



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2013-0109940
(43) 공개일자 2013년10월08일

- | | |
|---|--|
| <p>(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
 <i>C07D 231/14</i> (2006.01) <i>C07D 401/12</i> (2006.01)
 <i>A01N 43/56</i> (2006.01) <i>A01P 3/00</i> (2006.01)
 (21) 출원번호 10-2012-7031027
 (22) 출원일자(국제) 2011년06월01일
 심사청구일자 없음
 (85) 번역문제출일자 2012년11월27일
 (86) 국제출원번호 PCT/EP2011/059025
 (87) 국제공개번호 WO 2011/151369
 국제공개일자 2011년12월08일
 (30) 우선권주장
 10356019.9 2010년06월03일
 유럽특허청(EPO)(EP)
 (뒷면에 계속)</p> | <p>(71) 출원인
 바이엘 크롭사이언스 아게
 독일 40789 몬하임 알프레드-노벨-스트라세 50
 (72) 발명자
 벤텝 위르겐
 독일 42799 라이홀링겐 암젤슈트라세 7
 브라운 크리스토프
 독일 40625 뒤셀도르프 벤더슈트라세 18
 (뒷면에 계속)
 (74) 대리인
 특허법인코리아나</p> |
|---|--|

전체 청구항 수 : 총 17 항

(54) 발명의 명칭 N-[(헥트)아릴에틸] 피라졸(티오)카르복사미드 및 이의 헤테로치환된 유사체

(57) 요약

본 발명은 살진균성 N-[(헥트)아릴에틸] 피라졸카르복사미드 또는 티오카르복사미드 및 이의 헤테로치환된 유사체, 이의 제조 방법 및 이의 제조를 위한 중간체 화합물, 살진균제, 특히 살진균성 조성물 형태의 것으로서의 이의 용도 및 상기 화합물 또는 이의 조성물을 사용하여 식물의 식물병원성 진균류를 방제하는 방법에 관한 것이다.

(72) 발명자

꼬께롱 뻐에르-이브

프랑스 에프-69003 리옹 꾸르 드 라 리베르떼 56

크리스토프 뻐에르

프랑스 에프-69009 리옹 뤼 마리에똥 4

다멘 페터

독일 41470 노이썬 알테브뤼커슈트라쎄 63

데스보르트 필리쁘

프랑스 에프-69006 리옹 뤼 뤼 독뻐르 모위쎄 14

가리 스테빠니

프랑스 에프-69410 샹파뉴-오-몽-도르 뤼 시몽 뤼 송 9

그로일 외르크

독일 42799 라이흐링겐 암 산트베르크 30아

하다노 히로유키

일본 도치기켄 시모츠케시 기온 시모츠케시 3-2-18

크노블로 토마

프랑스 에프-69380 샤뮈롱 다제르그 도맹 데 비뉴 11

마이쓰너 루트

독일 51375 레버쿠젠 쿨만백 35

바헨도르프-노이만 울리케

독일 56566 노이비트 오베러 마르켄백 85

빌름스 로타르

독일 65719 호프하임 쾨니히슈타이너 슈트라쎄 50

(30) 우선권주장

10356033.0 2010년11월15일

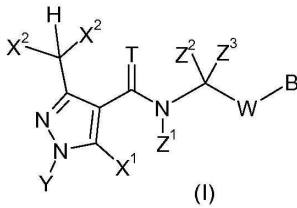
유럽특허청(EPO)(EP)

61/368,030 2010년07월27일 미국(US)

특허청구의 범위

청구항 1

식 (I)의 화합물 및 그 염, N-옥시드, 금속 착물, 반금속성 (metalloidic) 착물 및 광학 활성 이성질체:



[식 중,

- 동일하거나 또는 상이할 수 있는 X^1 및 X^2 는 할로젠 원자를 나타내고;
- Y 는 C_1 - C_4 -알킬을 나타내고;
- T 는 O 또는 S 를 나타내고;
- W 는 CZ^4Z^5 ; O ; S ; SO ; SO_2 ; NZ^6 ; SiZ^7Z^8 ; 또는 $-C(=U)-$ 를 나타내고;
- B 는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 5개 이하의 기 X 로 치환될 수 있는 페닐 고리; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 7개 이하의 기 X 로 치환될 수 있는 나프틸 고리; 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 X 로 치환될 수 있는, N, O, S 로 이루어진 목록에서 선택되는 1 내지 4개의 헤테로원자를 포함하는 포화, 부분 포화 또는 불포화, 모노시클릭 또는 융합 바이시클릭 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 9-, 10-원 고리를 나타내고;
- X 는 할로젠 원자 ; 니트로 ; 시아노 ; 이소니트릴 ; 히드록시 ; 아미노 ; 술팜닐 ; 펜타플루오로- λ^6 -술팜닐 ; 포르밀 ; 포르밀옥시 ; 포르밀아미노 ; 치환 또는 비치환 (히드록시이미노)- C_1 - C_8 -알킬 ; 치환 또는 비치환 (C_1 - C_8 -알콕시이미노)- C_1 - C_8 -알킬 ; 치환 또는 비치환 (C_2 - C_8 -알케닐옥시이미노)- C_1 - C_8 -알킬 ; 치환 또는 비치환 (C_2 - C_8 -알킬닐옥시이미노)- C_1 - C_8 -알킬 ; 치환 또는 비치환 (벤질옥시이미노)- C_1 - C_8 -알킬 ; 카르복시 ; 카르바모일 ; N-히드록시카르바모일 ; 카르바메이트 ; 치환 또는 비치환 C_1 - C_8 -알킬 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1 - C_8 -할로게노알킬 ; 치환 또는 비치환 C_2 - C_8 -알케닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_2 - C_8 -할로게노알케닐 ; 치환 또는 비치환 C_2 - C_8 -알킬닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_2 - C_8 -할로게노알킬닐 ; 치환 또는 비치환 C_1 - C_8 -알콕시 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1 - C_8 -할로게노알콕시 ; 치환 또는 비치환 C_1 - C_8 -알킬술팜닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1 - C_8 -할로게노알킬술팜닐 ; 치환 또는 비치환 C_1 - C_8 -알킬술피닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1 - C_8 -할로게노알킬술피닐 ; 치환 또는 비치환 C_1 - C_8 -알킬술포닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1 - C_8 -할로게노알킬술포닐 ; 치환 또는 비치환 C_1 - C_8 -알킬아미노 ; 치환 또는 비치환 디- C_1 - C_8 -알킬아미노 ; 치환 또는 비치환 C_2 - C_8 -알케닐옥시 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_2 - C_8 -할로게노알케닐옥시 ; 치환 또는 비치환 C_3 - C_8 -알킬닐옥시 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_2 - C_8 -할로게노알킬닐옥시 ; 치환 또는 비치환 C_3 - C_7 -시클로알킬 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_3 - C_7 -할로게노시클로알킬 ; 치환 또는 비치환 (C_3 - C_7 -시클로알킬)- C_1 - C_8 -알킬 ; 치환 또는 비치환 (C_3 - C_7 -시클로알킬)- C_2 - C_8 -알케닐 ; 치환 또는 비치환 (C_3 - C_7 -시클로알킬)- C_2 - C_8 -알킬닐 ; 치환 또는 비치환 트리(C_1 - C_8 -알킬)실릴 ; 치환 또는 비치환 트리(C_1 - C_8 -알킬)실릴- C_1 - C_8 -알킬 ; 치환 또는 비치환 C_1 - C_8 -알킬카르보닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1 - C_8 -할로게노알킬카르보닐 ; 치환 또는 비치환 C_1 - C_8 -알킬카르보닐옥시 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1 - C_8 -할로게노알킬카르보닐아미노 ; 치환 또는 비치환 C_1 - C_8 -알콕시카르보닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1 - C_8 -할로게노

알콕시카르보닐 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬옥시카르보닐옥시 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1-C_8 -할로게노알콕시카르보닐옥시 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬카르바모일 ; 치환 또는 비치환 디- C_1-C_8 -알킬카르바모일 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬아미노카르보닐옥시 ; 치환 또는 비치환 디- C_1-C_8 -알킬아미노카르보닐옥시 ; 치환 또는 비치환 N-(C_1-C_8 -알킬)히드록시 카르바모일 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알콕시카르바모일 ; 치환 또는 비치환 N-(C_1-C_8 -알킬)- C_1-C_8 -알콕시카르바모일 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 아릴 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 C_1-C_8 -아릴알킬 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 C_2-C_8 -아릴알케닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 C_2-C_8 -아릴알키닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 아릴옥시 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 아릴술폰닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 아릴아미노 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 C_1-C_8 -아릴알킬옥시 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 C_1-C_8 -아릴알킬술폰닐 ; 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 C_1-C_8 -아릴알킬아미노를 나타내거나; 또는

· 2개의 치환기 X 는 이들이 결합되는 연속되는 탄소 원자와 함께 동일하거나 또는 상이할 수 있는 4개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 5- 또는 6-원, 포화 카르보사이클 또는 포화 헤테로사이클을 형성할 수 있고;

· Z^1 은 수소 원자 ; 포르밀 기 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알콕시; 비치환 C_3-C_7 -시클로알킬 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있고 할로젠 원자, 시아노, C_1-C_8 -알킬, 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알킬, C_1-C_8 -알콕시, 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알콕시, C_1-C_8 -알콕시카르보닐, 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알콕시카르보닐, C_1-C_8 -알킬아미노카르보닐 또는 디- C_1-C_8 -알킬아미노카르보닐로 이루어진 목록에서 선택될 수 있는 10개 이하의 원자 또는 기로 치환되는 C_3-C_7 -시클로알킬을 나타내고;

· Z^2 , Z^3 , Z^4 및 Z^5 는 독립적으로 수소 원자 ; 할로젠 원자 ; 시아노 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1-C_8 -할로게노알킬 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알콕시 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬술폰닐 ; 또는 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알콕시카르보닐을 나타내거나; 또는

2개의 치환기 Z^i 및 Z^{i+1} (i 는 2 내지 4 의 정수임)는, 이들이 결합되는 연속되는 탄소 원자와 함께 동일하거나 또는 상이할 수 있고 할로젠 원자, C_1-C_8 -알킬 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 5개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_2 -할로게노알킬로 이루어진 목록에서 선택될 수 있는 4개 이하의 기로 치환될 수 있는 3-, 4-, 5-, 6- 또는 7-원 포화 카르보사이클을 형성할 수 있고;

· Z^6 은 수소 원자 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알킬 ; 치환 또는 비치환 C_2-C_8 -알케닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_2-C_8 -할로게노알케닐 ; 치환 또는 비치환 C_3-C_8 -알키닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_3-C_8 -할로게노알키닐 ; 치환 또는 비치환 C_3-C_7 -시클로알킬 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_3-C_7 -할로게노-시클로알킬 ; 치환 또는 비치환 C_3-C_7 -시클로알킬- C_1-C_8 -알킬 ; 포르밀 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬카르보닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알킬카르보닐 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알콕시카르보닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알콕시카르보닐 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬술폰닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알킬술폰닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 7개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 페닐메틸렌 ; 또는 동

일하거나 또는 상이할 수 있는 5개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 페닐술폴닐을 나타내고;

- Z^7 및 Z^8 은 독립적으로 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬을 나타내고;
- U 는 O ; S ; N-OR^a 또는 N-CN 을 나타내고;
- R^a 는 수소 원자 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_4 -알킬 ; 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 7개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_4 -할로게노알킬을 나타내고;
- Q 는 독립적으로 할로젠 원자 ; 시아노 ; 니트로 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 1 내지 9개의 할로젠 원자를 갖는 C_1-C_8 -할로게노알킬 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알콕시 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 1 내지 9개의 할로젠 원자를 갖는 C_1-C_8 -할로게노알콕시 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬술폴닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 1 내지 9개의 할로젠 원자를 갖는 C_1-C_8 -할로게노알킬술폴닐 ; 치환 또는 비치환 트리(C_1-C_8)알킬실릴 ; 치환 또는 비치환 트리(C_1-C_8)알킬실릴- C_1-C_8 -알킬 ; 치환 또는 비치환 (C_1-C_8 -알콕시이미노)- C_1-C_8 -알킬 ; 또는 치환 또는 비치환 (벤질옥시이미노)- C_1-C_8 -알킬을 나타냄].

청구항 2

제 1 항에 있어서, X^1 및 X^2 가 독립적으로 염소 또는 불소 원자를 나타내는 화합물.

청구항 3

제 1 항 또는 제 2 항에 있어서, Y 가 메틸을 나타내는 화합물.

청구항 4

제 1 항 내지 제 3 항 중 어느 한 항에 있어서, T 가 O 를 나타내는 화합물.

청구항 5

제 1 항 내지 제 4 항 중 어느 한 항에 있어서, B 가 치환 또는 비치환 페닐 고리 ; 치환 또는 비치환 나프틸 고리 ; 치환 또는 비치환 피리딜 고리 ; 치환 또는 비치환 티에닐 고리 ; 또는 치환 또는 비치환 벤조티에닐 고리; 바람직하게 치환 또는 비치환 페닐 고리 또는 치환 또는 비치환 2-피리딜 고리를 나타내는 화합물.

청구항 6

제 1 항 내지 제 5 항 중 어느 한 항에 있어서, X 가 독립적으로 할로젠 원자; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알킬 ; 치환 또는 비치환 트리(C_1-C_8 -알킬)실릴 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알콕시 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알콕시 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬술폴닐 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알킬술폴닐을 나타내거나; 또는 2개의 연속되는 치환기 X 가 페닐 고리와 함께 치환 또는 비치환 시클로펜틸 또는 시클로헥실 고리를 형성하는 화합물.

청구항 7

제 1 항 내지 제 6 항 중 어느 한 항에 있어서, X 가 독립적으로 불소, 염소, 브롬, 요오드, 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 부틸, 이소부틸, sec부틸, 터부틸 (terbutyl), 시클로프로필, 시클로펜틸, 시클로헥실, 트리메틸실릴, 메톡시, 에톡시, 메틸술폴닐, 에틸술폴닐, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로클로로메톡시, 트리플루오로에톡시, 디플루오로메틸술폴닐, 트리플루오로메틸술폴닐 및 디플루오로클로로-메틸술폴닐을 나타내는 화합물.

청구항 8

제 1 항 내지 제 7 항 중 어느 한 항에 있어서, Z^1 이 수소 원자; 비치환 C_3-C_7 시클로알킬; 또는 할로젠 원자, C_1-C_8 -알킬, 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알킬, C_1-C_8 -알콕시 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알콕시로 이루어진 목록에서 선택될 수 있고 동일하거나 또는 상이할 수 있는 10개 이하의 기 또는 원자로 치환되는 C_3-C_7 시클로알킬을 나타내는 화합물.

청구항 9

제 1 항 내지 제 8 항 중 어느 한 항에 있어서, Z^1 이 비치환 C_3-C_7 -시클로알킬, 바람직하게 시클로프로필을 나타내는 화합물.

청구항 10

제 1 항 내지 제 9 항 중 어느 한 항에 있어서, Z^2 , Z^3 , Z^4 및 Z^5 가 독립적으로 수소 원자, 불소 원자, 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬 또는 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알콕시를 나타내는 화합물.

청구항 11

제 1 항 내지 제 10 항 중 어느 한 항에 있어서, 2개의 치환기 Z^i 및 Z^{i+1} (i 는 2 내지 4 의 정수임)이, 이들이 결합되는 연속되는 탄소 원자와 함께 임의로 일치환 또는 다중치환된 3-, 4-, 5-, 6- 또는 7-원 포화 카르보사이클; 바람직하게 임의로 일치환 또는 다중치환된 시클로프로필, 시클로펜틸, 시클로헥실 또는 시클로헵틸 고리; 더욱 바람직하게 시클로프로필, 시클로펜틸 또는 시클로헥실 고리를 형성할 수 있는 화합물.

청구항 12

제 1 항 내지 제 11 항 중 어느 한 항에 있어서, Z^3 및 Z^4 가 이들이 결합되는 연속되는 탄소 원자와 함께 불소, 염소, 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 이소부틸, sec부틸, 터부틸, 트리플루오로메틸 또는 디플루오로메틸로 이루어진 목록에서 선택될 수 있고 동일하거나 또는 상이할 수 있는 4개 이하의 기로 치환될 수 있는, 시클로펜틸, 시클로헥실 또는 시클로헵틸 기를 형성할 수 있는 화합물.

청구항 13

제 1 항 내지 제 12 항 중 어느 한 항에 있어서, Z^6 이 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬을 나타내는 화합물.

청구항 14

제 1 항 내지 제 13 항 중 어느 한 항에 있어서, Z^7 및 Z^8 이 독립적으로 비치환 C_1-C_3 -알킬, 바람직하게 메틸을 나타내는 화합물.

청구항 15

제 1 항 내지 제 14 항 중 어느 한 항에 있어서, U 가 0 또는 N-O-(C_1-C_4 -알킬)을 나타내는 화합물.

청구항 16

활성 성분으로서, 유효량의 제 1 항 내지 제 15 항에 따른 식 (I)의 화합물 및 농업상 허용가능한 지지체, 담체 또는 충전제를 포함하는 살진균제 조성물.

청구항 17

농경적으로 유효하고 실질적으로 비식물독성적 양의 제 1 항 내지 제 15 항에 따른 화합물 또는 제 16 항에 따른 조성물을 식물이 성장하거나 성장할 수 있는 토양에, 식물의 잎 및/또는 과실에 또는 식물의 종자에 적용하는 것을 특징으로 하는 농작물의 식물병원성 진균류의 방제 방법.

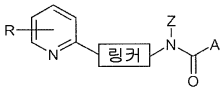
명세서

기술분야

[0001] 본 발명은 살진균성 N-[(헛)아틸에틸]] 피라졸카르복사미드 또는 티오카르복사미드 및 이의 헛테로치환된 유사체, 이의 제조 방법 및 이의 제조를 위한 중간체 화합물, 살진균제, 특히 살진균성 조성물 형태의 것으로서의 이의 용도, 및 상기 화합물 또는 이의 조성물을 사용하여 식물의 식물병원성 진균류를 방제하는 방법에 관한 것이다.

배경기술

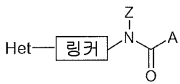
[0002] 국제 특허 출원 WO-2004/074280, WO-2005/058833, WO-2005/085238, WO-2005/103006, WO-2006/122955, WO-2007/108483 및 WO-2008/081011 에서, 특정 살진균성 피라졸카르복사미드 유도체는 일반적으로 하기 식의 다수 화합물의 폭넓은 공개물에 포함된다:



[0003]

[0004] [식 중, A 는 다양한 고리, 그들 중 피라졸 고리를 나타낼 수 있는 치환된 5-원 헛테로시클릭 기를 나타내고, Z 는 수소 원자, 알킬 기 또는 시클로알킬 기를 나타낼 수 있고, 치환 또는 비치환 2-피리딜 기는 2-원자 링커에 의해 피라졸카르복사미드 부위에 결합됨]. 그러나, 임의 이러한 유도체 (이때 A 는 1-알킬-3-(디플루오로 또는 디클로로)메틸-5-(클로로 또는 플루오로)-4-피라졸릴 기를 나타냄)의 상기 문헌에서 선택할 수 있는 분명한 공개물 또는 제안은 없다.

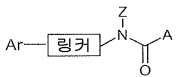
[0005] 국제 특허 출원 WO-2006/008193, WO-2006/008194, WO-2006/108791, WO-2006/117358, WO-2007/006739, WO-2008/151828, WO-2009/003672, WO-2010/084078 및 WO-2011/003683 에서, 특정 살진균성 피라졸카르복사미드 유도체는 일반적으로 하기 식의 다수 화합물의 폭넓은 공개물에 포함된다:



[0006]

[0007] [식 중, A 는 다양한 고리, 그 중에서 피라졸 고리를 나타낼 수 있는 치환된 5-원 헛테로시클릭 기를 나타내고, Z 는 수소 원자, 알킬 기, 알콕시 기 또는 시클로알킬 기를 나타낼 수 있고, Het 는 2-원자 링커에 의해 피라졸카르복사미드 부위에 결합되는 다양한 치환 또는 비치환 (융합된)-5- 및 6-원 헛테로사이클을 나타낼 수 있음]. 그러나, 임의 이러한 유도체 (이때 A 는 1-알킬-3-(디플루오로 또는 디클로로)메틸-5-(클로로 또는 플루오로)-4-피라졸릴 기를 나타냄)의 상기 문헌에서 선택할 수 있는 분명한 공개물 또는 제안은 없다.

[0008] 국제 특허 출원 WO-2006/016708, WO-2007/060164, WO-2007/060166, WO-2007/134799, WO-2007/0141009, WO-2007/144174, WO-2008/148570, WO-2010/063700, JP-2007/210924 및 JP-2008/115084 에서, 특정 살진균성 피라졸카르복사미드 유도체는 일반적으로 하기 식의 다수의 화합물의 폭넓은 공개물에 포함된다:



[0009]

[0010] [식 중, A 는 다양한 고리, 그 중에서도 피라졸 고리를 나타낼 수 있는 치환된 5-원 헛테로시클릭 기를 나타내고, Z 는 수소 원자, 알킬 기, 알콕시 기 또는 시클로알킬 기를 나타내고, Ar 은 2-원자 링커에 의해 피라졸카르복사미드 부위에 결합되는 치환 또는 비치환 페닐 또는 나프틸 기를 나타낼 수 있음]. 그러나, 임의 이러한 유도체 (이때 A 는 1-알킬-3-(디플루오로 또는 디클로로)메틸-5-(클로로 또는 플루오로)-4-피라졸릴 기를 나타냄)의 상기 문헌에서 선택할 수 있는 분명한 공개물 또는 제안은 없다.

[0011] 당업자에 의해 이미 알려진 화합물보다 더욱 활성인 살충성 화합물을 사용함으로써, 화합물이 동일한 효능을 유지하면서 감소된 양으로 사용될 수 있는 것은 농약 분야에서 항상 높은 관심대상이 된다.

[0012] 더욱이, 더욱 높은 효능을 가진 신규 살충성 화합물을 제공하는 것은 처리되는 진균류에서 내성균 (resistant strains)이 나타날 위험성을 크게 감소시킨다.

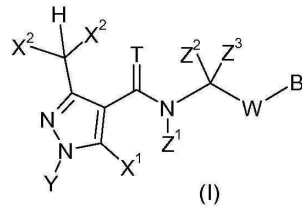
발명의 내용

해결하려는 과제

[0013] 발명자들은 최근 상기 화합물의 일반적으로 알려진 패밀리보다 강화된 살진균 활성을 나타내는 신규 화합물의 패밀리를 발견하였다.

과제의 해결 수단

[0014] 따라서, 본 발명은 하기 식 (I)의 N-[(헥트)아릴에틸]] 피라졸카르복사미드 또는 티오카르복사미드 유도체 및 그 염, N-옥시드, 금속 착물, 반금속성 (metalloidic) 착물 및 광학 활성 이성질체를 제공한다:



[0015]

[0016] [식 중,

[0017] · 동일하거나 또는 상이할 수 있는 X^1 및 X^2 는 할로젠 원자를 나타내고;

[0018] · Y 는 C_1-C_4 -알킬을 나타내고;

[0019] · T 는 O 또는 S 를 나타내고;

[0020] · W 는 CZ^4Z^5 ; O ; S ; SO ; SO_2 ; NZ^6 ; SiZ^7Z^8 ; 또는 $-C(=U)-$ 를 나타내고;

[0021] · B 는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 5개 이하의 기 X 로 치환될 수 있는 페닐 고리; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 7개 이하의 기 X 로 치환될 수 있는 나프틸 고리; 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 X 로 치환될 수 있는, N, O, S 로 이루어진 목록에서 선택되는 1 내지 4개의 헤테로원자를 포함하는 포화, 부분 포화 또는 불포화, 모노시클릭 또는 융합 바이시클릭 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 9-, 10-원 고리를 나타내고;

[0022] · X 는 할로젠 원자 ; 니트로 ; 시아노 ; 이소니트릴 ; 히드록시 ; 아미노 ; 술팜닐 ; 펜타플루오로- λ^6 -술팜닐 ; 포르밀 ; 포르밀옥시 ; 포르밀아미노 ; 치환 또는 비치환 (히드록시이미노)- C_1-C_8 -알킬 ; 치환 또는 비치환 (C_1-C_8 -알콕시이미노)- C_1-C_8 -알킬 ; 치환 또는 비치환 (C_2-C_8 -알케닐옥시이미노)- C_1-C_8 -알킬 ; 치환 또는 비치환 (C_2-C_8 -알킬닐옥시이미노)- C_1-C_8 -알킬 ; 치환 또는 비치환 (벤질옥시이미노)- C_1-C_8 -알킬 ; 카르복시 ; 카르바모일 ; N-히드록시카르바모일 ; 카르바메이트 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1-C_8 -할로게노알킬 ; 치환 또는 비치환 C_2-C_8 -알케닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_2-C_8 -할로게노알킬 ; 치환 또는 비치환 C_2-C_8 -알킬닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_2-C_8 -할로게노알킬닐 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알콕시 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1-C_8 -할로게노알콕시 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬술팜닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1-C_8 -할로게노알킬술팜닐 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬술팜피닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1-C_8 -할로게노알킬술팜피닐 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬술팜포닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_1-C_8 -할로게노알킬술팜포닐 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬아미노 ; 치환 또는 비치환 디- C_1-C_8 -알킬아미노 ; 치환 또는 비치환 C_2-C_8 -알케닐옥시 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_2-C_8 -할로게노알케닐옥시 ; 치환 또는 비치환 C_3-C_8 -알킬닐옥시 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_2-C_8 -할로게노알킬닐옥시 ; 치환 또는 비치환 C_3-C_7 -시클로알킬 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C_3-C_7 -할로게노시클로알킬 ; 치환 또는 비치환 (C_3-C_7 -시클로알킬)- C_1-C_8 -알킬 ; 치환 또는 비치환 (C_3-C_7 -시클로알킬)- C_2-C_8 -알케닐 ; 치환 또는 비치환 (C_3-C_7 -시클로알킬)- C_2-C_8 -알킬닐 ; 치환 또는 비치환 트리(C_1-C_8 -알킬)실릴 ; 치환 또는 비치환 트리(C_1-C_8 -알킬)실

틸-C₁-C₈-알킬 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬카르보닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알킬카르보닐 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬카르보닐옥시 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알킬카르보닐옥시 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬카르보닐아미노 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알킬-카르보닐아미노 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알콕시카르보닐 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알콕시카르보닐 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬옥시카르보닐옥시 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알콕시카르보닐옥시 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬카르바모일 ; 치환 또는 비치환 디-C₁-C₈-알킬카르바모일 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬아미노카르보닐옥시 ; 치환 또는 비치환 디-C₁-C₈-알킬아미노카르보닐옥시 ; 치환 또는 비치환 N-(C₁-C₈-알킬)히드록시 카르바모일 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알콕시카르바모일 ; 치환 또는 비치환 N-(C₁-C₈-알킬)-C₁-C₈-알콕시카르바모일 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 아릴 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 C₁-C₈-아릴알킬 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 C₂-C₈-아릴알케닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 C₂-C₈-아릴알키닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 아릴옥시 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 아릴술폰닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 아릴아미노 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 C₁-C₈-아릴알킬옥시 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 C₁-C₈-아릴알킬술폰닐 ; 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 6개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 C₁-C₈-아릴알킬아미노를 나타내거나; 또는

[0023] · 2개의 치환기 X 는 이들이 결합되는 연속되는 탄소 원자와 함께 동일하거나 또는 상이할 수 있는 4개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 5- 또는 6-원, 포화 카르보사이클 또는 포화 헤테로사이클을 형성할 수 있고;

[0024] · Z¹ 은 수소 원자 ; 포르밀 기 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알콕시; 비치환 C₃-C₇-시클로알킬 또는 할로젠 원자, 시아노, C₁-C₈-알킬, 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C₁-C₈-할로게노알킬, C₁-C₈-알콕시, 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C₁-C₈-할로게노알콕시, C₁-C₈-알콕시카르보닐, 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C₁-C₈-할로게노알콕시카르보닐, C₁-C₈-알킬아미노카르보닐 또는 디-C₁-C₈-알킬아미노카르보닐로 이루어진 목록에서 선택될 수 있고 동일하거나 또는 상이할 수 있는 10개 이하의 원자 또는 기로 치환되는 C₃-C₇-시클로알킬을 나타내고;

[0025] · Z², Z³, Z⁴ 및 Z⁵ 는 독립적으로 수소 원자 ; 할로젠 원자 ; 시아노 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬 ; 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알킬 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알콕시 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬술폰닐 ; 또는 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알콕시카르보닐을 나타내거나; 또는

[0026] 2개의 치환기 Zⁱ 및 Zⁱ⁺¹ (i 는 2 내지 4 의 정수임)는, 이들이 결합되는 연속되는 탄소 원자와 함께 할로젠 원자, C₁-C₈-알킬 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 5개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C₁-C₂-할로게노알킬로 이루어진 목록에서 선택될 수 있고 동일하거나 또는 상이할 수 있는 4개 이하의 기로 치환될 수 있는 3-, 4-, 5-, 6- 또는 7-원 포화 카르보사이클을 형성할 수 있고;

[0027] · Z⁶ 은 수소 원자 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C₁-C₈-할로게노알킬 ; 치환 또는 비치환 C₂-C₈-알케닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C₂-C₈-할로게노알케닐 ; 치환 또는 비치환 C₃-C₈-알키닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C₃-C₈-할로게노알키닐 ; 치환 또는 비치환 C₃-C₇-시클로알킬 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C₃-C₇-할로게노-시클로알킬 ; 치환 또는 비치환 C₃-C₇-시클로알킬-C₁-C₈-알킬 ; 포르밀 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬카르보닐 ; 동일하거나 또는 상이할

수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C₁-C₈-할로게노알킬카르보닐 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알콕시카르보닐 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C₁-C₈-할로게노알콕시카르보닐 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬술폰 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C₁-C₈-할로게노알킬술폰 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 7개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 페닐메틸렌 ; 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 5개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 페닐술폰을 나타내고;

- [0028] · Z⁷ 및 Z⁸ 은 독립적으로 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬을 나타내고;
- [0029] · U 는 O ; S ; N-OR^a 또는 N-CN 을 나타내고;
- [0030] · R^a 는 수소 원자 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₄-알킬 ; 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 7개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C₁-C₄-할로게노알킬을 나타내고;
- [0031] · Q 는 독립적으로 할로젠 원자 ; 시아노 ; 니트로 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 1 내지 9개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알킬 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알콕시 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 1 내지 9개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알콕시 ; 치환 또는 비치환 C₁-C₈-알킬술폰 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 1 내지 9개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알킬술폰 ; 치환 또는 비치환 트리(C₁-C₈)알킬실릴 ; 치환 또는 비치환 트리(C₁-C₈)알킬실릴-C₁-C₈-알킬 ; 치환 또는 비치환 (C₁-C₈-알콕시이미노)-C₁-C₈-알킬 ; 또는 치환 또는 비치환 (벤질옥시이미노)-C₁-C₈-알킬을 나타냄].

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

- [0032] 본 발명에 따른 화합물에 있어서, 하기 총칭은 일반적으로 하기 의미와 함께 사용된다:
- [0033] · 할로젠은 불소, 브롬, 염소 또는 요오드를 의미한다.
- [0034] 카르복시는 -C(=O)OH 를 의미한다;
- [0035] 카르보닐은 -C(=O)- 를 의미한다;
- [0036] 카르바모일은 -C(=O)NH₂ 를 의미한다;
- [0037] N-히드록시카르바모일은 -C(=O)NHOH 를 의미한다;
- [0038] SO 는 술폭시드 기를 의미한다;
- [0039] SO₂ 는 술폰 기를 의미한다;
- [0040] · 알킬 기, 알케닐 기 및 알키닐 기 뿐만아니라 상기 용어를 함유하는 부위는 선형 또는 분지형일 수 있다;
- [0041] · 아릴 기, 아릴알킬 기, 아릴알케닐 기 및 아릴알키닐 기에 함유된 아릴 부위 뿐만아니라 상기 용어를 함유한 부위는, 동일하거나 또는 상이할 수 있는 5개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 페닐 기, 동일하거나 또는 상이할 수 있는 7개 이하의 기 Q 로 치환될 수 있는 나프틸 기 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 4개 이하의 Q 기로 치환될 수 있는 피리딜 기일 수 있다;
- [0042] · 헤테로원자는 황, 질소 또는 산소를 의미한다.
- [0043] · 동일하거나 또는 상이할 수 있는 2개의 치환기로 치환되는 아미노 기 또는 임의 다른 아미노-포함 기의 아미노 부위의 경우, 2개의 치환기는 이들이 결합되는 질소 원자와 함께 헤테로시클릴 기, 바람직하게 치환될 수 있거나 또는 다른 헤테로 원자를 포함할 수 있는 5- 내지 7-원 헤테로시클릴 기, 예를 들어 모르폴리노 기 또는 피페리딘 기를 형성할 수 있다.
- [0044] · 달리 언급되지 않는 한, 본 발명에 따라 치환되는 기 또는 치환기는, 하기의 기 또는 원자 중 하나 이상으로 치환될 수 있다: 할로젠 원자, 니트로 기, 히드록시 기, 시아노 기, 아미노 기, 술폰 기, 펜타플루오로-λ⁶-술폰 기, 포르밀 기, 포르밀옥시 기, 포르밀아미노 기, 카르바모일 기, N-히드록시카르바모일 기, 카

르바메이트 기, (히드록시이미노)-C₁-C₆-알킬 기, C₁-C₈-알킬, 트리(C₁-C₈-알킬)실릴-C₁-C₈-알킬, C₁-C₈-시클로알킬, 트리(C₁-C₈-알킬)실릴-C₁-C₈-시클로알킬, 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알킬, 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노시클로알킬, C₂-C₈-알케닐, C₂-C₈-알키닐, C₂-C₈-알케닐옥시, C₂-C₈-알키닐옥시, C₁-C₈-알킬아미노, 디-C₁-C₈-알킬아미노, C₁-C₈-알콕시, 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알콕시, C₁-C₈-알킬술팜, 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알킬술팜, C₂-C₈-알케닐옥시, 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₂-C₈-할로게노알케닐옥시, C₃-C₈-알키닐옥시, 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₃-C₈-할로게노알키닐옥시, C₁-C₈-알킬카르보닐, 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알킬카르보닐, C₁-C₈-알킬카르바모일, 디-C₁-C₈-알킬카르바모일, N-C₁-C₈-알킬옥시카르바모일, C₁-C₈-알콕시카르바모일, N-C₁-C₈-알킬-C₁-C₈-알콕시카르바모일, C₁-C₈-알콕시카르보닐, 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알콕시카르보닐, C₁-C₈-알킬카르보닐옥시, 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알킬카르보닐옥시, C₁-C₈-알킬카르보닐아미노, 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알킬카르보닐아미노, C₁-C₈-알킬아미노카르보닐옥시, 디-C₁-C₈-알킬아미노카르보닐옥시, C₁-C₈-알킬옥시카르보닐옥시, C₁-C₈-알킬술팜, 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알킬술팜, C₁-C₈-알킬술팜, 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알킬술팜, 디-C₁-C₈-알킬아미노술팜, (C₁-C₆-알콕시이미노)-C₁-C₆-알킬, (C₁-C₆-알케닐옥시이미노)-C₁-C₆-알킬, (C₁-C₆-알키닐옥시이미노)-C₁-C₆-알킬, 2-옥소피롤리딘-1-일, (벤질옥시이미노)-C₁-C₆-알킬, C₁-C₈-알콕시알킬, 1 내지 5개의 할로젠 원자를 갖는 C₁-C₈-할로게노알콕시알킬, 벤질옥시, 벤질술팜, 벤질아미노, 페녹시, 페닐술팜, 또는 페닐아미노.

[0045] 본 발명의 임의 화합물은 화합물에서의 비대칭 중심의 수에 따라 하나 이상의 광학 또는 키랄 이성질체 형태로 존재할 수 있다. 따라서 본 발명은 동일하게 모든 광학 이성질체 및 그의 라세믹 또는 스칼레믹 (scalemic) 혼합물 (용어 "스칼레믹 (scalemic)"은 상이한 비율의 거울상이성질체의 혼합물을 나타냄) 및 모든 비율의 모든 가능한 입체이성질체의 혼합물에 관한 것이다. 부분입체이성질체 및/또는 광학 이성질체는 당업자에게 자체적으로 알려져 있는 방법에 따라 분리될 수 있다.

[0046] 본 발명의 임의 화합물은 또한 화합물의 이중 결합의 수에 따라 하나 이상의 기하 이성질체 형태로 존재할 수 있다. 따라서 본 발명은 동일하게 모든 기하 이성질체 및 모든 비율의 모든 가능한 혼합물에 관한 것이다. 기하 이성질체는 당업자에게 자체적으로 알려져 있는 일반적 방법에 따라 분리될 수 있다.

[0047] 본 발명의 임의 화합물은 또한 고리 B 의 치환기의 상대적 위치 (신/안티 (syn/anti) 또는 시스/트랜스)에 따라 하나 이상의 기하 이성질체 형태로 존재할 수 있다. 따라서 본 발명은 동일하게 모든 신/안티 (또는 시스/트랜스) 이성질체 및 모든 비율의 모든 가능한 신/안티 (또는 시스/트랜스) 혼합물에 관한 것이다. 신/안티 (또는 시스/트랜스) 이성질체는 당업자에게 자체적으로 알려진 일반적 방법에 따라 분리될 수 있다.

[0048] X 가 히드록시, 술팜 기 또는 아미노 기를 나타내는 임의 식 (I)의 화합물은 상기 히드록시, 술팜 또는 아미노 기의 프로톤의 이동 (shift)으로 인한 그 토토머 (tautomeric) 형태로 발견될 수 있다. 이러한 화합물의 상기 토토머 형태는 또한 본 발명의 부분이다. 더욱 일반적으로 말해서, 모든 토토머 형태의 식 (I) [식 중, X 는 히드록시, 술팜 기 또는 아미노 기를 나타냄]의 화합물, 뿐만 아니라 토토머 형태의 화합물 (이는 제조 프로세스에서 중간체로서 임의로 사용될 수 있고 상기 프로세스의 설명에서 정의될 것임)은, 또한 본 발명의 부분이다.

[0049] 본 발명에 따른 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, X¹ 및 X² 는 독립적으로 염소 또는 불소 원자를 나타냄]의 화합물이다. 본 발명에 따른 더욱 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, X¹ 및 X² 는 불소 원자를 나타냄]의 화합물이다.

[0050] 본 발명에 따른 다른 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, Y 는 메틸을 나타냄]의 화합물이다.

[0051] 본 발명에 따른 다른 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, T 는 O 를 나타냄]의 화합물이다.

[0052] 본 발명에 따른 다른 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, B 는 치환 또는 비치환 페닐 고리; 치환 또는 비치환 나프틸 고리; 치환 또는 비치환 피리딜 고리 ; 치환 또는 비치환 티에닐 고리 ; 또는 치환 또는 비치환 벤조티

에닐 고리를 나타냄]의 화합물이고; 본 발명에 따른 더욱 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, B 는 치환 또는 비치환 페닐 고리를 나타냄]의 화합물이고; 본 발명에 따른 다른 더욱 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, B 는 치환 또는 비치환 2-피리딜 고리를 나타냄]의 화합물이다.

[0053] 본 발명에 따른 다른 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, X 는 독립적으로 할로젠 원자; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬 ; 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알킬; 치환 또는 비치환 트리(C_1-C_8 -알킬)실릴 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알콕시 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알콕시 ; 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬술폰아닐 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알킬술폰아닐을 나타내거나; 또는 2개의 연속되는 치환기 X 는 페닐 고리와 함께 치환 또는 비치환 시클로펜틸 또는 시클로헥실 고리를 형성함]의 화합물이다.

[0054] 본 발명에 따른 더욱 더 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, X 는 독립적으로 불소, 염소, 브롬, 요오드, 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 부틸, 이소부틸, sec부틸, 터부틸 (terbutyl), 시클로프로필, 시클로펜틸, 시클로헥실, 트리메틸실릴, 메톡시, 에톡시, 메틸술폰아닐, 에틸술폰아닐, 트리플루오로메틸, 트리클로로메틸, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 디플루오로클로로메톡시, 트리플루오로에톡시, 디플루오로메틸술폰아닐, 트리플루오로메틸술폰아닐 및 디플루오로클로로-메틸술폰아닐을 나타냄]의 화합물이다.

[0055] 본 발명에 따른 다른 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, Z^1 은 수소 원자 ; 비치환 C_3-C_7 시클로알킬 ; 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있고 할로젠 원자, C_1-C_8 -알킬, 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알킬, C_1-C_8 -알콕시 또는 동일하거나 또는 상이할 수 있는 9개 이하의 할로젠 원자를 포함하는 C_1-C_8 -할로게노알콕시로 이루어진 목록에서 선택될 수 있는 10개 이하의 기 또는 원자로 치환되는 C_3-C_7 시클로알킬을 나타내고; 더욱 바람직하게 Z^1 는 비치환 C_3-C_7 -시클로알킬을 나타내고; 더 더욱 바람직하게 Z^1 는 시클로프로필을 나타냄]의 화합물이다.

[0056] 본 발명에 따른 다른 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, Z^2 , Z^3 , Z^4 및 Z^5 는 독립적으로 수소 원자, 불소 원자, 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬 또는 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알콕시를 나타냄]의 화합물이다.

[0057] 본 발명에 따른 다른 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, 2개의 치환기 Z^i 및 Z^{i+1} (i 는 2 내지 4 의 정수임)은, 이들이 결합되는 연속되는 탄소 원자와 함께 임의로 일치환 또는 다중치환된 3-, 4-, 5-, 6- 또는 7-원 포화 카르보사이클 ; 더욱 바람직하게 임의로 일치환 또는 다중치환된 시클로프로필, 시클로펜틸, 시클로헥실 또는 시클로헵틸 고리 ; 더 더욱 바람직하게 시클로프로필, 시클로펜틸 또는 시클로헥실 고리를 형성할 수 있음]의 화합물이다.

[0058] 본 발명에 따른 다른 더욱 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, Z^3 및 Z^4 는 이들이 결합되는 연속되는 탄소 원자와 함께 동일하거나 또는 상이할 수 있고 불소, 염소, 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 이소부틸, sec부틸, 터부틸, 트리플루오로메틸 또는 디플루오로메틸로 이루어진 목록에서 선택될 수 있는 3개 이하의 기로 치환될 수 있는 시클로펜틸 기를 형성할 수 있음]의 화합물이다.

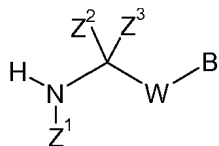
[0059] 본 발명에 따른 다른 더욱 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, Z^3 및 Z^4 는 이들이 결합되는 연속되는 탄소 원자와 함께 동일하거나 또는 상이할 수 있고 불소, 염소, 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 이소부틸, sec부틸, 터부틸, 트리플루오로메틸 또는 디플루오로메틸로 이루어진 목록에서 선택될 수 있는 4개 이하의 기로 치환될 수 있는 시클로헥실 기를 형성할 수 있음]의 화합물이다.

[0060] 본 발명에 따른 다른 더욱 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, Z^3 및 Z^4 는 이들이 결합되는 연속되는 탄소 원자와 함께 동일하거나 또는 상이할 수 있고 불소, 염소, 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 이소부틸, sec부틸, 터부틸, 트리플루오로메틸 또는 디플루오로메틸로 이루어진 목록에서 선택될 수 있는 4개 이하의 기로 치환될 수 있는 시클로헥실 기를 형성할 수 있음]의 화합물이다.

[0061] 본 발명에 따른 다른 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, Z^6 은 치환 또는 비치환 C_1-C_8 -알킬을 나타냄]의 화합물

이다.

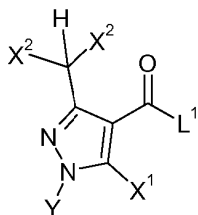
- [0062] 본 발명에 따른 다른 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, Z^7 및 Z^8 은 독립적으로 비치환 C_1-C_8 -알킬을 나타냄]의 화합물이다. 더욱 바람직하게, Z^7 및 Z^8 은 독립적으로 비치환 C_1-C_3 -알킬을 나타낸다. 더 더욱 바람직하게, Z^7 및 Z^8 은 메틸을 나타낸다.
- [0063] 본 발명에 따른 다른 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, U 는 O 를 나타냄]의 화합물이다.
- [0064] 본 발명에 따른 다른 바람직한 화합물은 식 (I) [식 중, U 는 N-O-(C_1-C_4 -알킬)을 나타냄]의 화합물이다.
- [0065] 본 발명에 따른 화합물의 치환기에 관하여 상기 언급된 바람직한 것은 다양한 방식으로 조합될 수 있다. 바람직한 특징의 상기 조합은 따라서 본 발명에 따른 화합물의 하위부류를 제공한다. 본 발명에 따른 바람직한 화합물의 이러한 하위부류의 예는:
- [0066] - X^1 의 바람직한 특징을 X^2 , Y, T, B, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^6 , Z^7 , Z^8 , X 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0067] - X^2 의 바람직한 특징을 X^1 , Y, T, B, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^6 , Z^7 , Z^8 , X 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0068] - Y 의 바람직한 특징을 X^1 , X^2 , T, B, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^6 , Z^7 , Z^8 , X 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0069] - T 의 바람직한 특징을 X^1 , X^2 , Y, B, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^6 , Z^7 , Z^8 , X 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0070] - B 의 바람직한 특징을 X^1 , X^2 , Y, T, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^6 , Z^7 , Z^8 , X 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0071] - Z^1 의 바람직한 특징을 X^1 , X^2 , Y, T, B, Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^6 , Z^7 , Z^8 , X 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0072] - Z^2 의 바람직한 특징을 X^1 , X^2 , Y, T, B, Z^1 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^6 , Z^7 , Z^8 , X 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0073] - Z^3 의 바람직한 특징을 X^1 , X^2 , Y, T, B, Z^1 , Z^2 , Z^4 , Z^5 , Z^6 , Z^7 , Z^8 , X 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0074] - Z^4 의 바람직한 특징을 X^1 , X^2 , Y, T, B, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^5 , Z^6 , Z^7 , Z^8 , X 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0075] - Z^5 의 바람직한 특징을 X^1 , X^2 , Y, T, B, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^6 , Z^7 , Z^8 , X 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0076] - Z^6 의 바람직한 특징을 X^1 , X^2 , Y, T, B, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^7 , Z^8 , X 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0077] - Z^7 의 바람직한 특징을 X^1 , X^2 , Y, T, B, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^6 , Z^8 , X 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0078] - Z^8 의 바람직한 특징을 X^1 , X^2 , Y, T, B, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^6 , Z^7 , X 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0079] - X 의 바람직한 특징을 X^1 , X^2 , Y, T, B, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^6 , Z^7 , Z^8 및 U 의 바람직한 특징과;
- [0080] - U 의 바람직한 특징을 X^1 , X^2 , Y, T, B, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^6 , Z^7 , Z^8 및 X 의 바람직한 특징과;
- [0081] 조합할 수 있는 것이다.
- [0082] 본 발명에 따른 화합물의 치환기의 바람직한 특징의 상기 조합에서, 상기 바람직한 특징은 또한 본 발명에 따른 화합물의 가장 바람직한 하위부류를 형성하도록, 각각의 X^1 , X^2 , Y, T, B, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 , Z^6 , Z^7 , Z^8 , X 및 U 의 더욱 바람직한 특징 중에서 선택될 수 있다.
- [0083] 본 발명은 또한 식 (I)의 화합물의 제조 프로세스에 관한 것이다.
- [0084] 따라서, 본 발명의 추가 측면에 따르면, 본원에 정의된 바와 같고 T 가 O 를 나타내는 식 (I)의 화합물의 제조 프로세스 P1 으로서, 하기 식 (II)의 N-치환된 아민 유도체 또는 그 염 중 하나를 하기 식 (III)의 카르복실산 유도체와; 촉매의 존재 하에 그리고 L^1 이 히드록실 기를 나타내는 경우 촉합제의 존재 하에, L^1 이 할로겐 원자를 나타내는 경우에 산 결합체의 존재 하에 반응시키는 것을 포함하는 것이 제공된다:



(II)

[0085]

[0086] [식 중, Z^1 , Z^2 , Z^3 , W 및 B 는 본원에 정의된 바와 같음];



(III)

[0087]

[0088] [식 중, X^1 , X^2 및 Y 는 본원에 정의된 바와 같고, L^1 은 할로젠 원자, 히드록실 기, $-OR^b$, $-OC(=O)R^b$ (R^b 는 치환 또는 비치환 C_1 - C_6 -알킬임), 치환 또는 비치환 C_1 - C_6 -할로알킬, 벤질, 4-메톡시벤질 또는 펜타플루오로페닐기로 이루어진 목록에서 선택되는 이탈기를 나타냄].

[0089] 식 (II)의 N-치환된 아민 유도체는 알려져 있거나 알려진 프로세스, 예컨대 알데히드 또는 케톤의 환원적 아민화 (Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters (2006), 2014), 또는 이민의 환원 (Tetrahedron (2005), 11689), 또는 할로젠, 메실레이트 또는 토실레이트의 친핵성 치환 (Journal of Medicinal Chemistry (2002), 3887)에 의해 제조될 수 있다.

[0090] 식 (III)의 카르복실산 유도체는 프로세스 P2 에 따라 제조될 수 있다.

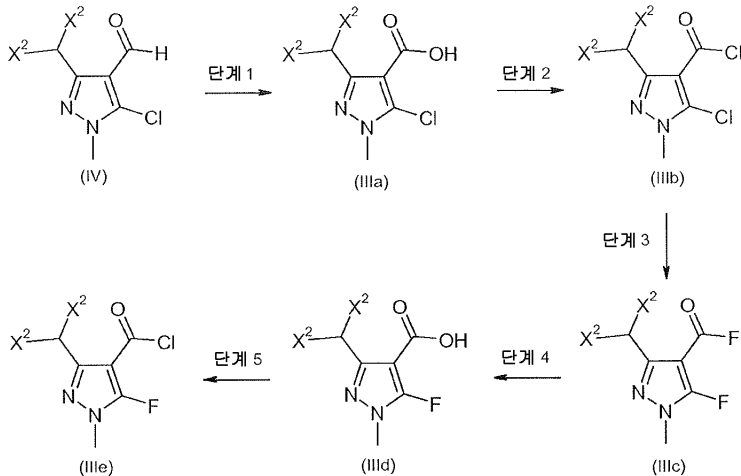
[0091] L^1 이 히드록시 기를 나타내는 경우, 본 발명에 따른 프로세스는 축합제의 존재 하에 수행된다. 적합한 축합제는 산 할라이드 형성제, 예컨대 포스젠, 포스포러스 트리-브로마이드, 포스포러스 트리클로라이드, 포스포러스 펜타클로라이드, 포스포러스 트리클로라이드 옥시드 또는 티오닐 클로라이드; 무수물 형성제, 예컨대 에틸 클로로포르메이트, 메틸 클로로포르메이트, 이소프로필 클로로포르메이트, 이소부틸 클로로포르메이트 또는 메탄술폰릴 클로라이드; 카르보디이미드, 예컨대 N,N'-디시클로헥실카르보디이미드 (DCC) 또는 기타 통상의 축합제, 예컨대 포스포러스 펜톡시드, 폴리인산, N,N'-카르보닐-디이미다졸, 2-에톡시-N-에톡시카르보닐-1,2-디히드로퀴놀린 (EEDQ), 트리페닐포스핀/테트라클로로메탄, 4-(4,6-디메톡시[1.3.5]트리아진-2-일)-4-메틸모르폴리늄 클로라이드 히드레이트 또는 브로모-트리피롤리디노-포스포늄-헥사플루오로포스페이트로 이루어진 비제한적 목록에서 선택될 수 있다.

[0092] 본 발명에 따른 프로세스는 촉매의 존재 하에 수행된다. 적합한 촉매는 4-디메틸-아미노피리딘, 1-히드록시-벤조트리아졸 또는 디메틸포름아미드로 이루어진 목록에서 선택될 수 있다.

[0093] L^1 이 할로젠 원자를 나타내는 경우, 본 발명에 따른 프로세스는 산 결합제의 존재 하에 수행된다. 본 발명에 따른 프로세스 P1 을 실시하기 위한 적합한 산 결합제는 각 경우에서 상기 반응에 통상적인 모든 무기 및 유기 염기이다. 알칼리 토금속, 알칼리금속 하이드라이드, 알칼리금속 히드록시드 또는 알칼리금속 알콕시드, 예컨대 나트륨 히드록시드, 나트륨 하이드라이드, 칼슘 히드록시드, 칼륨 히드록시드, 칼륨 tert-부톡시드 또는 다른 암모늄 히드록시드, 알칼리금속 카르보네이트, 예컨대 세슘 카르보네이트, 나트륨 카르보네이트, 칼륨 카르보네이트, 칼륨 바이카르보네이트, 나트륨 바이카르보네이트, 알칼리금속 또는 알칼리 토금속 아세테이트, 예컨대 나트륨 아세테이트, 칼륨 아세테이트, 칼슘 아세테이트 및 또한 3차 아민, 예컨대 트리메틸아민, 트리에틸아민, 디이소프로필에틸아민, 트리부틸아민, N,N-디메틸아닐린, 피리딘, N-메틸피페리딘, N,N-디메틸아미노피리딘, 디아자바이시클로옥탄 (DABCO), 디아자바이시클로노넨 (DBN) 또는 디아자바이시클로운데센 (DBU)을 사용하는 것이 바람직하다.

[0094] 또한 동시에 산 결합제로서 작용되도록 추가 축합제의 부재하에 작업하거나 또는 과량의 아민 성분을 사용하는 것이 가능하다.

[0095] 본 발명에 따른 추가 측면에 따르면, 하기 도식에 따라 예시되는 식 (III) [식 중, T 는 O 를 나타냄]의 카르복실산 유도체의 제조 프로세스 P2 가 제공된다:



프로세스 P2

[0096]

[0097] [이때 X^2 는 본원에 정의된 바와 같음].

[0098] 5-클로로-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르보알데히드는 WO-2004/014138 에 공지되어 있다 (참고예 35).

[0099] 프로세스 P2 의 단계 1 은 산화제의 존재 하에, 적절하게는 용매의 존재 하에 수행된다.

[0100] 프로세스 P2 의 단계 2 및 5 는 산 할라이드의 존재 하에, 적절하게는 용매의 존재 하에 수행된다.

[0101] 프로세스 P2 의 단계 3 은 플루오르화제의 존재 하에, 적절하게는 용매의 존재 하에 수행된다.

[0102] 프로세스 P2 의 단계 4 는 산 또는 염기의 존재 하에, 적절하게는 용매의 존재 하에 수행된다.

[0103] 본 발명에 따른 프로세스 P2 의 단계 1 을 실시하는데 적합한 산화제는 각 경우에 상기 반응에 통상적인 모든 무기 및 유기 산화제이다. 벤질트리에틸암모늄 퍼망가네이트, 브롬, 염소, m-클로로퍼벤조산, 크롬산, 크롬(VI) 옥시드, 수소 퍼옥시드, 수소 퍼옥시드-붕소 트리플루오라이드, 수소 퍼옥시드-우레아, 2-히드록시퍼옥시헥사플루오로-2-프로판올; 요오드, 산소-백금 촉매, 퍼벤조산, 퍼옥시아세틸 나이트레이트, 칼륨 퍼망가네이트, 칼륨 루테네이트, 피리디늄 디크로메이트, 루테늄(VIII) 옥시드, 은(I) 옥시드, 은(II) 옥시드, 은 나이트레이트, 나트륨 클로라이드, 나트륨 하이포클로라이드, 또는 2,2,6,6-테트라메틸피페리딘-1-옥시를 사용하는 것이 바람직하다.

[0104] 본 발명에 따른 프로세스 P2 의 단계 2 및 5 를 실시하기에 적합한 산 할라이드는 각 경우에 상기 반응에 통상적인 모든 유기 또는 무기 산 할라이드이다. 특히 포스젠, 포스포러스 트리클로라이드, 포스포러스 펜타클로라이드, 포스포러스 트리클로라이드 옥시드, 티오닐 클로라이드, 또는 탄소 테트라클로라이드-트리페닐포스핀을 사용하는 것이 바람직하다.

[0105] 본 발명에 따른 프로세스 P2 의 단계 3 을 실시하기에 적합한 플루오르화제는 각 경우에 상기 반응에 통상적인 모든 플루오르화제이다. 세슘 플루오라이드, 칼륨 플루오라이드, 칼륨 플루오라이드-칼슘 디플루오라이드, 또는 테트라부틸암모늄 플루오라이드를 사용하는 것이 바람직하다.

[0106] 본 발명에 따른 프로세스 P2 의 단계 1 내지 5 를 실시하는 경우, 반응 온도는 독립적으로 비교적 넓은 범위 내에서 다양할 수 있다. 일반적으로, 본 발명에 따른 프로세스는 0°C 내지 160°C, 바람직하게 10°C 내지 120°C의 온도에서 실시된다. 본 발명에 따른 프로세스에 있어서 온도를 조절하는 방식은 마이크로웨이브 기술을 사용하는 것이다.

[0107] 본 발명에 따른 프로세스 P2 의 단계 1 내지 5 는 일반적으로 독립적으로 대기압 하에 실시된다. 그러나 각 경우에서, 승압 또는 감압 하에 작업하는 것이 또한 가능하다.

[0108] 본 발명에 따른 프로세스 P2 의 단계 1을 실시하는 경우, 일반적으로 1 몰 또는 기타 과량의 산화제가 식 (IV)

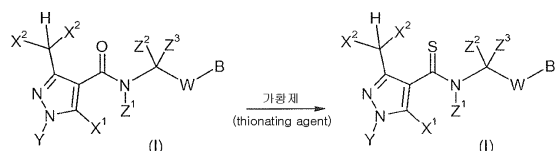
의 알데히드 1 몰 당 사용된다. 반응 성분을 다른 비로 사용하는 것도 또한 가능하다.

[0109] 본 발명에 따른 프로세스 P2 의 단계 2 및 5 를 실시하는 경우, 일반적으로 1 몰 또는 기타 과량의 산 할라이드 가 식 (IIIa) 또는 (IIId)의 산 1 몰 당 사용된다. 또한 반응 성분을 다른 비로 사용하는 것도 또한 가능하다.

[0110] 본 발명에 따른 프로세스 P2 의 단계 3 을 실시하는 경우, 일반적으로 1 몰 또는 기타 과량의 플루오르화제가 산 클로라이드 (IIIb) 1 몰 당 사용된다. 반응 성분을 다른 비로 사용하는 것도 또한 가능하다.

[0111] 본 발명에 따른 프로세스 P2 의 단계 4 를 실시하는 경우, 일반적으로 1 몰 또는 기타 과량의 산 또는 염기가 산 플루오라이드 (IIIc) 1 몰 당 사용된다. 반응 성분을 다른 비로 사용하는 것도 또한 가능하다.

[0112] 본 발명에 따른 추가 측면에 따르면, 촉매적 또는 화학량론적 또는 그 이상의 양의 무기 및 유기 염기와 같은 염기의 임의적 존재 하에 식 (I) [식 중, T 는 0 를 나타냄]의 화합물로부터 출발하여 하기 반응 도식에 따라 예시되는, 식 (I) [식 중, T 는 S 를 나타냄]의 화합물의 제조 프로세스 P3 가 제공된다:



[0113] 프로세스 P3

[0114] [식 중, X^1 , X^2 , Y, Z^1 , Z^2 , Z^3 , W 및 B 는 본원에 정의된 바와 같음]. 알칼리금속 카르보네이트, 예컨대 나트륨 카르보네이트, 칼륨 카르보네이트, 칼륨 바이카르보네이트, 나트륨 바이카르보네이트 ; 헤테로시클릭 방향족 염기, 예컨대 피리딘, 피콜린, 루티딘, 콜리딘 ; 및 또한 3차 아민, 예컨대 트리메틸아민, 트리에틸아민, 트리부틸아민, N,N-디메틸아닐린, N,N-디메틸아미노피리딘 또는 N-메틸-피페리딘을 사용하는 것이 바람직하다.

[0115] 본 발명에 따른 프로세스 P3 은 가황제 (thionating agent)의 존재 하에 수행된다.

[0116] 출발하는 식 (I)의 아미드 유도체는 프로세스 P1 에 따라 제조될 수 있다.

[0117] 본 발명에 따른 프로세스 P3 를 실시하기에 적합한 가황제는 황 (S), 황화수소 (H_2S), 나트륨 황피드 (Na_2S), 나트륨 히드로황피드 ($NaHS$), 붕소 트리황피드 (B_2S_3), 비스(디에틸알루미늄) 황피드 ($(AlEt_2)_2S$), 암모늄 황피드 ($(NH_4)_2S$), 포스포러스 펜타황피드 (P_2S_5), Lawesson 시약 (2,4-비스(4-메톡시페닐)-1,2,3,4-디티아디포스페탄 2,4-디황피드) 또는 중합체 지지된 가황 시약 (예컨대 Journal of the Chemical Society, Perkin 1 (2001), 358 에 기재됨)일 수 있다.

[0118] 본 발명에 따른 화합물은 상기 기재된 제조의 일반적 프로세스에 따라 제조될 수 있다. 그럼에도 불구하고 당업자의 일반적 지식 및 이용가능한 공개문헌을 기반으로 하여, 당업자는 합성하는 것으로 요구되는, 각 화합물의 사양에 따라 상기 방법을 적용할 수 있음이 이해될 것이다.

[0119] 추가 측면에서, 본 발명은 또한 화학식 (I) 의 활성 화합물의 유효적 및 비식물독성적 (non-phytotoxic) 양을 포함하는 살진균성 조성물에 관한 것이다.

[0120] "유효적 및 비식물독성적 양" 이란 표현은 농작물에 기생하거나 그에 출현하기 쉬운 진균류를 방제 또는 박멸하기에 충분하면서, 그 농작물에 어떠한 상당한 식물독성 증상으로 수반하지 않는 본 발명에 따른 조성물의 양을 의미한다. 그러한 양은 방제할 진균, 농작물 종류, 기후 조건 및 본 발명에 따른 살진균성 조성물에 포함된 화합물에 따라 광범위하게 가변적일 수 있다. 상기 양은, 당업자의 수행능력 내에서 조직적 재배 실험으로 결정할 수 있다.

[0121] 따라서, 본 발명에 의하면, 활성 성분으로서 유효량의 본원에 정의한 바와 같은 화학식 (I) 의 화합물 및 농업상 허용가능한 지지체, 담체 또는 충전제를 포함하는 살진균성 조성물이 제공된다.

[0122] 본 발명에 의하면, "지지체"란 용어는 특히 식물 부위에 적용되기 쉽도록 화학식 (I) 의 활성 화합물과 조합 또는 연관되는 천연 또는 합성, 유기 또는 무기 화합물을 말한다. 이 지지체는 따라서 일반적으로 불활성이고 농업상 허용가능해야 한다. 지지체는 고체 또는 액체일 수 있다. 적절한 지지체의 예에는, 점토, 천연 또는 합성 실리케이트, 실리카, 수지, 왁스, 고체 비료, 물, 알코올, 특히 부탄올 유기 용매, 미네랄 및

식물성 오일 및 그 유도체가 포함된다. 상기 지지체의 혼합물도 또한 사용할 수 있다.

- [0123] 본 발명에 따른 조성물은 또한 추가 성분을 함유할 수도 있다. 특히, 당해 조성물은 계면활성제를 추가로 함유할 수 있다. 계면활성제는 에멀전화제, 분산제 또는 이온 또는 비이온 형 습윤제 또는 이들 계면활성제의 혼합물일 수 있다. 예를 들어, 폴리아크릴산염, 리그노설폰산염, 페놀설폰산염 또는 나프탈렌설폰산염, 에틸렌 옥시드와 지방 알코올 또는 지방산 또는 지방 아민과의 중축합물, 치환 페놀 (특히 알킬페놀 또는 아릴페놀), 술포숙신산 에스테르염, 타우린 유도체 (특히 알킬 타우레이트), 폴리옥시에틸화 알코올 또는 페놀의 인산 에스테르, 폴리올의 지방산 에스테르, 및 술페이트, 술포네이트 및 포스페이트 작용기를 함유하는 상기 화합물의 유도체를 언급할 수 있다. 활성 화합물 및/또는 불활성 지지체가 비(非)수용성이고, 적용을 위한 벡터 제제가 물인 경우 일반적으로 하나 이상의 계면활성제가 반드시 존재한다. 바람직하게, 계면활성제 함량은 조성물의 5 중량% 내지 40 중량%일 수 있다.
- [0124] 임의로는 추가 성분에는 또한, 예컨대 보호 콜로이드, 접착제, 증점제, 요변제 (thixotropic agent), 침투제, 안정화제, 격리제 (sequestering agent) 가 포함될 수 있다. 더 일반적으로는, 활성 화합물을 통상적인 제형화 기술에 부합하는 임의의 고체 또는 액체 첨가제와 조합할 수 있다.
- [0125] 일반적으로, 본 발명에 따른 조성물은 0.05 내지 99 중량% 의 활성 화합물, 바람직하게는 10 내지 70 중량% 의 활성 화합물을 포함할 수 있다.
- [0126] 본 발명에 따른 조성물은, 에어로졸 디스펜서, 캡슐 현탁액, 냉각 연무 농축물 (cold fogging concentrate), 분체 (dustable powder), 유제 (emulsifiable concentrate), 수중유 에멀전, 유중수 에멀전, 캡슐화 과립 (encapsulated granule), 세립제 (fine granule), 종자처리액상수화제 (flowable concentrate for seed treatment), 기체 (가압하), 기체 발생 제품 (gas generating product), 과립, 열 연무 농축물 (hot fogging concentrate), 거대과립, 미립제 (microgranule), 유화성 분산제 (oil dispersible powder), 유화성 분의제 (oil miscible flowable concentrate), 오일제 (oil miscible liquid), 페이스트, 식물 생식흡반가시 (plant rodlet), 종자처리분의제 (powder for dry seed treatment), 살충제 코팅 종자, 액제, 가용성 분말, 종자처리 용액, 현탁 농축물 (액상수화제), 초미량 (ultra low volume (ulv))액, 초미량 (ulv) 현탁액, 과립 또는 정제 수화제, 종자처리수화성분의제 (water dispersible powder for slurry treatment), 수용성 과립 또는 정제, 종자처리수용성분의제 (water soluble powder for seed treatment) 및 수화제 (wetttable powder) 와 같은 다양한 형태로 사용될 수 있다. 상기 조성물은, 분무 또는 살포 장치와 같은 적절한 장치를 이용하여 처리할 식물 또는 종자에 바로 적용되는 조성물뿐 아니라, 농작물에 적용되기 전에 반드시 희석을 요하는 시판용 농축 조성물도 포함한다.
- [0127] 본 발명에 따른 화합물은 또한 하나 이상의 살충제, 살진균제, 살균제, 유인제, 진드기 구충제 또는 페로몬 활성 물질 또는 생물학적 활성을 지닌 기타 화합물과 혼합될 수도 있다. 이에 따라 수득된 혼합물은 통상 광범위해진 활성 범위를 갖는다. 다른 살진균제와의 혼합물이 특히 이롭다.
- [0128] 적합한 살진균제 혼합 파트너의 예는 하기 목록에서 선택될 수 있다:
- [0129] (1) 에르고스테롤 생합성 억제제, 예를 들어 (1.1) 알디모르프 (aldimorph) (1704-28-5), (1.2) 아자코나졸 (azaconazole) (60207-31-0), (1.3) 비터타놀 (bitertanol) (55179-31-2), (1.4) 브로뮤코나졸 (bromuconazole) (116255-48-2), (1.5) 사이프로코나졸 (cyproconazole) (113096-99-4), (1.6) 디클로부트라졸 (diclobutrazole) (75736-33-3), (1.7) 디페노코나졸 (difenoconazole) (119446-68-3), (1.8) 디니코나졸 (diniconazole) (83657-24-3), (1.9) 디니코나졸-M (83657-18-5), (1.10) 도데모르프 (dodemorph) (1593-77-7), (1.11) 도데모르프 아세테이트 (31717-87-0), (1.12) 에폭시코나졸 (epoxiconazole) (106325-08-0), (1.13) 에타코나졸 (etaconazole) (60207-93-4), (1.14) 페나리몰 (fenarimol) (60168-88-9), (1.15) 펜부코나졸 (fenbuconazole) (114369-43-6), (1.16) 펜헥사미드 (fenhexamid) (126833-17-8), (1.17) 펜프로피딘 (fenpropidin) (67306-00-7), (1.18) 펜프로피모르프 (fenpropimorph) (67306-03-0), (1.19) 플루킨코나졸 (fluquinconazole) (136426-54-5), (1.20) 플루프리미돌 (flurprimidol) (56425-91-3), (1.21) 플루실라졸 (flusilazole) (85509-19-9), (1.22) 플루트리아폴 (flutriafol) (76674-21-0), (1.23) 퍼코나졸 (furconazole) (112839-33-5), (1.24) 퍼코나졸-시스 (furconazole-cis) (112839-32-4), (1.25) 헥사코나졸 (hexaconazole) (79983-71-4), (1.26) 이마잘릴 (imazalil) (60534-80-7), (1.27) 이마잘릴 술페이트 (58594-72-2), (1.28) 이미벤코나졸 (imibenconazole) (86598-92-7), (1.29) 입코나졸 (ipconazole) (125225-28-7), (1.30) 메트코나졸 (metconazole) (125116-23-6), (1.31) 마이클로부타닐 (myclobutanil) (88671-89-0), (1.32) 나프티파인 (naftifine) (65472-88-0), (1.33) 누아리몰 (nuarimol) (63284-71-9), (1.34) 옥스포코나

졸 (oxpoconazole) (174212-12-5), (1.35) 파클로부트라졸 (paclobutrazol) (76738-62-0), (1.36) 페푸라조에이트 (pefurazoate)(101903-30-4), (1.37) 펜코나졸 (penconazole) (66246-88-6), (1.38) 피페랄린 (piperalin) (3478-94-2), (1.39) 프로클로라즈 (prochloraz) (67747-09-5), (1.40) 프로피코나졸 (propiconazole) (60207-90-1), (1.41) 프로티오코나졸 (prothioconazole) (178928-70-6), (1.42) 피리부티카르브 (pyributicarb) (88678-67-5), (1.43) 피리페녹스 (pyrifenox) (88283-41-4), (1.44) 퀴코나졸 (quinconazole)(103970-75-8), (1.45) 시메코나졸 (simeconazole) (149508-90-7), (1.46) 스피록사민 (spiroxamine) (118134-30-8), (1.47) 테부코나졸 (tebuconazole) (107534-96-3), (1.48) 터비나핀 (terbinafine) (91161-71-6), (1.49) 테트라코나졸 (tetraconazole)(112281-77-3), (1.50) 트리아디메폰 (triadimefon) (43121-43-3), (1.51) 트리아디메놀 (triadimenol) (89482-17-7), (1.52) 트리테르모르프 (tridemorph) (81412-43-3), (1.53) 트리플루미졸 (triflumizole) (68694-11-1), (1.54) 트리포린 (triforine) (26644-46-2), (1.55) 트리티코나졸 (triticonazole) (131983-72-7), (1.56) 유니코나졸 (uniconazole) (83657-22-1), (1.57) 유니코나졸-p (83657-17-4), (1.58) 비니코나졸 (viniconazole) (77174-66-4), (1.59) 보리코나졸 (voriconazole) (137234-62-9), (1.60) 1-(4-클로로페닐)-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일)시클로헥타놀 (129586-32-9), (1.61) 메틸 1-(2,2-디메틸-2,3-디히드로-1H-인덴-1-일)-1H-이미다졸-5-카르복실레이트 (110323-95-0), (1.62) N'-{5-(디플루오로메틸)-2-메틸-4-[3-(트리메틸실릴)프로폭시]페닐}-N-에틸-N-메틸이미도포름아미드, (1.63) N-에틸-N-메틸-N'-{2-메틸-5-(트리플루오로메틸)-4-[3-(트리메틸실릴)프로폭시]페닐}이미도포름아미드 및 (1.64) O-[1-(4-메톡시페녹시)-3,3-디메틸부탄-2-일] 1H-이미다졸-1-카르보티오에이트 (111226-71-2).

[0130] (2) 착물 I 또는 II 에서의 호홉 연쇄의 억제제, 예를 들어 (2.1) 빅사펜 (bixafen) (581809-46-3), (2.2) 보스칼리드 (boscalid) (188425-85-6), (2.3) 카르복신 (carboxin) (5234-68-4), (2.4) 디플루메토림 (diflumetorim) (130339-07-0), (2.5) 펜푸람 (fenfuram) (24691-80-3), (2.6) 플루오피람 (fluopyram) (658066-35-4), (2.7) 플루톨라닐 (flutolanil) (66332-96-5), (2.8) 플럭사피록사드 (fluxapyroxad) (907204-31-3), (2.9) 푸라메트피르 (furametpyr) (123572-88-3), (2.10) 퍼메시클록스 (furmecyclox) (60568-05-0), (2.11) 이소피라잠 (isopyrazam) (신(syn)-에피머 라세미체 1RS,4SR,9RS 및 안티(anti)-에피머 라세미체 1RS,4SR,9SR 의 혼합물) (881685-58-1), (2.12) 이소피라잠 (안티-에피머 라세미체 1RS,4SR,9SR), (2.13) 이소피라잠 (안티-에피머 거울상이성질체 1R,4S,9S), (2.14) 이소피라잠 (안티-에피머 거울상이성질체 1S,4R,9R), (2.15) 이소피라잠 (신 에피머 라세미체 1RS,4SR,9RS), (2.16) 이소피라잠 (신-에피머 거울상이성질체 1R,4S,9R), (2.17) 이소피라잠 (신-에피머 거울상이성질체 1S,4R,9S), (2.18) 메프로닐 (mepconil) (55814-41-0), (2.19) 옥시카르복신 (oxycarboxin) (5259-88-1), (2.20) 펜플루펜 (penflufen) (494793-67-8), (2.21) 펜티오피라드 (penthiopyrad) (183675-82-3), (2.22) 세닥산 (sedaxane) (874967-67-6), (2.23) 티플루자미드 (thifluzamide) (130000-40-7), (2.24) 1-메틸-N-[2-(1,1,2,2-테트라플루오로에톡시)페닐]-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-4-카르복사미드, (2.25) 3-(디플루오로메틸)-1-메틸-N-[2-(1,1,2,2-테트라플루오로에톡시)페닐]-1H-피라졸-4-카르복사미드, (2.26) 3-(디플루오로메틸)-N-[4-플루오로-2-(1,1,2,3,3,3-헥사플루오로프로폭시)페닐]-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드, (2.27) N-[1-(2,4-디클로로페닐)-1-메톡시프로판-2-일]-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드 (1092400-95-7) (WO 2008148570), (2.28) 5,8-디플루오로-N-[2-(2-플루오로-4-{[4-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]옥시}페닐)에틸]퀴나졸린-4-아민 (1210070-84-0) (WO2010025451) 및 (2.29) N-[9-(디클로로메틸렌)-1,2,3,4-테트라히드로-1,4-메타노나프탈렌-5-일]-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드.

[0131] (3) 착물 III 에서의 호홉 연쇄의 억제제, 예를 들어 (3.1) 아메톡트라딘 (ametoctradin) (865318-97-4), (3.2) 아미술프롬 (amisulbrom) (348635-87-0), (3.3) 아зок시스트로빈 (azoxystrobin) (131860-33-8), (3.4) 시아조파미드 (cyazofamid) (120116-88-3), (3.5) 쿠메톡시스트로빈 (coumethoxystrobin) (850881-30-0), (3.6) 쿠목시스트로빈 (coumoxystrobin) (850881-70-8), (3.7) 디목시스트로빈 (dimoxystrobin) (141600-52-4), (3.8) 에네스트로부린 (enestroburin) (238410-11-2) (WO 2004/058723), (3.9) 파목사돈 (famoxadone) (131807-57-3) (WO 2004/058723), (3.10) 페나미돈 (fenamidone) (161326-34-7) (WO 2004/058723), (3.11) 페녹시스트로빈 (fenoxystrobin) (918162-02-4), (3.12) 플루옥사스트로빈 (fluoxastrobin) (361377-29-9) (WO 2004/058723), (3.13) 크레속심 (kresoxim)-메틸 (143390-89-0) (WO 2004/058723), (3.14) 메토미노스트로빈 (metominostrobin) (133408-50-1) (WO 2004/058723), (3.15) 오리사스트로빈 (orysastrobin) (189892-69-1) (WO 2004/058723), (3.16) 피콕시스트로빈 (picoxystrobin) (117428-22-5) (WO 2004/058723), (3.17) 피라클로스트로빈 (pyraclostrobin) (175013-18-0) (WO 2004/058723), (3.18) 피라메토스트로빈 (pyrametostrobin) (915410-70-7) (WO 2004/058723), (3.19) 피라옥시스트로빈 (pyraoxystrobin) (862588-11-2) (WO

2004/058723), (3.20) 피리벤카르브 (pyribencarb) (799247-52-2) (WO 2004/058723), (3.21) 트리클로피리카르브 (triclopyricarb) (902760-40-1), (3.22) 트리플록시스트로빈 (trifloxystrobin)(141517-21-7) (WO 2004/058723), (3.23) (2E)-2-(2-([6-(3-클로로-2-메틸페녹시)-5-플루오로피리미딘-4-일]옥시)페닐)-2-(메톡시이미노)-N-메틸에탄아미드 (WO 2004/058723), (3.24) (2E)-2-(메톡시이미노)-N-메틸-2-(2-([1-([3-(트리플루오로메틸)페닐]에틸리덴)아미노]옥시)메틸)페닐)에탄아미드 (WO 2004/058723), (3.25) (2E)-2-(메톡시이미노)-N-메틸-2-(2-[(E)-({1-[3-(트리플루오로메틸)페닐]에톡시}이미노)메틸]페닐)에탄아미드 (158169-73-4), (3.26) (2E)-2-{2-[(E)-({1-([3-(E)-1-플루오로-2-페닐에테닐]옥시)페닐]에틸리덴)아미노]옥시}메틸]페닐}-2-(메톡시이미노)-N-메틸에탄아미드 (326896-28-0), (3.27) (2E)-2-{2-[(E)-4-(2,6-디클로로페닐)부트-3-엔-2-일리덴]아미노]옥시}메틸]페닐}-2-(메톡시이미노)-N-메틸에탄아미드, (3.28) 2-클로로-N-(1,1,3-트리메틸-2,3-디히드로-1H-인덴-4-일)피리딘-3-카르복사미드 (119899-14-8), (3.29) 5-메톡시-2-메틸-4-(2-([1-([3-(트리플루오로메틸)페닐]에틸리덴)아미노]옥시)메틸]페닐)-2,4-디히드로-3H-1,2,4-트리아졸-3-온, (3.30) 메틸 (2E)-2-{2-[(시클로프로필(4-메톡시페닐)이미노)메틸]술폰}메틸]페닐}-3-메톡시프로프-2-에노에이트 (149601-03-6), (3.31) N-(3-에틸-3,5,5-트리메틸시클로헥실)-3-(포르밀아미노)-2-히드록시벤즈아미드 (226551-21-9), (3.32) 2-{2-[(2,5-디메틸페녹시)메틸]페닐}-2-메톡시-N-메틸아세트아미드 (173662-97-0) 및 (3.33) (2R)-2-{2-[(2,5-디메틸페녹시)메틸]페닐}-2-메톡시-N-메틸아세트아미드 (394657-24-0).

[0132] (4) 유사분열 및 세포분열의 억제제, 예를 들어 (4.1) 베노밀 (benomyl) (17804-35-2), (4.2) 카르벤다짐 (carbendazim) (10605-21-7), (4.3) 클로르페나졸 (chlorfenazole) (3574-96-7), (4.4) 디에토펜카르브 (diethofencarb) (87130-20-9), (4.5) 에타복삼 (ethaboxam) (162650-77-3), (4.6) 플루오피콜리드 (fluopicolide) (239110-15-7), (4.7) 푸베리다졸 (fuberidazole) (3878-19-1), (4.8) 펜사이쿠론 (pencycuron) (66063-05-6), (4.9) 티아벤다졸 (thiabendazole) (148-79-8), (4.10) 티오파네이트 (thiophanate)-메틸 (23564-05-8), (4.11) 티오펜네이트 (23564-06-9), (4.12) 족사미드 (zoxamide) (156052-68-5), (4.13) 5-클로로-7-(4-메틸피페리딘-1-일)-6-(2,4,6-트리플루오로페닐)[1,2,4]트리아졸로[1,5-a]피리미딘 (214706-53-3) 및 (4.14) 3-클로로-5-(6-클로로피리딘-3-일)-6-메틸-4-(2,4,6-트리플루오로페닐)피리다진 (1002756-87-7).

[0133] (5) 다점 (multisite) 작용을 할 수 있는 화합물, 예를 들어 (5.1) 보르도 (bordeaux) 혼합물 (8011-63-0), (5.2) 캡타폴 (captafol) (2425-06-1), (5.3) 캡탄 (captan) (133-06-2) (WO 02/12172), (5.4) 클로로탈로닐 (chlorothalonil) (1897-45-6), (5.5) 구리 히드록시드 (20427-59-2), (5.6) 구리 나프테네이트 (1338-02-9), (5.7) 구리 옥시드 (1317-39-1), (5.8) 구리 옥시클로라이드 (1332-40-7), (5.9) 구리(2+) 술페이트 (7758-98-7), (5.10) 디클로플루아니드 (dichlofluanid) (1085-98-9), (5.11) 디티아논 (dithianon) (3347-22-6), (5.12) 도딘 (dodine) (2439-10-3), (5.13) 도딘 자유 염기, (5.14) 페밤 (ferbam) (14484-64-1), (5.15) 플루오로폴페트 (fluorofolpet) (719-96-0), (5.16) 폴페트 (folpet) (133-07-3), (5.17) 구아자틴 (guazatine) (108173-90-6), (5.18) 구아자틴 아세테이트, (5.19) 이미녹타딘 (iminocadine) (13516-27-3), (5.20) 이미녹타딘 알베실레이트 (albesilate) (169202-06-6), (5.21) 이미녹타딘 트리아세테이트 (57520-17-9), (5.22) 만코퍼 (mancopper) (53988-93-5), (5.23) 만코zeb (mancozeb) (8018-01-7), (5.24) 마넵 (maneb) (12427-38-2), (5.25) 메티람 (metiram) (9006-42-2), (5.26) 메티람 아연 (9006-42-2), (5.27) 옥신-구리 (10380-28-6), (5.28) 프로파미딘 (104-32-5), (5.29) 프로피넵 (propineb) (12071-83-9), (5.30) 황 및 칼슘 폴리술폰페드를 포함하는 황 제제 (7704-34-9), (5.31) 티람 (thiram) (137-26-8), (5.32) 톨릴플루아니드 (tolylfluanid) (731-27-1), (5.33) 지넵 (zineb) (12122-67-7) 및 (5.34) 지람 (ziram) (137-30-4).

[0134] (6) 숙주 방어를 유도할 수 있는 화합물, 예를 들어 (6.1) 아시벤졸라 (acibenzolar)-S-메틸 (135158-54-2), (6.2) 이소티아닐 (isotianil) (224049-04-1), (6.3) 프로베나졸 (27605-76-1) 및 (6.4) 티아디닐 (tiadinil) (223580-51-6).

[0135] (7) 아미노 산 및/또는 단백질 생합성의 억제제, 예를 들어 (7.1) 안도프림 (andoprim) (23951-85-1), (7.2) 블라스티시딘 (blasticidin)-S (2079-00-7), (7.3) 사이프로디닐 (cyprodinil) (121552-61-2), (7.4) 카수가마이신 (6980-18-3), (7.5) 카수가마이신 히드로클로라이드 하이드레이트 (19408-46-9), (7.6) 메파니프림 (mepanipyrim)(110235-47-7), (7.7) 피리메타닐 (pyrimethanil) (53112-28-0) 및 (7.8) 3-(5-플루오로-3,3,4,4-테트라메틸-3,4-디히드로이소퀴놀린-1-일)퀴놀린 (861647-32-7) (WO2005070917).

[0136] (8) ATP 생성의 억제제, 예를 들어 (8.1) 펜틴 (fentin) 아세테이트 (900-95-8), (8.2) 펜틴 클로라이드 (639-58-7), (8.3) 펜틴 히드록시드 (76-87-9) 및 (8.4) 실티오팜 (silthiofam) (175217-20-6).

- [0137] (9) 세포벽 합성의 억제제, 예를 들어 (9.1) 벤티아발리카르브 (benthiavalicarb) (177406-68-7), (9.2) 디메토모르프 (dimethomorph) (110488-70-5), (9.3) 플루모르프 (flumorph) (211867-47-9), (9.4) 이프로발리카르브 (iprovalicarb) (140923-17-7), (9.5) 만디프로파미드 (mandipropamid) (374726-62-2), (9.6) 폴리옥신스 (polyoxins) (11113-80-7), (9.7) 폴리옥소림 (polyoxorim) (22976-86-9), (9.8) 발리다마이신 (validamycin) A (37248-47-8) 및 (9.9) 발리페날레이트 (valifenalate) (283159-94-4; 283159-90-0).
- [0138] (10) 지질 및 막 합성의 억제제, 예를 들어 (10.1) 바이페닐 (92-52-4), (10.2) 클로로넵 (chloroneb) (2675-77-6), (10.3) 디클로란 (dicloran) (99-30-9), (10.4) 에디펜포스 (edifenphos) (17109-49-8), (10.5) 에트리디아졸 (etridiazole) (2593-15-9), (10.6) 이도카르브 (iodocarb) (55406-53-6), (10.7) 이프로벤포스 (iprobefos) (26087-47-8), (10.8) 이소프로티올란 (isoprothiolane) (50512-35-1), (10.9) 프로파모카르브 (propamocarb) (25606-41-1), (10.10) 프로파모카르브 히드로클로라이드 (25606-41-1), (10.11) 프로티오카르브 (prothiocarb) (19622-08-3), (10.12) 피라조포스 (pyrazophos) (13457-18-6), (10.13) 퀸토젠 (quintozene) (82-68-8), (10.14) 텍나젠 (tecnazene) (117-18-0) 및 (10.15) 톨클로포스 (tolclofos)-메틸 (57018-04-9).
- [0139] (11) 멜라닌 생합성의 억제제, 예를 들어 (11.1) 카르프로파미드 (carpropamid) (104030-54-8), (11.2) 디클로사이메트 (diclocymet) (139920-32-4), (11.3) 페녹사닐 (fenoxanil) (115852-48-7), (11.4) 프탈라이드 (phthalide) (27355-22-2), (11.5) 피로퀼론 (pyroquilon) (57369-32-1), (11.6) 트리사이클라졸 (tricyclazole) (41814-78-2) 및 (11.7) 2,2,2-트리플루오로에틸 {3-메틸-1-[(4-메틸벤조일)아미노]부탄-2-일}카르바메이트 (851524-22-6) (W02005042474).
- [0140] (12) 핵산 합성의 억제제, 예를 들어 (12.1) 베날락실 (benalaxyl) (71626-11-4), (12.2) 베날락실-M (키랄락실 (kiralaxyl)) (98243-83-5), (12.3) 부피리메이트 (bupirimate) (41483-43-6), (12.4) 클로질라콘 (clozylacon) (67932-85-8), (12.5) 디메티리몰 (dimethirimol) (5221-53-4), (12.6) 에티리몰 (ethirimol) (23947-60-6), (12.7) 푸랄락실 (furalaxyl) (57646-30-7), (12.8) 하이멕사졸 (hymexazol) (10004-44-1), (12.9) 메탈락실 (metalaxyl) (57837-19-1), (12.10) 메탈락실 (metalaxyl)-M (메페녹삼 (mefenoxam)) (70630-17-0), (12.11) 오퍼레이스 (ofurace) (58810-48-3), (12.12) 옥사딕실 (oxadixyl) (77732-09-3) 및 (12.13) 옥솔린산 (oxolinic acid) (14698-29-4).
- [0141] (13) 신호전달의 억제제, 예를 들어 (13.1) 클로졸리네이트 (chlozolate) (84332-86-5), (13.2) 펜피클로닐 (fenpiclonil) (74738-17-3), (13.3) 플루디옥소닐 (fludioxonil) (131341-86-1), (13.4) 이프로디온 (iprodione) (36734-19-7), (13.5) 프로사이미돈 (procymidone) (32809-16-8), (13.6) 퀴녹시펜 (quinoxifen) (124495-18-7) 및 (13.7) 빈클로졸린 (vinclozolin) (50471-44-8).
- [0142] (14) 언커플러 (uncoupler)로서 작용할 수 있는 화합물, 예를 들어 (14.1) 비나파크릴 (binapacryl) (485-31-4), (14.2) 디노캡 (dinocap) (131-72-6), (14.3) 페림존 (ferimzone) (89269-64-7), (14.4) 플루아지남 (fluazinam) (79622-59-6) 및 (14.5) 메틸디노캡 (meptyldinocap) (131-72-6).
- [0143] (15) 추가 화합물, 예를 들어 (15.1) 벤티아졸 (benthiazole) (21564-17-0), (15.2) 베크사진 (bethoxazin) (163269-30-5), (15.3) 캅시마이신 (capsimycin) (70694-08-5), (15.4) 카르본 (carvone) (99-49-0), (15.5) 치노메티오나트 (chinomethionat) (2439-01-2), (15.6) 피리오페논 (pyriofenone) (클라자페논 (chlazafenone)) (688046-61-9), (15.7) 쿠프라넵 (cufraneb) (11096-18-7), (15.8) 사이플루페나미드 (cyflufenamid) (180409-60-3), (15.9) 사이목사닐 (cymoxanil) (57966-95-7), (15.10) 사이프로솔파미드 (cyprosulfamid) (221667-31-8), (15.11) 다조메트 (dazomet) (533-74-4), (15.12) 데바카르브 (debacarb) (62732-91-6), (15.13) 디클로로펜 (97-23-4), (15.14) 디클로메진 (diclomezine) (62865-36-5), (15.15) 디펜조퀴트 (difenzoquat) (49866-87-7), (15.16) 디펜조퀴트 (difenzoquat) 메틸술페이트 (43222-48-6), (15.17) 디페닐아민 (122-39-4), (15.18) 에코메이트 (ecomate), (15.19) 펜피라자민 (fenpyrazamine) (473798-59-3), (15.20) 플루메토버 (flumetover) (154025-04-4), (15.21) 플루오로이미드 (fluoroimide) (41205-21-4), (15.22) 플루솔파미드 (flusulfamid) (106917-52-6), (15.23) 플루티아닐 (flutianil) (304900-25-2), (15.24) 포세틸 (fosetyl)-알루미늄 (39148-24-8), (15.25) 포세틸-칼슘, (15.26) 포세틸-나트륨 (39148-16-8), (15.27) 핵사클로로벤젠 (118-74-1), (15.28) 이루마마이신 (irumamycin) (81604-73-1), (15.29) 메타술포카르브 (methasulfocarb) (66952-49-6), (15.30) 메틸 이소티오시아네이트 (isothiocyanate) (556-61-6), (15.31) 메트라페논 (metrafenone) (220899-03-6), (15.32) 밀디오마이신 (mildiomycin) (67527-71-3), (15.33) 나타마이신 (natamycin) (7681-93-8), (15.34) 니켈 디메틸디티오카르바메이트 (15521-65-0), (15.35)

니트로탈 (nitrothal)-이소프로필 (10552-74-6), (15.36) 옥틸리논 (26530-20-1), (15.37) 옥사모카르브 (oxamocarb) (917242-12-7), (15.38) 옥시펜티인 (oxyfenthin) (34407-87-9), (15.39) 펜타클로로페놀 및 염 (87-86-5), (15.40) 페노트린 (phenothrin), (15.41) 포스포러스 산 및 그 염 (13598-36-2), (15.42) 프로파모 카르브-포세틸레이트 (fosetyl), (15.43) 프로파노신 (propanosine)-나트륨 (88498-02-6), (15.44) 프로퀴 나지드 (proquinazid) (189278-12-4), (15.45) 피리모르프 (pyrimorph) (868390-90-3), (15.46) 피롤니트린 (pyrrolnitrin) (1018-71-9) (EP-A 1 559 320), (15.47) 테부플로퀸 (tebufloquin) (376645-78-2), (15.48) 테클로프탈람 (76280-91-6), (15.49) 톨니파나이드 (tolnifenide) (304911-98-6), (15.50) 트리아옥시드 (triazoxide) (72459-58-6), (15.51) 트리클라미드 (trichlamide) (70193-21-4), (15.52) 자릴아미드 (zarilamid) (84527-51-5), (15.53) (3S,6S,7R,8R)-8-벤질-3-[(3-[(이소부틸옥시)메톡시]-4-메톡시피리딘-2-일)카르보닐]아미노-6-메틸-4,9-디옥소-1,5-디옥소난-7-일 2-메틸프로파노에이트 (517875-34-2) (WO2003035617), (15.54) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-디플루오로페닐)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-일)-2-[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에타논 (1003319-79-6) (WO 2008013622), (15.55) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-디플루오로페닐)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-일)-2-[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에타논 (1003319-80-9) (WO 2008013622), (15.56) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-디플루오로페닐)-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-일)-2-[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]에타논 (1003318-67-9) (WO 2008013622), (15.57) 1-(4-메톡시페녹시)-3,3-디메틸 부탄-2-일 1H-이미다졸-1-카르복실레이트 (111227-17-9), (15.58) 2,3,5,6-테트라클로로-4-(메틸술포닐)피리딘 (13108-52-6), (15.59) 2,3-디부틸-6-클로로티에노[2,3-d]피리미딘-4(3H)-온 (221451-58-7), (15.60) 2,6-디메 탈-1H,5H-[1,4]디티아노[2,3-c:5,6-c']디피롤-1,3,5,7(2H,6H)-테트론, (15.61) 2-[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]-1-(4-{4-[(5R)-5-페닐-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1-일)에타논 (1003316-53-7) (WO 2008013622), (15.62) 2-[5-메틸-3-(트리플루오로 메틸)-1H-피라졸-1-일]-1-(4-{4-[(5S)-5-페닐-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일]-1,3-티아졸-2-일}피페리딘-1- 일)에타논 (1003316-54-8) (WO 2008013622), (15.63) 2-[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]-1-(4- [4-(5-페닐-4,5-디히드로-1,2-옥사졸-3-일)-1,3-티아졸-2-일]피페리딘-1-일)에타논 (1003316-51-5) (WO 2008013622), (15.64) 2-부톡시-6-요오도-3-프로필-4H-크로텐-4-온, (15.65) 2-클로로-5-[2-클로로-1-(2,6-디 플루오로-4-메톡시페닐)-4-메틸-1H-이미다졸-5-일]피리딘, (15.66) 2-페닐페놀 및 염 (90-43-7), (15.67) 3-(4,4,5-트리플루오로-3,3-디메틸-3,4-디히드로이소퀴놀린-1-일)퀴놀린 (861647-85-0) (WO2005070917), (15.68) 3,4,5-트리클로로피리딘-2,6-디카르보니트릴 (17824-85-0), (15.69) 3-[5-(4-클로로페닐)-2,3-디메틸-1,2-옥사 졸리딘-3-일]피리딘, (15.70) 3-클로로-5-(4-클로로페닐)-4-(2,6-디플루오로페닐)-6-메틸피리다진, (15.71) 4-(4-클로로페닐)-5-(2,6-디플루오로페닐)-3,6-디메틸피리다진, (15.72) 5-아미노-1,3,4-티아디아졸-2-티올, (15.73) 5-클로로-N'-페닐-N'-(프로프-2-인-1-일)티오펜-2-술포노히드라지드 (134-31-6), (15.74) 5-플루오로-2-[(4-플루오로벤질)옥시]피리미딘-4-아민 (1174376-11-4) (WO2009094442), (15.75) 5-플루오로-2-[(4-메틸벤 질)옥시]피리미딘-4-아민 (1174376-25-0) (WO2009094442), (15.76) 5-메틸-6-옥틸[1,2,4]트리아졸로[1,5-a]피 리미딘-7-아민, (15.77) 에틸 (2Z)-3-아미노-2-시아노-3-페닐프로프-2-에노에이트, (15.78) N'-(4-{[3-(4-클로 로벤질)-1,2,4-티아디아졸-5-일]옥시}-2,5-디메틸페닐)-N-에틸-N-메틸이미도포름아미드, (15.79) N-(4-클로로벤 질)-3-[3-메톡시-4-(프로프-2-인-1-일옥시)페닐]프로판아미드, (15.80) N-[(4-클로로페닐)(시아노)메틸]-3-[3- 메톡시-4-(프로프-2-인-1-일옥시)페닐]프로판아미드, (15.81) N-[(5-브로모-3-클로로피리딘-2-일)메틸]-2,4-디 클로로피리딘-3-카르복사미드, (15.82) N-[1-(5-브로모-3-클로로피리딘-2-일)에틸]-2,4-디클로로피리딘-3-카르 복사미드, (15.83) N-[1-(5-브로모-3-클로로피리딘-2-일)에틸]-2-플루오로-4-요오도피리딘-3-카르복사미드, (15.84) N-[(E)-[(시클로프로필메톡시)이미노][6-(디플루오로메톡시)-2,3-디플루오로페닐]메틸]-2-페닐아세트아 미드 (221201-92-9), (15.85) N-[(Z)-[(시클로프로필메톡시)이미노][6-(디플루오로메톡시)-2,3-디플루오로페닐]메틸]-2-페닐아세트아미드 (221201-92-9), (15.86) N'-(4-{[3-tert-부틸-4-시아노-1,2-티아졸-5-일]옥시}-2-클로로-5-메틸페닐)-N-에틸-N-메틸이미도포름아미드, (15.87) N-메틸-2-(1-{[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸}피페리딘 -4-일)-N-(1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌-1-일)-1,3-티아졸-4-카르복사미드 (922514-49-6) (WO 2007014290), (15.88) N-메틸-2-(1-{[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸}피페리딘-4-일)-N-[(1R)-1,2,3,4- 테트라히드로나프탈렌-1-일]-1,3-티아졸-4-카르복사미드 (922514-07-6) (WO 2007014290), (15.89) N-메틸-2-(1-{[5-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-1-일]아세틸}피페리딘-4-일)-N-[(1S)-1,2,3,4-테트라히드로나프 탈렌-1-일]-1,3-티아졸-4-카르복사미드 (922514-48-5) (WO 2007014290), (15.90) 펜틸 {6-[(1-메틸-1H-테 트라졸-5-일)(페닐)메틸리덴]아미노}옥시메틸피리딘-2-일}카르바메이트, (15.91) 페나진-1-카르복실산,

(15.92) 퀴놀린-8-올 (134-31-6), (15.93) 퀴놀린-8-올 술페이트 (2:1) (134-31-6) 및 (15.94) tert-부틸 {6-[(1-메틸-1H-테트라졸-5-일)(페닐)메틸렌]아미노}옥시메틸피리딘-2-일}카르바메이트.

[0144] (16) 추가의 화합물, 예를 들어 (16.1) 1-메틸-3-(트리플루오로메틸)-N-[2'-(트리플루오로메틸)바이페닐-2-일]-1H-피라졸-4-카르복사미드, (16.2) N-(4'-클로로바이페닐-2-일)-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드, (16.3) N-(2',4'-디클로로바이페닐-2-일)-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드, (16.4) 3-(디플루오로메틸)-1-메틸-N-[4'-(트리플루오로메틸)바이페닐-2-일]-1H-피라졸-4-카르복사미드, (16.5) N-(2',5'-디플루오로바이페닐-2-일)-1-메틸-3-(트리플루오로메틸)-1H-피라졸-4-카르복사미드, (16.6) 3-(디플루오로메틸)-1-메틸-N-[4'-(프로프-1-인-1-일)바이페닐-2-일]-1H-피라졸-4-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.7) 5-플루오로-1,3-디메틸-N-[4'-(프로프-1-인-1-일)바이페닐-2-일]-1H-피라졸-4-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.8) 2-클로로-N-[4'-(프로프-1-인-1-일)바이페닐-2-일]피리딘-3-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.9) 3-(디플루오로메틸)-N-[4'-(3,3-디메틸부트-1-인-1-일)바이페닐-2-일]-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.10) N-[4'-(3,3-디메틸부트-1-인-1-일)바이페닐-2-일]-5-플루오로-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.11) 3-(디플루오로메틸)-N-(4'-에틸닐바이페닐-2-일)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.12) N-(4'-에틸닐바이페닐-2-일)-5-플루오로-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.13) 2-클로로-N-(4'-에틸닐바이페닐-2-일)피리딘-3-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.14) 2-클로로-N-[4'-(3,3-디메틸부트-1-인-1-일)바이페닐-2-일]피리딘-3-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.15) 4-(디플루오로메틸)-2-메틸-N-[4'-(트리플루오로메틸)바이페닐-2-일]-1,3-티아졸-5-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.16) 5-플루오로-N-[4'-(3-히드록시-3-메틸부트-1-인-1-일)바이페닐-2-일]-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.17) 2-클로로-N-[4'-(3-히드록시-3-메틸부트-1-인-1-일)바이페닐-2-일]피리딘-3-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.18) 3-(디플루오로메틸)-N-[4'-(3-메톡시-3-메틸부트-1-인-1-일)바이페닐-2-일]-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.19) 5-플루오로-N-[4'-(3-메톡시-3-메틸부트-1-인-1-일)바이페닐-2-일]-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.20) 2-클로로-N-[4'-(3-메톡시-3-메틸부트-1-인-1-일)바이페닐-2-일]피리딘-3-카르복사미드 (WO 2004/058723 에서 공지됨), (16.21) (5-브로모-2-메톡시-4-메틸피리딘-3-일)(2,3,4-트리메톡시-6-메틸페닐)메탄 (EP-A 1 559 320 에서 공지됨) 및 (16.22) N-[2-(4-{[3-(4-클로로페닐)프로프-2-인-1-일]옥시}-3-메톡시페닐)에틸]-N2-(메틸술포닐)발린아미드 (220706-93-4).

[0145] 모든 지명된 부류 (1) 내지 (16)의 혼합 파트너들은 이의 작용기가 이를 가능하게 하는 경우, 적합한 염기 또는 산을 가진 염을 임의로 형성할 수 있다.

[0146] 식 (I)의 화합물과 살균제 화합물의 혼합물을 포함하는 본 발명에 따른 조성물은 또한 특히 유리할 수 있다. 적합한 살균제 혼합 파트너의 예는 하기 목록에서 선택될 수 있다: 브로노폴, 디클로로펜, 니트라피린, 니켈 디메틸디티오카르바메이트, 카수가마이신, 옥틸리논, 푸란카르복실산, 옥시테트라시클린, 프로베나졸, 스트렙토마이신, 테클로프탈람, 황산 구리 및 기타 구리 제제.

[0147] 식 (I)의 화합물 및 본 발명에 따른 살진균제 조성물은 식물 또는 농작물의 식물병원성 진균류를 치유적 또는 예방적으로 방제하는데 사용될 수 있다.

[0148] 따라서, 본 발명의 추가 측면에 따라, 식 (I)의 화합물 또는 본 발명에 따른 살진균제 조성물이 종자, 식물에 또는 식물의 과실에, 또는 식물이 성장하고 있거나 성장하기를 바라는 토양에 적용되는 것을 특징으로 하는, 식물 또는 농작물의 식물병원성 진균류를 치유적 또는 예방적으로 방제하는 방법이 제공된다.

[0149] 본 발명에 따른 처리 방법은 번식체, 예컨대 괴경 또는 근경의 치료뿐만 아니라, 종자, 묘목 또는 이식 묘목 및 식물 또는 이식 식물의 처리에 유용할 수 있다. 상기 처리 방법은 뿌리의 처리에도 유용할 수 있다. 본 발명에 따른 처리 방법은 또한 관련 식물의 트렁크, 대 또는 줄기, 잎, 꽃 및 과실과 같은 식물의 지상 부위를 처리하는 데에도 유용할 수 있다.

[0150] 본 발명에 따라, 모든 식물 및 식물 부분이 처리될 수 있다. 식물은 모든 식물 및 식물 집단, 예컨대 바람직하고 비바람직할 야생 식물, 품종 (cultivar) 및 식물 변종 (plant varieties) (식물 변종 또는 식물 육종자의 권리에 의해 보호가능한지 아닌지)을 의미한다. 품종 및 식물 변종이 이계놈 반수체 (double haploid)의 사용, 원형질체 융합, 무작위 및 지정 돌연변이 유발, 분자 또는 유전자 마커에 의하거나 또는 바이오엔지니어

링 및 유전자 공학 방법에 의한 것과 같은 하나 이상의 생명공학적인 방법에 의해 보조 또는 보충될 수 있는 통상적인 번식 및 육종 방법에 의해 수득되는 식물일 수 있다. 식물 부분은 모든 지면 위 및 지면 아래 부분 및 식물의 조직, 예컨대 싹, 잎, 꽃 및 뿌리를 의미하고, 이로써 예를 들어 잎, 줄기, 가지, 꽃, 자실체, 과실 및 종자 뿐만 아니라 뿌리, 구경 및 근경이 나열된다. 농작물 및 식물생장 및 발생 번식체, 예를 들어 깎꽂이 순 (cuttings), 구경, 근경, 러너 (runners) 및 종자는 또한 식물 부분에 속한다.

[0151] 본 발명에 따른 방법에 의해 보호할 수 있는 식물 중에서는, 하기를 언급할 수 있다: 주된 전작물, 예컨대 옥수수, 대두, 목화, 브라시카 오일시드, 예컨대 브라시카 나푸스 (예를 들어 카놀라), 브라시카 라파, B. 준세아 (juncea) (예를 들어 머스터드) 및 브라시카 카리나타, 벼, 밀, 사탕무, 사탕수수, 귀리, 호밀, 보리, 수수, 라이밀, 아마, 포도나무 및 다양한 과실 및 다양한 보타니칼 탁사 (botanical taxa)의 야채, 예컨대 장미과 일종 (예를 들어, 씨 과실 예컨대 사과 및 배, 뿐만 아니라 핵과, 예컨대 살구, 체리, 아몬드 및 복숭아, 장과, 예컨대 딸기), 리베시오이다에 일종 (Ribesioideae sp.), 주글란다세아에 일종 (Juglandaceae sp.), 베툴라세아에 일종 (Betulaceae sp.), 아나카르디아세아에 일종 (Anacardiaceae sp.), 파가세아에 일종 (Fagaceae sp.), 모라세아에 일종 (Moraceae sp.), 올레아세아에 일종 (Oleaceae sp.), 악티니다세아에 일종 (Actinidaceae sp.), 라우라세아에 일종 (Lauraceae sp.), 무사세아에 일종 (Musaceae sp.) (예를 들어 바나나 나무 및 정식 (plantings)), 루비아세아에 일종 (Rubiaceae sp.) (예를 들어 커피), 테아세아에 일종 (Theaceae sp.), 스테르쿨리세아에 일종 (Sterculiaceae sp.), 루타세아에 일종 (Rutaceae sp.) (예를 들어 레몬, 오렌지 및 그레이프프루츠); 솔라나세아에 일종 (Solanaceae sp.) (예를 들어 토마토, 감자, 후추, 가지), 릴리아세아에 일종 (Liliaceae sp.), 콤포시티아에 일종 (Compositae sp.) (예를 들어 상추, 아티초크 및 치커리 - 뿌리 치커리, 엔디브 또는 통상의 치커리 포함), 엄벨리페라에 일종 (Umbelliferae sp.) (예를 들어 당근, 파슬리, 셀러리 및 셀러리액), 큐커비타세아에 일종 (Cucurbitaceae) (예를 들어 오이 - 피클 오이 (pickling cucumber), 스쿼시 (Squash), 수박, 호박 및 멜론 포함), 알리아세아에 일종 (Alliaceae sp.) (예를 들어 양파 및 락), 크루시페라에 일종 (Cruciferae sp.) (예를 들어 화이트 캐비지, 붉은 양배추, 브로콜리, 칼리플라워, 브뤼셀 스프라우트 (brussel sprout), 청경채, 콜라비, 래디쉬 (radish), 서양고추냉이, 크레스 (cress), 배추), 레구미노사에 일종 (예를 들어 땅콩, 완두콩 및 콩 - 예컨대 덩굴성 강낭콩 및 누에콩), 체노포디아세아에 일종 (Chenopodiaceae sp.) (예를 들어 만골드, 근대, 시금치, 비트루트 (beetroot)), 말바세아에 일종 (Malvaceae) (예를 들어 오크라), 아스파라가세아에 일종 (Asparagaceae) (예를 들어 아스파라거스); 원예 및 숲 농작물; 장식용 식물; 뿐만 아니라 상기 농작물의 유전적으로 개질된 동족체.

[0152] 본 발명에 따른 처리 방법은 유전자 변형 유기체 (GMO), 예를 들어 식물 또는 종자 처리에 사용될 수 있다. 유전자 변형 식물 (또는 유전자이식 식물)은 그 식물의 게놈에 이중 유전자가 안정적으로 삽입된 식물이다. "이중 유전자"란 표현은 본질적으로, 식물 외부에서 제공 또는 어셈블링하며, 핵, 엽록체 또는 미토콘드리아 게놈 내에 도입될 때, 형질전환된 식물에, 관심 단백질 또는 폴리펩티드를 발현시키거나, 또는 식물 내 존재하는 기타 유전자(들)를 하향조절 또는 침묵시킴으로써 (예를 들어 안티센스 기술, 공동억제 기술 또는 RNA 간섭 - RNAi - 기술을 이용함), 새롭거나 또는 개선된 작물학적 또는 기타 특성을 제공하는 유전자를 의미한다. 게놈에 위치한 이중 유전자는 또한 이식유전자로 지칭된다. 이의 식물 게놈에서의 특정 위치로 정의되는 이식유전자는 형질전환 또는 유전자이식 이벤트로 불린다.

[0153] 식물 종 또는 식물 품종, 이의 위치 및 성장 조건 (토양, 기후, 식생기간, 식이)에 따라, 본 발명에 따른 처리는 또한 추가산적 (시너지) 효과를 일으킬 수 있다. 따라서, 예를 들어, 감소된 적용비 및/또는 활성 범위의 확대 및/또는 본 발명에 따라 사용될 수 있는 활성 화합물 및 조성물의 활성 증가, 더 나은 식물 성장, 고온 또는 저온에서 증가된 내성, 가뭄 또는 수분 또는 토양염 함량에 대한 증가된 내성, 증가된 개화능, 더욱 용이해진 수확, 촉진된 성장, 더 높은 수확물, 더 커진 과실, 더 커진 식물 높이, 보다 푸르게 된 잎 색, 더 이른 개화, 수확 생산물의 더 높은 품질 및/또는 더 높아진 영양가, 과실에서의 더 높은 당도, 더 나은 저장 안정성 및/또는 수확 생성물의 가공성이 가능하며, 실제로 기대되는 효과를 초과한다.

[0154] 특정 적용비에서, 본 발명에 따른 활성 화합물 조합이 또한 식물에서 강화 효과를 도모할 수 있다. 따라서, 이들은 또한 원하지 않는 미생물의 공격으로부터 식물의 방어 시스템을 작동시키는데 적절하다. 이것은 적절한 경우에, 본 발명에 따른 조합물이, 예를 들어 진균류에 대해 강화된 활성을 갖는 것의 근거 중 하나일 수 있다. 식물-강화 (저항성-유도) 물질이란, 본 문맥에서, 원하지 않는 미생물을 후속해서 접촉할 때, 처리되는 식물이 상기 미생물에 대해 상당한 정도로 저항성을 보이도록 식물의 방어 시스템을 자극시킬 수 있는 물질들 또는 그 물질들의 조합물을 의미하는 것으로 이해된다. 본 경우에서, 원치 않는 미생물은 식물병원성 진균류, 세균 및 바이러스를 의미하는 것으로 이해된다. 따라서, 본 발명에 따른 물질은 처리 후 일정 시간의

기간 내에 상술한 병원체 공격으로부터 식물을 보호하는데 사용될 수 있다. 보호가 시행되는 기간은 활성 화합물로 식물을 처리한 후, 일반적으로 1 내지 10 일, 바람직하게는 1 내지 7 일이다.

[0155] 본 발명에 따라 바람직하게 처리될 식물 및 식물 품종은, (번식 및/또는 생명공학 수단으로 획득되던지 간에) 이들 식물에 특히 이롭고 유용한 형질을 부여하는 유전자 물질을 갖는 모든 식물을 포함한다.

[0156] 본 발명에 따라 바람직하게 처리되는 식물 및 식물 품종은 하나 이상의 생체적 스트레스에 대해 저항성이 있다, 즉 상기 식물은 동물, 및 선충, 곤충, 진드기, 식물병원성 진균류, 세균, 바이러스 및/또는 바이로이드 등의 미생물 해충으로부터 더 나은 방어를 보인다.

[0157] 선충 저항성 식물의 예는 예를 들어 US 특허 출원 번호 11/765,491, 11/765,494, 10/926,819, 10/782,020, 12/032,479, 10/783,417, 10/782,096, 11/657,964, 12/192,904, 11/396,808, 12/166,253, 12/166,239, 12/166,124, 12/166,209, 11/762,886, 12/364,335, 11/763,947, 12/252,453, 12/209,354, 12/491,396 또는 12/497,221 에 기재되어 있다.

[0158] 본 발명에 따라 처리될 수도 있는 식물 및 식물 품종은, 하나 이상의 무생체적 스트레스에 대해 저항성이 있는 식물이다. 무생체적 스트레스 조건에는, 예를 들어 가뭄, 냉온 노출, 열 노출, 삼투압 스트레스, 범람, 증가된 토양 염분, 증가된 미네랄 노출, 오존 노출, 높은 광 노출, 제한된 질소 영양분 이용도, 제한된 인 영양분 이용도, 그늘 회피가 포함될 수 있다.

[0159] 본 발명에 따라 처리될 수도 있는 식물 및 식물 품종은 강화된 수율 특성을 특징으로 하는 식물이다. 상기 식물에서 증가된 수율은, 예를 들어 개선된 식물 생리, 생장 및 발생, 예를 들어 용수 효율, 물 보유 효율, 개선된 질소 이용, 강화된 탄소 동화, 개선된 광합성, 증가된 발아 효율 및 촉진된 성숙의 결과일 수 있다. 수율은 더욱이 개선된 식물 구조 (스트레스 및 스트레스 없는 조건) 에 의해 영향을 받을 수 있는데, 여기에는 이에 제한되는 것은 아니나, 이른 개화, 잡종 종자 생산을 위한 개화 제어, 묘목 활기, 식물 크기, 절간 개수 및 거리, 뿌리 성장, 종자 크기, 과실 크기, 단 (pod) 크기, 단 또는 이삭 개수, 단 또는 이삭 당 종자 개수, 종자 질량, 강화된 종자 속 (filling), 감소된 종자 분산, 감소된 단 열개 및 내도복성이 포함된다. 추가 수율 형질에는 종자 조성물, 예를 들어 탄수화물 함량, 단백질 함량, 오일 함량 및 조성, 영양가, 항-영양 화합물의 감소, 개선된 가공성 및 더 나은 저장 안정성이 포함된다.

[0160] 상기한 형질을 지닌 식물의 예는 표 A 에 비제한적으로 나열되어 있다.

[0161] 본 발명에 따라 처리될 수 있는 식물은 일반적으로 수율, 활기, 건강 및 생체적 및 무생체적 스트레스에 대한 저항성이 더 높은, 잡종 강세 (heterosis) 또는 잡종 활기의 특성을 이미 보이고 있는 잡종 식물이다. 이러한 식물은 전형적으로 근친교배된 웅성-불임 모체 (자성 모체) 를 또 다른 근친교배된 웅성-가임 모체 (웅성 모체) 와 교배함으로써 제조된다. 잡종 종자는 전형적으로 웅성-불임 식물로부터 수확되어 재배자에게 팔린다. 웅성 불임 식물은 때때로 (예를 들어, 옥수수) 용수 절제, 즉 웅성 생식 기관 (또는 웅성 꽃) 의 기계적 제거로 제조될 수 있으나, 더 전형적으로는, 웅성 불임은 식물 게놈에서 유전 결정인자의 결과이다. 이 경우에서 및 특히 종자가 잡종 식물로부터 수확되기에 바람직한 생산물인 경우, 상기는 잡종 식물에서 웅성 생식력의 완전한 회복을 보장하는데 유용하다. 이는 웅성 모체가 웅성 불임에 대해 담당하는 유전적 결정인자를 포함하는 잡종 식물에서 웅성 생식력을 회복할 수 있는 적절한 생식력 회복 유전자를 갖는 것을 보장함으로써 달성될 수 있다. 웅성 불임에 대한 유전적 결정인자는 세포질에 위치할 수 있다. 세포질 웅성 불임성 (CMS) 의 예는 예를 들어 브라시카 종에 기재되어 있다 (WO 92/005251, WO 95/009910, WO 98/27806, WO 05/002324, WO 06/021972 및 US 6,229,072). 그러나, 웅성 불임성의 유전적 결정인자는 또한 핵 게놈에 위치할 수 있다. 웅성 불임 식물은 또한 유전공학 등의 식물 생명공학에 의해 수득될 수 있다. 특히 유용한 웅성 불임 식물의 수득 수단이 WO 89/10396 에 기술되어 있는데, 이에는 예를 들어 바나아제 (barnase) 등의 리보뉴클레아제가 수술에서의 융단층 (tapetum) 세포에서 선택적으로 발현된다. 이때, 생식력이 바스타 (barstar) 등의 리보뉴클레아제 억제제의 융단층 세포에서 발현에 의해 회복될 수 있다 (예를 들어, WO 91/002069).

[0162] 본 발명에 따라 처리될 수 있는 식물 또는 식물 품종 (유전공학 등의 식물 생명공학 방법에 의해 수득함) 은 제초제 내성 식물, 즉 하나 이상의 주어진 제초제에 내성이 있게 만들어진 식물이다. 이러한 식물은 유전자 형질전환 또는 상기의 제초제 내성을 부여하는 돌연변이를 갖는 식물의 선택으로 수득될 수 있다.

[0163] 제초제-저항성 식물은 예를 들어 글리포세이트 (glyphosate)-내성 식물, 즉 제초제 글리포세이트 또는 이의 염에 대해 내성을 갖는 식물이다. 식물은 상이한 수단을 통해 글리포세이트에 대해 내성이 될 수 있다.

예를 들어, 글리포세이트-내성 식물은 효소인 5-에놀피루빌시키페이트-3-포스페이트 신타아제 (EPSPS) 를 인코딩하는 유전자로 그 식물을 형질전환함으로써 취득될 수 있다. 이러한 EPSPS 유전자의 예는, 박테리아 살모넬라 티피무름 (*Salmonella typhimurium*)의 AroA 유전자 (돌연변이체 CT7) (Comai et al., 1983, Science 221, 370-371), 박테리아 아그로박테리움 일종 (*Agrobacterium* sp.)의 CP4 유전자 (Barry et al., 1992, Curr. Topics Plant Physiol 7, 139-145), 페투니아 (*Petunia*) EPSPS (Shah et al., 1986, Science 233, 478-481), 토마토 EPSPS (Gasser et al., 1988, J. Biol. Chem. 263, 4280-4289), 또는 엘루신 (Eleusine) EPSPS (WO 01/66704) 를 인코딩하는 유전자를 들 수 있다. 또한, 이는 예를 들어, EP-A 0837944, WO 00/066746, WO 00/066747 또는 WO 02/026995 에 기술된 바와 같은 돌연변이된 EPSPS 일 수 있다. 글리포세이트-내성 식물은 또한 U.S. 특허 제 5,776,760 호 및 제 5,463,175 호에 기술된 바와 같은 글리포세이트 옥시도-리덕타아제 효소를 인코딩하는 유전자를 발현함으로써 취득될 수 있다. 글리포세이트-내성 식물은 또한 예를 들어 WO 02/36782, WO 03/092360, WO 05/012515 및 WO 07/024782 에 기술된 바와 같은 글리포세이트 아세틸 트랜스퍼라아제 효소를 인코딩하는 유전자를 발현함으로써 취득될 수 있다. 글리포세이트-내성 식물은 또한 예를 들어 WO 01/024615 또는 WO 03/013226 에 기술한 바와 같은 상술한 유전자의 천연 발생 돌연변이를 포함하는 식물을 선택함으로써 취득될 수 있다. 글리포세이트 내성을 부여하는 EPSPS 유전자를 발현하는 식물은 예를 들어 US 특허 출원 번호 11/517,991, 10/739,610, 12/139,408, 12/352,532, 11/312,866, 11/315,678, 12/421,292, 11/400,598, 11/651,752, 11/681,285, 11/605,824, 12/468,205, 11/760,570, 11/762,526, 11/769,327, 11/769,255, 11/943801 또는 12/362,774 에 기재되어 있다. 글리포세이트 내성을 부여하는 기타 유전자, 예컨대 디카르복실라제 (decarboxylase) 유전자를 포함하는 식물은, 예를 들어, US 특허 출원 11/588,811, 11/185,342, 12/364,724, 11/185,560 또는 12/423,926 에 기재되어 있다.

[0164] 기타 제초제 저항성 식물은 예를 들어, 바이알라포스, 포스피노트리신 또는 글루포시네이트 등의 효소 글루타민 신타아제를 억제하는 제초제에 대해 내성인 식물이다. 이러한 식물은 예를 들어 US 특허 출원 번호 11/760,602 에 기재된 억제에 대해 저항적인 돌연변이 글루타민 신타아제 효소 또는 제초제의 독성을 없애는 효소를 발현함으로써 취득할 수 있다. 하나의 상기의 유효한 해독 효소는, 포스피노트리신 아세틸트랜스퍼라아제 (예를 들어, 스트렙토마이세스 종으로부터의 바(bar) 또는 패트 (pat) 단백질) 을 인코딩하는 효소이다. 외인성 포스피노트리신 아세틸트랜스퍼라아제를 발현하는 식물은 예를 들어 U.S. 특허 번호 5,561,236; 5,648,477; 5,646,024; 5,273,894; 5,637,489; 5,276,268; 5,739,082; 5,908,810 및 7,112,665 에 기재되어 있다.

[0165] 추가 제초제-내성 식물은 또한 효소 히드록시페닐피루베이트디옥시게나아제 (HPPD) 를 억제하는 제초제에 대해 내성인 식물이다. 히드록시페닐피루베이트디옥시게나아제는, 파라-히드록시페닐피루베이트 (HPP) 가 호모젠티세이트 (homogentisate) 로 변환되는 반응을 촉매작용하는 효소이다. HPPD-억제제에 내성인 식물은, WO 96/38567, WO 99/24585, WO 99/24586, WO 2009/144079, WO 2002/046387, 또는 US 6,768,044.에서 기술한 바와 같은 천연 발생 저항 HPPD 효소를 인코딩하는 유전자 또는 돌연변이된 또는 키메라 (chimeric) HPPD 효소를 인코딩하는 유전자로 형질전환될 수 있다. HPPD-억제제에 대한 내성은 또한 HPPD-억제제에 의해 천연 HPPD 효소의 억제에도 불구하고 호모젠티세이트를 형성할 수 있는 특정 효소를 인코딩하는 유전자로 식물을 형질전환함으로써 취득할 수 있다. 이러한 식물 및 유전자는 WO 99/34008 및 WO 02/36787 에 기재되어 있다. HPPD 억제제에 대한 식물의 내성은 또한 WO 2004/024928 에 기재된 바와 같이 HPPD-내성 효소를 인코딩하는 유전자에 더하여 프리페네이트 탈수소효소 (PDH) 활성을 갖는 효소를 인코딩하는 유전자로 식물을 형질전환시킴으로써 개선될 수 있다. 추가로, 식물은 이의 계능에 WO 2007/103567 및 WO 2008/150473 에 나타난 CYP450 효소와 같은, HPPD 억제제를 대사작용화 또는 분해시킬 수 있는 효소를 인코딩하는 유전자를 첨가함으로써 HPPD-억제제 제초제에 대해 더욱 내성이 될 수 있다.

[0166] 또한 추가의 제초제 저항성 식물은, 아세토라테이트 신타아제 (ALS) 억제제에 대해 내성을 갖는 식물이다. 공지된 ALS-억제제에는, 예를 들어 술폰일우레아, 이미다졸리논, 트리아졸로피리미딘, 피리미디니옥시(티오)벤조에이트, 및/또는 술폰일아미노카르보닐트리아졸리논 제초제가 포함된다. ALS 효소 (또한 아세토히드록시산 신타아제, AHAS 로도 공지됨) 에서의 상이한 돌연변이들이, 예를 들어 문헌 [Tranel and Wright (2002, Weed Science 50:700-712)] 및 U.S. 특허 5,605,011, 5,378,824, 5,141,870, 및 5,013,659 에서 기술된 바와 같이, 상이한 제초제 및 제초제 군들에 내성을 부여하는 것으로 공지되어 있다. 술폰일우레아-내성 식물 및 이미다졸리논-내성 식물의 제조는 U.S. 특허 5,605,011; 5,013,659; 5,141,870; 5,767,361; 5,731,180; 5,304,732; 4,761,373; 5,331,107; 5,928,937; 및 5,378,824; 및 국제 공보 WO 96/033270 에 기술되어 있다. 기타 이미다졸리논-내성 식물은 또한 예를 들어 WO 2004/040012, WO 2004/106529, WO 2005/020673, WO 2005/093093, WO 2006/007373, WO 2006/015376, WO 2006/024351, 및 WO 2006/060634 에 기술되어 있다.

추가 술포닐우레아- 및 이미다졸리논-내성 식물은 또한 예를 들어 WO 07/024782 및 US 특허 출원 번호 61/288958에 기술되어 있다.

- [0167] 이미다졸리논 및/또는 술포닐우레아에 대해 내성인 기타 식물이, 대두에 대해서는 예를 들어 U.S. 특허 5,084,082 에, 벼에 대해서는 WO 97/41218 에, 사탕무에 대해서는 U.S. 특허 5,773,702 및 WO 99/057965 에, 상추에 대해서는 U.S. 특허 5,198,599 에, 또는 해바라기에 대해서는 WO 01/065922 에 기술된 바와 같이, 유도 돌연변이 생성, 제초제의 존재 하 세포 배양에서의 선별 또는 돌연변이 육종에 의해 획득할 수 있다.
- [0168] 본 발명에 따라 처리될 수도 있는 식물 또는 식물 품종 (유전공학 등의 식물 생명공학 방법으로 획득됨) 은 곤충-저항성 유전자이식 식물이며, 즉 특정한 타겟 곤충에 의한 공격에 대해 저항성을 가진 식물이다. 이러한 식물은 유전자 형질전환 또는 이러한 곤충 저항성을 부여하는 돌연변이를 갖는 식물의 선별에 의해 획득될 수 있다.
- [0169] 본원에서 사용되는 바와 같은 "곤충-저항성 유전자이식 식물" 은 하기를 인코딩하는 코딩 서열을 포함하는 이식 유전자 하나 이상을 함유하는 임의의 식물을 포함한다:
- [0170] 1) 바실러스 투링기엔시스 (*Bacillus thuringiensis*)로부터의 살충 결정 단백질 또는 이의 살충 부위, 예컨대 온라인 http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/) 에서 바실러스 투링기엔시스 독소 명명법에서 Crickmore et al. (2005) 에 의해 업데이트된 [Crickmore et al., 1998, Microbiology and Molecular Biology Reviews, 62: 807-813]에 열거된 살충 결정 단백질 또는 이의 살충 부위, 예를 들어 Cry 단백질 부류 Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1B, Cry1C, Cry1D, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Aa, 또는 Cry3Bb 의 단백질 또는 이의 살충 부위 (예를 들어 EP 1999141 및 WO 2007/107302), 또는 예를 들어 US 특허 출원 번호 12/249,016 에 기재된 바와 같은 합성 유전자에 의해 인코딩된 상기 단백질; 또는
- [0171] 2) 바실러스 투링기엔시스로부터의 결정 단백질, 또는 이의 부위로서, 이는 바실러스 투링기엔시스의 2 차 다른 결정 단백질 또는 이의 부위의 존재 하에서 살충성인 것이며, 예를 들어, Cry34 및 Cry35 결정 단백질로 이루어진 2원성 독소 (Moellenbeck et al. 2001, Nat. Biotechnol. 19: 668-72; Schnepf et al. 2006, Applied Environm. Microbiol. 71, 1765-1774) 또는 Cry1A 또는 Cry1F 단백질 및 Cry2Aa 또는 Cry2Ab 또는 Cry2Ae 단백질로 이루어진 2원성 독소 (US 특허 출원 번호 12/214,022 및 EP 08010791.5)임; 또는
- [0172] 3) 바실러스 투링기엔시스로부터의 상이한 살충 결정 단백질의 부분을 포함하는 잡종 살충 단백질, 예컨대 상기 1)의 단백질의 잡종 또는 상기 2)의 단백질의 잡종, 예를 들어 옥수수 이벤트 MON89034 로 생성된 Cry1A.105 단백질(WO 2007/027777); 또는
- [0173] 4) 상기 1) 내지 3) 중 어느 하나의 단백질, 이때 일부, 특히 1 내지 10개의 아미노 산이 다른 아미노산으로 대체되어, 타겟 곤충 종에 더욱 큰 살충 활성을 획득하고/수득하거나, 영향 받는 타겟 곤충 종의 범위를 확대하고/확대하거나 클로닝 또는 형질전환 동안 인코딩 DNA 로 도입되는 변경으로 인한 것이고, 예컨대 옥수수 이벤트 MON863 또는 MON88017 에서의 Cry3Bb1 단백질, 또는 옥수수 이벤트 MIR604 의 Cry3A 단백질임; 또는
- [0174] 5) 바실러스 투링기엔시스 또는 바실러스 세레우스로부터의 살충 분비 단백질 또는 이의 살충 부위, 예컨대 식물 생장 살충 (VIP) 단백질, 그 목록은:
- [0175] http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html 에 열거되어 있으며, 예를 들어, VIP3Aa 단백질 부류로부터의 단백질임; 또는
- [0176] 6) 바실러스 투링기엔시스 또는 바실러스 세레우스로부터의 분비 단백질로서, 이는 바실러스 투링기엔시스 또는 B. 세레우스로부터의 2차 분비 단백질의 존재 하에 살충이며, 그 예는 VIP1A 및 VIP2A 단백질로 이루어진 2원성 독소 (WO 94/21795)임; 또는
- [0177] 7) 바실러스 투링기엔시스 또는 바실러스 세레우스로부터의 상이한 분비 단백질로부터의 부분을 포함하는 잡종 살충 단백질, 예컨대 상기 1)의 단백질의 잡종 또는 상기 2)의 단백질의 잡종; 또는
- [0178] 8) 상기 5) 내지 7) 중 어느 하나의 단백질로서, 이때 일부, 특히 1 내지 10개의 아미노 산이 다른 아미노산으로 대체되어, 타겟 곤충 종에 더욱 큰 살충 활성을 획득하고/수득하거나, 영향받는 타겟 곤충 종의 범위를 확대하고/확대하거나 (여전히 살충 단백질을 인코딩하면서) 클로닝 또는 형질전환 동안 인코딩 DNA 로 도입되는 변경으로 인한 것이고, 예컨대 목화 이벤트 COT102 에서의 VIP3Aa 단백질임; 또는
- [0179] 9) 바실러스 투링기엔시스 또는 바실러스 세레우스로부터의 분비 단백질로서, 이는 바실러스 투링기엔시스로부터

터의 결정 단백질의 존재 하에 살충이며, 그 예는 VIP3 및 Cry1A 또는 Cry1F 로 이루어진 2원성 독소 (US 특허 출원 번호 61/126083 및 61/195019), 또는 VIP3 단백질 및 Cry2Aa 또는 Cry2Ab 또는 Cry2Ae 단백질로 이루어진 2원성 독소 (US 특허 출원 번호 12/214,022 및 EP 08010791.5)임.

[0180] 10) 상기 9)의 단백질, 이때 일부, 특히 1 내지 10개의 아미노산이 다른 아미노산으로 대체되어 타겟 곤충 종에 대해 더욱 높은 살충 활성을 수득하고/수득하거나 영향받는 타겟 곤충 종의 범위를 확대하고/확대하거나 이는 (여전히 살충 단백질을 인코딩하면서) 클로닝 또는 형질전환 동안 인코딩 DNA 에 도입되는 변경으로 인한 것임.

[0181] 물론, 본원에서 사용되는 바와 같은 곤충-저항성 유전자이식 식물은 또한 상기 부류 1 내지 10 중 어느 하나의 단백질을 인코딩하는 유전자의 조합을 포함하는 임의의 식물을 포함한다. 한 구현예에서, 곤충-저항성 식물은 상기 부류 1 내지 10 의 임의의 하나의 단백질을 인코딩하는 하나 초과와 이식유전자를 포함하여, 상이한 타겟 곤충 종을 겨냥하는 상이한 단백질을 이용하는 경우에 영향을 받는 타겟 곤충 종의 범위를 확대하거나, 또는 동일한 타겟 곤충 종에 대해 살충인 상이한 단백질들, 그러나 작용 모드가 상이한, 예를 들어 곤충내 상이한 수용체 결합 부위에 결합하는 것을 이용함으로써 식물에 대한 곤충 저항성 발생을 지연시킨다.

[0182] 본원에서 사용되는 바와 같은 "곤충-저항성 유전자이식 식물"은 예를 들어 WO 2007/080126, WO 2006/129204, WO 2007/074405, WO 2007/080127 및 WO 2007/035650 에 기재된 바와 같이, 식물 해충에 의한 섭취 시 상기 해충의 성장을 억제하는 2중가닥 RNA 를 발현시 생성하는 서열을 포함하는 하나 이상의 이식 유전자를 함유하는 임의의 식물을 추가로 포함한다.

[0183] 본 발명에 따라 처리될 수도 있는 식물 또는 식물 품종 (유전자 공학 등의 식물 생명공학 방법으로 수득함) 은, 무생체적 스트레스에 내성이 있다. 이러한 식물은 유전자 형질전환, 또는 이러한 스트레스 저항성을 부여하는 돌연변이를 포함하는 식물의 선택에 의해 수득될 수 있다. 특히 유용한 스트레스 내성 식물로는 하기를 들 수 있다:

[0184] 1) WO 00/04173, WO2006/045633, EP 04077984.5, 또는 EP 06009836.5 에 기술된 바와 같은 식물 세포 또는 식물에서 폴리(ADP-리보오스)폴리머라아제 (PARP) 유전자의 활성 및/또는 발현을 감소시킬 수 있는 이식 유전자를 함유하는 식물.

[0185] 2) 예를 들어, WO 2004/090140 에 기술된 바와 같은 식물 또는 식물 세포의 유전자를 인코딩하는 PARG 의 발현 및/또는 활성을 감소시킬 수 있는 스트레스 내성 강화 이식 유전자를 포함하는 식물.

[0186] 3) 예를 들어, EP 04077624.7, WO 2006/133827, PCT/EP07/002433, EP 1999263, 또는 WO 2007/107326 에 기술한 바와 같은, 니코틴아미다아제, 니코티네이트 포스포리보실트랜스퍼라아제, 니코틴산 모노뉴클레오티드 아데닐 트랜스퍼라아제, 니코틴아미드 아데닌 디뉴클레오티드 신테타제 또는 니코틴 아미드 포스포리보실트랜스퍼라아제를 비롯한 니코틴아미드 아데닌 디뉴클레오티드 재이용 (salvage) 합성 경로의 식물-기능 효소를 코딩하는, 스트레스 내성 강화 이식 유전자를 함유하는 식물.

[0187] 본 발명에 따라 처리될 수도 있는 식물 또는 식물 품종 (유전자 공학 등의 식물 생명공학방법으로 수득함) 은, 수확한 생성물의 변경된 양, 품질 및/또는 저장-안정성, 및/또는 하기와 같은 수확한 생성물의 특정 성분의 변경된 특성을 보인다:

[0188] 1) 개질된 전분을 합성하는 유전자이식 식물로, 이의 물리-화학적 특성에 있어서, 특히 아밀로오스 함량 또는 아밀로오스/아밀로펙틴 비율에 있어서, 분지화도, 평균 사슬 길이, 측쇄 분포, 점도 거동, 겔화 강도, 전분 곡식 크기 및/또는 전분 곡식 형태가 야생형 식물 세포 또는 식물 내 합성 전분과 비교시 바뀌어져, 이는 특정 적용에서는 더 적합하다. 상기 개질 전분을 합성하는 유전자이식 식물은 예를 들어, EP 0571427, WO 95/04826, EP 0719338, WO 96/15248, WO 96/19581, WO 96/27674, WO 97/11188, WO 97/26362, WO 97/32985, WO 97/42328, WO 97/44472, WO 97/45545, WO 98/27212, WO 98/40503, WO99/58688, WO 99/58690, WO 99/58654, WO 00/08184, WO 00/08185, WO 00/08175, WO 00/28052, WO 00/77229, WO 01/12782, WO 01/12826, WO 02/101059, WO 03/071860, WO 2004/056999, WO 2005/030942, WO 2005/030941, WO 2005/095632, WO 2005/095617, WO 2005/095619, WO 2005/095618, WO 2005/123927, WO 2006/018319, WO 2006/103107, WO 2006/108702, WO 2007/009823, WO 00/22140, WO 2006/063862, WO 2006/072603, WO 02/034923, EP 06090134.5, EP 06090228.5, EP 06090227.7, EP 07090007.1, EP 07090009.7, WO 01/14569, WO 02/79410, WO 03/33540, WO 2004/078983, WO 01/19975, WO 95/26407, WO 96/34968, WO 98/20145, WO 99/12950, WO 99/66050, WO 99/53072, US 6,734,341, WO 00/11192, WO 98/22604, WO 98/32326, WO 01/98509, WO 01/98509, WO 2005/002359, US 5,824,790, US 6,013,861, WO 94/04693, WO 94/09144, WO 94/11520, WO 95/35026, WO 97/20936 에 개시되어 있다

- [0189] 2) 유전자 변형 없는 야생형 식물과 비교할 때 변경된 특성을 지닌 비(非) 전분 탄수화물 중합체를 합성하거나, 또는 비(非) 전분 탄수화물 중합체를 합성하는 유전자이식 식물. 이 예는, EP 0663956, WO 96/01904, WO 96/21023, WO 98/39460, 및 WO 99/24593 에 개시된 바와 같은 폴리푸럭토오스, 특히 이눌린 및 레반-형의 것을 생산하는 식물, WO 95/31553, US 2002/031826, US 6,284,479, US 5,712,107, WO 97/47806, WO 97/47807, WO 97/47808 및 WO 00/14249 에 개시된 바와 같은 알파-1,4-글루칸을 생산하는 식물, WO 00/73422 에 개시된 바와 같은 알파-1,6 분지화 알파-1,4-글루칸을 생산하는 식물, 예를 들어, WO 00/047727, O 00/73422, EP 06077301.7, US 5,908,975 및 EP 0728213 에 개시된 바와 같은 알테르난을 생산하는 식물이다,
- [0190] 3) 예를 들어, WO 2006/032538, WO 2007/039314, WO 2007/039315, WO 2007/039316, JP 2006/304779, 및 WO 2005/012529 에 개시된 바와 같은 히알루로난을 생산하는 유전자이식 식물,
- [0191] 4) 유전자이식 식물 또는 잡종 식물, 예컨대 US 특허 출원 번호 12/020,360 및 61/054,026 에 기술된 바와 같은 '고 가용성 고체 함량', '낮은 정도의 매운 맛' (LP) 및/또는 '장기간 저장' (LS)과 같은 특성을 지닌 양파.
- [0192] 본 발명에 따라 처리될 수도 있는 식물 또는 식물 품종 (유전자 공학 등의 식물 생명공학 방법으로 수득할 수 있음) 은, 변경된 섬유 특징을 갖는 목화 식물과 같은 식물이다. 이러한 식물은 유전자 형질전환, 또는 이러한 변경된 섬유 특성을 부여하는 돌연변이를 함유하는 식물 선택에 의해 수득할 수 있고, 이에 하기가 포함된다:
- [0193] a) 식물, 예컨대 목화 식물, WO 98/000549 에 기술된 바와 같은 셀룰로오스 신타아제 유전자의 변경된 형태를 포함함,
- [0194] b) 식물, 예컨대 목화 식물, WO 2004/053219 에 기술된 바와 같은 rsw2 또는 rsw3 상동체 핵산의 변경된 형태를 포함함,
- [0195] c) 식물, 예컨대 목화 식물, WO 01/17333 에 기술된 바와 같은 수크로오스 포스페이트 신타아제의 발현이 증가됨,
- [0196] d) 식물, 예컨대 목화 식물, WO 02/45485 에 기술된 바와 같은 수크로오스 신타아제의 발현이 증가됨,
- [0197] e) 식물, 예컨대 목화 식물, 이때 WO 2005/017157 에 기술된 바와 같이 또는 EP 08075514.3 또는 US 특허 출원 번호 61/128,938 에 기술된 바와 같이, 섬유 세포를 기초로 하는 플라스모데스마타 게이팅 (gating) 타이밍이, 예를 들어 섬유-선택적- β -1,3-글루카나아제의 하향조절을 통해 변경됨,
- [0198] f) 식물, 예컨대 목화 식물, WO 2006/136351 에 기술된 바와 같이 예를 들어 nodC 및 키틴 신타아제 유전자를 비롯한 N-아세틸글루코사민트랜스퍼라아제 유전자의 발현을 통해, 반응성이 변경된 섬유를 가짐.
- [0199] 본 발명에 따라 처리될 수도 있는 식물 또는 식물 품종 (유전자 공학 등의 식물 생명공학 방법으로 수득할 수 있음) 은, 변경된 오일 프로파일 특성을 가진 평지씨 또는 관련 브라시카 (brassica) 식물과 같은 식물이다. 이러한 식물은 유전자 형질전환에 의해, 또는 상기의 변경된 오일 프로파일 특성을 부여하는 돌연변이를 함유하는 식물의 선택에 의해 수득될 수 있으며, 이에 하기가 포함된다:
- [0200] a) 식물, 예컨대 평지씨 식물, 예를 들어, US 5,969,169, US 5,840,946 또는 US 6,323,392 또는 US 6,063,947 에 기술된 바와 같은 고 올레산 함량을 갖는 오일을 생산함,
- [0201] b) 식물, 예컨대 평지씨 식물, US 6,270,828, US 6,169,190 또는 US 5,965,755 에 기술된 바와 같은 저 리놀렌산 함량을 갖는 오일을 생산함,
- [0202] c) 식물, 예컨대 평지씨 식물, 예를 들어, US 특허 번호 5,434,283 또는 US 특허 출원 번호 12/668303 에 기술된 바와 같은 저 수준의 포화 지방산을 갖는 오일을 생산함.
- [0203] 본 발명에 따라 또한 처리될 수 있는 식물 또는 식물 품종 (식물 생명공학 방법, 예컨대 유전자 공학에 의해 수득가능함)은 변경된 종자 탈립 특성을 지닌 평지씨 또는 관련 브라시카 식물과 같은 식물이다. 상기 식물은 유전자 형질전환에 의해, 또는 상기 변경된 종자 탈립 특성을 부여하는 돌연변이를 함유하는 식물의 선택에 의해 수득될 수 있고, US 특허 출원 번호 61/135,230, W009/068313 및 W010/006732 에 기재된 바와 같은 지연 또는 감소된 종자 탈립을 지닌 평지씨 식물과 같은 식물을 포함한다.
- [0204] 본 발명에 따라 처리될 수 있는 특히 유용한 유전자이식 식물은 미국 농무부 (United States Department of Agriculture, USDA)의 미국동식물검역소 (Animal and Plant Health Inspection Service, APHIS)에서 미국의 비

규제품목 대상인 (상기 품목이 승인되거나 또는 여전히 계류중이든지), 형질전환 이벤트, 또는 형질전환 이벤트의 조합을 함유하는 식물이다. 언제라도 상기 정보는 APHIS (4700 River Road Riverdale, MD 20737, USA)로부터, 예를 들어 그 인터넷 사이트 (URL http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html)에서 용이하게 입수가 가능하다. 이러한 신청의 청구일에, APHIS 에 의해 승인되거나 또는 APHIS 에 계류되어 있는 비규제 품목은 하기 정보를 함유하는 표 B 에 나열된 것이었다:

- [0205] - 품목 (Petition): 품목의 식별 번호 (identification number). 형질전환 이벤트의 기술적 설명은 APHIS, 예를 들어 APHIS 웹사이트에서 수득가능한 개별 품목 서류에서 이러한 품목 번호를 참고하여 찾을 수 있다. 이러한 설명은 본원에서 참고로 포함되어 있다.
- [0206] - 품목의 확대 (Extension of Petition): 선행 품목에 대한 참고로서, 이에 대해 확대가 요청되는 것.
- [0207] - 기관 : 품목을 제출하는 단체의 명칭.
- [0208] - 규제 물품 : 관련된 식물 중.
- [0209] - 유전자 이식 표현형 : 형질전환 이벤트에 의해 식물에 부여된 형질.
- [0210] - 형질변환 이벤트 또는 계통 : 비규제 상태가 요청된 이벤트 또는 이벤트들 (또한 계통 또는 계통들로서 지정되는 경우도 있음)의 명칭.
- [0211] - APHIS 문서 : 품목 관련하여 APHIS 에 의해 공개된 다양한 문서로서 APHIS 에 요청될 수 있는 것.
- [0212] 단일 형질전환 이벤트 또는 형질전환 이벤트의 조합을 함유하는 추가의 특히 유용한 식물은 예를 들어 다양한 국가 또는 지역 규제 기구로부터의 데이터베이스 (예를 들어 http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx 및 <http://www.agbios.com/dbase.php> 참조)에 나열되어 있다.
- [0213] 추가로 특히 유전자이식 식물은 표 C 에 나열된 임의 특허 공보 중 하나에 기재된 바와 같은 작물학적으로 중성 또는 유익한 위치에 이식 유전자를 함유하는 식물들을 포함한다.

표 A

형질	참고문헌	
용수 효율	WO 2000/073475	
절소 이용 효율	WO 1995/009911	WO 2007/076115
	WO 1997/030163	WO 2005/103270
	WO 2007/092704	WO 2002/002776
개선된 광합성	WO 2008/056915	WO 2004/101751
선충 저항성	WO 1995/020669	WO 2003/033651
	WO 2001/051627	WO 1999/060141
	WO 2008/139334	WO 1998/012335
	WO 2008/095972	WO 1996/030517
	WO 2006/085966	WO 1993/018170
감소된 개협	WO 2006/009649	WO 1997/013865
	WO 2004/113542	WO 1996/030529
	WO 1999/015680	WO 1994/023043
	WO 1999/000502	
	WO 2006/125065	WO 2008/067043
진딧물 저항성	WO 1997/046080	WO 2004/072109
	WO 2006/135717	WO 2005/000007
스클레로티니아 저항성 (Sclerotinia resistance)	WO 2006/055851	WO 2002/099385
	WO 2005/090578	WO 2002/061043
보트리티스 저항성 (Botrytis resistance)	WO 2006/046861	WO 2002/085105
브레미아 저항성 (Bremia resistance)	US 20070022496	WO 2004/049786
	WO 2000/063432	
에르위니아 저항성 (Erwinia resistance)	WO 2004/049786	
클로스테로바이러스 저항성 (Closterovirus resistance)	WO 2007/073167	WO 2002/022836
	WO 2007/053015	
스트레스 내성 (내건성 포함)	WO 2010/019838	WO2008/002480
	WO 2009/049110	WO2005/033318
	WO 2006/038794	
토마모바이러스 저항성 (Tobamovirus resistance)		

[0214]

[0215] 표 B

2010 년 3 월 31 일자 이후로 APHIS 에 의해 승인되거나 또는 계류중인 비규제 품목 (Petitions of Nonregulated Status) 주: 더 이상 규제되지 않는 농작물 (Crops No longer Regulated)의 가장 최신 리스트를 얻기 위해서는, 품목 현황을 보시오. 이러한 리스트는 자동적으로 업데이트되며, 계류중이거나, 철회되거나 또는 승인된 품목을 포함하는, APHIS 가 최근까지 수령한 모든 품목을 반영한다. 약어: CMV-오이 모자이크 바이러스 (cucumber mosaic virus); CPB-콜로라도 감자 잎벌레 (colorado potato beetle); PLRV- 감자잎말림 바이러스 (potato leafroll virus); PRSV-파파야 링스팟 바이러스 (papaya ringspot virus); PVY-감자 바이러스 Y (potato virus Y); WMV2- 수박 모자이크 바이러스 2 (watermelon mosaic virus 2) ZYMV-호박 황색 모자이크 바이러스 (zucchini yellow mosaic virus)

[0216]

계류 중인 비규제 품목 (Petitions for Nonregulated Status Pending)					
신청 서류					
품목	품목 번호의 확대 ***	기관	규제 물품	유전자 이식 표현형	형질변환 이벤트 또는 계통 (Transformation Event or Line)
10-070-01p		Virginia Tech	땅콩	스클레로티니아 블라이트 (Sclerotinia blight) 저항성	N70, P39, 및 W171
09-349-01p		Dow AgroSciences	대두	제초제 내성	DAS-68416-4
09-328-01p		Bayer Crop Science	대두	제초제 내성	FG72
09-233-01p		Dow	옥수수	제초제 내성	DAS-40278-9
09-201-01p		Monsanto	대두		MON-87705-6
09-183-01p		Monsanto	대두		MON-87769
09-082-01p		Monsanto	대두	레피도프테란 (Lepidopteran) 저항성	MON 87701
09-063-01p		Stine Seed	옥수수	글리포세이트 내성	HCEM485
09-055-01p		Monsanto	옥수수	건내성	MON 87460
09-015-01p		BASF Plant Science, LLC	대두	제초제 내성	BPS-CV127-9 Soybean
08-366-01p		ArborGen	유칼립투스	내동결성, 생식력 변경	ARB-FTE1-08
08-340-01p		Bayer	목화	글루포시네이트 내성, 곤충 저항성	T304-40XGHB119
08-338-01p		Pioneer	옥수수	용성 불인, 생식력 회복, 시각 마커	DP-32138-1
08-315-01p		Florigene	장미	화초 색상 변경	IFD-52401-4 및 IFD-52901-9
07-253-01p		Syngenta	옥수수	레피도프테란 저항성	MIR-162 Maize
07-108-01p		Syngenta	목화	레피도프테란 저항성	COT67B
06-354-01p		Pioneer	대두	고 올레산	DP-305423-1
05-280-01p		Syngenta	옥수수	열안정성 알파-아밀라아제	3272
04-110-01p		Monsanto & Forage Genetics	알파파	글리포세이트 내성	J101, J163
03-104-01p		Monsanto & Scotts	크리핑 벤트그래스	글리포세이트 내성	ASR368

[0217]

승인된 비규제 품목 (Petitions for Nonregulated Status Granted)					
신청 서류					
품목	품목 번호의 확대 ***	기관	규제 물품	유전자 이식 표현형	형질변환 이벤트 또는 계통
07-152-01p		Pioneer	옥수수	글리포세이트 & 이미다졸리논 내성	DP-098140-6
04-337-01p		University of Florida	파파야	파파야 링스팟 바이러스 저항성	X17-2
06-332-01p		Bayer CropScience	목화	글리포세이트 내성	GHB614
06-298-01p		Monsanto	옥수수	유럽 옥수수 보러 (European Corn Borer) 저항성	MON 89034
06-271-01p		Pioneer	대두	글리포세이트 & 아세트락테이트 신타아제 내성	356043 (DP-356043-5)
06-234-01p	98-329-01p	Bayer CropScience	벼	포스피노트리신 내성	LLRice 601
06-178-01p		Monsanto	대두	글리포세이트 내성	MON 89788
04-362-01p		Syngenta	옥수수	보호된 옥수수 루트웜 (Corn Rootworm)	MIR604
04-264-01p		ARS	자두	플럼 폭스 바이러스 (Plum Pox Virus) 저항성	C5
04-229-01p		Monsanto	옥수수	고 리신	LY038
04-125-01p		Monsanto	옥수수	옥수수 루트웜 저항성	88017
04-086-01p		Monsanto	목화	글리포세이트 내성	MON 88913
03-353-01p		Dow	옥수수	옥수수 루트웜 저항성	59122
03-323-01p		Monsanto	사탕무	글리포세이트 내성	H7-1
03-181-01p	00-136-01p	Dow	옥수수	레피도프테란 저항성 & 포스피노트리신 내성	TC-6275
03-155-01p		Syngenta	목화	레피도프테란 저항성	COT 102
03-036-01p		Mycogen/Dow	목화	레피도프테란 저항성	281-24-236
03-036-02p		Mycogen/Dow	목화	레피도프테란 저항성	3006-210-23

[0218]

02-042-01p		Aventis	목화	포스피노테리신 내성	LLCotton25
01-324-01p	98-216-01p	Monsanto	평지씨	글리포세이트 내성	RT200
01-206-01p	98-278-01p	Aventis	평지씨	포스피노트리신 내성 & 수분 제어 (pollination control)	MS1 & RF1/RF2
01-206-02p	97-205-01p	Aventis	평지씨	포스피노트리신 내성	Topas 19/2
01-137-01p		Monsanto	옥수수	옥수수 루트웜 저항성	MON 863
01-121-01p		Vector	담배	감소된 니코틴	Vector 21-41
00-342-01p		Monsanto	목화	레피도프테란 저항성	Cotton Event 15985
00-136-01p		Mycogen c/o Dow & Pioneer	옥수수	레피도프테란 저항성 포스피노트리신 내성	Line 1507
00-011-01p	97-099-01p	Monsanto	옥수수	글리포세이트 내성	NK603
99-173-01p	97-204-01p	Monsanto	감자	PLRV & CPB 저항성	RBMT22-82
98-349-01p	95-228-01p	AgrEvo	옥수수	포스피노트리신 내성 및 웅성 불임	MS6
98-335-01p		U. of Saskatchewan	아마	숯포닐 우레아 제조제의 토양 잔류물에 대한 내성	CDC Triffid
98-329-01p		AgrEvo	벼	포스피노트리신 내성	LL Rice 06, LL Rice 62
98-278-01p		AgrEvo	평지씨	포스피노트리신 내성 & 수분 제어	MS8 & RF3
98-238-01p		AgrEvo	대두	포스피노트리신 내성	GU262
98-216-01p		Monsanto	평지씨	글리포세이트 내성	RT73
98-173-01p		Novartis Seeds & Monsanto	비트	글리포세이트 내성	GTSB77
98-014-01p	96-068-01p	AgrEvo	대두	포스피노트리신 내성	A5547-127
97-342-01p		Pioneer	옥수수	웅성 불임 & 포스피노트리신 내성	676, 678, 680
97-339-01p		Monsanto	감자	CPB & PVY 저항성	RBMT15-101, SEMT15-02, SEMT15-15
97-336-01p		AgrEvo	비트	포스피노트리신 내성	T-120-7
97-287-01p		Monsanto	토마토	레피도프테란 저항성	5345
97-265-01p		AgrEvo	옥수수	포스피노트리신 내성 & Lep. 저항성	CBH-351
97-205-01p		AgrEvo	평지씨	포스피노트리신 내성	T45
97-204-		Monsanto	감자	CPB & PLRV 저항성	RBMT21-129 &

[0219]

01p					RBMT21-350
97-148-01p		Bejo	치커리	웅성 불임	RM3-3, RM3-4, RM3-6
97-099-01p		Monsanto	옥수수	글리포세이트 내성	GA21
97-013-01p		Calgene	목화	브로복시닐 내성 & 레피도프테란 저항성	Events 31807 & 31808
97-008-01p		Du Pont	대두	오일 프로파일 변경	G94-1, G94-19, G-168
96-317-01p		Monsanto	옥수수	글리포세이트 내성 & ECB 저항성	MON802
96-291-01p		DeKalb	옥수수	유럽 옥수수 보러 저항성	DBT418
96-248-01p	92-196-01p	Calgene	토마토	과일 숙성 변경	1 개의 추가적인 FLAVRSAVR 계통
96-068-01p		AgrEvo	대두	포스피노트리신 내성	W62, W98, A2704-12, A2704-21, A5547-35
96-051-01p		Cornell U	파파야	PRSV 저항성	55-1, 63-1
96-017-01p	95-093-01p	Monsanto	옥수수	유럽 옥수수 보러 저항성	MON809 & MON810
95-352-01p		Asgrow	스쿼시 (Squash)	CMV, ZYMV, WMV2 저항성	CZW-3
95-338-01p		Monsanto	감자	CPB 저항성	SBT02-5 & -7, ATBT04-6 & -27, -30, -31, -36
95-324-01p		Agritope	토마토	과일 숙성 변경	35 1 N
95-256-01p		Du Pont	목화	솔포닐우레아 내성	19-51a
95-228-01p		Plant Genetic Systems	옥수수	웅성 불임	MS3
95-195-01p		Northrup King	옥수수	유럽 옥수수 보러 저항성	Bt11
95-179-01p	92-196-01p	Calgene	토마토	과일 숙성 변경	2 개의 추가적인 FLAVRSAVR 계통
95-145-01p		DeKalb	옥수수	포스피노트리신 내성	B16
95-093-01p		Monsanto	옥수수	레피도프테란 저항성	MON 80100
95-053-01p		Monsanto	토마토	과일 숙성 변경	8338
95-045-01p		Monsanto	목화	글리포세이트 내성	1445, 1698
95-030-01p	92-196-01p	Calgene	토마토	과일 숙성 변경	20 개의 추가적인 FLAVRSAVR 계통

[0220]

94-357-01p		AgrEvo	옥수수	포스포노트리신 내성	T14, T25
94-319-01p		Ciba Seeds	옥수수	레피도프테란 저항성	Event 176
94-308-01p		Monsanto	목화	레피도프테란 저항성	531, 757, 1076
94-290-01p		Zeneca & Petoseed	토마토	과실 폴리갈락투로나제 수준 감소	B, Da, F
94-257-01p		Monsanto	감자	콜레오포테란 저항성	BT6, BT10, BT12, BT16, BT17, BT18, BT23
94-230-01p	92-196-01p	Calgene	토마토	과실 숙성 변경	9 개의 추가적인 FLAVRSAVR 계통
94-228-01p		DNA Plant Tech	토마토	과실 숙성 변경	1345-4
94-227-01p	92-196-01p	Calgene	토마토	과실 숙성 변경	Line N73 1436-111
94-090-01p		Calgene	평지씨	오일 프로파일 변경	pCGN3828-212/86- 18 & 23
93-258-01p		Monsanto	대두	글리포세이트 내성	40-3-2
93-196-01p		Calgene	목화	브로독시닐 내성	BXN
92-204-01p		Upjohn	스쿼시	WMV2 & ZYMV 저항성	ZW-20
92-196-01p		Calgene	토마토	과실 숙성 변경	FLAVR SAVR
*** 품목 번호의 확대: 7CFR 340.6(e) 하에 개인은 APHIS 가 선행 규제완화 물품의 그 유사성을 기반으로 하여 다른 유기체로 비규제 상태의 결정을 확대하는 것을 요구할 수 있다. 이러한 결정은 규제완화 물품의 선행 승인된 품목을 나열한다. **** 예비 EA: 최종 승인 이전에 퍼플릭 코멘트가 처음 가능한 환경 평가.					

[0221]

표 C

식물 종	이벤트	형질	특허 참고문헌
옥수수	PV-ZMGT32 (NK603)	글리포세이트 내성	US 2007-056056
옥수수	MIR604	곤충 저항성 (Cry3a055)	EP 1 737 290
옥수수	LY038	고 리신 함량	US 7,157,281
옥수수	3272	셀프 프로세싱 (Self processing) 옥수수 (알파-아밀라아제)	US 2006-230473
옥수수	PV-ZMIR13 (MON863)	곤충 저항성 (Cry3Bb)	US 2006-095986
옥수수	DAS-59122-7	곤충 저항성 (Cry34Ab1/Cry35Ab1)	US 2006-070139
옥수수	TC1507	곤충 저항성 (Cry1F)	US 7,435,807
옥수수	MON810	곤충 저항성 (Cry1Ab)	US 2004-180373
옥수수	VIP1034	곤충 저항성	WO 03/052073
옥수수	B16	글루포시네이트 저항성	US 2003-126634
옥수수	GA21	글리포세이트 저항성	US 6,040,497
옥수수	GG25	글리포세이트 저항성	US 6,040,497
옥수수	GJ11	글리포세이트 저항성	US 6,040,497

[0222]

옥수수	FI117	글리포세이트 저항성	US 6,040,497
옥수수	GAT-ZM1	글루포시네이트 내성	WO 01/51654
옥수수	MON87460	내건성	WO 2009/111263
옥수수	DP-098140-6	글리포세이트 내성 / ALS 억제제 내성	WO 2008/112019
밀	Event 1	푸사리움 저항성 (트리코테센 3-O-아세틸트랜스퍼라제)	CA 2561992
사탕무	T227-1	글리포세이트 내성	US 2004-117870
사탕무	H7-1	글리포세이트 내성	WO 2004-074492
대두	MON89788	글리포세이트 내성	US 2006-282915
대두	A2704-12	글루포시네이트 내성	WO 2006/108674
대두	A5547-35	글루포시네이트 내성	WO 2006/108675
대두	DP-305423-1	고 올레산 / ALS 억제제 내성	WO 2008/054747
벼	GAT-OS2	글루포시네이트 내성	WO 01/83818
벼	GAT-OS3	글루포시네이트 내성	US 2008-289060
벼	PE-7	곤충 저항성 (Cry1Ac)	WO 2008/114282
평지씨	MS-B2	웅성 불임	WO 01/31042
평지씨	MS-BN1/RF-BN1	웅성 불임/회복	WO 01/41558
평지씨	RT73	글리포세이트 저항성	WO 02/36831
목화	CE43-67B	곤충 저항성 (Cry1Ab)	WO 2006/128573
목화	CE46-02A	곤충 저항성 (Cry1Ab)	WO 2006/128572
목화	CE44-69D	곤충 저항성 (Cry1Ab)	WO 2006/128571
목화	1143-14A	곤충 저항성 (Cry1Ab)	WO 2006/128569
목화	1143-51B	곤충 저항성 (Cry1Ab)	WO 2006/128570
목화	T342-142	곤충 저항성 (Cry1Ab)	WO 2006/128568
목화	event3006-210-23	곤충 저항성 (Cry1Ac)	WO 2005/103266
목화	PV-GHGT07 (1445)	글리포세이트 내성	US 2004-148666
목화	MON88913	글리포세이트 내성	WO 2004/072235
목화	EE-GH3	글리포세이트 내성	WO 2007/017186
목화	T304-40	곤충-저항성 (Cry1Ab)	WO2008/122406
목화	Cot202	곤충 저항성 (VIP3)	US 2007-067868
목화	LLCotton25	글루포시네이트 저항성	WO 2007/017186
목화	EE-GH5	곤충 저항성 (Cry1Ab)	WO 2008/122406
목화	event 281-24-236	곤충 저항성 (Cry1F)	WO 2005/103266
목화	Cot102	곤충 저항성 (Vip3A)	US 2006-130175
목화	MON 15985	곤충 저항성 (Cry1A/Cry2Ab)	US 2004-250317
벤트 그라스	Asr-368	글리포세이트 내성	US 2006-162007
가지	EE-1	곤충 저항성 (Cry1Ac)	WO 2007/091277

[0223]

[0224] 본 발명에 따른 방법에 의해 방제될 수 있는 식물 또는 농작물의 질환 중에서는, 하기를 언급할 수 있다:

[0225] · 흰가루병 (powdery mildew disease), 예컨대:

[0226] 예를 들어, 블루메리아 그라미니스 (*Blumeria graminis*) 에 기인한 블루메리아 (*Blumeria*) 질환;

[0227] 예를 들어, 포도스페라 류코트리차 (*Podosphaera leucotricha*) 에 기인한 포도스페라 (*Podosphaera*) 질환;

[0228] 예를 들어, 스페로테카 풀리기네아 (*Sphaerotheca fuliginea*) 에 기인한 스페로테카 (*Sphaerotheca*) 질환;

[0229] 예를 들어, 운시놀라 네카토르 (*Uncinula necator*) 에 기인한 운시놀라 (*Uncinula*) 질환;

[0230] · 녹병 (Rust disease), 예컨대:

[0231] 예를 들어, 겐노스포란지움 사비네 (*Gymnosporangium sabinae*) 에 기인한 겐노스포란지움 (*Gymnosporangium*) 질환;

[0232] 예를 들어, 헤밀레이아 바스타트릭스 (*Hemileia vastatrix*) 에 기인한 헤밀레이아 (*Hemileia*) 질환;

[0233] 예를 들어, 파코프소라 파치리지 (*Phakopsora pachyrhizi*) 또는 파코프소라 메이보미에 (*Phakopsora meibomiae*) 에 기인한 파코프소라 (*Phakopsora*) 질환;

[0234] 예를 들어, 푸시니아 레콘디타 (*Puccinia recondita*), 푸시니아 그라미니스 (*Puccinia graminis*) 또는 푸시니아 스트리포르미스 (*Puccinia striiformis*)에 기인한 푸시니아 (*Puccinia*) 질환;

[0235] 예를 들어, 우로마이세스 아펜디쿨라투스 (*Uromyces appendiculatus*) 에 기인한 우로마이세스 (*Uromyces*) 질환;

[0236] · 난균류 (Oomycete) 질환, 예컨대:

[0237] 예를 들어, 알부고 칸디다 (*Albugo candida*)에 기인한 알부고 (*Albugo*) 질환;

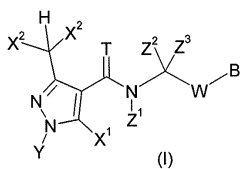
[0238] 예를 들어, 브레미아 락투cae (*Bremia lactucae*) 에 기인한 브레미아 (*Bremia*) 질환;

- [0239] 예를 들어, 페로노스포라 피시 (*Peronospora pisi*) 또는 *P. 브라시cae* (*P. brassicae*) 에 기인한 페로노스포라 (*Peronospora*) 질환;
- [0240] 예를 들어, 피토프토라 인페스탄스 (*Phytophthora infestans*) 에 기인한 피토프토라 (*Phytophthora*) 질환;
- [0241] 예를 들어, 플라스모파라 비티콜라 (*Plasmopara viticola*) 에 기인한 플라스모파라 (*Plasmopara*) 질환;
- [0242] 예를 들어, 슈도페로노스포라 후물리 (*Pseudoperonospora humuli*) 또는 슈도페로노스포라 쿠벤시스 (*Pseudoperonospora cubensis*) 에 기인한 슈도페로노스포라 (*Pseudoperonospora*) 질환;
- [0243] 예를 들어, 피티움 울티무 (*Pythium ultimum*) 에 기인한 피티움 (*Pythium*) 질환;
- [0244] · 반점병 (leafspot), 점무늬병 (leaf blotch) 및 겹무늬병, 예컨대:
- [0245] 예를 들어, 알테르나리아 솔라니 (*Alternaria solani*) 에 기인한 알테르나리아 (*Alternaria*) 질환;
- [0246] 예를 들어, 세르코스포라 베티콜라 (*Cercospora beticola*) 에 기인한 세르코스포라 (*Cercospora*) 질환;
- [0247] 예를 들어, 클라디오스포리움 쿠쿠머리눔 (*Cladosporium cucumerinum*) 에 기인한 클라디오스포리움 (*Cladosporium*) 질환;
- [0248] 예를 들어, 코칠리오볼루스 사티부스 (*Cochliobolus sativus*) (분생자형: 드레크슬레라 (*Drechslera*), 동의어: 헬민토스포리움 (*Helminthosporium*)) 또는 코칠리오볼루스 미야베너스 (*Cochliobolus miyabeanus*)에 기인한 코칠리오볼루스 (*Cochliobolus*) 질환;
- [0249] 예를 들어, 콜레토티리썸 린데무타니움 (*Colletotrichum lindemuthanium*) 에 기인한 콜레토티리썸 (*Colletotrichum*) 질환;
- [0250] 예를 들어, 시클로코니움 올레아기눔 (*Cycloconium oleaginum*) 에 기인한 시클로코니움 (*Cycloconium*) 질환;
- [0251] 예를 들어, 디아포르테 시트리 (*Diaporthe citri*) 에 기인한 디아포르테 (*Diaporthe*) 질환;
- [0252] 예를 들어, 엘시노에 파우세티 (*Elsinoe fawcettii*) 에 기인한 엘시노에 (*Elsinoe*) 질환;
- [0253] 예를 들어, 글로에오스포리움 래티컬러 (*Gloeosporium laeticolor*) 에 기인한 글로에오스포리움 (*Gloeosporium*) 질환;
- [0254] 예를 들어, 글로메렐라 신굴라타 (*Glomerella cingulata*) 에 기인한 글로메렐라 (*Glomerella*) 질환;
- [0255] 예를 들어, 귀그나르디아 비드웰리 (*Guignardia bidwelli*) 에 기인한 귀그나르디아 (*Guignardia*) 질환;
- [0256] 예를 들어, 렙토스페리아 마쿨란스 (*Leptosphaeria maculans*), 렙토스페리아 노도룸 (*Leptosphaeria nodorum*) 에 기인한 렙토스페리아 (*Leptosphaeria*) 질환;
- [0257] 예를 들어, 마그나포르테 그리세아 (*Magnaporthe grisea*) 에 기인한 마그나포르테 (*Magnaporthe*) 질환;
- [0258] 예를 들어, 마이코스페렐라 그라미니콜라 (*Mycosphaerella graminicola*), 마이코스페렐라 아라치디콜라 (*Mycosphaerella arachidicola*), 마이코스페렐라 피지엔시스 (*Mycosphaerella fijiensis*) 에 기인한 마이코스페렐라 (*Mycosphaerella*) 질환;
- [0259] 예를 들어, 페오스페리아 노도룸 (*Phaeosphaeria nodorum*) 에 기인한 페오스페리아 (*Phaeosphaeria*) 질환;
- [0260] 예를 들어, 피레노포라 테레스 (*Pyrenophora teres*) 또는 피레노포라 트리티시 레펜티스 (*Pyrenophora tritici repentis*)에 기인한 피레노포라 (*Pyrenophora*) 질환;
- [0261] 예를 들어, 라물라리아 콜로-시그니 (*Ramularia collo-cygni*) 또는 라물라리아 아레올라 (*Ramularia areola*) 에 기인한 라물라리아 (*Ramularia*) 질환;
- [0262] 예를 들어, 린초스포리움 세칼리스 (*Rhynchosporium secalis*) 에 기인한 린초스포리움 (*Rhynchosporium*) 질환;
- [0263] 예를 들어, 셉토리아 아피 (*Septoria apii*) 및 셉토리아 라이코페르시스 (*Septoria lycopersici*) 에 기인한 셉토리아 (*Septoria*) 질환;
- [0264] 예를 들어, 티풀라 인카르나타 (*Typhula incarnata*) 에 기인한 티풀라 (*Typhula*) 질환;

- [0265] 예를 들어, 벤투리아 이내퀄리스 (*Venturia inaequalis*) 에 기인한 벤투리아 (*Venturia*) 질환;
- [0266] · 뿌리, 껍질 (Sheath) 및 줄기 질환, 예컨대:
- [0267] 예를 들어, 코르티시움 그라미네아룸 (*Corticium graminearum*) 에 기인한 코르티시움 (*Corticium*) 질환;
- [0268] 예를 들어, 푸사리움 옥시스포룸 (*Fusarium oxysporum*) 에 기인한 푸사리움 (*Fusarium*) 질환;
- [0269] 예를 들어, 개움만노마이세스 그라미니스 (*Gaeumannomyces graminis*) 에 기인한 개움만노마이세스 (*Gaeumannomyces*) 질환;
- [0270] 예를 들어, 리족토니아 솔라니 (*Rhizoctonia solani*) 에 기인한 리족토니아 (*Rhizoctonia*) 질환;
- [0271] 예를 들어, 사르코클라디움 오리재 (*Sarocladium oryzae*) 에 기인한 사로클라디움 (*Sarocladium*) 질환;
- [0272] 예를 들어, 스크레로티움 오리재 (*Sclerotium oryzae*)에 기인한 스크레로티움 (*Sclerotium*) 질환;
- [0273] 예를 들어, 타페시아 아쿠포르미스 (*Tapesia acuformis*) 에 기인한 타페시아 (*Tapesia*) 질환;
- [0274] 예를 들어, 티엘라비오프시스 바시콜라 (*Thielaviopsis basicola*) 에 기인한 티엘라비오프시스 (*Thielaviopsis*) 질환;
- [0275] · 이삭 (ear) 및 원추꽃차례 질환, 예컨대:
- [0276] 예를 들어, 알테르나리아류 (*Alternaria* spp.) 에 기인한 알테르나리아 질환;
- [0277] 예를 들어, 아스페르길루스 플라부스 (*Aspergillus flavus*) 에 기인한 아스페르길루스 (*Aspergillus*) 질환;
- [0278] 예를 들어, 클라도스포리움류 (*Cladosporium* spp.) 에 기인한 클라도스포리움 (*Cladosporium*) 질환;
- [0279] 예를 들어, 클라비셉스 푸르푸레아 (*Claviceps purpurea*) 에 기인한 클라비셉스 (*Claviceps*) 질환;
- [0280] 예를 들어, 푸사리움 쿨모룸 (*Fusarium culmorum*) 에 기인한 푸사리움 (*Fusarium*) 질환;
- [0281] 예를 들어, 귀베렐라 제애 (*Gibberella zeae*) 에 기인한 귀베렐라 (*Gibberella*) 질환;
- [0282] 예를 들어, 모노그라펠라 니발리스 (*Monographella nivalis*) 에 기인한 모노그라펠라 (*Monographella*) 질환;
- [0283] · 감부기병 및 밀그물비린감부기병 (bunt), 예컨대:
- [0284] 예를 들어, 스파셀로테카 레일리아나 (*Sphacelotheca reiliana*) 에 기인한 스파셀로테카 (*Sphacelotheca*) 질환;
- [0285] 예를 들어, 틸레티아 카리에스 (*Tilletia caries*) 에 기인한 틸레티아 (*Tilletia*) 질환;
- [0286] 예를 들어, 우로시스티스 오쿨타 (*Urocystis occulta*) 에 기인한 우로시스티스 (*Urocystis*) 질환;
- [0287] 예를 들어, 우스틸라고 누다 (*Ustilago nuda*) 에 기인한 우스틸라고 (*Ustilago*) 질환;
- [0288] · 열매썩음병 및 곰팡이병, 예컨대:
- [0289] 예를 들어, 아스페르길루스 플라부스에 기인한 아스페르길루스 질환;
- [0290] 예를 들어, 보트리티스 시네레아 (*Botrytis cinerea*) 에 기인한 보트리티스 (*Botrytis*) 질환;
- [0291] 예를 들어, 페니실리움 엑스판숨 (*Penicillium expansum*) 에 기인한 페니실리움 (*Penicillium*) 질환;
- [0292] 예를 들어, 리조푸스 스톨로니퍼 (*Rhizopus stolonifer*)에 기인한 리조푸스 (*Rhizopus*) 질환;
- [0293] 예를 들어, 스크레로티니아 스크레로티오룸 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 에 기인한 스크레로티니아 (*Sclerotinia*) 질환;
- [0294] 예를 들어, 베르티실리움 알보아트룸 (*Verticilium alboatrum*) 에 기인한 베르티실리움 (*Verticilium*) 질환;
- [0295] · 종자 및 토양전파성 부패, 곰팡이병, 시들음병, 썩음병 (rot) 및 모잘록병:
- [0296] 예를 들어, 알테르나리아 브라시콜라 (*Alternaria brassicicola*) 에 기인한 알테르나리아 질환;
- [0297] 예를 들어 아파노마이세스 유테이체스 (*Aphanomyces euteiches*) 에 기인한 아파노마이세스 (*Aphanomyces*) 질환;

- [0298] 예를 들어 아스코치타 렌티스 (*Ascochyta lentis*) 에 기인한 아스코치타 (*Ascochyta*) 질환;
- [0299] 예를 들어 아스페르길러스 플라부스 (*Aspergillus flavus*) 에 기인한 아스페르길러스 (*Aspergillus*) 질환;
- [0300] 예를 들어 클라도스포리움 헤르바룸(*Cladosporium herbarum*) 에 기인한 클라도스포리움(*Cladosporium*) 질환;
- [0301] 예를 들어 코칠리오볼루스 사티부스 (*Cochliobolus sativus*) 에 기인한 코칠리오볼루스 (*Cochliobolus*) 질환;
- [0302] (분생자형: 드레크슬레라 (*Drechslera*), 바이폴라리스 (*Bipolaris*) 동의어: 헬민토스포리움 (*Helminthosporium*))
- [0303] 예를 들어 콜레토티리쭈 코코데스(*Colletotrichum coccodes*) 에 기인한 콜레토티리쭈(*Colletotrichum*) 질환;
- [0304] 예를 들어 푸사리움 쿨모룸(*Fusarium culmorum*) 에 기인한 푸사리움(*Fusarium*) 질환;
- [0305] 예를 들어 지베렐라 지애(*Gibberella zeae*) 에 기인한 지베렐라(*Gibberella*) 질환;
- [0306] 예를 들어 마크로포미나 파세오리나(*Macrophomina phaseolina*) 에 기인한 마크로포미나(*Macrophomina*) 질환;
- [0307] 예를 들어 모노그라펠라 니발리스(*Monographella nivalis*) 에 기인한 모노그라펠라(*Monographella*) 질환;
- [0308] 예를 들어 페니실리움 엑스판숨 (*Penicillium expansum*) 에 기인한 페니실리움(*Penicillium*) 질환;
- [0309] 예를 들어 포마 링감(*Phoma lingam*) 에 기인한 포마(*Phoma*) 질환;
- [0310] 예를 들어 포모프시스 소재 (*Phomopsis sojae*) 에 기인한 포모프시스(*Phomopsis*) 질환;
- [0311] 예를 들어 피토프토라 각토룸(*Phytophthora cactorum*) 에 기인한 피토프토라(*Phytophthora*) 질환;
- [0312] 예를 들어 피레노포라 그라미네아(*Pyrenophora graminea*) 에 기인한 피레노포라(*Pyrenophora*) 질환;
- [0313] 예를 들어 피리큘라리아 오리재(*Pyricularia oryzae*) 에 기인한 피리큘라리아(*Pyricularia*) 질환;
- [0314] 예를 들어 피티움 울티뮴(*Pythium ultimum*) 에 기인한 피티움(*Pythium*) 질환;
- [0315] 예를 들어 리족토니아 솔라니(*Rhizoctonia solani*) 에 기인한 리족토니아(*Rhizoctonia*) 질환;
- [0316] 예를 들어 리조푸스 오리재(*Rhizopus oryzae*) 에 기인한 리조푸스(*Rhizopus*) 질환;
- [0317] 예를 들어 스크레로티움 롤프시(*Sclerotium rolfsii*) 에 기인한 스크레로티움(*Sclerotium*) 질환;
- [0318] 예를 들어 셉토리아 노도룸(*Septoria nodorum*) 에 기인한 셉토리아(*Septoria*) 질환;
- [0319] 예를 들어 티폴라 인카르나타(*Typhula incarnata*) 에 기인한 티폴라(*Typhula*) 질환;
- [0320] 예를 들어 베르티실리움 달리에(*Verticillium dahliae*) 에 기인한 베르티실리움(*Verticillium*) 질환;
- [0321] · 궤양병, 빗자루병 및 가지고사병, 예컨대:
- [0322] 예를 들어, 넥트리아 갈리게나 (*Nectria galligena*) 에 기인한 넥트리아 (*Nectria*) 질환;
- [0323] · 마름병 (blight disease), 예컨대:
- [0324] 예를 들어, 모닐리니아 락사 (*Monilinia laxa*) 에 기인한 모닐리니아 (*Monilinia*) 질환;
- [0325] · 잎 수포 (blister) 또는 잎오갈병 (leaf curl) 예컨대:
- [0326] 예를 들어 엑소바시둠 벡산스 (*Exobasidium vexans*)에 기인한 엑소바시둠 (*Exobasidium*) 질환;
- [0327] 예를 들어, 타프리나 데포르만스 (*Taphrina deformans*) 에 기인한, 타프리나 (*Taphrina*) 질환;
- [0328] · 나무 식물의 쇠약병 (decline disease), 예컨대:
- [0329] 예를 들어, 패모니엘라 클라마이도스포라 (*Phaemoniella clamydospora*) 에 기인한 에스카 (*Esca*) 질환;
- [0330] 예를 들어, 유티파 라타 (*Eutypa lata*) 에 기인한 유티파 가지고사병 (*Eutypa dyeback*);
- [0331] 예를 들어 가노더마 보니넨스 (*Ganoderma boninense*)에 기인한 가노더마 (*Ganoderma*) 질환;
- [0332] 예를 들어 리지도포러스 리그노서스 (*Rigidoporus lignosus*)에 기인한 리지도포러스 (*Rigidoporus*) 질환

- [0333] · 꽃 및 종자의 질환, 예컨대:
- [0334] 보트리티스 시네레아 (*Botrytis cinerea*) 에 기인한 보트리티스 (*Botrytis*) 병;
- [0335] · 괴경 질환, 예컨대:
- [0336] 예를 들어, 리족토니아 솔라니에 기인한 리족토니아 질환.
- [0337] 예를 들어, 헬민토스포리움 솔라니(*Helminthosporium solani*) 에 기인한 헬민토스포리움(*Helminthosporium*) 질환;
- [0338] · 뿌리혹 질환, 예컨대:
- [0339] 예를 들어, 플라모디오포라 브라시카에 (*Plamodiophora Brassicae*)에 기인한 플라스모디오포라 질환.
- [0340] · 세균 유기체에 의해 기인한 질환, 예컨대:
- [0341] 잔토모나스 (*Xanthomonas*) 종, 예를 들어 잔토모나스 카페스트리스 pv. 오르제 (*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*);
- [0342] 슈도모나스 (*Pseudomonas*) 종, 예를 들어 슈도모나스 스트린가에 pv. 라크리만스 (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*);
- [0343] 에르위니아 (*Erwinia*) 종, 예를 들어 에르위니아 아밀로보라 (*Erwinia amylovora*).
- [0344] 본 발명에 따른 조성물은 또한 목재 (timber) 내부 또는 그 위에서 자라기 쉬운 진균성 질환에 대해 사용될 수도 있다. "목재"라는 용어는 모든 종류의 나무종, 및 상기 나무의 모든 건축용 가공 형태, 예컨대 원목 (solid wood), 고밀도 목재 (high-density wood), 집성재 및 합판을 의미한다. 본 발명에 따른 목재의 처리 방법은, 주로 본 발명에 따른 하나 이상의 화합물, 또는 본 발명의 조성물을 접촉시키는 것으로 이루어지며, 이에, 예컨대 직접 도포, 분무, 디핑 (dipping), 주입 또는 임의의 기타 적절한 수단이 포함된다.
- [0345] 본 발명에 따른 처리 방법에 통상 적용되는 활성 화합물의 용량은 경엽 처리에서의 적용에 있어서 일반적으로 유리하게는 10 내지 800 g/ha, 바람직하게 50 내지 300 g/ha 이다. 적용된 활성물의 용량은 종자 처리의 경우에는 일반적으로 유리하게는 종자 100kg 당 2 내지 200 g, 바람직하게 종자 100kg 당 3 내지 150 g 이다.
- [0346] 본원에 나타난 용량은 본 발명에 따른 방법의 예시로서 제공됨은 명백하게 이해된다. 당업자는 특히 처리될 식물 또는 농작물의 성질에 따라 적용 용량을 어떻게 채택할 지에 대해 알고 있을 것이다.
- [0347] 본 발명에 따른 화합물 또는 혼합물은 또한, 인간 또는 동물의 진균성 질병, 예컨대 사상균병, 피부병, 트리초 피톤병 (*trichophyton* disease) 및 아스페르길루스 푸미가투스 (*Aspergillus fumigatus*) 와 같은 아스페르길루스류 (*Aspergillus* spp.) 에 의한 칸디다증 또는 질병 등의 치유적 또는 예방적 치료에 유용한 조성물의 제조에 사용할 수도 있다.
- [0348] 본 발명의 다양한 측면은 이제 하기 화합물 예의 표 및 하기 제조 또는 효능 예를 참고로 하여 예시될 것이다.
- [0349] 표 1 은 본 발명에 따른 식 (I)의 화합물의 예를 비제한적으로 예시한다:



- [0350]
- [0351] 표 1 에서, 달리 제시되지 않는 한, M+H (ApcI+) 는 포지티브 대기압 화학 이온화 (positive atmospheric chemical ionisation)를 통해 질량 분광계에 관찰한 대로 분자 이온 피크 + 또는 - 1 a.m.u. (원자 질량 단위)를 각각 의미한다.
- [0352] 표 1 에서, logP 값을, 하기 방법을 이용해, 역상 컬럼 (C18) 상의 HPLC (High Performance Liquid Chromatography: 고성능 액체 크로마토그래피)에 의해 EEC Directive 79/831 Annex V.A8 에 따라 측정했다:
- [0353] 온도: 40℃; 이동상 : 0.1% 수성 포름산 및 아세트니트릴 ; 선형 구배 10% 아세트니트릴 → 90% 아세트니트릴.
- [0354] 보정 (Calibration) 은 공지된 logP 값 (2개의 연속하는 알카논들 사이에서 선형 보간법을 이용한 체류시간에

의한 logP 값의 측정) 을 가진 비분지형 알칸-2-온 (탄소수 3 내지 16) 을 이용하여 수행했다. 램다 최대값 을 200 nm 내지 400 nm 의 UV 스펙트럼 및 크로마토그래피 시그널의 피크 값을 이용하여 결정했다.

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
1	F	F	Me	O	시클로펜틸	H	H	CH2	페닐	3.69	366
2	F	F	Me	O	이소프로필	H	H	CH2	페닐	3.19	340
3	F	F	Me	O	2-시아노에틸	H	H	CH2	페닐	2.39	351
4	F	F	Me	O	에틸	H	H	CH2	페닐	2.43	312
5	F	F	Me	O	2,2,2- 트리플루오로 에틸	H	H	CH2	페닐	3.25	380
6	Cl	F	Me	O	시클로펜틸	H	H	CH2	페닐	3.89	382
7	Cl	F	Me	O	이소프로필	H	H	CH2	페닐	3.35	356
8	Cl	F	Me	O	2-시아노에틸	H	H	CH2	페닐	2.53	367
9	Cl	F	Me	O	에틸	H	H	CH2	페닐	2.60	328
10	Cl	F	Me	O	2,2,2- 트리플루오로 에틸	H	H	CH2	페닐	3.39	396
11	F	F	Me	O	시클로프로필	H	H	CH2	페닐	2.88	338
12	Cl	F	Me	O	시클로프로필	H	H	CH2	페닐	3.06	354

표 1:

[0355]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
13	F	F	Me	O	시클로프로필	H	H	CH(Me)	페닐	3.17	352
14	Cl	F	Me	O	시클로프로필	H	H	CH(Me)	페닐	3.31	368
15	F	F	Me	S	시클로프로필	H	H	CH(Me)	페닐	3.92	368
16	Cl	F	Me	S	시클로프로필	H	H	CH(Me)	페닐	4.11	384
17	F	F	Me	O	에틸	Me	H	C=O	페닐	2.59	354
18	Cl	F	Me	O	에틸	Me	H	C=O	페닐	2.71	370
19	F	F	Me	O	시클로프로필	Me	H	CH2	2-플루오로페닐	3.37	370
20	Cl	F	Me	O	시클로프로필	Me	H	CH2	2-플루오로페닐	3.52	386
21	F	F	Me	S	시클로프로필	Me	H	CH2	2-플루오로페닐	4.01	386
22	F	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	4-플루오로페닐	2.50	330
23	F	F	Me	O	이소프로필	H	H	CH2	4-플루오로페닐	3.23	358
24	Cl	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	4-플루오로페닐	2.66	346
25	Cl	F	Me	O	이소프로필	H	H	CH2	4-플루오로페닐	3.37	374

[0356]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
26	F	F	Me	O	시클로프로필	Me	H	CH2	2,6-디플루오로페닐	3.42	388
27	Cl	F	Me	O	시클로프로필	Me	H	CH2	2,6-디플루오로페닐	3.57	404
28	F	F	Me	S	시클로프로필	Me	H	CH2	2,6-디플루오로페닐	3.94	404
29	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	2,6-디플루오로페닐	2.92	364
30	F	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	2,6-디플루오로페닐	2.78	348
31	F	F	Me	O	H	Me	H	CH2	2-클로로페닐	2.94	346
32	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	2-클로로페닐	2.69	332
33	Cl	F	Me	O	H	Me	H	CH2	2-클로로페닐	3.15	362
34	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	2-클로로페닐	2.88	348
35	F	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	2-클로로페닐	2.76	346
36	Cl	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	2-클로로페닐	2.92	362
37	F	F	Me	S	H	Me	H	CH2	2-클로로페닐	3.61	362
38	Cl	F	Me	S	H	Me	H	CH2	2-클로로페닐	3.72	378

[0357]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
39	F	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	2-클로로페닐	2.94	346
40	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	2-클로로페닐	3.15	362
41	F	F	Me	O	시클로프로필	Me	H	CH(Me)	2-클로로페닐	3.87	400
42	Cl	F	Me	O	시클로프로필	Me	H	CH(Me)	2-클로로페닐	4.08	416
43	F	F	Me	S	시클로프로필	Me	H	CH(Me)	2-클로로페닐	4.72	416
44	F	F	Me	O	시클로프로필	H	H	CF2	2-클로로페닐	3.39	408
45	F	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	2-클로로페닐	3.27	360
46	Cl	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	2-클로로페닐	3.48	376
47	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	3-클로로페닐	2.75	332
48	Cl	F	Me	O	H	Me	H	CH2	3-클로로페닐	3.17	362
49	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	3-클로로페닐	2.92	348
50	F	F	Me	O	H	Me	H	CH2	3-클로로페닐	3.02	346
51	F	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	3-클로로페닐	3.02	346

[0358]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
52	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	3-클로로페닐	3.21	362
53	F	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	3-클로로페닐	3.31	360
54	Cl	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	3-클로로페닐	3.53	376
55	F	F	Me	O	시클로프로필	Me	H	CH2	4-클로로페닐	3.73	386
56	F	F	Me	O	에틸	H	H	CH2	4-클로로페닐	3.19	360
57	Cl	F	Me	O	에틸	H	H	CH2	4-클로로페닐	3.35	376
58	F	F	Me	S	에틸	H	H	CH2	4-클로로페닐	3.92	376
59	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH(iPr)	4-클로로페닐	3.94	390
60	F	F	Me	O	H	H	H	CH(iPr)	4-클로로페닐	3.78	374
61	F	F	Me	O	메틸	H	H	C=O	4-클로로페닐	2.53	360
62	Cl	F	Me	O	메틸	H	H	C=O	4-클로로페닐	2.68	376
63	F	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	4-클로로페닐	3.37	360
64	Cl	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	4-클로로페닐	3.58	376

[0359]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
65	F	F	Me	O	H	H	H	CH ₂	2,4-디클로로페닐	3.09	
66	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH ₂	2,4-디클로로페닐	3.31	
67	F	F	Me	O	H	Me	H	CH ₂	2,4-디클로로페닐	3.46	380
68	Cl	F	Me	O	H	Me	H	CH ₂	2,4-디클로로페닐	3.67	396
69	Cl	F	Me	S	H	Me	H	CH ₂	2,4-디클로로페닐	4.29	412
70	F	F	Me	S	H	Me	H	CH ₂	2,4-디클로로페닐	4.16	396
71	F	F	Me	S	H	H	H	CH ₂	2,4-디클로로페닐	3.99	382
72	Cl	F	Me	S	H	H	H	CH ₂	2,4-디클로로페닐	4.11	398
73	F	F	Me	O	H	Me	H	CH(OMe)	2,4-디클로로페닐	3.65 + 3.75 ⁽¹⁾	410
74	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH(OMe)	2,4-디클로로페닐	3.48	412
75	F	F	Me	O	H	H	H	CH(OMe)	2,4-디클로로페닐	3.25	396
76	Cl	F	Me	O	H	Et	H	CH(OMe)	2,4-디클로로페닐	4.18 + 4.23 ⁽¹⁾	440
77	F	F	Me	O	H	Et	H	CH(OMe)	2,4-디클로로페닐	3.94	424

[0360]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
78	Cl	F	Me	O	H			CH(OMe)	2,4-디클로로페닐	3.70	438
79	F	F	Me	O	H			CH(OMe)	2,4-디클로로페닐	3.46	422
80	F	F	Me	O	시클로프로판	H	H	CH(OMe)	2,4-디클로로페닐		436
81	F	F	Me	O	시클로프로판	Me	H	CH(OMe)	2,4-디클로로페닐		450
82	Cl	F	Me	O	H	Me	H	CH(OEt)	2,4-디클로로페닐	4.37 + 4.46 ⁽¹⁾	440
83	F	F	Me	O	H	Me	H	CH(OEt)	2,4-디클로로페닐	4.11 + 4.20 ⁽¹⁾	424
84	F	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	2,4-디클로로페닐	3.46	380
85	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	2,4-디클로로페닐	3.67	396
86	F	F	Me	O	시클로프로판	H	H	CF2	2,4-디클로로페닐	3.94	442
87	F	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	2,4-디클로로페닐	3.81	394
88	Cl	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	2,4-디클로로페닐	4.03	410
89	Cl	F	Me	S	H	H	H	C(Me)2	2,4-디클로로페닐	4.72	426

[0361]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
90	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	2,5-디클로로페닐	3.11	366
91	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	2,5-디클로로페닐	3.29	382
92	F	F	Me	O	H	Me	H	CH2	2,5-디클로로페닐	3.37	380
93	Cl	F	Me	O	H	Me	H	CH2	2,5-디클로로페닐	3.53	396
94	F	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	2,5-디클로로페닐	3.17	380
95	Cl	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	2,5-디클로로페닐	3.33	396
96	F	F	Me	S	메틸	H	H	CH2	2,5-디클로로페닐	3.87	396
97	F	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	2,5-디클로로페닐	3.35	380
98	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	2,5-디클로로페닐	3.55	396
99	F	F	Me	O	시클로프로판	H	H	CF2	2,5-디클로로페닐	3.85	442
100	F	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	2,5-디클로로페닐	3.68	394
101	Cl	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	2,5-디클로로페닐	3.89	410
102	F	F	Me	O	H	Me	H	CH2	3,5-디클로로페닐	3.48	380

[0362]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
103	F	F	Me	O	H	H	H	CH ₂	3,5-디클로로페닐	3.25	366
104	Cl	F	Me	O	H	Me	H	CH ₂	3,5-디클로로페닐	3.67	396
105	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH ₂	3,5-디클로로페닐	3.42	382
106	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH(OMe)	3,5-디클로로페닐	3.55	412
107	F	F	Me	O	H	H	H	CH(OMe)	3,5-디클로로페닐	3.33	396
108	Cl	F	Me	O	H	Me	H	CH(OMe)	3,5-디클로로페닐	3.79 + 3.92 ⁽¹⁾	426
109	F	F	Me	O	H	Me	H	CH(OMe)	3,5-디클로로페닐	3.55+ 3.70 ⁽¹⁾	410
110	F	F	Me	S	H	H	H	CH(OMe)	3,5-디클로로페닐	4.19	412
111	F	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	3,5-디클로로페닐	3.55	380
112	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	3,5-디클로로페닐	3.73	396
113	F	F	Me	O	H	H	H	C(Me) ₂	3,5-디클로로페닐	3.87	394
114	Cl	F	Me	O	H	H	H	C(Me) ₂	3,5-디클로로페닐	4.01	410
115	F	F	Me	O	시클로프로판	Me	H	CH ₂	2,6-디클로로페닐	4.06	420

[0363]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
116	Cl	F	Me	O	시클로프로필	Me	H	CH2	2,6-디클로로페닐	4.29	436
117	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	2,6-디클로로페닐	3.00	366
118	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	2,6-디클로로페닐	3.21	382
119	Cl	F	Me	O	시클로프로필	Me	H	CH2	2-클로로-6-플루오로페닐	3.94	420
120	F	F	Me	O	시클로프로필	Me	H	CH2	2-클로로-6-플루오로페닐	3.76	404
121	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	2-(트리플루오로메틸)페닐	2.92	366
122	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	2-(트리플루오로메틸)페닐	3.11	382
123	F	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	2-(트리플루오로메틸)페닐	3.00	380
124	Cl	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	2-(트리플루오로메틸)페닐	3.13	396
125	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	3-(트리플루오로메틸)페닐	3.35	396
126	F	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	3-(트리플루오로메틸)페닐	3.23	380
127	F	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	4-(트리플루오로메틸)페닐	3.25	380
128	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH(Me)	4-(트리플루오로메틸)페닐	3.39	396

[0364]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
129	F	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	3,4-디메톡시페닐	2.04	372
130	F	F	Me	O	시클로헥실	H	H	CH2	3,4-디메톡시페닐	3.42	440
131	Cl	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	3,4-디메톡시페닐	2.18	388
132	Cl	F	Me	O	시클로헥실	H	H	CH2	3,4-디메톡시페닐	3.53	456
133	F	F	Me	O	H	Me	Me	C=O	4-브로모-2-메틸페닐	3.37	432
134	F	F	Me	O	이소프로필	H	H	CH2	2,4,6-트리메틸페닐	4.30	382
135	F	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	2,4,6-트리메틸페닐	3.48	354
136	Cl	F	Me	O	이소프로필	H	H	CH2	2,4,6-트리메틸페닐	4.49	398
137	Cl	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	2,4,6-트리메틸페닐	3.67	370
138	F	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	4-tert-부틸페닐	3.78	368
139	Cl	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	4-tert-부틸페닐	3.96	384
140	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	2-페녹시페닐	3.48	390
141	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	2-페녹시페닐	3.64	406

[0365]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
142	F	F	Me	O	H	Me	Me	CH2	3-페녹시페닐	4.09	418
143	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	3-페녹시페닐	3.37	390
144	Cl	F	Me	O	H	Me	Me	CH2	3-페녹시페닐	4.30	434
145	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	3-페녹시페닐	3.55	406
146	F	F	Me	O	H	Me	H	CH2	3-페녹시페닐	3.64	404
147	Cl	F	Me	O	H	Me	H	CH2	3-페녹시페닐	3.80	420
148	F	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	3-페녹시페닐	3.92	418
149	Cl	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	3-페녹시페닐	4.15	434
150	F	F	Me	O	H	Me	Me	CH2	4-페녹시페닐	4.19	418
151	F	F	Me	O	H	Me	H	CH2	4-페녹시페닐	3.63	404
152	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	4-페녹시페닐	3.41	390
153	Cl	F	Me	O	H	Me	Me	CH2	4-페녹시페닐	4.39	434
154	Cl	F	Me	O	H	Me	H	CH2	4-페녹시페닐	3.83	420

[0366]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
155	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	4-페녹시페닐	3.60	406
156	F	F	Me	S	H	Me	H	CH2	4-페녹시페닐	4.29	420
157	F	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	4-페녹시페닐	4.06	418
158	Cl	F	Me	O	H	H	H	C(Me)2	4-페녹시페닐	4.21	434
159	Cl	F	Me	O	H	Me	H	CH(OMe)	4-메톡시-3-(프로프-2-인-1-일옥시)-페닐	2.76	442
160	F	F	Me	O	H	Me	Me	C=O	2-나프틸	2.92	390
161	F	F	Me	O	H	H	H	CH(CF3)	2-티에닐	2.75	372
162	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH(CF3)	2-티에닐	2.92	388
163	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	3-메틸-2-티에닐	2.68	334
164	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	3-메틸-2-티에닐	2.49	318
165	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	2-브로모-3-티에닐	2.82	399
166	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	2-브로모-3-티에닐	2.64	382
167	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	4,5-디메틸-3-티에닐	2.82	332

[0367]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
168	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	4,5-디메틸-3-티에닐	3.02	348
169	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	4,5,6,7-테트라하드로-1-벤조-티오펜-3-일	3.52	374
170	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	4,5,6,7-테트라하드로-1-벤조-티오펜-3-일	3.31	358
171	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	3-메틸-1-벤조티오펜-2-일	3.27	368
172	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	3-메틸-1-벤조티오펜-2-일	3.46	384
173	F	F	Me	O	H	Me	H	CH2	2-푸릴	2.20	302
174	Cl	F	Me	O	H	Me	H	CH2	2-푸릴	2.37	318
175	F	F	Me	O	시클로헥실	H	H	CH2	피리딘-2-일	1.48	381
176	F	F	Me	O	시클로펜틸	H	H	CH2	피리딘-2-일	1.29	367
177	F	F	Me	O	2-메톡시에틸	H	H	CH2	피리딘-2-일	0.50	357
178	F	F	Me	O	이소프로필	H	H	CH2	피리딘-2-일	0.85	341
179	F	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	피리딘-2-일	1.47	313
180	Cl	F	Me	O	시클로헥실	H	H	CH2	피리딘-2-일	1.58	397

[0368]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
181	Cl	F	Me	O	시클로펜틸	H	H	CH2	피리딘-2-일	1.40	383
182	Cl	F	Me	O	이소프로필	H	H	CH2	피리딘-2-일	1.00	357
183	Cl	F	Me	O	메틸	H	H	CH2	피리딘-2-일	1.63	329
184	Cl	F	Me	O	2-메톡시에틸	H	H	CH2	피리딘-2-일	0.63	373
185	F	F	Me	O	H	CF3	H	CH2	3-메틸피리딘-2-일	1.52	381
186	Cl	F	Me	O	H	CF3	H	CH2	3-메틸피리딘-2-일	1.70	397
187	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	3-클로로-5-(트리플루오로메틸) 피리딘-2-일	2.75	401
188	F	F	Me	O	시클로프로필	Me	H	CH2	3-클로로-5-(트리플루오로메틸) 피리딘-2-일	3.80	455
189	Cl	F	Me	O	시클로프로필	Me	H	CH2	3-클로로-5-(트리플루오로메틸) 피리딘-2-일	3.96	471
190	F	F	Me	O	H	Me	H	CH2	3-클로로-5-(트리플루오로메틸) 피리딘-2-일	3.08	415
191	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	3-클로로-5-(트리플루오로메틸) 피리딘-2-일	2.97	
192	F	F	Me	O	H	H	H	CH(Et)	3-클로로-5-(트리플루오로메틸) 피리딘-2-일	3.52	429
193	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH(Et)	3-클로로-5-(트리플루오로메틸) 피리딘-2-일	3.73	445

[0369]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
194	F	F	Me	O	H	Me	Me	C=O	3-클로로-5-(트리플루오로메틸) 피리딘-2-일	3.23	443
195	Cl	F	Me	O	H	Me	Me	C=O	3-클로로-5-(트리플루오로메틸) 피리딘-2-일	3.39	459
196	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	6-클로로피리딘-3-일	1.90	349
197	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	6-클로로피리딘-3-일	1.78	333
198	F	F	Me	O	이소프로필	H	H	CH2	피리딘-4-일	0.78	341
199	F	F	Me	O	2-메톡시에틸	H	H	CH2	피리딘-4-일	1.56	357
200	F	F	Me	O	시클로헥실	H	H	CH2	피리딘-4-일	1.39	381
201	F	F	Me	O	시클로펜틸	H	H	CH2	피리딘-4-일	1.20	367
202	Cl	F	Me	O	2-메톡시에틸	H	H	CH2	피리딘-4-일	1.69	373
203	Cl	F	Me	O	시클로헥실	H	H	CH2	피리딘-4-일	1.50	397
204	Cl	F	Me	O	시클로펜틸	H	H	CH2	피리딘-4-일	1.32	383
205	Cl	F	Me	O	이소프로필	H	H	CH2	피리딘-4-일	0.98	357
206	F	F	Me	O	메틸	H	H	CH(Me)	피리딘-4-일	1.60	327

[0370]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
207	Cl	F	Me	O	메틸	H	H	CH(Me)	피리딘-4-일	1.74	343
208	F	F	Me	O	H	H	H	CH2	2,3,5,6-테트라플루오로피리딘-4-일	2.44	371
209	Cl	F	Me	O	H	H	H	CH2	2,3,5,6-테트라플루오로피리딘-4-일	2.60	387
210	F	F	Me	O	시클로프로판				2-클로로페닐	4.31	412
211	F	F	Me	O	시클로프로판				2,4-디클로로페닐	4.67	446
212	F	F	Me	O	H				페닐	3.13	352
213	F	F	Me	O	H				페닐	3.29	352
214	Cl	F	Me	O	H				페닐	3.33	368

[0371]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
215	Cl	F	Me	O	H				페닐	3.51	368
216	F	F	Me	O	시클로프로판				2-클로로페닐	4.49	426
217	F	F	Me	O	시클로프로판				2,4-디클로로페닐	5.05	460
218	F	F	Me	O	시클로프로판				페닐	4.18 + 4.26 ⁽¹⁾	406
219	F	F	Me	S	시클로프로판				페닐	5.01 + 5.11 ⁽¹⁾	422
220	F	F	Me	O	H				4-플루오로페닐	2.59	328
221	Cl	F	Me	O	H				4-플루오로페닐	2.75	344

[0372]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
222	F	F	Me	O	H				3-플루오로페닐	2.59	328
223	Cl	F	Me	O	H				3-플루오로페닐	2.75	344
224	F	F	Me	O	H				4-클로로페닐	2.61	344
225	F	F	Me	O	H				2-(트리플루오로메틸)페닐	3.00	378
226	Cl	F	Me	O	H				2-(트리플루오로메틸)페닐	3.15	394
227	Cl	F	Me	O	H	H	H	Si(Me)2	페닐	3.31	358
228	F	F	Me	O	H	H	H	Si(Me)2	페닐	3.13	342
229	F	F	Me	O	시클로헥실	H	H	Si(Me)2	페닐	4.86	424
230	F	F	Me	O	메틸	H	H	Si(Me)2	페닐	3.23	356
231	F	F	Me	O	시클로프로필	H	H	Si(Me)2	2-클로로페닐	4.13	416
232	Cl	F	Me	O	H	H	H	Si(Me)2	2-클로로페닐	3.69	392
233	F	F	Me	O	H	H	H	Si(Me)2	2-클로로페닐	3.48	376

[0373]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
234	F	F	Me	S	H	H	H	Si(Me)2	2-클로로페닐	4.11	392
235	F	F	Me	O	시클로프로필	H	H	Si(Me)2	3-클로로페닐	4.18	416
236	Cl	F	Me	O	H	H	H	Si(Me)2	3-클로로페닐	3.71	392
237	F	F	Me	O	H	H	H	Si(Me)2	3-클로로페닐	3.55	376
238	F	F	Me	O	시클로프로필	H	H	Si(Me)2	2,4-디클로로페닐	4.78	450
239	Cl	F	Me	O	H	H	H	Si(Me)2	2,4-디클로로페닐	4.25	426
240	F	F	Me	O	H	H	H	Si(Me)2	2,4-디클로로페닐	4.06	410
241	F	F	Me	S	H	H	H	Si(Me)2	2,4-디클로로페닐	4.74	426
242	F	F	Me	O	시클로프로필	H	H	Si(Me)2	3,5-디클로로페닐	4.78	450
243	Cl	F	Me	O	H	H	H	Si(Me)2	3,5-디클로로페닐	4.27	426
244	F	F	Me	O	H	H	H	Si(Me)2	3,5-디클로로페닐	4.08	410
245	F	F	Me	O	시클로프로필	H	H	Si(Me)2	2-니프틸	4.36	432
246	Cl	F	Me	O	시클로프로필	H	H	Si(Me)2	2-니프틸	4.51	448

[0374]

예	X1	X2	Y	T	Z1	Z2	Z3	W	B	logP	질량 (M+H)
247	Cl	F	Me	O	시클로프로필	H	H	Si(Me) ₂	3-티에닐	3.71	404
248	F	F	Me	O	시클로프로필	H	H	Si(Me) ₂	3-티에닐	3.55	388
249	F	F	Me	O	메틸				페닐	3.27 + 3.46 ⁽¹⁾	366
250	Cl	F	Me	O	메틸				페닐	3.55 + 3.63 ⁽¹⁾	382

주 (1) : 2 개의 이성질체의 혼합물

[0375]

[0376] 하기 예는 본 발명에 따른 식 (I)의 화합물의 제조 및 효능을 비제한적으로 예시한다.

[0377] 제조예 1 : N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]프로판-2-일}-3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드(화합물 190)의 제조

[0378] 단계 1 : 5-클로로-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복실산 (IIIa)의 제조

[0379] 500 ml 플라스크 내, 6.0 g (31 mmol)의 5-클로로-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르보알데히드를 30 ml의 톨루엔에 첨가한다. 2.4 g (62 mmol)의 나트륨 히드록시드의 6ml의 수용액을 반응 혼합물에 첨가한 다음, 온도를 37℃ 미만으로 유지하면서 103 ml의 수소 퍼옥시드의 30% 수용액을 첨가한다. 첨가 종료 후, 반응 혼합물을 50℃에서 7시간 동안 교반한다. 반응 혼합물이 실온으로 돌아오면, 2개의 상을 분리하고 유기상을 100 ml의 물로 추출한다. 조합된 수상을 수성 염산에 의해 pH 2로 산성화한다. 생성되는 백색 침전물을 여과하고, 20 ml의 물로 2회 세정하고, 건조시켜 3.2 g의 5-클로로-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복실산을 백색 고체로서 수득한다. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm : 3.78 (s, 3H); 7.12 (t, 1H, JHF = 53.60 Hz)13.19 (s, 1H); IR (KBr) : 1688 cm⁻¹ (C=O); 2200-3200 cm⁻¹ 폭넓음 (수소 결합).

[0380] 단계 2 : 5-클로로-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르보닐 클로라이드 (IIIb)의 제조

[0381] 3.2 g의 5-클로로-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복실산 및 44.3 ml의 티오닐 클로라이드를 5시간 동안 환류한다. 냉각시킨 후, 반응 혼합물을 진공 하에 증발시켜 3.5 g의 5-클로로-3-(디플루오로메

틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르보닐 클로라이드를 황색 오일로서 수득한다. ^1H NMR (400 MHz, $\text{CHCl}_3\text{-d}_6$) δ ppm : 3.97 (s, 3H); 7.00 (t, J = 52.01 Hz, 1 H); IR (TQ) : 1759 및 1725 cm^{-1} (C=O).

[0382] 단계 3 : 3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르보닐 플루오라이드 (IIIc)의 제조

[0383] 4.0 g (70 mmol)의 칼륨 플루오라이드의 21 ml의 테트라히드로티오펜-1,1-디옥시드 중의 건조 용액에 5.0 g (22 mmol)의 5-클로로-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르보닐 클로라이드의 15 ml의 톨루엔 중의 100°C의 용액을 첨가한다. 생성되는 반응 혼합물을 190-200°C에서 22 시간 동안 교반한다. 진공 하에 증류시켜, 8 g의 3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르보닐 플루오라이드의 테트라히드로-티오펜-1,1-디옥시드 중의 용액 (25% 물)을 수득한다. ^1H NMR (250 MHz, $\text{CHCl}_3\text{-d}_6$) δ ppm : 3.87 (s, 3H); 6.79 (t, J = 53.75 Hz, 1 H); ^{19}F NMR (250 MHz, $\text{CHCl}_3\text{-d}_6$) δ ppm : 45.37 (s, COF); -117.5 (d, J = 28.2 Hz); -131.6 (m).

[0384] 단계 4 : 3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복실산 (IIId)의 제조

[0385] 400 ml의 1N 나트륨 히드록시드 수용액에, 67.5 g의 3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르보닐 플루오라이드의 테트라히드로티오펜-1,1-디옥시드 중의 용액 (10% 물)을 적가한다. 첨가하는 동안에 온도를 20°C 미만으로 유지한다. 2 시간의 실온에서의 교반 후, 반응 혼합물을 진한 수성 염산에 의해 pH 2로 조심스럽게 산성화한다. 생성되는 백색 침전물을 여과하고, 물로 세정하고, 건조시켜 6 g의 3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복실산을 백색 고체로서 수득한다. ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ ppm : 3.90 (s, 3H); 7.22 (t, 1H, J_{HF} = 53.55Hz); 13.33 (s, 1H).

[0386] 단계 5 : N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]프로판-2-일}-3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드의 제조

[0387] 주변 온도에서, 150 mg (0.545 mmol)의 1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]프로판-2-아민, 116 mg (0.60 mmol)의 3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복실산, 81 mg (0.60 mmol)의 1-히드록시벤조트리아졸 및 55 mg (0.545 mmol)의 트리에틸아민을 1 ml의 디메틸포름아미드 중에서 용해가 될 때까지 함께 교반한다. 상기 용액을 1.48 g의 Si-DCC 수지 (수지 1 g 당 1.09 mmol의 DCC)로 충전된 2g-함유 염기성 알루미늄 chem-elut™ 카트리지에 붓고, 밤새 주변 온도에서 정치시킨다. 이후 카트리지를 2 ml의 아세토니트릴로 3회 세정한다. 용매를 제거하고 미정제 아미드를 실리카겔 상의 컬럼 크로마토그래피로 정제하여 (구배 헵탄/에틸 아세테이트), 187 mg (78% 수율)의 N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]프로판-2-일}-3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드를 황색 고체로서 수득한다 (M+H = 415).

[0388] 제조예 2 : N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]프로판-2-일}-N-시클로프로필-3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드 (화합물 188)의 제조

[0389] 단계 1 : 3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르보닐 클로라이드 (IIIe)의 제조

[0390] 9.1 g의 3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복실산 및 75.5 ml의 티오닐 클로라이드를 1.5 시간 동안 환류한다. 냉각시킨 후, 반응 혼합물을 진공 하에 증발시켜 10 g의 3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르보닐 클로라이드를 황색 오일로서 수득한다. GC-MS ; 측정값 M/z : 분자이온 : (M^+) = 212 ; 프래그먼트 (fragment) : (M^+ -Cl) = 177 및 (M^+ -F) = 193.

[0391] 단계 2 : N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]프로판-2-일}-N-시클로프로필-3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드의 제조

[0392] 주변 온도에서, 74 mg (0.35 mmol)의 3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르보닐 클로라이드의 2 ml의 테트라히드로푸란 중의 용액을 100 mg (0.317 mmol)의 N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]프로판-2-일}시클로프로판아민 및 0.137 ml (0.984 mmol)의 트리에틸아민의 3 ml의 테트라히드로푸란 중의 용액에 적가한다. 반응 혼합물을 주변 온도에서 15 시간 동안 교반한다. 용매를 감압 하에 제거하고, 이후 50 ml의 물을 잔사에 첨가한다. 수층을 에틸 아세테이트 (2 x 25 ml)로 2회 세정하고, 조합된 유기층을 HCl의 1 N 용액, 칼륨 카르보네이트 포화 용액 및 염수로 계속하여 세정하고, 마그네슘 술페이트로 건

조하여, 농축 후에 131 mg 의 오일을 수득한다. 실리카겔 상의 컬럼 크로마토그래피 (구배 헵탄/에틸 아세테이트)시켜, 72 mg (47% 수율) 의 N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]프로판-2-일}-N-시클로프로필-3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드를 무색 오일로서 수득한다 (M+H = 455).

[0393] 제조예 3 : N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]-2-메틸-1-옥소프로판-2-일}-3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드 (화합물 194)의 제조

[0394] 13 ml Chemspeed™ 바이얼 내에서 73 mg (0.726 mmol) 의 트리에틸아민을 칭량한다. 3 ml 의 2-아미노-1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]-2-메틸프로판-1-온 (0.594 mmole)의 디클로로메탄 중의 0.23 M 의 용액을 첨가한 다음, 3 ml 의 3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르보닐 클로라이드 (0.66mmole)의 디클로로-메탄 중의 0.26 M 용액을 첨가하고, 주변 온도에서 15 시간 동안 교반한다. 이후 1 ml 의 물을 첨가하고, 혼합물을 염기성 알루미늄 카트리지 (2g) 상에 정치시키고, 8 ml 의 디클로로메탄으로 2 회 용리시킨다. 용매를 제거하여, 57 mg (19%) 의 순수한 N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]-2-메틸-1-옥소프로판-2-일}-3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드를 오일로서 수득한다 (M+H = 443).

[0395] 제조예 4 : N-[1-(2,4-디클로로페닐)-1-메톡시프로판-2-일]-3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드 (화합물 73)의 제조

[0396] 주변 온도에서, 233 mg (1.1 mmol) 의 3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르보닐 클로라이드 및 234 mg (1 mmol) 의 1-(2,4-디클로로페닐)-1-메톡시프로판-2-아민을 10 ml 의 디클로로메탄에 용해시킨다. 121 mg (1.2 mmol) 의 트리에틸아민을 첨가하고, 반응 혼합물을 4 시간 동안 주변 온도에서 교반한다. 혼합물을 50 ml 의 에틸 아세테이트로 희석하고, 계속적으로 HCl 의 1 N 용액 (2회), 칼륨 카르보네이트 포화 용액 (2회) 및 염수로 세정하고, 마그네슘 술페이트로 건조시킨다. 용매를 제거하고, 미정제 아미드를 실리카겔 상의 컬럼 크로마토그래피 (구배 헵탄/에틸 아세테이트)로 정제시켜 400 mg (97% 수율) 의 N-[1-(2,4-디클로로페닐)-1-메톡시프로판-2-일]-3-(디플루오로메틸)-5-플루오로-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드를 담황색 고체로서 수득한다 (M+H = 410).

[0397] 일반 제조예: Chemspeed™ 기기 상에서의 식 (I)의 아미드의 가황 (thionation)

[0398] 13 ml Chemspeed™ 바이얼 내에서 0.27mmole 의 포스포러스 펜타술퍼드 (P₂S₅)를 칭량한다. 3 ml 아미드 (I) (0.54mmole)의 디옥산 중의 0.18 몰 용액을 첨가하고, 혼합물을 환류하에 2시간 동안 가열한다. 이후 온도를 80도로 냉각시키고, 2.5 ml 의 물을 첨가한다. 혼합물을 80℃에서 한 시간 더 가열한다. 이후 2 ml 의 물을 첨가하고, 반응 혼합물을 4 ml 의 디클로로메탄으로 2회 추출한다. 유기상을 염기성 알루미늄 카트리지 (2g) 상에 두고, 8 ml 의 디클로로메탄으로 2회 용리시킨다. 용매를 제거하고, 미정제 티온아미드 유도체를 LCMS 및 NMR 로 분석한다. 불충분하게 순수한 화합물을 분취용 LCMS 로 추가 정제한다.

[0399] 실시예 A : 스페로테카 폴리기네아 (오이)에서의 생체내 방지 시험

[0400] 용매: 49 중량부의 N,N-디메틸포름아미드

[0401] 유화제: 1 중량부의 알킬아릴폴리글리콜에테르

[0402] 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 물로 원하는 농도로 희석한다.

[0403] 방지 활성에 대해 시험하기 위해, 유식물을 지정된 적용량의 활성 화합물의 제제로 분무한다. 상기 처리 1 일 후에, 식물을 스페로테카 폴리기네아의 수성 포자 현탁액으로 접종한다. 이후 식물을 대략 23℃ 및 대략 70% 의 상대 대기 습도의 온실에 배치한다.

[0404] 그 시험을 접종 7일 후에 평가한다. 0 % 는 비처리 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 반면, 100 % 의 효능은 질환이 관찰되지 않음을 의미한다.

[0405] 상기 조건 하에서, 표 A 의 하기 화합물에 있어서 500 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 양호한 보호 (70% 이상) 내지 전체 보호되는 것으로 관찰된다.

표 A:

예	효능	예	효능	예	효능
11	83	77	95	167	90
15	100	78	100	187	98
21	100	79	100	188	100
26	86	80	100	189	95
28	100	82	95	190	100
31	96	83	100	191	93
33	93	86	100	193	83
37	98	88	94	194	98
38	85	92	88	195	91
41	74	93	95	210	100
43	100	99	98	211	100
44	100	101	83	212	95
55	100	104	86	215	93
65	79	109	85	216	100
67	100	110	75	217	99
68	99	115	100	218	94
69	95	120	100	224	84
70	98	133	100	225	80
71	85	150	100	231	100
73	100	151	93	235	95
74	75	153	93	238	98
75	80	156	93	242	98
76	93	160	95	245	100

[0406]

[0407] 동일한 조건 하에, 화합물 187 및 화합물 191 에 있어서 500 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 고 보호 (90% 이상)되는 것으로 관찰되는 반면, 표 A2 에서와 같은 특허 출원 WO-2004/074280 에 개시된 실시예 J-1 의 화합물에 있어서, 불량한 보호 (20% 미만)가 관찰된다.

표 A2:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 187	500	98
본 발명의 191	500	93
WO-2004/074280 의 J-1	500	16

[0408]

[0409] 국제 특허 WO-2004/074280 에 개시된 실시예 J-1 은 N-{2-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]에틸}-5-플루오로-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0410] 상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 WO-2004/074280 에 개시된 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0411] 동일한 조건 하에, 화합물 212 (안티 이성질체)에 있어서 500 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 우수한 보호 (95% 초과)가 관찰되는 반면, 표 A3 에서와 같은 WO-2010/09466 에서 청구된 데스 플루오로 (des-fluoro) 유사체 화합물 CMP1 (안티 이성질체)에 있어서는 보호가 관찰되지 않는다.

표 A3:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 212	500	95
화합물 CMP1	500	0

[0412]

[0413] WO-2010/09466 에 청구된 데스 플루오로 유사체 화합물 CMP1 (안티 이성질체)은 3-(디플루오로메틸)-1-메틸-N-[(1R,2S-1S',2R')-2-페닐시클로헥실]-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0414] 상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0415] 동일한 조건 하에, 화합물 242 에 있어서 500 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 우수한 보호 (95% 초과)가 관찰되는 반면, 표 A4 에서와 같이 데스 플루오로 유사체 화합물 CMP2 에 있어서는 불량한 보호 (5% 미만)가 관찰된다.

표 A4:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 242	500	98
CMP2	500	5

[0416]

[0417] 데스 플루오로 유사체 화합물 CMP2 (안티 이성질체)는 N-시클로프로필-N-[(3,5-디클로로페닐)(디메틸)실릴]메틸}-5-플루오로-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

- [0418] 상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.
- [0419] 실시예 B : 알테르나리아 솔라니 (토마토)에서의 생체내 방지 시험
- [0420] 용매: 49 중량부의 N,N-디메틸포름아미드
- [0421] 유화제: 1 중량부의 알킬아릴폴리글리콜에테르
- [0422] 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 원하는 농도로 물로 희석한다.
- [0423] 방지 활성을 시험하기 위해, 유식물을 지정된 적용량의 활성 화합물의 제제로 분무한다. 상기 처리 1일 후에, 식물을 알테르나리아 솔라니의 수성 포자 현탁액으로 접종한다. 식물을 대략 22℃ 및 100%의 상대 대기 습도의 인큐베이션 캐비닛에 1일 동안 정치시킨다. 이후 식물을 대략 20℃ 및 96%의 상대 대기 습도의 인큐베이션 캐비닛에 배치한다.
- [0424] 그 시험을 접종 7일 후에 평가한다. 0 %는 비처리 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 반면, 100 %의 효능은 질환이 관찰되지 않음을 의미한다.
- [0425] 상기 조건 하에서, 표 B의 하기 화합물에 있어서 500 ppm의 활성 성분의 용량으로 했을 때 양호한 보호 (70% 이상) 내지 전체 보호되는 것으로 관찰된다.

표 B :

예	효능	예	효능	예	효능
4	100	64	100	118	90
9	95	65	90	119	100
11	95	67	100	120	100
12	100	68	95	121	95
13	95	69	94	122	95
14	100	70	95	123	100
15	90	71	94	124	100
16	95	72	94	125	95
17	80	73	100	126	90
19	100	74	95	127	100
20	95	75	95	128	100
21	95	76	95	133	95
22	100	77	100	135	95
24	100	78	100	137	90
26	100	79	100	138	100
27	95	80	95	139	90
28	90	82	95	140	100
29	100	83	100	141	80
30	100	84	95	142	90
31	100	85	100	143	95
32	95	86	100	144	95
33	100	87	95	145	95
34	100	88	100	146	95
35	100	90	95	147	100
36	100	91	95	150	95
37	94	92	100	151	95
38	89	93	100	152	95
39	100	94	100	153	95
40	100	95	100	154	100
41	100	96	95	155	95
42	80	97	95	156	89
43	90	98	95	158	80
44	100	99	95	160	95
45	90	100	95	161	95
46	70	101	100	162	100
47	100	102	95	163	90
48	95	103	90	164	95
49	100	104	95	165	90
50	100	105	95	167	100
51	100	107	90	169	80
52	100	108	90	171	100
53	70	109	95	172	100
55	95	110	80	185	95
56	100	111	95	187	100
57	80	112	95	188	100
59	100	113	80	189	100
60	100	115	100	190	100
61	90	116	100	191	94
63	90	117	95	192	100

[0426]

표 B (후속) :

예	효능	예	효능	예	효능
193	100	224	95	236	100
194	100	225	95	237	100
195	95	227	95	238	94
208	95	228	100	239	90
210	100	229	90	240	100
211	100	230	100	242	100
212	89	231	94	243	95
213	89	233	95	244	100
215	78	233	95	245	100
216	71	234	70	247	94
218	70	235	100	248	94

[0427]

[0428]

동일한 조건 하에, 화합물 65 및 화합물 66 에 있어서 100 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 고 보호 (90% 초과) 내지 전체 보호가 관찰되는 반면, 표 B2 에서와 같이 WO-2007/060166 에 청구된 테스 플루오로 유사체 화합물 CMP3 에 있어서는 보호가 관찰되지 않는다.

표 B2:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 65	100	90
본 발명의 66	100	100
화합물 CMP3	100	0

[0429]

[0430]

WO-2007/060166 에 청구된 테스 플루오로 유사체 화합물 CMP3 은 N-[2-(2,4-디클로로페닐)에틸]-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0431]

상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0432]

동일한 조건 하에, 화합물 74 및 화합물 75에 있어서 500 ppm 및 100 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 고 보호 (90% 이상)가 관찰되는 반면, 표 B3 에서와 같이 특허 출원 WO-2008/148570 에 개시된 예 1.02 의 화합물 에 있어서는 양호한 보호 (80% 이상) 내지 불량한 보호 (40% 미만)가 관찰된다.

표 B3:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 74	500	95
	100	90
본 발명의 75	500	95
	100	95
WO-2008/148570 의 1.02	500	80
	100	40

[0433]

[0434]

국제 특허 WO-2008/148570 에 개시된 예 1.02 는 N-[2-(2,4-디클로로페닐)-2-메톡시에틸]-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0435]

상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 WO-2008/148570 에 개시된 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0436]

동일한 조건 하에, 화합물 212 (인티 이성질체) 에 있어서 500 ppm 및 100 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 고 보호 (89% 초과)가 관찰되는 반면, 표 B4 에서와 같이 특허 출원 WO-2010/09466 에 청구된 테스 플루오로 유사체 화합물 CMP1 (안티 이성질체)에 있어서는 불량한 보호 (35% 미만) 내지 보호되지 않는 것으로 관찰된다.

표 B4:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 212	500	89
	100	89
화합물 CMP1	500	33
	100	0

[0437]

[0438]

WO-2010/09466 에 청구된 테스 플루오로 유사체 화합물 CMP1 (안티 이성질체)은 3-(디플루오로메틸)-1-메틸-N-[(1R,2S-1S',2R')-2-페닐시클로헥실]-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0439]

상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0440]

실시에 C : 피레노포라 테레스 (보리)에서의 생체내 방지 시험

- [0441] 용매: 49 중량부의 N,N-디메틸포름아미드
- [0442] 유화제: 1 중량부의 알킬아릴 폴리글리콜 에테르
- [0443] 활성 화합물의 적합한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 원하는 농도로 물로 희석한다.
- [0444] 방지 활성을 시험하기 위해, 유식물을 지정된 적용량의 활성 화합물의 제제로 분무한다. 상기 처리 1일 후에, 식물을 피레노포라 테레스의 수성 포자 현탁액으로 접종한다. 식물을 22℃ 및 100 %의 상대 대기 습도의 인큐베이션 캐비닛에 48 시간 동안 정치시킨다. 이후 식물을 대략 20℃의 온도 및 대략 80 %의 상대 대기 습도의 온실 내에 배치한다.
- [0445] 시험을 접종 7-9 일 후에 평가한다. 0 %는 비처리 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 반면, 100 %의 효능은 질환이 관찰되지 않음을 의미한다.
- [0446] 상기 조건 하에, 양호한 보호 (70 % 이상) 내지 전체 보호는 표 C의 하기 화합물에 있어서 500 ppm의 활성 성분의 용량으로 했을 때 관찰된다:

표 C:

예	효능	예	효능	예	효능
4	95	67	100	118	94
5	80	68	100	119	100
9	95	70	100	120	100
11	100	71	100	121	100
12	100	72	100	122	94
13	100	73	100	123	95
14	100	74	95	124	95
15	100	75	100	125	100
16	100	76	100	126	100
19	100	77	80	127	100
20	100	78	100	128	94
21	100	79	100	129	90
22	100	80	100	133	100
24	95	82	100	135	95
26	100	83	100	138	95
27	95	84	100	139	90
28	100	85	100	140	95
29	100	86	100	142	78
30	100	87	94	143	89
31	100	88	100	146	100
32	100	89	100	147	100
33	100	90	100	150	78
34	100	91	100	151	100
35	100	92	100	152	100
36	95	93	100	153	80
37	100	94	100	154	100
38	100	95	100	155	100
39	100	96	100	156	100
40	94	97	100	157	80
41	100	98	94	160	100
42	100	99	100	161	100
43	100	100	94	162	95
44	100	101	70	163	95
45	100	102	100	164	100
47	100	103	100	165	95
48	100	104	100	167	100
49	94	105	94	169	100
50	100	106	90	171	100
51	100	107	95	172	100
52	100	108	100	185	94
53	94	109	100	187	100
55	100	110	100	188	100
56	100	111	100	189	95
57	70	112	100	190	100
58	100	113	90	191	100
59	100	114	80	192	100
60	100	115	100	193	100
63	94	116	100	194	100
65	100	117	100	195	100

[0447]

표 C (후속):

예	효능	예	효능	예	효능
208	100	227	100	238	100
210	100	228	100	240	100
211	100	229	70	240	95
215	100	230	100	241	100
216	95	231	100	242	100
218	100	233	100	243	100
220	100	234	100	244	95
222	100	235	100	245	100
224	100	236	100	247	100
225	100	237	100	248	100

[0448]

[0449] 실시예 D : 벤틀리아 이네켈리스 (사과 스카브 (apple scab))에서의 생체내 방지 시험

[0450] 용매: 24.5 중량부의 아세톤

[0451] 24.5 중량부의 N,N-디메틸아세트아미드

[0452] 유화제: 1 중량부의 알킬아릴 폴리글리콜 에테르

[0453] 활성 화합물의 적절한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 원하는 농도로 물로 희석한다

[0454] 방지 활성을 시험하기 위해, 유식물을 지정된 적용량의 활성 화합물의 제제로 분무한다. 분무 코팅이 건조된 후, 식물을 사과 스카브 (벤틀리아 이네켈리스)의 병원체의 수성 분생자 (conidia) 현탁액으로 접종하고, 이어서 대략 20℃ 및 100 %의 상대 대기 습도의 인큐베이션 캐비닛에 1 일 동안 정치시킨다.

[0455] 이후 식물을 대략 21℃ 및 대략 90 %의 상대 대기 습도의 온실 내에 배치한다.

[0456] 시험을 접종 10 일 후에 평가한다. 0%는 비처리 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 반면, 100%의 효능은 질환이 관찰되지 않음을 의미한다.

[0457] 상기 조건 하에, 고 보호 (95 % 이상) 내지 전체 보호는 표 D의 하기 화합물에 있어서, 100ppm의 활성 성분의 용량으로 했을 때 관찰된다:

표 D:

예	효능	예	효능	예	효능
44	100	77	100	187	100
55	100	80	100	188	100
65	100	82	100	190	100
66	100	83	100	210	100
67	100	86	100	211	100
70	100	108	100	224	100
70	100	109	99	224	100
73	100	115	100	231	99
74	100	120	100	235	100
75	95	133	100	238	100
76	100	160	100	242	100

[0458]

[0459] 실시예 E : 셉토리아 트리티시 (Septoria tritici)(밀)에서의 생체내 방지 시험

[0460] 용매: 49 중량부의 N,N-디메틸아세트아미드

[0461] 유화제: 1 중량부의 알킬아릴 폴리글리콜 에테르

[0462] 활성 화합물의 적절한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물 또는 활성 화합물 조합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 원하는 농도로 물로 희석한다.

[0463] 방지 활성을 시험하기 위해, 유식물을 지정된 적용량에서의 활성 화합물 또는 활성 화합물 조합물의 제제로 분무한다.

[0464] 분무 코팅이 건조된 후, 식물을 셉토리아 트리티시의 포자 현탁액으로 분무한다. 식물을 대략 20℃ 및 대략 100 %의 상대 대기 습도의 인큐베이션 캐비닛에서 48 시간 동안 두고, 이후에는 대략 15℃에서 대략 100 %의 상대 대기 습도의 반투명 인큐베이션 캐비닛에 60 시간 동안 정치시킨다.

[0465] 식물을 대략 15℃의 온도 및 대략 80 %의 상대 대기 습도의 온실에 배치한다.

[0466] 시험을 접종 21일 후에 평가한다. 0%는 비처리 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 반면, 100%의

효능은 질환이 관찰되지 않음을 의미한다.

[0467] 상기 조건 하에, 양호한 보호 (70 % 이상) 내지 전체 보호는 표 E 의 하기 화합물에 있어서 500 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 관찰된다:

표 E :

예	효능	예	효능	예	효능
11	100	82	100	187	100
13	93	83	100	188	100
26	100	86	80	189	70
41	93	88	90	190	100
44	100	99	100	194	100
55	100	106	71	210	100
65	100	107	86	211	100
66	71	108	100	230	100
73	100	109	100	231	100
74	100	120	100	233	90
75	100	133	80	235	100
76	100	151	100	238	100
77	100	160	70	242	100

[0468] 실시예 F : 블루메리아 그라미니스 (보리)에서의 생체내 방지 시험

[0469] 용매: 49 중량부의 N,N-디메틸아세트아미드

[0470] 유화제: 1 중량부의 알킬아릴 폴리글리콜 에테르

[0471] 활성 화합물의 적절한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물 또는 활성 화합물 조합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 원하는 농도로 물로 희석한다

[0472] 방지 활성을 시험하기 위해, 유식물을 지정된 적용량의 활성 화합물 또는 활성 화합물 조합물의 제제로 분무한다.

[0473] 분무 코팅이 건조된 후, 식물을 블루메리아 그라미니스 f.sp. 호르데이 (Blumeria graminis f.sp. hordei)의 포자로 살포한다.

[0474] 그 식물을 대략 18℃의 온도 및 대략 80 %의 상대 대기 습도에서의 온실에 배치하여 마일듀 퍼스틀스 (mildew pustules)의 진행을 촉진시킨다.

[0475] 시험을 접종 7일 후에 평가한다. 0%는 비처리 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 반면, 100%의 효능은 질환이 관찰되지 않음을 의미한다.

[0476] 상기 조건 하에, 표 F의 하기 화합물에 있어서 500 ppm의 활성 성분의 용량으로 했을 때 양호한 보호 (70 % 이상) 내지 전체 보호가 관찰된다:

표 F :

예	효능	예	효능	예	효능
11	100	77	100	188	100
13	100	83	100	189	100
26	100	86	100	190	100
41	100	88	80	194	100
44	100	99	89	210	100
55	100	107	78	211	100
65	95	109	100	230	100
66	90	115	100	231	100
70	100	120	94	235	94
73	100	133	100	238	100
74	100	151	100	242	100
75	100	160	70		
76	100	187	94		

[0477] 실시예 G : 푸사리움 니발레 (Fusarium nivale) (밀)에서의 생체내 방지 시험

[0478] 용매: 49 중량부의 N,N-디메틸아세트아미드

[0479] 유화제: 1 중량부의 알킬아릴 폴리글리콜 에테르

[0480] 활성 화합물의 적절한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물 또는 활성 화합물 조합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 원하는 농도로 물로 희석한다.

- [0483] 방지 활성을 시험하기 위해, 유식물을 지정된 적용량에서의 활성 화합물 또는 활성 화합물 조합물 제제로 분무한다.
- [0484] 분무 코팅이 건조된 후, 식물을 샌드블라스트를 사용하여 약간 손상시키고, 이후 이들을 푸사리움 니발레 (var. majus)의 분생자 현탁액으로 분무한다.
- [0485] 식물을 대략 10℃의 온도 및 대략 100 %의 상대 대기 습도의 반투명 인큐베이션 캐비닛 하의 온실에 배치한다.
- [0486] 시험을 접종 5일 후에 평가한다. 0%는 비처리 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 반면, 100%의 효능은 질환이 관찰되지 않음을 의미한다.
- [0487] 상기 조건 하에, 표 G의 하기 화합물에 있어서 500 ppm의 활성 성분의 용량으로 했을 때 고 보호 (80% 이상) 내지 전체 보호가 관찰된다:

표 G:

예	효능	예	효능	예	효능
44	100	120	100	210	86
55	100	133	100	211	100
66	100	151	100	230	83
73	88	160	83	231	83
86	93	188	100	235	100
88	88	189	100	238	83
99	92	190	88	242	83
115	100	194	100		

- [0488]
- [0489] 실시예 H: 푸사리움 니발레 (밀)에서의 생체내 치유적 시험
- [0490] 용매: 49 중량부의 N,N-디메틸아세트아미드
- [0491] 유화제: 1 중량부의 알킬아릴 폴리글리콜 에테르
- [0492] 활성 화합물의 적절한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물 또는 활성 화합물 조합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 원하는 농도로 물로 희석한다.
- [0493] 치유적 활성을 시험하기 위해, 유식물을 샌드블라스트를 사용하여 약간 손상시키고, 이후 이들을 푸사리움 니발레 (var. majus)의 분생자 현탁액으로 분무하고, 대략 10℃의 온도 및 대략 100 %의 상대 대기 습도의 반투명 인큐베이션 캐비닛 하의 온실 내에 24 시간 동안 배치한 다음, 지정된 적용량의 활성 화합물 제제로 분무한다.
- [0494] 분무 코팅이 건조된 후, 식물을 대략 10℃의 온도 및 대략 100 %의 상대 대기 습도의 반투명 인큐베이션 클로세 (cloche) 하의 온실에 정치시킨다.
- [0495] 시험을 접종 5일 후에 평가한다. 0%는 비처리 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 반면, 100%의 효능은 질환이 관찰되지 않음을 의미한다.
- [0496] 상기 조건 하에, 표 H의 하기 화합물에 있어서 500 ppm의 활성 성분의 용량으로 했을 때 고 보호 (85 % 이상) 내지 전체 보호가 관찰된다:

표 H:

예	효능	예	효능	예	효능
11	100	75	86	106	93
13	93	76	86	108	100
26	100	77	100	109	100
70	92	82	100		
74	100	83	100		

- [0497]
- [0498] 실시예 I: 렙토스패리아 노도룸 (밀)에서의 생체내 방지 시험
- [0499] 용매: 49 중량부의 N,N-디메틸아세트아미드
- [0500] 유화제: 1 중량부의 알킬아릴 폴리글리콜 에테르
- [0501] 활성 화합물의 적절한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 원하는 농도로 물로 희석한다
- [0502] 방지 활성을 시험하기 위해, 유식물을 지정된 적용량에서의 활성 화합물 제제로 분무한다. 상기 처리 1일 후에, 식물을 렙토스패리아 노도룸의 수성 포자 현탁액으로 접종한다. 식물을 22℃ 및 100 %의 상대 대기

습도의 인큐베이션 캐비닛에 48 시간 정치시킨다. 그 후 식물을 대략 22℃의 온도 및 대략 90 %의 상대 대기 습도의 온실에 배치한다.

[0503] 시험을 접종 7-9 일 후에 평가한다. 0%는 비처리 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 반면, 100%의 효능은 질환이 관찰되지 않는 것을 의미한다.

[0504] 상기 조건 하에, 표 I의 하기 화합물에 있어서 500 ppm의 활성 성분의 용량으로 했을 때 양호한 보호 (70% 이상) 내지 전체 보호가 관찰된다:

표 I:

예	효능	예	효능	예	효능
11	95	79	80	210	90
13	100	80	100	211	95
15	100	83	90	218	95
16	95	86	100	222	90
19	70	87	70	224	80
26	95	88	90	230	80
28	95	96	90	231	100
31	70	99	95	233	80
41	95	115	95	235	100
43	100	120	100	238	100
44	100	133	100	240	95
55	95	151	70	242	100
67	90	160	70	245	100
70	78	188	100	248	94
77	95	194	90		
78	80	195	94		

[0505]

[0506] 실시예 J: 우로마이세스 아펜디쿨라투스 (콩류)에서의 생체내 방지 시험

[0507] 용매: 24.5 중량부의 아세톤

[0508] 24.5 중량부의 N,N-디메틸아세트아미드

[0509] 유화제: 1 중량부의 알킬아릴 폴리글리콜 에테르

[0510] 활성 화합물의 적절한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 원하는 농도로 물로 희석한다.

[0511] 방지 활성을 시험하기 위해, 유식물을 지정된 적용량의 활성 화합물의 제제로 분무한다. 분무 코팅을 건조시킨 후에, 식물을 콩 녹병 (우로마이세스 아펜디쿨라투스)의 병원체의 수성 포자 현탁액으로 접종한 후, 대략 20℃ 및 100 %의 상대 대기 습도의 인큐베이션 캐비닛 내에 1 일 동안 정치시킨다.

[0512] 그 후 식물을 대략 21℃ 및 대략 90 %의 상대 대기 습도의 온실 내에 배치한다.

[0513] 시험을 접종 10일 후에 평가한다. 0%는 비처리 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 반면, 100%의 효능은 질환이 관찰되지 않음을 의미한다.

[0514] 상기 조건 하에, 표 J의 하기 화합물에 있어서, 100 ppm의 활성 성분의 용량으로 했을 때 양호한 보호 (75% 이상) 내지 전체 보호가 관찰된다:

표 J:

예	효능	예	효능	예	효능
55	96	115	98	231	100
65	100	120	100	235	100
66	98	187	96	238	100
70	75	188	98	242	100
80	80	211	100		
108	100	224	100		

[0515]

[0516] 실시예 K: 보트리티스 시네레아 (콩류)에서의 생체내 방지 시험

[0517] 용매: 24.5 중량부의 아세톤

[0518] 24.5 중량부의 N,N-디메틸아세트아미드

[0519] 유화제: 1 중량부의 알킬아릴 폴리글리콜 에테르

[0520] 활성 화합물의 적절한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고,

농축물을 원하는 농도로 물로 희석한다.

[0521] 방지 활성을 시험하기 위해, 유식물을 활성 화합물 제제로 분무한다. 분무코팅을 건조시킨 후, 보트리티스 시네레아가 자란 것으로 덮힌 작은 아가 조각 2개를 각 잎에 배치한다. 접종된 식물을 20℃ 및 100 %의 상대 대기 습도의 암실에 배치한다.

[0522] 접종 2 일 후, 잎의 병변 크기를 평가한다. 0%는 비처리 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 반면, 100%의 효능은 질환이 관찰되지 않음을 의미한다.

[0523] 상기 조건 하에, 표 K의 하기 화합물에 있어서 100 ppm의 활성 성분의 용량으로 했을 때 양호한 보호 (70% 이상) 내지 전체 보호가 관찰된다:

표 K:

예	효능	예	효능	예	효능
44	99	76	72	187	100
55	100	77	97	188	98
65	100	80	100	190	96
66	99	82	98	210	100
67	89	83	98	211	100
70	100	86	100	224	100
70	100	115	93	231	99
73	99	120	94	235	99
74	93	133	100	238	100
75	95	160	100	242	100

[0524]

[0525] 동일한 조건 하에, 전체 보호가 화합물 55에 있어서 500 ppm의 활성 성분의 용량으로 했을 때 관찰되는 한편, 표 K2에서와 같은 특허 출원 WO-2007/060164에서 개시된 예 F-3의 화합물에 있어서 보호가 관찰되지 않는다.

표 K2:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 55	500	100
WO-2007/060164의 F-3	500	0

[0526]

[0527] 국제 특허 WO-2007/060164에 개시된 예 F-3은 N-[1-(4-클로로페닐)프로판-2-일]-N-시클로프로필-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0528] 상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 WO-2007/060164에 개시된 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0529] 동일한 조건 하에, 화합물 65 및 화합물 66에 있어서, 100 ppm의 활성 성분의 용량으로 했을 때 우수한 보호 (95% 초과) 내지 전체 보호가 관찰되는 한편, 표 K3에서와 같은 WO-2007/060166에 청구된 데스 플루오로 유사체 화합물 CMP3에서는 보호가 관찰되지 않는다.

표 K3:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 65	100	100
본 발명의 66	100	99
화합물 CMP3	100	0

[0530]

[0531] WO-2007/060166에 청구된 데스 플루오로 유사체 화합물 CMP3은 N-[2-(2,4-디클로로페닐)에틸]-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0532] 상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0533] 동일한 조건 하에, 화합물 160에 있어서, 500 ppm의 활성 성분의 용량으로 했을 때 전체 보호가 관찰되는 반면, 표 K4에서와 같이 특허 출원 WO-2006/016708에 개시된 예 2-1의 화합물에 있어서는 불량한 보호 (30% 미만)가 관찰된다.

표 K4:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 160	500	100
WO-2006/016708의 2-1	500	30

[0534]

[0535] 국제 특허 WO-2006/016708에 개시된 예 2-1은 5-클로로-1,3-디메틸-N-[2-메틸-1-(2-나프틸)-1-옥소프로판-2-

일]-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0536] 상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 WO-2006/016708 에 개시된 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0537] 동일한 조건 하에, 화합물 188 에 있어서 500 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 우수한 보호 (95% 초과)가 관찰되는 한편, 표 K5 에서와 같이 WO-2005/058833 에서 청구된 테스트 플루오로 유사체 화합물 CMP4 및 화합물 CMP5 에 있어서는, 보호가 관찰되지 않는다.

표 K5:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 188	500	95
화합물 CMP4	500	0
화합물 CMP5	500	0

[0538]

[0539] WO-2005/05883 에 청구된 테스트 플루오로 유사체 화합물 CMP4 는 N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]프로판-2-일}-N-시클로프로필-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당하고, WO-2005/05883 에 청구된 테스트 플루오로 유사체 화합물 CMP5 는 N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]프로판-2-일}-N-시클로프로필-5-플루오로-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0540] 상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0541] 동일한 조건 하에, 화합물 190 에 있어서 500 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 전체 보호가 관찰되는 한편, 표 K6 에서와 같이 WO-2005/058833 에 청구된 테스트 플루오로 유사체 화합물 CMP6 에 있어서는 보호가 관찰되지 않는다.

표 K6:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 190	500	100
화합물 CMP6	500	0

[0542]

[0543] WO-2005/05883 에 청구된 테스트 플루오로 유사체 화합물 CMP6 은 N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]프로판-2-일}-5-플루오로-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0544] 상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0545] 동일한 조건 하에, 고 보호 (90% 이상) 내지 전체 보호가 화합물 187 및 화합물 191 에 있어서 500 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 관찰되는 한편, 표 K7 에서와 같이 특허 출원 WO-2004/074280 에 개시된 예 J-1 의 화합물에 있어서 보호가 관찰되지 않는다.

표 K7:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 187	500	100
본 발명의 191	500	91
WO-2004/074280 의 J-1	500	0

[0546]

[0547] 국제 특허 WO-2004/074280 에 개시된 예 J-1 은 N-{2-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]에틸}-5-플루오로-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0548] 상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 WO-2004/074280 에 개시된 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0549] 동일한 조건 하에, 우수한 보호 (95% 초과)가 화합물 212 (안티 이성질체)에 있어서 500 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 관찰되는 한편, 표 K8 에서와 같이 WO-2010/094666 에 청구된 테스트 플루오로 유사체 화합물 CMP1 (안티 이성질체)에 있어서는 보호가 관찰되지 않는다.

표 K8:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 212	500	96
화합물 CMP1	500	0

[0550]

[0551] WO-2010/09466 에 청구된 테스트 플루오로 유사체 화합물 CMP1 (안티 이성질체)은 3-(디플루오로메틸)-1-메틸-N-

[(1R,2S-1S',2R')-2-페닐시클로헥실]-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0552] 상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0553] 동일한 조건 하에, 화합물 224 (신 이성질체)에 있어서 500 ppm 및 100 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 전체 보호가 관찰되는 한편, 표 K9 에서와 같이 특허 출원 WO-2007/134799 에 개시된 예 1.001 의 화합물 (신 이성질체)에 있어서 양호한 보호 (85% 이상) 내지 불량한 보호 (10% 미만)가 관찰된다.

표 K9:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 224	500	100
	100	100
WO-2007/134799 의 1.001	500	89
	100	8

[0555] 국제 특허 WO-2007/134799 에 개시된 예 1.001 (신 이성질체)은 N-[(1S,2S-1R',2R')-2-(4-클로로페닐)시클로프로필]-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0556] 상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 WO-2007/134799 에 개시된 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0557] 동일한 조건 하에, 화합물 242 에 있어서 500 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 전체 보호가 관찰되는 한편, 표 K10 에서와 같이 데스 플루오로 유사체 화합물 CMP2 에 있어서 불량한 보호 (10% 미만)가 관찰된다.

표 K10:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 242	500	100
CMP2	500	10

[0559] 데스 플루오로 유사체 화합물 CMP2 (안티 이성질체)는 N-시클로프로필-N-{[(3,5-디클로로페닐)(디메틸)실릴]메틸}-5-플루오로-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0560] 상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0561] 실시예 L : 푸치니아 트리티시나 (Puccinia trititica) (밀)에서의 생체내 방지 시험

[0562] 용매: 49 중량부의 N,N-디메틸아세트아미드

[0563] 유화제: 1 중량부의 알킬아릴 폴리글리콜 에테르

[0564] 활성 화합물의 적절한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물 또는 활성 화합물 조합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 원하는 농도로 물로 희석한다

[0565] 방지 활성을 시험하기 위해, 유식물을 지정된 적용량에서의 활성 화합물 또는 활성 화합물 조합물의 제제로 분무한다. 분무 코팅이 건조된 후, 식물을 푸치니아 트리티시나의 포자 현탁액으로 분무한다. 식물을 대략 20℃ 및 대략 100 % 의 상대 대기 습도의 인큐베이션 캐비넷에서 48 시간 동안 정치시킨다.

[0566] 식물을 대략 20℃의 온도 및 대략 80 % 의 상대 대기 습도의 온실 내에 배치한다.

[0567] 시험을 접종 8 일 후에 평가한다. 0% 는 비처리 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 반면, 100% 의 효능은 질환이 관찰되지 않음을 의미한다.

[0568] 상기 조건 하에, 표 L 의 하기 화합물에 있어서 500 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 양호한 보호 (70% 이상) 내지 전체 보호가 관찰된다:

표 L:

예	효능	예	효능	예	효능
24	80	115	90	231	100
26	90	119	80	232	95
33	80	120	70	233	95
80	80	147	70	235	100
93	70	188	90	238	100
95	70	189	80	239	70
102	70	211	100	240	100
104	70	229	80	242	100
108	100	230	95	245	95

[0569]

[0570]

동일한 조건 하에, 화합물 188 에 있어서 500 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 고 보호 (90% 초과)가 관찰되는 한편, 표 L2 에서와 같이 WO-2005/058833 에서 청구된 데스 플루오로 유사체 화합물 CMP4 및 화합물 CMP5 에 있어서 불량한 보호 (15% 미만)가 관찰된다.

표 L2:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 188	500	90
화합물 CMP4	500	11
화합물 CMP5	500	11

[0571]

[0572]

WO-2005/05883 에 청구된 데스 플루오로 유사체 화합물 CMP4 는 N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]프로판-2-일}-N-시클로프로필-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당하고, WO-2005/05883 에 청구된 데스 플루오로 유사체 화합물 CMP5 는 N-{1-[3-클로로-5-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일]프로판-2-일}-N-시클로프로필-5-플루오로-1,3-디메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0573]

상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0574]

동일한 조건 하에, 화합물 211 에 있어서 500 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 우수한 보호 (95% 초과)가 관찰되는 한편, 표 L3 에서와 같이 특허 출원 WO-2010/09466 에 개시된 예 7 의 화합물에 있어서 불량한 보호 (5% 미만)가 관찰된다.

표 L3:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 211	500	98
WO-2010/094666 의 7	500	5

[0575]

[0576]

국제 특허 WO-2010/09466 에 개시된 예 7 은 N-시클로프로필-N-[2-(2,4-디클로로페닐)시클로펜틸]-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0577]

상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 WO-2010/09466 에 개시된 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다..

[0578]

실시예 M : 코칠리오볼루스 미야비너스 (Cochliobolus miyabeanus) (벼)에서의 생체내 보호 시험

[0579]

용매: 28.5 중량부의 아세톤

[0580]

유화제: 1.5 중량부의 폴리옥시에틸렌 알킬 페닐 에테르

[0581]

활성 화합물의 적절한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 원하는 농도로 물로 희석한다.

[0582]

보호 활성을 시험하기 위해, 유식물을 지정된 적용량에서의 활성 화합물 제제로 분무한다. 분무 1일 후, 식물을 벼깨씨무늬병균 (rice brown spot)(코칠리오볼루스 미야비너스)의 병원체의 수성 포자 현탁액으로 접종한다. 그 후 식물을 대략 25℃ 및 대략 100 % 의 상대 대기 습도의 인큐베이터에 1일 동안 배치한다.

[0583]

시험을 접종 4 일 후에 평가한다. 0 % 는 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 한편, 100 % 의 효능은 질환이 관찰되지 않는 것을 의미한다.

[0584]

상기 조건 하에, 표 M 의 하기 화합물에 있어서 250 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 고 보호 (90 % 이상)가 관찰된다:

표 M :

예	효능	예	효능	예	효능
50	90	92	90	188	80
73	98	187	85		

[0585]

[0586] 동일한 조건 하에, 화합물 73 에 있어서 250 ppm, 100 ppm, 50 ppm 및 10 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 우수한 보호 (95% 이상) 내지 양호한 보호 (65% 이상)가 관찰되는 한편, 표 M2 에서와 같이 특허 출원 WO-2008/148570 에서 개시된 예 1.14 의 화합물에 있어서는 우수한 보호 (95% 이상) 내지 불량한 보호 (20% 미만)가 관찰된다.

표 M2:

예	용량 (ppm)	효능
본 발명의 73	250	98
	100	97
	50	92
	10	65
WO-2008/148570 의 1.14	250	98
	100	92
	50	80
	10	20

[0587]

[0588] 국제 특허 WO-2008/148570 에 개시된 예 1.14 는 N-[1-(2,4-디클로로페닐)-1-메톡시프로판-2-일]-3-(디플루오로메틸)-1-메틸-1H-피라졸-4-카르복사미드에 해당한다.

[0589] 상기 결과는 본 발명에 따른 화합물이 WO-2008/148570 에 개시된 구조적으로 가장 근접한 화합물보다 훨씬 더 양호한 생물학적 활성을 가짐을 나타낸다.

[0590] 실시예 N : 파코프소라 파치리지 (대두)에서의 생체내 보호 시험

[0591] 용매: 28.5 중량부의 아세톤

[0592] 유화제: 1.5 중량부의 폴리옥시에틸렌 알킬 페닐 에테르

[0593] 활성 화합물의 적절한 제제를 제조하기 위해, 1 중량부의 활성 화합물을 지정량의 용매 및 유화제와 혼합하고, 농축물을 원하는 농도로 물로 희석한다.

[0594] 보호 활성을 시험하기 위해, 유식물을 지정된 적용량에서의 활성 화합물 제제로 분무한다. 분무 1일 후, 식물을 대두 녹병 (파코프소라 파치리지)의 병원체의 수성 포자 현탁액으로 접종한다. 그 후 식물을 대략 20 °C 및 대략 80 % 의 상대 대기 습도의 온실에 배치한다.

[0595] 그 시험을 접종 11 일 후 평가한다. 0% 는 대조군의 효능에 해당하는 효능을 의미하는 한편, 100% 의 효능은 질환이 관찰되지 않는 것을 의미한다.

[0596] 상기 조건 하에, 표 N 의 하기 화합물에 있어서 250 ppm 의 활성 성분의 용량으로 했을 때 고 보호 (80% 이상) 내지 전체 보호가 관찰된다:

표 N :

예	효능	예	효능	예	효능
211	80	235	100	242	99
231	80	238	85		

[0597]

[0598] 실시예 O : 푸사리움 프로리페라툼 (Fusarium proliferatum)에 의해 생성된 푸모니신 (Fumonisin) FB1 의 억제

[0599] 화합물을 마이크로타이터 플레이트에서 0.5% DMSO 를 함유하는 푸모니신-유도 액체 배지 (리터 당 0.5g 맥아 추출물, 1g 효모 추출물, 1g 박토 펩톤 (bacto peptone), 20 g 프락토오스, 1g KH₂PO₄, 0.3g MgSO₄·7H₂O, 0.3g KCl, 0.05g ZnSO₄·7H₂O 및 0.01g CuSO₄·5H₂O)에서 2000 포자/ml 의 최종 농도까지 푸사리움 프로리페라툼의 농축된 포자 현탁액으로 접종하여 시험하였다.

[0600] 플레이트를 덮고 20 °C 의 고 습도에서 5일 동안 인큐베이션하였다.

[0601] 시작 시점과 5 일 후에, 웰 (정사각형: 3 x 3) 당 멀티플 리드 (multiple read)에 의한 OD₆₂₀ 에서의 OD 측정을 하여, 성장 억제를 계산하였다.

[0602] 5일 후에 각 배양 배지의 샘플을 취하여 50 % 아세토니트릴 중에서 1:1000 로 희석하였다. 샘플의 푸모니신

FB1 의 양을 HPLC-MS/MS 로 분석하고, 그 결과를 이용하여 화합물이 없는 대조군과 비교하여 FB1 생성의 억제를 계산하였다.

[0603] HPLC-MS/MS 를 하기 파라미터로 수행하였다:

[0604] 이온화 모드: ESI 포지티브

[0605] 이온분무 전압: 5500V

[0606] 분무기체 온도: 500℃

[0607] 디클러스터링 전위 (Declustering potential): 114V

[0608] 충돌 에너지: 51eV

[0609] 충돌 기체: N₂

[0610] MRM 추적: 722,3 > 352,3; 체류 시간 100ms

[0611] HPLC 컬럼: Waters Atlantis T3 (삼작용성 C18 결합, 전부 말단캡핑 (endcap)됨)

[0612] 입자 크기: 3 μm

[0613] 컬럼 크기: 50x2 mm

[0614] 온도: 40℃

[0615] 용매 A: 물+0.1% HCOOH (v/v)

[0616] 용매 B: 아세토니트릴+0.1% HCOOH (v/v)

[0617] 흐름: 400 μL/min

[0618] 주사액 부피: 5 μL

[0619] 구배:

구배 :

시간 [분]	A%	B%
0	90	10
2	5	95
4	5	95
4.1	90	10
9	90	10

[0620] 표 0 의 화합물은 50 μM 에서 푸모니신 FB1 생성의 우수한 억제 (99 % 이상) 내지 전체 억제를 보여주었다. 상기 예의 푸사리움 프로리페라툼의 성장 억제는 50 μM 에서 74 내지 86 % 로 다양하였다.

표 0 :

예	용량 (μM)	FB1 생성의 % 억제	진균 성장의 % 억제
73	50	100	86
187	50	100	75
188	50	99	74
190	50	100	74

[0622] 실시예 P : 푸사리움 그라미니어룸 (*Fusarium graminearum*)에 의해 생성된 데옥시니발레놀 (deoxynivalenol, DON) 및 아세틸데옥시니발레놀 (아세틸-DON)의 억제

[0623] 화합물을 마이크로타이터 플레이트에서, 10 % 귀리 추출물로 보충되고, 0.5% DMSO 를 함유하는 DON-유도 액체 배지 (리터 당 1g (NH₄)₂HPO₄, 0.2g MgSO₄·7H₂O, 3g KH₂PO₄, 10g 글리세린, 5g NaCl 및 40g 사카로오스 (Sachharose))에서 푸사리움 그라미니어룸의 농축된 포자 현탁액으로 최종 농도 2000 포자/ml 까지 접종하여 시험하였다.

[0624] 플레이트를 덮고, 28℃의 고 습도에서 7일 동안 인큐베이션하였다.

[0625] 시작 시점과 3일 후에, 웰 (정사각형: 3 x 3) 당 멀티플 리드에 의한 OD₆₂₀ 에서의 OD 측정을 하여, 성장 억제를 계산하였다.

[0627] 7일 후에 1 체적의 84/16 아세트니트릴/물을 각 웰에 첨가하고, 액체 배지의 샘플을 취하여 10 % 아세트니트릴 중에서 1:100 으로 희석하였다. 샘플의 DON 및 아세트-DON 의 양을 HPLC-MS/MS 로 분석하고, 그 결과를 이용하여 화합물이 없는 대조군과 비교하여 DON/AcDON 생성의 억제를 계산하였다.

[0628] HPLC-MS/MS 를 하기 파라미터로 수행하였다:

[0629] 이온화 모드: ESI 네거티브

[0630] 이온분무 전압: -4500V

[0631] 분무기체 온도: 500℃

[0632] 디클러스터링 전위: -40V

[0633] 충돌 에너지: -22eV

[0634] 충돌 기체: N₂

[0635] MRM 추적: 355,0 > 264,9; 체류 시간 150ms

[0636] HPLC 컬럼: Waters Atlantis T3 (삼작용성 C18 결합, 전부 말단캡핑됨)

[0637] 입자 크기: 3 μm

[0638] 컬럼 크기: 50x2 mm

[0639] 온도: 40℃

[0640] 용매 A: 물/2.5mM NH₄OAc+0.05% CH₃COOH (v/v)

[0641] 용매 B: 메탄올/2.5mM NH₄OAc+0.05% CH₃COOH (v/v)

[0642] 흐름: 400 μL/min

[0643] 주사액 부피: 11 μL

[0644] 구배:

구배:

시간 [분]	A%	B%
0	100	0
0.75	100	0
1.5	5	95
4	5	95
5	100	0
10	100	0

[0645]

[0646] 표 P 의 화합물은 50 μM 에서 DON/아세트-DON 생성의 우수한 억제 (90 % 이상) 내지 전체 억제를 나타냈다. 상기 예의 푸사리움 그라미니어룸의 성장 억제는 50 μM 에서 0% 내지 전체 억제로 다양하였다.

표 P:

예	용량 (μM)	FB1 생성의 % 억제	진균 성장의 % 억제
55	50	90	0
73	50	100	100
160	50	100	89
187	50	99	85
188	50	99	95
190	50	100	96

[0647]

[0648] 실시예 Q : 아스퍼길루스 파라시티커스 (Aspergillus parasiticus)에 의해 생성된 아플라톡신 (aflatoxine)의 억제

[0649] 화합물을 마이크로타이터 플레이트 (96 웰 흑색 평면 투명 바닥)에서 20mM 의 카바졸 (Cavasol) (히드록시프로필-베타-시클로덱스트린)로 보충되고, 1% 의 DMSO 를 함유하는, 아플라톡신-유도 액체 배지 (리터 당 20g 수크로오스, 효모 추출물 4g, KH₂PO₄ 1g, 및 MgSO₄ 7H₂O 0.5g)에서 시험하였다. 검정을, 최종 농도 1000 포자/ml 에서 아스퍼길루스 파라시티커스의 농축된 포자 현탁액으로 배지를 접종함으로써 개시한다.

[0650] 플레이트를 덮고, 20℃에서 7일 동안 인큐베이션하였다.

[0651] 배양 7 일 후에, 웰 (원형: 4 x 4) 당 멀티플 리드에 의한 OD_{620nm} 에서의 OD 측정을 Infinite 1000 (Tecan)로 하여 성장 억제를 계산하였다. 동시에, 웰 (정사각형: 3 x 3) 당 멀티플 리드에 의해 Em_{360nm} 및 Ex_{426nm} 에서 바닥 형광 측정을 하여, 아플라톡신 형성의 억제를 계산하였다.

[0652] 표 Q 의 화합물은 50 μ M 에서 아플라톡신 생성의 고 억제 (86% 이상) 내지 전체 억제를 나타냈다. 이러한 예의 푸사리움 그라미니어룸의 성장 억제는 50 μ M 에서 69 내지 100 % 로 다양하였다.

표 Q :

예	50 μ M 에서의 아플라톡신의 % 억제	50 μ M 에서의 진균 성장의 % 억제	예	50 μ M 에서의 아플라톡신의 % 억제	50 μ M 에서의 진균 성장의 % 억제
4	100	91	79	100	98
11	100	100	80	100	100
12	100	92	82	100	100
13	100	100	83	100	100
14	100	100	84	100	100
15	100	83	85	100	100
17	100	83	86	100	98
19	100	100	87	100	94
20	86	69	88	100	86
22	100	100	90	100	100
24	100	88	91	100	100
26	100	99	92	100	100
29	100	82	93	100	100
30	100	98	94	100	100
31	100	100	95	100	100
32	100	99	96	100	82
33	100	100	97	100	100
34	100	84	98	100	95
35	100	100	100	99	85
36	100	94	101	100	86
37	94	78	102	100	100
39	100	100	103	100	99
40	99	78	104	100	98
41	100	100	105	100	95
42	100	84	106	89	69
43	100	90	107	98	74
44	100	100	108	100	100
47	100	100	109	100	100
49	100	91	111	100	96
50	100	100	112	100	83
51	100	100	115	100	100
52	100	83	117	100	100
55	100	100	118	100	81
56	100	93	119	95	79
59	100	83	120	100	100
60	100	96	121	100	100
61	100	84	123	100	100
65	100	100	124	100	87
66	100	100	125	99	78
67	100	100	126	100	98
68	100	100	127	100	100
69	100	86	128	100	82
70	100	100	129	90	70
73	100	100	133	100	100
74	100	100	135	100	96
75	100	100	138	100	80
76	100	100	146	100	83
77	100	100	147	93	77
78	100	100	151	100	94

[0653]

표 Q (후속):

예	50 μ M에서의 아플라톡신의 % 억제	50 μ M에서의 진균 성장의 % 억제	예	50 μ M에서의 아플라톡신의 % 억제	50 μ M에서의 진균 성장의 % 억제
152	100	82	202	99	81
154	99	80	207	99	37
159	98	77	208	99	100
160	100	100	210	100	100
161	100	85	211	100	100
162	98	80	212	100	99
163	98	80	216	100	84
164	100	95	218	100	99
165	99	81	220	100	81
166	100	97	222	99	81
167	100	100	224	100	100
168	100	97	225	97	83
169	91	75	227	87	71
170	100	95	228	100	93
171	100	93	230	100	100
172	100	85	231	100	100
173	100	83	233	88	76
174	89	76	235	100	100
185	100	87	236	99	84
187	100	100	237	100	100
188	100	100	238	100	100
189	100	90	240	100	84
190	100	100	242	100	100
191	100	100	243	99	84
192	100	100	244	100	100
193	100	91	245	100	100
194	100	100	247	100	100
195	100	81	248	100	100

[0654]