



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2009-0018144
(43) 공개일자 2009년02월19일

- | | |
|---|--|
| <p>(51) Int. Cl.
 <i>A01N 43/90</i> (2006.01) <i>A01P 5/00</i> (2006.01)
 <i>A01P 7/00</i> (2006.01) <i>C07D 495/04</i> (2006.01)</p> <p>(21) 출원번호 10-2008-7030895
 (22) 출원일자 2008년12월19일
 심사청구일자 없음
 번역문제출일자 2008년12월19일</p> <p>(86) 국제출원번호 PCT/EP2007/054717
 국제출원일자 2007년05월15일
 (87) 국제공개번호 WO 2007/135029
 국제공개일자 2007년11월29일</p> <p>(30) 우선권주장
 60/802,354 2006년05월22일 미국(US)</p> | <p>(71) 출원인
 바스프 에스이
 독일 데-67056 루트비샤펜</p> <p>(72) 발명자
 바우만, 에른스트
 독일 67373 두텐호펜 팔켄스트라쎄 6아
 바스티안스, 헨리쿠스 마리아 마르티누스
 독일 61250 유진겐 바르톨로모이스-아르놀디-스트라쎄 35
 (뒷면에 계속)</p> <p>(74) 대리인
 양영준, 위혜숙</p> |
|---|--|

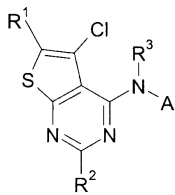
전체 청구항 수 : 총 25 항

(54) 4-아미노-5-클로로-티에노 [2,3-D]-피리미딘 화합물을 사용하는 살충 방법

(57) 요약

본 발명은 하기 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물을 사용하는 신규 살충 방법에 관한 것이다. 본 발명은 상기 화학식 I의 화합물을 적용하는 살충 방법, 및 화학식 I의 화합물의 신규 유도체에 관한 것이다.

<화학식 I>



상기 식에서, R¹, R², R³ 및 A는 본 명세서에 정의된 바와 같다.

(72) 발명자

본 데인, 볼프강

독일 67435 노이스타트 안 데르 블라이헤 24

폴, 미하엘

독일 68623 람페르타임 뷔르스테터 스트라쎬 95

락, 미하엘

독일 69214 에펠하임 힐다스트라쎬 11/1

안스파우그, 더글라스 디.

미국 27502 노쓰 캐롤라이나주 아펙스 와인코트 드
라이브 4007

쿨버트슨, 데보라 엘.

미국 27526 노쓰 캐롤라이나주 푸웨이 바리나 빈티
지 럿지 레인 6400

올로우미-사데히, 핫산

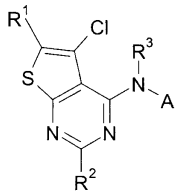
미국 27614 노쓰 캐롤라이나주 탈레이 폴리스 밀
서클 12105

특허청구의 범위

청구항 1

곤충류, 거미류 또는 선충류 또는 그의 식량 공급원, 서식처 또는 번식지를 구충 유효량의 하나 이상의 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물, 또는 하나 이상의 화학식 I의 화합물 및/또는 하나 이상의 그의 농업상 허용되는 염을 포함하는 조성물과 접촉시키는 것을 포함하는, 곤충류, 거미류 또는 선충류의 박멸 또는 방제 방법.

<화학식 I>



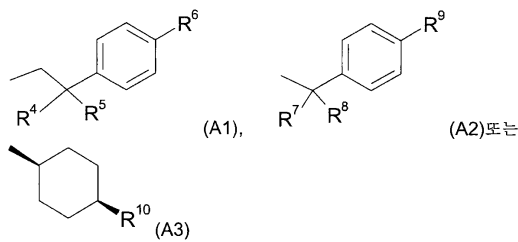
상기 식에서,

R¹은 수소, 할로젠, 포르밀, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-알케닐, C₁-C₁₀-알키닐, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-할로알케닐, C₁-C₁₀-할로알키닐, C₁-C₁₀-알콕시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₆-알킬, C₁-C₁₀-할로알콕시, C₁-C₁₀-알킬티오, C₁-C₁₀-알킬술피닐, C₁-C₁₀-알킬술폰닐, C₁-C₁₀-알킬아미노, 디(C₁-C₁₀-알킬)아미노, CN, CNOH, CNOCH₃ 또는 CNOC₂H₅에서 선택되고;

R²는 수소, 할로젠, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-알콕시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₆-알킬, C₁-C₁₀-할로알콕시, C₁-C₁₀-알킬티오, C₁-C₁₀-알킬술피닐, C₁-C₁₀-알킬술폰닐, C₁-C₁₀-알킬아미노 또는 디(C₁-C₁₀-알킬)아미노에서 선택되고;

R³은 수소 또는 C₁-C₁₀-알킬이고;

A는



이고,

여기서,

R⁴, R⁵, R⁷은 서로 독립적으로 수소 또는 C₁-C₁₀-알킬에서 선택되고;

R⁸은 C₁-C₁₀-알킬이고;

R⁶, R⁹는 할로젠, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-알콕시 또는 C₁-C₁₀-할로알콕시에서 선택되고;

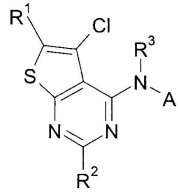
R¹⁰은 C₁-C₁₀-알킬 또는 C₁-C₁₀-할로알킬이다.

청구항 2

식물, 또는 식물이 성장하고 있는 토양 또는 물을 구충 유효량의 하나 이상의 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물, 또는 하나 이상의 화학식 I의 화합물 및/또는 하나 이상의 그의 농업상 허용되는

염을 포함하는 조성물과 접촉시키는 것을 포함하는, 곤충류, 거미류 또는 선충류에 의한 공격 또는 침입으로부터 작물 및 성장하고 있는 식물을 보호하는 방법.

<화학식 I>



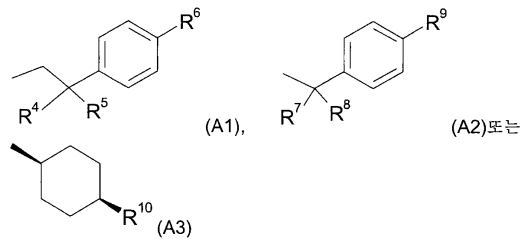
상기 식에서,

R¹은 수소, 할로젠, 포르밀, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-알케닐, C₁-C₁₀-알키닐, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-할로알케닐, C₁-C₁₀-할로알키닐, C₁-C₁₀-알콕시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₆-알킬, C₁-C₁₀-할로알콕시, C₁-C₁₀-알킬티오, C₁-C₁₀-알킬술피닐, C₁-C₁₀-알킬술포닐, C₁-C₁₀-알킬아미노, 디(C₁-C₁₀-알킬)아미노, CN, CNOH, CNOCH₃ 또는 CNOC₂H₅에서 선택되고;

R²는 수소, 할로젠, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-알콕시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₆-알킬, C₁-C₁₀-할로알콕시, C₁-C₁₀-알킬티오, C₁-C₁₀-알킬술피닐, C₁-C₁₀-알킬술포닐, C₁-C₁₀-알킬아미노 또는 디(C₁-C₁₀-알킬)아미노에서 선택되고;

R³은 수소 또는 C₁-C₁₀-알킬이고;

A는



이고,

여기서,

R⁴, R⁵, R⁷은 서로 독립적으로 수소 또는 C₁-C₁₀-알킬에서 선택되고;

R⁸은 C₁-C₁₀-알킬이고;

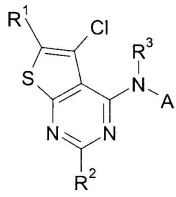
R⁶, R⁹는 할로젠, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-알콕시 또는 C₁-C₁₀-할로알콕시에서 선택되고;

R¹⁰은 C₁-C₁₀-알킬 또는 C₁-C₁₀-할로알킬이다.

청구항 3

종자를 하나 이상의 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물, 또는 하나 이상의 화학식 I의 화합물 및/또는 하나 이상의 그의 농업상 허용되는 염을 포함하는 조성물과 파종 전에 및/또는 예비발아 후에 접촉시키는 것을 포함하는, 토양 곤충류로부터 종자를 보호하고, 토양 및 엽상 곤충류로부터 묘목 뿌리 및 묘조를 보호하는 방법.

<화학식 I>



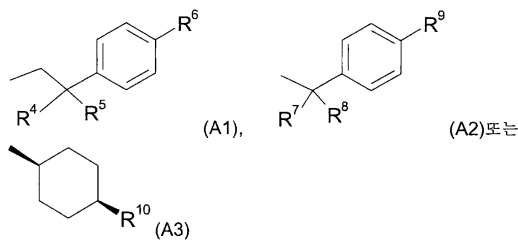
상기 식에서,

R¹은 수소, 할로젠, 포르밀, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-알케닐, C₁-C₁₀-알키닐, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-할로알케닐, C₁-C₁₀-할로알키닐, C₁-C₁₀-알콕시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₆-알킬, C₁-C₁₀-할로알콕시, C₁-C₁₀-알킬티오, C₁-C₁₀-알킬술피닐, C₁-C₁₀-알킬술포닐, C₁-C₁₀-알킬아미노, 디(C₁-C₁₀-알킬)아미노, CN, CNOH, CNOCH₃ 또는 CNOC₂H₅에서 선택되고;

R²는 수소, 할로젠, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-알콕시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₆-알킬, C₁-C₁₀-할로알콕시, C₁-C₁₀-알킬티오, C₁-C₁₀-알킬술피닐, C₁-C₁₀-알킬술포닐, C₁-C₁₀-알킬아미노 또는 디(C₁-C₁₀-알킬)아미노에서 선택되고;

R³은 수소 또는 C₁-C₁₀-알킬이고;

A는



이고,

여기서,

R⁴, R⁵, R⁷은 서로 독립적으로 수소 또는 C₁-C₁₀-알킬에서 선택되고;

R⁸은 C₁-C₁₀-알킬이고;

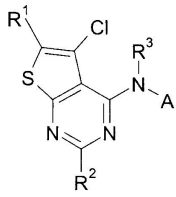
R⁶, R⁹는 할로젠, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-알콕시 또는 C₁-C₁₀-할로알콕시에서 선택되고;

R¹⁰은 C₁-C₁₀-알킬 또는 C₁-C₁₀-할로알킬이다.

청구항 4

동물에게 기생충 유효량의 하나 이상의 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물, 또는 하나 이상의 화학식 I의 화합물 및/또는 하나 이상의 그의 수의학상 허용되는 염을 포함하는 조성물을 투여하는 것을 포함하는, 기생충에 의한 침입 또는 감염에 대해 동물을 치료, 방제, 예방 또는 보호하는 방법.

<화학식 I>



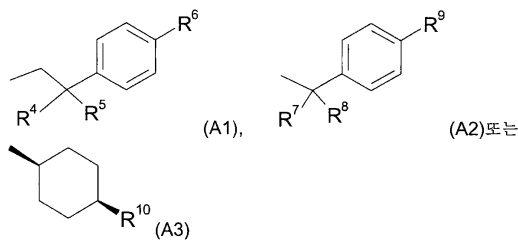
상기 식에서,

R¹은 수소, 할로젠, 포르밀, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-알케닐, C₁-C₁₀-알키닐, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-할로알케닐, C₁-C₁₀-할로알키닐, C₁-C₁₀-알콕시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₆-알킬, C₁-C₁₀-할로알콕시, C₁-C₁₀-알킬티오, C₁-C₁₀-알킬술피닐, C₁-C₁₀-알킬술포닐, C₁-C₁₀-알킬아미노, 디(C₁-C₁₀-알킬)아미노, CN, CNOH, CNOCH₃ 또는 CNOC₂H₅에서 선택되고;

R²는 수소, 할로젠, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-알콕시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₆-알킬, C₁-C₁₀-할로알콕시, C₁-C₁₀-알킬티오, C₁-C₁₀-알킬술피닐, C₁-C₁₀-알킬술포닐, C₁-C₁₀-알킬아미노 또는 디(C₁-C₁₀-알킬)아미노에서 선택되고;

R³은 수소 또는 C₁-C₁₀-알킬이고;

A는



이고,

여기서,

R⁴, R⁵, R⁷은 서로 독립적으로 수소 또는 C₁-C₁₀-알킬에서 선택되고;

R⁸은 C₁-C₁₀-알킬이고;

R⁶, R⁹는 할로젠, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-알콕시 또는 C₁-C₁₀-할로알콕시에서 선택되고;

R¹⁰은 C₁-C₁₀-알킬 또는 C₁-C₁₀-할로알킬이다.

청구항 5

제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 있어서, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물의 A가 A1로서 정의되는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 6

제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 있어서, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물의 A가 A2로서 정의되는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 7

제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 있어서, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물의 A

가 A2이고 S-거울상이성질체를 나타내는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 8

제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 있어서, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물의 A가 A3로서 정의되는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 9

제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 있어서, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물의 R¹ 및 R²가 서로 독립적으로 수소 또는 C₁-C₆-알킬에서 선택되는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 10

제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 있어서, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물의 R⁵ 및 R⁷이 수소인 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 11

제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 있어서, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물의 R¹⁰이 분지된 C₃-C₁₀-알킬인 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 12

제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 있어서, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물의 R¹⁰이 이소-프로필, sec-부틸 또는 tert-부틸인 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 13

제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 있어서, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물이 (5-클로로-티에노[2,3-d]피리미딘-4-일)-[1-S-(4-트리플루오로메톡시-페닐)-에틸]-아민인 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 14

제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 있어서, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물이 시스-(4-tert-부틸-시클로헥실)-(5-클로로-티에노[2,3-d]피리미딘-4-일)-아민인 것을 특징으로 하는 방법.

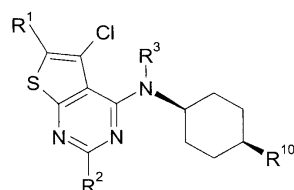
청구항 15

제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 있어서, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물이 (5-클로로-티에노[2,3-d]피리미딘-4-일)-[2-(4-트리플루오로메톡시-페닐)-에틸]-아민인 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 16

화학식 I-A3의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물 및/또는 하나 이상의 그의 농업상 또는 수의 학상 허용되는 염.

<화학식 I-A3>



상기 식에서,

R^1 은 수소, 할로젠, 포르밀, C_1-C_{10} -알킬, C_1-C_{10} -알케닐, C_1-C_{10} -알키닐, C_1-C_{10} -할로알킬, C_1-C_{10} -할로알케닐, C_1-C_{10} -할로알키닐, C_1-C_{10} -알콕시, C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_6 -알킬, C_1-C_{10} -할로알콕시, C_1-C_{10} -알킬티오, C_1-C_{10} -알킬술피닐, C_1-C_{10} -알킬술포닐, C_1-C_{10} -알킬아미노, 디(C_1-C_{10} -알킬)아미노, CN, CNOH, CNOCH₃ 또는 CNOC₂H₅에서 선택되고;

R^2 은 수소, 할로젠, C_1-C_{10} -알킬, C_1-C_{10} -할로알킬, C_1-C_{10} -알콕시, C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_6 -알킬, C_1-C_{10} -할로알콕시, C_1-C_{10} -알킬티오, C_1-C_{10} -알킬술피닐, C_1-C_{10} -알킬술포닐, C_1-C_{10} -알킬아미노, 디(C_1-C_{10} -알킬)아미노에서 선택되고;

R^3 은 수소 또는 C_1-C_{10} -알킬이고;

R^{10} 은 C_1-C_{10} -알킬 또는 C_1-C_{10} -할로알킬이다.

청구항 17

제16항에 있어서, R^1 , R^2 가 서로 독립적으로 수소 또는 C_1-C_6 -알킬에서 선택되는 것인 화학식 I-A3의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물.

청구항 18

제16항에 있어서, R^{10} 이 분지된 C_3-C_{10} -알킬인 화학식 I-A3의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물.

청구항 19

제16항에 있어서, R^{10} 이 이소-프로필, sec-부틸 또는 tert-부틸인 화학식 I-A3의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물.

청구항 20

시스-(4-tert-부틸-시클로헥실)-(5-클로로-티에노[2,3-d]피리미딘-4-일)-아민.

청구항 21

제16항 내지 제20항 중 어느 한 항에 따른 하나 이상의 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물, 또는 그의 거울상이성질체, 부분입체이성질체 또는 염 및 하나 이상의 불활성 액체 및/또는 고체 담체를 포함하는, 농업용 또는 수의용 조성물.

청구항 22

제4항에 있어서, 동물에게 기생충 유효량의 제4항 및 제5항 내지 제15항 중 어느 한 항에 정의된 바와 같은 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물 또는 그의 수의학상 허용되는 염을 경구로, 국소로 또는 비경구로 투여하거나 또는 적용하는 것을 포함하는 방법.

청구항 23

제3항에 있어서, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물이 종자 100 kg 당 100 mg 내지 10 kg의 양으로 적용되는 것인 방법.

청구항 24

제3항에 있어서, 얻어진 식물의 뿌리 및 묘조가 보호되는 것인 방법.

청구항 25

제3항 및 제5항 내지 제17항 중 어느 한 항에 정의된 바와 같은 화학식 I의 화합물 또는 그의 농업상 유용한 염을 종자 100 kg 당 0.1 g 내지 10 kg의 양으로 포함하는 종자.

명세서

기술분야

<1> 본 발명은 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물 및 그의 염을 사용하는 신규 살충 방법에 관한 것이다.

배경기술

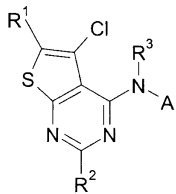
<2> 동물 해충은 성장하고 있는 작물 및 수확된 작물을 파괴하고 목조 주거용 및 상업용 건물을 공격하여, 식량 공급원 및 재산에 큰 경제적 손실을 일으킨다. 다수의 구충제가 공지되어 있으나, 상기 구충제에 대한 내성을 발생하는 표적 해충의 능력으로 인해, 동물 해충 박멸을 위한 새로운 구충제에 대한 지속적인 필요성이 존재한다. 특히, 동물 해충, 예컨대 곤충류 및 진드기류는 효과적으로 방제되기 어렵다.

발명의 상세한 설명

<3> 따라서, 본 발명의 목적은 우수한 구충 활성을 갖고, 특히 방제하기가 어려운 곤충류 및 진드기류에 대해 우수한 구충 활성을 갖는 화합물 및 방법을 제공하는 것이다.

<4> 이들 목적은 하기 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 유도체 및/또는 하나 이상의 그의 농업상 또는 수의학상 허용되는 염에 의해 해결된다는 것이 밝혀졌다.

화학식 I



<5>

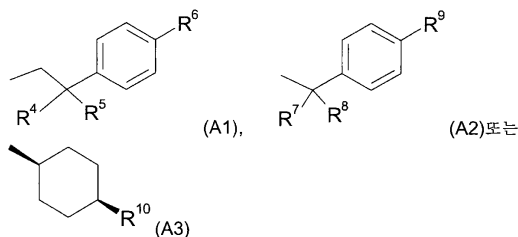
<6> 상기 식에서,

<7> R¹은 수소, 할로젠, 포르밀, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-알케닐, C₁-C₁₀-알키닐, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-할로알케닐, C₁-C₁₀-할로알키닐, C₁-C₁₀-알콕시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₆-알킬, C₁-C₁₀-할로알콕시, C₁-C₁₀-알킬티오, C₁-C₁₀-알킬술피닐, C₁-C₁₀-알킬술포닐, C₁-C₁₀-알킬아미노, 디(C₁-C₁₀-알킬)아미노, CN, CNOH, CNOCH₃ 또는 CNOC₂H₅에서 선택되고;

<8> R²는 수소, 할로젠, C₁-C₁₀-알킬, C₁-C₁₀-할로알킬, C₁-C₁₀-알콕시, C₁-C₆-알콕시-C₁-C₆-알킬, C₁-C₁₀-할로알콕시, C₁-C₁₀-알킬티오, C₁-C₁₀-알킬술피닐, C₁-C₁₀-알킬술포닐, C₁-C₁₀-알킬아미노 또는 디(C₁-C₁₀-알킬)아미노에서 선택되고;

<9> R³은 수소 또는 C₁-C₁₀-알킬이고;

<10> A는



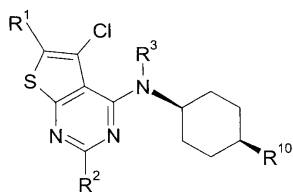
<11>

<12> 이고,

<13> 여기서,

- <14> R^4 , R^5 , R^7 은 서로 독립적으로 수소 또는 C_1 - C_{10} -알킬에서 선택되고;
- <15> R^8 은 C_1 - C_{10} -알킬이고;
- <16> R^6 , R^9 는 할로젠, C_1 - C_{10} -알킬, C_1 - C_{10} -할로알킬, C_1 - C_{10} -알콕시 또는 C_1 - C_{10} -할로알콕시에서 선택되고;
- <17> R^{10} 은 C_1 - C_{10} -알킬 또는 C_1 - C_{10} -할로알킬이다.
- <18> 치환 패턴에 의존하여, 화학식 I의 화합물은 하나 이상의 키랄 중심을 가질 수 있으며, 이러한 경우에 이는 거울상이성질체 또는 부분입체이성질체 혼합물로서 존재한다. 본 발명의 대상은 이들 혼합물을 함유하는 조성물 뿐만 아니라, 또한 순수한 거울상이성질체 또는 부분입체이성질체를 함유하는 조성물이다.
- <19> 그러므로, 본 발명은 상기 화학식 I의 화합물을 적용하는 하기 살충 방법에 관한 것이다.
- <20> 본 발명의 목적은 동물 해충, 동물 해충이 성장하고 있거나 성장할 수 있는 그의 서식지, 번식지, 식량 공급원, 식물, 종자, 토양, 지역, 물질 또는 환경, 또는 동물의 공격 또는 침입으로부터 보호하고자 하는 물질, 식물, 종자, 토양, 표면 또는 공간을 구충 유효량의 하나 이상의 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물 및/또는 하나 이상의 그의 농업상 허용되는 염과 접촉시키는 것을 포함하는, 동물 해충의 박멸 및 방제 방법에 관한 것이고;
- <21> 본 발명의 추가 목적은 작물 또는 성장하고 있는 식물을 구충 유효량의 하나 이상의 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물 및/또는 하나 이상의 그의 농업상 허용되는 염과 접촉시키는 것을 포함하는, 동물 해충에 의한 공격 또는 침입으로부터 작물을 보호하는 방법을 제공하는 것이고;
- <22> 본 발명의 다른 목적은 종자를 하나 이상의 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물 또는 하나 이상의 그의 농업상 허용되는 염과 파종 전에 및/또는 예비발아 후에 접촉시키는 것을 포함하는, 토양 곤충류로부터 종자를 보호하고, 토양 및 엽상 곤충류로부터 묘목 뿌리 및 묘조를 보호하는 방법을 제공하는 것이고;
- <23> 본 발명의 다른 목적은 동물에게 기생충 유효량의 하나 이상의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물 및/또는 하나 이상의 그의 수의학상 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 기생충에 의한 침입 또는 감염에 대해 동물을 치료, 방제, 예방 또는 보호하는 방법을 제공하는 것이다. 또한, 본 발명의 목적은 기생충을 그의 기생충 활성 양으로 처리함으로써 동물 내의 및 동물 상의 기생충의 박멸을 위해, 하나 이상의 화학식 I의 화합물 및/또는 그의 수의학상 허용되는 염을 사용하는 방법이다.
- <24> 추가로, 본 발명은 화학식 I-A3의 신규 시클로-헥실 치환된 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물, 그의 농업용 또는 수의학상 유용한 염, 및 상기 화합물 및 하나 이상의 불활성 액체 및/또는 고체 농업상 허용되는 담체를 포함하는 수의용 또는 농업용 조성물에 관한 것이다.

화학식 IA3



- <25>
- <26> 상기 식에서,
- <27> R^1 은 수소, 할로젠, 포르밀, C_1 - C_{10} -알킬, C_1 - C_{10} -알케닐, C_1 - C_{10} -알키닐, C_1 - C_{10} -할로알킬, C_1 - C_{10} -할로알케닐, C_1 - C_{10} -할로알키닐, C_1 - C_{10} -알콕시, C_1 - C_6 -알콕시- C_1 - C_6 -알킬, C_1 - C_{10} -할로알콕시, C_1 - C_{10} -알킬티오, C_1 - C_{10} -알킬술피닐, C_1 - C_{10} -알킬술포닐, C_1 - C_{10} -알킬아미노, 디(C_1 - C_{10} -알킬)아미노, CN, CNOH, CNOCH₃ 또는 CNOCH₂H₅에서 선택되고;
- <28> R^2 는 수소, 할로젠, C_1 - C_{10} -알킬, C_1 - C_{10} -할로알킬, C_1 - C_{10} -알콕시, C_1 - C_6 -알콕시- C_1 - C_6 -알킬, C_1 - C_{10} -할로알콕시,

C₁-C₁₀-알킬티오, C₁-C₁₀-알킬술피닐, C₁-C₁₀-알킬술포닐, C₁-C₁₀-알킬아미노 또는 디(C₁-C₁₀-알킬)아미노에서 선택되고;

- <29> R³은 수소 또는 C₁-C₁₀-알킬이고;
- <30> R¹⁰은 C₁-C₁₀-알킬 또는 C₁-C₁₀-할로알킬이다.
- <31> 티에노피리미딘은 선행 기술에 공지되어 있고 기재되어 있다. 4-아미노-티에노피리미딘은 살균 특성을 갖는 아르알킬아민 유도체로서 제EP-A 0370704호에 언급되어 있다. 4-아미노-티에노피리미딘 유도체 조성물은 또한 진균, 바이러스 및 세균 식물 질환 및 곤충 손상의 방제에 대해 제DE-A 2654090호에 기재되어 있다. 제EP-A 0452002호에는 살진균, 살충 및 진드기박멸 유용성을 갖는 N-치환된-티에노피리미딘-4-아민이 개시되어 있다. 제JP-A 2004-238380호에는 4-페닐에틸아미노피리미딘의 제조 및 살충제로서의 그의 용도가 기재되어 있다. 살진균 활성을 갖는 티에노-피리미딘 화합물은 제WO 2006/047397호에 기재되어 있다. 제초제, 성장-조절 및 살충 활성을 갖는 N-치환된 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물은 제EP-A 0447891호에 기재되어 있다.
- <32> 제EP-A 0447891호에 개시된 상기 화합물과 비교하여, 본 발명의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물은 놀랍게도 우수한 살충 활성을 나타낸다. 특히, 본 발명의 화합물은 아미노기의 질소에 부착된 파라치환된 6원 시클릭 고리를 갖는다.
- <33> 화학식 I의 화합물, 및 그의 농업상 또는 수의학상 허용되는 염은 동물 해충, 즉 유해한 절지동물류 및 선충류에 대해, 특히 방제가 곤란한 곤충류 및 진드기류에 대해 매우 활성이다.
- <34> 또한, 화학식 I의 화합물의 염은 바람직하게는 농업상 또는 수의학상 허용되는 염이다. 상기 염은 통상적인 방법으로, 예를 들어 화학식 I의 화합물이 염기성 관능성인 경우 상기 화합물을 해당 음이온의 산과 반응시킴으로써, 또는 화학식 I의 산성 화합물을 적합한 염기와 반응시킴으로써 형성될 수 있다.
- <35> 유용한 염은 특히 상기 양이온의 염, 또는 상기 산의 산 부가 염이며, 그의 양이온 및 음이온 각각은 본 발명에 따른 화합물의 작용에 대해 임의의 유해한 효과를 갖지 않는다. 적합한 양이온은 특히 알칼리 금속, 바람직하게는 리튬, 나트륨 및 칼륨의 이온, 알칼린 토금속, 바람직하게는 칼슘, 마그네슘 및 바륨의 이온, 및 전이 금속, 바람직하게는 망간, 구리, 아연 및 철의 이온, 및 또한 암모늄 (NH₄⁺), 및 1개 내지 4개의 수소 원자가 C₁-C₄-알킬, C₁-C₄-히드록시알킬, C₁-C₄-알콕시, C₁-C₄-알콕시-C₁-C₄-알킬, 히드록시-C₁-C₄-알콕시-C₁-C₄-알킬, 페닐 또는 벤질에 의해 대체된 치환된 암모늄 이온의 예는 메틸암모늄, 이소프로필암모늄, 디메틸암모늄, 디이소프로필암모늄, 트리메틸암모늄, 테트라메틸암모늄, 테트라에틸암모늄, 테트라부틸암모늄, 2-히드록시에틸암모늄, 2-(2-히드록시에톡시)에틸-암모늄, 비스(2-히드록시에틸)암모늄, 벤질트리메틸암모늄 및 벤질트리에틸암모늄, 또한 포스포늄 이온, 술포늄 이온, 바람직하게는 트리(C₁-C₄-알킬)술포늄, 및 술포소늄 이온, 바람직하게는 트리(C₁-C₄-알킬)술포소늄을 포함한다.
- <36> 유용한 산 부가 염의 음이온은 주로 클로라이드, 브로마이드, 플루오라이드, 수소 술페이트, 술페이트, 이수소 포스페이트, 수소 포스페이트, 포스페이트, 니트레이트, 수소 카르보네이트, 카르보네이트, 핵사플루오로실리케이트, 핵사플루오로포스페이트, 벤조에이트, 및 C₁-C₄-알칸산의 음이온, 바람직하게는 포르메이트, 아세테이트, 프로피오네이트 및 부티레이트이다. 이는 화학식 I의 화합물을 상응하는 음이온의 산, 바람직하게는 염산, 브롬화수소산, 황산, 인산 또는 질산과 반응시킴으로써 형성될 수 있다.
- <37> 변수의 상기 정의에 언급된 유기 잔기는 용어 할로겐과 같이 개별적인 군 구성원의 개별적인 열거를 위한 집합적인 용어이다. 접두사 C_n-C_m은 각 경우에서 기내의 가능한 탄소 원자수를 나타낸다.
- <38> "할로겐"은 플루오로, 클로로, 브로모 및 요오도를 의미하는 것으로 해석될 것이다.
- <39> 용어 "부분적으로 또는 완전히 할로겐화됨"은 주어진 라디칼의 1개 이상, 예를 들어 1, 2, 3, 4 또는 5개 또는 모든 수소 원자가 할로겐 원자에 의해, 특히 불소 또는 염소에 의해 대체된 것을 의미하는 것으로 해석될 것이다.
- <40> 본원에서 사용되는 용어 "C_n-C_m-알킬" (및 또한 C_n-C_m-알킬아미노, 디-C_n-C_m-알킬아미노, C_n-C_m-알킬아미노카르보닐, 디-(C_n-C_m-알킬아미노)카르보닐, C_n-C_m-알킬티오, C_n-C_m-알킬술피닐 및 C_n-C_m-알킬술포닐에서)은 n 내지 m개,

예를 들어 1 내지 10개의 탄소 원자, 바람직하게는 1 내지 6개의 탄소 원자를 갖는 분지된 또는 비분지된 포화된 탄화수소기, 예를 들어 메틸, 에틸, 프로필, 1-메틸에틸, 부틸, 1-메틸프로필, 2-메틸프로필, 1,1-디메틸에틸, 펜틸, 1-메틸부틸, 2-메틸부틸, 3-메틸부틸, 2,2-디메틸프로필, 1-에틸프로필, 헥실, 1,1-디메틸프로필, 1,2-디메틸프로필, 1-메틸펜틸, 2-메틸펜틸, 3-메틸펜틸, 4-메틸펜틸, 1,1-디메틸부틸, 1,2-디메틸부틸, 1,3-디메틸부틸, 2,2-디메틸부틸, 2,3-디메틸부틸, 3,3-디메틸부틸, 1-에틸부틸, 2-에틸부틸, 1,1,2-트리메틸프로필, 1,2,2-트리메틸프로필, 1-에틸-1-메틸프로필, 1-에틸-2-메틸프로필, 헵틸, 옥틸, 2-에틸헥실, 노닐 및 데실, 및 그의 이성질체를 지칭한다. C₁-C₄-알킬은 예를 들어 메틸, 에틸, 프로필, 1-메틸에틸, 부틸, 1-메틸프로필, 2-메틸프로필 또는 1,1-디메틸에틸을 의미한다.

<41> 본원에서 사용되는 용어 "C_n-C_m-할로알킬" (및 또한 C_n-C_m-할로알킬술페닐 및 C_n-C_m-할로알킬술포닐에서)은 n 내지 m개의 탄소 원자, 예를 들어 1 내지 10개, 특히 1 내지 6개의 탄소 원자를 갖는 직쇄 또는 분지된 알킬기 (상기 언급된 바와 같음) (여기서 이들 기 중 몇몇 또는 모든 수소 원자는 상기 언급된 바와 같은 할로겐 원자에 의해 대체될 수 있음), 예를 들어 C₁-C₄-할로알킬, 예컨대 클로로메틸, 브로모메틸, 디클로로메틸, 트리클로로메틸, 플루오로메틸, 디플루오로메틸, 트리플루오로메틸, 클로로플루오로메틸, 디클로로플루오로메틸, 클로로디플루오로메틸, 1-클로로에틸, 1-브로모에틸, 1-플루오로에틸, 2-플루오로에틸, 2,2-디플루오로에틸, 2,2,2-트리플루오로에틸, 2-클로로-2-플루오로에틸, 2-클로로-2,2-디플루오로에틸, 2,2-디클로로-2-플루오로에틸, 2,2,2-트리클로로에틸, 펜타플루오로에틸 등을 지칭한다. 용어 C₁-C₁₀-할로알킬은 특히 1, 2, 3, 4 또는 5개의 수소 원자가 불소 원자에 의해 치환된 C₁-C₂-플루오로알킬 (메틸 또는 에틸과 동의어임), 예컨대 플루오로메틸, 디플루오로메틸, 트리플루오로메틸, 1-플루오로에틸, 2-플루오로에틸, 2,2-디플루오로에틸, 2,2,2-트리플루오로에틸 및 펜타플루오로메틸을 포함한다.

<42> 유사하게, "C_n-C_m-알콕시" 및 "C_n-C_m-알킬티오" (또는 각각 C_n-C_m-알킬술페닐)는 알킬기의 임의의 결합에서 산소 또는 황 연결을 통해 각각 결합된, n 내지 m개의 탄소 원자, 예를 들어 1 내지 10개, 특히 1 내지 6개, 또는 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 직쇄 또는 분지된 알킬기 (상기 언급된 바와 같음)를 지칭한다. 예로는 C₁-C₄-알콕시, 예컨대 메톡시, 에톡시, 프로톡시, 이소프로톡시, 부톡시, sec-부톡시, 이소부톡시 및 tert-부톡시, 추가로 C₁-C₄-알킬티오, 예컨대 메틸티오, 에틸티오, 프로필티오, 이소프로필티오 및 n-부틸티오가 포함된다.

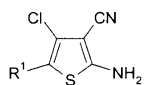
<43> 따라서, 용어 "C_n-C_m-할로알콕시" 및 "C_n-C_m-할로알킬티오" (또는 각각 C_n-C_m-할로알킬술페닐)는 알킬기의 임의의 결합에서 산소 또는 황 연결을 통해 각각 결합된, n 내지 m개의 탄소 원자, 예를 들어 1 내지 10개, 특히 1 내지 6개, 또는 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 직쇄 또는 분지된 알킬기 (상기 언급된 바와 같음) (여기서, 이들 기 중 몇몇 또는 모든 수소 원자는 상기 언급된 바와 같은 할로겐 원자에 의해 대체될 수 있음), 예를 들어 C₁-C₂-할로알콕시, 예컨대 클로로메톡시, 브로모메톡시, 디클로로메톡시, 트리클로로메톡시, 플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 클로로플루오로메톡시, 디클로로플루오로메톡시, 클로로디플루오로메톡시, 1-클로로에톡시, 1-브로모에톡시, 1-플루오로에톡시, 2-플루오로에톡시, 2,2-디플루오로에톡시, 2,2,2-트리플루오로에톡시, 2-클로로-2-플루오로에톡시, 2-클로로-2,2-디플루오로에톡시, 2,2-디클로로-2-플루오로에톡시, 2,2,2-트리클로로에톡시 및 펜타플루오로에톡시, 추가로 C₁-C₂-할로알킬티오, 예컨대 클로로메틸티오, 브로모메틸티오, 디클로로메틸티오, 트리클로로메틸티오, 플루오로메틸티오, 디플루오로메틸티오, 트리플루오로메틸티오, 클로로플루오로메틸티오, 디클로로플루오로메틸티오, 클로로디플루오로메틸티오, 1-클로로에틸티오, 1-브로모에틸티오, 1-플루오로에틸티오, 2-플루오로에틸티오, 2,2-디플루오로에틸티오, 2,2,2-트리플루오로에틸티오, 2-클로로-2-플루오로에틸티오, 2-클로로-2,2-디플루오로에틸티오, 2,2-디클로로-2-플루오로에틸티오, 2,2,2-트리클로로에틸티오 및 펜타플루오로에틸티오 등을 지칭한다. 유사하게, 용어 C₁-C₂-플루오로알콕시 및 C₁-C₂-플루오로알킬티오는 산소 원자 또는 황 원자를 통해 각각 분자의 나머지에 결합된 C₁-C₂-플루오로알킬을 지칭한다.

<44> 본원에서 사용되는 용어 "C₂-C_m-알케닐"은 2 내지 m개, 예를 들어 2 내지 10개, 또는 2 내지 6개의 탄소 원자 및 임의의 위치에서 이중 결합을 갖는 분지된 또는 비분지된 불포화된 탄화수소기, 예컨대 에테닐, 1-프로페닐, 2-프로페닐, 1-메틸-에테닐, 1-부테닐, 2-부테닐, 3-부테닐, 1-메틸-1-프로페닐, 2-메틸-1-프로페닐, 1-메틸-2-프로페닐, 2-메틸-2-프로페닐, 1-펜테닐, 2-펜테닐, 3-펜테닐, 4-펜테닐, 1-메틸-1-부테닐, 2-메틸-1-부테닐, 3-메틸-1-부테닐, 1-메틸-2-부테닐, 2-메틸-2-부테닐, 3-메틸-2-부테닐, 1-메틸-3-부테닐, 2-메틸-3-부테닐, 3-메

틸-3-부테닐, 1,1-디메틸-2-프로페닐, 1,2-디메틸-1-프로페닐, 1,2-디메틸-2-프로페닐, 1-에틸-1-프로페닐, 1-에틸-2-프로페닐, 1-헥세닐, 2-헥세닐, 3-헥세닐, 4-헥세닐, 5-헥세닐, 1-메틸-1-펜테닐, 2-메틸-1-펜테닐, 3-메틸-1-펜테닐, 4-메틸-1-펜테닐, 1-메틸-2-펜테닐, 2-메틸-2-펜테닐, 3-메틸-2-펜테닐, 4-메틸-2-펜테닐, 1-메틸-3-펜테닐, 2-메틸-3-펜테닐, 3-메틸-3-펜테닐, 4-메틸-3-펜테닐, 1-메틸-4-펜테닐, 2-메틸-4-펜테닐, 3-메틸-4-펜테닐, 4-메틸-4-펜테닐, 1,1-디메틸-2-부테닐, 1,1-디메틸-3-부테닐, 1,2-디메틸-1-부테닐, 1,2-디메틸-2-부테닐, 1,2-디메틸-3-부테닐, 1,3-디메틸-1-부테닐, 1,3-디메틸-2-부테닐, 1,3-디메틸-3-부테닐, 2,2-디메틸-3-부테닐, 2,3-디메틸-1-부테닐, 2,3-디메틸-2-부테닐, 2,3-디메틸-3-부테닐, 3,3-디메틸-1-부테닐, 3,3-디메틸-2-부테닐, 1-에틸-1-부테닐, 1-에틸-2-부테닐, 1-에틸-3-부테닐, 2-에틸-1-부테닐, 2-에틸-2-부테닐, 2-에틸-3-부테닐, 1,1,2-트리메틸-2-프로페닐, 1-에틸-1-메틸-2-프로페닐, 1-에틸-2-메틸-1-프로페닐 및 1-에틸-2-메틸-2-프로페닐을 나타낸다.

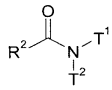
- <45> 본원에서 사용되는 용어 " C_2-C_m -알킬닐"은 2 내지 m개, 예를 들어 2 내지 10개, 또는 2 내지 6개의 탄소 원자를 갖고 하나 이상의 삼중 결합을 함유하는 분지된 또는 비분지된 불포화된 탄화수소기, 예컨대 에틸닐, 프로피닐, 1-부티닐, 2-부티닐 등을 지칭한다.
- <46> 본원에서 사용되는 용어 C_1-C_6 -알콕시- C_1-C_6 -알킬은 알킬 라디칼의 하나 이상의 수소 원자(들)가 C_1-C_6 -알콕시기에 의해 대체된, 1 내지 6개의 탄소 원자를 갖는 알킬 (예를 들어, 상기 언급된 특정 예와 같음)을 지칭한다.
- <47> 본 발명에 따른 상이한 사용 방법에 관하여, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물의 치환체 및 변수가 각 경우에 그 자체 또는 조합으로 하기 의미를 갖는 경우 특히 바람직하다:
- <48> A가 A1인 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물이 바람직하다.
- <49> A가 A2인 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물이 바람직하다.
- <50> A가 A2이고 S-거울상이성질체를 나타내는 제1항의 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물이 특히 바람직하다.
- <51> A가 A3인 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물이 바람직하다.
- <52> R^1 및 R^2 가 서로 독립적으로 수소 또는 C_1-C_6 -알킬에서 선택된 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물이 바람직하다.
- <53> R^5 또는 R^7 이 수소인 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물이 바람직하다.
- <54> R^{10} 이 분지된 C_3-C_{10} -알킬인 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물이 바람직하다.
- <55> R^{10} 이 이소-프로필, sec-부틸 또는 tert-부틸인 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물이 특히 바람직하다.
- <56> 제조 방법
- <57> 본 발명에 따른 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]-피리미딘 화합물은 제EP 0447 891 B호에 기재된 바와 같이 티오펜 화합물 (II)로부터 출발하여 제조될 수 있다.
- <58> 하기 화학식 II의 티오펜 유도체는 하기 화학식 Ia의 티에노-(2,3-d)-피리미딘 유도체를 제공하기 위해, 과량의 포스포릴 할로겐화물 (예를 들어, 화합물 (II) 1 mol에 비해 포스포릴 클로라이드 또는 포스포릴 브로마이드 2 내지 20 mol)의 존재하에 디알킬 아마이드 (III)와 반응된다.

화학식 II



- <59>
- <60> 상기 식에서, R^1 은 상기 정의된 바와 같다.

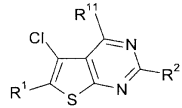
화학식 III



<61>

<62> 상기 식에서, T¹ 및 T²는 서로 독립적으로 C₁-C₄-알킬이거나, 또는 질소와 함께 5원 내지 7원 포화된 헤테로사이클을 형성하고, R²는 상기 정의된 바와 같다.

화학식 Ia



<63>

<64> 상기 식에서, R¹¹은 클로로 또는 브로모이다.

<65> 상기 기재된 바와 같이 수득된 화학식 Ia의 화합물은 문헌 ['The Chemistry of Heterocyclic compounds', "The pyrimidines", ed. D.J. Brown, J. Wiley & Sony, New York, London, Vol. 16, (1962); Vol. 16, Suppl. 1, Vol. 16, Suppl. 2 (1985)]에 기재된 바와 같은 공지된 방법에 따라 다른 친핵성 부분에 의한 위치 4에서 할로겐 원자의 치환에 의해 전환될 수 있다.

<66> 이는 제EP-A 447 891호에 기재된 바와 같이 NR³A에 의한 R¹¹의 치환에 의해 상응하는 화학식 I의 화합물로 전환된다.

<67> 적합한 디알킬-아미드 (III)의 예는 N,N-디메틸-포름아미드, N,N-디메틸-아세트아미드, N,N-디에틸-포름아미드, N,N-디에틸-아세트아미드, N,N-디메틸-프로피온아미드 및 N,N-디메틸 벤조산 아미드이다.

<68> 상기 언급된 바와 같이, 반응은 티오펜 유도체 (II)에 비해 과량의 포스포릴 클로라이드 또는 포스포릴 브로마이드의 존재하에 수행되어야 한다. 유리하게, 반응은 용매로서 포스포릴 할로겐화물로 실시될 수 있다. 바람직하게는, 티오펜 유도체 (II) mol 당 포스포릴 할로겐화물 2 내지 6 mol이 사용된다.

<69> 일반적으로, 티오펜 유도체 (II) 대 N,N-디알킬 아미드 (III)의 몰 비율은 1:1 내지 1:5이다.

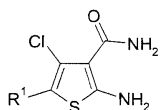
<70> 반응은 통상적으로 불활성 용매, 예를 들어 클로로벤젠, 니트로벤젠, 벤조산 메틸 에스테르, 메틸렌 클로라이드, 디클로로벤젠, 트리클로로벤젠, 벤조산 에틸 에스테르, 클로로포름, 사염화탄소, 상기 나열된 N,N-디알킬 아미드 중 하나, 트리클로로에탄, 헥사메틸인산 트리아미드 (HMPT) 또는 테트라클로로에틸렌에서 수행된다. 바람직한 용매는 포스포릴 클로라이드 및 포스포릴 브로마이드 또는 상기 나열된 N,N-디알킬 아미드 중 하나이다.

<71> 반응은 20℃ 초과와 충분한 반응 속도를 갖는다. 150℃ 초과와 온도에서 반응 특이성이 저하된다. 바람직하게는, 반응은 50 내지 110℃ 범위의 온도에서 수행된다.

<72> 루이스 산, 예컨대 염화칼륨, 염화나트륨, 염화철 (III), 염화알루미늄, 염화아연, 염화주석, 오불화안티몬, 삼불화붕소 또는 사염화티타늄, 또는 염기성 촉매, 예컨대 N,N-디메틸 아닐린 또는 N,N-디에틸 아닐린의 촉매량의 사용에 의해 수율의 증가 및 반응 속도의 향상이 성취될 수 있다.

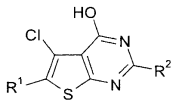
<73> 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]피리미딘 화합물의 다른 제조 방법은 통상적인 관행에 따라 하기 화학식 IV의 화합물을, 적어도 R²-CO- 잔기를 함유하는 산 무수물, 또는 카르복실산 R²-COOH, 또는 카르복실산 및 루이스 산의 부가물과 반응시킴으로써 화학식 Ib의 화합물로 제조된다.

화학식 IV



<74>

화학식 Ib



<75>

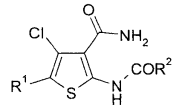
<76>

상기 식들에서, R¹ 및 R²는 각각 상기 정의된 바와 같다.

<77>

화학식 Ib의 화합물은 포스포릴 할로젠화물에 의해 상기 정의된 바와 같은 화학식 Ia의 화합물로 전환된다. 상기 전환을 2단계로 전환시키는 것이 특정 경우에 적합하며, 이에 의해 화학식 VI의 중간체 화합물을 단리한다.

화학식 VI



<78>

<79>

일반적으로, 산 무수물 또는 부가물은 화합물 (VI)에 대해 100 내지 500 몰%, 바람직하게는 100 내지 300 몰%의 양으로 사용된다.

<80>

하나 이상의 R²-CO- 잔기를 함유하는 카르복실산 무수물은 피발산, 프로피온산 또는 아세트산으로서 2개의 카르복실산 R²-COOH으로부터; 또는 인산 또는 황산으로서 하나의 옥소산과 하나의 카르복실산 R²-COOH으로부터 제공될 수 있다.

<81>

바람직한 카르복실산 R²-COOH는 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 산, 특히 포름산 및 아세트산이다.

<82>

추가로, 루이스 산, 예컨대 염화아연, 삼불화붕소 및 사염화티타늄, 및 카르복실산 R²-COOH의 부가물이 또한 적합하다.

<83>

화합물 (IV)의 화합물 (Ib)로의 전환은 유리하게는 불활성 용매, 예컨대 N,N-디알킬 아미드, 바람직하게는 N,N-디메틸 포름아미드 및 N,N-디메틸 아세트아미드, N-메틸-피롤리돈, N,N-디메틸 프로필렌 우레아 또는 헥사메틸 인산 트리아미드에서, (-10) 내지 150°C, 바람직하게는 20 내지 120°C, 보다 바람직하게는 80 내지 120°C의 온도에서 수행된다.

<84>

중간체 화합물 (VI)을 단리하기 위해, 반응 온도는 (-10) 내지 80°C에서 선택되어야 한다.

<85>

일반적으로, 염기, 예컨대 트리에틸아민, N-메틸-피롤리돈 또는 N,N-디메틸 아닐린은 카르복실산 무수물, 카르복실산 또는 카르복실산-루이스산-부가물에 비해 1 내지 10배 과량으로, 바람직하게는 1 내지 5배 과량으로 첨가되어야 한다.

<86>

물 제거제, 예컨대 디시클로헥실 카르보이미드 또는 빌스마이어(vilsmeier) 시약의 첨가는 반응 속도를 증가시키고, 화학식 Ib의 화합물의 수율을 증가시킬 수 있다.

<87>

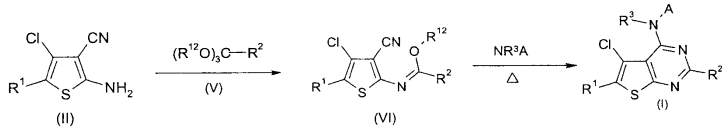
화학식 Ib의 화합물의 위치 4의 히드록시기는 통상적인 관행에 따라 클로로 또는 브로모에 의해, 예를 들어 포스포릴 클로라이드 또는 포스포릴 브로마이드로 치환될 수 있다.

<88>

최종적으로, 위치 4의 클로로 및 브로모는 예를 들어 제EP-A 447 891호에 기재된 바와 같이 NR³A에 의해 치환된다.

<89>

또한, 오르토에스테르 (V) (여기서, R¹²는 C₁-C₄-알킬임)에 의한 화학식 II의 티오펜 화합물의 화학식 VI의 유도체의 전환, 및 아민 NR³A의 존재하 후속적인 고리화에 의해, 본 발명에 따른 화학식 I의 티에노[2,3-d]피리미딘 화합물이 수득될 수 있다.



<90>

<91>

맨 뒤에 기재된 반응식은 제DE-A 26 54 090호로부터 공지되어 있다. 티오펜 유도체 (II) 및 (IV)는 제EP-A1 0193 885호에 개시된 지시사항에 따라 수득될 수 있다.

<92>

농업 또는 수의학 용도에 적합한 염의 수득을 위해, 화학식 I의 4-아미노-5-클로로-티에노[2,3-d]피리미딘 화합물은 통상적인 염 형성제, 예컨대 염산, 브롬화수소산, 요오드화수소산, 황산, 인산, 포름산, 아세트산, 옥살산, 벤젠 술폰산, p-톨루올-술폰산, 도데실벤젠 술폰산, 메틸 브로마이드, 디메틸 술페이트 또는 디에틸 술페이트와 0 내지 150°C, 바람직하게는 20 내지 120 °C 범위의 온도에서 반응될 수 있다.

<93>

염의 형성은 통상적으로 용해제 또는 희석제에서 수행된다. 예를 들어 지방족 탄화수소, 예컨대 n-헥산 또는 페트롤 에테르, 방향족 탄화수소, 예컨대 벤졸, 톨루올 또는 크실롤, 벤진 또는 에테르, 예컨대 디에틸 에테르, 메틸-tert-부틸 에테르, 테트라히드로푸란 또는 디옥산, 추가로 케톤, 예컨대 아세톤, 메틸-에틸-케톤 또는 메틸-이소프로필-케톤, 뿐만 아니라 할로겐화된 탄화수소, 예컨대 클로로벤졸, 메틸렌 클로라이드, 에틸렌 클로라이드, 클로로포름 또는 테트라클로르 에틸렌이 적합하다. 상기 용매의 혼합물이 또한 사용될 수 있다.

<94>

화학식 I의 화합물의 염의 제조를 위해, 유리체는 통상적으로 화학양론적 비율로 사용된다. 과량의 한 성분 또는 다른 성분이 유용할 수 있다.

<95>

기재된 제조 방법에서, 변수 R¹, R² 및 R³은 상기 정의된 바와 같은 의미를 가지며, 특히 언급된 의미가 바람직하다.

<96>

개별 화합물이 상기 기재된 경로를 통해 제조될 수 없는 경우, 이는 다른 화합물 I의 유도체화에 의해 또는 기재된 합성 경로의 통상적인 변형에 의해 제조될 수 있다.

<97>

반응 혼합물은 통상적인 방법으로, 예를 들어 물과 혼합시키고, 상들을 분리하고, 적절한 경우, 크로마토그래피, 예를 들어 알루미늄이나 또는 실리카 겔 상의 크로마토그래피에 의해 조 생성물을 정제함으로써 마무리 처리된다. 몇몇 중간체 및 최종 생성물은 무색 또는 옅은 갈색 점성 오일의 형태로 수득될 수 있으며, 이는 감압하에 중간의 승온에서 휘발성 성분으로부터 분리되거나 또는 정제된다. 중간체 및 최종 생성물이 고체로서 수득되는 경우, 이는 재결정화 또는 분해에 의해 정제될 수 있다.

<98>

적용

<99>

화학식 I의 화합물 및 그의 염은 절지동물류 해충, 예컨대 거미류, 다족류 및 곤충류 뿐만 아니라 선충류를 효율적으로 방제하는데 특히 적합하다.

<100>

특히, 이는 하기로부터의 곤충류와 같은 곤충류 해충의 방제에 적합하다:

<101>

인시목 (레피도테라(Lepidoptera)) 곤충, 예를 들어 아그로티스 입실론(Agrotis ypsilon), 아그로티스 세게툼(Agrotis segetum), 알라바마 아르길라세아(Alabama argillacea), 안티카르시아 겐마탈리스(Anticarsia gemmatalis), 아르기레스티아 콘쥬겔라(Argyresthia conjugella), 아우토그라파 감마(Autographa gamma), 부팔루스 피니아리우스(Bupalus piniarius), 카코에시아 무리나나(Cacoecia murinana), 카푸아 레티쿨라나(Capua reticulana), 케이마토비아 브루마타(Cheimatobia brumata), 코리스토뉴라 푸미페라나(Choristoneura fumiferana), 코리스토뉴라 옥기덴탈리스(Choristoneura occidentalis), 시르피스 유니푼크타(Cirphis unipuncta), 시디아 포모넬라(Cydia pomonella), 덴드롤리무스 피니(Dendrolimus pini), 디아파니아 니티달리스(Diaphania nitidalis), 디아트라에아 그란디오셀라(Diatraea grandiosella), 에아리아스 인술라나(Earias insulana), 엘라스모팔푸스 리그노셀루스(Elasmopalpus lignosellus), 유포에실리아 암비구엘라(Eupoecilia ambiguella), 에베트리아 불리아나(Evetria bouliana), 펠티아 서브테라네아(Feltia subterranea), 갈레리아 멜로넬라(Galleria mellonella), 그라폴리타 푸네브라나(Grapholitha funebrana), 그라폴리타 몰레스타(Grapholitha molesta), 헬리오티스 아르미게라(Heliothis armigera), 헬리오티스 비레센스(Heliothis virescens), 헬리오티스 제아(Heliothis zea), 헬룰라 운달리스(Hellula undalis), 히베르니아 데폴리아리아(Hibernia defoliaria), 히판트리아 쿠네아(Hyphantria cunea), 히포노메우타 말리넬루스(Hyponomeuta malinellus), 케이페리아 리코페르시셀라(Keiferia lycopersicella), 람디나 피셀라리아(Lambdaia fiscellaria), 라피그마 엑시구아(Laphygma exigua), 류콕테라 코페엘라(Leucoptera coffeella), 류콕테라 시

텔라(*Leucoptera scitella*), 리토콜레티스 블란카르텔라(*Lithocolletis blancardella*), 로베시아 보트라나(*Lobesia botrana*), 록소스테게 스틱티칼리스(*Loxostege sticticalis*), 리만트리아 디스파르(*Lymantria dispar*), 리만트리아 모나카(*Lymantria monacha*), 리오네티아 클레르켈라(*Lyonetia clerkella*), 말라코소마 뉴스트리아(*Malacosoma neustria*), 마메스트라 브라시카에(*Mamestra brassicae*), 오르기이아 슈도츄가타(*Orgyia pseudotsugata*), 오스트리니아 누빌라리스(*Ostrinia nubilalis*), 파놀리스 플라메아(*Panolis flammea*), 펙티노포라 고시피엘라(*Pectinophora gossypiella*), 페리드로마 사우시아(*Peridroma saucia*), 팔레라 부케팔라(*Phalera bucephala*), 프토리마에아 오페르쿨렐라(*Phthorimaea operculella*), 필록니스티스 시트렐라(*Phyllocnistis citrella*), 피에리스 브라시카에(*Pieris brassicae*), 플라티페나 스카브라(*Plathypena scabra*), 플루텔라 크실로스텔라(*Plutella xylostella*), 슈도플루시아 인클루덴스(*Pseudoplusia includens*), 리아시오니아 프루스트라나(*Rhyacionia frustrana*), 스크로비팔풀라 압솔루타(*Scrobipalpus absoluta*), 시토티로가 세레알렐라(*Sitotroga cerealella*), 스파르가노티스 필레리아나(*Sparganothis pilleriana*), 스포돔테라 에리다니아(*Spodoptera eridania*), 스포돔테라 프루기페르다(*Spodoptera frugiperda*), 스포돔테라 리토랄리스(*Spodoptera littoralis*), 스포돔테라 리투라(*Spodoptera litura*), 타우마토포에아 피티오캄파(*Thaumtopoea pityocampa*), 토르트릭스 비리다나(*Tortrix viridana*), 트리코플루시아 니(*Trichoplusia ni*) 및 제이라페라 카나덴시스(*Zeiraphera canadensis*);

<102>

딱정벌레목 (콜레옵테라(*Coleoptera*)) 곤충, 예를 들어 아그릴루스 시누아투스(*Agrilus sinuatus*), 아그리오테스 리네아투스(*Agriotes lineatus*), 아그리오테스 옵스쿠루스(*Agriotes obscurus*), 암피말루스 솔스티티알리스(*Amphimallus solstitialis*), 아니산드루스 디스파르(*Anisandrus dispar*), 안토노무스 그란디스(*Anthonomus grandis*), 안토노무스 포모룸(*Anthonomus pomorum*), 아토마리아 리네아리스(*Atomaria linearis*), 블라스토파구스 피니페르다(*Blastophagus piniperda*), 블리토파가 운다타(*Blitophaga undata*), 브루쿠스 루피마누스(*Bruchus rufimanus*), 브루쿠스 피소룸(*Bruchus pisorum*), 브루쿠스 렌티스(*Bruchus lentis*), 빅티스쿠스 베틀라에(*Byctiscus betulae*), 카시다 네블로사(*Cassida nebulosa*), 세로토마 트리푸르카타(*Ceratomya trifurcata*), 슈토린쿠스 아시밀리스(*Ceuthorrhynchus assimilis*), 슈토린쿠스 나피(*Ceuthorrhynchus napi*), 카에톡네마 티비알리스(*Chaetocnema tibialis*), 코노데루스 베스페르티누스(*Conoderus vespertinus*), 크리오세리스 아스파라기(*Crioceris asparagi*), 디아브로티카 롱기코르니스(*Diabrotica longicornis*), 디아브로티카 12-푼크타타(*Diabrotica 12-punctata*), 디아브로티카 비르기페라(*Diabrotica virgifera*), 에필라크나 바리베스티스(*Epilachna varivestis*), 에피트릭스 히르티페니스(*Epitrix hirtipennis*), 유티노보트루스 브라실리엔시스(*Eutinobothrus brasiliensis*), 히로비우스 아비에티스(*Hylobius abietis*), 히페라 브루네이페니스(*Hypera brunneipennis*), 히페라 포스티카(*Hypera postica*), 입스 티포그라푸스(*Ips typographus*), 레마 빌리네아타(*Lema bilineata*), 레마 멜라노푸스(*Lema melanopus*), 렙티노타르사 데셀리네아타(*Leptinotarsa decemlineata*), 리모니우스 칼리포니쿠스(*Limonius californicus*), 리소롭트루스 오리조필루스(*Lissorhoptrus oryzophilus*), 멜라노투스 코무니스(*Melanotus communis*), 멜리게테스 아에네우스(*Meligethes aeneus*), 멜로론타 히포카스타니(*Melolontha hippocastani*), 멜로론타 멜로론타(*Melolontha melolontha*), 오울레마 오리자에(*Oulema oryzae*), 오르티오린쿠스 술카투스(*Ortiorrhynchus sulcatus*), 오티오린쿠스 오바투스(*Otiorrhynchus ovatus*), 파에돈 코클레아리아에(*Phaedon cochleariae*), 필로트레타 크리소세팔라(*Phyllotreta chrysocephala*), 필로파가(*Phyllophaga*) 종, 필로페르타 호르티콜라(*Phyllopertha horticola*), 필로트레타 네모룸(*Phyllotreta nemorum*), 필로트레타 스트리올라타(*Phyllotreta striolata*), 포필리아 자포니카(*Popillia japonica*), 시토나 리네아투스(*Sitona lineatus*) 및 시토피루스 그라나리아(*Sitophilus granaria*);

<103>

쌍시목 (딧테라(*Diptera*)) 곤충, 예를 들어 아에데스 아에깃티(*Aedes aegypti*), 아에데스 벅산스(*Aedes vexans*), 아나스트레파 루덴스(*Anastrepha ludens*), 아노펠레스 마쿨리페니스(*Anopheles maculipennis*), 세라티티스 카피타타(*Ceratitis capitata*), 크리소미아 베찌아나(*Chrysomya bezziana*), 크리소미아 호미니보락스(*Chrysomya hominivorax*), 크리소미아 마셀라리아(*Chrysomya macellaria*), 콘타리니아 소르기콜라(*Contarinia sorghicola*), 코르딜로비아 안트로포파가(*Cordylobia anthropophaga*), 컬렉스 피피엔스(*Culex pipiens*), 다쿠스 쿠쿠르비타에(*Dacus cucurbitae*), 다쿠스 올레아에(*Dacus oleae*), 다시뉴라 브라시카에(*Dasineura brassicae*), 파니아 카니쿨라리스(*Fannia canicularis*), 가스테로필루스 인테스티날리스(*Gasterophilus intestinalis*), 글로시나 모르시탄스(*Glossina morsitans*), 하에마토비아 이리탄스(*Haematobia irritans*), 하플로디플로시스 에퀘스트리스(*Haplodiplosis equestris*), 힐레미아 플라투라(*Hylemyia platura*), 히포데르마 리네아타(*Hypoderma lineata*), 리리오미자 사티바에(*Liriomyza sativae*), 리리오미자 트리폴리이(*Liriomyza trifolii*), 루실리아 카프리카(*Lucilia caprina*), 루실리아 쿠프리카(*Lucilia cuprina*), 루실리아 세리카타(*Lucilia sericata*), 리코리아 펙토랄리스(*Lycoria pectoralis*), 마에티올라 데스트룩터(*Mayetiola*);

destructor), 무스카 아우툼날리스(*Musca autumnalis*), 무스카 도메스티카(*Musca domestica*), 무시나 스타불란스(*Muscina stabulans*), 오에스트루스 오비스(*Oestrus ovis*), 오시넬라 프리트(*Oscinella frit*), 페고미아 히소시아미(*Pegomya hysocyami*), 포르비아 안티쿠아(*Phorbia antiqua*), 포르비아 브라시카에(*Phorbia brassicae*), 포르비아 코아르크타타(*Phorbia coarctata*), 라골레티스 세라시(*Rhagoletis cerasi*), 라골레티스 포모넬라(*Rhagoletis pomonella*), 타바누스 보비누스(*Tabanus bovinus*), 티풀라 올레라세아(*Tipula oleracea*) 및 티풀라 팔루도사(*Tipula paludosa*);

<104> 총채목 (티사놉테라(*Thysanoptera*)) 곤충, 예를 들어 디크로모트립스(*Dichromothrips*) 중, 프랑클리니엘라 푸스카(*Frankliniella fusca*), 프랑클리니엘라 옥키넨탈리스(*Frankliniella occidentalis*), 프랑클리니엘라 트리티시(*Frankliniella tritici*), 시르토티립스 시트리(*Scirtothrips citri*), 트립스 오리자에(*Thrips oryzae*), 트립스 팔미(*Thrips palmi*) 및 트립스 타바시(*Thrips tabaci*);

<105> 막시목 (히메놉테라(*Hymenoptera*)) 곤충, 예를 들어 아탈리아 로사에(*Athalia rosae*), 아타 세팔로테스(*Atta cephalotes*), 아타 섹덴스(*Atta sexdens*), 아타 텍사나(*Atta texana*), 호플로캄파 미누타(*Hoplocampa minuta*), 호플로캄파 테스트디네아(*Hoplocampa testudinea*), 라시우스 리게르(*Lasius niger*), 모노모리움 파라오니스(*Monomorium pharaonis*), 솔레놉시스 게미나타(*Solenopsis geminata*) 및 솔레놉시스 인빅타(*Solenopsis invicta*);

<106> 노린재목 (헤테로테라(*Heteroptera*)) 곤충, 예를 들어 아크로스테르눔 힐라레(*Acrosternum hilare*), 블리수스 류콕테루스(*Blissus leucopterus*), 시르토펠티스 노트투스(*Cyrtopeltis notatus*), 디스테르쿠스 신굴라투스(*Dysdercus cingulatus*), 디스테르쿠스 인테르메디우스(*Dysdercus intermedius*), 유리가스테르 인테그리셉스(*Eurygaster integriceps*), 유쉬스투스 임픽티벤트리스(*Euschistus impictiventris*), 렙토글로수스 필로푸스(*Leptoglossus phyllopus*), 리구스 리네올라리스(*Lygus lineolaris*), 리구스 프라텐시스(*Lygus pratensis*), 네자라 비리둘라(*Nezara viridula*), 피에스마 쿼드라타(*Piesma quadrata*), 솔루베아 인슐라리스(*Solubea insularis*) 및 티안타 페르디토르(*Thyanta perditor*);

<107> 매미목 (호뎬테라(*Homoptera*)) 곤충 (특히, 진딧물), 예를 들어 아시르토시폰 오노브리키스(*Acyrtosiphon onobrychis*), 아델게스 라리시스(*Adelges laricis*), 아피둘라 나스투르티이(*Aphidula nasturtii*), 아피스 크라시보라(*Aphis craccivora*), 아피스 파바에(*Aphis fabae*), 아피스 포르베시(*Aphis forbesi*), 아피스 포미(*Aphis pomi*), 아피스 고시피이(*Aphis gossypii*), 아피스 그로술라리아에(*Aphis grossulariae*), 아피스 슈네이테리(*Aphis schneideri*), 아피스 스피라에콜라(*Aphis spiraecola*), 아피스 삼부시(*Aphis sambuci*), 아시르토시폰 피숨(*Acyrtosiphon pisum*), 아우라코르툼 솔라니(*Aulacorthum solani*), 베미시아 타바시(*Bemisia tabaci*), 베미시아 아르겐티폴리이(*Bemisia argentifolii*), 브라키카우두스 카르두이(*Brachycaudus cardui*), 브라키카우두스 헬리크리시(*Brachycaudus helichrysi*), 브라키카우두스 페르시카에(*Brachycaudus persicae*), 브라키카우두스 프루니콜라(*Brachycaudus prunicola*), 브레비코리네 브라시카에(*Brevicoryne brassicae*), 카피토포루스 호르니(*Capitophorus horni*), 세로시폰 고시피이(*Cerosiphia gossypii*), 카에토시폰 프라가에폴리이(*Chaetosiphon fragaefolii*), 크립토미주스 리비스(*Cryptomyzus ribis*), 드레이푸시아 노르만니아나에(*Dreyfusia normanniana*), 드레이푸시아 피세아에(*Dreyfusia piceae*), 디사피스 라디콜라(*Dysaphis radicola*), 디사우라코르툼 슈도솔라니(*Dysaulacorthum pseudosolani*), 디사피스 플란타기네아(*Dysaphis plantaginea*), 디사피스 피리(*Dysaphis pyri*), 엠포아스카 파바에(*Empoasca fabae*), 히알로테루스 프루니(*Hyalopterus pruni*), 히페로미주스 락투카에(*Hyperomyzus lactucae*), 마크로시폰 아베나에(*Macrosiphum avenae*), 마크로시폰 유포르비아에(*Macrosiphum euphorbiae*), 마크로시폰 로사에(*Macrosiphon rosae*), 메고우라 비시아에(*Megoura viciae*), 멜라나피스 피라리우스(*Melanaphis pyraeius*), 메토폴로피움 디로둠(*Metopolophium dirhodum*), 미조데스 페르시카에(*Myzodes persicae*), 미주스 아스칼로니쿠스(*Myzus ascalonicus*), 미주스 세라시(*Myzus cerasi*), 미주스 바리안스(*Myzus varians*), 나소노비아 리비스니그리(*Nasonovia ribis-nigri*), 닐라파르바타 루겐스(*Nilaparvata lugens*), 펠피구스 부르사리우스(*Pemphigus bursarius*), 페르킨시엘라 사카리시다(*Perkinsiella saccharicida*), 포로돈 후물리(*Phorodon humuli*), 실라 말리(*Psylla mali*), 실라 피리(*Psylla piri*), 로팔로미주스 아스칼로니쿠스(*Rhopalomyzus ascalonicus*), 로팔로시폰 마이디스(*Rhopalosiphum maidis*), 로팔로시폰 파디(*Rhopalosiphum padi*), 로팔로시폰 인세르툼(*Rhopalosiphum insertum*), 사파피스 말라(*Sappaphis mala*), 사파피스 말리(*Sappaphis mali*), 쉬자피스 그라미눔(*Schizaphis graminum*), 쉬조뉴라 라누기노사(*Schizoneura lanuginosa*), 시토비온 아베나에(*Sitobion avenae*), 트리아레우로데스 바포라리오룸(*Trialeurodes vaporariorum*), 독솅테라 아우란티안드(*Toxoptera aurantiand*) 및 비테우스 비티폴리이(*Viteus vitifolii*);

<108> 흰개미목 (이솅테라(*isoptera*)) 곤충, 예를 들어 칼로테르메스 플라비콜리스(*Calotermes flavicollis*), 류코테

르메스 플라비페스(*Leucotermes flavipes*), 레티쿨리테르메스 그라쎄이(*Reticulitermes grassei*), 레티쿨리테르메스 루시푸구스(*Reticulitermes lucifugus*), 레티쿨리테르메스 산토넨시스(*Reticulitermes santonensis*) 및 테르메스 나탈렌시스(*Termes natalensis*);

<109> 메뚜기목 (오르토펙테라(*Orthoptera*)) 곤충, 예를 들어 아케타 도메스티카(*Acheta domestica*), 블라타 오리엔탈리스(블라타 오리엔탈리스), 블라텔라 게르마니카(*Blattella germanica*), 포르피콜라 아우리콜라리아(*Forficula auricularia*), 그릴로탈파 그릴로탈파(*Grylotalpa grylotalpa*), 로쿠스타 미그라토리아(*Locusta migratoria*), 멜라노플루스 비비타투스(*Melanoplus bivittatus*), 멜라노플루스 페무-루브룸(*Melanoplus femur-rubrum*), 멜라노플루스 멕시카누스(*Melanoplus mexicanus*), 멜라노플루스 산구이니페스(*Melanoplus sanguinipes*), 멜라노플루스 스프레투스(*Melanoplus spretus*), 노마다크리스 셉템파시아타(*Nomadacris septemfasciata*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 쉬스토세르카 아메리카나(*Schistocerca americana*), 쉬스토세르카 페레그리나(*Schistocerca peregrina*), 스타우로노투스 마로카누스(*Stauronotus maroccanus*) 및 타키시네스 아시나모루스(*Tachycines asynamorus*); 및

<110> 툽토기류 (콜렘볼라(*Collembola*)) 곤충, 예를 들어 오니키우루스(*Onychiurus*) 종.

<111> 화학식 I의 화합물 및 그의 염은 선충류, 식물 기생 선충류, 예컨대 당근혹 선충류, 멜로이도진 하플라(*Meloidogyne hapla*), 멜로이도진 인코그니타(*Meloidogyne incognita*), 멜로이도진 자바니카(*Meloidogyne javanica*), 및 기타 멜로이도진(*Meloidogyne*) 종; 포자형성 선충류, 글로보데라 로스토키엔시스(*Globodera rostochiensis*) 및 기타 글로보데라(*Globodera*) 종; 헤테로데라 아베나에(*Heterodera avenae*), 헤테로데라 글리시네스(*Heterodera glycines*), 헤테로데라 스차치티이(*Heterodera schachtii*), 헤테로데라 트리폴리이(*Heterodera trifolii*) 및 기타 헤테로데라(*Heterodera*) 종; 밀알선충류, 안구이나(*Anguina*) 종; 줄기 및 잎 선충류, 아펠렌초이데스(*Aphelenchoides*) 종; 침선충류, 벨로놀라이무스 롱기카우다투스(*Belonolaimus longicaudatus*) 및 기타 벨로놀라이무스(*Belonolaimus*) 종; 파인(Pine)선충류, 부르사펠렌투스 크실로필루스(*Bursaphelenchus xylophilus*) 및 기타 부르사펠렌투스(*Bursaphelenchus*) 종; 고리선충류, 크리코네마(*Criconema*) 종, 크리코네멜라(*Criconemella*) 종, 크리코네모이데스(*Criconemoides*) 종, 메소크리코네마(*Mesocriconema*) 종; 줄기 및 구근 선충류, 디틸렌투스 데스트루크토르(*Ditylenchus destructor*), 디틸렌투스 디프사시(*Ditylenchus dipsaci*) 및 기타 디틸렌투스(*Ditylenchus*) 종; 송곳선충류, 돌리초도루스(*Dolichodorus*) 종; 나선선충류, 헬리코틸렌투스 멀티싱크투스(*Heliocotylenchus multinctus*) 및 기타 헬리코틸렌투스(*Heliocotylenchus*) 종; 엽초(Sheath) 및 초(sheathoid) 선충류, 헤미시클리오포라(*Hemicycliophora*) 종 및 헤미크리코네모이데스(*Hemicriconemoides*) 종; 히르쉬만니엘라(*Hirshmanniella*) 종; 작살선충류, 호플로아이무스(*Hoploaimus*) 종; 가성 뿌리혹 선충류, 나코부스(*Nacobbus*) 종; 바늘선충류, 롱기도루스 엘롱가투스(*Longidorus elongatus*) 및 기타 롱기도루스(*Longidorus*) 종; 뿌리썩이 선충류, 프라틸렌투스 네글렉투스(*Pratylenchus neglectus*), 프라틸렌투스 페네트랜스(*Pratylenchus penetrans*), 프라틸렌투스 쿠르비타투스(*Pratylenchus curvatus*), 프라틸렌투스 고오데이(*Pratylenchus goodeyi*) 및 기타 프라틸렌투스(*Pratylenchus*) 종; 네모구린 선충류, 라도폴루스 시밀리스(*Radopholus similis*) 및 기타 라도폴루스(*Radopholus*) 종; 신장형(Reniform) 선충류, 로틸렌투스 로부스투스(*Rotylenchus robustus*) 및 기타 로틸렌투스(*Rotylenchus*) 종; 스쿠텔로네마(*Scutellonema*) 종; 삼나무활선충류, 트리초도루스 프리미티브스(*Trichodorus primitivus*) 및 기타 트리초도루스 종, 파라트리초도루스(*Paratrichodorus*) 종; 위축선충류, 틸렌초르힌투스 클레이토니(*Tylenchorhynchus claytoni*), 틸렌초르힌투스 두비우스(*Tylenchorhynchus dubius*) 및 기타 틸렌초르힌투스(*Tylenchorhynchus*) 종; 감귤선충류, 틸렌툴루스(*Tylenchulus*) 종; 뿔나무선충류, 시피네마(*Xiphinema*) 종; 및 기타 식물 기생 선충류 종의 방제에 유용하다.

<112> 화학식 I의 화합물 및 그의 염은 거미강, 예컨대 거미류 (아카리나(*Acarina*)), 예를 들어 아르가시다에(*Argasidae*), 익소디다에(*Ixodidae*) 및 사르콥티다에(*Sarcoptidae*) 과, 예컨대 암블리오마 아메리카눔(*Amblyomma americanum*), 암블리오마 바리에가툼(*Amblyomma variegatum*), 아르가스 페르시쿠스(*Argas persicus*), 부필루스 아놀라투스(*Boophilus annulatus*), 부필루스 데코로라투스(*Boophilus decoloratus*), 부필루스 미크로폴루스(*Boophilus microplus*), 데르마센토르 실바룸(*Dermacentor silvarum*), 히알로마 트룬카툼(*Hyalomma truncatum*), 익소테스 리시누스(*Ixodes ricinus*), 익소테스 루비쿤두스(*Ixodes rubicundus*), 오르니토도루스 모우바타(*Ornithodoros moubata*), 오토비우스 메그니니(*Otobius megnini*), 데르마니수스 갈리나에(*Dermanyssus gallinae*), 소롭테스 오비스(*Psoroptes ovis*), 리피세팔루스 아펜디쿨라투스(*Rhipicephalus appendiculatus*), 리피세팔루스 에베르트시(*Rhipicephalus evertsi*), 사르콥테스 스카비에이(*Sarcoptes scabiei*) 및 혹응애과 종, 예컨대 아쿨루스 쉘레흐텐달리(*Aculus schlechtendali*), 필로콥트라타 올레이보라

(*Phyllocoptrata oleivora*) 및 에리오피에스 셸도니(*Eriophyes sheldoni*); 먼지응애과 중, 예컨대 피토네무스 팔리두스(*Phytonemus pallidus*) 및 폴리파고타르손에무스 라투스(*Polyphagotarsonemus latus*); 주름응애과 중, 예컨대 브레비팔푸스 포에니시스(*Brevipalpus phoenicis*); 잎응애과 중, 예컨대 테트라니쿠스 시나바리누스(*Tetranychus cinnabarinus*), 테트라니쿠스 칸자와이(*Tetranychus kanzawai*), 테트라니쿠스 파시피쿠스(*Tetranychus pacificus*), 테트라니쿠스 텔라리우스(*Tetranychus telarius*) 및 테트라니쿠스 우르티카에(*Tetranychus urticae*), 파노니쿠스 올미(*Panonychus ulmi*), 파노니쿠스 시트리(*Panonychus citri*) 및 올리고니쿠스 프라텐시스(*oligonychus pratensis*)의 방제에 또한 유용하다.

<113> 화학식 I의 화합물은 곤충류, 바람직하게는 흡즙(sucking) 또는 관통(piercing) 곤충류, 예컨대 티사놉테라(*Thysanoptera*) 속, 히메놉테라(*Hymenoptera*) 속, 오르토포테라(*Orthoptera*) 속 및 호뎬테라(*Homoptera*) 속, 특히 하기 중으로부터의 곤충류의 방제에 특히 유용하다:

<114> 총채목 (티사놉테라(*Thysanoptera*)) 곤충, 예를 들어 프랑클리니엘라 푸스카(*Frankliniella fusca*), 프랑클리니엘라 옥키덴탈리스(*Frankliniella occidentalis*), 프랑클리니엘라 트리티시(*Frankliniella tritici*), 시르토티립스 시트리(*Scirtothrips citri*), 트립스 오리자에(*Thrips oryzae*), 트립스 팔미(*Thrips palmi*) 및 트립스 타바시(*Thrips tabaci*);

<115> 막시목 (히메놉테라(*Hymenoptera*)) 곤충, 예를 들어 아탈리아 로사에(*Athalia rosae*), 아타 세팔로테스(*Atta cephalotes*), 아타 섹덴스(*Atta sexdens*), 아타 텍사나(*Atta texana*), 호플로캄파 미누타(*Hoplocampa minuta*), 호플로캄파 테스투디네아(*Hoplocampa testudinea*), 모노모리움 파라오니스(*Monomorium pharaonis*), 솔레놉시스 게미나타(*Solenopsis geminata*) 및 솔레놉시스 인빅타(*Solenopsis invicta*);

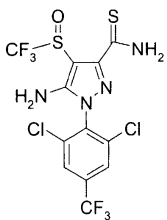
<116> 메뚜기목 (오르토포테라(*Orthoptera*)) 곤충, 예를 들어 아케타 도메스티카(*Acheta domestica*), 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*), 블라텔라 게르마니카(*Blattella germanica*), 포르피쿨라 아우리쿨라리아(*Forficula auricularia*), 그릴로탈파 그릴로탈파(*Grylotalpa grylotalpa*), 로쿠스타 미그라토리아(*Locusta migratoria*), 멜라노플루스 비비타투스(*Melanoplus bivittatus*), 멜라노플루스 페무루브룸(*Melanoplus femur-rubrum*), 멜라노플루스 멕시코누스(*Melanoplus mexicanus*), 멜라노플루스 산구이니페스(*Melanoplus sanguinipes*), 멜라노플루스 스프레투스(*Melanoplus spretus*), 노마다크리스 셉템파시아타(*Nomadacris septemfasciata*), 페리플라네타 아메리카나(*Periplaneta americana*), 슈스토세르카 아메리카나(*Schistocerca americana*), 슈스토세르카 페레그리나(*Schistocerca peregrina*), 스타우로노투스 마로카누스(*Stauronotus maroccanus*) 및 타키시네스 아시나모루스(*Tachycines asynamorus*);

<117> 매미목 (호뎬테라(*Homoptera*)) 곤충, 특히 진딧물, 아시르토시폰 오노브리키스(*Acyrtosiphon onobrychis*), 아델게스 라리시스(*Adelges laricis*), 아피둘라 나스투르티이(*Aphidula nasturtii*), 아피스 파바에(*Aphis fabae*), 아피스 포르베시(*Aphis forbesi*), 아피스 포미(*Aphis pomi*), 아피스 고시피이(*Aphis gossypii*), 아피스 그로술라리아에(*Aphis grossulariae*), 아피스 슈네이테리(*Aphis schneideri*), 아피스 스피라에콜라(*Aphis spiraecola*), 아피스 삼부시(*Aphis sambuci*), 아시르토시폰 피숨(*Acyrtosiphon pisum*), 아우라코르툼 솔라니(*Aulacorthum solani*), 브라키카우두스 카르두이(*Brachycaudus cardui*), 브라키카우두스 헬리크리시(*Brachycaudus helichrysi*), 브라키카우두스 페르시카에(*Brachycaudus persicae*), 브라키카우두스 프루니콜라(*Brachycaudus prunicola*), 브레비코리네 브라시카에(*Brevicoryne brassicae*), 카피토포루스 호르니(*Capitophorus horni*), 세로시파 고시피이(*Cerosipha gossypii*), 카에토시폰 프라가에폴리이(*Chaetosiphon fragaefolii*), 크립토미주스 리비스(*Cryptomyzus ribis*), 드레이푸시아 노르만니아나에(*Dreyfusia normanniana*), 드레이푸시아 피세아에(*Dreyfusia piceae*), 디사피스 라디콜라(*Dysaphis radicola*), 디사우라코르툼 슈도솔라니(*Dysaulacorthum pseudosolani*), 디사피스 플란타기네아(*Dysaphis plantaginea*), 디사피스 피리(*Dysaphis pyri*), 엠포아스카 파바에(*Empoasca fabae*), 히알로테루스 프루니(*Hyalopterus pruni*), 히페로미주스 락투카에(*Hyperomyzus lactucae*), 마크로시폼 아베나에(*Macrosiphum avenae*), 마크로시폼 유포로비아에(*Macrosiphum euphorbiae*), 마크로시폼 로사에(*Macrosiphum rosae*), 메고우라 비시아에(*Megoura viciae*), 멜라나피스 피라리우스(*Melanaphis pyraeius*), 메토폴로피움 디로둠(*Metopolophium dirhodum*), 미조데스 페르시카에(*Myzodes persicae*), 미주스 아스칼로니쿠스(*Myzus ascalonicus*), 미주스 세라시(*Myzus cerasi*), 미주스 바리안스(*Myzus varians*), 나소노비아 리비스니그리(*Nasonovia ribis-nigri*), 닐라파르바타 루겐스(*Nilaparvata lugens*), 펨피구스 부르사리우스(*Pemphigus bursarius*), 페르킨시엘라 사카리시다(*Perkinsiella saccharicida*), 포로돈 후물리(*Phorodon humuli*), 실라 말리(*Psylla mali*), 실라 피리(*Psylla piri*), 로팔로미주스 아스칼로니쿠스(*Rhopalomyzus ascalonicus*), 로팔로시폼 마이디스(*Rhopalosiphum maidis*), 로팔로시폼 파디(*Rhopalosiphum padi*), 로팔로시폼 인세르툼(*Rhopalosiphum insertum*), 사파피스 말라(*Sappaphis mala*), 사

파피스 말리(*Sappaphis mali*), 쉬자피스 그라미눔(*Schizaphis graminum*), 쉬조뉴라 라누기노사(*Schizoneura lanuginosa*), 시토비온 아베나에(*Sitobion avenae*), 트리알레우로데스 바포라리오룸(*Trialeurodes vaporariorum*), 독솅테라 아우란티안드(*Toxoptera aurantiiand*) 및 비테우스 비티폴리이(*Viteus vitifolii*).

- <118> 본 발명에 따른 방법에서, 해충은 표적 기생충/해충, 그의 식량 공급원, 서식처, 번식지 또는 그의 생육지를 구충 유효량의 화학식 I의 화합물 또는 그의 염, 또는 살충 유효량의 화학식 I의 화합물 또는 그의 염을 함유하는 조성물과 접촉시킴으로써 방제된다.
- <119> "생육지"는 해충 또는 기생충이 성장하고 있거나 성장할 수 있는 서식지, 번식지, 식물, 종자, 토양, 지역, 물질 또는 환경을 의미한다.
- <120> 일반적으로, "구충 유효량"은 괴사, 사멸, 지연, 예방, 및 제거, 파괴, 또는 다른 방식의 표적 유기체의 출현 및 활성 감소의 효과를 포함한 성장에 대한 가시적인 효과를 달성하기 위해 필요한 활성 성분의 양을 의미한다. 구충 유효량은 본 발명에서 사용되는 다양한 화합물/조성물에 대해 다양할 수 있다. 조성물의 구충 유효량은 또한, 주요 조건, 예컨대 원하는 살충 효과 및 지속기간, 기상, 표적종, 생육지, 적용 방식 등에 따라 다양할 것이다.
- <121> 본 발명의 화합물은 또한 해충의 출현이 예상되는 장소에 예방적으로 적용될 수 있다.
- <122> 화학식 I의 화합물은 또한, 성장하고 있는 식물을 구충 유효량의 화학식 I의 화합물과 접촉시킴으로써 식물을 해충의 공격 또는 침입으로부터 보호하는 데 사용될 수 있다. 따라서, "접촉"은 직접 접촉 (화합물/조성물을 직접 해충 및/또는 식물, 전형적으로 식물의 잎, 줄기 또는 뿌리에 적용) 및 간접 접촉 (화합물/조성물을 해충 및/또는 식물의 생육지에 적용) 둘 다를 포함한다.
- <123> 상기 언급된 조성물은 상기 해충의 침입에 대해 작물 식물을 보호하는데, 또는 침입된 식물에서 상기 해충을 박멸하는데 특히 유용하다.
- <124> 작물 식물 처리에 사용하기 위해, 본 발명의 활성 성분의 적용률은 1 헥타르 당 0.1 g 내지 4000 g, 바람직하게는 1 헥타르 당 25 g 내지 600 g, 보다 바람직하게는 1 헥타르 당 50 g 내지 500 g의 범위일 수 있다.
- <125> 본 발명의 한 변형에 따라, 본 발명의 추가 대상은, 예를 들어 화학식 I의 화합물을 단독으로 또는 다른 활성 성분과의 혼합물로 함유하는 과립 제형의 형태로 특히 종자 드릴로의 적용에 의한 토양의 처리 방법이다. 상기 방법은 유리하게 곡식, 옥수수, 목화 및 해바라기의 묘상에 사용된다. 곡식 및 옥수수에 대해, 적용률은 사용되는 활성 성분에 의존할 수 있고, 하나의 활성 성분에 대해 1 헥타르 당 50 내지 500 g, 및 기타 활성 성분에 대해 1 헥타르 당 50 내지 200 g의 범위일 수 있다.
- <126> 토양 처리 또는 해충 주거지 또는 보금자리로의 적용의 경우, 활성 성분의 양은 100 m² 당 0.0001 내지 500 g, 바람직하게는 100 m² 당 0.001 내지 20 g의 범위이다.
- <127> 본 발명의 화합물은 또한 개미류, 흰개미류, 장수말벌류, 파리류, 모기류, 귀뚜라미류 또는 바퀴류과 같은 비-작물 곤충 해충에 대해 적용될 수 있다. 상기 비-작물 해충에 대해 사용하기 위해, 화학식 I의 화합물은 바람직하게는 미끼 조성물에 사용된다.
- <128> 미끼는 액체, 고체 또는 반고체 제제 (예를 들어, 겔)일 수 있다. 고체 미끼는 각 적용에 적합한 다양한 형상 및 형태, 예를 들어 과립, 블록, 막대, 디스크로 형성될 수 있다. 액체 미끼는 적합한 적용이 보장되는 다양한 장치, 예를 들어 개방 용기, 분무 장치, 액적원(droplet source), 또는 증발원 내에 충전될 수 있다. 겔은 수성 또는 유성 매트릭스를 기재로 할 수 있으며, 점착성, 보습성 또는 숙성 특성에 대한 특정 필요성에 따라 제제화될 수 있다.
- <129> 조성물에 사용되는 미끼는 이를 섭식하도록 곤충류, 예컨대 개미류, 흰개미류, 장수말벌류, 파리류, 모기류, 귀뚜라미류 등 또는 바퀴류를 자극하기에 충분히 유인성인 생성물이다. 유인도(attractiveness)는 섭취 자극물질 또는 성 호르몬을 사용함으로써 조정될 수 있다. 식량 자극물질은 예를 들어, 비제한적으로, 동물 및/또는 식물 단백질 (육분, 어분 또는 혈분, 곤충 부분, 난황), 동물 및/또는 식물 기원의 지방 및 오일, 또는 모노-, 올리고- 또는 폴리유기사카라이드, 특히 수크로스, 락토스, 프락토스, 텍스트로스, 글루코스, 전분, 펙틴 또는 심지어 당밀 또는 화밀로부터 선택된다. 신선한 또는 부패한 과일, 작물, 식물, 동물, 곤충류의 부분 또는 이의 특정 부분이 또한 섭취 자극물질로서 작용할 수 있다. 성 호르몬은 보다 곤충 특이적인 것으로 공지되어 있다. 구체적 호르몬은 문헌에 기재되어 있으며, 당업자에게 공지되어 있다.

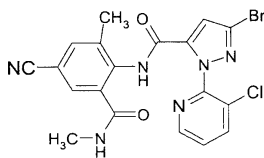
- <130> 미끼 조성물에서 사용하기 위한 활성 성분의 전형적인 함량은 활성 화합물 0.001 중량% 내지 15 중량%, 바람직하게는 0.001 중량% 내지 5 중량%이다.
- <131> 본 발명의 방법에서 화합물 I은 기타 활성 성분, 예를 들어 기타 구충제, 살충제, 제초제, 비료, 예컨대 질산암모늄, 우레아, 가성 칼륨, 및 과인산염, 식물독성제 및 식물 성장 조절제, 완화제 및 살선충제와 함께 적용될 수 있다. 이들 추가 성분은 상기 기재된 조성물과 순차적으로 또는 그와 조합하여 사용될 수 있으며, 적절한 경우 단지 사용 직전에 첨가될 수도 있다 (탱크 혼합). 예를 들어, 기타 활성 성분으로 처리되기 전에 또는 후에 식물(들)에 본 발명의 조성물을 분무할 수 있다.
- <132> 본 발명에 따른 화합물과 함께 사용될 수 있고, 그와 함께 잠재적 상승 효과를 생성할 수 있는 구충제에 대한 하기 목록 M은, 가능한 조합을 예시하도록 의도된 것이며, 어떠한 제한도 부여되도록 의도되지 않는다.
- <133> M.1. 유기(티오)포스페이트: 아세페이트, 아자메티포스, 아진포스-에틸, 아진포스-메틸, 클로르에톡시포스, 클로르펜빈포스, 클로르메포스, 클로르피리포스, 클로르피리포스-메틸, 쿠마포스, 시아노포스, 데메톤-S-메틸, 디아지논, 디클로르보스/DDVP, 디크로토포스, 디메토에이트, 디메틸빈포스, 디술포톤, EPN, 에티온, 에토프로포스, 팜푸르, 페나미포스, 페니트로티온, 펜티온, 플루피라조포스, 포스티아제이트, 헵테노포스, 이속사티온, 말라티온, 메카르밤, 메타미도포스, 메티다티온, 메빈포스, 모노크로토포스, 날레드, 오메토에이트, 옥시데메톤-메틸, 파라티온, 파라티온-메틸, 펜토에이트, 포레이트, 포살론, 포스메트, 포스파미돈, 폭심, 피리미포스-메틸, 프로페노포스, 프로페탐포스, 프로티오포스, 피라클로포스, 피리다펜티온, 퀴날포스, 술포테프, 테부피림포스, 테메포스, 터부포스, 테트라클로르빈포스, 티오메톤, 트리아조포스, 트리클로르폰, 바미도티온;
- <134> M.2. 카르바메이트: 알디카르브, 알라니카르브, 벤디오카르브, 벤푸라카르브, 부토카르복심, 부톡시카르복심, 카르브아릴, 카르보푸란, 카르보술포, 에티오펜카르브, 페노부카르브, 포르메타네이트, 푸라티오카르브, 이소프로카르브, 메티오카르브, 메토밀, 메톨카르브, 옥사밀, 피리미카르브, 프로폭수르, 티오디카르브, 티오파녹스, 트리메타카르브, XMC, 크실릴카르브, 트리아자메이트;
- <135> M.3. 피레트로이드: 아크리나트린, 알레트린, d-시스-트랜스 알레트린, d-트랜스 알레트린, 비펜트린, 비오알레트린, 비오알레트린 S-시클로펜테닐, 비오레스메트린, 시클로프로트린, 시플루트린, 베타-시플루트린, 시할로트린, 람다-시할로트린, 감마-시할로트린, 시피메트린, 알파-시피메트린, 베타-시피메트린, 세타-시피메트린, 제타-시피메트린, 시페노트린, 델타메트린, 엠펜트린, 에스펜발레레이트, 에토펜프록스, 펜프로파트린, 펜발레레이트, 플루시트리네이트, 플루메트린, 타우-플루발리네이트, 할펜프록스, 이미프로트린, 페르메트린, 페노트린, 프랄레트린, 레스메트린, RU 15525, 실라플루오펜, 테플루트린, 테트라메트린, 트랄로메트린, 트랜스플루트린, ZXI 8901;
- <136> M.4. 소아 호르몬 모방체: 히드로프렌, 키노프렌, 메토프렌, 페녹시카르브, 피리프록시펜;
- <137> M.5. 니코틴 수용체 효능제/길항제 화합물: 아세트아미프리드, 벤솔탐, 카르탐 히드로클로라이드, 클로티아니딘, 디노테푸란, 이미다클로프리드, 티아메톡삼, 니텐피람, 니코틴, 스피노사드 (알로스테릭 효능제), 티아클로프리드, 티오시클람, 티오술포-나트륨 및 AKD 1022;
- <138> M.6. GABA 관문 클로라이드 채널 길항제 화합물: 클로르단, 엔도술포, 감마-HCH (린단); 아세토프롤, 에티프롤, 피프로닐, 피라플루프롤, 피리프롤, 바닐리프롤, 하기 화학식 M^{6.1}의 페닐피라졸 화합물;
- <139> <화학식 M^{6.1}>



- <140>
- <141> M.7. 클로라이드 채널 활성인자: 아바멕틴, 에마멕틴 벤조에이트, 밀베멕틴, 레피멕틴;
- <142> M.8. METI I 화합물: 페나자퀸, 펜피록시메이트, 피리미디펜, 피리다벤, 테부펜피라드, 툴펜피라드, 플루페네림, 로테논;

- <143> M.9. METI II 및 III 화합물: 아세퀴노실, 플루아시프럼, 히드라메틸논;
- <144> M.10. 산화적 인산화의 짝풀림제(uncoupler): 클로르페나피르, DNOC;
- <145> M.11. 산화적 인산화의 억제제: 아조시클로틴, 시핵사틴, 디아펜티우론, 펜부타틴 옥시드, 프로파르가이트, 테트라디폰;
- <146> M.12. 탈피 교란 화합물: 시로마진, 크로마페노지드, 할로페노지드, 메톡시 페노지드, 테부페노지드;
- <147> M.13. 상승작용제: 피페로닐 부톡시드, 트리부포스;
- <148> M.14. 나트륨 채널 차단제 화합물: 인독사카르브, 메타플루미존;
- <149> M.15. 훈증제: 메틸 브로마이드, 클로로피크린 술푸릴 플루오라이드;
- <150> M.16. 선택적 섭취 차단제: 크릴로타이, 피메트로진, 플로니카미드;
- <151> M.17. 줌진드기 성장 억제제: 클로벤테진, 핵시티아족, 예톡사졸;
- <152> M.18. 키틴 합성 억제제: 부프로페진, 비스트리플루론, 클로르플루아주론, 디플루벤주론, 플루시클록수론, 플루페녹수론, 핵사플루무론, 루페누론, 노발루론, 노비플루무론, 테플루벤주론, 트리플루무론;
- <153> M.19. 지질 생합성 억제제: 스피로디클로펜, 스피로메시펜, 스피로테트라마트;
- <154> M.20. 옥타파민성 효능제: 아미트라즈;
- <155> M.21. 리아노딘 수용체 조정제: 플루벤디아미드;
- <156> M.22. 기타: 알루미늄 포스피드, 아미도플루메트, 벤클로티아즈, 벤족시메이트, 비페나제이트, 보락스, 브로모 프로필레이트, 시아나이드, 시에노피라펜, 시플루메토펜, 키노메티오네이트, 디코폴, 플루오로아세테이트, 포스핀, 피리달릴, 피리플루퀴나존, 황, 타르타르 구토제;
- <157> M.23. N-R'-2,2-디할로-1-R"시클로-프로판카르복사미드-2-(2,6-디클로로- α , α , α -트리플루오로-p-톨릴)히드라존 또는 N-R'-2,2-디(R''')프로피온아미드-2-(2,6-디클로로- α , α , α -트리플루오로-p-톨릴)-히드라존 (여기서, R'은 메틸 또는 에틸이고, 할로는 클로로 또는 브로모이고, R"은 수소 또는 메틸이고, R'''은 메틸 또는 에틸임);
- <158> M.24. 안트라닐아미드: 클로르안트라닐리프롤, 화학식 M^{24.1}의 화합물

<159> <화학식 M^{24.1}>



- <160>
- <161> A.25. 말로노니트릴 화합물: $CF_3(CH_2)_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_2H$, $CF_3(CH_2)_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_5CF_2H$, $CF_3(CH_2)_2C(CN)_2(CH_2)_2C(CF_3)_2F$, $CF_3(CH_2)_2C(CN)_2(CH_2)_2(CF_2)_3CF_3$, $CF_2H(CF_2)_3CH_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_2H$, $CF_3(CH_2)_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_3$, $CF_3(CF_2)_2CH_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_2H$, $CF_3CF_2CH_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_2H$, 2-(2,2,3,3,4,4,5,5-옥타플루오로펜틸)-2-(3,3,4,4,4-펜타플루오로부틸)-말로노디니트릴 및 $CF_2HCF_2CF_2CF_2CH_2C(CN)_2CH_2CH_2CF_2CF_3$;
- <162> A.26. 미생물 교란 화합물: 바실루스 투린지엔시스 아종 이스라엘렌시(*Bacillus thuringiensis subsp. Israelensis*), 바실루스 스파에리쿠스(*Bacillus sphaericus*), 바실루스 투린지엔시스 아종 아이자와이(*Bacillus thuringiensis subsp. Aizawai*), 바실루스 투린지엔시스 아종 쿠르스타키(*Bacillus thuringiensis subsp. Kurstaki*), 바실루스 투린지엔시스 아종 테네브리온시스(*Bacillus thuringiensis subsp. Tenebrionis*);
- <163> 군 A의 시판되는 화합물은 다른 공개물 중 문헌 [The Pesticide Manual, 13th Edition, British Crop Protection Council (2003)]에서 찾을 수 있다.
- <164> 화학식 M^{6.1}의 티오아미드 및 그의 제조는 제WO 98/28279호에 기재되어 있다. 레피벡틴은 문헌 [Agro Project,

PJB Publication Ltd, November 2004. Benclonthiaz]에 공지되어 있고, 그의 제조는 제EP-A1 454621호에 기재되어 있다. 메티다티온 및 파라옥손 및 그의 제조는 문헌 [Farm Chemicals Handbook, Volume 88, Meister Publishing Company, 2001]에 기재되어 있다. 아세토프롤 및 그의 제조는 제WO 98/28277호에 기재되어 있다. 메타플루미존 및 그의 제조는 제EP-A1 462 456호에 기재되어 있다. 플루피라조포스는 문헌 [Pesticide Science 54, 1988, p.237-243] 및 제US 4822779호에 기재되어 있다. 피라플루프롤 및 그의 제조는 제JP 2002193709호 및 제WO 01/00614호에 기재되어 있다. 피리프롤 및 그의 제조는 제WO 98/45274호 및 제US 6335357호에 기재되어 있다. 아미도플루메트 및 그의 제조는 제US 6221890호 및 제JP 21010907호에 기재되어 있다. 플루페네림 및 그의 제조는 제WO 03/007717호 및 제WO 03/007718호에 기재되어 있다. AKD 1022 및 그의 제조는 제US 6300348호에 기재되어 있다. 클로르안트라닐리프롤은 제WO 01/70671호, 제WO 03/015519호 및 제WO 05/118552호에 기재되어 있다. 화학식 M^{24.1}의 안트라닐아미드 유도체는 제WO 01/70671호, 제WO 04/067528호 및 제WO 05/118552호에 기재되어 있다. 시플루메토펜 및 그의 제조는 WO 04/080180에 기재되어 있다. 아미노퀴나졸리논 화합물 피리플루퀴나존은 제EP A 109 7932호에 기재되어 있다. 말로노니트릴 화합물 CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H, CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₅CF₂H, CF₃(CH₂)₂C(CN)₂(CH₂)₂C(CF₃)₂F, CF₃(CH₂)₂C(CN)₂(CH₂)₂(CF₂)₃CF₃, CF₂H(CF₂)₃CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H, CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₃, CF₃(CF₂)₂CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H, CF₃CF₂CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H, 2-(2,2,3,3,4,4,5,5-옥타플루오로펜틸)-2-(3,3,4,4,4-펜타플루오로부틸)-말로노디니트릴 및 CF₂HCF₂CF₂CF₂CH₂C(CN)₂CH₂CH₂CF₂CF₃은 제WO 05/63694호에 기재되어 있다.

<165> 제형

<166> 본 발명에 따른 방법에서 사용하기 위해, 화합물 I은 통상적인 제형, 예컨대 용액, 에멀전, 현탁액, 더스트, 분말, 페이스트, 과립 및 직접 분무가능한 용액으로 변환될 수 있다. 사용 형태는 특정 목적 및 적용 방법에 의존적이다. 제형 및 적용 방법은 각 경우에 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물의 미세 및 균질한 분포를 확실하게 가지도록 선택된다.

<167> 제형은 공지된 방식으로, 예를 들어 활성 화합물을, 농약 제형에 적합한 보조제, 예컨대 용매 및/또는 담체, 필요에 따라 유화제, 계면활성제 및 분산제, 방부제, 소포제, 동결방지제, 또한 임의로 종자 처리 제형을 위해 착색제 및/또는 결합제 및/또는 겔화제로 증량시킴으로써 제조된다 (예를 들어, 개괄적으로 제US 3,060,084호, 제EP-A 707 445호 (액체 농축물에 대한 것), 문헌 [Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57], 제WO 91/13546호, 제US 4,172,714호, 제US 4,144,050호, 제US 3,920,442호, 제US 5,180,587호, 제US 5,232,701호, 제US 5,208,030호, 제GB 2,095,558호, 제US 3,299,566호, 문헌 [Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961], [Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989] 및 [Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Germany), 2001], [2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8)] 참조).

<168> 적합한 용매/담체는 예를 들어 하기의 것들이다:

<169> - 용매, 예컨대 물, 방향족 용매 (예를 들어 솔베소(Solvesso) 생성물, 크실렌 등), 파라핀 (예를 들어, 광물 분획물), 알콜 (예를 들어, 메탄올, 부탄올, 펜탄올, 벤질 알콜), 케톤 (예를 들어, 시클로헥산온, 감마-부티로락톤), 피롤리돈 (N-메틸-피롤리돈 (NMP), N-옥틸피롤리돈 (NOP)), 아세테이트 (글리콜 디아세테이트), 알킬 락테이트, 락톤, 예컨대 g-부티로락톤, 글리콜, 지방산 디메틸아미드, 지방산 및 지방산 에스테르, 트리글리세리드, 식물 또는 동물 기원 오일 및 개질된 오일, 예컨대 알킬화된 식물성 오일 등. 원칙적으로, 용매 혼합물을 사용할 수도 있다.

<170> - 담체, 예컨대 분쇄된 천연 광물 및 분쇄된 합성 광물, 예컨대, 실리카 겔, 미분된 규산, 실리카이트, 활석, 카올린, 아타클레이(attaclay), 석회석, 석회, 백악, 교회 점토, 리스, 점토, 백운석, 규조토, 황산칼슘 및 황산마그네슘, 산화마그네슘, 분쇄된 합성 물질, 비료, 예컨대 황산암모늄, 인산암모늄, 질산암모늄, 우레아 및 식물 기원 생성물, 예컨대 곡분, 모피분, 목분 및 견과피분, 셀룰로스 분말 및 기타 고체 담체.

<171> 적합한 유화제는 비이온성 및 음이온성 유화제 (예를 들어, 폴리옥시에틸렌 지방 알콜 에테르, 알킬술포네이트 및 아릴술포네이트)이다.

- <172> 분산제의 예는, 리그닌-숄파이트 페액 및 메틸셀룰로스이다.
- <173> 적합한 계면활성제는 리그노숄폰산, 나프탈렌숄폰산, 페놀숄폰산, 디부틸나프탈렌숄폰산, 알킬아릴숄포네이트, 알킬 숄페이트, 알킬숄포네이트, 지방 알콜 숄페이트, 지방산 및 황산화된 지방 알콜 글리콜 에테르의 알칼리 금속, 알칼리 토금속 및 암모늄 염, 및 숄폰화된 나프탈렌 및 나프탈렌 유도체와 포름알데히드의 축합물, 나프탈렌 또는 나프탈렌숄폰산과 페놀 및 포름알데히드의 축합물, 폴리옥시에틸렌 옥틸페닐 에테르, 에톡실화된 이소옥틸페놀, 옥틸페놀, 노닐페놀, 알킬페닐 폴리글리콜 에테르, 트리부틸페닐 폴리글리콜 에테르, 트리스테아릴페닐 폴리글리콜 에테르, 알킬아릴 폴리에테르 알콜, 알콜 및 지방 알콜/에틸렌 옥시드 축합물, 에톡실화된 피마자유, 폴리옥시에틸렌 알킬 에테르, 에톡실화된 폴리옥시프로필렌, 라우릴 알콜 폴리글리콜 에테르 아세탈, 소르비톨 에스테르이다.
- <174> 또한, 글리세린, 에틸렌 글리콜, 프로필렌 글리콜 등의 동결방지제 및 살균제를 제형에 첨가할 수 있다.
- <175> 적합한 소포제는, 예를 들어 규소 또는 마그네슘 스테아레이트 기재의 소포제이다.
- <176> 적합한 방부제는, 예를 들어 디클로로펜 및 벤질 알콜 헤미포르말이다.
- <177> 적합한 증점제는, 제형에 유사가소성 유동 거동, 즉 정지상태에서 고점도 및 교반 상태에서 저점도를 제공하는 화합물이다. 이러한 맥락에서, 예를 들어 다당류 기재의 시판용 증점제, 예컨대 크산탄 검(Xanthan Gum)® (켈코(Kelco)로부터의 켈잔(Kelzan)®), 로도폴(Rhodopol)®23 (룽 프랑(Rhone Poulenc)) 또는 비검(Veegum)® (RT. 반데르빌트(RT. Vanderbilt)), 또는 유기 층상실리케이트(phyllsilicate), 예컨대 아타클레이® (엔겔하르트(Engelhardt))를 들 수 있다. 본 발명에 따른 분산액에 적합한 소포제는, 예를 들어, 실리콘 에멀전 (예컨대 실리콘(Silikon)® SRE (와커(Wacker)) 또는 로도실(Rhodorsil)® (로디아(Rhodia)로부터)), 장쇄 알콜, 지방산, 유기불소 화합물 및 이들의 혼합물이다. 살생제를 첨가하여 본 발명에 따른 조성물을 미생물의 공격에 대해 안정화시킬 수 있다. 적합한 살생제는, 예를 들어 이소티아졸론을 기재로 한 것, 예컨대 아베시아(Avecia) (또는 아크(Arch))로부터 상표명 프록셀(Proxel)®로, 또는 토르 케미(Thor Chemie)로부터 악티사이드(Acticide)® RS로, 또한 롬 앤 하스(Rohm & Haas)로부터 카톤(Kathon)® MK로 시판되는 화합물이다. 적합한 동결방지제는 유기 폴리올, 예를 들어 에틸렌 글리콜, 프로필렌 글리콜 또는 글리세롤이다. 이들은 통상적으로 활성 화합물 조성물의 총 중량을 기준으로 10 중량% 이하의 양으로 사용된다. 적절한 경우, 본 발명에 따른 활성 화합물 조성물은, pH 조절을 위해, 제조된 제형의 총량을 기준으로 1 내지 5 중량%의 완충제를 포함할 수 있으며, 사용된 완충제의 양 및 유형은 활성 화합물(들)의 화학적 특성에 따라 달라진다. 완충제의 예는, 약한 무기산 또는 유기산, 예컨대 인산, 보론산, 아세트산, 프로피온산, 시트르산, 푸마르산, 타르타르산, 옥살산 및 숙신산의 알칼리 금속염이다.
- <178> 직접 분무가능한 용액, 에멀전, 페이스트 또는 유분산액 제조에 적합한 물질은 중간 내지 높은 비점의 광유 분획물, 예컨대 케로센 또는 디젤 오일, 또한 콜 타르 오일 및 식물 또는 동물 기원의 오일, 지방족, 시클릭 및 방향족 탄화수소, 예를 들어 톨루엔, 크실렌, 파라핀, 테트라히드로나프탈렌, 알킬화된 나프탈렌 또는 그의 유도체, 메탄올, 에탄올, 프로판올, 부탄올, 시클로헥산올, 시클로헥산온, 이소포론, 강한 극성 용매, 예를 들어 디메틸 숄폭시드, N-메틸피롤리돈 및 물이다.
- <179> 분말, 살포용 물질 및 더스트는 활성 물질을 고체 담체와 혼합 또는 동반 분쇄함으로써 제조될 수 있다.
- <180> 과립, 예를 들어 코팅 과립, 함침 과립 및 균질 과립은 활성 성분을 고체 담체에 결합시킴으로써 제조될 수 있다. 고체 담체의 예는 광물성 토양, 예컨대 실리카 겔, 실리케이트, 활석, 카올린, 아타클레이, 석회석, 석회, 백악, 교회 점토, 피스, 점토, 백운석, 규조토, 황산칼슘, 황산마그네슘, 산화마그네슘, 분쇄된 합성 물질, 비료, 예컨대 황산암모늄, 인산암모늄, 질산암모늄, 우레아 및 식물 기원 생성물, 예컨대 곡분, 목피분, 목분 및 건과피분, 셀룰로스 분말 및 기타 고체 담체이다.
- <181> 일반적으로, 제형은 0.01 내지 95 중량%, 바람직하게는 0.1 내지 90 중량%의 활성 성분을 포함한다. 활성 성분은 90% 내지 100%, 바람직하게는 95% 내지 100%의 순도 (NMR 스펙트럼에 따름)로 사용된다.
- <182> 종자 처리를 위해, 각각의 제형은 2 내지 10배로 희석되어 0.01 내지 60 중량%, 바람직하게는 0.1 내지 40 중량%의 활성 화합물의 즉시 사용가능한 제제에서의 농도를 형성할 수 있다.
- <183> 화학식 I의 화합물은 그 자체로, 또는 그의 제형 형태, 또는 그로부터 제조된 사용 형태, 예를 들어 직접 분무가능한 용액, 분말, 현탁액 또는 분산액, 에멀전, 유분산액, 페이스트, 살분(dusting)가능한 생성물, 살포용 물질 또는 과립의 형태로 분무, 아토마이징, 살분, 살포 또는 푸어링(pouring)에 의해 사용될 수 있다. 사용 형

태는 전적으로 의도하는 목적에 따라 달라지고, 이들은 각각의 경우에 본 발명에 따른 활성 화합물이 가능한 한 미세하게 분산되는 것을 보장하도록 의도된다.

- <184> 제형의 예는 하기와 같다:
- <185> 1. 물 희석용 생성물. 종자 처리를 위해, 이러한 생성물은 희석되거나 희석되지 않고 종자에 적용될 수 있음.
- <186> A) 수용성 농축물 (SL, LS)
- <187> 활성 화합물 10 중량부를 90 중량부의 물 또는 수용성 용매 중에 용해시킨다. 별법으로, 습윤제 또는 기타 보조제를 첨가한다. 물로 희석하면 활성 화합물은 용해되고, 이로써 10% (w/w)의 활성 화합물을 갖는 제형이 얻어진다.
- <188> B) 분산성 농축물 (DC)
- <189> 활성 화합물 20 중량부를 10 중량부의 분산제 (예를 들어, 폴리비닐피롤리돈)의 첨가와 함께 70 중량부의 시클로헥산온 중에 용해시킨다. 물로 희석하면 분산액이 생성되고, 이로써 20% (w/w)의 활성 화합물을 갖는 제형이 얻어진다.
- <190> C) 유화성 농축물 (EC)
- <191> 활성 화합물 15 중량부를 칼슘 도데실벤젠술포네이트 및 피마자유 에톡실레이트 (각 경우에 5 중량부)의 첨가와 함께 7 중량부의 크실렌 중에 용해시킨다. 물로 희석하면 에멀전이 생성되고, 이로써 15% (w/w)의 활성 화합물을 갖는 제형이 얻어진다.
- <192> D) 에멀전 (EW, EO, ES)
- <193> 활성 화합물 25 중량부를 칼슘 도데실벤젠술포네이트 및 피마자유 에톡실레이트 (각 경우에 5 중량부)의 첨가와 함께 35 중량부의 크실렌 중에 용해시킨다. 이 혼합물을 유화제 (예를 들어, 울트라투락스(Ultratrurax))를 이용하여 30 중량부의 물에 도입하여 균질한 에멀전으로 제조한다. 물로 희석하면 에멀전이 생성되고, 이로써 25% (w/w)의 활성 화합물을 갖는 제형이 얻어진다.
- <194> E) 현탁액 (SC, OD, FS)
- <195> 교반 볼 밀에서, 활성 화합물 20 중량부를 10 중량부의 분산제, 습윤제 및 70 중량부의 물 또는 유기 용매의 첨가와 함께 분쇄하여 활성 화합물의 미세 현탁액을 수득한다. 물로 희석하면 활성 화합물의 안정한 현탁액이 생성되고, 이로써 20% (w/w)의 활성 화합물을 갖는 제형이 얻어진다.
- <196> F) 수분산성 과립 및 수용성 과립 (WG, SG)
- <197> 활성 화합물 50 중량부를 50 중량부의 분산제 및 습윤제의 첨가와 함께 미분하고, 기술적 장치 (예를 들어, 압출, 분무 타워, 유동층)를 이용하여 수분산성 또는 수용성 과립으로 제조한다. 물로 희석하면 활성 화합물의 안정한 분산액 또는 용액이 생성되고, 이로써 50% (w/w)의 활성 화합물을 갖는 제형이 얻어진다.
- <198> G) 수분산성 분말 및 수용성 분말 (WP, SP, SS, WS)
- <199> 활성 화합물 75 중량부를 회전자-고정자 밀에서 25 중량부의 분산제, 습윤제 및 실리카 겔의 첨가와 함께 분쇄한다. 물로 희석하면 활성 화합물의 안정한 분산액 또는 용액이 생성되고, 이로써 75% (w/w)의 활성 화합물을 갖는 제형이 얻어진다.
- <200> H) 겔 제형 (GF)
- <201> 교반 볼 밀에서, 활성 화합물 20 중량부를 10 중량부의 분산제, 1 중량부의 겔화제, 습윤제 및 70 중량부의 물 또는 유기 용매 첨가와 함께 분쇄하여, 활성 화합물의 미세 현탁액을 수득한다. 물로 희석하면 활성 화합물의 안정한 현탁액이 생성되며, 이로써 20%(w/w)의 활성 화합물을 갖는 제형이 얻어진다.
- <202> 2. 희석하지 않고 적용되는 잎 적용을 위한 생성물. 종자 처리를 위해, 이러한 생성물은 희석되거나 희석되지 않고 종자에 적용될 수 있음.
- <203> I) 살분가능한 분말 (DP, DS)
- <204> 활성 화합물 5 중량부를 미분하고, 미분된 카울린 95 중량부와 치밀 혼합한다. 이로써 5% (w/w)의 활성 화합물을 갖는 살분가능한 생성물이 생성된다.

- <205> J) 과립 (GR, FG, GG, MG)
- <206> 활성 화합물 0.5 중량부를 미분하고, 95.5 중량부의 담체와 회합시켜, 이로써 0.5% (w/w)의 활성 화합물을 갖는 제형이 얻어진다. 현행 방법은 압출, 분무 건조 또는 유동층 방법이다. 이로써 회석되지 않고 적용되는 일 용도를 위한 과립이 생성된다.
- <207> K) ULV 용액 (UL)
- <208> 활성 화합물 10 중량부를 90 중량부의 유기 용매 (예를 들어, 크실렌) 중에 용해시킨다. 이로써 회석되지 않고 적용되는 일 용도를 위한 10% (w/w)의 활성 화합물을 갖는 생성물이 생성된다.
- <209> 수성 사용 형태는 에멀전 농축물, 페이스트 또는 습윤성 분말 (분무성 분말, 유분산액)으로부터 물의 첨가에 의해 제조될 수 있다. 에멀전, 페이스트 또는 유분산액을 제조하기 위해서, 물질 그 자체 또는 오일 또는 용매 중에 용해된 물질은 습윤제, 점착부여제, 분산제 또는 유화제를 사용하여 물에서 균질화될 수 있다. 별법으로, 활성 물질, 습윤제, 점착부여제, 분산제 또는 유화제, 및 적절한 경우 용매 또는 오일로 구성된 농축물을 제조하는 것이 가능하고, 이러한 농축물은 물로 회석하기에 적합하다.
- <210> 화학식 I의 화합물의 에어로졸 (예를 들어, 분무 캔내), 오일 스프레이 또는 펌프 스프레이로서의 제형은 비전문가인 사용자가 해충, 예컨대 파리류, 벼룩류, 진드기류, 모기류 또는 바퀴벌레를 방제하는데 매우 적합하다. 에어로졸 제형에는 바람직하게는 활성 화합물, 용매, 예컨대 저급 알콜 (예를 들어, 메탄올, 에탄올, 프로판올, 부탄올), 케톤 (예를 들어, 아세톤, 메틸 에틸 케톤), 비점이 대략 50 내지 250°C 범위의 파라핀 탄화수소 (예를 들어, 케로센), 디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈, 디메틸 술폭시드, 방향족 탄화수소, 예컨대 톨루엔, 크실렌, 물, 또한 보조제, 예컨대 유화제, 예컨대 소르비톨 모노올레에이트, 에틸렌 옥시드 3 내지 7 물을 포함하는 올레일 에톡실레이트, 지방 알콜 에톡실레이트, 방향 오일, 예컨대 에테르성 오일, 중급 지방산과 저급 알콜의 에스테르, 방향족 카르보닐 화합물, 적절한 경우 안정화제, 예컨대 나트륨 벤조에이트, 양쪽성 계면활성제, 저급 에폭시드, 트리에틸 오르토포르메이트, 및 필요한 경우 추진제, 예컨대 프로판, 부탄, 질소, 압축 공기, 디메틸 에테르, 이산화탄소, 아산화질소, 또는 상기 가스의 혼합물이 포함된다.
- <211> 오일 스프레이 제형은 추진제가 사용되지 않는다는 점에서 에어로졸 제형과 상이하다.
- <212> 분무 조성물에 사용하기 위해, 활성 성분의 함량은 0.001 내지 80 중량%, 바람직하게는 0.01 내지 50 중량%, 가장 바람직하게는 0.01 내지 15 중량%이다.
- <213> 화학식 I의 화합물 및 그의 각 조성물은 또한 모기 및 훈증 코일, 연무 카트리지, 기화기 판 또는 장시간 기화기, 또한 나방지(moth paper), 나방 패드(moth pad) 또는 기타 열-무관(heat-independent) 기화기 시스템에서 사용될 수 있다.
- <214> 즉시 사용가능한 생성물 내의 활성 성분 농도는 비교적 폭넓은 범위내에서 다양할 수 있다. 일반적으로, 0.0001 내지 10 중량%, 바람직하게는 0.01 내지 1 중량%이다.
- <215> 활성 성분은 또한 95 중량%가 넘게 활성 성분을 포함하는 제형으로 적용하거나, 또는 심지어 첨가제 없이 활성 성분을 적용할 수 있는 극소부피 (ULV) 공정에서도 성공적으로 사용될 수 있다.
- <216> 동물 건강
- <217> 농업 해충에 대한 화합물의 활성은, 예를 들어 경구 투여의 경우 구토를 유발하지 않는 낮은 투여량, 동물과의 대사 상용성, 낮은 독성 및 안전한 취급을 요하는 동물 내부의 또한 동물 상의 내부기생충 및 외부기생충의 방제에 대한 그의 적합성을 제시하지 않는다.
- <218> 놀랍게도, 화학식 I의 화합물은 동물 내부의 또한 동물 상의 내부기생충 및 외부기생충의 박멸에 적합한 것으로 밝혀졌다.
- <219> 화학식 I의 화합물 또는 그의 거울상이성질체 또는 수의학상 허용되는 염 및 그를 포함하는 조성물은 바람직하게는 온혈 동물 (인간 포함) 및 어류를 포함한 동물의 침입 및 감염의 방제 및 예방에 사용된다. 이들은, 예를 들어 포유동물, 예컨대 소, 양, 돼지, 낙타, 사슴, 말, 새끼돼지, 가금류, 토끼, 염소, 개 및 고양이, 물소, 당나귀, 다마사슴 및 순록에서, 또한 모피 동물, 예컨대 밍크, 친칠라 및 미국너구리, 조류, 예컨대 암탉, 거위, 칠면조 및 오리, 및 어류, 예컨대 민물고기 및 바닷물고기, 예컨대 송어, 잉어 및 뱀장어에서의 침입 및 감염의 방제 및 예방에 적합하다.

- <220> 화학식 I의 화합물 또는 그의 거울상이성질체 또는 수의학적 허용되는 염 및 그를 포함하는 조성물은 바람직하게는, 가축, 예컨대 개 및 고양이에서의 침입 및 감염의 방제 및 예방에 사용된다.
- <221> 온혈 동물 및 어류에서의 침입은, 이, 무는 이, 진드기, 코의 말파리 유충, 흡혈 파리, 무는 파리, 머스코이드 파리, 파리, 미리아스틱 파리 유충, 털진드기, 각다귀, 모기 및 벼룩을 포함하나, 이에 제한되지는 않는다.
- <222> 화학식 I의 화합물 또는 그의 거울상이성질체 또는 수의학적 허용되는 염 및 그를 포함하는 조성물은 내부기생충 및/또는 외부기생충의 전신 및/또는 비전신 방제에 적합하다. 이들은 발생의 모든 또는 일부 단계에 대해 활성이다.
- <223> 화학식 I의 화합물은 외부기생충 박멸에 특히 유용하다.
- <224> 화학식 I의 화합물은, 각각 하기 목 및 종의 기생충 박멸에 특히 유용하다:
- <225> 벼룩류 (시포나프테라(*Siphonaptera*)), 예를 들어 고양이벼룩(*Ctenocephalides felis*), 개벼룩(*Ctenocephalides canis*), 열대쥐벼룩(*Xenopsylla cheopis*), 사람벼룩(*Pulex irritans*), 모래벼룩(*Tunga penetrans*) 및 유럽쥐벼룩(*Nosopsyllus fasciatus*),
- <226> 바퀴류 (블라타리아(*Blattaria*) - 블라토테아(*Blattodea*)), 예를 들어 블라텔라 게르마니카, 블라텔라 아사히나에(*Blattella asahinae*), 페리플라네타 아메리카나, 페리플라네타 자포니카(*Periplaneta japonica*), 페리플라네타 브룬네아(*Periplaneta brunnea*), 페리플라네타 풀리기노사(*Periplaneta fuliginosa*), 페리플라네타 아우스트랄라시아에(*Periplaneta australasiae*), 및 블라타 오리엔탈리스(*Blatta orientalis*),
- <227> 파리류, 모기류 (딧테라), 예를 들어 아에테스 아에집티, 아에테스 알보픽투스(*Aedes albopictus*), 아에테스 벡산스, 아나스트레파 루덴스, 아노펠레스 마쿨리페니스, 아노펠레스 크루시안스(*Anopheles crucians*), 아노펠레스 알비만누스(*Anopheles albimanus*), 아노펠레스 갬비아에(*Anopheles gambiae*), 아노펠레스 프리보르니(*Anopheles freeborni*), 아노펠레스 류코스피루스(*Anopheles leucosphyrus*), 아노펠레스 미니무스(*Anopheles minimus*), 아노펠레스 쿼드리마쿨라투스(*Anopheles quadrimaculatus*), 칼리포라 비시나(*Calliphora vicina*), 크리소미아 베짜야나, 크리소미아 호미니보락스, 크리소미아 마셀라리아, 크리소프스 디스칼리스(*Chrysops discalis*), 크리소프스 실라세아(*Chrysops silacea*), 크리소프스 아틀란티쿠스(*Chrysops atlanticus*), 코클리오미아 호미니보락스(*Cochliomyia hominivorax*), 코르딜로비아 안트로포파가, 쿨리코이테스 푸렌스(*Culicoides furens*), 쿨렉스 피피엔스, 쿨렉스 니그리팔푸스(*Culex nigripalpus*), 쿨렉스 퀴네파시아투스(*Culex quinquefasciatus*), 쿨렉스 타르살리스(*Culex tarsalis*), 쿨리세타 이노르나타(*Culiseta inornata*), 쿨리세타 멜라누라(*Culiseta melanura*), 데르마토비아 호미니스(*Dermatobia hominis*), 파니아 카니쿨라리스, 가스테로필루스 인테스티날리스, 글로시나 모르시탄스, 글로시나 팔팔리스(*Glossina palpalis*), 글로시나 푸스시페스(*Glossina fuscipes*), 글로시나 타키노이데스(*Glossina tachinoides*), 하에마토비아 이리탄스, 하플로디플로시스 에퀘스트리스, 힙펠라테스(*Hippelates*) 종, 히포테르마 리네아타, 레프트코노프스 토렌스(*Leptoconops torrens*), 루실리아 카프리카, 루실리아 쿠프리카, 루실리아 세리카타, 리코리아 펙토탈리스, 만소니아(*Mansonia*) 종, 무스카 도메스티카, 무시나 스타블란스, 오에스트루스 오비스, 플레보토무스 아르겐티페스(*Phlebotomus argentipes*), 소로포라 콜롬비아에(*Psorophora columbiae*), 소로포라 디스콜로르(*Psorophora discolor*), 로시물룸 믹스툼(*Prosimulium mixtum*), 사르코파가 하에모르호이달리스(*Sarcophaga haemorrhoidalis*), 사르코파가(*Sarcophaga*) 종, 시물룸 비타툼, 스토목시스 칼시트란스(*Stomoxys calcitrans*), 타바누스 보비누스, 타바누스 아트라투스(*Tabanus atratus*), 타바누스 리네올라(*Tabanus lineola*) 및 타바누스 시밀리스(*Tabanus similis*),
- <228> 이류 (프티랍테라(*Phthiraptera*)), 예를 들어 페디쿨루스 휴마누스 카피티스(*Pediculus humanus capitis*), 페디쿨루스 휴마누스 코르포리스(*Pediculus humanus corporis*), 프티루스 푸비스(*Phthirus pubis*), 하에마토피누스 에우리스테르누스(*Haematopinus eurysternus*), 하에마토피누스 수시스(*Haematopinus suis*), 리노그나투스 비툴리(*Linognathus vituli*), 보비콜라 보비스(*Bovicola bovis*), 메노폰 갈리나에(*Menopon gallinae*), 메나카투스 스트라미네우스(*Menacanthus stramineus*) 및 솔레노포테스 카필라투스(*Solenopotes capillatus*),
- <229> 진드기류 및 기생 좀진드기류 (파라시티포르메스(*Parasitiformes*)): 진드기 (익소디다(*Ixodida*)), 예를 들어 익소데스 스카폴라리스(*Ixodes scapularis*), 익소데스 홀로시클루스(*Ixodes holocyclus*), 익소데스 파시피쿠스(*Ixodes pacificus*), 리피세팔루스 산구이네우스(*Rhiphicephalus sanguineus*), 데르마센토르 안데르소니(*Dermacentor andersoni*), 데르마센토르 바리아빌리스(*Dermacentor variabilis*), 암블리오마 아메리카눔, 암블리오마 마쿨라툼(*Ambryomma maculatum*), 오르니토도루스 헤름시(*Ornithodoros hermsi*), 오르니토도루스 투리카

타(*Ornithodoros turicata*) 및 기생 흡진드기류 (메소스티그마타(*Mesostigmata*)), 예를 들어 오르니토니수스 바코티(*Ornithonyssus bacoti*) 및 데르마니수스 갈리나에,

- <230> 악티네디다(*Actinedida*) (전기문야목(*Prostigmata*)) 및 아카리디다(*Acaridida*) (무기문류아목(*Astigmata*)), 예를 들어 아카라피스(*Acarapis*) 종, 케일레티엘라(*Cheyletiella*) 종, 오르니토케일레티아(*Ornithocheyletia*) 종, 미오비아(*Myobia*) 종, 소레르가테스(*Psorergates*) 종, 데모텍스(*Demodex*) 종, 트롬비쿨라(*Trombicula*) 종, 리스트로포루스(*Listrophorus*) 종, 아카루스(*Acarus*) 종, 티로파구스(*Tyrophagus*) 종, 칼로글리푸스(*Caloglyphus*) 종, 히포텍테스(*Hypodectes*) 종, 테로리쿠스(*Pterolichus*) 종, 소로프테스(*Psoroptes*) 종, 코리오프테스(*Chorioptes*) 종, 오토텍테스(*Otodectes*) 종, 사르코프테스(*Sarcoptes*) 종, 노토에드레스(*Notoedres*) 종, 네미도코프테스(*Knemidocoptes*) 종, 시토디테스(*Cytodites*) 종 및 라미노시오프테스(*Laminosioptes*) 종,
- <231> 빈대류 (헤테로프테리다(*Heteropterida*)): 시멕스 렉툴라리우스(*Cimex lectularius*), 시멕스 헤미프테루스(*Cimex hemipterus*), 레두비우스 세닐리스(*Reduvius senilis*), 트리아토마(*Triatoma*) 종, 로드니우스(*Rhodnius*) 종, 판스트롱일루스(*Panstrongylus*) 아종 및 아틸루스 크리타투스(*Arilus critatus*),
- <232> 아노플루리다(*Anoplurida*), 예를 들어 하에마토미누스(*Haematopinus*) 종, 리노그나투스(*Linognathus*) 종, 페디쿠루스(*Pediculus*) 종, 프티루스(*Phthirus*) 종, 및 솔레노포테스(*Solenopotes*) 종,
- <233> 말로파기다(*Mallophagida*) (아른블리세리나(*Arnblycerina*) 및 이스크노세리나(*Ischnocerina*)의 아목), 예를 들어 트리메노폰(*Trimenopon*) 종, 메노폰(*Menopon*) 종, 트리노톤(*Trinoton*) 종, 보니콜라(*Bovicola*) 종, 웨르네키엘라(*Werneckiella*) 종, 레피켄트론(*Lepikentron*) 종, 트리코텍테스(*Trichodectes*) 종 및 펠리콜라(*Felicola*) 종,
- <234> 회충 선충류:
- <235> 와이프웜(wipeworm) 및 선모충 (트리코시링기다(*Trichosyringida*)), 예를 들어 트리키넬리다에(*Trichinellidae*) (트리키넬라(*Trichinella*) 종), (트리쿠리다에(*Trichuridae*)) 트리쿠리스(*Trichuris*) 종, 카필라리아(*Capillaria*) 종,
- <236> 원충목, 예를 들어 라브디티스(*Rhabditis*) 종, 스트롱일로이데스(*Strongyloides*) 종, 헬리세팔로부스(*Helicephalobus*) 종,
- <237> 스트롱일리다(*Strongylida*), 예를 들어 스트롱일루스(*Strongylus*) 종, 안실로스토타(*Ancylostoma*) 종, 네카토르 아메리카누스(*Necator americanus*), 부노스토뎀(*Bunostomum*) 종 (십이지장충), 트리코스트롱일루스(*Trichostrongylus*) 종, 하에몬쿠스 콘토르투스(*Haemonchus contortus*), 오스테르타기아(*Ostertagia*) 종, 코오페리아(*Cooperia*) 종, 네마토디루스(*Nematodirus*) 종, 디크티오카울루스(*Dictyocaulus*) 종, 시아토스토마(*Cyathostoma*) 종, 오에소파고스토뎀(*Oesophagostomum*) 종, 스테파누루스 덴타투스(*Stephanurus dentatus*), 올룰라누스(*Ollulanus*) 종, 카베르티아(*Chabertia*) 종, 스테파누루스 덴타투스(*Stephanurus dentatus*), 싱가무스트라케아(*Syngamus trachea*), 안실로스토타(*Ancylostoma*) 종, 운시나리아(*Uncinaria*) 종, 글로보세팔루스(*Globocephalus*) 종, 네카투르(*Necator*) 종, 메타스트롱일루스(*Metastrongylus*) 종, 무엘레리우르 카필라리스(*Muellerius capillaris*), 프로토스트롱일루스(*Protostrongylus*) 종, 안지오스트롱일루스(*Angiostrongylus*) 종, 파렐라포스트롱일루스(*Parelaphostrongylus*) 종, 알레우로스트롱일루스 아브스트루수스(*Aleurostrongylus abstrusus*) 및 디옥토피마 레날레(*Diocetophyma renale*),
- <238> 창자 회충 (아스카리디다(*Ascaridida*)), 예를 들어 아스카리스 룬브리코이데스(*Ascaris lumbricoides*), 아스카리스 수움(*Ascaris suum*), 아스카리디아 갈리(*Ascaridia galli*), 파라스카리스 에쿠오룸(*Parascaris equorum*), 엔테로비우스 베르미쿨라리스(*Enterobius vermicularis*) (선충), 톡소카라 카니스(*Toxocara canis*), 톡사스카리스 레오니네(*Toxascaris leonine*), 스크르자비네마(*Skrjabinema*) 종 및 옥시우리스 에퀴(*Oxyuris equi*),
- <239> 무순선충, 예를 들어 드라쿤쿨루스 메디넨시스(*Dracunculus medinensis*) (기니아충),
- <240> 선미선충목, 예를 들어 텔라지아(*Thelazia*) 종, 우케레리아(*Wuchereria*) 종, 브루기아(*Brugia*) 종, 온코세르카(*Onchocerca*) 종, 디로필라리(*Dirofilaria*) 종 a, 디페탈로네마(*Dipetalonema*) 종, 세타리아(*Setaria*) 종, 엘라에오폴라(*Elaeophora*) 종, 스피로세르카 루피(*Spirocerca lupi*) 및 하브로네마(*Habronema*) 종,
- <241> 구두충 (아칸토세팔라(*Acanthocephala*)), 예를 들어 아칸토세팔루스(*Acanthocephalus*) 종, 마크라칸토린쿠스 히루디나세우스(*Macracanthorhynchus hirudinaceus*) 및 온시콜라(*Oncicola*) 종,

- <242> 플라나리아 (플라텔민테스(*Plathelminthes*)):
- <243> 흡충 (트레마토다(*Trematoda*)), 예를 들어 파시올라(*Faciola*) 종, 파스시오로이테스 마그나(*Fascioloides magna*), 파라고니무스(*Paragonimus*) 종, 디크로코엘륨(*Dicrocoelium*) 종, 파스시오롭시스 부스키(*Fasciolopsis buski*), 클로노르키스 시넨시스(*Clonorchis sinensis*), 시스토소마(*Schistosoma*) 종, 트리코빌라르시아(*Trichobilharzia*) 종, 알라리아 알라타(*Alaria alata*), 파라고니무스(*Paragonimus*) 종 및 나노시에테스(*Nanocyetes*) 종,
- <244> 세르코메로모르파(*Cercomeromorpha*), 특히 조충류 (촌충), 예를 들어 디필로보트리움(*Diphyllobothrium*) 종, 테니아(*Tenia*) 종, 에키노코쿠스(*Echinococcus*) 종, 디필리둠 카니눔(*Dipylidium caninum*), 멀티셉스(*Multiceps*) 종, 히메놀레피스(*Hymenolepis*) 종, 메소세스토이테스(*Mesocestoides*) 종, 밤피롤레피스(*Vampirolepis*) 종, 모니에지아(*Moniezia*) 종, 아노플로세팔라(*Anoplocephala*) 종, 시로메트라(*Sirometra*) 종, 아노플로세팔라(*Anoplocephala*) 종 및 히메놀레피스(*Hymenolepis*) 종.
- <245> 화학식 I의 화합물 및 이를 함유하는 조성물은 덩테라, 시포나프테라 및 익소디다 목으로부터의 해충의 방제에 특히 유용하다.
- <246> 또한, 모기류 박멸을 위한 화학식 I의 화합물 및 이를 함유하는 조성물의 용도가 특히 바람직하다.
- <247> 파리류 박멸을 위한 화학식 I의 화합물 및 이를 함유하는 조성물의 용도가 본 발명의 추가의 바람직한 실시양태이다.
- <248> 또한, 벼룩류 박멸을 위한 화학식 I의 화합물 및 이를 함유하는 조성물의 용도가 특히 바람직하다.
- <249> 진드기류 박멸을 위한 화학식 I의 화합물 및 이를 함유하는 조성물의 용도가 본 발명의 추가의 바람직한 실시양태이다.
- <250> 화학식 I의 화합물은 또한 내부기생충 (회충, 선충, 구두충 및 플라나리아) 박멸에 특히 유용하다.
- <251> 투여는 예방적으로 및 치료적으로 둘 다로 수행될 수 있다.
- <252> 활성 화합물의 투여는 직접, 또는 경구로, 국소/피부로 또는 비경구로 적합한 제제의 형태로 수행된다.
- <253> 온혈 동물에 대한 경구 투여를 위해, 화학식 I의 화합물은 동물 사료, 동물 사료 예비혼합물, 동물 사료 농축물, 환제, 용액, 페이스트, 현탁액, 물약, 겔, 정제, 볼루스 및 캡슐로서 제제화될 수 있다. 또한, 화학식 I의 화합물을 동물의 음료수로 동물에게 투여할 수 있다. 경구 투여를 위해, 선택된 투여 형태는 동물에게 1일마다 동물 체중 1 kg 당 0.01 mg 내지 100 mg의 화학식 I의 화합물, 바람직하게는 1일마다 동물 체중 1 kg 당 0.5 mg 내지 100 mg의 화학식 I의 화합물을 제공하여야 한다.
- <254> 별법으로, 화학식 I의 화합물을, 비경구로, 예를 들어 정관내, 근육내, 정맥내 또는 피하 주사에 의해 동물에게 투여할 수 있다. 화학식 I의 화합물을 피하 주사를 위해 생리학상 허용되는 담체 중에 분산시키거나 용해시킬 수 있다. 별법으로, 화학식 I의 화합물을 피하 투여용 이식물로 제제화할 수 있다. 또한, 화학식 I의 화합물을 동물에게 경피 투여할 수 있다. 비경구 투여를 위해, 선택된 투여 형태는 동물에게 1일마다 동물 체중 1 kg 당 0.01 mg 내지 100 mg의 화학식 I의 화합물을 제공하여야 한다.
- <255> 화학식 I의 화합물은 또한, 덩(dip), 더스트, 분말, 칼라(collar), 메달, 스프레이, 샴푸, 스팟-온(spot-on) 및 푸어-온(pour-on) 제형 형태로, 또한 연고 또는 수중유 또는 유중수 에멀전으로 동물에게 국소 투여할 수 있다. 국소 투여를 위해, 덩 및 스프레이는 통상적으로 0.5 ppm 내지 5,000 ppm, 바람직하게는 1 ppm 내지 3,000 ppm의 화학식 I의 화합물을 함유한다. 또한, 화학식 I의 화합물은 동물, 특히 소 및 양과 같은 사지동물용 이어택(ear tag)으로서 제제화될 수 있다.
- <256> 적합한 제제는,
- <257> - 용액, 예컨대 경구용 용액, 희석 후 경구 투여하기 위한 농축물, 피부 상에 또는 체강 내에 사용하기 위한 용액, 푸어링-온 제형, 겔;
- <258> - 경구 또는 피부 투여용 에멀전 및 현탁액; 반고체 제제;
- <259> - 활성 화합물이 연고 기재 또는 수중유 또는 유중수 에멀전 기재 중에서 가공된 제형;
- <260> - 고체 제제, 예컨대 분말, 예비혼합물 또는 농축물, 과립, 펠릿, 정제, 볼루스, 캡슐; 에어로졸 및 흡입제 및

활성 화합물 함유 성형품이다.

- <261> 주사에 적합한 조성물은, 활성 성분을 적합한 용매 중에 용해시키고, 임의로 추가 성분, 예컨대 산, 염기, 완충제 염, 방부제 및 가용화제를 첨가하여 제조된다. 용액을 여과하고 멸균 충전한다.
- <262> 적합한 용매는 생리학상 허용되는 용매, 예컨대 물, 알칸올, 예컨대 에탄올, 부탄올, 벤질 알콜, 글리세롤, 프로필렌 글리콜, 폴리에틸렌 글리콜, N-메틸-피롤리돈, 2-피롤리돈 및 이들의 혼합물이다.
- <263> 활성 화합물은 임의로는, 주사에 적합한 생리학상 허용되는 식물성 또는 합성 오일 중에 용해될 수 있다.
- <264> 적합한 가용화제는 주용매 중의 활성 화합물의 용해를 촉진시키고 그의 침전을 방지하는 용매이다. 그 예는 폴리비닐피롤리돈, 폴리비닐 알콜, 폴리옥시에틸화 피마자유, 및 폴리옥시에틸화 소르비탄 에스테르이다.
- <265> 적합한 방부제는 벤질 알콜, 트리클로로부탄올, p-히드록시벤조산 에스테르 및 n-부탄올이다.
- <266> 경구용 용액은 직접 투여한다. 농축물은 먼저 사용 농도로 희석한 후에 경구 투여된다. 경구용 용액 및 농축물은 당분야의 현황에 따라, 또한 주사 용액에 대해 상기한 바와 같이 제조되며, 멸균 절차는 필수적이지 않다.
- <267> 피부 상에 사용하기 위한 용액은 점적, 분산, 문지름, 스프링클링(sprinkling) 또는 분무된다.
- <268> 피부 상에 사용하기 위한 용액은 당분야의 현황에 따라, 또한 주사 용액에 대해 상기한 바에 따라 제조되며, 멸균 절차는 필수적이지 않다.
- <269> 추가의 적합한 용매는 폴리프로필렌 글리콜, 페닐 에탄올, 페녹시 에탄올, 에스테르, 예컨대 에틸 또는 부틸 아세테이트, 벤질 벤조에이트, 에테르, 예컨대 알킬렌글리콜 알킬에테르, 예를 들어 디프로필렌글리콜 모노메틸에테르, 케톤, 예컨대 아세톤, 메틸에틸케톤, 방향족 탄화수소, 식물성유 및 합성 오일, 디메틸포름아미드, 디메틸아세트아미드, 트랜스큐톨, 솔케탈, 프로필렌카르보네이트 및 이들의 혼합물이다.
- <270> 제조 동안 증점제를 첨가하는 것이 유리할 수 있다. 적합한 증점제는 무기 증점제, 예컨대 벤토나이트, 콜로이드 규산, 알루미늄 모노스테아레이트, 유기 증점제, 예컨대 셀룰로스 유도체, 폴리비닐 알콜 및 그의 공중합체, 아크릴레이트 및 메타크릴레이트이다.
- <271> 겔은 피부 상에 도포되거나 피부 상에 분산되거나, 또는 체강내에 도입된다. 겔은 주사 용액의 경우에서 기재된 바와 같이 제조된 용액을 충분한 증점제로 처리하여 연고 유사 점조도를 갖는 투명한 물질을 형성함으로써 제조된다. 사용되는 증점제는 상기 주어진 증점제이다.
- <272> 푸어-온 제형은 피부의 제한된 영역 상에 푸어링되거나 분무되어, 활성 화합물이 피부로 침투되어 전신 작용한다.
- <273> 푸어-온 제형은 활성 화합물을 적합한 피부-상용성 용매 또는 용매 혼합물 중에 용해, 현탁 또는 유화시킴으로써 제조된다. 적절한 경우, 기타 보조제, 예컨대 착색제, 생체흡수-촉진 물질, 향산화제, 광 안정화제, 접착제를 첨가한다.
- <274> 적합한 용매는, 물, 알칸올, 글리콜, 폴리에틸렌 글리콜, 폴리프로필렌 글리콜, 글리세롤, 방향족 알콜, 예컨대 벤질 알콜, 페닐에탄올, 페녹시에탄올, 에스테르, 예컨대 에틸 아세테이트, 부틸 아세테이트, 벤질 벤조에이트, 에테르, 예컨대 알킬렌 글리콜 알킬 에테르, 예컨대 디프로필렌 글리콜 모노메틸 에테르, 디에틸렌 글리콜 모노-부틸 에테르, 케톤, 예컨대 아세톤, 메틸 에틸 케톤, 시클릭 카르보네이트, 예컨대 프로필렌 카르보네이트, 에틸렌 카르보네이트, 방향족 및/또는 지방족 탄화수소, 식물성 또는 합성 오일, DMF, 디메틸아세트아미드, n-알킬피롤리돈, 예컨대 메틸피롤리돈, n-부틸피롤리돈 또는 n-옥틸피롤리돈, N-메틸피롤리돈, 2-피롤리돈, 2,2-디메틸-4-옥시-메틸렌-1,3-디옥솔란 및 글리세롤 포르말이다.
- <275> 적합한 착색제는 동물 상에 사용할 수 있고 용해 또는 현탁가능한 모든 착색제이다.
- <276> 적합한 흡수-촉진 물질은, 예를 들어, DMSO, 분산 오일, 예컨대 이소프로필 미리스테이트, 디프로필렌 글리콜 펠라르그네이트, 실리콘 오일 및 그의 폴리에테르, 지방산 에스테르, 트리글리세리드, 지방 알콜과의 공중합체이다.
- <277> 적합한 향산화제는 술파이트 또는 메타비술파이트, 예컨대 칼륨 메타비술파이트, 아스코르브산, 부틸히드록시톨루엔, 부틸히드록시아니솔, 토크페롤이다.
- <278> 적합한 광 안정화제는, 예를 들어 노반티솔산이다.

- <279> 적합한 접착제는, 예를 들어 셀룰로스 유도체, 전분 유도체, 폴리아크릴레이트, 천연 중합체, 예컨대 알기네이트, 젤라틴이다.
- <280> 에멀전은 경구로, 피부로 또는 주사액으로서 투여할 수 있다.
- <281> 에멀전은 유중수 유형 또는 수중유 유형이다.
- <282> 이는 활성 화합물을 소수성 또는 친수성 상 중에 용해시키고, 적합한 유화제의 도움 하에 다른 상의 용매, 및 적절한 경우 기타 보조제, 예컨대 착색제, 흡수-촉진 물질, 방부제, 항산화제, 광 안정화제, 점도 향상 물질과 함께 균질화함으로써 제조된다.
- <283> 적합한 소수성 상 (오일)은,
- <284> 액체 파라핀, 실리콘 오일, 천연 식물성 오일, 예컨대 참깨씨유, 아몬드유, 피마자유, 합성 트리글리세리드, 예컨대 카프릴/카프르 비글리세리드, 트리글리세리드의 C₈-C₁₂의 쇠 길이를 갖는 식물성 지방산 또는 기타 특정 선택된 천연 지방산과의 혼합물, 포화 또는 불포화 지방산 (또한 히드록실기를 함유할 수 있음)의 부분 글리세리드 혼합물, C₈-C₁₀ 지방산의 모노- 및 디글리세리드, 지방산 에스테르, 예컨대 에틸 스테아레이트, 디-n-부틸 아디페이트, 헥실 라우레이트, 디프로필렌 글리콜 퍼라르고네이트, 중쇄 길이를 갖는 분지된 지방산과 C₁₆-C₁₈의 쇠 길이를 갖는 포화 지방 알코올의 에스테르, 이소프로필 미리스테이트, 이소프로필 팔미테이트, C₁₂-C₁₈의 쇠 길이를 갖는 포화 지방 알코올의 카프릴산/카프르산 에스테르, 이소프로필 스테아레이트, 올레일 올레에이트, 데실 올레에이트, 에틸 올레에이트, 에틸 락테이트, 왁스상 지방산 에스테르, 예컨대 합성 오리 미콜샘 지방, 디부틸 프탈레이트, 디이소프로필 아디페이트, 및 후자에 관련된 에스테르 혼합물, 지방 알코올, 예컨대 이소트리데실 알코올, 2-옥틸도데칸올, 세틸스테아릴 알코올, 올레일 알코올, 및 지방산, 예컨대 올레산 및 이들의 혼합물이다.
- <285> 적합한 친수성 상은 물, 알코올, 예컨대 프로필렌 글리콜, 글리세롤, 소르비톨 및 이들의 혼합물이다.
- <286> 적합한 유화제는,
- <287> 비이온성 계면활성제, 예를 들어 폴리에톡실화 피마자유, 폴리에톡실화 소르비탄 모노올레에이트, 소르비탄 모노스테아레이트, 글리세롤 모노스테아레이트, 폴리옥시에틸 스테아레이트, 알킬페놀 폴리글리콜 에테르;
- <288> 양쪽성 계면활성제, 예컨대 이나트륨 N-라우릴-p-이미노디프로피오네이트 또는 레시틴;
- <289> 음이온성 계면활성제, 예컨대 나트륨 라우릴 술페이트, 지방 알코올 에테르 술페이트, 모노/디알킬 폴리글리콜 에테르 오르토인산 에스테르 모노에탄올아민염;
- <290> 양이온-활성 계면활성제, 예컨대 세틸트리메틸암모늄 클로라이드이다.
- <291> 적합한 추가의 보조제는, 점도를 향상시키고 에멀전을 안정화시키는 물질, 예컨대 카르복시메틸셀룰로스, 메틸셀룰로스 및 기타 셀룰로스 및 전분 유도체, 폴리아크릴레이트, 알기네이트, 젤라틴, 아라비아 검, 폴리비닐피롤리돈, 폴리비닐 알코올, 메틸 비닐 에테르 및 말레산 무수물의 공중합체, 폴리에틸렌 글리콜, 왁스, 콜로이드성 규산 또는 상기 언급된 물질의 혼합물이다.
- <292> 현탁액은 경구로 또는 국소/피부로 투여할 수 있다. 이들은 활성 화합물을 현탁화제 중에 현탁시키고, 적절한 경우 기타 보조제, 예컨대 습윤제, 착색제, 생체흡수-촉진 물질, 방부제, 항산화제, 광 안정화제를 첨가함으로써 제조된다.
- <293> 액체 현탁화제는 모든 균질 용매 및 용매 혼합물이다.
- <294> 적합한 습윤제 (분산제)는 상기 주어진 유화제이다.
- <295> 언급될 수 있는 기타 보조제는 상기 주어진 것들이다.
- <296> 반고체 제제는 경구로 또는 국소/피부로 투여할 수 있다. 이들은 단지 그의 고점도에 의해 상기한 현탁액 및 에멀전과 상이하다.
- <297> 고체 제제의 제조를 위해서는, 활성 화합물을 적합한 부형제와, 적절한 경우 보조제를 첨가하여 혼합하여, 원하는 형태를 형성한다.
- <298> 적합한 부형제는 모든 생리학상 허용되는 고체 불활성 물질이다. 사용되는 것들은 무기 및 유기 물질이다. 무기 물질은, 예를 들어, 염화나트륨, 탄산염, 예컨대 탄산칼슘, 탄산수소염, 산화알루미늄, 산화티타늄, 규산,

점토질토(argillaceous earth), 침전 또는 콜로이드 실리카, 또는 포스페이트이다. 유기 물질은, 예를 들어, 당, 셀룰로스, 식료품 및 사료, 예컨대 분유, 동물식, 곡식 및 단편(shred), 전분이다.

- <299> 적합한 보조제는, 상기 언급된 방부제, 항산화제 및/또는 착색제이다.
- <300> 기타 적합한 보조제는 윤활제 및 활택제, 예컨대 마그네슘 스테아레이트, 스테아르산, 활석, 벤토나이트, 봉쇄-촉진 물질, 예컨대 전분 또는 가교 폴리비닐피롤리돈, 결합제, 예컨대 전분, 젤라틴 또는 선형 폴리비닐피롤리돈, 및 건조 결합제, 예컨대 미세결정 셀룰로스이다.
- <301> 일반적으로, "기생충 유효량"은, 피사, 사멸, 지연, 예방, 및 제거, 파괴, 또는 다른 방식의 표적 유기체의 출현 및 활성 감소의 효과를 포함한 성장에 대한 가시적인 효과를 달성하기 위해 필요한 활성 성분의 양을 의미한다. 기생충 유효량은 본 발명에서 사용되는 다양한 화합물/조성물에 대해 다양할 수 있다. 조성물의 구충 유효량은 또한, 주요 조건, 예컨대 요망되는 살기생충 효과 및 지속기간, 표적종, 적용 방식 등에 따라 다양할 것이다.
- <302> 본 발명에서 사용될 수 있는 조성물은 일반적으로 약 0.001 내지 95%의 화학식 I의 화합물을 포함할 수 있다.
- <303> 일반적으로, 화학식 I의 화합물을 1일마다 1 kg 당 0.5 mg 내지 100 mg, 바람직하게는 1일마다 1 kg 당 1 mg 내지 50 mg의 총량으로 적용하는 것이 유리하다.
- <304> 즉시 사용가능한 제제는 기생충, 바람직하게는 외부기생충에 대해 작용하는 화합물을 10 ppm 내지 80 중량%, 바람직하게는 0.1 내지 65 중량%, 보다 바람직하게는 1 내지 50 중량%, 가장 바람직하게는 5 내지 40 중량%의 농도로 함유한다.
- <305> 사용 전에 희석되는 제제는 외부기생충에 대해 작용하는 화합물을 0.5 내지 90 중량%, 바람직하게는 1 내지 50 중량%의 농도로 함유한다.
- <306> 또한, 제제는 내부기생충에 대한 화학식 I의 화합물을 10 ppm 내지 2 중량%, 바람직하게는 0.05 내지 0.9 중량%, 매우 특히 바람직하게는 0.005 내지 0.25 중량%의 농도로 함유한다.
- <307> 본 발명의 바람직한 실시양태에서는, 화학식 I의 화합물을 포함하는 조성물을 피부/국소로 투여한다.
- <308> 추가의 바람직한 실시양태에서, 국소 투여는 화합물 함유 성형품, 예컨대 갈라, 메달, 이어 텍, 신체 일부에 고정시키기 위한 밴드 및 접착제 스트립 및 호일 의 형태로 수행된다.
- <309> 일반적으로, 화학식 I의 화합물을 3주 동안 처치 동물 체중 1 kg 당 10 mg 내지 300 mg, 바람직하게는 20 mg 내지 200 mg, 가장 바람직하게는 25 mg 내지 160 mg의 총량으로 방출하는 고체 제형을 적용하는 것이 유리하다.
- <310> 성형품의 제조를 위해, 열가소성 및 가요성 플라스틱 뿐만 아니라 엘라스토머 및 열가소성 엘라스토머를 사용한다. 적합한 플라스틱 및 엘라스토머는, 화학식 I의 화합물과 충분히 상용성인 폴리비닐 수지, 폴리우레탄, 폴리아크릴레이트, 에폭시 수지, 셀룰로스, 셀룰로스 유도체, 폴리아미드 및 폴리에스테르이다. 플라스틱 및 엘라스토머의 상세한 목록 뿐만 아니라 성형품의 제조 절차는, 예를 들어 제WO 03/086075호에 기재되어 있다.
- <311> 종자 처리
- <312> 화학식 I의 화합물은 또한, 종자를 곤충 해충, 특히 토양-생활 곤충 해충으로부터 보호하고, 생성된 식물 뿌리 및 묘조를 토양 해충 및 엽상 곤충류로부터 보호하기 위한 종자 처리에 적합하다.
- <313> 화학식 I의 화합물은 종자를 토양 해충으로부터 보호하고, 생성된 식물 뿌리 및 묘조를 토양 해충 및 엽상 곤충류로부터 보호하는데 특히 유용하다. 생성된 식물 뿌리 및 묘조의 보호가 바람직하다. 생성된 식물 묘조를 관통 및 흡즙 곤충류로부터 보호하는 것이 보다 바람직하며, 진딧물로부터의 보호가 가장 바람직하다.
- <314> 따라서, 본 발명은 종자를 파종 전 및/또는 예비발아 후 화학식 I의 화합물 또는 그의 염과 접촉시키는 것을 포함하는, 종자를 곤충류, 특히 토양 곤충류로부터 보호하고, 묘목의 뿌리 및 묘조를 곤충류, 특히 토양 및 엽상 곤충류로부터 보호하는 방법을 포함한다. 식물의 뿌리 및 묘조를 보호하는 방법이 특히 바람직하고, 식물 묘조를 관통 및 흡즙 곤충류로부터 보호하는 방법이 보다 바람직하며, 식물 묘조를 진딧물로부터 보호하는 방법이 가장 바람직하다.
- <315> 용어 종자는 진정 종자(true seed), 종자 일부, 포기(sucker), 구경, 구근, 과실, 덩이줄기, 낱알, 삼목(cutting), 삼묘조(cut shoot) 등을 포함한 (이에 제한되지는 않음) 종자 및 모든 종류의 식물 번식체

(propagule)를 포함하고, 바람직한 실시양태에서는 진정 종자를 의미한다.

- <316> 용어 종자 처리는 종자 드레싱, 종자 코팅, 종자 살분, 종자 침지 및 종자 펠렛화 등의 당업계에 공지된 모든 적합한 종자 처리 기술을 포함한다.
- <317> 본 발명은 또한 활성 화합물로 코팅되거나 이를 함유하는 종자를 포함한다.
- <318> 용어 "~로 코팅되고/거나 이를 함유하는"은 일반적으로, 활성 성분이 적용시에 증식 생성물의 표면 상의 대부분에 존재하지만, 성분의 보다 많거나 적은 부분은 적용 방법에 따라 증식 생성물내로 침투될 수 있음을 의미한다. 상기 증식 생성물이 (재)식재된 경우, 이는 활성 성분을 흡수할 수 있다.
- <319> 적합한 종자는 곡식, 뿌리 작물, 유료 작물, 채소류, 향신료, 관상식물의 종자, 예를 들어 듀럼 및 기타 밀, 보리, 귀리, 호밀, 옥수수 (사료 옥수수 및 당 옥수수/및 사탕 옥수수 및 사료용 옥수수), 대두, 유료 작물, 십자화과식물, 목화, 해바라기, 바나나, 쌀, 지방종자 평지, 순무 평지, 사탕무, 사료용 사탕무, 가지, 감자, 풀, 소형잔디, 대형잔디, 사료용 풀, 토마토, 부추, 호박(pumpkin/squash), 양배추, 양상추, 후추, 오이, 멜론, 브라시카(Brassica) 종, 멜론, 콩, 완두, 마늘, 양파, 당근, 덩이줄기 식물, 예컨대 감자, 사탕수수, 담배, 포도, 페튜니아, 제라늄/양아욱속, 팬지 및 봉선화의 종자이다.
- <320> 또한, 활성 화합물을 유전자 조작 방법을 포함한 육종으로 인해 제조제 또는 살진균제 또는 살충제의 작용에 대해 내성을 갖는 식물로부터의 종자 처리에 사용할 수도 있다.
- <321> 예를 들어, 활성 화합물을 스폴포닐우레아, 이미다졸리논, 글루포시네이트-암모늄 또는 글리포세이트-이소프로필 암모늄 및 유사 활성 성분으로 구성된 군으로부터의 제조제에 대해 내성을 갖는 식물로부터의 종자 처리에 (예를 들어, 제EP-A-0242236호, 제EP-A-242246호) (제WO 92/00377호) (제EP-A-0257993호, 미국 특허 제5,013,659호), 또는 식물이 특정 해충에 대해 내성을 갖도록 하는 바실리우스 투린지엔시스(*Bacillus thuringiensis*) 독소 (Bt 독소) 생성능을 갖는 형질전환 작물 식물, 예를 들어 목화에 (제EP-A-0142924호, 제EP-A-0193259호) 사용할 수 있다.
- <322> 또한, 활성 화합물은, 예를 들어 전형적인 육종 방법 및/또는 돌연변이 생성에 의해, 또는 재조합 방법에 의해 생성될 수 있는, 기존 식물이 갖는 것과 비교되는 변형된 특징을 갖는 식물로부터의 종자 처리에 사용할 수도 있다. 예를 들어, 식물에서 합성된 전분을 변형시키기 위한 작물 식물의 재조합 변형에 대해 (예를 들어, 제WO 92/11376호, 제WO 92/14827호, 제WO 91/19806호) 또는 개질된 지방산 조성물을 갖는 형질전환 작물 식물에 대해 (제WO 91/13972호) 많은 경우가 기재되어 있다.
- <323> 활성 화합물의 종자 처리 적용은 식물의 파종 전 및 식물의 발아 전에 분무 또는 살분에 의해 수행된다.
- <324> 종자 처리에서, 상응하는 제형은 종자를 유효량의 활성 화합물로 처리함으로써 적용된다. 여기서, 활성 화합물의 적용률은 일반적으로 종자 100 kg 당 0.1 g 내지 10 kg, 바람직하게는 종자 100 kg 당 1 g 내지 5 kg, 특히 종자 100 kg 당 1 g 내지 2.5 kg이다. 특정 작물, 예컨대 양배추는 적용률이 더 높을 수 있다.
- <325> 종자 처리에 특히 유용한 조성물은 예를 들어 하기와 같다:
- <326> A 가용성 농축물 (SL, LS)
- <327> D 에멀전 (EW, EO, ES)
- <328> E 현탁액 (SC, OD, FS)
- <329> F 수분산성 과립 및 수용성 과립 (WG, SG)
- <330> G 수분산성 분말 및 수용성 분말 (WP, SP, WS)
- <331> H 겔 제형 (GF)
- <332> I 살분가능한 분말 (DP, DS)
- <333> 통상적인 종자 처리 제형은 예를 들어 유동성 농축물 FS, 용액 LS, 건조 처리를 위한 분말 DS, 슬러리 처리를 위한 수분산성 분말 WS, 수용성 분말 SS 및 에멀전 ES 및 EC, 및 겔 제형 GF를 포함한다. 이들 제형은 희석되거나 희석되지 않고 종자에 적용될 수 있다. 종자에의 적용은 파종 전에, 종자 상에 직접, 또는 종자를 예비발아시킨 후 수행한다.
- <334> 바람직한 실시양태에서, FS 제형이 종자 처리에 사용된다. 전형적으로, FS 제형은 1 내지 800 g/L의 활성

성분, 1 내지 200 g/L의 계면활성제, 0 내지 200 g/L의 동결방지제, 0 내지 400 g/L의 결합제, 0 내지 200 g/L의 안료 및 1 L 이하의 용매, 바람직하게는 물을 포함할 수 있다.

<335> 종자 처리를 위한 화학식 I의 화합물의 바람직한 FS 제형은 통상적으로, 0.1 내지 80 중량% (1 내지 800 g/L)의 활성 성분, 0.1 내지 20 중량% (1 내지 200 g/L)의 하나 이상의 계면활성제, 예를 들어 0.05 내지 5 중량%의 습윤제 및 0.5 내지 15 중량%의 분산제, 20 중량% 이하, 예를 들어 5 내지 20%의 동결방지제, 0 내지 15 중량%, 예를 들어 1 내지 15 중량%의 안료 및/또는 염료, 0 내지 40 중량%, 예를 들어 1 내지 40 중량%의 결합제 (고착제/접착제), 임의로 5 중량% 이하, 예를 들어 0.1 내지 5 중량%의 증점제, 임의로 0.1 내지 2%의 소포제, 및 임의로 예를 들어 0.01 내지 1 중량%의 양의 방부제, 예컨대 살생제, 항산화제 등, 및 100 중량% 이하의 충전제/비히클을 포함한다.

<336> 종자 처리 제형은 추가로 결합제 및 임의로는 착색제를 포함할 수도 있다.

<337> 결합제는 처리 후 활성 물질의 종자 상에의 접촉을 개선하기 위해 첨가될 수 있다. 적합한 결합제는 블록 공중합체 EO/PO 계면활성제 뿐만 아니라 폴리비닐알콜, 폴리비닐피롤리돈, 폴리아크릴레이트, 폴리메타크릴레이트, 폴리부텐, 폴리이소부틸렌, 폴리스티렌, 폴리에틸렌아민, 폴리에틸렌아미드, 폴리에틸렌이민 (루파솔(Lupasol)®), 폴리민(Polymin)®, 폴리에테르, 폴리우레탄, 폴리비닐아세테이트, 킬로스 및 이들 중합체로부터 유도된 공중합체이다.

<338> 임의로는, 착색제가 제형에 포함될 수도 있다. 종자 처리 제형에 적합한 착색제 또는 염료는, 로다민 (Rhodamin) B, 씨.아이. 피그먼트(C.I. Pigment) 레드 112, 씨.아이. 솔벤트(C.I. Solvent) 레드 1, 피그먼트 블루 15:4, 피그먼트 블루 15:3, 피그먼트 블루 15:2, 피그먼트 블루 15:1, 피그먼트 블루 80, 피그먼트 옐로우 1, 피그먼트 옐로우 13, 피그먼트 레드 112, 피그먼트 레드 48:2, 피그먼트 레드 48:1, 피그먼트 레드 57:1, 피그먼트 레드 53:1, 피그먼트 오렌지 43, 피그먼트 오렌지 34, 피그먼트 오렌지 5, 피그먼트 그린 36, 피그먼트 그린 7, 피그먼트 화이트 6, 피그먼트 브라운 25, 베이직(basic) 바이올렛 10, 베이직 바이올렛 49, 애시드(acid) 레드 51, 애시드 레드 52, 애시드 레드 14, 애시드 블루 9, 애시드 옐로우 23, 베이직 레드 10, 베이직 레드 108이다.

<339> 겔화제의 예는 캐라긴 (사티아겔(Satiage1)®)이다.

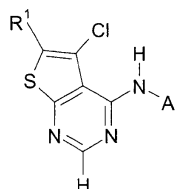
<340> 종자의 처리에서, 화합물 I의 적용률은 일반적으로 종자 100 kg 당 0.1 g 내지 10 kg, 바람직하게는 종자 100 kg 당 1 g 내지 5 kg, 특히 종자 100 kg 당 1 g 내지 1000 g이다.

<341> 따라서, 본 발명은 또한, 본원에 정의된 바와 같은 화학식 I의 화합물 또는 화합물 I의 농업상 유용한 염을 포함하는 종자에 관한 것이다. 화합물 I 또는 그의 농업상 유용한 염의 양은 일반적으로 종자 100 kg 당 0.1 g 내지 10 kg, 바람직하게는 종자 100 kg 당 1 g 내지 5 kg, 특히 종자 100 kg 당 1 g 내지 1000 g으로 다양할 것이다.

<342> 이제, 본 발명을 하기 실시예에 의해 보다 상세하게 예시한다.

<343> 본 발명에 따른 방법에서 사용하기 위한 화학식 I*의 화합물의 바람직한 화합물의 몇몇 예는 하기 표 C에서 그의 용점을 특징으로 한다.

<344> <화학식 I*>



<345>

표 C

화합물 n°	R ¹	A1			A2			A3 R ¹⁰	물리적 데이터: T _{mp} (융점) [°C]
		R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹		
C.1	H				H	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂		84-87
C.2	H				H	CH ₃	OCF ₃		79-80
C.3	H				H	CH ₃	OCHF ₂		102-103

<346>

화합물 n°	R ¹	A1			A2			A3 R ¹⁰	물리적 데이터: T _{mp} (융점) [°C]
		R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹		
C.4	H				H	C ₂ H ₅	OCF ₂ CHFC F ₃		오일
C.5	H	H	H	OCF ₃					77-79
C.6	H							시스-C(CH ₃) ₃	107-109
C.7	H							시스- CH(CH ₃)C ₂ H ₅	70-73
C.8	H							트랜스-CF ₃	수지
C.9	H							트랜스- CH ₂ CH ₂ CF ₃	수지
C.10	H							시스-CF ₃	105-109
C.11	H							CH ₂ CH ₂ CF ₃	수지
C.12	CHO							시스-C(CH ₃) ₃	90-91
C.13	CHCl ₂							시스-C(CH ₃) ₃	178-185
C.14	CH ₃							시스-C(CH ₃) ₃	128-133
C.15	CH ₃				H	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂		수지
C.16	CH ₃				H	CH ₃	OCF ₃		68-72
C.17	CH ₃				H	CH ₃	OCHF ₂		77-81
C.18	CH ₃							시스- CH(CH ₃)C ₂ H ₅	오일
C.19	CH ₃	H	H	OCF ₃					73-77
C.20	CH ₃							트랜스-CH ₂ CH ₂ CF ₃	130-135
C.21	CH(OCH ₃) ₂							시스-C(CH ₃) ₃	오일
C.22	CHCH ₂							시스-C(CH ₃) ₃	114-127
C.23	CH=N-OH							시스-C(CH ₃) ₃	214-215
C.24	CH=N-OCH ₃							시스-C(CH ₃) ₃	수지 (E- 이성질체)
C.25	CH=N-OCH ₃							시스-C(CH ₃) ₃	90-93 (E/Z- 이성질체 2:1)
C.26	CN							시스-C(CH ₃) ₃	160-166

<347>

화합물 n°	R ¹	A1			A2			A3 R ¹⁰	물리적 데이터: T _{mp} (융점) [°C]
		R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹		
C.27	CH=N-OC ₂ H ₅							시스-C(CH ₃) ₃	146-157 (E- 이성질체)
C.28	CH=N-OC ₂ H ₅							시스-C(CH ₃) ₃	수지 (E/Z- 이성질체 2:1)
C.29	C ₂ H ₅							시스-C(CH ₃) ₃	70-75
C.30	C ₂ H ₅				H	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂		오일
C.31	C ₂ H ₅				H	CH ₃	OCF ₃		오일
C.32	C ₂ H ₅				H	CH ₃	OCHF ₂		오일
C.33	C ₂ H ₅							시스- CH(CH ₃)C ₂ H ₅	오일

<348>

실시예

<349>

합성 실시예

<350>

S.1 (5-클로로-티에노[2,3-d]피리미딘-4-일)-[1-(4-트리플루오로메톡시-페닐)-에틸]-아민 (화합물 실시예 C.2)

<351>

4,5-디클로로-티에노-[2,3-d]-피리미딘 0.5 g (2.4 mmol)을 톨루올 25 ml에 용해하였다. 후속적으로, 트리에틸아민 0.29 g (2.7 mmol), 테트라부틸-암모늄요오다이드 촉매량 및 (S)-1-(4-트리플루오로메톡시페닐)-에틸아민 0.5 g (2.5 mmol)을 첨가하였다. 용액을 환류하에 4시간 동안 가열하고, 추가 12시간 동안 실온에서 교반하였다. 용매를 증류하고, 잔류물을 CH₂Cl₂에서 회수하고, 2N HCl 및 H₂O로 세척하였다. 잔류물을 플래시 크로마토그래피에 의해 세정하고, 건조시키고, 농축시켰다. 수득된 화합물 C.3은 수율이 0.5 g (1.4 mmol, 이론적인 수율 56%)이고, 79 내지 80°C의 융점 T_{mp}을 갖는다.

¹H-NMR (CDCl₃): 8.45 (s, 1H), 7.45 (d, 2H), 7.20 (d, 2H), 7.10 (s, 1H), 6.80 (d, 1H), 5.55 (t, 1H), 1.65 (d, 3H);

<352>

<353>

S.2 시스-(4-tert-부틸-시클로헥실)-(5-클로로-티에노[2,3-d]피리미딘-4-일)-아민 (화합물 실시예 C.6)

<354>

4,5-디클로로-티에노-[2,3-d]-피리미딘 2 g (9.7 mmol)을 톨루올 25 ml에 용해하였다. 후속적으로, 트리에틸아민 1.1 g (10.7 mmol), 테트라부틸-암모늄요오다이드 촉매량 및 시스-4-t-부틸시클로헥실아민 1.6 g (10.2 mmol)을 첨가하였다. 용액을 환류하에 8시간 동안 가열하고, 추가 12시간 동안 실온에서 교반하였다. 용매를 증류하고, 잔류물을 CH₂Cl₂에서 회수하고, 2N HCl 및 H₂O로 세척하였다. 잔류물을 플래시 크로마토그래피에 의해 세정하고, 건조시키고, 농축시켰다. 수득된 화합물 C.6은 수율이 2.2 g (6.8 mmol, 이론적인 수율 70%)이고, 107 내지 109°C의 융점 T_{mp}을 갖는다.

¹H-NMR (CDCl₃): 8.45 (s, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.90 (m, 1H), 4.55 (m, 1H), 2.05 (d, 2H), 1.75 (m, 2H), 1.60 (m, 2H), 1.30-1.10 (m, 3H), 0.90 (s, 9H)

<355>

<356>

S.3. (5-클로로-티에노[2,3-d]피리미딘-4-일)-[2-(4-트리플루오로메톡시-페닐)-에틸]-아민 (화합물 실시예 C.5)

<357>

4,5-디클로로-티에노-[2,3-d]-피리미딘 0.5 g (2.4 mmol)을 톨루올 20 ml에 용해하였다. 후속적으로, 트리에틸아민 0.271 g (2.7 mmol), 테트라부틸-암모늄요오다이드 촉매량 및 2-(4-트리플루오로메톡시페닐)-에틸아민 0.55 g (2.7 mmol)을 첨가하였다. 용액을 환류하에 6시간 동안 가열하고, 추가 12시간 동안 실온에서 교반하였다. 용매를 증류하고, 잔류물을 CH₂Cl₂에서 회수하고, 2N HCl 및 H₂O로 세척하였다. 잔류물을 교반하고, 헥산으로 흡입하고, 건조시키고, 농축시켰다. 수득된 화합물 C.5은 수율이 0.73 g (1.9 mmol, 이론적인 수율 76%)이고, 77 내지 79°C의 융점 T_{mp}을 갖는다.

¹H-NMR (CDCl₃): 8.50 (s, 1H), 7.25 (d, 2H), 7.15 (d, 2H), 7.05 (s, 1H), 6.55 (bs, 1H), 3.90 (t, 2H), 3.00 (t, 2H);

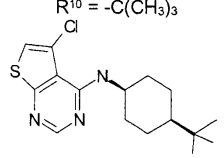
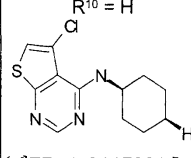
- <358>
- <359> 해충에 대한 생물학적 작용의 실시예
- <360> 하기 시험에서, 달리 언급이 없다면, 몇몇 화합물 실시예의 제제화된 용액을 300 ppm의 활성 성분 농도로 희석하고, 희석된 용액을 하기 언급된 시험에 적용하였다.
- <361> B.1. 목화 진딧물 (아피스 고시피이), 혼합된 생활 단계
- <362> 활성 화합물을 50:50 아세톤:물 및 100 ppm 키네틱(Kinetic)TM 계면활성제에서 제제화하였다.
- <363> 떡잎기의 목화 식물을 처리 전에 주요 진딧물 집락으로부터 많이 침입된 잎을 각 떡잎의 상부에 위치시킴으로써 침입시켰다. 진딧물이 밤새 이동하도록 방지하고, 숙주 잎을 제거하였다. 그 후, 침입된 떡잎을 침지시키고, 시험 용액에서 3초 동안 진탕하고, 흡 후드에서 건조시켰다. 시험 식물을 24-hr 광주기에서 25°C 및 20-40% 상대 습도에서 형광하에 유지하였다. 처리된 식물 상의 진딧물 사멸률을 미처리된 대조군 식물에 대한 사멸률과 비교하여 5일 후에 결정하였다.
- <364> 상기 시험에서, 화합물 실시예 1 내지 7, 9, 10, 11 및 16 내지 19는 100 ppm에서 미처리된 대조군에 비해 목화 진딧물 (아피스 고시피이, 혼합된 생활 단계)의 90% 이상의 사멸률을 나타내었다.
- <365> B.2. 복숭아혹 진딧물 (미주스 페르시카에(*Myzus persicae*)), 혼합된 생활 단계
- <366> 제1 본잎 단계의 피망 식물을 처리 전에 주요 진딧물 집락으로부터 많이 침입된 잎을 처리 식물의 상부에 위치시킴으로써 침입시켰다. 진딧물이 밤새 이동하도록 방지하여, 식물 당 30 내지 40마리의 진딧물 침입을 성취하고, 숙주 잎을 제거하였다. 그 후, 시험 식물의 침입된 떡잎을 침지시키고, 시험 용액에서 3초 동안 진탕하고, 흡 후드에서 건조시켰다. 시험 식물을 24-hr 광주기에서 25°C 및 20-40% 상대 습도에서 형광하에 유지하였다. 처리된 식물 상의 진딧물 사멸률을 미처리된 대조군 식물에 대한 사멸률과 비교하여 5일 후에 결정하였다.
- <367> 상기 시험에서, 화합물 실시예 1 내지 7, 9 내지 11, 16 내지 18, 30, 31 및 33은 100 ppm에서 미처리된 대조군에 비해 복숭아혹 진딧물의 90% 이상의 사멸률을 나타내었다.
- <368> B.3. 쌀 메뚜기 (밀라파르바타 루겐스)
- <369> 쌀 묘목을 분무전 24시간에 세정하고 세척하였다. 활성 화합물을 50:50 아세톤:물에서 제제화하고, 0.1 부피/부피% 계면활성제 (EL 620)를 첨가하였다. 화분에 심은 쌀 묘목에 5 ml 시험 용액을 분무하고, 공기 건조시키고, 케이지에 위치시키고, 10마리의 성충으로 접종하였다. 처리된 쌀 식물을 28-29°C 및 50-60%의 상대 습도에서 유지시켰다. 사멸률%를 72시간 후에 기록하였다.
- <370> 상기 시험에서, 화합물 1, 2, 5, 6, 7 및 9 내지 11은 100 ppm에서 90% 이상의 사멸률을 나타내었다.
- <371> B.4. 거염벌레(Southern Armyworm) (스포돗테라 에리다니아), 제2-제3 영 유충
- <372> 활성 화합물을 35% 아세톤 및 물의 혼합물 중 10.000 ppm 용액으로 제제화하고, 필요하다면 이를 물로 희석하였다.
- <373> 제1 본잎으로 확장된 시에바 리마(*Sieva lima*) 콩 잎을 침지시키고, 시험 용액에서 3초 동안 진탕하고, 흡 후드에서 건조시켰다. 그 후, 처리된 식물을 25-cm 플라스틱 천공된 집 봉합 백에 위치시키고, 10개의 제2-영 유충을 첨가하고, 백을 밀봉하였다. 사멸률, 식물 섭취, 및 애벌레 성장에 의한 입의의 방해를 4일 후에 관찰하였다.
- <374> 상기 시험에서, 화합물 1, 5, 7, 10, 11 및 15는 100 ppm에서 미처리된 대조군에 비해 60% 이상의 사멸률을 나타내었다.
- <375> B.5. 은잎 백색파리 (베미시아 아르겐티폴리이(*Bemisia argentifolii*))
- <376> 활성 화합물을 50:50 아세톤:물 및 100 ppm 키네틱TM 계면활성제에서 제제화하였다.
- <377> 선택된 목화 식물을 떡잎 상태 (화분 당 1개의 식물)로 성장시켰다. 잎을 완전히 도포하기 위해 떡잎을 시험 용액에 침지시키고, 통풍이 잘 되는 곳에 위치시켜 건조시켰다. 처리된 묘목을 갖는 화분 각각을 플라스틱 컵에 위치시키고, 10 내지 12마리의 백색파리 성충 (대략 3 내지 5일됨)을 도입하였다. 흡인기 및 장벽 피펫 팁에 연결된 0.6 cm 무독성 타이곤0 관 (R-3603)을 사용하여 곤충류를 수집하였다. 그 후, 수집된 곤충류를 함

유하는 틱을, 처리된 식물을 함유하는 토양에 온화하게 삽입하여, 곤충류가 섭취를 위해 잎에 도달하도록 틱을 기어다니게 하였다. 컵을 재사용가능한 스크리닝된 뚜껑 (테크코 인크(Tetko Inc)로부터의 150 μm 메쉬 폴리에스테르 스크린 PeCap)으로 덮었다. 시험 식물을 약 25°C 및 20-40% 상대 습도에서 3일 동안 형광 (24 시간 광기간)으로의 직접 노출을 회피하는 유지실에서 유지시켜, 컵 내부에 열의 포획을 방지하였다. 사멸률을 식물의 처리 후 3일에 평가하였다.

- <378> 상기 시험에서, 화합물 1 내지 7, 11, 15, 16 및 18은 100 ppm에서 미처리된 대조군에 비해 90% 이상의 사멸률을 나타내었다.
- <379> B.6. 콜로라도 감자잎벌레 (렙티노타르사 데셈리네아타(*Leptinotarsa decemlineata*))
- <380> 바이오검정법을 위해 감자 식물을 사용하였다. 절단된 식물 잎을 활성 화합물의 1:1 아세톤/물 희석물에 침지시켰다. 잎을 건조시킨 후, 페트리 접시의 바닥 상의 습윤된 여과지 상에 각각 위치시켰다. 각 접시를 5 내지 7마리의 유충으로 침입시키고, 뚜껑으로 덮었다. 각 처리 희석물을 4회 복제하였다. 시험 접시를 대략 27°C 및 60% 습도에서 유지시켰다. 처리 적용 후 5일에 각 접시에서 살아있는 유충 및 사멸된 유충의 수를 평가하고, 사멸률%를 계산하였다.
- <381> 상기 시험에서, 화합물 1 내지 7, 9, 13 내지 16, 18 내지 21 및 25는 100 ppm에서 미처리된 대조군에 비해 90% 이상의 사멸률을 나타내었다.
- <382> B.7. 끝동매미충 (네포테티스 비레센스(*Nephotettix virescens*))
- <383> 쌀 묘목을 분무전 24시간에 세정하고 세척하였다. 활성 화합물을 50:50 아세톤:물에서 제제화하고, 0.1 부피/부피% 계면활성제 (EL 620)를 첨가하였다. 화분에 심은 쌀 묘목에 5 ml 시험 용액을 분무하고, 공기 건조시키고, 케이지에 위치시키고, 10마리의 성충으로 접종하였다. 처리된 쌀 식물을 28-29°C 및 50-60%의 상대 습도에서 유지시켰다. 사멸률%를 72시간 후에 기록하였다.
- <384> 상기 시험에서, 화합물 2, 7, 5, 6, 10 및 11은 100 ppm에서 60% 이상의 사멸률을 나타내었다.
- <385> B.8. 콩진딧물 (아피스 파바에(*Aphis fabae*))
- <386> 활성 화합물을 50:50 아세톤:물 및 100 ppm 키네틱™ 계면활성제에서 제제화하였다.
- <387> 제1 잎-쌍 단계에서 메트로(Metro) 혼합물에서 성장된 금련화 식물 (변종 '혼합된 줄(Mixed Jewle)')을, 침입된 절단 식물을 시험 식물의 상부 상에 위치시킴으로써 대략 2 내지 30마리의 실험실-사육된 진딧물로 침입시켰다. 절단 식물을 24시간 후에 제거하였다. 잎, 줄기, 튀어나온 종자 표면 및 둘러싼 입방 표면을 완전히 도포하기 위해 각 식물을 시험 용액에 침지시키고, 흡 후드에서 건조시켰다. 처리된 식물을 약 25°C에서 연속 형광으로 유지시켰다. 진딧물 사멸률을 3일 후에 결정하였다.
- <388> 상기 시험에서, 화합물 1 내지 3, 6 및 7은 100 ppm에서 60% 이상의 사멸률을 나타내었다.
- <389> B.9. 동부 진딧물(Cowpea aphid) (아피스 크라시보라(*aphis craccivora*))
- <390> 활성 화합물을 50:50 아세톤:물에서 제제화하였다. 해충 개체수를 기록한 후, 각종 단계의 100 내지 150 마리의 진딧물로 콜로니를 형성한 화분에 심은 동부 식물에 분무하였다. 개체수 감소를 24, 72 및 120시간 후에 기록하였다.
- <391> 상기 시험에서, 화합물 1 내지 7, 9 내지 11, 14 내지 16, 18, 20, 25, 29 및 30은 100 ppm에서 75% 이상의 사멸률을 나타내었다.
- <392> 비교 시험:
- <393> 본 발명의 화합물은 제EP-A 0447891호에 개시된 것과 비교하여 예상치 못한 더 높은 생물학적 활성을 추가로 나타내었다. 표 B.1 및 B.2의 생물학적 활성은 생물학적 활성이 없는 것을 나타내는 0% 내지 총 대조군으로서 100%의 스케일 범위로 평가하였다. 비교 생물학적 시험을 상기 기재된 바와 같이 수행하였다.

<394>

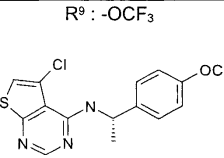
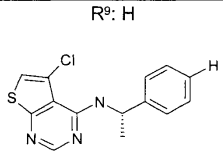
<표 B.1>

유기체	농도 (ppm)	$R^{10} = -C(CH_3)_3$  화합물 실시예 C.6	$R^{10} = H$  (제EP-A 0447891호의 실시예 288)
닐라파르마타 루겐스	300	100	0
아피스 고시피이	300	100	75
미주스 페르시카에	300	100	50
스포둡테라 에리다니아	300	100	0
베메시아 아르겐티폴리아	300	100	0

<395>

<396>

<표 B.2>

유기체	농도 (ppm)	$R^9 : -OCF_3$  화합물 실시예 C.2	$R^9 : H$  (제EP-A 0447891호의 실시예 378)
닐라파르마타 루겐스	300	100	0
아피스 고시피이	300	100	100
미주스 페르시카에	300	100	100
베메시아 아르겐티폴리아	300	100	0

<397>