChR) 작용제, 예컨대 네오니코티노이드 아세타미프리드, 클로티아니딘, 디노테퓨란, 이미다클로프리드, 니텐피람, 니티아진, 티아클로프리드, 및 티아메톡삼, 및 설펡사플로르; 니코틴성 아세틸콜린 수용체(nAChR) 알로스테릭 활성제, 예컨대 스피노신 스피네토람 및 스피노사드; 클로라이드 채널 활성제, 예컨대 아버멕틴 아바멕틴 및 에마멕틴; 유충 호르몬 모방제, 예컨대 디오펜놀란, 메토프렌, 페녹시캅 및 피리프록시펜; 선택적 동시류 섭생 차단제, 예컨대 피메트로진 및 플로니카미드; 진드기 성장 저해제, 예컨대 에톡사졸; 미토콘드리아 ATP 합성효소의 저해제, 예컨대 프로파자이트; 양성자 구배의 파괴를 통한 산화적 인산화의 언커플러, 예컨대 클로르페나피르; 니코틴성 아세틸콜린 수용체(nAChR) 채널 차단제, 예컨대 네레이스톡신 유사체 카르타프; 키틴 생합성 저해제, 예컨대 벤조일우레아 플루페녹수론, 핵사플루무론, 루페뉴론, 노발루론, 노비플루무론 및 트리플루무론, 및 부프로페진; 쌍시류 탈피 장애물질, 예컨대 사이로마진; 액디손 수용체 작용제, 예컨대 디아실하이드라진 메톡시페노자이드 및 테부페노자이드; 옥토파민 수용체 작용제, 예컨대 아미트라즈; 미토콘드리아 복합체 III 전자 전달 저해제, 예컨대 히드라메틸논; 미토콘드리아 복합체 I 전자 전달 저해제, 예컨대 피리다벤; 전압 의존성 나트륨 채널 차단제, 예컨대 인독사카브; 아세틸 CoA 카복실라아제 저해제, 예컨대 테트론산 및 테트라산 스피로디클로펜, 스피로메시펜 및 스피로테트라멧; 미토콘드리아 복합체 II 전자 전달 저해제, 예컨대 β-케토니트릴 사이노피라펜 및 사이플루메토펜; 리아니딘 수용체 조절제, 예컨대 안트라닐 디아미드 클로르안트라닐리프롤, 사이안트라닐리프롤 및 사이안트라닐리프롤, 디아미드, 예컨대 플루벤디아미드, 및 리아노딘 수용체 리간드, 예컨대 리아노딘; 생물학적 활성을 담당하는 표적 부위가 알려지지 않거나 특성화되지 않은 화합물, 예컨대 아자디라크틴, 비페나제이트, 피리달릴, 피리플루퀴나존 및 트리플루메조피람; 곤충 중장막의 미생물에 의한 파괴물질, 예컨대 바실러스 튜링겐시스 및 이들이 생산하는 델타-엔도톡신 및 바실러스 스파에리쿠스(*Bacillus sphaericus*); 및 핵 다각체병 바이러스(NPV) 및 기타 자연 발생 또는 유전자 변형 살곤충 바이러스를 비롯한 생물학적 제제를 포함하나, 이들로 한정되는 것은 아니다.

[0517] 본 발명의 화합물과 함께 제형화될 수 있는 생물학적 활성 화합물 또는 제제의 추가 예로는 살진균제, 예컨대 아시벤졸라-S-메틸, 알디모르프, 아메톡트라진, 아미셀브롬, 아닐라진, 아자코나졸, 아족시스트로빈, 베날락실(베날락실-M 포함), 베노다닐, 베노밀, 벤티아발리카브(벤티아발리카브-이소프로필 포함), 벤조빈디플루피르,

베톡사진, 비나파크릴, 비페닐, 비터타놀, 빅사펜, 블라스티시딘-S, 보스칼리드, 브로무코나졸, 부피리메이트, 부티오베이트, 카복신, 카르프로파미드, 캡타폴, 캡탄, 카벤다짐, 클로로넵, 클로로탈로닐, 클로졸리네이트, 수산화구리, 옥시염화구리, 황산구리, 코우목시스트로빈, 시아조파미드, 사이플루벤아미드, 사이목사닐, 사이프로코나졸, 사이프로디닐, 디클로플루아니드, 디클로사이메트, 디클로메진, 디클로란, 디에토펜카브, 디페노코나졸, 디플루메토펜, 디메티리몰, 디메토모르프, 디목시스트로빈, 디니코나졸(디니코나졸-M포함), 디노캡, 디티아논, 디티올란, 도데모르프, 도딘, 에코나졸, 에타코나졸, 에디펜포스, 에녹사스트로빈(에네스트로부린으로도 알려짐), 에폭시코나졸, 에타복삼, 에티리몰, 에트리디아졸, 파목사돈, 페나미돈, 페나민스트로빈, 페나리몰, 펜부코나졸, 펜푸람, 펜헥사미드, 페녹사닐, 펜피클로닐, 펜프로피딘, 펜프로피모르프, 펜피라자민, 펜틴 아세테이트, 펜틴 하이드록사이드, 퍼밤, 페림존, 플로메토퀸, 플루아지남, 플루디옥소닐, 플루페녹시스트로빈, 플루모르프, 플루오피콜라이드, 플루오피람, 플루옥사트스로빈, 플루퀸코나졸, 푸루실라졸, 플루실파미드, 플루티아닐, 플루톨라닐, 플루트리아폴, 플룩사피록사드, 폴페트, 프탈리드(fthalide)(프탈리드(phthalide)로도 알려짐), 푸베리다졸, 푸탈락실, 푸라메트피르, 헥사코나졸, 히벡사졸, 구아자틴, 이마잘릴, 이미벤코나졸, 이미녹타딘 알베실레이트, 이미녹타딘 트리아세테이트, 이오디카브, 이프로코나졸, 이소페타미드, 이프로벤포스, 이프로디온, 이프로발리카브, 이소프로티올레인, 이소피라잠, 이소티아닐, 카스가마이신, 크레속심-메틸, 만코제브, 만디프로파미드, 만데스트로빈, 마넵, 마파니피린, 메프로닐, 맵틸디노캡, 메탈락실 (메탈락실-M/메페녹삼포함), 메트코나졸, 메타설포카브, 메티람, 메토미노스트로빈, 메트라페논, 마이클로뷰타닐, 나프티딘, 네오-아소진(메탄아르손산제이철), 누아리몰, 옥틸리논, 오프레이스, 오리사스트로빈, 옥사딕실, 옥사티아피프롤린, 옥솔린산, 옥스포코나졸, 옥시카복신, 옥시테트라사이클린, 펜코나졸, 펜사이큐론, 펜플루벤, 펜티오피라드, 퍼푸라조에이트, 아인산(그 염 포함, 예컨대, 포세틸-알루미늄), 피카뷰트라족스, 피콕시스트로빈, 피페랄린, 폴리옥신, 프로베나졸, 프로클로라즈, 프로시미돈, 프로파모카브, 프로피코나졸, 프로피네브, 프로퀸아지드, 프로티오카브, 프로티오코나졸, 피라클로스트로빈, 피라메토스트로빈, 피라옥시스트로빈, 피라조포스, 피리벤카브, 피리부타카브, 피리페녹스, 피리오페논, 페리속사졸, 피리메타닐, 피리페녹스, 피롤니트린, 피로퀼론, 퀸코나졸, 퀸메티오네이트, 퀴녹시펜, 퀸토젠, 실티오팜, 세닥세인, 시메코나졸, 스피록사민, 스트렙토마이신, 황, 테부코나졸, 테부플로퀸, 테클로프탈람(teclofthalam), 테클로프탈람(teclofthalam), 테크나젠, 테르비나핀, 테트라코나졸, 티아벤다졸, 티플루자미드, 티오파네이트, 티오파네이트-메틸, 티람, 티아디닐, 톨클로포스-메틸, 톨프로카브, 톨리플루아니드, 트리아디메폰, 트리아디메놀, 트리아리몰, 트리아족사이드, 3염기 황산구리, 트리클로피리카브, 트리데모르프, 트리프록시스트로빈, 트리플루미줄, 트리모프라미드, 트리아이클라졸, 트리포린, 트리티코나졸, 유니코나졸, 발리다마이신, 발리페날레이트(발리페날로도 알려짐), 빈클로졸린, 지네브, 지람 및 족사미드; 살선충제, 예컨대 플루오피람, 스피로테트라멧, 티오디캅, 포스티아제이트, 아바멕틴, 이프로디온, 플루엔설포, 디메틸 디설파이드, 티옥사자펜, 1,3-디클로로프로펜 (1,3-D), 메탐 (나트륨 및 칼륨), 다조메트, 클로로피크린, 페나미포스, 에토프로포스, 카두사포스, 터부포스, 이미시아포스, 옥사밀, 카보퓨란, 티옥사자펜, 바실러스 필무스(*Bacillus firmus*) 및 파스테우리아 니시자와에(*Pasteuria nishizawae*); 살균제, 예컨대 스트렙토마이신; 살비제, 예컨대 아미트라즈, 키노메티오나트, 클로로벤질레이트, 사이헥사틴, 디코폴, 디에노클로르, 에톡사졸, 페나자퀸, 펜부타딘 옥사이드, 펜프로파트린, 펜피록시메이트, 헥시티아족스, 프로파자이트, 피리다벤 및 테부펜피라드가 있다.

- [0518] 어떤 경우에는, 본 발명의 화합물과 다른 생물학적 활성(특히 무척추 해충 방제) 화합물 또는 제제(즉, 활성 성분)의 조합은 상가작용 이상(즉, 상승적) 효과를 가져올 수 있다. 효과적인 해충 방제를 보장하면서 환경에 방출되는 활성 성분의 양을 감소시키는 것이 항상 바람직하다. 무척추 해충 방제 활성 성분과의 상승 작용이 농경학적으로 만족스러운 무척추 해충 방제 수준을 제공하는 시용량(application rate)에서 일어날 때, 이러한 조합은 작물 생산 비용의 절감 및 환경 부하의 감소에 유리할 수 있다.
- [0519] 본 발명의 화합물 및 그 조성물은 무척추 해충에 유독한 단백질(예컨대, 바실러스 튜링겐시스 델타-엔도톡신)을 발현하도록 유전적으로 형질전환된 식물에 적용될 수 있다. 이러한 적용은 더 넓은 범위의 식물 보호를 제공할 수 있으며, 저항성 관리에 유리하다. 본 발명의 외인성 적용 화합물의 효과는 발현된 독소 단백질과 상승 작용할 수 있다.
- [0520] 이들 농업용 보호제(즉, 살균충제, 살진균제, 살선충제, 살비제, 제초제 및 생물학적 제제)에 관한 일반적인 참고문헌은 *The Pesticide Manual, 13th Edition*, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 및 *The BioPesticide Manual, 2nd Edition*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001을 포함한다.
- [0521] 하나 이상의 이러한 다양한 혼합 상대물질이 사용되는 구현예의 경우, 이들 다양한 혼합 상대물질(전체) 대 화

화합물 1의 화합물의 중량비는 일반적으로 약 1:3000 내지 약 3000:1이다. 주목할 것은 약 1:300 내지 약 300:1의 중량비(예컨대, 약 1:30 내지 30:1의 비)이다. 당업자는 원하는 생물학적 활성 범위에 필요한 활성 성분의 생물학적 유효량을 간단한 실험을 통해 쉽게 결정할 수 있다. 이러한 추가 성분의 포함이 화합물 1의 화합물 단독으로 방제하는 범위를 넘어 기생 선충류의 방제 범위를 확장시킬 수 있음은 명백할 것이다.

[0522] 일반적으로 조성물 형태인 본 발명의 하나 이상의 화합물을 농경학적 및/또는 비농경학적 침입 장소를 포함하는 해충의 환경에, 보호될 영역에, 또는 방제되어야 하는 해충에 직접 생물학적 유효량으로 적용함으로써 기생 선충류는 농경학적 및 비농경학적 분야에서 방제된다.

[0523] 따라서, 본 발명은 농경학적 및/또는 비농경학적 분야에서 기생 선충을 방제하는 방법으로서, 기생 선충 또는 그 환경을 생물학적 유효량의 본 발명의 하나 이상의 화합물과 접촉시키거나, 또는 적어도 하나의 이러한 화합물을 포함하는 조성물 또는 적어도 하나의 이러한 화합물 및 적어도 하나의 추가 생물학적 활성 화합물 또는 제제를 포함하는 조성물과 접촉시키는 단계를 포함하는 방법을 포함한다. 본 발명의 화합물 및 적어도 하나의 추가 생물학적 활성 화합물 또는 제제를 포함하는 적절한 조성물의 예로는 과립형 조성물을 포함하며, 이때 추가 활성 화합물은 본 발명의 화합물과 동일한 입체 상에 존재하거나 본 발명의 화합물의 입체와는 별도의 입체 상에 존재한다.

[0524] 본 발명의 화합물 또는 조성물과 접촉시켜 기생 선충류로부터 농작물을 보호하기 위해, 본 화합물 또는 조성물은 일반적으로 식재 전에 작물의 종자에, 경작 식물의 군엽(예컨대, 잎, 줄기, 꽃, 열매)에, 또는 작물의 식재 전 또는 후에 토양 또는 다른 성장 매체에 적용된다.

[0525] 접촉 방법의 일 구현에는 분무에 의한 것이다. 대안적으로, 본 발명의 화합물을 포함하는 과립형 조성물은 식물 군엽 또는 토양에 적용될 수 있다. 본 발명의 화합물은 또한 액체 제형의 토양 관주, 토양에의 과립형 제형, 육묘 상자 처리 또는 이식 침지로서 적용되는 본 발명의 화합물을 포함하는 조성물과 식물을 접촉시킴으로써 식물 흡수를 통해 효과적으로 전달될 수 있다. 주목할 것은 토양 관주용 액체 제형 형태의 본 발명의 조성물이다. 또한 주목할 것은 기생 선충 방제 방법으로서, 기생 선충 또는 그 환경을 생물학적 유효량의 본 발명의 화합물 또는 생물학적 유효량의 본 발명의 화합물을 포함하는 조성물과 접촉시키는 단계를 포함하는 방법이다. 또한 주목할 것은 환경이 토양이고 조성물이 토양 관주 제형으로서 토양에 적용되는 이러한 방법이다. 또한 주목할 것은 본 발명의 화합물이 침입 장소에 국소 적용하여도 효과적이라는 것이다. 다른 접촉 방법은 직접 잔류 분무, 공중 분무, 겔, 종자 코팅, 마이크로캡슐화, 전신 흡수, 미끼, 귀표, 볼루스, 연무기, 훈증제, 에어로졸, 분제 및 기타 여러가지로 본 발명의 화합물 또는 조성물을 적용하는 것을 포함한다. 접촉 방법의 일 구현에는 본 발명의 화합물 또는 조성물을 포함하는 지수 안정적인 비료 입체, 스틱 또는 정제를 포함한다. 본 발명의 화합물은 무척추 동물 방제 장치(예컨대, 포충망) 제작용 재료에 함침될 수도 있다.

[0526] 본 발명의 화합물은 기생 선충류로부터 종자를 보호하기 위한 종자 처리에 또한 유용하다. 본 명세서 및 청구범위의 문맥에서, 종자 처리는 종자를 생물학적 유효량의 본 발명의 화합물(일반적으로 본 발명의 조성물로 제형 화됨)과 접촉시키는 것을 의미한다. 이러한 종자 처리는 무척추 토양 해충으로부터 종자를 보호하고, 발아 종자로부터 발육하는 모종의 토양과 접촉된 뿌리 및 다른 식물 부분도 일반적으로 보호할 수 있다. 종자 처리는 또한, 본 발명의 화합물 또는 제2 활성 성분을 발육하고 있는 식물 내로 옮김으로써 군엽을 보호할 수 있다. 종자 처리는 특수 형질을 발현하도록 유전적으로 형질전환된 식물이 발아될 종자를 비롯한 모든 유형의 종자에 적용될 수 있다. 유전적으로 형질전환된 식물의 대표적인 예는 바실러스 튜링겐시스 독소와 같은 기생 선충류에 유독한 단백질을 발현하는 것, 또는 글리포세이트에 대한 저항성을 제공하는 글리포세이트 아세트이트랜스퍼라제와 같은 제초제 저항성을 발현하는 것을 포함한다.

[0527] 종자 처리의 한 방법은 파종 전에 본 발명의 화합물(즉, 제형화된 조성물로서)을 종자에 분무하거나 살포하는 것이다. 종자 처리용으로 제형화된 조성물은 일반적으로 필름 형성제 또는 고착제(adhesive agent)를 포함한다. 따라서, 본 발명의 종자 코팅 조성물은 일반적으로 생물학적 유효량의 화합물 1, 1a 또는 1b의 화합물, 및 필름 형성제 또는 고착제를 포함한다. 종자는 유동성 현탁제제를 종자의 텀블링층(tumbling bed) 내로 직접 분무한 후 종자를 건조시켜 코팅될 수 있다. 대안적으로, 다른 제형 유형, 예컨대 습윤 분말, 용액, 유현탁액, 유제 및 유탁제가 종자 상에 분무될 수 있다. 이러한 처리는 종자 상에 필름 코팅을 적용하는 데 특히 유용하다. 다양한 코팅기 및 코팅 방법을 당업자가 이용할 수 있다. 적합한 방법은 P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Monograph No. 57, 및 거기에 열거된 참고문헌에 열거된 것들을 포함한다.

[0528] 처리된 종자는 일반적으로 종자 100 kg 당 약 0.1 g 내지 1 kg(즉, 처리 전 종자의 약 0.0001 내지 1 중량%)의 양으로 본 발명의 화합물을 포함한다. 종자 처리용으로 제형화된 유동성 현탁액은 일반적으로 약 0.5 내지 약

70%의 활성 성분, 약 0.5 내지 약 30%의 필름 형성 접착제, 약 0.5 내지 약 20%의 분산제, 0 내지 약 5%의 증점제, 0 내지 약 5%의 안료 및/또는 염료, 0 내지 약 2%의 소포제, 0 내지 약 1%의 방부제, 및 0 내지 약 75%의 휘발성 액체 희석제를 포함한다.

- [0529] 농경학적 분야의 경우, 효과적 방제에 필요한 시용량(즉, "생물학적 유효량")은 방제 대상 선충의 종, 선충의 생활 주기, 생활 단계, 크기, 위치, 연중 시기, 숙주 작물 또는 동물, 섭식 거동, 짝짓기 거동, 주위 습도, 온도 등과 같은 요인에 따라 달라질 것이다. 정상적인 상황에서, 헥타르 당 약 0.01 내지 2 kg의 활성 성분의 시용량이 농경 생태계에서 선충류를 방제하는 데 충분하지만, 헥타르 당 0.0001 kg만큼 적은 양이 충분할 수 있거나 헥타르 당 8 kg만큼 많은 양이 필요할 수 있다. 비농경학적 분야의 경우, 효과적인 사용량은 평방 미터 당 약 1.0 내지 50 mg의 범위일 것이지만, 평방 미터 당 0.1 mg만큼 적은 양이 충분할 수 있거나 평방 미터 당 150 mg만큼 많은 양이 필요할 수 있다. 당업자는 원하는 수준의 기생 선충 방제에 필요한 생물학적 유효량을 용이하게 결정할 수 있다.
- [0530] 다음의 시험들은 특정 해충에 대한 본 발명의 화합물의 방제 효능을 입증한다. "방제 효능"은 상당히 감소된 섭생을 야기하는 기생 선충 발생의 억제(사망 포함)를 나타낸다. 그러나, 화합물이 제공하는 해충 방제 보호가 이들 중에 한정되는 것은 아니다.
- [0531] 본 발명의 생물학적 실시예
- [0532] 시험 A
- [0533] 사질 토양 혼합물 및 오이 모종으로 채워진 작은 개방 용기로 이루어진 시험 유닛에서 접촉 및/또는 전신 수단을 통한 고구마 뿌리혹 선충(*Meloidogyne incognita*)의 방제를 평가하였다.
- [0534] 50%의 아세톤과 50%의 물을 함유한 용액을 사용하여 시험 화합물을 제형화하였다. 시험 화합물을 500 ppm 활성 성분의 농도로 시험 유닛의 토양에 직접 적용하였다. 각각의 시험은 3회 반복하였다. 처리 후, 시험 유닛을 1시간 동안 건조시킨 후, 약 400 마리의 2단계 미숙(J2) 유충 및 800개의 알을 피펫으로 토양에 넣었다. 시험 유닛은 27°C로 유지하였고, 7일 동안 필요에 따라 물을 주었다.
- [0535] 살선충 효능은 미처리 대조군과 비교시 관찰된 뿌리혹 형성량에 의해 결정되었다. 혹 형성이 없음은 100% 선충 방제를 나타낸다. 미처리 대조군에서 발견된 것과 동등한 혹 형성은 0% 방제를 나타낸다. 상당한 식물독성을 나타내는 화합물에는 선충 방제 등급을 부여하지 않았다.
- [0536] 500 ppm의 농도로 시험된 화합물들 중, 다음의 화합물들이 양호한 수준의 식물 보호(용매 처리된 대조군에 비해 50% 이상 뿌리혹 감소)를 제공하였고, 유의한 식물독성을 나타내지 않았다. 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 10, 11, 12, 14, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 26, 27, 29, 30, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 39, 40, 42, 43, 45, 46, 47, 48, 50, 52, 53, 56, 58, 60, 62, 63, 65, 67, 70, 72, 74, 75, 77, 80, 89, 90, 92, 95, 96, 101 및 103.