



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2008-0018891
(43) 공개일자 2008년02월28일

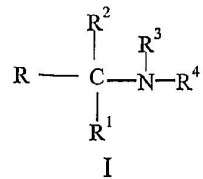
- | | |
|---|---|
| <p>(51) Int. Cl.
<i>A01N 43/14</i> (2006.01)</p> <p>(21) 출원번호 10-2007-7029241</p> <p>(22) 출원일자 2007년12월14일
심사청구일자 없음
번역문제출일자 2007년12월14일</p> <p>(86) 국제출원번호 PCT/US2006/019365
국제출원일자 2006년05월19일</p> <p>(87) 국제공개번호 WO 2006/127426
국제공개일자 2006년11월30일</p> <p>(30) 우선권주장
60/682,460 2005년05월19일 미국(US)</p> | <p>(71) 출원인
바이엘 크롭사이언스 아게
독일 40789 몬하임 알프레드-노벨-스트라세 50</p> <p>(72) 발명자
딕슨 존 에이.
미국 펜실바니아 18940-1490 뉴타운 캔터베리 코
네티컷 135
테오도리디스 조지
미국 뉴저지 08540 프린스턴 몬로 레인 45
(뒷면에 계속)</p> <p>(74) 대리인
이은선, 최규팔</p> |
|---|---|

전체 청구항 수 : 총 34 항

(54) 살충성을 가지는 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 유도체

(57) 요약

특정의 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 유도체는 예기치 않은 살충 및 살비 활성을 가진다. 이들 화합물은 하기 화학식 I로 나타내어진다:



상기 식에서,

R, R¹, R², R³ 및 R⁴는 명세서에 정의된 바와 같다.

또한, 살충 유효량의 적어도 하나의 화학식 I의 화합물 및 임의로 유효량의 적어도 하나의 추가의 화합물을 하나 이상의 살충제에 적합한 담체와 함께 포함하는 조성물이 상기 조성물을 곤충이 존재하거나 존재할 것으로 예상되는 장소에 적용시키는 것을 포함하는 곤충의 구제 방법과 함께 개시된다.

(72) 발명자

엘제너위 제이납 엠.

미국 펜실바니아 18966 홀랜드 애담스 코트 583

듀건 벤자민 제이.

미국 펜실바니아 19342-1403 글렌 밀스 콘코드 로
드 437

파텔 마노라마 엠.

미국 뉴저지 08550 웨스트 윈저 페리 드라이브 6

마론 에드워드 제이.

미국 뉴저지 08619-1861 트렌턴 노팅엄 웨이 3292

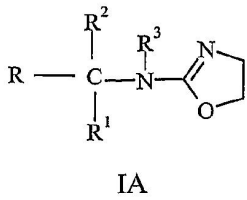
도노반 스티븐 에프.

미국 펜실바니아 18953 리비어 피.오.박스 121

특허청구의 범위

청구항 1

화학식 IA의 화합물 및 그의 농학적으로 허용되는 염을 포함하는 살충성 조성물:



상기 식에서,

R은 1-나프틸, 페닐, 또는 할로젠, (C₁-C₂) 알킬, (C₁-C₂) 알콕시, (C₁-C₂) 할로알킬 및 페닐중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환된 페닐에서 선택되고;

R¹은 수소, (C₁-C₂) 알킬, (C₁-C₂) 하이드록시알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬에서 선택되며;

R²는 수소 및 (C₁-C₂) 알킬에서 선택되고;

R³은 수소, (C₁-C₂) 알킬,

		$-S(O)_a-R^{15}$		$-CH=N-R^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

에서 선택되며;

여기에서,

X는 산소 또는 황이고;

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이며;

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;

R¹⁴는 수소이며;

a는 2이고;

R¹⁵는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이며;

R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이고;

R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이나;

단, R이 1-나프틸이고 R³은 수소인 경우, R¹ 및 R²는 (C₁-C₂) 알킬이 아니다.

청구항 2

제 1 항에 있어서,

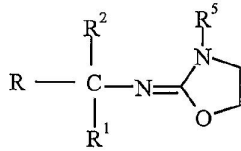
R이 2,3-디클로로페닐 또는 2,3-디메틸페닐이고;

R¹은 수소 또는 메틸이며;

R² 및 R³ 수소인 화학식 IA의 화합물로 구성된 살충성 조성물.

청구항 3

화학식 IB의 화합물 및 그의 농학적으로 허용되는 염을 포함하는 살충성 조성물:



IB

상기 식에서,

R은 1-나프틸, 페닐, 또는 할로젠 및 (C₁-C₄) 알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환된 페닐이고;

R¹은 수소, (C₁-C₄) 알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬에서 선택되며;

R²는 수소이고;

R⁵는 시아노, (C₁-C₂) 알콕시(C₁-C₂) 알킬, 4-(C₁-C₂) 알콕시벤질,

$ \begin{array}{c} \text{R}^8 \\ \\ -\text{P}-\text{R}^7 \\ \quad \quad \quad \diagdown \\ \quad \quad \quad \text{X} \end{array} $	$ \begin{array}{c} \text{R}^{10} \quad \text{O} \\ \quad \quad \\ -\text{CH}-\text{O}-\text{C}-\text{R}^{11} \end{array} $	$ \begin{array}{c} \text{X} \\ \\ -\text{C}-\text{N}-\text{R}^{13}\text{R}^{14} \end{array} $
(1),	(3),	(5),

-S(O) _a -R ¹⁵	$ \begin{array}{c} \text{X} \\ \\ -\text{C}-\text{R}^{16} \end{array} $	-CH=N-R ¹⁹
(6),	(7) 및	(9);

에서 선택되며;

여기에서,

X는 산소 또는 황이고;

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시 또는 (C₁-C₂) 할로알킬이며;

R¹⁰은 수소이고;

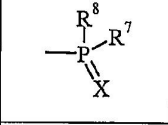
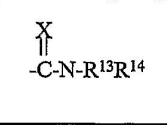
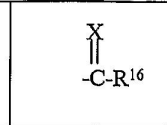
R¹¹은 (C₁-C₄) 알킬이며;

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;

R¹⁴는 수소 또는 (C₁-C₂) 알킬이며;

a는 2이고;

R⁵는

		$-S(O)_a-R^{15}$		$-CH=N-R^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

에서 선택되고;

여기에서,

X는 산소 또는 황이며;

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이고;

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이며;

R¹⁴는 수소이고;

a는 2이며;

R¹⁵는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이고;

R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이며;

R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이다.

청구항 8

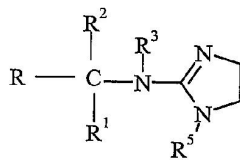
제 5 항에 있어서,

R이 2,3-디클로로페닐, 2,3-디메틸페닐이고;

R⁵는 X가 황인 식 (1) 또는 X가 산소이고 R¹⁶은 (C₁-C₂) 알콕시인 식 (7)인 화학식 ID의 화합물로 구성된 살충성 조성물.

청구항 9

화학식 IE의 화합물 및 그의 농학적으로 허용되는 염을 포함하는 살충성 조성물:



IE

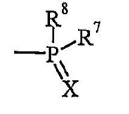
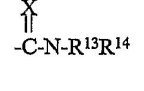

상기 식에서,

R은 1-나프틸, 페닐, 또는 할로젠, (C₁-C₂) 알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환된 페닐에서 선택되고;

R¹은 수소, (C₁-C₃) 알킬, 페닐 또는 벤질에서 선택되며;

R²는 수소이고;

R³은 수소, (C₁-C₂) 알킬,

		$-S(O)_a-R^{15}$		$-CH=N-R^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

에서 선택되며;

여기에서,

X는 산소 또는 황이고;

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이며;

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;

R¹⁴는 수소 또는 (C₁-C₂) 알킬이며;

a는 2이고;

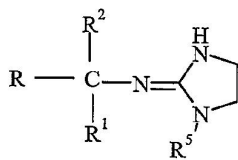
R¹⁵는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이며;

R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이고;

R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이다.

청구항 10

화학식 IF의 화합물 및 그의 농학적으로 허용되는 염을 포함하는 살충성 조성물:



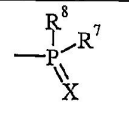


IF

상기 식에서,

R은 할로젠 및 (C₁-C₂) 알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 임의로 치환된 페닐이고;

R¹ 및 R²는 수소이며;

R⁵는 시아노,

		$-S(O)_a-R^{15}$		$-CH=N-R^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

에서 선택되고;

여기에서,

X는 산소 또는 황이며;

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이고;

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이며;

R¹⁴는 수소 또는 (C₁-C₂) 알킬이고;

a는 2이며;

R¹⁵는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이고;

R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이며;

R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이다.

청구항 11

제 1 항에 있어서, 살해충제, 식물 성장 조절제, 비료 및 토양 개량제로 구성된 그룹중에서 선택된 하나 이상의 추가의 화합물을 더 포함하는 살충성 조성물.

청구항 12

제 3 항에 있어서, 살해충제, 식물 성장 조절제, 비료 및 토양 개량제로 구성된 그룹중에서 선택된 하나 이상의 추가의 화합물을 더 포함하는 살충성 조성물.

청구항 13

제 5 항에 있어서, 살해충제, 식물 성장 조절제, 비료 및 토양 개량제로 구성된 그룹중에서 선택된 하나 이상의 추가의 화합물을 더 포함하는 살충성 조성물.

청구항 14

제 7 항에 있어서, 살해충제, 식물 성장 조절제, 비료 및 토양 개량제로 구성된 그룹중에서 선택된 하나 이상의 추가의 화합물을 더 포함하는 살충성 조성물.

청구항 15

제 9 항에 있어서, 살해충제, 식물 성장 조절제, 비료 및 토양 개량제로 구성된 그룹중에서 선택된 하나 이상의 추가의 화합물을 더 포함하는 살충성 조성물.

청구항 16

제 10 항에 있어서, 살해충제, 식물 성장 조절제, 비료 및 토양 개량제로 구성된 그룹중에서 선택된 하나 이상의 추가의 화합물을 더 포함하는 살충성 조성물.

청구항 17

제 1 항의 조성물을 곤충이 존재하거나 존재할 것으로 예상되는 장소에 적용하는 것을 포함하는 곤충의 구제 방법.

청구항 18

제 3 항의 조성물을 곤충이 존재하거나 존재할 것으로 예상되는 장소에 적용하는 것을 포함하는 곤충의 구제 방법.

청구항 19

제 5 항의 조성물을 곤충이 존재하거나 존재할 것으로 예상되는 장소에 적용하는 것을 포함하는 곤충의 구제 방법.

청구항 20

제 7 항의 조성물을 곤충이 존재하거나 존재할 것으로 예상되는 장소에 적용하는 것을 포함하는 곤충의 구제 방법.

청구항 21

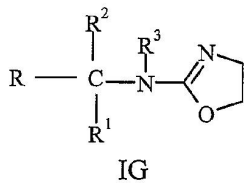
제 9 항의 조성물을 곤충이 존재하거나 존재할 것으로 예상되는 장소에 적용하는 것을 포함하는 곤충의 구제 방법.

청구항 22

제 10 항의 조성물을 곤충이 존재하거나 존재할 것으로 예상되는 장소에 적용하는 것을 포함하는 곤충의 구제 방법.

청구항 23

화학식 IG의 화합물 및 그의 농학적으로 허용되는 염:



상기 식에서,

R은 1-나프틸, 페닐, 또는 할로젠, (C₁-C₂) 알킬, (C₁-C₂) 알콕시, (C₁-C₂) 할로알킬 및 페닐중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 임의로 치환된 페닐에서 선택되고;

R¹은 수소, (C₁-C₂) 알킬, (C₁-C₂) 하이드록시알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬에서 선택되며;

R²는 수소 및 (C₁-C₂) 알킬에서 선택되고;

R³은 수소, (C₁-C₂) 알킬,

$ \begin{array}{c} \text{R}^8 \\ \\ -\text{P}-\text{R}^7 \\ \\ \text{X} \end{array} $	$ \begin{array}{c} \text{X} \\ \\ -\text{C}-\text{N}-\text{R}^{13}\text{R}^{14} \end{array} $	$ -\text{S}(\text{O})_a-\text{R}^{15} $	$ \begin{array}{c} \text{X} \\ \\ -\text{C}-\text{R}^{16} \end{array} $	$ -\text{CH}=\text{N}-\text{R}^{19} $
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

에서 선택되며;

여기에서,

X는 산소 또는 황이고;

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이며;

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;

R¹⁴는 수소이며;

a는 2이고;

R¹⁵는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이며;

R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이고;

R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이나;

단,

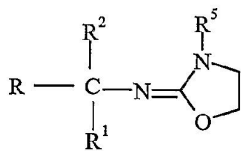
R¹이 메틸이고, R² 및 R³은 수소인 경우, R은 페닐이 아니고;

R이 1-나프틸이고, R³은 수소인 경우, R¹ 및 R²는 (C₁-C₂) 알킬이 아니며;

R¹, R² 및 R³이 수소인 경우, R은 2-클로로페닐, 2-플루오로페닐, 2-메틸페닐, 4-클로로페닐, 3-트리플루오로메틸페닐, 3,4-디클로로페닐 및 3,5-디클로로페닐이 아니다.

청구항 24

화학식 IH의 화합물 및 그의 농화학적으로 허용되는 염:



IH

상기 식에서,

R은 1-나프틸, 페닐, 또는 할로젠 및 (C₁-C₂) 알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 임의로 치환된 페닐이고;

R¹은 수소, (C₁-C₄) 알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬에서 선택되며;

R²는 수소이고;

R⁵는 시아노, (C₁-C₂) 알콕시(C₁-C₂) 알킬, 4-(C₁-C₂) 알콕시벤질,

$ \begin{array}{c} \text{R}^8 \\ \\ -\text{P} - \text{R}^7 \\ \\ \text{X} \end{array} $	$ \begin{array}{c} \text{R}^{10} \quad \text{O} \\ \quad \\ -\text{CH}-\text{O}-\text{C}-\text{R}^{11} \end{array} $	$ \begin{array}{c} \text{X} \\ \\ -\text{C}-\text{N}-\text{R}^{13}\text{R}^{14} \end{array} $
(1),	(3),	(5),

-S(O) _n -R ¹⁵	$ \begin{array}{c} \text{X} \\ \\ -\text{C}-\text{R}^{16} \end{array} $	-CH=N-R ¹⁹
(6),	(7) 및	(9);

에서 선택되며;

여기에서,

X는 산소 또는 황이고;

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시 또는 (C₁-C₂) 할로알킬이며;

R¹⁰은 수소이고;

R¹¹은 (C₁-C₄) 알킬이며;

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;

R¹⁴는 수소 또는 (C₁-C₂) 알킬이며;

a는 2이고;

R¹⁵는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이며;

R¹⁶은 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이고;

R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이나;

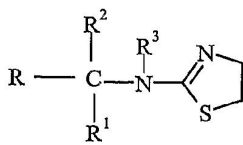
단,

R이 1-나프틸이고, R⁵는 X가 황이고 R¹³은 메틸이며 R¹⁴는 수소인 식 (5)인 경우, R¹은 (C₁-C₄) 알킬이 아니고;

R은 3-클로로-2-메틸페닐이고, R¹은 수소인 경우, R⁵는 X가 산소이고 R¹³은 메틸이며 R¹⁴는 수소인 식 (5) 또는 R¹⁵가 메틸인 식 (6)이 아니다.

청구항 25

화학식 IJ의 화합물 및 그의 농화학적으로 허용되는 염:



IJ

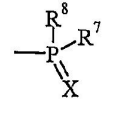
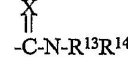
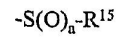

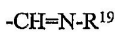
상기 식에서,

R은 1-나프틸, 2-(C₁-C₂) 알콕시페닐, 3-(C₁-C₂) 알콕시페닐, 4-(C₁-C₂) 알콕시페닐, 2,4-(C₁-C₂) 디알콕시페닐, 페닐, 또는 할로젠, (C₁-C₂) 알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 임의로 치환된 페닐에서 선택되고;

R¹은 수소, (C₁-C₃) 알킬, 페닐 또는 벤질에서 선택되며;

R²는 수소이고;

R³은 수소, (C₁-C₂) 알킬,

				
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

에서 선택되며;

여기에서,

X는 산소 또는 황이고;

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이며;

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;

R¹⁴는 수소이며;

a는 2이고;

R¹⁵는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이며;

R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이고;

R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이나,

단,

R이 2,3-디메틸페닐 이외의 것인 경우, R¹ 또는 R³의 적어도 하나는 수소가 아니며;

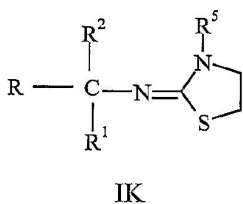
R이 페닐이고, R¹ 및 R³은 메틸인 경우, 화합물은 ((1S)-1-페닐에틸)메틸-1,3-티아졸린-2-일아민 이성체가 아니며;

R은 페닐이고, R¹은 메틸이며, R³은 수소인 경우, 화합물은 ((1R)-1-페닐에틸)-1,3-티아졸린-2-일아민 이성체가 아니며;

R이 2,3-디클로로페닐이고, R¹은 수소인 경우, R³은 X가 산소이고 R¹⁶은 메톡시인 식 (7)이 아니다.

청구항 26

화학식 IK의 화합물 및 그의 농화학적으로 허용되는 염:

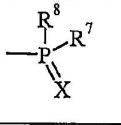
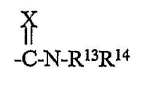



상기 식에서,

R은 할로젠 및 (C₁-C₂) 알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 임의로 치환된 페닐이고;

R¹ 및 R²는 수소이며;

R⁵는

		$-\text{S}(\text{O})_a-\text{R}^{15}$		$-\text{CH}=\text{N}-\text{R}^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

에서 선택되고;

여기에서,

X는 산소 또는 황이며;

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이고;

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이며;

R¹⁴는 수소이고;

a는 2이며;

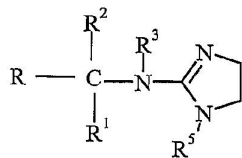
R¹⁵는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이고;

R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이며;

R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이다.

청구항 27

화학식 II의 화합물 및 그의 농화학적으로 허용되는 염:



II

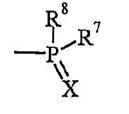
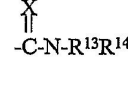

상기 식에서,

R은 1-나프틸, 페닐, 또는 할로겐, (C₁-C₂) 알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환된 페닐에서 선택되고;

R¹은 수소, (C₁-C₃) 알킬, 페닐 또는 벤질에서 선택되며;

R²는 수소이고;

R³은 수소, (C₁-C₂) 알킬,

		$-S(O)_a-R^{15}$		$-CH=N-R^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

에서 선택되며;

여기에서,

X는 산소 또는 황이고;

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이며;

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;

R¹⁴는 수소 또는 (C₁-C₂) 알킬이며;

a는 2이고;

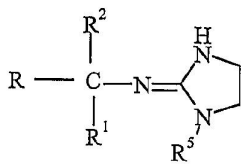
R¹⁵는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이며;

R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이고;

R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이다.

청구항 28

화학식 IM의 화합물 및 그의 농화학적으로 허용되는 염:



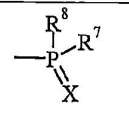
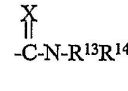

IM

상기 식에서,

R은 할로젠 및 (C₁-C₂) 알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 임의로 치환된 페닐이고;

R¹ 및 R²는 수소이며;

R⁵는 시아노,

		$-S(O)_a-R^{15}$		$-CH=N-R^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

에서 선택되고;

여기에서,

X는 산소 또는 황이며;

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이고;

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이며;

R¹⁴는 수소 또는 (C₁-C₂) 알킬이고;

a는 2이며;

R¹⁵는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이고;

R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이며;

R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이다.

청구항 29

제 23 항의 화합물을 포함하는 살충성 조성물.

청구항 30

제 24 항의 화합물을 포함하는 살충성 조성물.

청구항 31

제 25 항의 화합물을 포함하는 살충성 조성물.

청구항 32

제 26 항의 화합물을 포함하는 살충성 조성물.

청구항 33

제 27 항의 화합물을 포함하는 살충성 조성물.

청구항 34

제 28 항의 화합물을 포함하는 살충성 조성물.

명세서

기술 분야

- <1> 본 출원은 2005년 5월 19일자로 출원된 미국 가출원 제 60/682,460호의 이점을 청구하고 있다.
- <2> 본 발명은 일반적으로 살충 화합물 및 곤충 및 진드기를 구제하는데 있어서 그의 용도에 관한 것이다. 특히, 본 발명은 살충성 치환된 아미노알킬 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 유도체 및 그의 농학적으로 허용가능한 염의 조성물 및 곤충 및 진드기를 구제하는데 있어서 그의 사용방법에 관한 것이다.

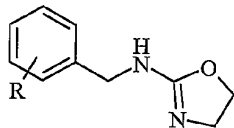
배경 기술

- <3> 곤충은 일반적으로 농업 분야에서 경작되는 농작물뿐만 아니라, 예를 들면, 흰개미 및 흰색 곰팡이와 같은 토양성 곤충(soil-borne insect)에 의해 손상이 유발되는 구조물 및 잔디밭에 심각한 손상을 야기시킬 수 있는 것으로 알려졌다. 이러한 손상에 따라 소정 작물, 잔디밭 또는 구조물과 관련하여 수백만 달러의 가치 손실이 초래될 수 있다. 다수의 곤충 목들이 상당한 농작물 손상을 유발시킬 수 있지만, 예를 들어 "매미"목의 곤충이 특히 중요하다. 매미목으로는, 예를 들어 진딧물, 멸구, 매미, 가루이 및 벚나무 깍지벌레를 들 수 있다. 매미

류 곤충은 뚫거나/흡입하는 구기를 가지고 있어, 유관속 식물로부터 액즙을 빨아들여 양분을 충족할 수 있다. 매미류에 의한 곤충 손상은 직접적인 먹이 섭취에 의해 유발되는 손상 이외에도, 다수의 상이한 방식으로 나타난다. 일례로, 많은 종들은 곤충이 먹고 사는 식물에 부착성인 점착성 노폐물인 감로를 분비한다. 감로는 단독으로 농작물에 외관상 손상을 유발시킨다. 그을음병은 종종 감로에서 증식하여 식품이나 관상 식물의 외관을 불품 없게 만들며, 이로 인해 이들의 장식 및 경제적인 가치가 감소할 것이다. 일부 매미류 곤충들은 그들이 섭취하는 식물에 독성 타액을 주입한다. 상기 타액은 형태를 손상시켜 식물에 손상을 입히며, 일부의 경우에는 식물을 고사시키기도 한다. 매미류 곤충들은 또한 종종 질병 유발 병원체를 매개할 수 있다. 직접적인 손상과 달리, 소수의 질병 매개 곤충으로도 농작물에 상당한 손상이 일어난다.

<4> 따라서, 보다 안전하면서 더 효과적이고 비용이 덜 드는 새로운 살충제 및 새로운 살비제가 계속해서 요구되고 있다. 살충제 및 살비제는, 구제하지 않으면 밀, 옥수수, 대두, 감자, 목화 등의 농작물에 대해 토양 위 및 토양 아래 수준 모두에서 현저한 손상을 유발할 수 있는 곤충 및 진드기를 구제하는데 유용하다. 농작물 보호를 위해서, 농작물에는 해를 입히지 않으면서 곤충 및 진드기를 구제할 수 있고 포유동물 및 다른 살아있는 유기체에 유해한 영향이 없는 살충제 및 살비제가 요구된다.

<5> 다수의 논문 및 특허들에는 살충 활성 용도를 가지는 것으로 보고된 몇몇 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 화합물이 개시되었다. 예를 들어, [Journal of Insect Science, 3:4(온라인으로부터 이용가능: insectscience.org /3.4)는 화랑곡나방 *Plodia interpunctella*의 우는 행동을 억제하는 일부 옥토파민 작용제의 유효성에 대해 보고하였다. 본 조사에는 하기 구조의 화합물이 포함되었다:

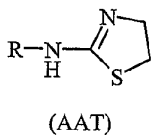


<6>

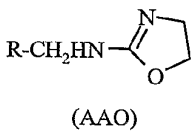
<7> 상기 식에서,

<8> R은 알킬 또는 두 할로젠 원자이다.

<9> [Pesticide Science, 55:119-128 (1999)]에는 이동메뚜기인 풀무치(*Locusta migratoria*) 및 미국 바퀴(*Periplaneta Americana*)에 대한 옥토파미너직 리간드의 정량적인 구조-활성 조사가 개제되었다. 본 조사에는 하기 구조의 화합물이 포함되었다:



<10>



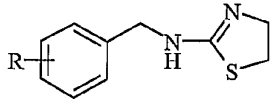
<11>

<12> 상기 식에서,

<13> 화학식 (AAT)에서의 R은 벤질 및 메틸, 트리플루오로메틸 또는 1 내지 2개의 할로젠 원자에 의해 치환된 벤질을 포함하고,

<14> 화학식 (AAO)에서의 R은 트리플루오로메틸 또는 1 내지 2개의 할로젠 원자에 의해 치환된 페닐을 포함한다.

<15> [Pesticide Science, 1995, 43 311-315]에는 미국 바퀴(*Periplaneta Americana*)에 대한 일부 옥토파미너직 작용제의 정량적인 구조-활성 조사가 개제되었다. 본 조사에는 하기 구조의 화합물이 포함되었다:



<16>

<17>

상기 식에서,

<18>

R은 수소, 메틸, 트리플루오로메틸, 메톡시 또는 1 내지 2개의 할로젠 원자이다.

<19>

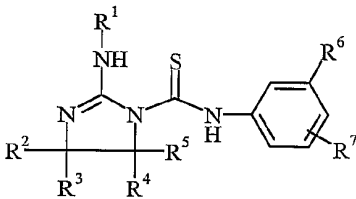
[Bioscience, Biotechnology, and Biochemistry (1992), 56(7), 1062-5]에는 2-(치환된 벤질아미노)-2-티아졸린의 합성 및 옥토파미너직 활성이 기술되었다.

<20>

[European Journal of Medicinal Chemistry (1980), 15(1), 41-53]에는 이노 및 염분 배설 활성을 가지는 신규 "벤질"-티오우레아 유도체 및 이들 사이클릭 유사체의 합성이 개시되었다.

<21>

미국 특허 제 4,195,092호에는 살충제로 유용한 하기 화학식의 2-(치환된 아미노)-N-(3-치환된 페닐)-2-이미다졸린-1-카보티오아미드가 개시되었다:



<22>

<23>

상기 식에서,

<24>

R¹은 약 18개 이하의 탄소 원자를 가지며 페닐 부분이 C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 알콕시, C₁-C₆ 알킬티오, 트리플루오로메틸, 할로 및 시아노중에서 선택된 1 내지 3개의 그룹에 의해 임의로 치환된 페닐알킬을 포함하고;

<25>

R², R³, R⁴ 및 R⁵는 독립적으로 수소, C₁-C₃ 알킬 및 페닐중에서 선택되며;

<26>

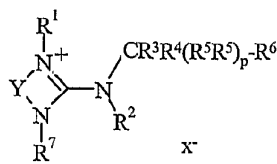
R⁶은 할로, 트리플루오로메틸, 시아노 또는 1,1,2,2-테트라플루오로에톡시를 나타내고;

<27>

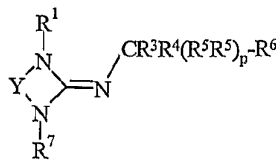
R⁷은 수소, C₁-C₃ 알킬 또는 할로를 나타낸다.

<28>

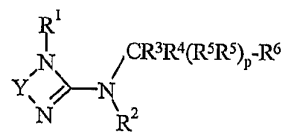
국제 출원 공개 제 WO 91/05473호는 농학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께, 하기 화학식의 살진균성 조성물, 화합물 및 이들의 제조 및 용도에 대해 개시하였다:



I-A



I-B



I-C

<29>

<30>

R¹ 및 R⁷은 각각 독립적으로 수소 또는 C₁-C₃ 알킬이고,

<31>

R²는 수소 또는 C₁-C₆ 알킬이며,

<32>

R³ 및 R⁴는 독립적으로 및 각 R⁵는 독립적으로 수소 또는 C₁-C₄ 알킬이고,

<33>

R⁶은 1 내지 5개의 식 R⁸ 그룹에 의해 치환된 사이클로헥실 그룹 또는 모노사이클릭 또는 비사이클릭 방향족 그룹이며, 여기에서 R⁸은 할로젠, C₁-C₁₀ 알킬 그룹, C₁-C₁₀ 알콕시 그룹, 트리-C₁-C₄-알킬실릴 그룹, 또는 각각 페

닐 또는 페녹시 그룹이 하나 이상의 할로젠 원자, C₁-C₆ 알킬 또는 C₁-C₆ 알콕시 그룹, 트리할로메틸 그룹, 페닐 그룹 또는 페녹시 그룹에 의해 임의로 치환된 페녹시, 페닐, 페닐-C₁-C₂-알킬렌 또는 페닐-C₂-알케닐렌 그룹이고,

<34> p는 0, 1 또는 2이며,

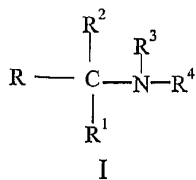
<35> Y는 식 -C(R⁹R⁹)_n-의 그룹이고, 여기에서 n은 2, 3 또는 4이며, 각 R⁹는 독립적으로 수소 또는 G-C₄ 알킬이고,

<36> X는 적합한 카운터 이온이다.

<37> 상기 언급된 어떠한 특허 또는 문헌에도 "매미" 목의 구성원에 대한 본 발명의 화합물의 살충 활성이 개시되거나 제시되어 있지 않다. 또한, 상기 언급된 어떠한 특허 또는 문헌에도 본 발명의 신규 화합물의 구조가 개시되거나 제시되어 있지 않다.

<38> 발명의 요약

<39> 본 발명은 일반적으로 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 유도체의 살충 및 살비 조성물, 특정의 유용한 신규 화합물, 즉 본 발명의 살충 및 살비 조성물 및 방법의 사용시에 곤충 및 진드기를 구제하는데 놀랄 만치 활성적인 특성의 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 유도체에 관한 것이다. 본 발명의 살충 및 살비 조성물은 적어도 하나의 살충적으로 유효한 양의 화학식 (I)의 화합물 및 그의 적어도 하나의 살충적으로 상용성인 담체로 이루어지며, 여기에서 화합물은 하기 화학식 I 및 그의 농학적으로 허용되는 염이다:



<40>

<41> 상기 식에서,

<42> R, R¹, R² 및 R³는 이하 상세히 설명되며;

<43> R⁴는



(A),



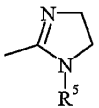
(B),



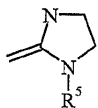
(C),



(D),



(E)



(F);

<44>

<45> 중에서 선택되고,

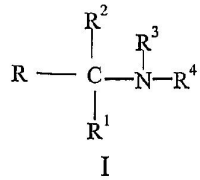
<46> R³은 이하 상세히 설명되는 바와 같거나, R⁴에서의 연결 원자와 함께 식 (B), 식 (D) 및 식 (F)에서와 같이 이중 결합을 형성한다.

<47> 본 발명은 또한 살충 유효량의 적어도 하나의 화학식 I의 화합물 및 임의로 유효량의 적어도 하나의 추가의 화합물을 적어도 하나의 살충제에 적합한 담체와 함께 함유하는 조성물에 관한 것이다.

<48> 본 발명은 또한 살충 유효량의 상기 조성물을 농작물 재배 장소, 또는 곤충이 존재하거나 존재할 것으로 예상되는 작물, 건물, 토양 또는 다른 장소에 적용하는 것을 포함하여, 구제를 원하는 곤충을 구제하는 방법에 관한 것이다.

발명의 상세한 설명

<49> 본 발명은 일반적으로 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 유도체의 살충 및 살비 조성물, 특정의 유용한 신규 화합물, 즉 본 발명의 살충 및 살비 조성물 및 방법의 사용시에 곤충 및 진드기를 구제하는데 놀랄 만치 활성적인 특성의 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 유도체에 관한 것이다. 본 발명의 살충 및 살비 조성물은 적어도 하나의 살충적으로 유효한 양의 화학식 (I)의 화합물 및 그의 적어도 하나의 살충적으로 상용성인 담체로 이루어지며, 여기에서 화합물은 하기 화학식 I 및 그의 농학적으로 허용되는 염이다:

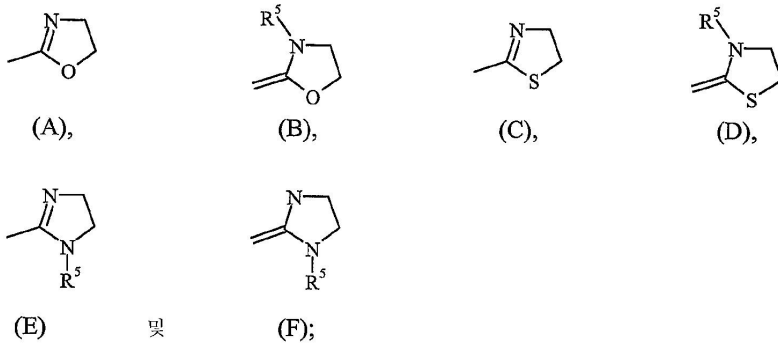


<50>

<51> 상기 식에서,

<52> R, R¹, R² 및 R⁵는 이하 상세히 설명되며;

<53> R⁴는

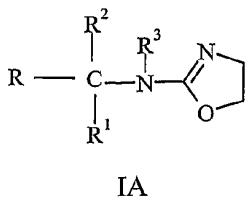


<54>

<55> 중에서 선택되고,

<56> R³은 이하 상세히 설명되는 바와 같거나, R⁴에서의 연결 원자와 함께 식 (B), 식 (D) 및 식 (F)에서와 같이 이중 결합을 형성한다.

<57> 보다 특히, 본 발명의 상기 측면에서 바람직한 것은 화학식 IA의 화합물로 구성된 살충성 조성물이다:



<58>

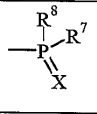
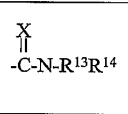
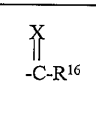
<59> 상기 식에서,

<60> R은 1-나프틸, 페닐, 또는 할로젠, (C₁-C₂) 알킬, (C₁-C₂) 알콕시, (C₁-C₂) 할로알킬 및 페닐중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환된 페닐에서 선택되고;

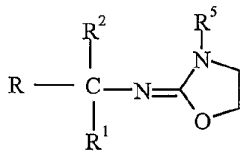
<61> R¹은 수소, (C₁-C₂) 알킬, (C₁-C₂) 하이드록시알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬에서 선택되며;

<62> R²는 수소 및 (C₁-C₂) 알킬에서 선택되고;

<63> R³은 수소, (C₁-C₂) 알킬,

		<p>-S(O)_a-R¹⁵</p>		<p>-CH=N-R¹⁹</p>
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

- <64>
- <65> 에서 선택되며;
- <66> 여기에서,
- <67> X는 산소 또는 황이고;
- <68> R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이며;
- <69> R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;
- <70> R¹⁴는 수소이며;
- <71> a는 2이고;
- <72> R¹⁵는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이며;
- <73> R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이고;
- <74> R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이나;
- <75> 단, R이 1-나프틸이고 R³은 수소인 경우, R¹ 및 R²는 (C₁-C₂) 알킬이 아니다.
- <76> 본 발명의 상기 측면에서 보다 바람직한 것은
- <77> R이 2,3-디클로로페닐 또는 2,3-디메틸페닐이고;
- <78> R¹은 수소 또는 메틸이며;
- <79> R² 및 R³ 수소인 화학식 IA의 화합물로 구성된 살충성 조성물이다.
- <80> 본 발명의 다른 측면에 있어서, 바람직한 것은 화학식 IB의 화합물로 구성된 살충성 조성물이다:



IB

- <81>
- <82> 상기 식에서,
- <83> R은 1-나프틸, 페닐, 또는 할로젠 및 (C₁-C₂) 알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환된 페닐이고;
- <84> R¹은 수소, (C₁-C₄) 알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬에서 선택되며;
- <85> R²는 수소이고;

<86> R⁵는 시아노, (C₁-C₂) 알콕시(C₁-C₂) 알킬, 4-(C₁-C₂) 알콕시벤질,

$\begin{array}{c} R^8 \\ \\ -P-R^7 \\ \\ X \end{array}$	$\begin{array}{c} R^{10} \quad O \\ \quad \\ -CH-O-C-R^{11} \end{array}$	$\begin{array}{c} X \\ \\ -C-N-R^{13}R^{14} \end{array}$
(1),	(3),	(5),

<87>

-S(O) _a -R ¹⁵	$\begin{array}{c} X \\ \\ -C-R^{16} \end{array}$	-CH=N-R ¹⁹
(6),	(7) 및	(9);

<88>

<89> 에서 선택되며;

<90> 여기에서,

<91> X는 산소 또는 황이고;

<92> R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시 또는 (C₁-C₂) 할로알킬이며;

<93> R¹⁰은 수소이고;

<94> R¹¹은 (C₁-C₄) 알킬이며;

<95> R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;

<96> R¹⁴는 수소 또는 (C₁-C₂) 알킬이며;

<97> a는 2이고;

<98> R¹⁵는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이며;

<99> R¹⁶은 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이고;

<100> R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이나;

<101> 단,

<102> R이 1-나프틸이고, R⁵는 X가 황이고 R¹³은 메틸이며 R¹⁴는 수소인 식 (5)인 경우, R¹은 (C₁-C₂) 알킬이 아니고;

<103> R은 3-클로로-2-메틸페닐이고, R¹은 수소인 경우, R⁵는 X가 산소이고 R¹³은 메틸이며 R¹⁴는 수소인 식 (5) 또는 a가 2이고 R¹⁵는 메틸인 식 (6)이 아니다.

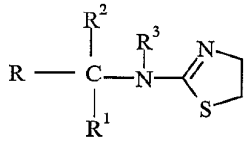
<104> 본 발명의 상기 측면에서 보다 바람직한 것은

<105> R이 2,3-디클로로페닐, 2,3-디메틸페닐 또는 3-클로로-2-메틸페닐이고;

<106> R¹은 수소이며;

<107> R⁵는 시아노, 식 (1), 식 (5) 또는 식 (7)인 화학식 IB의 화합물로 구성된 살충성 조성물이다.

<108> 본 발명의 또 다른 측면에 있어서, 바람직한 것은 화학식 IC의 화합물로 구성된 살충성 조성물이다:



IC

<109>

상기 식에서,

<110>

R은 1-나프틸, 2-(C₁-C₂) 알콕시페닐, 3-(C₁-C₂) 알콕시페닐, 4-(C₁-C₂) 알콕시페닐, 2,4-(C₁-C₂) 디알콕시페닐, 페닐, 또는 할로겐, (C₁-C₂) 알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환된 페닐에서 선택되고;

<111>

R¹은 수소, (C₁-C₃) 알킬, 페닐 또는 벤질에서 선택되며;

<112>

R²는 수소이고;

<113>

R³은 수소, (C₁-C₂) 알킬,

<114>

$ \begin{array}{c} \text{R}^8 \\ \\ -\text{P}-\text{R}^7 \\ \\ \text{X} \end{array} $	$ \begin{array}{c} \text{X} \\ \\ -\text{C}-\text{N}-\text{R}^{13}\text{R}^{14} \end{array} $	$-\text{S}(\text{O})_a-\text{R}^{15}$	$ \begin{array}{c} \text{X} \\ \\ -\text{C}-\text{R}^{16} \end{array} $	$-\text{CH}=\text{N}-\text{R}^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

<115>

에서 선택되고;

<116>

여기에서,

<117>

X는 산소 또는 황이며;

<118>

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이고;

<119>

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이며;

<120>

R¹⁴는 수소이고;

<121>

a는 2이며;

<122>

R¹⁵는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이고;

<123>

R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이며;

<124>

R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이나;

<125>

단,

<126>

R¹ 및 R³이 수소인 경우, R은 2-메틸페닐, 2,4-디메틸페닐 또는 2-클로로-6-메틸페닐이 아니며;

<127>

R이 페닐이고, R¹ 및 R³은 메틸인 경우, 화합물은 ((1S)-1-페닐에틸)메틸-1,3-티아졸린-2-일아민 이성체가 아니고;

<128>

R이 페닐이고, R¹은 메틸이며, R³은 수소인 경우, 화합물은 ((1R)-1-페닐에틸)-1,3-티아졸린-2-일아민 이성체가

<129>

아니고;

<130> R은 2,3-디클로로페닐이고, R¹은 수소인 경우, R³은 X가 산소이고 R¹⁶은 메톡시인 식 (7)이 아니다.

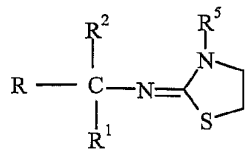
<131> 본 발명의 상기 측면에서 보다 바람직한 것은

<132> R이 2,3-디클로로페닐 또는 2,3-디메틸페닐이고;

<133> R¹은 수소 또는 메틸이며;

<134> R³은 수소 또는 식 (7)이고, 여기에서 X는 산소이고 R¹⁶은 (C₁-C₂) 알콕시인 화학식 IC의 화합물로 구성된 살충성 조성물이다.

<135> 본 발명의 또 다른 측면에 있어서, 바람직한 것은 화학식 ID의 화합물로 구성된 살충성 조성물이다:



ID

<136>

상기 식에서,

<138> R은 할로젠 및 (C₁-C₂) 알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 임의로 치환된 페닐이고;

<139> R¹ 및 R²는 수소이며;

<140> R⁵는

		-S(O) _a -R ¹⁵		-CH=N-R ¹⁹
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

<141>

에서 선택되고;

<142>

여기에서,

<143>

X는 산소 또는 황이며;

<144>

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이고;

<145>

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이며;

<146>

R¹⁴는 수소이고;

<147>

a는 2이며;

<148>

R¹⁵는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이고;

<149>

R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이며;

<150>

R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이다.

<151>

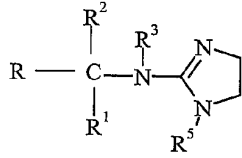
본 발명의 상기 측면에서 보다 바람직한 것은

<152>

<153> R이 2,3-디클로로페닐, 2,3-디메틸페닐이고;

<154> R⁵는 X가 황인 식 (1) 또는 X가 산소이고 R¹⁶은 (C₁-C₂) 알콕시인 식 (7)인 화학식 ID의 화합물로 구성된 살충성 조성물이다.

<155> 본 발명의 또 다른 측면에 있어서, 바람직한 것은 화학식 IE의 화합물로 구성된 살충성 조성물이다:



IE

<156>

<157> 상기 식에서,

<158> R은 1-나프틸, 페닐, 또는 할로젠, (C₁-C₂) 알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환된 페닐에서 선택되고;

<159> R¹은 수소, (C₁-C₃) 알킬, 페닐 또는 벤질에서 선택되며;

<160> R²는 수소이고;

<161> R³은 수소, (C₁-C₂) 알킬,

		-S(O) _a -R ¹⁵		-CH=N-R ¹⁹
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

<162>

<163> 에서 선택되며;

<164> 여기에서,

<165> X는 산소 또는 황이고;

<166> R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이며;

<167> R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;

<168> R¹⁴는 수소 또는 (C₁-C₂) 알킬이며;

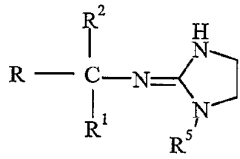
<169> a는 2이고;

<170> R¹⁵는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이며;

<171> R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이고;

<172> R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이다.

<173> 본 발명의 또 다른 측면에 있어서, 바람직한 것은 화학식 IF의 화합물로 구성된 살충성 조성물이다:



IF

<174>

<175>

상기 식에서,

<176>

R은 할로젠 및 (C₁-C₂) 알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 임의로 치환된 페닐이고;

<177>

R¹ 및 R²는 수소이며;

<178>

R⁵는 시아노,

		-S(O) _a -R ¹⁵		-CH=N-R ¹⁹
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

<179>

에서 선택되고;

<180>

<181>

여기에서,

<182>

X는 산소 또는 황이며;

<183>

R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이고;

<184>

R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이며;

<185>

R¹⁴는 수소 또는 (C₁-C₂) 알킬이고;

<186>

a는 2이며;

<187>

R¹⁵는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이고;

<188>

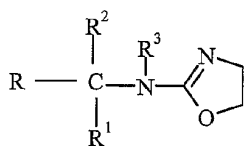
R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이며;

<189>

R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이다.

<190>

본 발명의 조성물에 유용한 특정의 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 유도체는 신규 화합물이다. 많은 이들 화합물은 하기 화학식 IG 및 그의 농화학적으로 허용되는 염으로 나타내어진다:



IG

<191>

<192>

상기 식에서,

<193>

R은 1-나프틸, 페닐, 또는 할로젠, (C₁-C₂) 알킬, (C₁-C₂) 알콕시, (C₁-C₂) 할로알킬 및 페닐중에서 선택된 1 또

는 2개의 치환체에 의해 치환된 페닐에서 선택되고;

<194> R¹은 수소, (C₁-C₂) 알킬, (C₁-C₂) 하이드록시알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬에서 선택되며;

<195> R²는 수소 및 (C₁-C₂) 알킬에서 선택되고;

<196> R³은 수소, (C₁-C₂) 알킬,

(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

<197>

<198> 에서 선택되며;

<199> 여기에서,

<200> X는 산소 또는 황이고;

<201> R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이며;

<202> R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;

<203> R¹⁴는 수소이며;

<204> a는 2이고;

<205> R¹⁵는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이며;

<206> R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이고;

<207> R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이나;

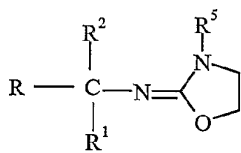
<208> 단,

<209> R¹이 메틸이고, R² 및 R³은 수소인 경우, R은 페닐이 아니고;

<210> R이 1-나프틸이고, R³은 수소인 경우, R¹ 및 R²는 (C₁-C₂) 알킬이 아니며;

<211> R¹, R² 및 R³이 수소인 경우, R은 2-클로로페닐, 2-플루오로페닐, 2-메틸페닐, 4-클로로페닐, 3-트리플루오로메틸페닐, 3,4-디클로로페닐 및 3,5-디클로로페닐이 아니다.

<212> 본 발명의 조성물에 유용한 그밖의 다른 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 유도체는 신규 화합물이다. 이들 화합물은 하기 화학식 III 및 그의 농화학적으로 허용되는 염으로 나타내어진다:



III

<213>

<214> 상기 식에서,

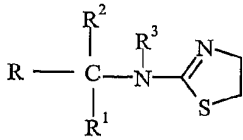
- <215> R은 1-나프틸, 페닐, 또는 할로젠 및 (G-C₂) 알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환된 페닐이고;
- <216> R¹은 수소, (C₁-C₄) 알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬에서 선택되며;
- <217> R²는 수소이고;
- <218> R⁵는 시아노, (C₁-C₂) 알콕시(C₁-C₂) 알킬, 4-(C₁-C₂) 알콕시벤질,

$\begin{array}{c} R^8 \\ \\ -P-R^7 \\ \\ X \end{array}$	$\begin{array}{c} R^{10} \quad O \\ \quad \\ -CH-O-C-R^{11} \end{array}$	$\begin{array}{c} X \\ \\ -C-N-R^{13}R^{14} \end{array}$
(1),	(3),	(5),

<219>

-S(O) _a -R ¹⁵	$\begin{array}{c} X \\ \\ -C-R^{16} \end{array}$	-CH=N-R ¹⁹
(6),	(7) 및	(9);

- <220> 에서 선택되며;
- <221> 여기서,
- <222> X는 산소 또는 황이고;
- <223> R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시 또는 (C₁-C₂) 할로알킬이며;
- <224> R¹⁰은 수소이고;
- <225> R¹¹은 (C₁-C₄) 알킬이며;
- <226> R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;
- <227> R¹⁴는 수소 또는 (C₁-C₂) 알킬이며;
- <228> a는 2이고;
- <229> R¹⁵는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이며;
- <230> R¹⁶은 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이고;
- <231> R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이나;
- <232> 단,
- <233> R이 1-나프틸이고, R⁵는 X가 황이고 R¹³은 메틸이며 R¹⁴는 수소인 식 (5)인 경우, R¹은 (C₁-C₄) 알킬이 아니고;
- <234> R은 3-클로로-2-메틸페닐이고, R¹은 수소인 경우, R⁵는 X가 산소이고 R¹³은 메틸이며 R¹⁴는 수소인 식 (5) 또는 R¹⁵가 메틸인 식 (6)이 아니다.
- <235> 본 발명의 조성물에 유용한 그밖의 또 다른 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 유도체는 신규 화합물이다. 이들 화합물은 하기 화학식 IJ 및 그의 농화학적으로 허용되는 염으로 나타내어진다:



IJ

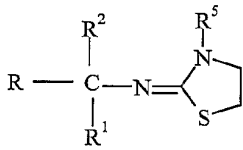
- <237>
- <238> 상기 식에서,
- <239> R은 1-나프틸, 2-(C₁-C₂) 알콕시페닐, 3-(C₁-C₂) 알콕시페닐, 4-(C₁-C₂) 알콕시페닐, 2,4-(C₁-C₂) 디알콕시페닐, 페닐, 또는 할로젠, (C₁-C₂) 알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환된 페닐에서 선택되고;
- <240> R¹은 수소, (C₁-C₃) 알킬, 페닐 또는 벤질에서 선택되며;
- <241> R²는 수소이고;
- <242> R³은 수소, (C₁-C₂) 알킬,

(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

- <243>
- <244> 에서 선택되며;
- <245> 여기에서,
- <246> X는 산소 또는 황이고;
- <247> R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이며;
- <248> R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;
- <249> R¹⁴는 수소이며;
- <250> a는 2이고;
- <251> R¹⁵는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이며;
- <252> R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이고;
- <253> R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이나,
- <254> 단,
- <255> R이 2,3-디메틸페닐 이외의 것인 경우, R¹ 또는 R³의 적어도 하나는 수소가 아니며;
- <256> R이 페닐이고, R¹ 및 R³은 메틸인 경우, 화합물은 ((1S)-1-페닐에틸)메틸-1,3-티아졸린-2-일아민 이성체가 아니며;
- <257> R은 페닐이고, R¹은 메틸이며, R³은 수소인 경우, 화합물은 ((1R)-1-페닐에틸)-1,3-티아졸린-2-일아민 이성체가 아니며;

<258> R이 2,3-디클로로페닐이고, R¹은 수소인 경우, R³은 X가 산소이고 R¹⁶은 메톡시인 식 (7)이 아니다.

<259> 본 발명의 조성물에 유용한 그밖의 또 다른 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 유도체는 신규 화합물이다. 이들 화합물은 하기 화학식 IK 및 그의 농화학적으로 허용되는 염으로 나타내어진다:



IK

<260>

<261> 상기 식에서,

<262> R은 할로젠 및 (C₁-C₂) 알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 임의로 치환된 페닐이고;

<263> R¹ 및 R²는 수소이며;

<264> R⁵는

		-S(O) _a -R ¹⁵		-CH=N-R ¹⁹
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

<265>

<266> 에서 선택되고;

<267> 여기에서,

<268> X는 산소 또는 황이며;

<269> R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이고;

<270> R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이며;

<271> R¹⁴는 수소이고;

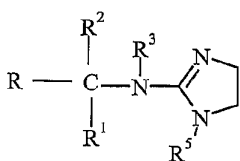
<272> a는 2이며;

<273> R¹⁵는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이고;

<274> R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이며;

<275> R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이다.

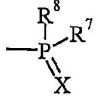
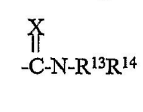
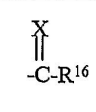
<276> 본 발명의 조성물에 유용한 그밖의 또 다른 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 유도체는 신규 화합물이다. 이들 화합물은 하기 화학식 IL 및 그의 농화학적으로 허용되는 염으로 나타내어진다:



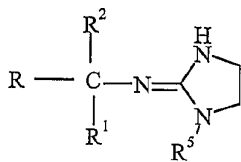
IL

<277>

- <278> 상기 식에서,
- <279> R은 1-나프틸, 페닐, 또는 할로젠, (C₁-C₂) 알킬 및 (C₁-C₂) 할로알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 치환된 페닐에서 선택되고;
- <280> R¹은 수소, (C₁-C₃) 알킬, 페닐 또는 벤질에서 선택되며;
- <281> R²는 수소이고;
- <282> R³은 수소, (C₁-C₂) 알킬,

		$-S(O)_a-R^{15}$		$-CH=N-R^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

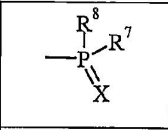
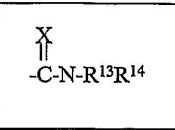
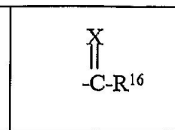
- <283> 에서 선택되며;
- <284> 여기서,
- <285> X는 산소 또는 황이고;
- <286> R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이며;
- <287> R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이고;
- <288> R¹⁴는 수소 또는 (C₁-C₂) 알킬이며;
- <289> a는 2이고;
- <290> R¹⁵는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이며;
- <291> R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이고;
- <292> R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이다.
- <293> 본 발명의 조성물에 유용한 그밖의 또 다른 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 및 헤테로아릴 유도체는 신규 화합물이다. 이들 화합물은 하기 화학식 IM 및 그의 농화학적으로 허용되는 염으로 나타내어진다:



IM

- <295> 상기 식에서,
- <296> R은 할로젠 및 (C₁-C₂) 알킬중에서 선택된 1 또는 2개의 치환체에 의해 임의로 치환된 페닐이고;
- <297> R¹ 및 R²는 수소이며;

<299> R⁵는 시아노,

		$-S(O)_a-R^{15}$		$-CH=N-R^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) 및	(9)

<300>

<301> 에서 선택되고;

<302> 여기에서,

<303> X는 산소 또는 황이며;

<304> R⁷ 및 R⁸은 (C₁-C₂) 알콕시이고;

<305> R¹³은 (C₁-C₂) 알킬이며;

<306> R¹⁴는 수소 또는 (C₁-C₂) 알킬이고;

<307> a는 2이며;

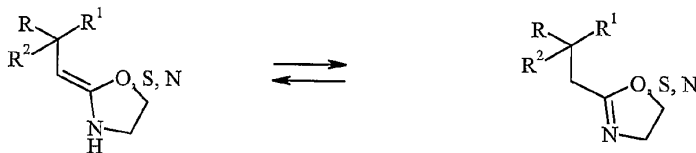
<308> R¹⁵는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 디알킬아미노이고;

<309> R¹⁶은 수소, (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이며;

<310> R¹⁹는 (C₁-C₂) 알킬 또는 (C₁-C₂) 알콕시이다.

<311> 또한, 특정의 경우, 본 발명의 화합물은 비대칭 중심을 가질 수 있으며, 이에 따라 광학적 거울상 이성체 및 부분 입체 이성체가 형성될 수 있다. 상기 화합물은 물리 화학적 성질이 현저히 상이한 2개 이상의 형태, 즉 다형체로 존재할 수 있다.

<312> 본 발명의 화합물은 또한 토토머로서 존재할 수 있으며, 이들 분자 내에서는 수소 원자의 이동으로 평형인 2개 이상의 구조가 생성된다. 예를 들어, R⁴가 (A) 및 (B), (C) 및 (D) 또는 (E) 및 (F)에서 선택되는 화학식 I의 화합물은 하기 식으로 보여지는 바와 같이 토토머로 존재할 수 있다. 이러한 토토머 현상은 [S. Patai (The Chemistry of Functional Groups: Amidines and Imidates, Vol 2, 1991, pages 259-262)]에 기술된 바와 같이 익히 공지되었다. 이러한 모든 토토머들이 본 발명에 포함되는 것으로 이해하여야 한다.



<313>

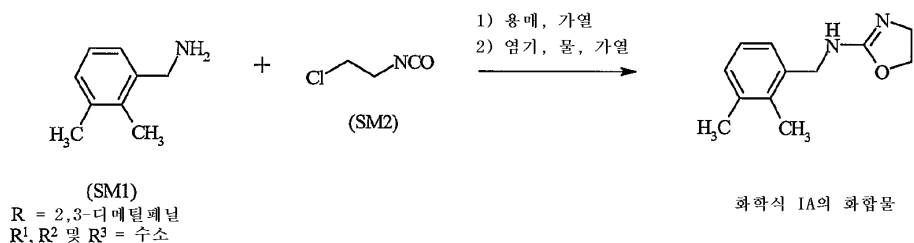
<314> 본 발명은 상기와 같은 거울상 이성체, 다형체, 토토머, 염 및 금속 착물의 용도를 포함한다. 농학적으로 허용 가능한 염 및 금속 착물에는 예를 들어, 암모늄 염, 유기 및 무기산, 예를 들어 염산, 설펡산, 에탄설펡산, 트리플루오로아세트산, 메틸벤젠설펡산, 인산, 글루콘산, 파모산의 염 및 다른 산 염과, 예를 들어 나트륨, 칼륨, 리튬, 마그네슘, 칼슘 및 다른 금속과의 알칼리 금속 및 알칼리 토금속 착물이 포함되나 이들에 제한되지 않는다.

<315> 본 발명의 방법은 살충 유효량의 화학식 I의 화합물이 곤충내에 존재하도록 하여 곤충을 박멸 또는 구제할 것으로 예상된다. 바람직한 살충 유효량은 곤충을 구제하기에 충분한 양이다. 화학식 I 화합물의 유도체(이는 곤충 내에서 화학식 I의 화합물로 전환된다)를 곤충과 접촉시켜 화학식 I의 화합물을 곤충내에 존재토록 하는 것은 본 발명의 범위에 포함된다. 본 발명은 상기와 같은 화합물의 용도를 포함하며, 이러한 화합물은 전구

(pro)-살충제로 지칭된다.

- <316> 본 발명의 다른 측면은 살충 유효량의 적어도 하나의 화학식 I의 화합물을 적어도 하나의 살충제에 적합한 그의 담체와 함께 함유하는 조성물에 관한 것이다.
- <317> 본 발명의 또 다른 측면은 살충 유효량의 적어도 하나의 화학식 I의 화합물 및 유효량의 적어도 하나의 추가의 화합물을 적어도 하나의 살충제에 적합한 그의 담체와 함께 함유하는 조성물에 관한 것이다.
- <318> 본 발명의 그밖의 다른 측면은 살충 유효량의 상기 조성물을 예를 들어 곡류, 목화, 채소, 과일 등이 예시되거나 이들에만 한정되지 않는 작물의 재배 장소, 또는 곤충이 존재하거나 존재할 것으로 예상되는 다른 지역에 적용 시킴으로써 곤충을 구제하는 방법에 관한 것이다.
- <319> 본 발명은 또한 비-농학적 곤충 종들, 예를 들어 건조목 흰개미 및 동굴 흰개미의 구제를 위한 본 발명의 화합물 및 조성물의 용도뿐만 아니라 그의 약제 및 조성물로서의 용도를 포함한다. 수의약 분야에서, 본 발명의 화합물은 특정 체내- 및 체외-기생충들, 예를 들어 동물에 해를 끼치는 곤충 및 벌레들에 유효할 것으로 예상된다. 이러한 동물 기생충의 예에는 비제한적인 것으로 가스트로필루스 종(*Gastrophilus spp.*), 스토크시스 종(*Stomoxys spp.*), 트리코덱테스 종(*Trichodectes spp.*), 로드니우스 종(*Rhodnius spp.*), 크테노세팔리데스 카니스(*Ctenocephalides canis*) 및 다른 종들이 있다.
- <320> 본 명세서에 사용되는 경우, 달리 명시되지 않으면, 단독으로 또는 보다 큰 부분의 일부로 사용되는 치환체 "알킬" 및 "알콕시"라는 용어는 이들 치환체에 적절히 적어도 1 또는 2개의 탄소원자의 직쇄 또는 분지쇄 및, 바람직하게는 12개 이하, 보다 바람직하게는 10개 이하, 가장 바람직하게는 7개 이하의 탄소원자를 포함한다. 단독으로 또는 보다 큰 부분의 일부로 사용되는 "알케닐" 및 "알키닐"이라는 용어는 적어도 하나의 탄소-탄소 이중 결합 또는 삼중 결합을 함유하는 적어도 2개의 탄소원자의 직쇄 또는 분지쇄 및, 바람직하게는 12개 이하, 보다 바람직하게는 10개 이하, 가장 바람직하게는 7개 이하의 탄소원자를 포함한다. 용어 "헤테로사이클릭"이라는 것은 탄소 및 질소로 구성된 4 내지 8 원자의 비방향족 환 구조를 말하며, 산소 또는 황을 포함할 수 있다. 5 원 환은 예를 들어 옥사졸리딘 및 티아졸리딘을 제한없이 포함한다. 6 원 환은 예를 들어 피페라진, 피페리딘, 모르폴린 및 티오모르폴린을 제한없이 포함한다. "아릴"이란 용어는 탄소수 4 내지 10의 융합 환을 포함하는 방향족 환 구조, 예를 들어 페닐, 나프틸 및 5,6,7,8-테트라하이드로나프틸을 의미한다. "헤테로아릴"이란 용어는 융합 환을 포함하며 적어도 하나의 원자가 탄소 이외의 것, 예를 들어 비제한적으로 황, 산소 또는 질소인 방향족 환 구조를 의미한다. 용어 "염수"는 포화 염화나트륨 수용액을 의미한다. 용어 "TEA"는 트리에틸아민을 의미한다. 용어 "THF"는 테트라하이드로푸란을 의미한다. "할로겐" 또는 "할로"란 용어는 불소, 브롬, 요오드 또는 염소를 의미한다. "주변 온도"란 용어는, 예를 들어 화학 반응 혼합물 온도와 관련하여, 20 내지 30 °C 범위의 온도를 의미한다. "살충성" 또는 "살비성", "살충제" 또는 "살비제"란 용어는 단독으로 또는 적어도 하나의 제 2 화합물 또는 적어도 하나의 적합한 담체와의 혼합물로서, 곤충 또는 진드기를 구제하거나 그의 작용을 저해하는 본 발명의 화합물을 의미한다.
- <321> 본 발명의 화합물은 당업계의 숙련자들에게 일반적으로 공지된 방법으로 제조된다. 본 발명의 다수의 화합물은 하기 반응식 1에 예시된 방식으로 제조된다.

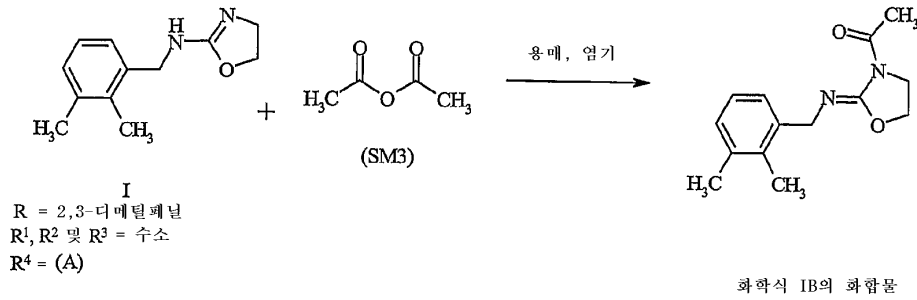
반응식 1



- <322>
- <323> 반응식 1에 예시된 바와 같이, 적절히 치환된 벤질아민(SM1)과 2-클로로에틸 이소시아네이트(SM2)를 반응시켜 적절히 치환된 벤질 1,3-옥사졸리딘 아민, 예를 들어 후술하는 실시예 1에 기술된 화학식 IA의 화합물인 ((2,3-디메틸페닐)메틸)-1,3-옥사졸리딘-2-일아민을 제공한다.

<324> 반응식 2는 R⁵ 치환체가 수소이외의 것인 화학식 I의 화합물에 대한 일반적인 제조방법을 제공한다.

반응식 2

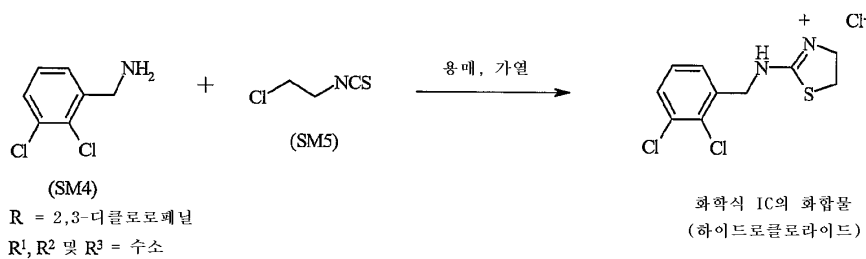


<325>

<326> 반응식 2에 예시된 바와 같이, 적절히 치환된 벤질 1,3-옥사졸리닐 아민(화학식 IA의 화합물)을 적절한 용매중에 염기성 조건하에서 아세트산 무수물(SM3)과 반응시켜 상응하는 3-아세틸-2-치환된 메틸아미노-1,3-옥사졸리딘, 예를 들어 실시예 2에 기술된 화학식 IB의 화합물인 3-아세틸-(1-아자-2-(2,3-디메틸페닐)에틸리덴)-1,3-옥사졸리딘을 제공한다.

<327> 반응식 3은 화학식 IC 화합물의 제조방법을 제공한다.

반응식 3



<328>

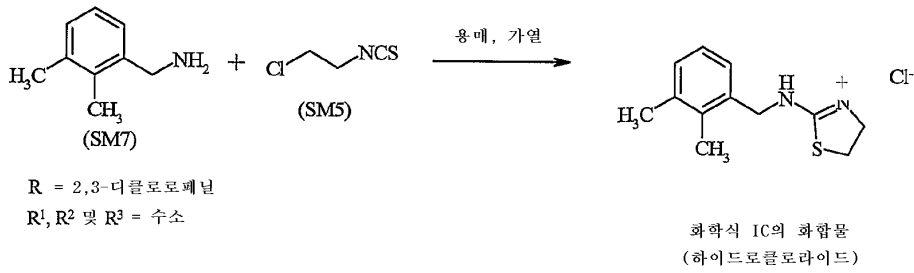


<329>

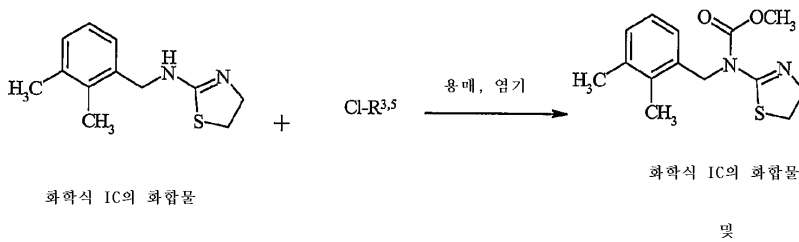
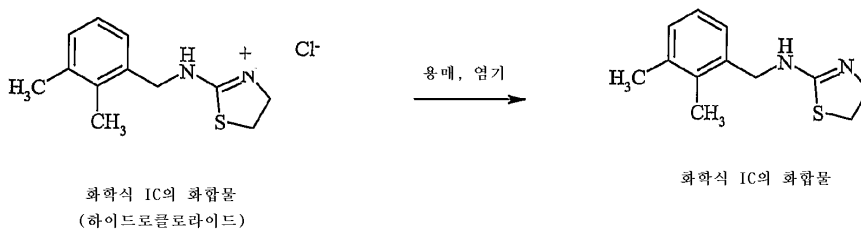
<330> 반응식 3에 예시된 바와 같이, 치환된 벤질아민(SM4)과 2-클로로에틸 이소티오시아네이트(SM5)를 반응시켜 적절히 치환된 벤질 1,3-티아졸리닐 아민 하이드로클로라이드, 예를 들어 실시예 3의 단계 A에 기술된 화학식 IC의 화합물인 ((2,3-디클로로페닐)메틸)-1,3-티아졸리딘-2-일아민 하이드로클로라이드를 제공한다. 화학식 IC 화합물의 하이드로클로라이드를 적절한 용매중에서 염기로 처리하여 상응하는 치환된 벤질 1,3-티아졸리닐 아민, 예를 들어 실시예 3의 단계 B에 기술된 화학식 IC의 화합물인 ((2,3-디클로로페닐)메틸)-1,3-티아졸리딘-2-일아민을 제공한다.

<331> 반응식 4는 화학식 IC 및 화학식 ID 화합물의 제조방법을 제공한다.

반응식 4



<332>



<333>

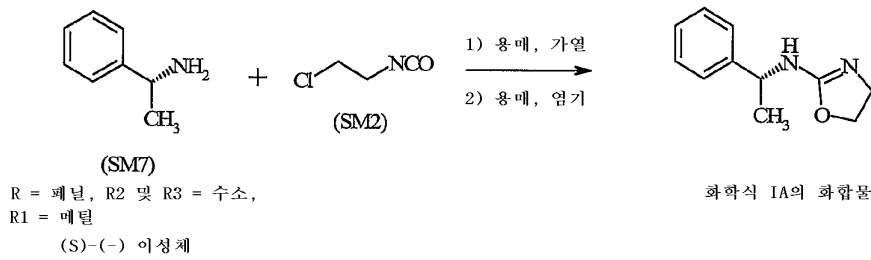
<334>

반응식 4에 예시된 바와 같이, 이치환된 벤질아민, 예를 들어 2,3-디메틸벤질아민과 2-클로로에틸 이소티오시아네이트(SM5)를 반응시켜 적절히 치환된 벤질 1,3-티아졸리닐 아민 하이드로클로라이드, 예를 들어 예를 들어 실시예 4의 단계 A에 기술된 화학식 IC의 화합물인 ((2,3-디메틸페닐)메틸)-1,3-티아졸리닐-2-일아민 하이드로클로라이드를 제공한다. 화학식 IC 화합물의 하이드로클로라이드를 적절한 용매중에서 염기로 처리하여 상응하는 치환된 벤질 1,3-티아졸리닐 아민, 예를 들어 실시예 4의 단계 B에 기술된 화학식 IC의 화합물인 ((2,3-디메틸페닐)메틸)-1,3-티아졸리닐-2-일아민을 제공한다. 치환된 벤질 1,3-티아졸리닐 아민을, 예를 들어 메틸 클로로포르메이트와 염기성 조건하에서 반응시켜 두 개의 화합물을 제공한다. 먼저, R³ 치환체가 수소이외의 것인 화학식 IC의 화합물, 예를 들어 메틸 2-(1-아자-2-((2,3-디메틸페닐)에틸리덴)-1,3-티아졸리딘-3-카복실레이트 및 그 다음으로 R⁵ 치환체가 수소이외의 것인 화학식 ID의 화합물, 예를 들어 N-((2,3-디메틸페닐)메틸)메톡시-N-(1,3-티아졸리딘-2-일)카복사미드(이들은 후술하는 실시예 4의 단계 C에 상세히 기술되었다).

<335>

반응식 5는 R¹ 치환체가 수소이외의 것인 화학식 I 화합물의 제조방법을 제공한다.

반응식 5



- <336>
- <337> 반응식 5에 예시된 바와 같이, 페닐에틸아민의 적절히 치환된 이성체(SM7), 예를 들어 (S)-(-)-페닐에틸아민을 2-클로로에틸 이소시아네이트(SM2)와 반응시켜 적절히 치환된 페닐에틸 1,3-옥사졸리닐 아민, 예를 들어 실시예 5에 기술된 화학식 IA의 화합물인 ((1S)-1-페닐에틸)-1,3-옥사졸린-2-일아민을 제공한다.
- <338> 당업계의 숙련자는 물론, 독성제의 제형화 및 적용 방법이 소정의 용도에서 상기 물질의 활성에 영향을 미칠 수 있음을 인지할 것이다. 따라서, 농학적 용도를 위해, 본 발명의 살충 화합물을 목적하는 적용 방식에 따라, 비교적 큰 입자 크기(예를 들어 8/16 또는 4/8 US 메쉬)의 과립, 수용성 또는 수 분산성 과립, 분말 가루, 습윤성 분말, 유화성 농축물, 수성 유화액, 용액 또는 임의의 다른 공지된 유형의 농학적으로 유용한 제형으로 제형화할 수 있다. 본 명세서에 기재된 양은 "약"이라는 단어가 앞에 위치한 것처럼, 단지 근사값을 의미하는 것으로 이해하여야 한다.
- <339> 이들 살충성 조성물을 물로 희석한 스프레이, 가루 또는 과립으로 곤충 구제를 원하는 영역에 적용할 수 있다. 이들 제형은 활성 성분을 0.1 중량%, 0.2 중량% 또는 0.5 중량% 내지 95 중량% 만큼 함유할 수 있다.
- <340> 가루는 활성 성분과 미분 고체, 예를 들어 활석, 천연 점토, 규조토, 고운 가루, 예컨대 호두 껍질 및 목화씨 가루, 및 독성제의 분산제 및 담체로서 작용하는 다른 유기 및 무기 고체와의 자유 유동 혼합물이며; 이들 미분 고체는 평균 입자 크기가 약 50 마이크론 미만이다. 본 발명에 유용한 전형적인 가루 제형은 1.0 부 이하의 살충 화합물 및 99.0 부의 활석을 함유하는 것이다.
- <341> 또한 살충제에 유용한 제형인 습윤성 분말은 물 또는 다른 분산제 중에 용이하게 분산되는 미분 입자 형태이다. 습윤성 분말은 궁극적으로 곤충 구제가 필요한 장소에 건조 가루로 또는 물 또는 다른 액체 중의 유화액으로 적용된다. 습윤성 분말에 전형적인 담체로는 백토, 카올린 점토, 실리카 및 다른 흡수성이 강한 습윤이 용이한 무기 희석제가 포함된다. 습윤성 분말은 일반적으로 담체의 흡수성에 따라 약 5 내지 80%의 활성 성분을 함유하고 또한 대개는 분산을 촉진시키기 위해서 소량의 습윤, 분산 또는 유화제를 함유하도록 제조된다. 예를 들어, 유용한 습윤성 분말 제형은 80.0 부의 살충 화합물, 17.9 부의 팔메토 점토, 및 습윤제로서 1.0 부의 나트륨 리그노설포네이트 및 0.3 부의 설폰화된 지방산 폴리에스테르를 함유한다. 식물의 잎에서 분산을 촉진시키기 위해서 흔히 추가의 습윤제 및/또는 오일이 탱크 혼합물에 첨가되기도 한다.
- <342> 살충제 적용에 유용한 다른 제형은 유화성 농축물(ES)이며, 이는 물 또는 다른 분산제에 분산 가능한 균질한 액체 조성물이며, 전적으로 살충 화합물 및 액체 또는 고체 유화제로만 구성되거나, 액체 담체, 예를 들어 자일렌, 중질 방향족 나프타, 이소포론, 또는 다른 비 휘발성 유기 용매를 또한 함유할 수도 있다. 살충제 적용을 위해서 상기 농축물을 물 또는 다른 액체 담체 중에 분산시키고 통상적으로는 처리하려는 지역에 분무 적용한다. 필수적인 활성 성분의 중량 퍼센트는 상기 조성물을 적용하는 방식에 따라 달라질 수 있지만, 일반적으로는 살충제 조성물에 대해 0.5 내지 95 중량%의 활성 성분을 포함한다.
- <343> 유동성 제형은 활성 성분이 액체 담체, 일반적으로는 물에 현탁된 점만을 제외하고 EC와 유사하다. EC와 마찬가지로, 유동성 제형은 소량의 계면활성제를 포함할 수 있으며, 전형적으로는 상기 조성물의 0.5 내지 95 중량%, 흔히 10 내지 50 중량% 범위로 활성 성분을 함유할 것이다. 적용을 위해서, 상기 유동성 제형을 물 또는 다른 액체 비히클에 희석시키고, 통상적으로는 처리하려는 지역에 분무 적용한다.
- <344> 농학적 제형에 사용되는 전형적인 습윤, 분산 또는 유화제로는 알킬 및 알킬아릴 설포네이트 및 설페이트, 및 이들의 나트륨 염; 알킬아릴 폴리에테르 알콜; 황산화된 고급 알콜; 폴리에틸렌 옥사이드; 설폰화된 동물 및 식물성 오일; 설폰화된 석유계 오일; 다가 알콜의 지방산 에스테르 및 이러한 에스테르의 에틸렌 옥사이드 부가 생성물; 및 장쇄 머캡탄과 에틸렌 옥사이드의 부가 생성물이 있으나, 이들에 한정되는 것은 아니다. 많은 다른

유형의 유용한 계면활성제들이 상업적으로 입수가 가능하다. 계면활성제는, 사용시 보통 상기 조성물의 1 내지 15 중량%를 차지한다.

- <345> 다른 유용한 제형은 비교적 비휘발성인 용매, 예를 들어 물, 옥수수 오일, 케로센, 프로필렌 글리콜 또는 다른 적합한 용매중의 상기 활성 성분의 현탁액을 포함한다.
- <346> 살충제 적용에 유용한 또 다른 제형에는 소정 농도를 완전히 용해시키는 용매, 예를 들어 아세톤, 알킬화된 나프탈렌, 자일렌 또는 다른 유기 용매 중의 활성 성분의 단순 용액이 포함된다. 독성제가 비교적 낮은 입자로 운반되는 과립 제형은 공중 살포 또는 간작 덮개의 침투에 특히 유용하다. 가압 스프레이, 전형적으로 활성 성분이 저 비등 분산제 용매 담체가 휘발됨으로써 미분 형태로 분산되는 에어로졸이 또한 사용될 수도 있다. 수용성 또는 수 분산성 과립은 자유 유동성이며, 가루가 아니고, 물에 용이하게 용해되거나 혼화된다. 농부가 밭에 사용할 때에는, 상기 과립 제형, 유화성 농축물, 유동성 농축물, 수성 유화액, 용액 등을 물로 희석하여 0.1% 또는 0.2% 내지 1.5% 또는 2% 범위의 활성 성분 농도를 제공할 수 있다.
- <347> 본 발명의 살충 및 살비 활성 화합물을 적어도 하나의 추가의 화합물과 함께 제형화하고/하거나 적용시킬 수 있다. 이러한 조합은, 예를 들어 곤충 해충이 상당히 구제되도록 상승 효과를 나타내고, 살충제의 적용 비율을 감소시켜 환경이나 작업자 안전성에 대한 임의의 영향을 최소화하고, 보다 넓은 범위의 곤충 해충을 구제하고, 농작물에 대한 식물 독성을 완화시키고, 비-해충 종들, 예를 들어 포유동물 및 어류에 대한 허용성을 개선시킬 수 있는 것 등이 예시되나 이들로만 국한되지 않는 특정한 이점을 제공할 수 있다.
- <348> 추가의 화합물로는 비제한적인 것으로 다른 살해충제, 식물 성장 조절제, 비료, 토양 개량제 또는 다른 농약들이 있다. 본 발명의 활성 화합물을 적용하는 경우에는, 단독으로 제형화되든 또는 다른 농약과 함께 제형화되든 간에 상관없이, 유효량 및 유효 농도의 활성 화합물이 물론 사용되며; 이들 양은 약 0.001 내지 약 3 kg/ha, 바람직하게는 약 0.03 내지 약 1 kg/ha의 범위로 변할 수 있다. 살충제의 손실이 있는 밭에 사용하기 위해서는 보다 높은 적용 비율(예를 들어 상기 언급한 비율의 4 배)을 사용할 수도 있다.
- <349> 본 발명의 살충 활성 화합물을 하나 이상의 추가의 화합물, 예를 들어 제초제와 같은 다른 살해충제와 함께 사용하는 경우, 이들 제초제로는, 예를 들어 N-(포스포노메틸)글리신(예: 글리포세이트); 아릴옥시알칸산(예: 2,4-D, MCPA 및 MCPP); 우레아(예: 이소프로투론); 이미다졸리논(예: 이마자피르, 이마자메타벤즈, 이마제타피르 및 이마자퀸); 디페닐 에테르(예: 아시플루오르펜, 비페녹스 및 포마사퀸); 하이드록시벤조니트릴(예: 아이옥시닐 및 브록시닐); 설폰일우레아(예: 클로리무론, 아클로르설푸론, 벤셀푸론, 피라조설푸론, 티셀설푸론 및 트리아설푸론); 2-(4-아릴옥시페녹시)알칸산(예: 페녹사프로프, 플루아지포프, 퀴알로포프 및 디클로포프); 벤조티아디아지논(예: 벤타존); 2-클로로아세트아닐리드(예: 부타클로르, 메톨라클로르, 아세토클로르 및 디메텐아미드); 아렌카복실산(예: 디캄바); 피리딜옥시아세트산(예: 플루록시피르, 아릴 트리아졸리논, 예를 들어 설펜트라존 및 카펜트라존-에틸); 이속사졸리디논(예: 클로마존); 및 다른 제초제가 포함되나, 이들에만 한정되는 것은 아니다.
- <350> 본 발명의 살충 활성 화합물을 하나 이상의 추가의 화합물, 예를 들어 다른 살충제와 같은 다른 살해충제와 함께 사용하는 경우, 상기 다른 살충제는 예를 들어 유기 포스페이트 살충제, 예를 들어 클로르피리포스, 디아지논, 디메토에이트, 말라티온, 파라티온-메틸 및 테부포스; 피레트로이드 살충제, 예를 들어 펜탈레레이트, 델타메트린, 펜프로파트린, 사이플루트린, 플루사이트리네이트, 페메트린, 알파-사이피메트린, 베타-사이피메트린, 제타-사이피메트린, 비펜트린, 사이피메트린, 용해 사이할로트린, 에토펜프록스, 에스펜발레레이트, 트랄로메트린, 테플루트린, 사이클로프로트린, 베타사이플루트린 및 아크리나트린; 카바메이트 살충제, 예를 들어 알데카브, 카바릴, 카보푸란 및 메토밀; 유기 염소 살충제, 예를 들어 엔도설판, 엔드린, 헵타클로르 및 린단; 벤조일우레아 살충제, 예를 들어 디플루베누론, 트리플루무론, 테플루벤주론, 클로르플루아주론, 플루사이클록수론, 헥사플루무론, 플루페녹수론 및 루페누론; 및 예를 들어 아미트라즈, 클로펜테진, 펜피록시메이트, 헥시티아주스, 스피노사드 및 이미다클로프리드와 같은 다른 살충제들을 포함한다.
- <351> 본 발명의 살충 활성 화합물을 하나의 추가의 화합물, 예를 들어 살진균제와 같은 다른 살해충제와 함께 사용하는 경우, 상기 살진균제는 예를 들어 벤즈이미다졸 살진균제, 예를 들어 베노밀, 카벤다짐, 티아벤다졸 및 티오파네이트-메틸; 1,2,4-트리아졸 살진균제, 예를 들어 에폭시코나졸, 사이프로코나졸, 플루실라졸, 플루트리아폴, 프로피코나졸, 테부코나졸, 트리아디메폰 및 트리아디메놀; 치환된 아닐리드 살진균제, 예를 들어 메탈락실, 옥사디실, 프로사이미돈 및 빈클로졸린; 유기 인 살진균제, 예를 들어 포세틸, 이프로벤포스, 피라조포스, 에디펜포스 및 툴클로포스-메틸; 모르폴린 살진균제, 예를 들어 펜프로피모프, 트리데모프 및 도데모프; 다른 전신 살진균제, 예를 들어 페나리몰, 이마잘릴, 프로클라라즈, 트리아이클라졸 및 트리포린; 디티오카

바메이트 살진균제, 예를 들어 만코제브, 마네브, 프로피네브, 지네브 및 지람; 비전신 살진균제, 예를 들어 클로로탈로닐, 디클로폴루아니드, 디티아논, 이프로디온, 캅탄, 디노캅, 도딘, 플루아지남, 글루아자틴, PCNB, 펜사이쿠론, 퀴토젠, 트리실라미드 및 발리다마이신; 무기 살진균제, 예를 들어 구리 및 황 생성물, 및 다른 살진균제를 포함한다.

<352> 본 발명의 살충 활성 화합물을 하나 이상의 추가의 화합물, 예를 들어 살선충제와 같은 다른 살해충제와 함께 사용하는 경우, 상기 살선충제에는 예를 들어 카보푸란, 카보실판, 터부포스, 알데카브, 에토프로프, 페남포스, 옥사밀, 이사조포스, 카두사포스 및 다른 살선충제가 포함된다.

<353> 본 발명의 살충 활성 화합물을 하나 이상의 추가의 화합물, 예를 들어 식물 성장 조절제와 같은 다른 물질과 함께 사용하는 경우, 상기 식물 성장 조절제로는 예를 들어 말레산 하이드라지드, 클로르메콰트, 에테폰, 지베렐린, 메콰트, 티디아존, 이나벤파이드, 트리아펜테놀, 파클로부트라졸, 유나코나졸, DCPA, 프로헥사디온, 트리넥사팍-에틸 및 다른 식물 성장 조절제가 포함된다.

<354> 토양 개량제는 토양에 첨가시 식물의 성장에 유효한 다양한 이점들을 도모하는 물질이다. 토양 개량제는 토양 압밀을 감소시키고, 배수 효과를 증진 및 증가시키고, 토양 침투성을 개선시키고, 토양중 최적 식물 영양소 함량을 증진시키고, 살충제 및 비료의 보다 나은 혼입을 증진시키기 위해 사용된다. 본 발명의 살충 활성 화합물을 하나 이상의 추가의 화합물, 예를 들어 토양 개량제 등의 다른 물질과 함께 사용하는 경우, 상기 토양 개량제는 유기 물질, 예를 들어 토양 중의 양이온 식물 영양소의 유지를 증진시키는 부식토; 양이온 영양소, 예를 들어 칼슘, 마그네슘, 가성 칼륨, 나트륨 및 수소 착물의 혼합물; 또는 식물 성장에 유리한 토양 상태를 도모하는 미생물 조성물을 포함한다. 이와 같은 미생물 조성물로는 예를 들어 바실러스(*bacillus*), 슈도모나스(*pseudomonas*), 아조토박터(*azotobacter*), 아조스피릴럼(*azospirillum*), 리조뮴(*rhizobium*) 및 토양성 시아노박테리아가 있다.

<355> 비료는 통상적으로 질소, 인 및 칼륨을 함유하는 식물 양분 공급물이다. 본 발명의 살충 활성 화합물을 하나 이상의 추가의 화합물, 예를 들어 비료 등의 다른 물질과 함께 사용하는 경우, 상기 비료는 질소 비료, 예를 들어 황산 암모늄, 질산 암모늄 및 골분; 인산염 비료, 예를 들어 과인산 비료, 삼중 과인산비료, 황산 암모늄 및 황산 이암모늄; 및 칼륨 비료, 예를 들어 가성 칼륨의 염화물, 황산 칼륨 및 질산 칼륨, 및 다른 비료를 포함한다.

<356> 하기 실시예들로 본 발명이 보다 상세히 예시하나, 이들이 본 발명의 범위를 어떠한 식으로도 제한하는 것으로 해석하여서는 안된다. 실시예들은 본 발명의 화학식 I의 화합물의 합성 프로토콜을 제공하고, 이에 따라 합성된 종들의 목록을 나타내며, 합성된 화합물의 효능을 나타내는 특정 생물학적 데이터들을 나타내도록 구성된다.

<357> 화학식 I의 화합물은 상업적으로 용이하게 입수가 가능한 중간체로부터 당업자들에게 개별적으로 알려진 방법으로 합성될 수 있다.

<358> **실시예 1**

<359> 본 실시예는 ((2,3-디메틸페닐)메틸)-1,3-옥사졸린-2-일아민(화합물 A25)의 제조에 대한 프로토콜의 일례를 예시한다.

<360> 10 mL 1,4-디옥산중의 1.0 g(0.0074 mole)의 2,3-디메틸벤질아민 및 0.69 g(0.0081 mole)의 2-클로로에틸이소시아네이트의 혼합물을 약 18 시간동안 교반하면서 가열환류시켰다. 반응 혼합물을 냉각하고, 수산화나트륨 수용액(3.0 몰 용액 4.0 mL)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 약 18 시간동안 가열환류시킨 후, 주변 온도로 냉각하였다. 반응 혼합물을 감압하에 농축하여 점성 오일 잔사를 수득하였다. 잔사를 50 mL의 에틸 아세테이트에 현탁시키고, 20 mL의 물로 세척하였다. 유기상을 20 mL의 3.0 몰 수성 염산으로 추출하였다. 3.0 몰 수성 수산화나트륨을 가하여 수성 추출물을 염기성으로 만들고, 염기성 혼합물을 50 mL의 에틸 아세테이트로 추출하였다. 추출물을 황산나트륨으로 건조시키고, 여과한 후, 여액을 감압하에 농축하여 0.81 g의 표제 화합물을 오일로 수득하였다. NMR 스펙트럼은 제안된 구조와 일치하였다.

<361> **실시예 2**

<362> 본 실시예는 3-아세틸-(1-아자-2-(2,3-디메틸페닐)에틸리덴)-1,3-옥사졸리딘(화합물 B2)의 제조에 대한 프로토콜의 일례를 예시한다.

<363> 10 mL 디에틸 에테르중의 0.2 g(0.002 mole)의 ((2,3-디메틸페닐)메틸)-1,3-옥사졸린-2-일아민(화합물 A25), 0.1 g(0.0008 mole)의 황산마그네슘 및 0.4 g(0.006 mole)의 탄산칼륨의 교반 냉각(5 °C) 혼합물에 무수 아세

트산(1.0 g, 0.002 mole)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 두 시간동안 교반하면서 주변 온도로 가온하였다. 반응 혼합물을 여과하고, 여과 케이크를 디에틸 에테르로 세척한 뒤, 여액을 모아 감압하에 농축하여 잔사를 얻었다. 잔사를 1 mL의 디에틸 에테르와 4 mL의 헥산 혼합물과 교반하였다. 형성된 침전을 여과 수집하여 헥산으로 세척하고, 감압하에 건조시켜 0.16 g의 표제 화합물을 수득하였다. NMR 스펙트럼은 제안된 구조와 일치하였다.

<364> **실시예 3**

<365> 본 실시예는 ((2,3-디클로로페닐)메틸)-1,3-티아졸린-2-일아민 하이드로클로라이드(화합물 C7) 및 ((2,3-디클로로페닐)메틸)-1,3-티아졸린-2-일아민(화합물 C9)의 제조에 대한 프로토콜의 일례를 예시한다.

<366> 단계 A

<367> ((2,3-디클로로페닐)메틸)-1,3-티아졸린-2-일아민 하이드로클로라이드(화합물 C7)의 합성

<368> 10 mL 1,4-디옥산중의 0.5 g(0.0028 mole)의 2,3-디클로로벤질아민 및 0.27 g(0.0081 mole)의 2-클로로에틸이소티오시아네이트의 혼합물을 밀폐 반응 용기에 도입하였다. 반응 혼합물을 약 18 시간동안 교반하면서 80 °C로 가열하였다. 반응 혼합물을 냉각하고, 형성된 침전을 여과 수집하였다. 고체를 디에틸 에테르로 세척하고, 감압하에 건조시켜 0.68 g의 표제 화합물을 수득하였다. NMR 스펙트럼은 제안된 구조와 일치하였다.

<369> 단계 B

<370> ((2,3-디클로로페닐)메틸)-1,3-티아졸린-2-일아민(화합물 C9)의 합성

<371> 1 mL 물중의 0.36 g(0.0012 mole)의 ((2,3-디클로로페닐)메틸)-1,3-티아졸린-2-일아민 하이드로클로라이드(화합물 C7)의 혼합물을 10 mL 물 및 10 mL 디에틸 에테르중의 0.05 g(0.0013 mole)의 수산화나트륨의 교반 냉각(빙수조) 혼합물에 첨가하였다. 반응 혼합물을 10 분동안 교반한 후, 분리 깔때기에 붓고, 디에틸 에테르(2×50 mL)로 추출하였다. 추출물을 모아 황산나트륨으로 건조시키고, 여과하였다. 여액을 감압하에 농축하여 0.31 g의 표제 화합물을 백색 고체로 수득하였다. NMR 스펙트럼은 제안된 구조와 일치하였다.

<372> **실시예 4**

<373> 본 실시예는 ((2,3-디메틸페닐)메틸)-1,3-티아졸린-2-일아민 하이드로클로라이드(화합물 C11), ((2,3-디메틸페닐)메틸)-1,3-티아졸린-2-일아민(화합물 C66), 메틸 2-(1-아자-2-(2,3-디메틸페닐)에틸리덴)-1,3-티아졸리딘-3-카복실레이트(화합물 C53) 및 N-((2,3-디메틸페닐)메틸)메톡시-N-(1,3-티아졸린-2-일)카복사미드(화합물 D5)의 제조에 대한 프로토콜의 일례를 예시한다.

<374> 단계 A

<375> ((2,3-디메틸페닐)메틸)-1,3-티아졸린-2-일아민 하이드로클로라이드(화합물 C11)의 합성

<376> 무수 질소 분위기하에서, 100 mL 1,4-디옥산중의 5.56 g(0.041 mole)의 2,3-디메틸벤질아민 및 5.0 g(0.041 mole)의 2-클로로에틸이소티오시아네이트의 교반 혼합물을 약 18 시간동안 교반하면서 80 °C로 가열하였다. 반응 혼합물을 냉각하고, 형성된 침전을 여과 수집하였다. 고체를 디에틸 에테르로 세척하고, 감압하에 건조시켜 8.0 g의 표제 화합물을 수득하였다. NMR 스펙트럼은 제안된 구조와 일치하였다.

<377> 단계 B

<378> ((2,3-디메틸페닐)메틸)-1,3-티아졸린-2-일아민(화합물 C66)의 합성

<379> 100 mL 물중의 1.4 g(0.034 mole)의 수산화나트륨의 혼합물을 100 mL 디에틸 에테르중의 8.0 g (0.031 mole)의 ((2,3-디메틸페닐)메틸)-1,3-티아졸린-2-일아민 하이드로클로라이드(화합물 C11)의 교반 냉각(빙수조) 혼합물에 첨가하였다. 반응 혼합물을 두 시간동안 교반하면서 주변 온도로 가온하였다. 반응 혼합물을 분리 깔때기에 붓고, 유기상을 제거하여 보관하였다. 수성상을 100 mL의 디에틸 에테르로 추출하였다. 유기 추출물을 보관해 놓은 유기상과 합하여 황산나트륨으로 건조시킨 뒤, 여과하였다. 여액을 감압하에 농축하여 6.8 g의 표제 화합물을 융점 110-114 °C의 백색 고체로 수득하였다. NMR 스펙트럼은 제안된 구조와 일치하였다.

<380> 단계 C

<381> 메틸 2-(1-아자-2-(2,3-디메틸페닐)에틸리덴)-1,3-티아졸리딘-3-카복실레이트(화합물 C53) 및 N-((2,3-디메틸페닐)메틸)메톡시-N-(1,3-티아졸린-2-일)카복사미드(화합물 D5)의 합성

<382> 무수 질소 분위기하에서, 10 mL의 THF에 용해시킨 0.25 g(0.0011 mole)의 ((2,3-디메틸페닐)메틸)-1,3-티아졸린-2-일아민 용액을 0.08 g(0.0012 mole)의 수소화나트륨(오일중 60% 현탁액)의 교반 현탁액에 첨가하였다. 혼합물을 30 분동안 교반하면서 5 mL THF중의 0.11 mL (0.0014 mole)의 메틸 클로로포르메이트의 용액을 천천히 첨가하였다. 반응 혼합물을 주변 온도에서 약 18 시간동안 교반하였다. 반응 혼합물을 1 시간동안 교반하면서 60 °C로 가열하였다. 반응 혼합물을 25 mL의 염수로 희석한 후, 에틸 아세테이트로 추출하였다(2×25 mL). 추출물을 모아 25 mL의 물로 세척하여 황산나트륨으로 건조시킨 뒤, 여과하였다. 여액을 감압하에 농축하여 고체 잔사를 얻었다. 잔사를 TLC로 분석하여 두 화합물이 존재함을 확인하였다. 잔사를 헥산:메틸렌 클로라이드 (1:1)를 사용하여 실리카겔상에서 칼럼 크로마토그래피에 의해 정제하였다. 적절한 분획을 모으고, 감압하에 농축하여 0.05 g의 메틸 2-(1-아자-2-(2,3-디메틸페닐)에틸리덴)-1,3-티아졸리딘-3-카복실레이트(화합물C53) 및 0.14 g의 N-((2,3-디메틸페닐)메틸)메톡시-N-(1,3-티아졸린-2-일)카복사미드(화합물D5)를 수득하였다. NMR 스펙트럼은 제안된 구조와 일치하였다.

<383> **실시예 5**

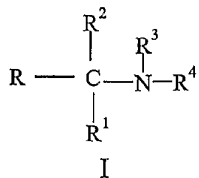
<384> 본 실시예는 ((1S)-1-페닐에틸)-1,3-옥사졸린-2-일아민 (화합물 A58)의 제조에 대한 프로토콜의 일례를 예시한다.

<385> 10 mL 1,4-디옥산중의 0.5 g(0.0041 mole)의 (S)-(-)-페닐에틸아민 및 0.44 g(0.0042 mole)의 2-클로로에틸이소시아네이트의 혼합물을 약 18 시간동안 교반하면서 가열환류시켰다. 반응 혼합물을 냉각하고, 수산화나트륨 수용액(3.0 몰 용액 1.0 mL)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 3 시간동안 가열환류시킨 후, 주변 온도로 냉각하였다. 반응 혼합물을 감압하에 농축하여 점성 오일 잔사를 수득하였다. 잔사를 50 mL의 에틸 아세테이트에 현탁시키고, 10 mL의 3.0 몰 수성 염산으로 추출하였다. 3.0 몰 수성 수산화나트륨을 가하여 수성 추출물을 염기성으로 만들었다. 염기성 혼합물을 에틸 아세테이트로 추출하였다(2×30 mL). 추출물을 합하여 황산나트륨으로 건조시키고, 여과한 후, 여액을 감압하에 농축하여 0.45 g의 표제 화합물을 고체로 수득하였다. NMR 스펙트럼은 제안된 구조와 일치하였다.

<386> 하기 표는 본 발명에 유용한 화학식 I의 화합물의 일부 추가적인 예들을 나타낸다:

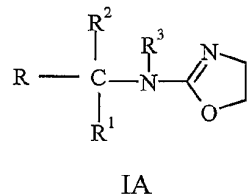
<387> **표 1**

<388> 살충성 치환된 벤질아미노 헤테로사이클릭 유도체









<389>













<390> R⁴가 식 (A)인 화학식 I:



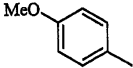
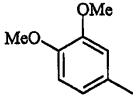
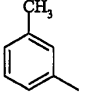
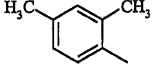
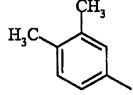
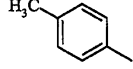
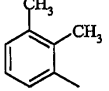
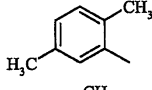
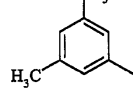

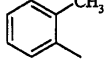
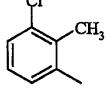
<391>

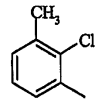
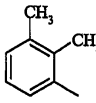
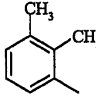
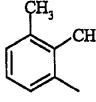
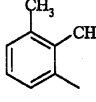
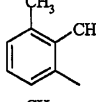
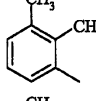
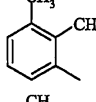
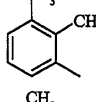
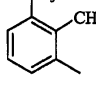
화합물 번호	R	R ¹	R ²	R ³
A1		H	H	H
A2		H	H	H
A3		H	H	H
A4		H	H	H
A5		H	H	H
A6		H	H	H

<392>

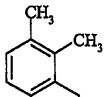
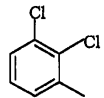
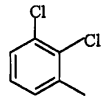
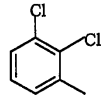
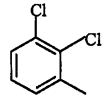
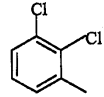
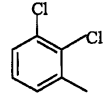
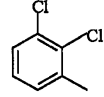
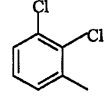
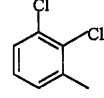
화합물 번호	R	R ¹	R ²	R ³
A7		H	H	H
A8		H	H	H
A9		H	H	H
A10		H	H	H
A11		H	H	H
A12		H	H	H
A13		H	H	H
A14		H	H	H
A15		H	H	H
A16		H	H	H
A17		H	H	H
A18		H	H	H

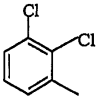


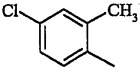
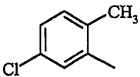
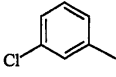





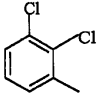



<393>

화합물 번호	R	R ¹	R ²	R ³
A19		H	H	H
A20		H	H	H
A21		H	H	H
A22		H	H	H
A23		H	H	H
A24		H	H	H
A25		H	H	H
A26		H	H	H
A27		H	H	H
A28		H	H	H
A29		H	H	H
A30		H	H	H

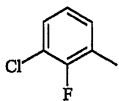

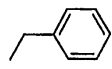
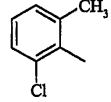
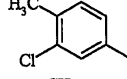
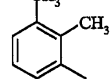
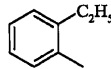
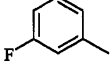
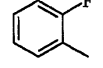
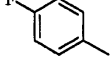
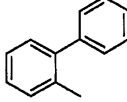
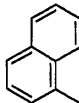

화합물 번호	R	R ¹	R ²	R ³
A31		H	H	H
A32		H	H	-COCH ₃
A33		H	H	-SO ₂ N(CH ₃) ₂
A34		H	H	-PO(OC ₂ H ₅) ₂
A35		H	H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
A36		H	H	-CO ₂ CH ₃
A37		H	H	-CHO
A38		H	H	-CONHCH ₃
A39		H	H	-CSNHCH ₃
A40		H	H	-CH=NC ₂ H ₅

<395>

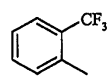
화합물 번호	R	R ¹	R ²	R ³
A41		H	H	-CH=NOC ₂ H ₅
A42		H	H	-COCH ₃
A43		H	H	-SO ₂ N(CH ₃) ₂
A44		H	H	-PO(OC ₂ H ₅) ₂
A45		H	H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
A46		H	H	-CO ₂ CH ₃
A47		H	H	-CHO
A48		H	H	-CONHCH ₃
A49		H	H	-CSNHCH ₃
A50		H	H	-CH=NC ₂ H ₅

화합물 번호	R	R ¹	R ²	R ³
A51		H	H	-CH=NOC ₂ H ₅
A52		-CH ₃	H	H
A53		-CH ₃	-CH ₃	H
A54		H	H	H
A55		H	H	H
A56		H	H	-CH ₃
A57		H	H	-CH ₃
A58*		-CH ₃	H	H
A59**		-CH ₃	H	-CH ₃
A60*		-CH ₃	H	-CH ₃
A61**		-CH ₃	H	H
A62		-CH ₃	H	H
A63		-C ₂ H ₅	H	H
A64			H	H

<397>

화합물 번호	R	R ¹	R ²	R ³
A65		H	H	H
A66			H	H
A67		H	H	H
A68		H	H	H
A69		-CH ₃	H	H
A70		H	H	H
A71		H	H	H
A72		-CH ₃	H	H
A73		-CH ₃	H	H
A74		H	H	H
A75		H	H	H
A76		H	H	H

<398>

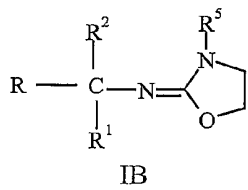
화합물 번호	R	R ¹	R ²	R ³
A77		-CH ₃	H	H

* ((1S)-1-페닐에틸) 이성체
 ** ((1R)-1-페닐에틸) 이성체

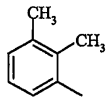
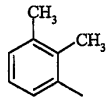
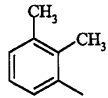
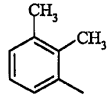
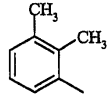
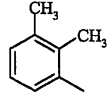
<399>

<400> R²가 수소이고,

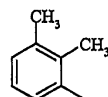
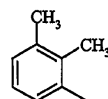
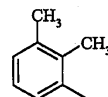
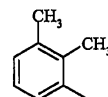
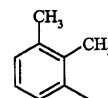
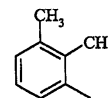
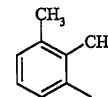
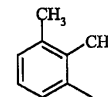
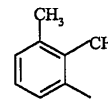
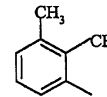
<401> R⁴는 식 (B)인 화학식 I:



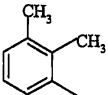
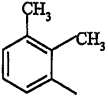
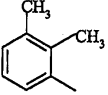
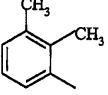
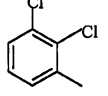
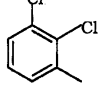
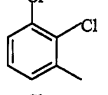
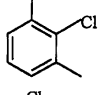
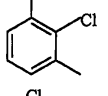
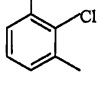
<402>

화합물 번호	R	R ¹	R ⁵
B1		H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
B2		H	-COCH ₃
B3		H	-SO ₂ CH ₃
B4		H	-PS(OCH ₃) ₂
B5		H	-CH ₂ OCOC(CH ₃) ₃
BB6		H	-CON(CH ₃) ₂







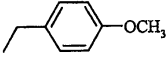




<403>

화합물 번호	R	R ¹	R ⁵
B7		H	-COC ₂ H ₅
B8		H	-SO ₂ N(CH ₃) ₂
B9		H	-CONH(CH ₃)
B10		H	-PO(OC ₂ H ₅) ₂
B11		H	-CO ₂ C ₂ H ₅
B12		H	-CO ₂ CH ₃
B13		H	-PO(OCH ₃) ₂
B14		H	-PO(N(CH ₃) ₂) ₂
B15		H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
B16		H	-CH ₂ OC ₂ H ₅




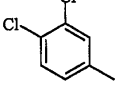



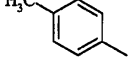
<404>

화합물 번호	R	R ¹	R ⁵
B17		H	-CHO
B18		H	-CSNHCH ₃
B19		H	-CH=NC ₂ H ₅
B20		H	-CH=NOC ₂ H ₅
B21		H	-COCH ₃
B22		H	-SO ₂ N(CH ₃) ₂
B23		H	-PO(OC ₂ H ₅) ₂
B24		H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
B25		H	-CO ₂ CH ₃
B26		H	-CHO

<405>

화합물 번호	R	R ¹	R ⁵
B27		H	-CONHCH ₃
B28		H	-CSNHCH ₃
B29		H	-CH=NC ₂ H ₅
B30		H	-CH=NOC ₂ H ₅
B31		H	-CN
B32		H	
B33		H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
B34		H	-PO[N(CH ₃) ₂] ₂
B35		H	-PS(OCH ₃) ₂
B36		H	-CN

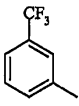
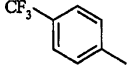
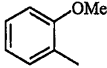

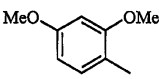
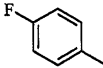
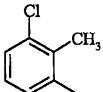
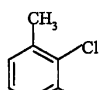
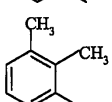
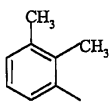
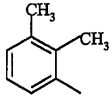
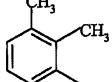
<406>

화합물 번호	R	R ¹	R ³
C1		H	-CH ₃
C2		H	H
C3 하이드로 요오다이드염		H	H
C4 하이드로 클로라이드염		H	H
C5 하이드로 클로라이드염		H	H
C6 하이드로 클로라이드염		H	H
C7 하이드로 클로라이드염		H	H
C8		H	H

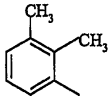
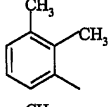
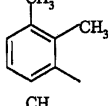
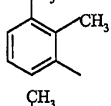
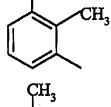
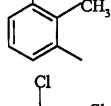
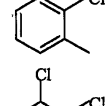
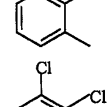
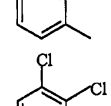
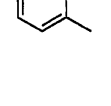
<412>

화합물 번호	R	R ¹	R ³
C9		H	H
C10 하이드로 클로라이드염		H	H
C11 하이드로 클로라이드염		H	H
C12 하이드로 클로라이드염		H	H
C13 하이드로 클로라이드염		H	H
C14		H	H
C15 하이드로 클로라이드염		H	H
C16 하이드로 클로라이드염		H	H
C17 하이드로 클로라이드염		H	H
C18 하이드로 클로라이드염		H	H
C19 하이드로 클로라이드염		H	H
C20 하이드로 클로라이드염		H	H

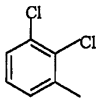
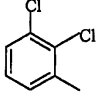
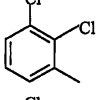
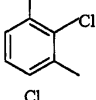
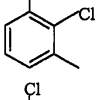
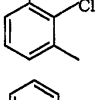
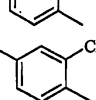
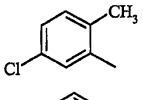
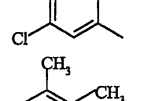
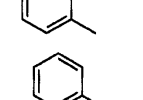


<413>

화합물 번호	R	R ¹	R ³
C21 하이드로 클로라이드염		H	H
C22 하이드로 클로라이드염		H	H
C23 하이드로 클로라이드염		H	H
C24 하이드로 클로라이드염		H	H
C25		H	H
C26		H	H
C27		H	H
C28		H	H
C29		H	-COCH ₃
C30		H	-SO ₂ N(CH ₃) ₂
C31		H	-PO(OC ₂ H ₅) ₂
C32		H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂









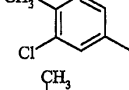
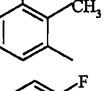



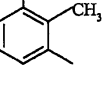
<414>

화합물 번호	R	R ¹	R ³
C33		H	-CO ₂ CH ₃
C34		H	-CHO
C35		H	-CONHCH ₃
C36		H	-CSNHCH ₃
C37		H	-CH=NC ₂ H ₅
C38		H	-CH=NOC ₂ H ₅
C39		H	-COCH ₃
C40		H	-SO ₂ N(CH ₃) ₂
C41		H	-PO(OC ₂ H ₅) ₂
C42		H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂

<415>

화합물 번호	R	R ¹	R ³
C43		H	-CO ₂ CH ₃
C44		H	-CHO
C45		H	-CONHCH ₃
C46		H	-CSNHCH ₃
C47		H	-CH=NC ₂ H ₅
C48		H	-CH=NOC ₂ H ₅
C49		-CH ₃	H
C50		H	H
C51		H	H
C52		H	-CH ₃
C53		H	-CO ₂ CH ₃
C54*		-CH ₃	H

<416>

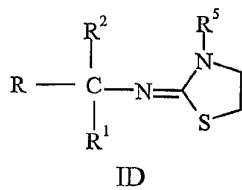
화합물 번호	R	R ¹	R ³
C55**		-CH ₃	-CH ₃
C56		-CH ₃	H
C57		-C ₂ H ₅	H
C58			H
C59		H	H
C60			H
C61		H	H
C62		-CH ₃	H
C63		H	H
C64		H	H
C65		-CH(CH ₃) ₂	H
C66		H	H

* ((1S)-1-페닐에틸) 이성체
 ** ((1R)-1-페닐에틸) 이성체

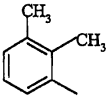
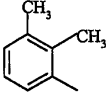
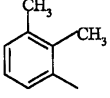
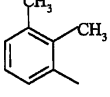
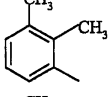
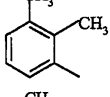
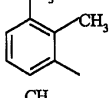
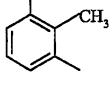
<417>

<418> R¹ 및 R²가 수소이고,

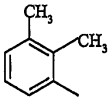
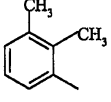
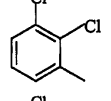
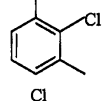
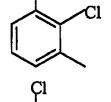
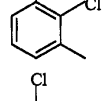
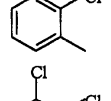
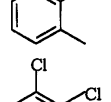
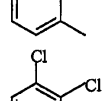
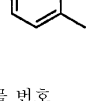
<419> R⁴는 식 (D)인 화학식 I:



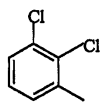
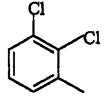
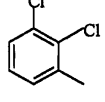
<420>

화합물 번호	R	R ⁵
D1		-COCH ₃
D2		-SO ₂ N(CH ₃) ₂
D3		-PO(OC ₂ H ₅) ₂
D4		-PS(OC ₂ H ₅) ₂
D5		-CO ₂ CH ₃
D6		-CHO
D7		-CONHCH ₃
D8		-CSNHCH ₃

<421>

화합물 번호	R	R ⁵
D9		-CH=NC ₂ H ₅
D10		-CH=NOC ₂ H ₅
D11		-COCH ₃
D12		-SO ₂ N(CH ₃) ₂
D13		-PO(OC ₂ H ₅) ₂
D14		-PS(OC ₂ H ₅) ₂
D15		-CO ₂ CH ₃
D16		-CHO
D17		-CONHCH ₃
D18		-CSNHCH ₃

<422>

화합물 번호	R	R ⁵
D19		-CH=NC ₂ H ₅
D20		-CH=NOC ₂ H ₅
D21		-PS(OCH ₃) ₂

<423>

<424> 하기 표는 본 발명의 특정 화학식 I의 화합물에 대한 물성 데이터를 나타낸다:

<425>

표 2

<426> 살충성 벤질아미노 헤테로사이클릭 유도체 화합물의 특성

분자식	고체의 용점 (°C) 또는 물리적 상태
A1	C ₁₀ H ₁₀ Cl ₂ N ₂ O 113-115
A2	C ₁₀ H ₁₁ ClN ₂ O 오일
A3	C ₁₀ H ₁₁ ClN ₂ O 오일
A4	C ₁₀ H ₁₁ ClN ₂ O 86-88
A5	C ₁₀ H ₁₀ Cl ₂ N ₂ O 오일
A6	C ₁₀ H ₁₀ Cl ₂ N ₂ O 121-124
A7	C ₁₀ H ₁₀ Cl ₂ N ₂ O 오일
A8	C ₁₀ H ₁₀ Cl ₂ N ₂ O 102-105
A9	C ₁₁ H ₁₁ F ₃ N ₂ O 78-79
A10	C ₁₁ H ₁₁ F ₃ N ₂ O 오일
A11	C ₁₁ H ₁₁ F ₃ N ₂ O 114-115
A12	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ O ₂ 오일
A13	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O ₃ 오일
A14	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O ₃ 오일
A15	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O ₃ 고체
A16	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O ₃ 고체
A17	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O ₃ 108-112
A18	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ O ₂ 99-102
A19	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ O ₂ 75-78
A20	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O ₃ 오일

<427>

분자식	고체의 용점 (°C) 또는 물리적 상태
A21	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ O 오일
A22	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O 오일
A23	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O 오일
A24	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ O 오일
A25	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O 81-83
A26	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O 85-88
A27	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O 오일
A28	C ₁₀ H ₁₂ N ₂ O 오일
A29	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ O 오일
A30	C ₁₁ H ₁₃ ClN ₂ O 100-102
A52	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ O 110-112
A53	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O 129-133
A54	C ₁₁ H ₁₃ ClN ₂ O 104-108
A55	C ₁₁ H ₁₃ ClN ₂ O 98-102
A56	C ₁₁ H ₁₃ ClN ₂ O 오일
A57	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ O 오일
A58	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ O 고체
A59	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O 오일
A60	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O 오일
A61	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ O 81-83
A62	C ₁₁ H ₁₂ Cl ₂ N ₂ O 100-105
A63	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O 116-119
A64	C ₁₆ H ₁₆ N ₂ O 151-153
A65	C ₁₀ H ₁₀ ClFN ₂ O 42-45
A66	C ₁₇ H ₁₈ N ₂ O 129-131
A67	C ₁₁ H ₁₃ ClN ₂ O 130-131
A68	C ₁₁ H ₁₃ ClN ₂ O 63-65
A69	C ₁₃ H ₁₈ N ₂ O 149-151
A70	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O 48-50
A71	C ₁₀ H ₁₁ FN ₂ O 오일
A72	C ₁₁ H ₁₃ FN ₂ O 132-135
A73	C ₁₁ H ₁₃ FN ₂ O 104-106
A74	C ₁₆ H ₁₆ N ₂ O 143-148
A75	C ₁₄ H ₁₄ N ₂ O 96-100
A76	C ₁₀ H ₁₁ FN ₂ O 오일
A77	C ₁₁ H ₁₁ F ₃ N ₂ O 165-167
A78	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ O ₂ 오일
A79	C ₁₂ H ₁₃ F ₃ N ₂ O 139-142
B1	C ₁₆ H ₂₅ N ₂ O ₃ PS 오일
B2	C ₁₄ H ₁₈ N ₂ O ₂ 125-126
B3	C ₁₃ H ₁₈ N ₂ O ₃ S 127-128
B4	C ₁₄ H ₂₁ N ₂ O ₃ PS 오일
B5	C ₁₈ H ₂₆ N ₂ O ₃ 오일
B6	C ₁₅ H ₂₁ N ₂ O ₂ 오일
B7	C ₁₅ H ₂₆ N ₂ O ₂ 85-86
B8	C ₁₄ H ₂₁ N ₂ O ₃ S 오일
B9	C ₁₄ H ₁₉ N ₂ O ₂ 135-136

<428>

분자식	고체의 융점(°C) 또는 물리적 상태
B10	C ₁₆ H ₂₅ N ₂ O ₄ P 오일
B11	C ₁₅ H ₂₀ N ₂ O ₃ 109-110
B12	C ₁₄ H ₁₈ N ₂ O ₃ 119-120
B13	C ₁₄ H ₂₁ N ₂ O ₄ P 오일
B14	C ₁₆ H ₂₇ N ₄ O ₂ P 오일
B15	C ₁₅ H ₂₂ N ₂ O ₂ 오일
B17	C ₁₄ H ₁₉ N ₃ OS 122-123
B31	C ₁₃ H ₁₅ N ₃ O 125-127
B32	C ₂₀ H ₂₄ N ₂ O ₂ 오일
B33	C ₁₅ H ₂₂ CIN ₇ O ₃ PS 오일
B34	C ₁₅ H ₂₄ CIN ₄ O ₂ P 오일
B35	C ₁₃ H ₁₈ CIN ₇ O ₃ PS 94-95
B36	C ₁₂ H ₁₂ CIN ₃ O 126-127
B37	C ₁₃ H ₁₆ CIN ₃ OS 고체
B38	C ₁₃ H ₁₅ CIN ₂ O ₂ 고체
B39	C ₁₄ H ₁₇ CIN ₂ O ₂ 고체
B40	C ₁₆ H ₂₃ N ₃ OS 127-128
B41	C ₁₅ H ₂₁ N ₃ OS 127-128
B42	C ₁₃ H ₁₆ FN ₃ OS 오일
B43	C ₁₃ H ₁₆ FN ₃ OS 오일
B44	C ₁₃ H ₁₆ FN ₃ OS 오일
B45	C ₁₈ H ₁₉ N ₃ OS 123-128
B46	C ₁₃ H ₁₇ N ₃ OS 109-112
B47	C ₁₆ H ₁₇ N ₃ OS 136-140
B48	C ₁₃ H ₁₄ F ₃ N ₃ OS 오일
B49	C ₁₄ H ₁₉ N ₃ OS 오일
C1	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ S 오일
C2	C ₁₀ H ₁₂ N ₂ S 82
C3	C ₁₀ H ₁₃ N ₂ S. I 고체
C4	C ₁₀ H ₁₁ Cl ₂ N ₂ S. Cl 164-166
C5	C ₁₀ H ₁₃ N ₂ S. Cl 100-102
C6	C ₁₀ H ₁₂ CIN ₂ S. Cl 187-188
C7	C ₁₀ H ₁₁ Cl ₂ N ₂ S. Cl 218-220
C8	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ S 94-96
C9	C ₁₀ H ₁₀ Cl ₂ N ₂ S 119-121
C10	C ₁₁ H ₁₃ N ₂ S. Cl 148-150
C11	C ₁₂ H ₁₇ N ₂ S. Cl 180-182
C12	C ₁₂ H ₁₇ N ₂ S. Cl 146-148
C13	C ₁₂ H ₁₇ N ₂ S. Cl 170-173
C14	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ S 154-155
C15	C ₁₀ H ₁₂ CIN ₂ S. Cl 148-150
C16	C ₁₀ H ₁₂ CIN ₂ S. Cl 145-147
C17	C ₁₀ H ₁₁ Cl ₂ N ₂ S. Cl 163-165
C18	C ₁₀ H ₁₁ Cl ₂ N ₂ S. Cl 212-213
C19	C ₁₀ H ₁₁ Cl ₂ N ₂ S. Cl 202-204
C20	C ₁₁ H ₁₂ F ₃ N ₂ S. Cl 192-194
C21	C ₁₁ H ₁₂ F ₃ N ₂ S. Cl 147-148

분자식	고체의 용점 (°C) 또는 물리적 상태
C22	C ₁₁ H ₁₂ F ₃ N ₂ S. Cl 129-131
C23	C ₁₁ H ₁₃ N ₂ OS. Cl 118-120
C24	C ₁₁ H ₁₃ N ₂ OS. Cl 128-130
C25	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O ₂ S 82-85
C26	C ₁₀ H ₁₁ FN ₂ S 고체
C27	C ₁₁ H ₁₃ ClN ₂ S 124-125
C49	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ S 110-113
C50	C ₁₁ H ₁₃ ClN ₂ S 118-120
C51	C ₁₁ H ₁₃ ClN ₂ S 134-135
C52	C ₁₁ H ₁₃ ClN ₂ S 오일
C53	C ₁₄ H ₁₈ N ₂ O ₂ S 액체
C54	C ₁₁ H ₁₄ N ₂ S 84-86
C55	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ S 오일
C56	C ₁₁ H ₁₂ Cl ₂ N ₂ S 114-116
C57	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ S 105-106
C58	C ₁₆ H ₁₆ N ₂ S 124-126
C59	C ₁₀ H ₁₀ ClFN ₂ S 92-94
C60	C ₁₇ H ₁₈ N ₂ S 122-123
C61	C ₁₁ H ₁₃ ClN ₂ S 90-95
C62	C ₁₃ H ₁₈ N ₂ S 120-121
C63	C ₁₀ H ₁₁ FN ₂ S 106-109
C64	C ₁₀ H ₁₁ FN ₂ S 고체
C65	C ₁₃ H ₁₈ N ₂ S 110-114
C66	C ₁₂ H ₁₆ N ₂ S 110-114
D2	C ₁₄ H ₂₁ N ₃ O ₂ S ₂ 81-84
D4	C ₁₆ H ₂₃ N ₂ O ₂ PS ₂ 액체
D5	C ₁₄ H ₁₈ N ₂ O ₂ S 129-131
D11	C ₁₂ H ₁₂ Cl ₂ N ₂ OS 137-140
D12	C ₁₂ H ₁₅ Cl ₂ N ₃ O ₂ S ₂ 119-120
D14	C ₁₄ H ₁₉ Cl ₂ N ₂ O ₂ PS ₂ 액체
D15	C ₁₂ H ₁₂ Cl ₂ N ₂ O ₂ S 105-110
D21	C ₁₂ H ₁₅ Cl ₂ N ₂ O ₂ PS ₂ 액체

<430>

<431>

처리된 목화 식물잎 절편 상에서 목화 진딧물(*Aphis gossypii*) 집단 사충률을 처리되지 않은 식물잎 절편 상의 목화 진딧물 집단과 비교 관찰하여 후보 살충제에 대한 목화 진딧물 살충 활성을 평가하였다.

<432>

떡잎 및 새로 자란 본잎을 베어내고 가장 오래된 잎 두개를 남겨 3 주 내지 1 개월된 목화 식물(*Gossypium hirsutum*)을 감염용으로 준비하였다. 목화 진딧물 콜로니로 증식된 목화 식물로부터 이동되도록 하여 준비한 시험 식물을 목화 진딧물로 감염시켰다. 깨끗한 128-웰 트레이(CD-International, Pittman, New Jersey)에 딱딱한 3% 아가 수용액 1 ml를 채우고 주변 온도로 냉각하였다. 진딧물로 감염된 목화잎을 식물로부터 제거하여 커팅 플랫폼 바닥면에 놓았다. 감염 잎으로부터 원형 절편을 잘라 웰당 하나의 절편으로 냉각 아가젤 바닥면에 놓았다. 각 잎 절편을 육안 관찰하여 최소 10 마리의 살아있는 진딧물이 존재하는 것을 확인하였다. 적절한 양의 시험 화합물을 DMSO에 용해시켜 50 mM의 시험 화합물 원액을 준비하였다. 0.003% Kinetic[®] (비이온성 습윤제/전착제/침투 보조제, Helena Chemical Company, Collierville, Tennessee) 수용액 140 μl에 원액 10 μl를 용해시켜 각 시험 화합물 1000 ppm을 포함하는 용액을 준비하였다. 필요에 따라, 시험 화합물 1000 ppm 용액을 934 mL 물중 66 mL의 DMSO 및 30 μl의 Kinetic[®]의 용액(희석 용액)으로 일련적으로 희석하여 보다 낮은 적용 비율, 예를 들어 300 ppm, 100 ppm, 30 ppm 또는 10 ppm의 각 시험 화합물 용액을 제공하였다. 각 중복 감염 식물 절편에 시험 용액 10 μl를 약 8 psi로 1 초간 분무하였다. 비교를 위해서, 시험 화합물을 함유하지 않는 희석 용액 및 시험 화합물을 함유하지 않는 0.003% Kinetic[®]의 수용액과 비펜트린과 같은 표준 용액을 또한 시험 식물 절편상에 분무하였다. 시험 화합물 용액 및 시험 화합물을 함유하지 않는 용액의 분무를 완료하고, 식물 절편을 건조시켰다. 건조가 완료되면, 시험 트레이를 플라스틱 필름으로 덮었다. 각 웰상의 필름에 세개의 슬릿을 만들어 공기가 각 웰로 유입되도록 하였다. 시험 트레이를 바이오챔버 (25 °C, 16 시간동안 광, 8 시간동안 어둠 및 35-40% 상대습도 조건)에 3 일동안 두었다. 그 후, 각 식물 절편을 시험 화합물을 함유하지 않는 시험 식물 절편상에 감염된 진딧물 집단과 비교하여, 시험 화합물에 의해 유발된 사충률을 평가하였다. 화합물이 분무된 식물상에서 목화 진딧물 사충률이 40% 내지 75%이면, 시험 화합물이 살충 활성(SA)을 갖는 것으로 간주하였다. 목화 진딧물의 사충률이 75% 이상이면, 시험 화합물이 보다 살충 활성(A)인 것으로 간주하였다. 목화 진딧물의 사충률이 40% 이하이면, 시험 화합물이 불활성(I)인 것으로 간주하였다.

<433>

상기 시험으로부터 소정 적용 비율에서의 살충 활성 평가를 하기 표 3에 나타내었다. 화학식 I의 시험 화합물

을 표 1에 상응하는 번호로 나타내었다.

<434> 표 3

<435> 하기 본 발명의 화합물들은 감염된 목화 잎 절편상에서 1000 ppm 이하의 적용비율로 적용시 목화 진딧물 집단을 적어도 40 내지 100% 감소시켰다

화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호
A2	A3	A4	A5	A6	A7	A8	A10	A11	A12
A13	A14	A15	A16	A17	A18	A19	A20	A21	A22
A23	A24	A26	A27	A53	A54	A79	B3	B8	B11
B12	B13	B15	B40	B41	C1	C3	C4	C7	C8
C9	C12	C13	C14	C16	C17	C19	C20	C21	C22
C23	C24	C25	C27	C50	C52	C53	C65	C66	D2
D4	D5	D12	D14	D15					

<436>

<437> 처리된 목화 식물상에서 목화 진딧물(아피스 고시피이(*Aphis gossypii*)) 집단의 사충률을 처리되지 않은 식물상의 상기 목화 진딧물 집단과 비교 관찰하여 후보 살충제에 대한 살충 활성을 평가하였다.

<438> 시험 화합물의 각 적용 비율에 대해서, 시험을 위해 7.6 cm 직경의 용기에서 성장시킨 두 개의 7 내지 10 일된 목화 묘목(고시피움 히르수티움(*Gossypium hirsutum*))을 선택하였다. 각 시험 식물 위에 목화 진딧물 콜로니를 증식시킨 목화 잎 조각을 놓아 각 시험 식물을 약 120 마리의 목화 진딧물로 감염시켰다. 감염이 되었으면, 시험 식물을 약 12 시간까지 유지시켜 진딧물이 시험 식물로 완전히 이동되도록 하였다. 시험 화합물 10 밀리그램을 아세톤 1 ml에 용해시켜 각 시험 화합물 1000 ppm을 함유하는 용액을 제조하였다. 이어서, 각 용액을 물 100 ml 중의 폴리옥시에틸렌(10) 이소옥틸페닐 에테르 0.03 ml 용액 9 ml로 희석하였다. 각 시험 식물 증복물에 분무하기 위해(각 시험 화합물에 대해 총 5 ml) 각 시험 화합물 약 2.5 ml의 용액이 필요하였다. 필요에 따라, 시험 화합물 1000 ppm의 용액을 수중 10% 아세톤 및 300 ppm의 폴리옥시에틸렌(10) 이소옥틸페닐 에테르 용액으로 일련적으로 희석하여 보다 낮은 적용 비율, 예를 들어 300 ppm, 100 ppm, 30 ppm 또는 10 ppm의 각 시험 화합물 용액을 제공하였다. 각 시험 식물 증복물에 잎의 상하면 모두에 흘러 내릴때까지 시험 화합물 용액을 분무하였다. 시험 식물로부터 약 30.5 cm 떨어져 위치한 곳에서 드빌버스(DeVilbus) 분무기 모델 152(Sunrise Medical, Carlsbad, CA)를 약 0.63 내지 0.74 kg/cm²의 압력으로 사용하여 모든 시험 식물에 분무를 행하였다. 비교를 위해서, 시험 화합물을 함유하지 않는 수중 10% 아세톤 및 300 ppm의 폴리옥시에틸렌(10) 이소옥틸페닐 에테르 용액을 또한 대조 시험 식물에 분무하였다. 시험 화합물 용액 및 시험 화합물을 함유하지 않는 용액의 분무를 완료하고, 식물을 건조시켰다. 건조가 완료되면, 시험 및 대조 식물을 약 2.5 cm의 물을 함유하는 트레이에 놓고, 증식 챔버에서 72 시간 동안 유지시켰다. 그 후, 각 식물을 시험 화합물로 처리하기 전 시험 식물을 감염시킨 진딧물 집단과 비교하여, 시험 화합물에 의해 유발된 사충률을 평가하였다. 화합물이 분무된 식물상에서 목화 진딧물 사충률이 40% 내지 75%이면, 시험 화합물이 살충 활성(SA)을 갖는 것으로 간주하였다. 목화 진딧물의 사충률이 75% 이상이면, 시험 화합물이 보다 살충 활성(A)인 것으로 간주하였다. 목화 진딧물의 사충률이 40% 이하이면, 시험 화합물이 불활성(I)인 것으로 간주하였다.

<439> 상기 시험으로부터 소정 적용 비율에서의 살충 활성 평가를 표 3A에 나타내었다. 화학식 I의 시험 화합물을 표 1에 상응하는 번호로 나타내었다.

<440> 표 3A

<441> 하기 본 발명의 화합물들은 감염된 목화 식물상에서 1000 ppm 이하의 적용비율로 적용시 목화 진딧물 집단을 40 내지 100% 까지 감소시켰다

화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호
A1	A9	A25	A28	A29	A30	A52	A55	A56	A57
A58	A59	A60	A61	A62	A63	A64	A65	A66	A67

<442>

화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호	화합물 번호
A68	A69	A70	A71	A72	A73	A74	A75	A76	A77	
A78	B1	B2	B4	B5	B6	B7	B9	B10	B14	
B17	B31	B32	B33	B34	B35	B36	B37	B38	B39	
B42	B43	B44	B45	B46	B47	B48	B49	C2	C5	
C6	C10	C11	C15	C18	C26	C49	C51	C54	C55	
C56	C57	C58	C59	C60	C61	C62	C63	C64	D11	
D21										

<443>

<444>

상기 표 3 및 3A에 나타나 있는 바와 같이, 본 발명의 대부분의 화합물들은 1000 ppm 이하의 적용비율로 적용시 목화 진딧물 집단을 적어도 40% 감소시켰다

<445>

본 발명을 바람직한 구체예에 중점을 두어 개시하였지만, 당업계의 통상적인 숙련자들은 상기 바람직한 구체예의 변형들이 이용될 수 있고 본 발명을 본 발명에 구체적으로 개시한 것과 다르게도 실시할 수 있음을 이해할 것이다. 따라서, 본 발명은 하기 청구 범위에 의해 한정되는 바와 같은 본 발명의 취지 및 범위 내에 포함된 모든 변형들을 포함한다.