

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(51) Int. Cl. ⁶ A01N 51/00 A01N 61/00	(45) 공고일자 2004년03월26일 (11) 등록번호 10-0406821 (24) 등록일자 2003년11월11일
(21) 출원번호 10-1997-0703787 (22) 출원일자 1997년06월05일 번역문제출일자 1997년06월05일 (86) 국제출원번호 PCT/EP1995/004667 (86) 국제출원일자 1995년11월27일 (81) 지정국 국내특허 : 아일랜드 기네 오스트레일리아 바베이도스 불가리아 브라질 캐나다 헝가리 일본 대한민국 스리랑카 노르웨이 루마니아 미국 중 국 체코 멕시코 뉴질랜드 폴란드 슬로바키아 우크라이나 EA 유라시아 특허 : 벨라루스 카자흐스탄 러시아 EP 유럽특허 : 그리스 모나코 포르투갈 핀란드 OA OAPI특허 : 코트디부아르 니제르	(65) 공개번호 10-1998-0700005 (43) 공개일자 1998년03월30일 (87) 국제공개번호 WO 1996/17520 (87) 국제공개일자 1996년06월13일
(30) 우선권주장 P 44 43 888.5 1994년12월09일 독일(DE)	
(73) 특허권자 바이엘 악티엔게젤샤프트 독일 데-51368 레버쿠센	
(72) 발명자 키르코르 시린얀 독일연방공화국 데-51467 베르기쉬 글라드바흐 훔페르딩크스트라세 12 후버트 돈 독일연방공화국 데-42115 부페르탈 팔케스트라세71 리차드 쿠자네크 독일연방공화국 데-51061 쾰른 볼프스카울 3 클레멘스 크리거 독일연방공화국 데-51789 린드랄르 록스스테예크 1 울리히 호이캄프 독일연방공화국 데-51515 퀴르텐 암 담베르크 2 도리스 학게월러 독일연방공화국 데-40221 뒤셀도르프 노르페르 스트라세 19 테렌스 홉킨스 오스트레일리아 큐엘디 4270 타보린 부베랑 로드 41	
(74) 대리인 김석중, 최규팔	

심사관 : 신동환

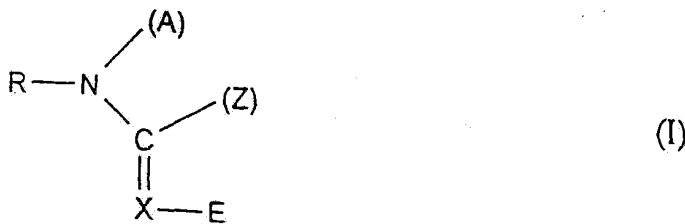
(54) 피부적용이 가능한 살기생충제제

명세서

- <1> 본 발명은 곤충의 니코틴성 아세틸콜린 수용체의 작용제 또는 길항제에 의해 동물에 기생하는 곤충을 피부상에서 구제하기 위한 제제에 관한 것이다.
- <2> 곤충의 니코틴성 아세틸콜린 수용체의 작용제 또는 길항제는 알려져 있다. 이들은 니코티닐 살충제 및 매우 특히 클로로니코티닐 살충제를 포함한다.
- <3> PCT 출원 WO 93/24 002에는 특정의 1-[N-(할로-3-피리딜메틸)]-N-메틸아미노-1-알킬아미노-2-니트로에틸렌 유도체가 가축의 벼룩에 대해 전신 사용하기에 적절하다고 개시되어 있다. WO 93/24 002에 따르면 비전신성, 즉 피부-적용 방식은 가축의 벼룩을 구제하기에 부적절하다.
- <4> 본 발명에 따라 동물의 벼룩, 이 또는 파리와 같은 기생 곤충의 피부 구제에 특히 적절한, 곤충의 니코틴성 아세틸콜린 수용체의 작용제 또는 길항제의 피부 적용을 위한 새로운 제제가 발견되었다.
- <5> 본 발명에 따른 제제는 다음 조성을 갖는다:
- <6> -제제의 총중량을 기준으로 1 내지 20 중량% 농도의 곤충의 니코틴성 아세틸콜린 수용체의 작용제 또는 길항제;
- <7> -제제의 총중량을 기준으로 적어도 20 중량% 농도의 벤질 알콜 및 임의로 치환된 피롤리돈의 그

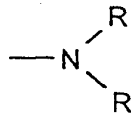
룹중에서 선택된 용매;

- <8> -필요에 따라, 제제의 총중량을 기준으로 5.0 내지 80 중량% 농도의 사이클릭 카보네이트 및 락톤의 그룹중에서 선택된 추가의 용매;
- <9> -필요에 따라, 제제의 총중량을 기준으로 0.025 내지 10 중량% 농도의 농후제, 천연제, 착색제, 항산화제, 추진제, 방부제, 접착제, 유화제의 그룹중에서 선택된 추가의 보조제.
- <10> 곤충의 니코틴성 아세틸콜린 수용체의 작용제 또는 길항제가 예를들어 유럽 공개 출원 제 464 830호, 제 428 941 호, 제 425 978호, 제 386 565호, 제 383 091 호, 제 375 907호, 제 364 844 호, 제 315 826 호, 제 259 738 호, 제 254 859 호, 제 235 725 호, 제 212 600 호, 제 192 060 호, 제 163 855 호, 제 154 178 호, 제 136 636 호, 제 303 570 호, 제 302 833 호, 제 306 696 호, 제 189 972 호, 제 455 000 호, 제 135 956 호, 제 471 372 호, 제 302 389 호; 독일 공개 명세서 제 3 639 877 호, 제 3 712 307 호; 일본 공개 명세서 제 03 220 176 호, 제 02 207 083 호, 제 63 307 857 호, 제 63 287 764 호, 제 03 246 283 호, 제 04 9371 호, 제 03 279 359 호, 제 03 255 072 호, 미국 특허 명세서 제 5 034 524 호, 제 4 948 798 호, 제 4 918 086 호, 제 5 039 686 호, 제 5 034 404 호; PCT 특허 출원 제 W0 91/17 659 호, 제 91/4965 호; 프랑스 특허 출원 제 2 611 114 호; 브라질 특허 출원 제 88 03 621 호로 부터 알려져 있다.
- <11> 본 명세서에서는 이들 공보에 기재된 화합물 및 그들의 제조방법을 명백히 참조 한다.
- <12> 이들 화합물은 바람직하게는 일반식 (I)에 의해 나타낼 수 있다:



- <14> 상기 식에서,
- <15> R은 수소, 또는 아실, 알킬, 아릴, 아르알킬, 헤테로아릴 및 헤테로아릴알킬의 그룹 중에서 선택된 임의로 치환된 라디칼을 나타내고;
- <16> A는 수소, 아실, 알킬, 아릴의 그룹중에서 선택된 일작용성 기를 나타내거나, 라디칼 Z 에 연결된 이작용성 기를 나타내며;
- <17> E는 전자-흡인 라디칼을 나타내고;
- <18> X는 라디칼 $-\text{CH}=\text{}$ 또는 $=\text{N}-$ 을 나타내며, 여기에서 H원자 대신에 라디칼 $-\text{CH}=\text{}$ 가 라디칼 Z에 연결되는 것이 가능하고;

Z는 알킬, $-\text{O}-\text{R}$, $-\text{S}-\text{R}$,



의 그룹중에서 선택된 일작용성

- <20> 기를 나타내거나, 라디칼 A 또는 라디칼 X에 연결된 이작용성 기를 나타낸다.
- <21> 특히 바람직한 일반식 (I)의 화합물은 라디칼들이 하기 의미를 갖는 화합물이다:
- <22> R은 수소를 나타내거나, 아실, 알킬, 아릴, 아르알킬, 헤테로아릴, 및 헤테로아릴알킬 중에서 선택된 임의로 치환된 라디칼을 나타낸다.
- <23> 아실 라디칼로서 언급될 수 있는 것은 포닐, 알킬카보닐, 아릴카보닐, 알킬설포닐, 아릴설포닐, (알킬)-(아릴)-포스포릴이고, 이들은 치환될 수 있다.
- <24> 알킬로서 언급될 수 있는 것은 C_{1-10} -알킬, 특히 C_{1-4} -알킬, 더욱 특히 메틸, 에틸, i-프로필, 2급-또는 3급-부틸이고, 이들은 치환될 수 있다.
- <25> 아릴로서 언급될 수 있는 것은 페닐, 나프틸, 특히 페닐이다.
- <26> 아르알킬로서 언급될 수 있는 것은 페닐메틸, 페닐에틸이다.
- <27> 헤테로아릴로서 언급될 수 있는 것은 10개 이하의 환 원자를 갖고 헤테로 원자로서 N, O, S, 특히 N을 갖는 헤테로아릴이다. 특히 언급될 수 있는 것은 티에닐, 푸릴, 티아졸릴, 이미다졸릴, 피리딜, 벤조티아졸릴이다.
- <28> 헤테로아릴알킬로서 언급될 수 있는 것은 6개 이하의 환 원자를 갖고 헤테로원자로서 N, O, S, 특히 N을 갖는 헤테로아릴메틸, 헤테로아릴에틸이다.
- <29> 예로서 바람직한 것으로 열거될 수 있는 치환체는 바람직하게는 1 내지 4개, 특히 1 또는 2개의 탄소 원자를 갖는 알킬, 예를들어 메틸, 에틸, n- 및 i-프로필 및 n-, i- 및 t-부틸; 바람직하게는 1 내지 4개, 특히 1 또는 2개의 탄소 원자를 갖는 알콕시, 예를들어 메톡시, 에톡시, n- 및 i-프로필옥시 및 n-, i- 및 t-부틸옥시; 바람직하게는 1 내지 4개, 특히 1 또는 2개의 탄소 원자를 갖는 알킬티오, 예를들어 메틸티오, 에틸티오, n- 및 i- 프로필티오 및 n-, i- 및 t-부틸티오; 바람직하게는 1 내지 4개, 특히

1 또는 2개의 탄소 원자, 및 바람직하게는 1 내지 5개, 특히 1 내지 3개의 할로겐 원자를 갖고, 할로겐 원자는 동일하거나 상이하며, 바람직하게는 불소, 염소 또는 브롬, 특히 불소인 할로게노알킬, 예를 들어 트리플루오로메틸; 하이드록실; 할로겐, 바람직하게는 불소, 염소, 브롬 및 요오드, 특히 불소, 염소 및 브롬; 시아노; 니트로; 아미노; 알킬 기당 바람직하게는 1 내지 4개, 특히 1 또는 2개의 탄소 원자를 갖는 모노알킬- 및 디알킬아미노, 예를 들어 메틸아미노, 메틸-에틸-아미노, n- 및 i-프로필아미노 및 메틸-n-부틸아미노; 카복실; 바람직하게는 2 내지 4개, 특히 2 또는 3개의 탄소 원자를 갖는 카보알콕시, 예를 들어 카보메톡시 및 카보에톡시; 설포(-SO₃H); 바람직하게는 1 내지 4개, 특히 1 또는 2개의 탄소 원자를 갖는 알킬설포닐, 예를 들어 메틸설포닐 및 에틸설포닐; 바람직하게는 6 또는 10개의 아릴 탄소 원자를 갖는 아릴설포닐, 예를 들어 페닐설포닐, 및 또한 헤테로아릴아미노 및 헤테로아릴알킬아미노, 예를 들어 클로로피리딜아미노 및 클로로피리딜메틸아미노이다.

<30> A는 특히 바람직하게는 수소를 나타내거나, 바람직하게는 R에 대한 의미를 갖는 아실, 알킬 및 아릴 그룹중에서 선택된 임의로 치환된 라디칼을 나타낸다. A는 추가로 이작용성 기를 나타낸다. 언급될 수 있는 것은 1 내지 4개, 특히 1 또는 2개의 탄소 원자를 갖는 임의로 치환된 알킬렌이고, 여기서 치환체는 상기 열거된 치환체이고, 알킬렌 기는 N, O 및 S 그룹중에서 선택된 헤테로원자에 의해 차단될 수 있다.

<31> A 및 Z는 그들이 부착된 원자들과 함께 포화 또는 불포화 헤테로사이클릭 환을 형성할 수 있다. 헤테로사이클릭 환은 추가의 1 또는 2개의 동일하거나 상이한 헤테로원자 및 헤테로-기를 함유할 수 있다. 헤테로원자는 바람직하게는 산소, 황 또는 질소이고, 헤테로-기는 바람직하게는 N-알킬이며, 여기에서 N-알킬기중의 알킬은 바람직하게는 1 내지 4개, 특히 1 또는 2개의 탄소 원자를 함유한다. 알킬 기로서 언급될 수 있는 것은 메틸, 에틸, n- 및 i-프로필 및 n-, i- 및 t-부틸이다. 헤테로사이클릭 환은 5 내지 7개, 바람직하게는 5 또는 6개의 환 원을 함유한다.

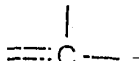
<32> 언급될 수 있는 헤테로사이클릭 환의 예는 각각 임의로 바람직하게는 메틸에 의해 치환될 수 있는 피롤리딘, 피페리딘, 피페라진, 헥사메틸렌이민, 헥사하이드로-1,3,5-트리아진, 모르폴린이다.

<33> E는 전자 흡인 라디칼이고, 이와 관련하여 특히 언급될 수 있는 것은 NO₂, CN, 1,5-할로게노-C₁₋₄-카보닐, 특히 COCF₃와 같은 할로게노알킬카보닐이다.

<34> X는 -OH= 또는 -N=을 나타낸다.

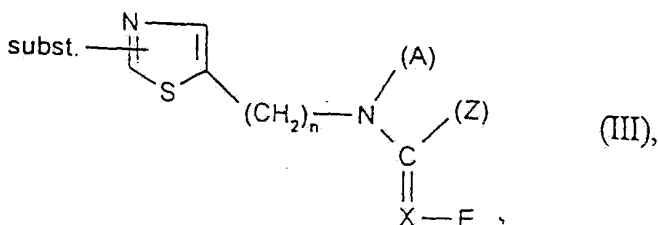
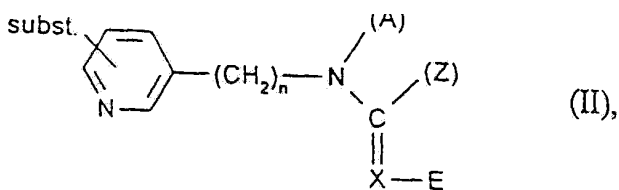
<35> Z는 임의로 치환된 라디칼, 알킬, -OR, -SR, -NRR을 나타내고, 여기에서, R 및 치환체는 바람직하게는 상기 언급된 의미를 갖는다.

<36> Z는 상기 언급된 환과 별도로, 그가 부착된 원자와 함께 및 X 대신에 라디칼

<37>  과 함께 포화 또는 불포화 헤테로사이클릭 환을 형성할 수 있다. 헤테로사이클릭 환은 추가의 1 또는 2개의 동일하거나 상이한 헤테로원자 및/또는 헤테로-기를 함유할 수 있다. 헤테로원자는 바람직하게는 산소, 황 또는 질소이고, 헤테로-기는 N-알킬이며, 여기에서, 알킬 또는 N-알킬기는 바람직하게는 1 내지 4개, 특히 1 또는 2개의 탄소 원자를 함유한다. 알킬로서 언급될 수 있는 것은 메틸, 에틸, n- 및 i-프로필 및 n-, i- 및 t-부틸이다. 헤테로사이클릭 환은 5 내지 7개, 바람직하게는 5 또는 6개의 환 원을 함유한다.

<38> 언급될 수 있는 헤테로사이클릭 환의 예는 피롤리딘, 피페리딘, 피페라진, 헥사메틸렌이민, 모르폴린 및 N-메틸피페라진이다.

<39> 본 발명에 따라서 매우 특히 바람직하게 사용될 수 있는 화합물로서 언급될 수 있는 것은 일반식 (II) 및 (III)의 화합물이다:



<41> 상기 식에서,

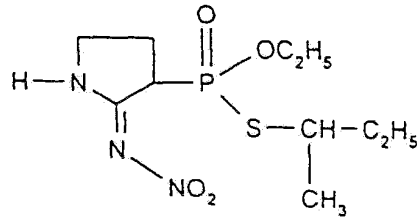
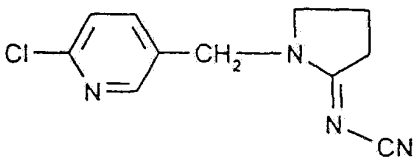
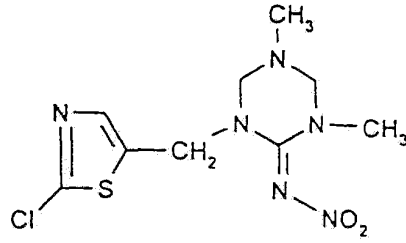
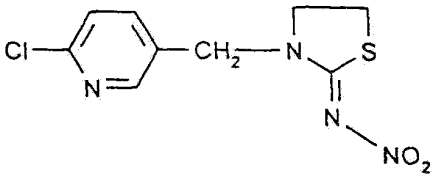
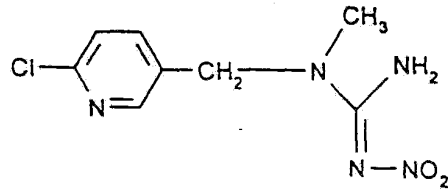
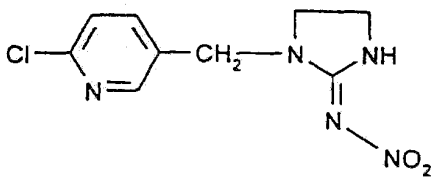
<42> n은 1 또는 2를 나타내고,

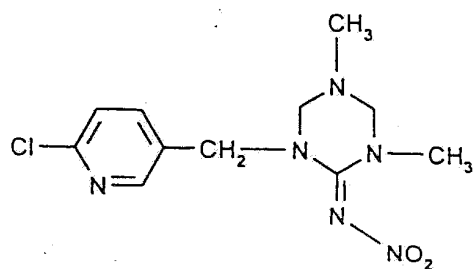
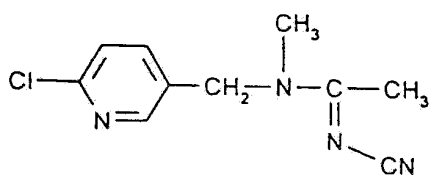
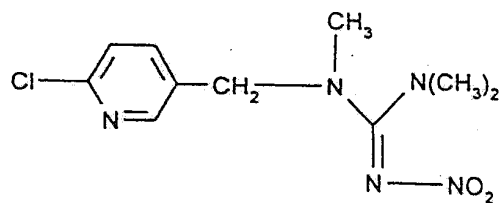
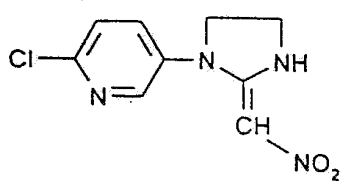
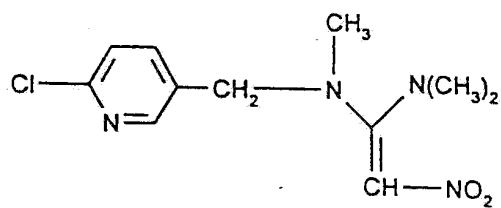
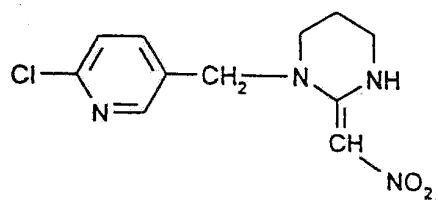
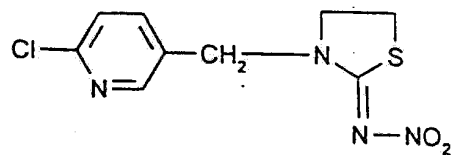
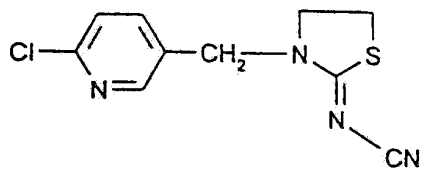
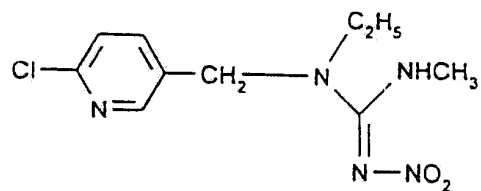
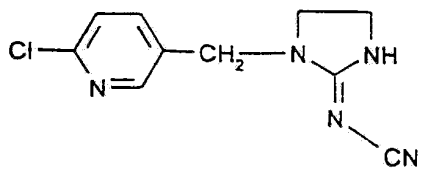
<43> subst는 상기 열거된 치환체의 하나, 특히 할로겐, 매우 특히 염소를 나타낸다.

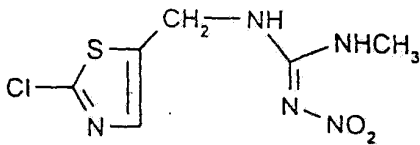
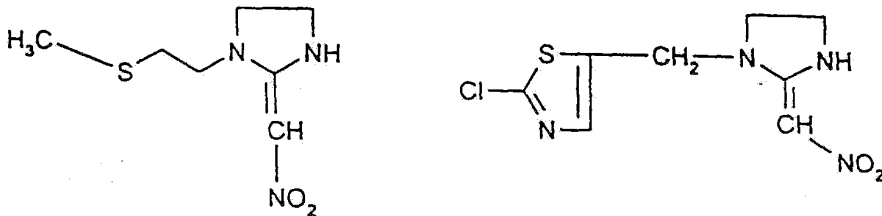
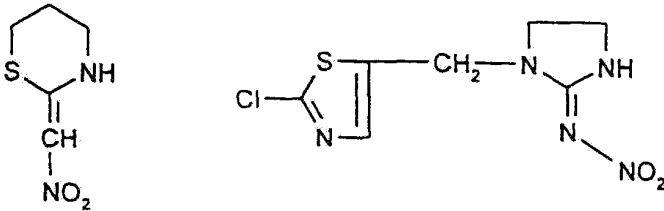
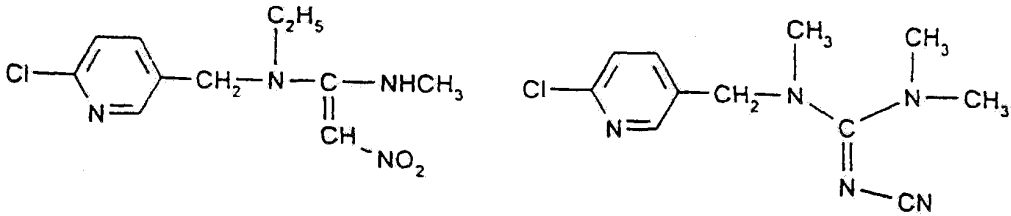
<44> A, Z, X 및 E는 상기 언급된 의미를 갖는다.

<45>

특히, 하기 화합물들이 언급될 수 있다:







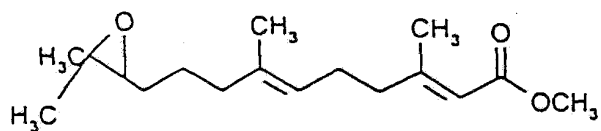
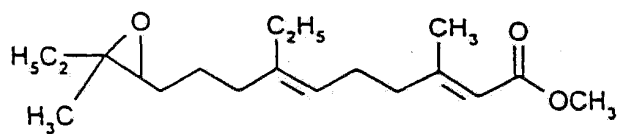
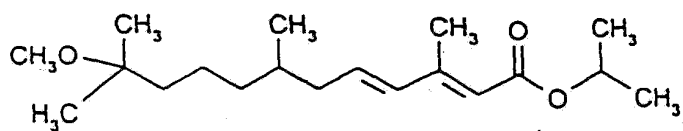
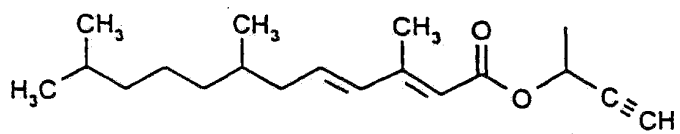
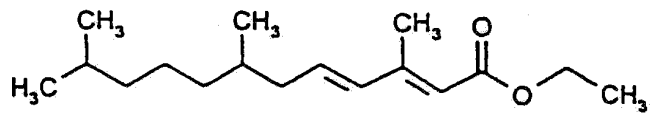
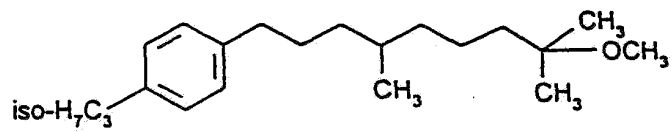
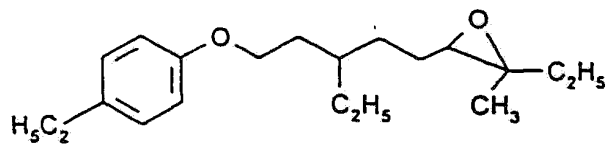
- <49> 본 발명에 따른 제제는 0.1 내지 20 중량%, 바람직하게는 1 내지 12.5 중량%의 농도로 활성 물질을 함유한다.
- <50> 사용하기 전에 희석되는 제제는 0.5 내지 90 중량%, 바람직하게는 1 내지 50 중량%의 농도로 활성 물질을 함유한다.
- <51> 일반적으로, 효과적인 결과를 얻기 위하여 1일 체중당 활성 물질을 약 0.5 내지 50 mg, 바람직하게는 1 내지 20 mg의 양을 투여하는 것이 유리한 것으로 증명되었다.
- <52> 적절한 용매는:
- <53> 벤질 알콜 또는 임의로 치환된 피롤리돈, 예를들어 2-피롤리돈, 1-(C₂₋₂₀-알킬)-2-피롤리돈, 특히 1-에틸피롤리돈, 1-옥틸피롤리돈, 1-도데실피롤리돈, 1-이소프로필피롤리돈, 1-(s- 또는 t- 또는 n-부틸)-피롤리돈, 1-헥실피롤리돈, 1-(C₂₋₁₀-알케닐)-2-피롤리돈, 예를들어 1-비닐-2-피롤리돈, 1-(C₃₋₈-사이클로알킬)-2-피롤리돈, 예를들어 1-사이클로헥실피롤리돈, 1-(C₁₋₆-하이드록시알킬)-2-피롤리돈, 1-(C₁₋₆-알콕시-C₁₋₆-알킬)-2-피롤리돈, 예를들어 1-(2-하이드록시에틸)-피롤리돈, 1-(3-하이드록시프로필)-피롤리돈, 1-(2-메톡시에틸)-피롤리돈, 1-(3-메톡시프로필)-피롤리돈, 및 또한 1-벤질피롤리돈이다. 특히 언급될 수 있는 것은 벤질알콜 또는 n-도데실- 또는 n-옥틸피롤리돈이다. 이들 용매는 단독으로 또는 추가의 용매(보조 용매)와 혼합물 상태로 이용될 수 있다.
- <54> 이들 용매는 적어도 20 중량%, 바람직하게는 40 내지 90 중량%, 특히 바람직하게는 50 내지 90 중량%의 농도로 존재한다.
- <55> 적절한 추가의 용매 또는 보조 용매는 사이클릭 카보네이트 또는 락톤이다. 이러한 것으로 언급될 수 있는 것은 에틸렌 카보네이트, 프로필렌 카보네이트, γ-부티로락톤이다.
- <56> 이들 추가의 용매는 5.0 내지 80 중량%, 바람직하게는 7.5 내지 50 중량%, 특히 바람직하게는 10 내지 50 중량%의 농도로 존재한다.
- <57> 적절한 추가의 보조제는 방부제, 예를들어 벤질 알콜(용매로서 이미 존재한 경우 필요하지 않

음), 트리클로로부탄올, p-하이드록시벤조산 에스테르, n-부탄올이다.

- <58> 농후제는 무기 농후제, 예를들어 벤토나이트, 콜로이드성 규산, 알루미늄 모노스테아레이트, 및 유기 농후제, 예를들어 셀룰로즈 유도체, 폴리비닐 알콜, 폴리비닐피롤리돈 및 그의 공중합체, 아크릴레이트 및 메타크릴레이트이다.
- <59> 언급될 수 있는 착색제는 동물에서 사용이 허용되는 것으로 용해되거나 현탁될 수 있는 모든 착색제이다.
- <60> 보조제는 또한 전연(spreading) 오일, 예를들어 디-2-에틸헥실 아디페이트, 이소프로필 미리스테이트, 디프로필렌 글리콜 펠라고네이트, 사이클릭 및 아사이클릭 실리콘 오일, 예를들어 디메티콘 및 또한 그의 에틸렌 옥사이드, 프로필렌옥사이드 및 포르말린과의 공중합체 및 터폴리머, 지방산 에스테르, 트리글리세리드, 지방 알콜이다.
- <61> 향산화제는 아황산염, 메타중아황산염, 예를들어 메타중아황산 칼륨, 아스코르브 산, 부틸화 하이드록시톨루엔, 부틸화 하이드록시아니솔, 토코페롤이다.
- <62> 광안정화제는 예를들어 벤조페논 또는 노반티솔 산의 부류로 부터의 물질이다.
- <63> 접착제는 예를들어 셀룰로즈 유도체, 전분 유도체, 폴리아크릴레이트, 천연으로 생성되는 중합체, 예를들어 알기네이트, 젤라틴이다.
- <64> 보조제는 또한 유화제, 예를들면, 비이온성 계면활성제, 예를들어 폴리옥시에틸화 카스터 오일, 폴리옥시에틸화 소르비탄 모노올리에이트, 소르비탄 모노스테아레이트, 글리세롤 모노스테아레이트, 폴리옥시에틸스테아레이트, 알킬페놀 폴리글리콜 에테르; 양쪽성 계면활성제, 예를들어 디-Na N-라우릴-β-이미노디프로피오네이트 또는 레시틴; 음이온성 계면활성제, 예를들어 Na-라우릴 설페이트, 지방알콜 에테르 설페이트, 모노/디알킬-폴리글리콜 에테르 오르토인산 에스테르 모노 에탄올아민 염; 양이온성 계면활성제, 예를들어 세틸트리메틸암모늄 클로라이드이다.
- <65> 추가의 보조제는 본 발명에 따른 제제를 피부에 분무시키거나 분출시킬 수 있는 제제이다. 이들 보조제는 분무 캔에 필요한 통상의 추진 가스, 예를들어 프로판, 부탄, 디메틸 에테르, CO₂ 또는 할로겐화 저급 알칸, 또는 그의 서로 다른 것과의 혼합물이다.
- <66> 본 발명에 따른 제제는 온혈 종(species)에 지독성을 나타내며, 이 제제는 가축 및 생산성 동물에서, 동물원 및 연구소 동물 및 실험에 사용되는 동물에서 및 애완동물의 동물 사육 및 동물 육종시 만나는 기생 곤충의 구제에 적절하다. 여기에서, 이 제제는 해충의 모든 또는 개별의 발달 단계에 대해서 및 해충의 내성 종 및 보통 민감한 종에 대해서 활성이다.
- <67> 해충에는
- <68> 이(Anoplura)목, 예를들어 하에마토피누스 아종(Haematopinus spp.), 리노그나투스 아종(Linognathus spp.), 솔레노포테스 아종(Solenopotes spp.), 페디쿨루스 아종(Pediculus spp.), 및 프티루스 아종(Phthirus spp.);
- <69> 털이(Mallophaga)목, 예를들어 트리메노폰 아종(Trimenopon spp.), 메노폰 아종(Menopon spp.), 에오메나칸투스 아종(Eomenacanthus spp.), 메나칸투스 아종(Menacanthus spp.), 트리코덱테스 아종(Trichodectes spp.), 펠리콜라 아종(Felicola spp.), 다말리네아 아종(Damalinea spp.), 및 보비콜라 아종(Bovocola spp.);
- <70> 파리(Diptera)목, 예를들어 크리소프스 아종(Chrysops spp.), 타바누스 아종(Tabanus spp.), 무스카 아종(musca spp.), 하이드로타에아 아종(Hydrotaea spp.), 무스시나 아종(Muscina spp.), 하에마토보스카 아종(Haematobia spp.), 하에마토비아 아종(Haematobia spp.), 스토크시스 아종(Stomoxys spp.), 파니아 아종(Fannia spp.), 글로시나 아종(Glossina spp.), 루실리아 아종(Lucilia spp.), 칼리포라 아종(Calliphora spp.), 아우크메로미아 아종(Auchmeromyia spp.), 코르딜로비아 아종(Cordylobia spp.), 코클리오미아 아종(Cochliomyia spp.), 크리소미아 아종(Chrysomyia spp.), 사코파가 아종(Sarcophaga spp.), 보흐파르티아 아종(Wohlfartia spp.), 가스테로필루스 아종(Gasterophilus spp.), 오에스테로미아 아종(Oesteromyia spp.), 오에데르마게나 아종(Oedemagena spp.), 히포더마 아종(Hypoderma spp.), 오에스트루스 아종(Oestrus spp.), 리노에스트루스 아종(Rhinoestrus spp.), 멜로파구스 아종(Melophagus spp.), 및 히포보스카 아종(Hippobosca spp.);
- <71> 벼룩(Siphonaptera)목, 예를들어 크테노세팔리데스 아종(Ctenocephalides spp.), 에키드노파가 아종(Echidnophaga spp.), 및 세라토피루스 아종(Ceratophyllus spp.)이 있다.
- <72> 특히 언급될 수 있는 것은 벼룩 목, 특히 벼룩에 대한 작용이다.
- <73> 생산성 가축 및 육종 동물에는 예를들어, 소, 말, 양, 돼지, 염소, 낙타, 물소, 당나귀, 토끼, 사슴 및 순록과 같은 포유 동물, 밍크, 친칠라 및 너구리와 같은 모피 동물, 닭, 거위, 칠면조 및 오리와 같은 조류가 포함된다.
- <74> 연구소 동물 및 실험용 동물에는 마우스, 랫트, 기니아 피크, 골든, 햄스터, 개 및 고양이가 포함된다.
- <75> 애완동물에는 개 및 고양이가 포함된다.
- <76> 활성 화합물은 예방 및 치료적으로 모두 투여할 수 있다.
- <77> 본 발명에 따라 성형된 제품에서, 추가의 활성 물질이 존재하는 것이 가능하다. 추가의 활성 물질은 살충제, 예를들어 인-함유 화합물, 즉 포스페이트 또는 포스포네이트, 천연 또는 합성 피레트로이드, 카바메이트, 아미딘, 유충 호르몬 및 주베노이드(juvenoid) 합성 활성 물질, 및 디아릴 에

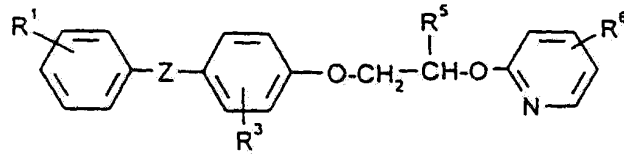
테르 및 벤조일우레아와 같은 키틴 합성 억제제를 포함한다.

- <78> 포스페이트 및 포스포네이트에는
- <79> 0-에틸-0-(8-퀴놀릴)페닐 티오포스페이트 (퀸티오포스),
- <80> 0,0-디에틸 0-(3-클로로-4-메틸-7-쿠마리닐)-티오포스페이트 (쿠마포스),
- <81> 0,0-디에틸 0-페닐글리코실로니트릴 옥심 티오포스페이트 (폭심),
- <82> 0,0-디에틸 0-시아노클로로벤즈알독심 티오포스페이트 (클로르폭심),
- <83> 0,0-디에틸 0-(4-브로모-2,5-디클로로페닐) 포스포로티오네이트 (브로모포스-에틸),
- <84> 0,0,0',0'-테트라에틸 S,S'-메틸렌-디(포스포로디티오네이트) (에티온),
- <85> 2,3-p-디옥산디티올 S,S-비스(0,0-디에틸 포스포로디티오네이트),
- <86> 2-클로로-1-(2,4-디클로로페닐)-비닐 디에틸 포스페이트 (클로로펜빈포스),
- <87> 0,0-디메틸 0-(3-메틸-4-메틸티오펜일) 티오노포스페이트 (펜티온)가 있다.
- <88> 카바메이트에는
- <89> 2-이소프로폭시페닐 메틸카바메이트(프로폭수르),
- <90> 1-나프틸 N-메틸카바메이트 (카바밀)이 있다.
- <91> 합성 피레트로이드에는
- <92> 3-[2-(4-클로로페닐)-2-클로로비닐]-2,2-디메틸-사이클로-프로판카복실산(α -시아노-4-플루오로-3-페녹시)-벤질 에스테르(플루메트린),
- <93> α -시아노(4-플루오로-3-페녹시)-벤질 2,2-디메틸-3-(2,2-디클로로비닐)-사이클로프로판카복실레이트(사이플루트린) 및 그의 에난티오머 및 입체 이성체,
- <94> α -시아노-3-페녹시벤질 (\pm)-시스, 트랜스-3-(2,2-디클로로비닐)-2,2-디메틸사이클로프로판카복실레이트(펠타메트린),
- <95> α -시아노-3-페녹시벤질 2,2-디메틸-3-(2,2-디클로로비닐)-사이클로프로판카복실레이트 (사이퍼메트린),
- <96> 3-페녹시벤질 (\pm)-시스, 트랜스-3-(2,2-디클로로비닐)-2,2-디메틸사이클로프로판카복실레이트 (퍼메트린),
- <97> α -시아노-3-페녹시-벤질 α -(p-Cl-페닐)-이소발레레이트 (핀발레레이트),
- <98> 2-시아노-3-페녹시벤질 2-(2-클로로- α, α, α -트리플루오로-p-톨루이디노)-3-메틸부티레이트 (플루발리네이트)가 있다.
- <99> 아미딘에는
- <100> 3-메틸-2-[2,4-디메틸-페닐이미노]-티아졸린,
- <101> 2-(4-클로로-2-메틸페닐이미노)-3-메틸티아졸리딘,
- <102> 2-(4-클로로-2-메틸페닐이미노)-3-(이소부틸-1-에닐)-티아졸리딘,
- <103> 1,5-비스-(2,4-디메틸페닐)-3-메틸-1,3,5-트리아자펜타-1,4-디엔(아미트라스)이 있다.
- <104> 이버맥틴 및 아바맥틴과 같은 사이클릭 매크로리드(cyclic macroliths). 이와 관련하여 언급될 수 있는 것은 예를들어 5-0-디메틸-22,23-디하이드로아버맥틴-A_{1a}, -22,23-디하이드로아버맥틴 B_{1a} 및 22,23-디하이드로아버맥틴 B_{b1} (참조, 예를들어 문헌[WHO. F.A. Series 27, pp. 27-73(1991)])이 있다. 유충 호르몬 및 유충 호르몬류 물질에는 특히 하기 구조식의 화합물이 있다:



<106>

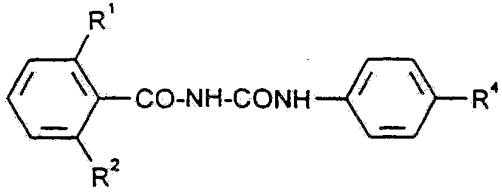
치환된 디아릴 에테르에는 특히 하기 일반식의 화합물이 포함된다:



R ¹	R ³	R ⁵	R ⁶	Z
H	H	CH ₃	H	O
H	H	CH ₃	2-Cl	O
5-F	H	CH ₃	H	O
H	H	CF ₃	H	O
H	H	C ₂ H ₅	H	O
H	H	H	H	O
H	H	CH ₃	H	CH ₂
H	H	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂

<108>

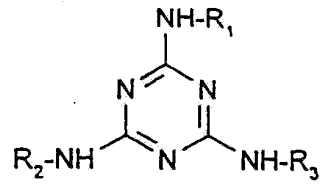
벤조일 우레아에는 하기 일반식의 화합물이 포함된다:



R ¹	R ²	R ⁴
H	Cl	CF ₃
Cl	Cl	CF ₃
F	F	CF ₃
H	F	CF ₃
H	Cl	SCF ₃
F	F	SCF ₃
H	F	SCF ₃
H	Cl	OCF ₃
F	F	OCF ₃
H	F	OCF ₃
F	F	
F	F	
F	F	

<110>

트리아진에는 하기 일반식의 화합물이 포함된다:



R ₁	R ₂	R ₃
사이클로프로필	H	H
사이클로프로필	H	CH ₃
사이클로프로필	H	C ₂ H ₅
사이클로프로필	H	C ₃ H _{7-n}
사이클로프로필	H	C ₄ H _{9-n}
사이클로프로필	H	C ₅ H _{11-n}
사이클로프로필	H	C ₆ H _{13-n}
사이클로프로필	H	C ₇ H _{15-n}

(계속)

R ₁	R ₂	R ₃
사이클로프로필	H	C ₈ H _{17-n}
사이클로프로필	H	C ₁₂ H _{25-n}
사이클로프로필	H	CH ₂ -C ₄ H _{9-n}
사이클로프로필	H	CH ₂ CH(CH ₃)C ₂ H ₅
사이클로프로필	H	CH ₂ CH=CH ₂
사이클로프로필	Cl	C ₂ H ₅
사이클로프로필	Cl	C ₆ H _{13-n}
사이클로프로필	Cl	C ₈ H _{17-n}
사이클로프로필	Cl	C ₁₂ H _{25-n}
사이클로프로필	H	사이클로프로필
사이클로프로필	H	COCH ₃
사이클로프로필	H	COCH ₃ HCl
사이클로프로필	H	COC ₂ H ₅ HCl
사이클로프로필	H	COC ₂ H ₅
사이클로프로필	H	COC ₃ H _{7-n}
사이클로프로필	H	COC ₃ H _{7-i}
사이클로프로필	H	COC ₄ H _{9-t} HCl
사이클로프로필	H	COC ₄ H _{9-n}
사이클로프로필	H	COC ₆ H _{13-n}

(계속)

R ₁	R ₂	R ₃
사이클로프로필	H	COC ₁₁ -H _{23-n}
사이클로프로필	COCH ₃	COC ₂ H ₅
사이클로프로필	COC ₃ H _{7-n}	COC ₆ H _{13-n}
사이클로프로필	COCH ₃	COC ₃ H _{7-n}
사이클로프로필	COC ₂ H ₅	COC ₃ H _{7-n}
사이클로프로필	H	CO사이클로프로필
사이클로프로필	CO 사이클로프로필	CO 사이클로프로필
사이클로프로필	COCH ₃	COCH ₃
이소프로필	H	H
이소프로필	H	COCH ₃
이소프로필	H	COC ₃ H _{7-n}
사이클로프로필	H	CONHCH ₃
사이클로프로필	H	CONHC ₃ H _{7-i}
사이클로프로필	CONHCH ₃	CONHCH ₃
사이클로프로필	H	SCNHCH ₃
사이클로프로필	H	CONHCH ₂ CH=CH ₂
사이클로프로필	CONHCH ₂ CH=CH ₂	CONHCH ₂ CH=CH ₂
사이클로프로필	CSNHCH ₃	CSNHCH ₃

<114> 일반명, 프로폭수르, 사이플루트린, 플루메트린, 피리프록시펜, 메토프렌, 다이아지논, 아미트라즈, 펜티온 및 레바미솔을 갖는 추가의 활성 물질이 특히 강조된다.

<115> 하기 실시예들에서, 이용된 활성 물질은 1-[(6-클로로-3-피리디닐)메틸]-N-니트로-2-이미다졸리디늄(일반명 이미다클로프리드)이다.

<116>	<u>실시예 1</u>	
	이미다클로프로리드	10 g
	프로필렌 카보네이트	45 g
	벤질 알콜	45 g
	벨실 [®] (Belsil) DMC 6031	1 g
<118>	(Wacker GmbH, D-81737 Munich로 부터의 폴리실록산 공중합체)	
<119>	<u>실시예 2</u>	
	이미다클로프로리드	10 g
	n-옥틸-2-피롤리돈	44.5 g
	γ -부티로락톤	44.5 g
	벨실 L 066	1 g
<122>	(Wacker GmbH, D-81737 Munich로 부터의 폴리실록산 공중합체)	
<123>	<u>실시예 3</u>	
	이미다클로프로리드	8.5 g
	n-도데실-피롤리돈	45.25 g
	γ -부티로락톤	45.25 g
	벨실 L 066	1 g
<125>	(전연제로서 폴리실록산 공중합체)	
<126>	<u>실시예 4</u>	
	이미다클로프로리드	10 g
	벤질 알콜	89.9 g
	벨실 DMC 6031	0.1 g
<128>	(전연제로서 폴리실록산 공중합체)	

<129>	<u>실시예 5</u>		
	이미다클로프리드	12.5 g	
	벤질 알콜	70.0 g	
	프로필렌 카보네이트	17.5 g	
<131>	<u>실시예 6</u>		
	이미다클로프리드	10.0 g	
	1-사이클로헥실피롤리돈	80.0 g	
	프로필렌 카보네이트	10.0 g	
<133>	<u>실시예 7</u>		
	이미다클로프리드	11.0 g	
	벤질 알콜	70.0 g	
	프로필렌 카보네이트	15.0 g	
	이소프로필 미리스테이트	4.0 g	
<135>	<u>실시예 8</u>		
	이미다클로프리드	12.5 g	
	벤질 알콜	70.0 g	
	프로필렌 카보네이트	17.4 g	
	부틸화 하이드록시톨루엔	0.1 g	

<137>	<u>실시예 9</u>	
	이미다클로프리드	10.0 g
	벤질 알콜	70.0 g
	프로필렌 카보네이트	17.5 g
	다-2-에틸헥실 아디페이트	2.5 g
<139>	<u>실시예 10</u>	
	이미다클로프리드	12.5 g
	2-피롤리돈	70.0 g
	프로필렌 카보네이트	17.5 g
<141>	<u>실시예 11</u>	
	이미다클로프리드	10.0 g
	피리프록시펜	1.0 g
	벤질 알콜	70.0 g
	프로필렌 카보네이트	18.9 g
	부틸화 하이드록시플루엔	0.1 g
<143>	<u>실시예 12</u>	
	이미다클로프리드	12.5 g
	트리플루무론	2.5 g
	벤질 알콜	60.0 g
	프로필렌 카보네이트	27.5 g

<145>

실시에 13

이미다클로프리드 10.0 g

플루메트린 2.0 g

벤질 알콜 60.0 g

프로필렌 카보네이트 28.0 g

<148>

실시에 14

이미다클로프리드 10.0 g

벤질 알콜 60.0 g

에틸렌 카보네이트 15.0 g

프로필렌 카보네이트 15.0 g

<150>

사용 실시에 A

<151>

실시에 1에 기술된 제제 2 ml를 벼룩으로 감염된 체중이 20 kg인 개의 등에 부었다. 하기 결과를 얻었다.

기간 (일)	개 1 마리당 벼룩의 수		작용 %
	비처리됨	처리됨	
-1	100 마리 벼룩으로 감염시킴		
0	처리 및 계수	30	0
5, 8	100 마리 벼룩으로 감염시킴		
9	계수	56	0
15	100 마리 벼룩으로 감염시킴		
16	계수	76	0
19	100 마리 벼룩으로 감염시킴(비처리된 동물) 250 마리 벼룩으로 감염시킴(처리된 동 물)		
20	계수	39	0
26	100 마리 벼룩으로 감염시킴		
27	계수	43	0

<153>

사용 실시예 B

<154>

실시예 4에 따른 용액 1ml를 체중이 20 kg인 개의 어깨에 위치시켰다. 처리한 지 2일 및 6일 후 동물을 20 마리 벼룩으로 감염시켰다. 각각 처리한지 3일째 및 7일째 개에 남아있는 벼룩을 계수하였다. 살아있는 벼룩이 발견되지 않았다. 작용이 100%이었다.

(57) 청구의 범위

청구항 1

제제의 총중량을 기준으로 0.1 내지 20 중량% 농도의 곤충의 니코틴성 아세틸콜린 수용체의 작용제 또는 길항제(활성물질);

제제의 총중량을 기준으로 적어도 20 중량% 농도의 벤질 알콜 및 치환 또는 비치환된 피롤리돈의 그룹중에서 선택된 용매; 및

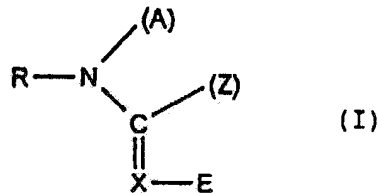
제제의 총중량을 기준으로 5.0 내지 50 중량% 농도의 사이클릭 카보네이트 및 락톤의 그룹중에서 선택된 용매를 함유하는 것을 특징으로 하는 동물의 기생충을 피부 구제하기 위한 조성물.

청구항 2

제 1 항에 있어서, 제제의 총중량을 기준으로 0.025 내지 10 중량% 농도의 농후제, 천연제, 착색제, 향산화제, 추진제, 방부제, 접착제 및 유화제의 그룹중에서 선택된 추가의 보조제를 함유하는 것을 특징으로 하는 조성물.

청구항 3

제 1 항에 있어서, 활성물질이 하기 일반식 (I)의 화합물임을 특징으로 하는 조성물:



상기 식에서,

R은 수소, 또는 아실, 알킬, 아릴, 아르알킬, 헤테로아릴 및 헤테로아릴알킬의 그룹중에서 선택되고 치환 또는 비치환된 라디칼을 나타내고;

A는 수소, 아실, 알킬 및 아릴의 그룹중에서 선택된 일작용성 기를 나타내거나, 라디칼 Z 에 연결된 이작용성 기를 나타내며;

E는 전자-흡인 라디칼을 나타내고;

X는 라디칼 $-\text{CH}=\text{}$ 또는 $=\text{N}-$ 을 나타내며, 여기에서 라디칼 $-\text{CH}=\text{}$ 는 H 원자 대신에 라디칼 Z에 연결되는 것이 가능하고;

Z는 알킬, $-\text{O}-\text{R}$, $-\text{S}-\text{R}$ 및 $\begin{array}{c} \text{R} \\ \diagdown \\ \text{N} \\ \diagup \\ \text{R} \end{array}$ (R은 앞에서 정의한 바와 같다)의 그룹중에서 선택된 일작용성 기를 나타내거나, 라디칼 A 또는 라디칼 X에 연결된 이작용성 기를 나타낸다.

청구항 4

제 1 항에 있어서, 활성물질이 하기와 같이 정의된 일반식 (I)의 화합물임을 특징으로 하는 조성물:

R은 수소를 나타내거나, 아실, 알킬, 아릴, 아르알킬, 헤테로아릴, 및 헤테로아릴알킬의 그룹중에서 선택되고 치환 또는 비치환된 라디칼을 나타내고,

여기서, 아실 라디칼은 포닐, 알킬카보닐, 아릴카보닐, 알킬설포닐, 아릴설포닐 또는 (알킬-)(아릴-)-포스포릴이고,

알킬 라디칼은 C_{1-10} -알킬이며,

아릴 라디칼은 페닐 또는 나프틸이고,

아르알킬 라디칼은 페닐메틸 또는 펜에틸이며,

헤테로아릴 라디칼은 티에닐, 푸릴, 티아졸릴, 이미다졸릴, 피리딜 또는 벤조티아졸릴이고,

헤테로아릴알킬 라디칼은 헤테로아릴메틸이며,

이들의 치환체는 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 알킬; 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 알콕시;

1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 알킬티오; 1 내지 4개의 탄소 원자 및 1 내지 5개의 할로겐 원자를 갖고, 할로겐 원자는 동일하거나 상이하며, 불소, 염소 또는 브롬인 할로게노알킬; 하이드록실; 할로겐; 시아노; 니트로; 아미노; 알킬기가 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 모노알킬- 및 디알킬아미노; 카복실; 2 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 카보알콕시; 설펜(-SO₂H); 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 알킬설펜; 페닐설펜; 또는 헤테로아릴아미노 및 헤테로아릴알킬아미노이고,

A는 수소를 나타내거나, R에 대해 정의된 바와 같은, 아실, 알킬 및 아릴의 그룹중에서 선택되고 치환 또는 비치환된 라디칼을 나타내거나, 이작용성 기를 나타내며, 여기에서 이작용성 기는 1 내지 4개의 탄소 원자를 가지며, 상기 열거된 치환체에 의해 치환 또는 비치환되고, N, O 및 S 그룹중에서 선택된 헤테로원자에 의해 차단될 수 있는 알킬렌이고,

A 및 Z는 그들이 부착된 원자들과 함께 포화 또는 불포화 헤테로사이클릭 환을 형성할 수 있으며, 헤테로사이클릭 환은 추가의 1 또는 2개의 동일하거나 상이한 헤테로원자, 헤테로-기, 또는 헤테로원자 및 헤테로-기를 함유할 수 있고, 헤테로원자는 산소, 황 또는 질소이고, 헤테로-기는 N-알킬이며, 여기에서 N-알킬기중의 알킬은 1 또는 2개의 탄소 원자를 함유하고, 헤테로사이클릭 환은 5 또는 6개의 환 원자를 함유하며,

E는 NO₂ 또는 CN을 나타내고,

X는 -N=을 나타내며,

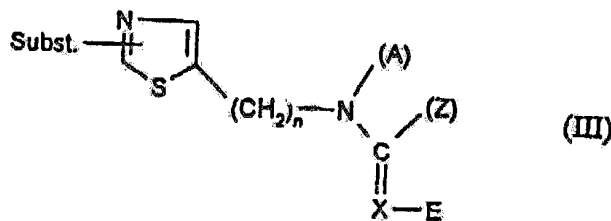
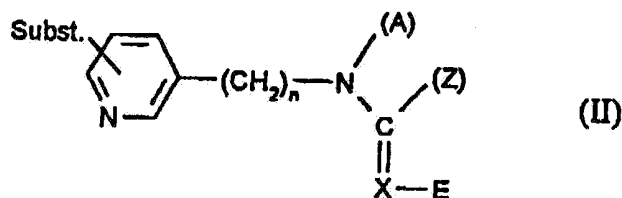
Z는 치환 또는 비치환된 알킬, -OR, -SR 또는 -NRR 라디칼을 나타내고, 여기에서, R 및 치환체는 상기 정의된 바와 같다.

청구항 5

제 4 항에 있어서, 아릴이 페닐인 것을 특징으로 하는 조성물.

청구항 6

제 1 항에 있어서, 활성물질이 하기 일반식 (II) 또는 (III)의 화합물임을 특징으로 하는 조성물:



상기 식에서,

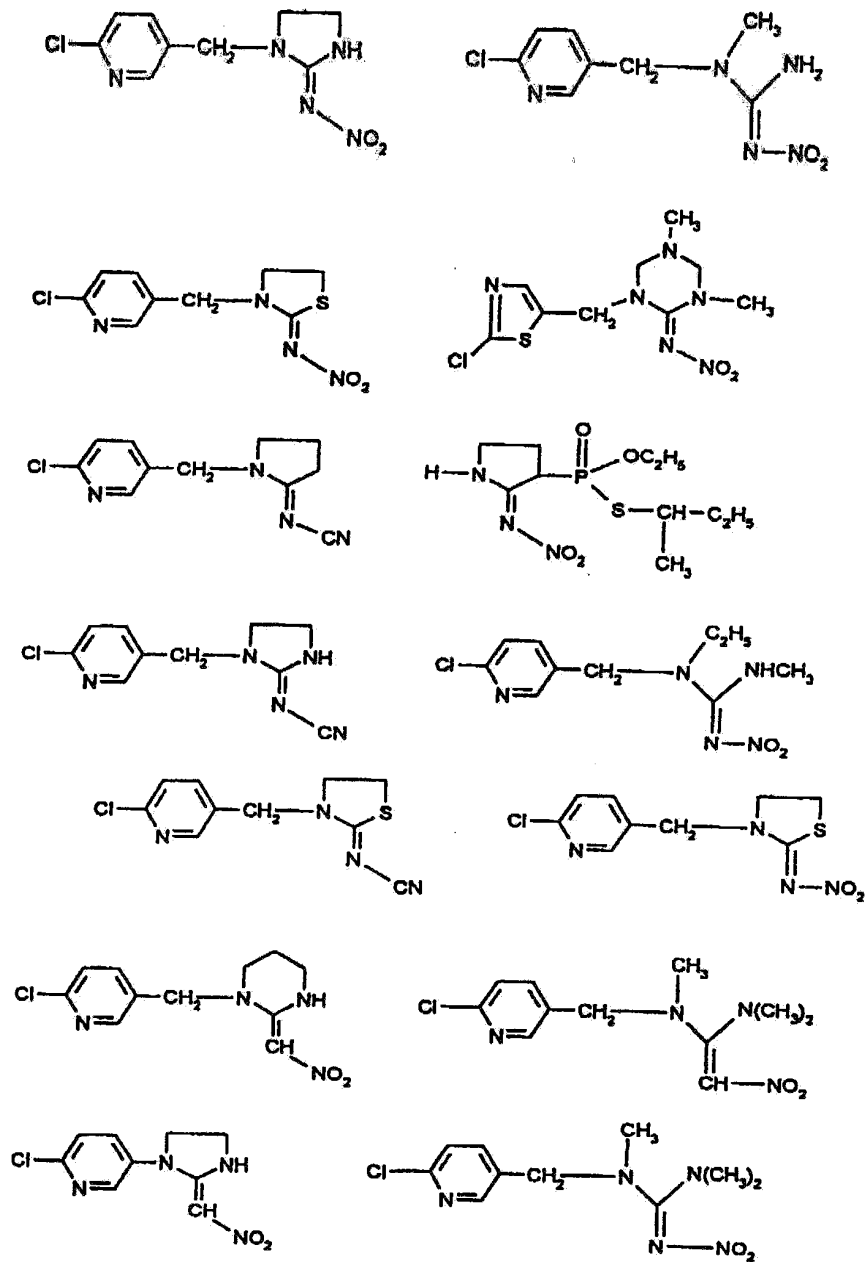
n은 1 또는 2를 나타내고,

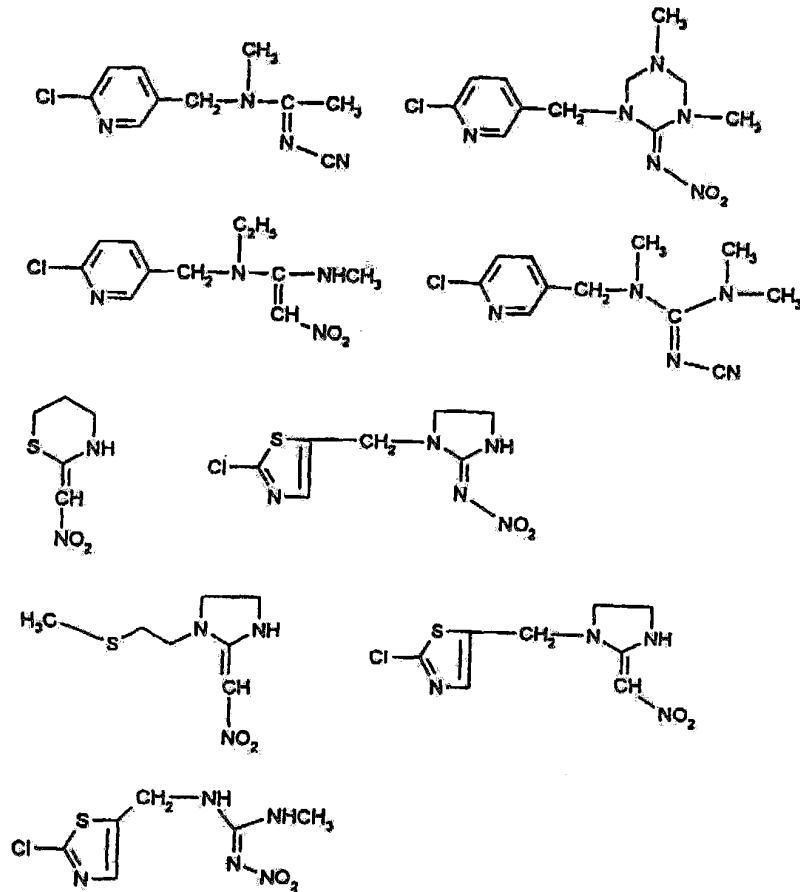
subst는 할로겐을 나타내며,

A, Z, X 및 E는 제 4 항에서 정의된 바와 같다.

청구항 7

제 1 항에 있어서, 활성물질이 다음 식의 화합물임을 특징으로 하는 조성물:



**청구항 8**

제 1 항에 있어서, 활성물질이 1-[(6-클로로-3-피리디닐)메틸]-N-니트로-2-이미다졸리딘아민 (일반명: 이미다클로프리드)임을 특징으로 하는 조성물.

청구항 9

제 1 항, 제 2 항 내지 제 8 항에 있어서, 1 내지 12.5 중량%의 농도의 활성물질을 함유하는 것을 특징으로 하는 조성물.

청구항 10

제 1 항, 제 2 항 내지 제 8 항에 있어서, 용매로서 벤질 알콜을 함유하는 것을 특징으로 하는 조성물.

청구항 11

제 1 항, 제 2 항, 내지 제 8 항에 있어서, 벤질 알콜 및 치환 또는 비치환된 피롤리돈 그룹중에서 선택된 용매가 40 내지 90 중량%의 농도로 존재하는 것을 특징으로 하는 조성물.

청구항 12

제 1 항, 제 2 항 내지 제 8 항에 있어서, 사이클릭 카보네이트 또는 락톤이 에틸렌 카보네이트, 프로필렌 카보네이트 또는 γ -부티로락톤로부터 선택되는 것을 특징으로 하는 조성물.

청구항 13

제 1 항, 제 2 항 내지 제 8 항에 있어서, 사이클릭 카보네이트 및 락톤의 그룹중에서 선택된 용매가 7.5 내지 50 중량%의 농도로 존재하는 것을 특징으로 하는 조성물.

청구항 14

제 1 항, 제 2 항 내지 제 8 항에 있어서, 추가의 활성물질로서 프로폭수르, 사이플루트린, 플루메트린, 피리프록시펜, 메토프렌, 다이아지논, 아미트라즈, 펜티온 및 레바미솔의 그룹에서 선택된 물질을 함유하는 것을 특징으로 하는 조성물.

청구항 15

제 1 항에 따른 조성물의 치료학적으로 유효한 양을 기생충의 피부 구제가 필요한 인간을 제외한 동물에게 적용하는 단계를 포함하는 것을 특징으로 하여 인간을 제외한 동물의 기생충을 피부 구제하는 방법.

요약

본 발명은 하기 조성을 갖는, 동물의 기생충의 피부 구제를 위한 제제에 관한 것이다:

-제제의 총중량을 기준으로 1 내지 20 중량% 농도의 곤충의 니코틴성 아세틸콜린 수용체의 작용제 또는 길항제;

-제제의 총중량을 기준으로 적어도 20 중량% 농도의 벤질 알콜 및 임의로 치환된 피롤리돈의 그룹중에서 선택된 용매;

-필요에 따라, 제제의 총중량을 기준으로 5.0 내지 80 중량% 농도의 사이클릭 카보네이트 및 락톤의 그룹중에서 선택된 추가의 용매;

-필요에 따라, 제제의 총중량을 기준으로 0.025 내지 10 중량% 농도의 농후제, 전연제, 착색제, 향산화제, 추진제, 방부제, 접착제, 유화제의 그룹중에서 선택된 추가의 보조제.