(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2014-0103188
(43) 공개일자 2014년08월25일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
A01N 43/16 (2006.01) *A01P 17/00* (2006.01)
(21) 출원번호 10-2014-7021621(분할)
(22) 출원일자(국제) 2005년11월03일
심사청구일자 없음
(62) 원출원 특허 10-2007-7010019
원출원일자(국제) 2005년11월03일
심사청구일자 2010년11월03일
(85) 번역문제출일자 2014년07월31일
(86) 국제출원번호 PCT/US2005/040146
(87) 국제공개번호 WO 2006/050519
국제공개일자 2006년05월11일
(30) 우선권주장
60/624,579 2004년11월03일 미국(US)

(71) 출원인
이 아이 듀폰 디 네모아 앤드 캄파니
미합중국 델라웨아주 (우편번호 19898) 윌밍톤시 마아켓트 스트리이트 1007
(72) 발명자
시알돈, 마크
미국 19390 펜실바니아주 웨스트 그로브 알스미어 드라이브 77
(74) 대리인
김영, 장수길

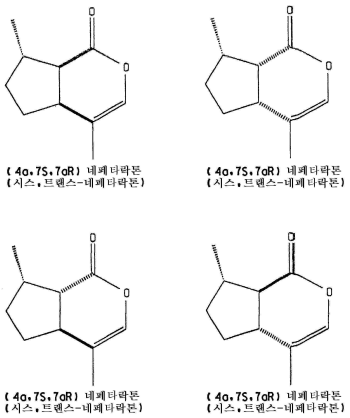
전체 청구항 수 : 총 13 항

(54) 발명의 명칭 **디히드로네페타락톤, 알코올 및 에스테르를 포함하는 방충제 조성물**

(57) 요 약

개박하 (네페타(Nepeta) 종), 예컨대 네페타 카타리아(Nepeta cataria)의 정유의 소량 천연 성분인 디히드로네페타락톤이 효과적인 방충제 화합물로 확인되었다. 디히드로네페타락톤의 합성은 개박하 정유의 주요 성분인 네페타락톤의 수소화에 의해 달성될 수 있다. 향료 성질도 갖는 이 화합물 및 그의 조성물은 그의 방충 성질로 인해서 상업적으로 이용될 수 있다.

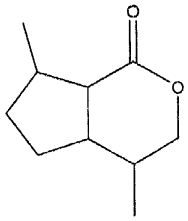
대 표 도 - 도1



특허청구의 범위

청구항 1

(a) 하기 화학식으로 표시되는 디히드로네페타락톤, 또는 디히드로네페타락톤 입체이성질체들의 혼합물,



(b) (i) C_6-C_{20} 선형, 분지형 또는 시클릭 알칸올 및 (ii) C_{10}-C_{50} 알코올로부터 선택되는 알코올, 및

(c) 에스테르를 포함하는 방충제 조성물.

청구항 2

제1항에 있어서, C_6-C_{20} 선형, 분지형 또는 시클릭 알칸 폴리올을 추가로 포함하는 조성물.

청구항 3

제1항에 있어서, C_4-C_{400} 폴리에틸렌 글리콜을 추가로 포함하는 조성물.

청구항 4

제1항에 있어서, C_4-C_{400} 폴리에틸렌 에테르 글리콜을 추가로 포함하는 조성물.

청구항 5

제1항에 있어서, C_{12}-C_{60} 알코올의 C_{14}-C_{140} 폴리에틸렌 글리콜 에테르를 추가로 포함하는 조성물.

청구항 6

제1항에 있어서, C_{12}-C_{60} 알코올의 C_{16}-C_{140} 폴리에틸렌 글리콜 에테르를 추가로 포함하는 조성물.

청구항 7

제1항에 있어서, 파라벤을 추가로 포함하는 조성물.

청구항 8

제7항에 있어서, 파라벤이 메틸파라벤, 에틸파라벤, 프로필파라벤, 이소프로필파라벤, 부틸파라벤, 이소부틸파라벤, 이소데실파라벤, 벤질파라벤 및 페닐파라벤으로 이루어진 군으로부터 선택되는 것인 조성물.

청구항 9

제1항에 있어서, 물을 추가로 포함하는 조성물.

청구항 10

제1항에 있어서, 에스테르가 C_{12}-C_{40} 카르복실산 및 C_8-C_{40} 폴리에틸렌 글리콜의 에스테르를 포함하는 것인 조성물.

청구항 11

제1항에 있어서, 에스테르가

(a) 아밀, 메틸, 부틸, 에틸, 에톡시에탄올, 에톡시디글리콜, 테트라히드로푸르푸릴, 이소아밀, 이소부틸, 이소프로필 또는 프로필 아세테이트;

(b) 이소부틸, 메틸, 스테아릴, 옥틸, 라우릴, 미리스틸 또는 팔미토일 벤조에이트;

(c) 디메틸 프탈레이트, 글루타레이트, 말레에이트, 아디페이트 또는 숙시네이트;

(d) 옥틸, 라우릴, 미리스틸, 팔미토일 또는 스테아릴 살리실레이트;

(e) 글리콜 올레에이트, 팔미테이트, 스테아레이트 또는 리시놀레에이트;

(f) 부틸 이소스테아레이트, 미리스테이트 또는 올레에이트;

(g) 세틸 아세테이트, 카프릴레이트, 락테이트, 라우레이트, 옥타노에이트 또는 올레에이트;

(h) 이소스테아릴 벤조에이트, 락테이트, 네오펜타노에이트, 옥타노에이트, 팔미테이트 또는 미리스테이트;

(i) 이소아밀 라우레이트;

(j) 이소부틸 미리스테이트, 팔미테이트, 펠아르고네이트 또는 스테아레이트;

(k) 이소세틸 이소데카노에이트, 팔미테이트 또는 스테아레이트;

(l) 이소데실 시트레이트, 히드록시스테아레이트, 라우레이트, 미리스테이트, 네오펜타노에이트, 팔미테이트 또는 스테아레이트;

(m) 이소프로필 히드록시스테아레이트, 이소스테아레이트, 라놀에이트, 라우레이트, 리놀레에이트, 미리스테이트, 올레에이트, 팔미테이트 또는 스테아레이트;

(n) 메틸 히드록시스테아레이트, 라우레이트, 이소스테아레이트, 미리스테이트, 올레에이트, 팔미테이트, 스테아레이트 또는 펠아르고네이트;

(o) 폴리글리세릴 미리스테이트, 올레에이트, 펜타스테아레이트 또는 리시놀레에이트;

(p) 스테아릴 아세테이트, 벤조에이트 또는 락테이트;

(q) C_{12}-C_{60} 알코올의 C_{16}-C_{140} 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 인산 에스테르 및 디에스테르;

(r) 글리세릴 카프릴레이트, 카프레이트, 히드록시스테아레이트, 이소팔미테이트, 이소스테아레이트, 라놀에이트, 라우레이트, 올레에이트, 리놀레에이트, 리놀레네이트, 미리스테이트, 팔미테이트, 스테아레이트 또는 리시놀레에이트; 및

(s) 프로필렌 글리콜 히드록시스테아레이트, 이소스테아레이트, 스테아레이트, 라우레이트, 리놀레에이트, 미리스테이트, 리시놀레에이트, 올레에이트 또는 카프릴레이트로 이루어지는 군으로부터 선택되는 것인 조성물.

청구항 12

제1항에 있어서, 액체로서 배합된 조성물.

청구항 13

제1항에 있어서, 로션으로서 배합된 조성물.

명 세 서

기 술 분 야

[0001] 본 출원은 2004년 11월 3일자로 출원된 미국 가출원 제 60/624,579 호의 이점을 청구하고 있으며, 상기 출원은 모든 목적을 위하여 본원의 일부로서 전체로 인용된다.

배 경 기 술

[0002] 방충제 물질은 일반적으로 곤충을 곤충 수용성 식품 원료 또는 주거지로부터 쫓거나 퇴치한다. 대부분의 공지

된 방충제들은 경미한 독성만을 띤다. 실제로, 몇몇 공지된 방충제들은 전혀 활성 독성물질이 아니며, 오히려 곤충 먹이 원료 또는 생육 조건을 끌리지 않게 또는 불리하게 만드는 것에 의해 식물/동물 또는 제품에 대한 손해를 방지한다. 현재 대부분의 상업적인 방충제들은 합성 화학물질인 N,N-디에틸-m-톨루아미드(DEET)를 그의 주요 활성 성분으로서 함유한다. 예를 들어, 오프!(Off!)®, 딥 우즈 오프!(Deep Woods Off!)®, 및 커터(Cutter)®와 같은 주요 상업적 상표명들로 시판되는 방충제들은 모두 DEET에 기초한 제품들이며, 방충제 판매량의 85%를 이룬다(미국 소비자 보고서 구매 가이드(Consumer Reports Buying Guide), 1994 특별 연말 발간). 게다가, 소비자 보고서 시험은 가장 높은 농도의 DEET를 포함하는 제품이 가장 오래 모기에 대한 효력을 유지한다는 것을 보여 주었다.

[0003] 하지만, 이 화합물은 효과적인 방충제임에도 불구하고 특정 단점들을 갖는다. 구체적으로, 이 화합물은 냄새가 불쾌하고, 피부에 미끄러운 느낌을 준다. 최근에 EPA에 의해 미국 내 사용이 공인되었지만, 특히 어린이에게 사용 시, 안전성에 대한 우려가 높아지고 있다 (브리아술리스, 지.(Briassoulis, G.); 날리오글로우, 엠.(Narlioglou, M.); 하트지스, 티.(Hatzis, T.)의 문헌[(2001) Human & Experimental Toxicology 20(1), 8-14]). 어떤 연구들은 고 농도의 DEET가 어떤 사람들에게는 알레르기 또는 독성 반응을 유발할 수 있다는 것을 보여주었다. DEET와 관련된 다른 문제점들에는 (1) 제한된 활성 범위를 갖는 합성 화학물질이라는 점; (2) 강력한 가소제이고, 다수의 플라스틱 및 페인트칠 표면을 용해시키거나 훼손할 것이라는 점; 및 (3) 유효 기간을 늘이기 위하여 국소 배합물 중에 전형적으로 사용되는 불활성 성분들을 가소화시킨다는 점이 포함된다. 이는 DEET 배합물의 사용자 수용성을 저하시킬 수 있다.

발명의 내용

해결하려는 과제

[0004] 상기한 바와 같은 한계점으로 인해서, DEET를 포함하지 않는 방충 활성 제품을 소비자들이 원하고 있으며, 천연 산물(DEET와 같은 합성 화학물질에 대한)을 함유하는 조성물에 대한 수요가 증가하고 있다. 이러한 DEET를 포함하지 않는 방충제 화합물들은 우수한 방충성, 높은 잔류 활성 및 인간 (또는 애완동물) 및 환경에 대해 비교적 저독성이거나 무독성이라는 성질들의 조합을 필요로 한다. 이러한 소비자 요구에 부응하여, 천연 식물 재료로부터 얻을 수 있거나, 그로부터 합성할 수 있고 사용하기 쾌적한 신규한 방충제 화합물을 개발하고자 하는 계속되는 필요가 존재한다.

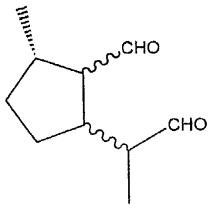
과제의 해결 수단

[0005] 다수의 식물 종들은 방충제 및 향료 화학물질의 천연 원료로서 사용되는 정유 (방향유)를 생산한다 (헤이, 알. 케이.엠.(Hay, R.K.M.), 스보보다, 케이.피.(Svoboda, K.P.)의 문헌[Botany, in 'Volatile Oil Crops: their biology, chemistry and production'. 헤이, 알.케이.엠., 워터만, 피.지.(Waterman, P.G.) (편집), Longman Group UK Limited (1993)]. 곤충에 대한 전반적인 방충성으로 인해 알려져 있는 시트로넬라 기름은 볏과 식물 심보포곤 윈테리아누스(Cymbopogon winterianus) 및 씨. 나르더스(C. nardus)로부터 얻는다. 향료 화학물질의 원료로서 사용되는 식물의 예는 멜리사 오피시날리스(Melissa officinalis)(멜리사), 페릴라 프루테신스(Perilla frutescenes)(들깨), 포소스테몬 캐블린(Posostemon cablin)(파출리) 및 다양한 라반둘라 종(Lavandula spp.) (라벤더)을 포함한다. 향료 산업에 대해 가치 있는 기름을 생산하는 식물의 이러한 예 모두는 광대나물 (라미아세(Lamiaceae)) 과이다. 네페타(Nepeta) 속의 식물 (개박하) 또한 이러한 과에 속하며, 소량으로 시판되고 있는 품목인 정유를 생산한다. 이 기름에는 이리도이드로 알려져 있는 모노테르페노이드 화합물 부류 (이노우에, 에이취.(Inouye, H.)의 문헌[Iridoids. Methods in Plant Biochemistry 7: 99-143 (1991)]), 더 구체적으로는 메틸시클로펜타노이드 네페타락톤 (클라크, 엘. 제이.(Clark, L.J.) 등의 문헌[The Plant Journal, 11: 1387-1393 (1997)]) 및 유도체가 매우 풍부하다.

[0006] 이리도이드 모노테르페노이드는 장시간 다양한 곤충 종에 대해 효과적인 방충제인 것으로 알려져 있다 (아이스너, 티.(Eisner, T.)의 문헌[(1964) Science 146: 1318-1320]; 아이스너, 티.의 문헌 [(1965) Science 148: 966-968]; 피터슨, 씨.(Peterson, C.) 및 코츠, 제이.(Coats, J.)의 문헌 [(2001) Pesticide Outlook 12: 154-158]; 페터슨, 씨.(Peterson, C.) 등의 문헌 [(2001) Abstracts of Papers American Chemical Society 222 (1-2)]; AGRO73). 미국 특허 제 4,663,346 호는 비시클릭 이리도이드 락톤 (예를 들어, 이리도미르메신)을 포함하는 조성물을 포함하는 방충제를 개시한다. 게다가, 미국 특허 제 4,869,896 호는 DEET에 의한 강화 방충제 혼합물 중에서의 이들 비시클릭 이리도이드 락톤 조성물의 용도를 개시한다.

[0007] 네페타락톤으로부터 유도된 이리도이드 모노테르페노이드의 한 부류인 디히드로네페타락톤(도 1에 도시되어 있음)의 방충성에 관한 이전 연구들은 매우 결론적이지 못하고, 이들 화합물들이 인간 사회에 흔한 해충들에 대한 방충 효과를 발휘한다는 것을 교시하거나 암시하지 못하였다. 예를 들어, 개미 이리도미르멕스 니티더스(Iridomyrmex nitidus)의 항문선 분비물의 조성물에 대한 연구는 이소디히드로네페타락톤이 상당한 양으로 이소이리도미르메신과 함께 존재했다는 것을 보여주었다 (카빌, 지.더블유.케이.(Cavill, G.W.K.) 및 디.브이. 클라크(D.V. Clark)의 문헌 [(1967), J. Insect Physiol. 13:131-135]). 이소이리도미르메신은 그 당시에 양호한 "큰 타격의(knockdown)" 살충 활성을 갖는 것으로 알려졌지만, 이소디히드로네페타락톤에 대한 유사한 활성을 지지하는 증거가 전혀 제공되지 않았고, 이 화합물의 방충 효과(살충 활성과 구별되는)에 대한 어떠한 조사도 이루어지지 않았다.

[0008] 카빌, 지.더블유.케이. 등(Cavill, G.W.K., et al.)에 의한 후속 문헌 [Tetrahedron 38:1931-1938 (1982)]에서는, 개미의 방어 분비물 중에 디히드록네페타락톤이 존재하는 것이 다시 보고되었지만, 저자들은 디히드록네페타락톤보다는 이리도디알 화합물이 기본적인 방충 성분이라고 결론내렸다.



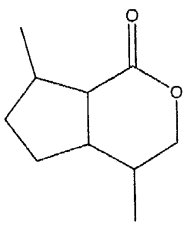
[0009] 이리도디알

[0010] 가장 최근에는, 문헌 [Jefson, M., et al., J. Chemical Ecology 9:159-180 (1983)]에서 디히드로네페타락톤의 방충 효과가 설명되었다. 비희석된 화합물에 의해 야기되는 초기 방충성을 먹이를 주면서 개미 종인 모노모리움 디스트럭터(Monomorium destructor)에 대해 측정하였다. 순수한 디히드로네페타락톤에 대해 노출한지 25초 후, 약 50-60%의 개미가 먹이 먹는 것을 중지하였다. 하지만, 보다 긴 시간 동안의 방충성에 대한 추가 분석이 나타나 있지 않으며, 순수한 비희석 화합물이 아닌 다른 것을 이용한 분석도 나타나 있지 않다. 농축된 화학물질을 이용하고 이렇게 짧은 시간(초)에 걸쳐 관찰된 방충성은 국소 방충제와 같은 실제적인 적용에서의 효능을 예측하게 하기에는 불충분하다.

[0011] 결과적으로, 개선된 방충 특성(DEET에 대해)을 갖고, 실질적으로 인간에게 무독성이거나 경미한 독성만을 갖는, 생물학적 기반의 화합물에 대한 계속되는 필요가 존재한다. 바람직한 방충제는 다양한 곤충, 예를 들어 살을 무는 곤충, 나무를 파는 곤충, 해충, 가정 내 해충 등에 대해 활성을 가질 것이다. 본 출원인은 디히드로네페타락톤, 및 그의 조성물이 선행 기술 조성물들의 불리한 특성들을 갖지 않는 새로운 부류의 효과적인 방충제 화합물로서 우수하게 작용한다는 것을 발견하였다.

[0012] 발명의 요약

[0013] 본 발명의 한 실시태양은 하기 화학식으로 표시되는 디히드로네페타락톤, 또는 디히드로네페타락톤의 입체이성질체 혼합물을 함유하는 방충제 조성물 또는 물품이다:



[0014]

[0015] 본 발명의 다른 실시태양은 상기 설명된 바와 같은 디히드로네페타락톤, 또는 디히드로네페타락톤 입체이성질체의 혼합물을, 조성물 또는 제품으로 제공하거나, 조성물 또는 제품 중에 혼입하는 것에 의해, 방충제 조성물 또는 방충제 제품을 제조하는 방법이다.

[0016] 본 발명의 또다른 실시태양은 상기 설명된 바와 같은 디히드로네페타락톤, 또는 디히드로네페타락톤 입체이성질

체 혼합물, 또는 이들의 조성물의 방충제로서의 용도; 및 그에 따라, 방충 방법에서 곤충들이 상기 설명된 바와 같은 디히드로네페타락톤, 또는 디히드로네페타락톤 입체이성질체 혼합물, 또는 이들의 조성물에 노출되는 실시태양이다.

[0017] 본 발명의 또다른 실시태양은 상기 설명된 바와 같은 디히드로네페타락톤, 또는 디히드로네페타락톤 입체이성질체 혼합물 및 하나 이상의 담체, 보조제(adjuvant) 및 첨가제를 포함하는 배합된 방충제 조성물이다.

발명의 효과

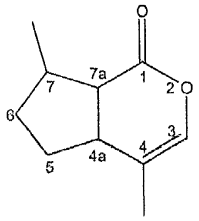
[0018] 본 출원인은 디히드로네페타락톤, 및 그의 조성물이 선행 기술 조성물들의 불리한 특성들을 갖지 않는 새로운 부류의 효과적인 방충제 화합물로서 우수하게 작용한다는 것을 발견하였다.

도면의 간단한 설명

[0019] 도 1은 천연 이리도이드(메틸시클로펜타노이드)네페타락톤의 화학적 구조를 나타낸다.

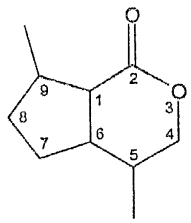
발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

[0020] 네페타락톤은 하기 화학식을 갖는 화합물이다:

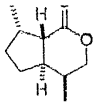
[0021] 

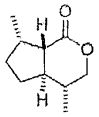
[0022] 상기한 바와 같이 네페타락톤의 메틸시클로펜타노이드 주쇄 내부의 탄소 4, 4a, 7 및 7a에 4개의 키랄 중심이 존재한다; (7S)-네페타락톤은 몇 가지 식물 및 곤충에 의해 생산된다. 디히드로네페타락톤은 네페타 속의 몇 가지 광대나물과 식물 정유의 소량 성분으로 알려져 있다 (레그니에, 에프.이.(Regnier, F.E.) 등의 문헌 [(1967) Phytochemistry 6: 1281-1289]; 데푸테르, 에이취.엘.(DePooter, H.L.) 등의 문헌 [(1988) Flavour and Fragrance Journal 3: 155-159]; 핸드지에바, 엔.브이.(Handjieva, N.V.) 및 에스.에스. 포포브(S.S. Popov)의 문헌 [(1996) J. Essential Oil Res. 8: 639-643]). 디히드로네페타락톤은 하기 화학식 1로 표시된다:

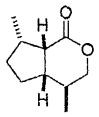
화학식 1

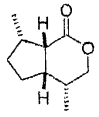
[0023] 

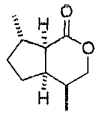
[0024] 상기 화학식에서, 1, 5, 6 및 9는 분자의 4개의 키랄 중심을 나타내고 도시된 구조는 디히드로네페타락톤의 모든 입체이성질체들을 포함하는 것이다. (7S)-네페타락톤으로부터 유도될 수 있는 디히드로네페타락톤 입체이성질체의 구조는 하기에 도시된 바와 같다.

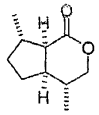

(1S,5S,9S,6R)-5,9-디메틸-3-옥사바이시클로[4.3.0]노난-2-온

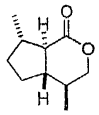

(1S,9S,5R,6R)-5,9-디메틸-3-옥사바이시클로[4.3.0]노난-2-온

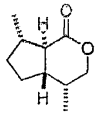

(1S,5S,9S,6S)-5,9-디메틸-3-옥사바이시클로[4.3.0]노난-2-온


(1S,9S,6S,5R)-5,9-디메틸-3-옥사바이시클로[4.3.0]노난-2-온


(9S,5S,1R,6R)-5,9-디메틸-3-옥사바이시클로[4.3.0]노난-2-온


(9S,1R,5R,6R)-5,9-디메틸-3-옥사바이시클로[4.3.0]노난-2-온


(9S,6S,1R,5S)-5,9-디메틸-3-옥사바이시클로[4.3.0]노난-2-온


(9S,6S,1R,5R)-5,9-디메틸-3-옥사바이시클로[4.3.0]노난-2-온

[0025]

[0026] 용어 "디히드로네페타락톤" 또는 "디히드로네페타락톤 혼합물"은 임의의 디히드로네페타락톤 입체이성질체 혼합물을 의미한다. 전체 디히드로네페타락톤 조성물에 대한 이들 이성질체들 각각의 몰 조성 또는 질량 조성은 달라질 수 있다. 디히드록네페타락톤은 "DHN"으로 약칭된다.

[0027] 디히드로네페타락톤은 특별한 이성질체 또는 혼합물이 언급되지 않는다면, 임의의 그리고 모든 디히드로네페타락톤 입체이성질체 및 그의 혼합물을 포함하는 것으로 이해될 것이다. 디히드로네페타락톤이 네페타락톤의 천연 원료로부터 제조될 때, 입체이성질체 몰 농도의 약간의 변화가 예상된다. 그러나 천연 원료로부터의 제조가 바람직한 제조 방법이다.

[0028] 디히드로네페타락톤은 네페타(Nepeta) 속의 몇 가지 광대나물과 식물 정유의 소량 성분으로 문헌들에 보고되고 있다([Regnier, F.E., et al., Phytochemistry 6 : 1281-1289 (1967)]; [DePooter, H.L., et al. , Flavour and Fragrance Journal 3:155-159 (1988)]; [Handjieva, N.V. and S.S. Popov, J. Essential Oil Res. 8:639-643 (1996)]). 뿐만 아니라, 디히드로네페타락톤은 특정 곤충, 예를 들어 반날개[Jefson, M., et al., J. Chem. Ecol. 9:159-180 (1983)] 및 개미, 구체적으로 이리도미르멕스(Iridomyrmex) 종[Cavill, G.W.K. and D.V. Clark. J. Insect Physiol. 13:131-135 (1967)]의 방어 분비물의 구성성분으로서 확인되었다. 디히드로네페타락톤을 갖는 이러한 종들에서는, 이들이 이리도이드 모노테르펜 이리도디알로부터 생합성 유도되는 것으로 제안되었다.

[0029] 디히드로네페타락톤 및 이들의 관련 이리도이드 모노테르페노이드 화합물의 화학적 합성이 설명되었고, 다양한 방식으로 수행되는 것으로 발견되었다. 하기는 합성에 관련된 유용한 참고문헌들이다:

[0030] 1) Abelman, M.M. et al . J. Am. Chem. Soc. 104 (14) :4030-2 (1982)

[0031] 2) Fleming, I. and N. K. Terrett. Tetrahedron Lett. 25(44) : 5103-5104 (1984) ; J. Chem. Soc. , Perkin Trans. 1:2645-2650 (1998).

[0032] 3) Lee, E. and CH. Yoon. J. Chem. Soc, Chem. Commun. 4: 479-81 (1994).

[0033] 4) Nagata, H. and K. Ogasawara. Tetrahedron Lett. 40(36) : 6617-6620 (1999).

[0034] 5) Nangia, A. et al. Tetrahedron Lett. 35(22) : 3755-8 (1994).

[0035] 6) Tanimori, S. and M. Nakayama. Agric Biol. Chem. 55(4) : 1181-1184 (1991).

[0036] 7) Uyehara, T. et al. J. Chem. Soc, Chem. Commun. 2:113-14 (1989); Tennen YnKi Kagobutsu Toronkai Koen Yoshishu 32: 441-6 (1990); J. Org. Chem. 57(11) : 3139-3145 (1992).

[0037] 8) Wolinsky, J. and E.J. Eustace. J. Org. Chem. 37 (21) : 3376-8 (1972).

[0038] 9) Wolinsky, J. and D. L. Nelson. Tetrahedron 25 (17) : 3767-74 (1969).

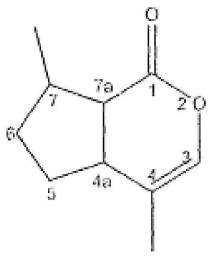
[0039] 레그니에(Regnier) 등의 상기 문헌은 네페타 속의 식물 (개박하)의 정유로부터 분리된 네페타락톤의 촉매 작용 수소화에 의해 네페타락톤으로부터 DHN을 제조하는 것을 개시한다. 그러므로 한가지 바람직하고 편리한 디히드로네페타락톤의 제조 방법은 네페타 속 식물 (개박하)로부터 다양한 방법에 의해 분리된 정유로부터 비교적 순수한 형태로 얻어지는 네페타락톤의 수소화에 의한 것이다. 탄산스트론튬 상에 담지된 산화플라티늄 및 팔라듐과 같은 촉매는 24-90 % 수율로 디히드로네페타락톤을 형성한다 (레그니에 등의 상기 문헌).

[0040] 그러므로, 본 발명에서 화학식 I에 의해 나타내지는 디히드로네페타락톤을 제조하는 바람직한 방법은 제조 비용 및 그 생물학적 기초의 관점에서 산업적으로 유리한 접근법인, 소정의 네페타락톤 입체이성질체 함량을 갖는 기름으로 식물로부터의 네페타락톤을 수소화시키는 것에 의한 것이다. 다른 방법들은 US 03/225,290(WO 03/84946)에 개시되어 있는 바와 같으며, 이는 모든 목적을 위해 본원의 일부로서 전체로 인용되고 있다.

[0041] 정유를 단리 또는 추출하는 방법에는 증기 증류, 유기 용매 추출, 마이크로파 보조 유기 용매 추출, 초임계 유체 추출, 기계적 추출 및 냉침법 (지방으로의 초기 냉각 추출 후의 유기 용매 추출)이 포함되지만, 이들에 한정되지는 않는다.

[0042] 다른 종류의 네페타 종으로부터 분리된 정유는 각각의 네페타락톤 천연 입체이성질체를 다른 비율로 포함하는 것으로 알려져 있다 (레그니에 등의 상기 문헌; 데푸테르 등의 상기 문헌; 핸드지에바 등의 상기 문헌). 그러므로 임의의 네페타 종으로부터 유도된 기름으로부터 제조된 DHN은 필수적으로 그의 입체이성질체 혼합물일 것인데, 그 혼합물의 조성은 그것이 유도되는 네페타의 특정 종에 따라 다르다.

[0043] 상기한 바와 같이, 4개의 키랄 중심이 네페타락톤의 메틸시클로펜타노이드 주쇄 내부에 탄소 4, 4a, 7 및 7a에 존재한다:

[0044] 

[0045] 총 8쌍의 디히드로네페타락톤 거울상이성질체가 네페타락톤의 수소화 이후에 가능하다. 이들 중에서, 지금까지 기술된 천연 입체이성질체는 (9S)-디히드로네페타락톤이다. 본 발명에 따른 바람직한 방충제 물질은 임의의 또는 전부의 디히드로네페타락톤의 가능한 입체이성질체들을 포함한다. 더 바람직한 방충제 물질은 (9S)-디히드로네페타락톤의 혼합물을 포함한다. 가장 바람직하게는 (7S)-네페타락톤으로부터 유도된 (9S)-디히드로네페타락톤 입체이성질체이다. 이것은 도 1에 도시된 바와 같이, 시스,트랜스-네페타락톤, 시스,시스-네페타락톤, 트랜스,시스-네페타락톤 및 트랜스,트랜스-네페타락톤으로 알려져 있는 화합물을 포함한다. 엔. 카타리아(N. cataria)에 의해 생산되는 주요 입체이성질체들 (시스,트랜스 및 트랜스,시스-)가 바람직하다.

[0046] 수소화 반응 완결 시, 형성된 이성질체 생성물의 혼합물을 편리한 방법 (예를 들어, 분취 액체 크로마토그래피)에 의해 분리하여 각각의 고순도 디히드로네페타락톤의 부분입체이성질체 쌍을 얻을 수 있다. 이것에 의해 특정 곤충에 대해 가장 효과적인 다양한 여러 가지 부분입체이성질체들을 발견할 수 있다. 식물로부터 특정 네페타락톤 이성질체를 분리하여 수소화에 의해 부분입체이성질체의 그의 상응하는 쌍으로 전환시키는 것이 바람

직하다.

[0047] 여러 가지 네페타 종들 사이에 네페타락톤 입체이성질체 함량이 다양하다는 것과 함께, 종 내부 다양성도 존재하는 것으로 알려져 있다. 실제로, 주어진 종의 식물들이 성장 조건 또는 수확 시 성장 단계에 따라 다른 조성을 갖는 기름을 생산할 것이다. 실제로 성장 조건 또는 수확 시의 성장 단계와 상관없는 기름 조성에 있어서의 다양성을 네페타 라세모사(Nepeta racemosa)에서 발견했다 (클라크, 엘.제이. 등의 상기 문헌). 다른 기름 조성을 나타내는 식물을 화학형이라 한다. 네페타 라세모사에 있어서, 여러 가지 네페타락톤 입체이성질체들의 비율에 있어서 현저한 차이를 나타내는 화학형들이 존재한다. 그러므로, 특정 디히드로네페타락톤 거울상이성질체를 제조하기 위한 바람직한 방법은 특정 네페타락톤 입체이성질체들을 포함하는 것으로 알려져 있는 네페타 화학형으로부터의 기름의 수소화이다.

[0048] 곤충은 성숙 단계 (비성숙 곤충 단계는 유충 및 번데기를 포함한다)에서, 몸체가 머리, 가슴 및 배로 나뉘고, 3쌍의 다리와, 종종 (항상은 아님) 2 쌍의 막 형태의 날개를 갖는 것을 특징으로 하는 대규모 군의 무척추 동물의 임의의 일원을 포함한다. 그러므로 이러한 정의는 다양한 무는 곤충 (예를 들어, 개미, 벌, 진디등에, 털진드기, 벼룩, 그린 헤드 플라이, 모기, 마구간 파리, 진드기, 말벌), 나무를 파는 곤충 (예를 들어, 흰개미), 해충 (예를 들어, 집파리, 바퀴벌레, 이, 진딧물, 나무 이), 및 가정 내 해충 (예를 들어 밀가루 및 콩 딱정벌레, 집먼지진드기, 나방, 좀벌레, 비구미)을 포함하지만 이것으로 제한되는 것은 아니다.

[0049] 숙주는 곤충의 영향을 받는 임의의 식물 또는 동물이다. 전형적으로, 숙주는 곤충 수용성 식품 원료 또는 곤충 수용성 서식지인 것으로 생각된다. 곤충 취약성 물품은 곤충에 의해 영향 받는, 인간에 의해 만들어진 임의의 상업 품목이다. 여기에는 건물, 가구 등이 포함될 수 있다. 전형적으로는, 이들 제품들은 곤충 수용성 식품 원료 또는 곤충 수용성 서식지인 것으로 생각된다.

[0050] 용어 "방충제", "방충제 조성물" 또는 "퇴치 조성물"은 곤충이 선호하는 숙주 또는 곤충 적합성 제품으로부터 곤충을 격리시키는 화합물 또는 조성물을 의미할 것이다.

[0051] 대부분의 공지된 방충제들은 전혀 활성 독성 물질이 아니며, 오히려 곤충 먹이 원료 또는 생육 조건을 끌리지 않게 또는 불리하게 만드는 것에 의해 식물/동물 또는 제품에 대한 손해를 방지한다. 전형적으로, 방충제는 숙주에 국소 도포될 수 있는 화합물 또는 조성물이거나, 곤충 취약성 물품 내로 혼입되어 숙주 또는 물품이 존재하는 3차원 공간 근방으로부터 곤충을 격리시키는 방충 물품을 제조할 수 있는 화합물 또는 조성물이다. 어떤 경우라도, 방충제의 효과는 (1) 숙주로부터 곤충을 쫓거나 퇴치함으로써 곤충이 숙주를 "무는" 빈도를 최소화하는 것; 및/또는 (2) 곤충 취약성 물품으로부터 곤충을 쫓거나 퇴치함으로써 물품을 곤충에 의한 손해로부터 보호하는 것이다. 방충제는 기체(후각), 액체, 또는 고체(미각) 형태일 수 있다.

[0052] 공지된 방충제의 일부 예로는 벤질; 벤질 벤조에이트; 2,3,4,5-비스(부틸-2-엔) 테트라히드로푸르푸랄 (MGK 방충제 11); 부톡시폴리프로필렌 글리콜; N-부틸아세트아닐리드; n-부틸-6,6-디메틸-5,6-디히드로-1,4-피론-2-카르복실레이트 (인달론); 디부틸 아디페이트; 디부틸 프탈레이트; 디-n-부틸 숙시네이트 (타바트렉스); N,N-디에틸-메타-톨루아미드 (DEET); 디메틸 카르베이트 (엔도, 엔도)-디메틸 바이시클로[2.2.1]헵트-5-엔-2,3-디카르복실레이트); 디메틸 프탈레이트; 2-에틸-2-부틸-1,3-프로판디올; 2-에틸-1,3-헥산디올 (룻거스 612); 디-n-프로필 이소신코메로네이트 (MGK 방충제 326); 2-페닐시클로헥산올; p-메탄-3,8-디올, 및 n-프로필 N,N-디에틸숙시나메이트가 포함된다. 모기, 진드기 등에 대한 표준 방충제로는 시트로넬라 기름(하기에서 논의함), 디메틸 프탈레이트, n-부틸메시틸 옥시드 옥살레이트 및 2-에틸 헥산디올-1,3가 있다(문헌 [Kirk-Othmer Encyclopedia of Chemical Technology, 2nd Ed., Vol. 11: 724-728; and The Condensed Chemical Dictionary, 8th Ed., p 756] 참조).

[0053] 방충제는 숙주로부터 곤충을 격리하는 임의의 화합물 또는 조성물이다. 그러한 사용법은 장시간 동안 이로운 효과를 나타내는 것들 및/또는 곤충 행동에 대한 괄목할 만한 효과가 있기 이전에 매우 높은 표면 농도를 필요로 하는 것들과 비교해서 매우 단시간의 효과를 나타내는 화합물들에 있어서 차이가 없다는 것이 이해될 것이다.

[0054] 그러므로 용어 "방충제"는 처리가 전혀 안 된 경우에 비교하여 숙주를 곤충으로부터 보호하는 화합물 또는 조성물을 나타내는 것이다. 보호는 바람직하게는 통계적인 곤충 수의 상당한 감소를 야기하며, 예를 들어 인간을 포함하는 처리된 동물 및 처리된 무생물 표면에 대한 곤충 행동을 관찰하는 시험으로 평균 완전 보호 시간 ("CPT")을 측정하는 것에 의해 통상적으로 측정될 수 있다. 평균 CPT는 처리된 표면에서 최초 착륙, 탐색 또는 물기 (무는 곤충의 경우) 또는 기어다니기 (진드기 또는 털진드기의 경우) 이전까지의 시간을 관찰하는 시험들

을 반복하는 경우의 평균 시간을 의미한다 (예를 들어, 문헌 [US EPA Office of Prevention, Pesticides and Toxic Substances product performance test quidelines OPPTS 810.3700]; 및 프래딘, 엠.에스.(Fradin, M.S.) 및 데이, 제이.에프(Day, J.F.)의 문헌 [(2002) New Egland Journal of Medicine 347, 13-18]을 참고한다). 본 발명의 한 실시태양에 있어서, 그의 방충제 조성물은 통계학적으로 DEET와 차이가 없는 평균 CPT를 갖는다. DHN 조성물 및 DEET의 각각의 평균 CPT 성능이 통계학적으로 차이를 나타내지 않는 이러한 조건의 시험에 있어서, 이용되는 시험 조건 (활성 성분의 양 포함)은 물론 동일해야 하고, 또는 동일하지 않다면, 기술된 조건의 존재를 증명할 목적으로 결과를 이용하는 것을 막지 않는 방법에서만 달라야 한다.

[0055] 상기한 바와 같이, DHN은 성능 면에서 DEET에 유리하게 비교된다. 게다가, DEET 및 다수의 기타 방충제들이 천연 원료로부터 제조되지 않는 것인 반면에, DHN은 유리하게 식물 유래의 천연 네페타락톤으로부터 제조되는데-이것은 소비자가 효과적인 방충제를 선택하는데 있어서 중요한 고려 사항이다. 천연 원료로부터의 제조는 낮은 제조 비용에 대한 가능성도 제공한다.

[0056] DHN의 유용한 특성은 효과적인 방충성을 나타내면서 DEET의 냄새에 비해 상당한 개선을 제공한다는 점이다. 본 발명의 DHN 화합물 및 조성물은 좋은 향기를 갖는다. DHN 물질의 향기 성분들은, 예를 들어 조성물 중 1종 이상의 기타 성분들에 의해 이루어지는 후각 반응을 이용하거나 변형하는 것에 의해, DHN 물질들이 방충제 조성물 또는 제품의 전체적인 후각 성분을 부여, 변경, 증대 또는 개선하는데 있어서 유용하도록 한다. 특히, 본 발명의 DHN 조성물들은 최종 방충제 조성물 또는 제품 배합물 중 기타 성분에 의한 냄새를 차단 또는 변형하고/하거나, 특징적인 향기 또는 방향을 부여하는 것에 의해 제품의 소비자 호감도를 개선하는데 이용될 수 있다.

[0057] 상기 설명한 바와 같은 화학적 화합물 및 조성물 뿐 아니라, 다양한 효과적인 방충제들은 정유 및/또는 정유의 활성 성분을 함유한다. "정유"는 향기 및 식물의 다른 특징적인 특성을 갖는 식물로부터 얻어지는 임의 부류의 휘발성 기름으로서 정의된다. 정유인 방충 화합물의 예로는 아몬드 비터 기름, 아니스 기름, 바질 기름, 월계수 기름, 카라웨이 기름, 카르다몸 기름, 세다 기름, 셀러리 기름, 카모마일 기름, 신나몬 기름, 시트로넬라 기름, 클로브 기름, 코리안더 기름, 쿠민 기름, 딜 기름, 유칼립투스 기름, 펜넬 기름, 생강 기름, 그레이프프루트 기름, 레몬 기름, 라임 기름, 민트 기름, 파슬리 기름, 페퍼민트 기름, 페퍼 기름, 장미 기름, 스피어민트 기름(멘톨), 스위트 오렌지 기름, 타임 기름, 심황 기름, 및 윈터그린 기름이 포함된다. 정유 중 활성 성분의 예로는 시트로넬랄, 메틸 살리실레이트, 에틸 살리실레이트, 프로필 살리실레이트, 시트로넬롤, 사프롤, 및 리모넨이 있다.

[0058] 방충제와 달리, 살충제는 경구 섭취, 곤충 큐티클에의 접촉, 또는 공기를 통한 훈증 작용에 의해 곤충을 피독시킬 수 있는 화합물 또는 혼합물이다. 따라서, 살충제는 인간에게 유해한(즉, 질병 벡터로서 직접적으로 유해하거나, 작물, 음식 제품, 또는 텍스타일 직물 파괴를 통해 간접적으로 유해한) 곤충의 생명을 제어하기 위해 고안된 농약(pesticide)의 한 유형이다. 몇몇 공지된 살충제에는 무기 화합물(예를 들어, 비소, 납 및 구리); 천연 유기 화합물(예를 들어, 로테논, 피레트린스, 니코틴, 구리 나프테네이트 및 석유 유도체); 및 합성 유기 화합물(예를 들어, DDT, 디엘드린, 엔드린, 클로르단, 린단, 파라-디클로로벤젠 및 파라티온)이 포함된다.

[0059] 강화된 방충제 조성물은 단독 또는 부가적인 성분의 공지된 효과로부터 합리적으로 예상되거나 예측될 수 있는 실질적으로 과다한 결과를 만드는 방충제 조성물이다. 본 발명에서 강화된 방충제 조성물은 전형적으로, 디히드로네페타락톤 또는 그의 혼합물, 및 그 자체가 디히드로네페타락톤이 아닌 하나 이상의 다른 방충제 화합물(때로는, 비-디히드로네페타락톤 방충제 화합물이라고 불림)을 포함할 것이다.

[0060] 방충제 조성물은 방충 물품의 한 성분으로서 사용될 수 있으며, 여기서 방충 물품은 방충제 조성물이 그 위에 또는 그 안에 존재함으로써 증강, 변경, 또는 증대되는 방충성을 갖는 제품이다. 방충성에 관해서 본원에서 사용되는 바와 같이, 다양한 형태로 사용되는 용어 "변경" 및 "변형"은 조성물에 방충성을 제공하거나 부여하는 방법, 또는 어떤 측면에서 천연 방충성이 결핍된 기존의 방충 특성을 증대시키는 방법, 또는 품질 또는 특성을 변형시키기 위해 기존의 방충성을 보충하는 방법을 의미한다. 용어 "증강"은 방충제 조성물 또는 방충 물품 중의 하나 이상의 방충 특성의 강화(방충성의 종류 및 질에는 변화 없음)를 의미하고자 의도된 것이다.

[0061] 본 발명의 디히드로네페타락톤은 독특한 방충 특성을 가지며, 특히 넓은 범위의 흔한 해충들, 예를 들어 살을 무는 곤충, 나무를 파는 곤충, 해충 및 가정내 해충, 및 인간 사회에 지장을 주는 다른 곤충들에 대해 효과적이다. 이러한 곤충들에는 다양한 살을 무는 곤충(예를 들어, 개미, 벌, 진디등에, 털진드기, 벼룩, 그린 헤드 플라이, 모기, 마구간 파리, 진드기, 말벌, 감침 파리), 나무를 파는 곤충 (예를 들어, 흰개미), 해충 (예를 들어, 집파리, 바퀴벌레, 이, 진딧물, 나무 이), 및 가정 내 해충 (예를 들어, 밀가루 및 콩 딱정벌레, 집먼지 진드기, 나방, 좀벌레, 비구미)이 포함된다. 병원성 미생물을 운반하는 모기의 경우, 이러한 방충 특성들은 그

러한 질환에의 감염을 방지하는데 추가적으로 효과적이다.

[0062] 대부분(전부는 아니더라도)의 방충제들이 그 구조에 있어 극성 부분 및 비극성 부분을 모두 함유하고 있기 때문에, 전체적인 방충성에 대해 중요한 한 가지 특성은 표면 활성이다. 두 번째 특성은 휘발성이다. 방충제들은 곤충에게 물리는 것으로부터 숙주를 보호하거나 곤충에 의한 손해로부터 물품을 보호함으로써 측정되는 바와 같은 효과를 위해, 숙주의 피부 표면 또는 방충 물품으로부터의 활성 성분의 증발이 필수적인 비통상적인 부류의 화합물들을 형성한다. 국소용 방충제의 경우, 특정의 최소 방충제 농도가 곤충을 퇴치하기 위해 숙주의 피부 표면 바로 위의 공기 공간에 요구되며, 이 농도는 방충제 효능의 척도이다. 하지만, 증발 속도는 또한, 피부 흡수 속도에 의해 영향받으며, 대부분의 경우 피부 내로의 침투 및 피부를 통한 침투는 피부 표면으로부터 화합물이 소실되는 바람직하지 못한 방식이다. 방충 물품 자체를 둘러싼 3차원적인 공기 공간에서 요구되는 최소 방충제 농도에 관해서, 유사한 고려가 방충 물품에 대해 이루어져야 한다.

[0063] 이러한 증발(및, 임의적으로는 침투) 특성들을 균형있게 하도록 시도하는 연구자들에게 다양한 전략들이 가능하다. 먼저, 물리적 특성들이 올바르게 균형잡힌 단일의 활성 성분을 찾는 것이 가능하다. 다르게는, 활성 성분이 숙주의 피부 표면 위 또는 방충 물품 내의 활성 성분의 지속성을 변형시키기 위한 목적으로 활성 성분에 첨가되는 불활성 성분 및 중합체와 배합될 수 있다. 하지만, 활성 성분에 불활성 성분을 첨가하는 것은 방충 막 또는 물품의 표면 상의 활성 성분의 분자 개수를 제한한다. 증발하기 위해서는 분자가 표면 상에 있어야 하므로, 증발 속도가 낮아진다. 이는 숙주의 피부 표면에 도포될 수 있거나 방충 물품의 표면 상에 존재하는 활성 성분의 농도를 희석하게 되는 부정적인 결과를 수반한다. 이어서, 이는 불활성 성분을 함유하는 배합물의 전체 효능을 감소시킨다. 세 번째 별법으로는, 활성 성분이 마이크로캡슐 내에 함유되어, 숙주의 피부 표면 또는 방충 물품으로부터의 소실 속도를 제어할 수 있다. 마지막으로, 활성 성분의 증발 속도를 제한하는 다른 기법은 피부 표면 또는 방충 물품 상에서 천천히 붕해되어 활성 성분을 방출하는 전구체 분자를 합성하는 것이다.

[0064] 예를 들어, 활성 성분들의 방출은, 예를 들어 미크론 이하 캡슐화에 의할 수 있는데, 여기에서 활성 성분은 공기가 풍선 내부에 포집되는 방식으로 피부 영양분 단백질 내부에 캡슐화된다(둘러싸인다). 단백질은, 예를 들어 20 % 농도로 사용될 수 있다. 방충제의 사용은 수-기재 로션 또는 분무 사용을 위한 물 중에 현탁된 이들 단백질 캡슐 다수를 포함한다. 피부와의 접촉 후에 단백질 캡슐이 파괴되기 시작해서 캡슐화된 디히드로네페타락톤이 방출된다. 이러한 과정은 각각의 미세한 캡슐이 고갈될 때까지 계속된 다음에 연속적으로 새로운 캡슐에 의해 대체되고 이것은 피부와 접촉하게 되고 그의 활성 성분을 방출하게 된다. 이 과정은 1회 사용에 24 시간이 걸릴 수 있다. 단백질은 피부에 매우 효과적으로 부착되기 때문에, 이들 배합물은 발한 (땀 분비) 및 물에 대한 저항성이 크다. 사용 시 건조하고 미끄러운 감이 없기 때문에 쾌적하다. 이러한 시스템은 매우 효과적인 보호를 제공하지만, 의류가 단백질을 방출할 수 없기 때문에 피부에 사용될 때만 효과적이다. 다른 시스템은 방충제를 둘러싸는 중합체를 사용하는데, 이것은 초기 증발을 늦추기 때문에 나중에 디히드로네페타락톤이 더 많이 증발될 수 있다. 이러한 시스템은 종종 대조용의 비포집 제품에 비해서 방충제 효능 지속 시간을 25 내지 50 % 더 연장할 수 있다. 다른 별법에서는, 상승제를 사용해서 조성물 중 디히드로네페타락톤 증발 촉진을 유지한다.

[0065] 방충제의 휘발성을 제어하기 위해 적용되는 특정 전략에 관계 없이, 각 방충제는 효과적인 방충성을 위하여 피부 표면/물품 바로 위의 공기 공간 중의 방충제의 최소 요구 농도를 유지하기 위하여 피부 표면 또는 방충 물품으로부터의 최소 유효 증발 속도(MEER)를 가져야 한다. 최소 유효 증발 속도(MEER)보다 빠른 증발 속도는 상당하고도 원치 않는 소실 방식을 야기한다. 하지만, MEER이 현장 상태의 함수로서 변화할 것이기 때문에, 이 문제는 더욱 복잡하다. 곤충의 맹렬도(avidity) 또는 무는 경향 및 숙주의 환경에서의 곤충의 농도 모두가 고려되어야 한다. 예를 들어, 모기의 맹렬도가 증가하는 경우, 보다 높은 MEER이 요구될 것이다. 배고프지 않은 모기들의 농도가 낮은 환경에서는, MEER이 2만큼, 보다 흔하게는 5 또는 6만큼 낮아질 수 있다. 반대로, 배고픈 모기의 농도가 높은 환경에서는, MEER이 12-15만큼 높을 수 있다. 본 발명에서는, 피부 표면 증발 속도가 바람직하게는 약 5시간인 시간 동안의 최소 유효 증발 속도와 적어도 동일한 방충제 조성물이 바람직하다.

[0066] DHN 또는 임의의 방충제의 유효성은 적용되는 숙주 표면 상의 활성 성분의 표면 농도에 달려 있다. 하지만, 방충성을 보이는 당업계에 공지된 많은 화합물들은 비교적 농축된 형태로만 방충성을 보인다. 예를 들어, 6.25-25%의 방충제 농도의 사용을 개시한 맥거번 등(McGovern et al.)의 US 4,416,881을 참조할 수 있다. 당업계의 기술을 대표하는 다른 상황에서는, 1%보다도 훨씬 낮은 농도의 DEET는 유효한 표면 농도를 얻기 위해 반복 적용을 필요로 하는 것으로 흔히 발견되고 있지만, 30%를 초과하는 농도는 과도한 표면 농도를 야기하며, 이는 소모적이고, 원치 않는 부작용들을 생성시킨다. 결과적으로, 본 발명의 추가적인 이점은 DHN이 DEET에 대해 사용되는 농도와 비슷한 농도에서 효과적인 방충성을 제공할 뿐 아니라, DHN이 순수 DHN 이하의 농도에서 사용될 수

있다(즉, 본원에서의 조성물은 필요하다면, 100 중량%의 DHN을 함유할 수 있음)는 것이다. DHN의 효과적인 방충 특성은 넓은 범위의 농도 수준에 걸쳐서 DHN 활성 성분의 경제적인 이용을 위한 많은 선택사항들을 제공한다.

[0067] 본 발명의 한 실시태양에서, DHN은 숙주 식물 또는 동물, 바람직하게는 인간 피부에 적용되기에 적합한 조성물 내로 유효량이 혼입된다. 적합한 조성물은 DHN 및 비히클 또는 담체, 바람직하게는 알코올, 예를 들어 이소-프로필 알코올, 로션, 예를 들어 당업계에서 공지된 수많은 피부 크림들 중 하나, 또는 실리카성 점토를 포함한다. 바람직하게는, DHN은 약 0.1 중량% 내지 30 중량%, 바람직하게는 약 0.5 중량% 내지 20 중량%, 가장 바람직하게는 1 중량% 내지 15 중량%의 농도로 본 발명의 방충제 조성물 중에 존재한다.

[0068] 본 발명에 있어서, 다양한 담체 또는 희석제를 상기 디히드로네페타락톤에 대해 사용할 수 있다. 담체는 배합물을 방충제 분자의 유효 농도로 조정하는 작용을 한다. 국소용 방충제 배합시에, 바람직하게는 방충제 분자가 피부학적으로 허용 가능한 담체 중에 혼합된다. 담체는 또한 발수성을 제공하고, 피부 자극을 방지하고(방지하거나) 피부를 진정하고 조절하는 역할을 할 수 있다. 임의의 방충제 배합물에 대한 담체(들)을 선택하는데 있어서 고려하는 요인들은 상업적 구입성, 비용, 방충성, 증발 속도, 냄새, 및 안정성을 포함한다. 특정 담체들은 자체 방충성을 가질 수 있다. 게다가, 담체는 바람직하게는 또한 환경에 대해 유해하지 않은 것이어야 한다.

[0069] 본 발명에 있어서, 최종 생성물과의 바람직한 균질 혼합물을 얻는데 사용될 담체(존재한다면)의 구체적인 선택은 방충제 배합물에서 통상적으로 사용되는 임의의 담체일 수 있다. 또한, 담체는 바람직하게는 환경에 해롭지 않은 것이어야 한다. 따라서, 담체는 다양한 상업적으로 구입할 수 있는 유기 및 무기 액체, 고체, 또는 반-고체 담체 또는 방충제 제품 배합에 이용가능한 담체 배합물 중 임의의 것일 수 있다. 예를 들어 담체는 실리콘, 바셀린 또는 라놀린 또는 몇 가지 다른 공지된 담체 성분들 중 많은 것들을 포함할 수 있다.

[0070] 유기 액체 담체의 예는 액체 지방족 탄화수소 (예를 들어, 펜탄, 헥산, 헵탄, 노난, 데칸 및 그의 동족체) 및 액체 방향족 탄화수소를 포함한다. 기타 액체탄화수소의 예는 석탄의 증류에 의해 제조되는 기름 및 다양한 유형 및 등급의 석유 화학 원료의 증류물, 예컨대 석유의 분별 증류에 의해 얻어지는 등유를 포함한다. 기타 석유 기름들은 일반적으로 농업 분무 기름으로 불리는 것들을 포함한다 (예를 들어, 소위 경 및 중 분무 기름, 석유 증류 시 중간 분획으로 구성되고, 이것은 오로지 가벼운 휘발성 물질이다). 상기 기름은 통상적으로 고도로 정련되며 단지 소량의 불포화 화합물들을 포함할 수 있다. 게다가, 상기 기름들은 일반적으로 파라핀 기름이며 따라서 물 및 유화제에 의해 유화되고, 낮은 농도로 희석되고, 분무제로 사용될 수 있다. 목재 펄프의 황산염 분해물로부터 얻어지는 톨유, 예컨대 파라핀 기름이 유사하게 사용될 수 있다. 기타 유기 액체 담체는 액체 테르펜 탄화수소 및 테르펜 알코올, 예컨대 알파-피넨, 디펜텐, 테르피네올 등을 포함할 수 있다.

[0071] 기타 담체는 실리콘, 바셀린, 라놀린, 액체 탄화수소, 농약 분무 기름, 파라핀 기름, 톨유, 액체 테르펜 탄화수소 및 테르펜 알코올, 지방족 및 방향족 알코올, 에스테르, 알데히드, 케톤, 광유, 고급 알코올, 미세 분할 유기 및 무기 물질을 포함한다.

[0072] 또다른 액체 담체는 유기 용매, 예를 들어 지방족 및 방향족 알코올, 에스테르, 알데히드, 및 케톤을 포함할 수 있다. 지방족 1가 알코올은 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, n-부틸, s-부틸, 및 t-부틸 알코올을 포함한다. 적합한 알코올은 글리콜 (예컨대 에틸렌 및 프로필렌 글리콜) 및 피나콜을 포함한다. 적합한 다가 알코올은 글리세롤, 아라비톨, 에리트리톨, 소르비톨 등을 포함한다. 최종적으로, 적합한 시클릭 알코올은 시클로펜틸 및 시클로헥실 화합물을 포함한다.

[0073] 통상적인 방향족 및 지방족 에스테르, 알데히드 및 케톤이 담체로서 사용될 수 있으며, 때로는 상기 언급된 알코올과 조합되어 사용된다. 또다른 액체 담체에는 비교적 비점이 높은 석유 생성물, 예를 들어 광유 및 고급 알코올(예를 들어, 세틸 알코올)이 포함된다. 추가로, 통상적인 또는 소위 "안정제" (예를 들어, t-부틸 술피닐 디메틸 디티오카르보네이트)를 본 발명의 조성물을 구성하는 담체 또는 담체들과 함께, 또는 그의 성분으로서 사용될 수 있다.

[0074] 본 발명의 조성물 중에 사용될 수 있는 고체 담체는 미세 분할 유기 및 무기 고체 물질을 포함한다. 적절한 미세 분할 고체 무기 담체는 규토질 광물, 예컨대 합성 및 천연 점토, 벤토나이트, 아타풀가이트, 백토, 규조토, 카올린, 운모, 탈크, 미세 분할 석영 등과 합성으로 제조된 규토질 물질, 예컨대 실리카 에어로겔 및 침전 및 훈증 실리카를 포함한다. 미세 분할 고체 유기 물질의 예는 셀룰로스, 톱밥, 합성 유기 중합체 등을 포함한다. 반고체 또는 콜로이드상 담체의 예는 본 발명의 범위 내에서 효과적인 방충성을 제공하기 위한, 왁스상 고체,

겔 (예컨대 석유 젤리), 라놀린 등 및 반고체 담체 제품을 제공할 수 있는 이미 알려져 있는 액체 및 고체 물질의 혼합물을 포함한다.

[0075] 물 뿐만 아니라, 본 발명의 조성물 중에 사용되기에 적합한 다른 담체에는 하기 물질들 중 하나 이상이 포함된다.

[0076] - 아세톤

[0077] - C10-C18 트리글리세리드

[0078] - C12-C18 산 트리글리세리드

[0079] - 디프로필, 디부틸, 디이소세틸, 디이소프로필 또는 디메틸 옥살레이트

[0080] - 시클로 (에톡시)메티콘

[0081] - 아밀, 메틸, 부틸, 에틸, 에톡시에탄올, 에톡시디글리콜 또는 테트라히드로푸르푸릴 아세테이트

[0082] - 에톡시디글리콜

[0083] - 케로센

[0084] - 에톡시에탄올

[0085] - 디아세틴

[0086] - 벤질, 디아세톤, 변성 에틸, 테트라히드로푸르푸릴 또는 올레일 알코올

[0087] - 벤질 벤조에이트 또는 라우레이트

[0088] - 에틸렌 카르보네이트

[0089] - 에틸 헥산디올

[0090] - 베르톨레타 엑셀사 너트(Bertholetta Excelsa Nut), 카르타무스 틴크토리우스(Carthamus Tinctorius), 헬리안투스 안누스(Helianthus Annuus), 리시누스 콤무니스(Ricinus Communis), 알레우리테스 몰루카나(Aleurites Moluccana), 리눔 우시타티시뭄(Linum Usitatissimum), 코코스 누시페라(Cocos Nucifera), 제아 메이스(Zea Mays), 피누스 팔루스트리스(Pinus Palustris), 세사뭄 인디쿰(Sesamum Indicum), 글리신 소자(Glycine Soja), 헬리안투스 안누스(Helianthus Annuus), 프루누스 아미그달루스 둘시스(Prunus Amygdalus Dulcis), 올레아 유로파에(Olea Europaea), 엘래이스 구이닌시스(Elaeis Guineensis), 프루누스 페르시카 커넬(Prunus Persica Kernel), 쿠쿠르비타 페포(Cucurbita Pepo), 브라시카 캄페스트리스(Brassica Campestris), 오리자 사티바(Oryza Sativa), 오리자 살리바(Oryza Saliva), 카르타무스 틴크토리우스(Carthamus Tinctorius), 주글란스 레지아(Juglans Regia) 또는 트리이쿰 불가레(Triicum Vulgare)의 기름

[0091] - 디부틸 프탈레이트 또는 세바케이트

[0092] - 푸르푸랄

[0093] - 부톡시-디글리콜, -프로판올 또는 -에탄올

[0094] - 디에톡시에틸 숙시네이트

[0095] - 디에틸 옥살레이트, 프탈레이트, 세바케이트 또는 숙시네이트

[0096] - n- 또는 t-부틸, 헥실 또는 이소프로필 알코올

[0097] - 글리코푸롤

[0098] - 글리콜

[0099] - 부틸렌, 헥실렌, 디에틸렌, 디프로필렌, 펜틸렌, 프로필렌 또는 트리에틸렌 글리콜

[0100] - C6-C20 선형, 분지형 또는 시클릭 알칸, 알칸올 또는 알칸 폴리올

[0101] - 부틸옥탄올

[0102] - 디헥실, 디이소부틸, 디이소데실, 디트리데실, 디부틸, 디이소세틸, 디이소프로필, 디프로필 또는 디이소포닐

아디페이트

[0103] - 부티로락톤

[0104] - 1,2,6-헥산돌

[0105] - 카프릴산, 카프르산, 라우르산 또는 스테아르산 트리글리세리드

[0106] - 이소아밀, 이소부틸, 이소프로필 또는 프로필 아세테이트

[0107] - 이소부톡시프로판올

[0108] - 디이소프로필 세바케이트

[0109] - 디메톡시디글리콜

[0110] - 이소부틸, 메틸 또는 스테아릴 벤조에이트

[0111] - 이소프로필 라우레이트, 미리스테이트, 팔미테이트 또는 스테아레이트

[0112] - 옥틸, 라우릴, 미리스틸, 팔미토일 또는 스테아릴 벤조에이트

[0113] - 디메틸 프탈레이트, 글루타레이트, 말레에이트, 아디페이트 또는 숙시네이트

[0114] - 디메틸 술폰

[0115] - 디메틸 에테르

[0116] - 디메틸 이소소르바이드

[0117] - 디옥틸 세바케이트, 아디페이트, 프탈레이트 또는 숙시네이트

[0118] - 메틸에틸케톤

[0119] - 3-메톡시부탄올

[0120] - 디펜텐

[0121] - 메톡시디글리콜

[0122] - 디페닐 메탄

[0123] - 메톡시-에탄올, -이소프로판올 또는 -메틸부탄올

[0124] - C4-C400 폴리에틸렌, 폴리프로필렌, 폴리에틸렌/에테르 또는 폴리프로필렌/에테르 글리콜

[0125] - 퍼플루오로데칼린

[0126] - 메틸알

[0127] - 퍼플루오로테트랄린

[0128] - 페록시이소프로판올

[0129] - 페닐프로판올

[0130] - 메틸 헥실 에테르

[0131] - 메틸프로판디올

[0132] - 메틸 피롤리돈

[0133] - 메틸 부틸 케톤

[0134] - 티올란디올

[0135] - 톨루엔

[0136] - 프로판디올

[0137] - 트리아세틴

[0138] - 트리부틸 시트레이트

[0139] - 트리부틸크레실부탄

[0140] - 프로필렌 카르보네이트

[0141] - 트리카프린

[0142] - 트리카프릴린

[0143] - 트리클로로에탄

[0144] - 트리헵타노인

[0145] - 트리히드록시스테아린

[0146] - 트리이소노나노인

[0147] - 트리이소스테아린

[0148] - 트리라우린

[0149] - 트리리놀레인

[0150] - 트리리놀레닌

[0151] - 트리메틸헥산올

[0152] - 트리미리스틴

[0153] - 트리옥타노인

[0154] - 트리올레인

[0155] - 트리팔미틴

[0156] - 트리세바신

[0157] - 트리스테아린

[0158] - 트리운데카노인

[0159] - 크시텐

[0160] 상기 언급된 물질들, 예를 들어 액체 탄화수소 뿐 아니라, 담체는 최종 용도 적용을 위해 디히드로네페타락톤 화합물을 물 중에 분산시키고, 물로 희석시키는데 사용될 수 있는 통상적인 에멀젼화제를 함유할 수 있다.

[0161] 디히드로네페타락톤을 함유하는 본 발명의 방충제 조성물은 개인 위생 제품 배합물 분야에 알려져 있는 보조제, 예컨대 증점제, 완충제, 킬레이트화제, 보존제, 향료, 항산화제, 겔화제, 안정제, 계면활성제, 연화제, 착색제, 알로에 베라, 왁스, 기타 침투 증진제 및 그의 혼합물과, 치료학적 또는 미용학적 활성제도 포함할 수 있다.

[0162] 뿐만 아니라, 본 발명의 조성물은 또한 하나 이상의 치료학적 또는 미용학적 활성 성분과 같은 다른 보조제들을 함유할 수 있다. 본 발명의 조성물 중에 유용한 예시적인 치료학적 또는 미용학적 활성 성분들은 살진균제, 햇볕타기방지제, 자외선방지제, 비타민, 태닝제, 식물 추출물, 항염증제, 항산화제, 라디칼 제거제, 레티노이드, 알파-히드록시산, 연화제, 방부제, 항생제, 항균제 또는 항히스타민제를 포함하며, 원하는 치료학적 또는 미용학적 효과를 달성하는데 효과적인 양으로 존재할 수 있다.

[0163] 추가적으로, 본 발명의 조성물은 하나 이상의 다른 첨가제들, 예를 들어 항산화제, 에멀젼 안정제, 방부제, 추진제, 유연제, 태양광차단체, 계면활성제, 에멀젼화제, 가용화제 및/또는 자외선 흡수제를 함유할 수 있다. 그러한 첨가제들로서 작용할 수 있는 물질들의 예는 하기에 설명되어 있다.

[0164] 본 발명의 조성물은 항산화제로서 작용할 수 있는 하나 이상의 물질들, 예를 들어 환원제 및 유리 라디칼 포획제를 포함할 수 있다. 항산화제로서 작용할 수 있는 적합한 물질들에는 다음의 물질들 중 하나 이상이 포함된다:

[0165] - 아세틸 시스테인

[0166] - 아스코르브산

[0167] - 아스코르빌 팔미테이트 또는 스테아레이트

[0168] - t-부틸 히드로퀴논

[0169] - 시스테인

[0170] - 디아밀히드로퀴논

[0171] - 디세틸, 디라우릴, 디미리스틸, 디스테아릴 또는 디트리데실 티오디프로피오네이트

[0172] - 에리토르브산

[0173] - 2-에틸헥실, 라우릴, 미리스틸, 팔미토일 또는 스테아릴 4-메톡시신나메이트

[0174] - 에틸 페룰레이트

[0175] - 페룰산

[0176] - 히드로퀴논

[0177] - p-히드록시아니솔

[0178] - 히드록실아민 술페이트

[0179] - 마그네슘 아스코르베이트

[0180] - 마그네슘 아스코르빌 포스페이트

[0181] - 옥틸 갈레이트

[0182] - 옥틸, 라우릴, 미리스틸, 팔미토일 또는 스테아릴 살리실레이트

[0183] - 옥토크릴렌

[0184] - 플로로글루시놀

[0185] - 토코페롤의 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0186] - 칼륨 아스코르빌 토코페릴 포스페이트

[0187] - 칼륨 술파이트

[0188] - 프로필 갈레이트

[0189] - 루틴

[0190] - 나트륨 아스코르베이트

[0191] - 나트륨 에리토르베이트

[0192] - 나트륨 술파이트

[0193] - 나트륨 티오글리콜레이트

[0194] - 소르비틸 푸르푸랄

[0195] - 삼차 부틸 4-메톡시 페놀

[0196] - 티오디글리콜

[0197] - 티오디글리콜아미드

[0198] - 티오글리콜산

[0199] - 티오락트산

[0200] - 티오살리실산

[0201] - 토코페롤

[0202] - 토코페릴 아세테이트

[0203] - 토코페릴 리놀레에이트

[0204] - 토코페릴 니코티네이트

[0205] - 토코페릴 숙시네이트

[0206] - 트리스 (노닐페닐) 포스파이트

[0207] 본 발명의 조성물은 또한, 에멀젼 안정제로서 작용할 수 있는 하나 이상의 물질들을 포함할 수 있다. 이들 물질들은 일차 에멀젼화제로서 작용하지 않고, 에멀젼화된 액적들의 응집을 방지하거나 감소시킬 것이다. 이는, 예를 들어 전기적 반발, 점도 변화, 또는 점적 표면 상의 막 형성을 통해 에멀젼의 연속 또는 분산 상을 변형시킴으로써 이루어질 수 있다. 에멀젼 안정제로서 작용할 수 있는 적합한 물질들에는 하기 물질들 중 하나 이상이 포함된다:

[0208] - 세틸 알코올

[0209] - 몬트모릴로나이트

[0210] - 알루미늄 카프릴레이트, 스테아레이트, 라우레이트, 팔미테이트, 라놀에이트 또는 미리스테이트

[0211] - C15-C18 글리콜

[0212] - 도데실헥사데칸올

[0213] - $H(OCH_2CH_2)_nOH$(여기서 n은 350 내지 160,000)

[0214] - 펙틴

[0215] - 글루코스 펜타아세테이트

[0216] - 글리콜 올레에이트, 팔미테이트, 스테아레이트 또는 리시놀레에이트

[0217] - (알킬) 셀룰로스

[0218] - 히드록시알킬 (알킬) 셀룰로스

[0219] - 칼슘 라우레이트, 미리스테이트 또는 스테아레이트

[0220] - C10-C50 알코올, 예를 들어 세틸, 미리스틸, 스테아릴, 탈로우 또는 라우릴 알코올

[0221] - 폴리비닐 아세테이트

[0222] - 라놀린

[0223] - 스티렌/말레산 무수물 공중합체

[0224] - 크산탄 검

[0225] 본 발명의 조성물은 또한, 미생물 성장을 방지하거나 지연시켜, 사용하는 동안 소비자에 의해 손상되거나 부주의하게 오염되는 것으로부터 조성물(또는 그로부터 제조되는 제품)을 보호하는 방부제로서 작용할 수 있는 하나 이상의 물질들을 포함할 수 있다. 방부제로서 작용할 수 있는 적합한 물질들에는 다음 물질들 중 하나 이상이 포함된다:

[0226] - 암모늄 벤조에이트 또는 프로피오네이트

[0227] - 클로록시 에놀

[0228] - 이소부틸파라벤

[0229] - o, m 또는 p-크레졸

[0230] - 이소데실파라벤

[0231] - 벤조산

[0232] - 이소프로필 크레졸, 파라벤 또는 소르베이트

[0233] - 벤조트리아졸

[0234] - 벤질 알코올

[0235] - 마그네슘 벤조에이트

[0236] - 벤질파라벤

[0237] - 데히드로아세트산

[0238] - 마그네슘 프로피오네이트

[0239] - 5-브로모-5-니트로-1,3-디옥산

[0240] - 디아졸리디닐 우레아

[0241] - 마그네슘 살리실레이트

[0242] - 2-브로모-2-니트로프로판-1,3-디올

[0243] - 디브로모프로파미딘 디이소티오네이트

[0244] - 부틸 벤조에이트

[0245] - 디메틸 히드록시메틸 피라졸

[0246] - 부틸파라벤

[0247] - 디메틸올 에틸렌 티오우레아

[0248] - 칼슘 벤조에이트, 살리실레이트, 소르베이트, 파라벤 또는 프로피오네이트

[0249] - 디메틸 옥사졸리딘

[0250] - 메틸 히드록실 히단토인

[0251] - 메틸디브로모 글루타로니트릴

[0252] - 메틸이소티아졸리논

[0253] - 메틸파라벤

[0254] - 에틸파라벤

[0255] - 클로르헥시딘 디아세테이트, 디글루코네이트 또는 디히드로클로라이드

[0256] - 포름알데히드

[0257] - 글루타랄

[0258] - 글리옥살

[0259] - 클로로아세트아미드

[0260] - 헥사미딘

[0261] - 클로로부탄올

[0262] - 헥사미딘 디파라벤

[0263] - 페놀

[0264] - p-클로로-m-크레졸

[0265] - 헥사미딘 파라벤

[0266] - 옥틸, 라우릴, 미리스틸, 팔미토일 또는 스테아릴 살리실레이트

[0267] - 옥틸, 라우릴, 미리스틸, 팔미토일 또는 스테아릴 벤조에이트

[0268] - 옥토크릴렌

[0269] - 페녹시에탄올

[0270] - 클로로펜

[0271] - 4히드록시벤조산

[0272] - 페녹시에틸파라벤

[0273] - p-클로로페놀

[0274] - 히드록시메틸 디옥소아자바이시클로옥탄

[0275] - 페녹시이소프로판올

[0276] - 클로로티몰

[0277] - 이미다졸리디닐 우레아

[0278] - 페닐 벤조에이트

[0279] - 페닐 수은 아세테이트, 벤조에이트, 보레이트, 브로마이드 또는 클로라이드

[0280] - 칼륨 살리실레이트, 소르베이트, 벤조에이트, 프로필파라벤, 부틸파라벤, 에틸파라벤, 메틸파라벤, 파라벤, 페녹시드, o-페닐페네이트 또는 프로피오네이트

[0281] - 프로피온산

[0282] - 프로필 벤조에이트

[0283] - 페닐파라벤

[0284] - 프로필파라벤

[0285] - o-페닐페놀

[0286] - 은 보로실리케이트

[0287] - 은 마그네슘 알루미늄 포스페이트

[0288] - 소르브산

[0289] - 나트륨 히드록시메틸글리시네이트, 메틸파라벤, 파라벤, 페놀술포네이트, 페녹시드, o-페닐페네이트, 프로피오네이트, 프로필파라벤, 피리티온, 살리실레이트, 소르베이트, 벤조에이트, 부틸파라벤, p-클로로-m-크레졸, 데히드로아세테이트, 에틸파라벤, 포르메이트 또는 히드록시메탄 술포네이트

[0290] - 아연 피리티온

[0291] 본 발명의 조성물은 또한, 가압된 용기로부터 제품(에어로졸)을 배출하는데 사용되는 화학물질인 추진체로서 작용할 수 있는 하나 이상의 물질들을 포함할 수 있다. 추진체의 관능성은 주위 온도에서의 증기압 및 압축성에 달려 있다. 용기 내에서 발생하는 압력이 정상 보관 및 사용 조건 하에서의 용기의 파열 압력보다 안전하게 낮은 한, 액체 또는 기체가 추진체로서 사용될 수 있다. 추진체로서 작용할 수 있는 적합한 물질로는 하기 물질들 중 하나 이상이 포함된다:

[0292] - 부탄

[0293] - CH_3CClF_2

[0294] - 질소

[0295] - 이산화탄소

[0296] - CH_3CF_2

[0297] - 산화이질소

[0298] - 디메틸 에테르

[0299] - 이소부탄

[0300] - 펜탄

[0301] - 에탄

[0302] - 이소펜탄

[0303] - 프로판

[0304] - CH_3CHF_2

[0305] 본 발명의 조성물은 또한, 피부의 연하고, 부드럽고, 유연한 외관을 유지시켜 주는 화장 성분인 유연제로서 작용할 수 있는 하나 이상의 물질들을 포함할 수 있다. 유연제의 목적은 피부 표면 상에 또는 각질층 중에 잔류하여 윤활제로서 작용하고, 플레이킹을 감소시키고, 피부의 외관을 개선시키는 것이다. 유연제로서 작용할 수 있는 적합한 물질에는 다음 물질들 중 하나 이상이 포함된다:

[0306] - 아세틸화 라놀린 또는 라놀린 알코올

[0307] - 비스페닐헥사메티콘

[0308] - 베르톨레타 엑셀사 너트 기름

[0309] - 카프릴산/카프르산 글리세리드

[0310] - 부톡시에틸 스테아레이트

[0311] - 카프릴산/카프르산/숙신산 트리글리세리드

[0312] - 아세틸화 수크로스 디스테아레이트

[0313] - 아세틸 트리헥실 시트레이트

[0314] - 부틸 이소스테아레이트, 미리스테이트, 올레에이트 또는 스테아레이트

[0315] - 카프릴릴 글리콜

[0316] - 아세틸 트리옥틸 시트레이트

[0317] - 세테아릴 옥타노에이트 또는 팔미테이트

[0318] - 프루누스 아르멘라카(Prunus Armenlaca) 커널 기름

[0319] - 세틸 아세테이트, 카프릴레이트, 락테이트, 라우레이트, 옥타노에이트 또는 올레에이트

[0320] - 아라키딜 프로피오네이트

[0321] - C14-C15 알코올

[0322] - 세틸아라키돌

[0323] - 아르가니아 스피노사(Argania Spinosa) 기름

[0324] - C12-C28 알킬 아세테이트, 벤조에이트 또는 락테이트 또는 옥타노에이트

[0325] - 페르세아 그라티시마(Persea Gratissima) 기름

[0326] - 오르비그니아 올렐페라(Orbignya Olelfera) 기름

[0327] - 멜리사 오피시날리스(Melissa Officinalis) 씨 기름

[0328] - C24-C28 알킬 메티콘

[0329] - C12-C13 알킬 옥타노에이트

[0330] - 세틸 글리콜, 글리콜 이소스테아레이트 또는 글리콜 팔미테이트

[0331] - 벤질 라우레이트

[0332] - 비스-디글리세릴 폴리아실아디페이트- 1 또는 -2

[0333] - 카멜리아 키시(Camellia Kissi) 기름

[0334] - 이소스테아릴, 미리스틸, 라우릴, 이소세틸, 펜타데실, 올레일, 트리데실 또는 운데실 알코올

[0335] - 이소스테아릴 글리세릴 에테르

[0336] - 이소스테아릴 벤조에이트, 락테이트, 네오펜타노에이트, 옥타노에이트, 팔미테이트 또는 미리스테이트

[0337] - 메틸 스테아레이트

[0338] - 로자 모스차타(Rosa Moschata) 씨 기름

[0339] - 히드록시세틸이소스테아레이트

[0340] - 이사티스 틴크토리아(Isatis Tinctoria) 기름

[0341] - 이소아밀 라우레이트

[0342] - 이소부틸 미리스테이트, 팔미테이트, 펠아르고네이트 또는 스테아레이트

[0343] - 이소프로필 라우레이트, 미리스테이트, 팔미테이트 또는 스테아레이트

[0344] - 이소트리데실 이소노나노에이트

[0345] - 미리스틸 이소스테아레이트, 락테이트, 네오펜타노에이트, 옥타노에이트 또는 프로피오네이트

[0346] - 악티니디아 키넨시스(Actinidia Chinensis) 씨 기름

[0347] - 이소세틸 이소데카노에이트, 팔미테이트 또는 스테아레이트

[0348] - 라놀린

[0349] 라놀린 기름 또는 왁스

[0350] - 이소데실 시트레이트, 히드록시스테아레이트, 라우레이트, 미리스테이트, 네오펜타노에이트, 팔미테이트 또는 스테아레이트

[0351] - 네오펜틸 글리콜 디카프릴레이트, 디카프레이트, 디라우레이트 또는 디옥타노에이트

[0352] - 노닐 아세테이트

[0353] - 라우릴 글리콜

[0354] - 옥틸 아세톡시스테아레이트

[0355] - 라우릴 이소스테아레이트 또는 락테이트

[0356] - 옥틸데칸올

[0357] - 옥틸도데칸올

[0358] - 옥틸도데실 벤조에이트, 락테이트, 네오펜타노에이트 또는 옥타노에이트

[0359] - 옥틸, 라우릴, 미리스틸, 팔미토일 또는 스테아릴 벤조에이트 이소헥사데칸

[0360] - 메틸 벤조에이트, 카프로에이트, 카프릴레이트, 카프레이트 또는 글루코스 디올레에이트

[0361] - 이소헥실 네오펜타노에이트, 팔미테이트 또는 라우레이트

[0362] - 옥틸 히드록시스테아레이트, 라우레이트, 이소팔미테이트, 이소스테아레이트, 미리스테이트, 네오펜타노에이트, 올레에이트, 팔미테이트 또는 스테아레이트

[0363] - 메틸 글루코스 이소스테아레이트, 라우레이트, 세스퀴카프릴레이트, 세스퀴카프레이트, 세스퀴라우레이트 또는 세스퀴스테아레이트

[0364] - 이소프로필 히드록시세틸 에테르

[0365] - 이소프로필 히드록시스테아레이트, 이소스테아레이트, 라놀에이트, 라우레이트, 리놀레에이트, 미리스테이트 또는 올레에이트

[0366] - 2-올레아미도-1,3-옥타데칸디올

[0367] - 올레일 아세테이트, 락테이트 또는 올레에이트

[0368] - 메틸 히드록시스테아레이트, 라우레이트, 이소스테아레이트, 미리스테이트, 올레에이트, 팔미테이트 또는 펠아르고네이트

[0369] - 이소프로필 팔미테이트, 이소프로필 또는 스테아레이트

[0370] - 이소소르바이드 라우레이트

[0371] - 파시플로라 에둘스(Passiflora Eduls) 기름

[0372] - 폴리에틸렌 글리콜 글리세리드

[0373] - 폴리글리세릴 미리스테이트, 올레에이트, 펜타스테아레이트 또는 리시놀레에이트

[0374] - 폴리글리세릴 올레일 에테르

[0375] - 폴리에틸렌 글리콜 트리카프릴 시트레이트, 트리세틸 시트레이트, 트리라우릴 시트레이트, 트리미리스틸 시트레이트 또는 트리스테아릴 시트레이트

[0376] - 폴리에틸렌 글리콜 피마자유

[0377] - 펜타에리트리틸 디올레에이트, 디스테아레이트, 스테아레이트, 테트라벤조에이트 또는 트리올레에이트

[0378] - 폴리글리세릴 세스퀴올레에이트, 스테아레이트, 테트라올레에이트, 테트라스테아레이트, 카프레이트, 카프릴레이트, 데카리놀레에이트, 라우레이트 또는 이소팔미테이트

[0379] - 프로필렌 글리콜 히드록시스테아레이트 스테아레이트, 라우레이트, 리놀레에이트, 미리스테이트, 리시놀레에이트, 스테아레이트, 올레에이트, 소이에이트 또는 카프릴레이트

[0380] - 프로필렌 글리콜 미리스틸 에테르 또는 미리스틸 에테르 아세테이트

[0381] - 수크로스 폴리올레에이트, 폴리팔메이트, 폴리스테아레이트, 리시놀레에이트, 스테아레이트, 트리아세테이트, 폴리라우레이트, 폴리리놀레에이트, 미리스테이트, 올레에이트, 라우레이트 또는 팔미테이트

[0382] - 폴리프로필렌 글리콜 라우릴, 세틸, 스테아릴, 올레일 또는 펜타에리트리틸 에테르

[0383] - 트리데실 네오펜타노에이트, 옥타노에이트, 스테아레이트 또는 이소노나노에이트

[0384] - 스테아릴 아세테이트, 벤조에이트 또는 락테이트

[0385] - 스테아릴 글리콜 이소스테아레이트 또는 시트레이트

[0386] - 폴리프로필렌 글리콜/폴리에틸렌 글리콜

[0387] - 트리메틸올프로판 또는 프로펜

[0388] - 트리옥틸 트리멜리테이트

[0389] - 트리스(트리부톡시실록시)메틸실란

[0390] 본 발명의 조성물은 또한, 태양광차단제로서 작용할 수 있는 하나 이상의 물질들을 포함할 수 있다. 58 Fed. Reg. 28194(1993년 5월 12일)에는, 태양광차단 활성 성분이 290 내지 320 나노미터 파장의 UV 범위에서 85% 이상의 방사선을 흡수하지만, 320 나노미터 초과의 파장에서는 방사선을 투과할 수 있거나 그렇지 않을 수 있는 성분으로서 정의되어 있다. 태양광차단제로서 작용할 수 있는 적합한 물질들에는 다음 물질들 중 하나 이상이 포함된다:

[0391] - 아미노벤조산 ("PABA")

[0392] - 글리세릴 아미노벤조에이트 (글리세릴 PABA)

[0393] - 옥시벤존 (벤조페논-3)

[0394] - 시녹세이트

[0395] - 호모살레이트

[0396] - 옥틸 디메틸 PABA

[0397] - 디에탄올아민 메톡시신나메이트

[0398] - 2-에틸헥실, 라우릴, 미리스틸, 팔미토일, 또는 스테아릴 4-메톡시신나메이트

[0399] - 디히드록시아세톤이 있는 로손

[0400] - 페닐벤지미다졸 술폰산

[0401] - 멘틸 안트라닐레이트

[0402] - 적 바셀린

[0403] - 디갈로일 트리올레에이트

[0404] - 옥토크릴렌

[0405] - 술이소벤존 (벤조페논-4)

[0406] - 디옥시벤존 (벤조페논-8)

[0407] - 옥틸 메톡시신나메이트

[0408] - 이산화티탄

[0409] - 에틸 4-[비스(히드록시프로필)] 아미노벤조에이트 (에틸 디히드록시프로필 PABA)

[0410] - 옥틸 살리실레이트

[0411] - 트롤아민 살리실레이트

[0412] 본 발명의 조성물은 또한, 계면활성제, 에멀젼화제 또는 가용화제로서 작용할 수 있는 하나 이상의 물질들을 포함할 수 있다. 그러한 물질은 표면 장력을 감소시키거나, 에멀젼화된 액적의 표면 상에 복합 막을 형성하거나, 에멀젼화된 액적 상에 반발 장벽을 형성하여 응집을 방지하거나, 저장 기간 동안에 걸쳐 에멀젼의 물리적 변화를 지연시키거나, 용질을 계면활성제에 의해 형성된 미셀의 일부가 되게 하는데 사용될 수 있다. 계면활성제, 에멀젼화제 또는 가용화제로서 작용할 수 있는 적합한 물질들에는 다음 물질들 중 하나 이상이 포함될 수 있다:

[0413] - C50-C650 선형, 또는 분지형 디히드록시 폴리옥시에틸렌/폴리옥시프로필렌 블록 공중합체

[0414] - 에틸렌 디아민의 C50-C650 분지형, 폴리히드록시 폴리옥시에틸렌/폴리옥시프로필렌 블록 공중합체

[0415] - C12-C330 에톡시화 알킬 페놀

[0416] - C12-C60 알코올의 C16-C140 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0417] - C12-C330 에톡시화 알킬 페놀의 카르복실산 에스테르

[0418] - C12-C40 카르복실산 및 C8-C40 폴리에틸렌 글리콜의 에스테르

[0419] - 카프릴산 또는 카프르산 트리글리세리드 및 C8-C40 폴리에틸렌 글리콜의 에스테르

[0420] - C12-C330 에톡시화 알킬 페놀의 인산 에스테르

[0421] - C12-C60 알코올의 C16-C140 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 인산 에스테르 및 디에스테르

[0422] - 아비에트산

[0423] - 칼슘 스테아로일 락틸레이트

[0424] - 세트에틸 모르폴리늄 에토술페이트

[0425] - 세트리모늄 브로마이드, 클로라이드, 메토술페이트 또는 토실레이트

[0426] - 세틸 알코올

[0427] - 세틸 디메티콘 코폴리올

[0428] - 세틸 글리세릴 에테르/글리세린 공중합체

[0429] - 세틸 포스페이트

[0430] - 세테아릴 글루코시드

[0431] - 덱스트린 베헤네이트, 라우레이트, 미리스테이트, 팔미테이트 또는 스테아레이트

[0432] - 디세틸 포스페이트

[0433] - 디에티타미노에틸 라우레이트 또는 스테아레이트

[0434] - 디메틸 옥티네디올

[0435] - 디미리스틸 포스페이트

[0436] - 글리세릴 아라키데이트, 베헤네이트, 카프릴레이트, 카프레이트, 코코에이트, 에루케이트, 수소화 로시네이트, 히드록시스테아레이트, 이소팔미테이트, 이소스테아레이트, 이소트리데카노에이트/스테아레이트/아디페이트, 라놀에이트, 라우레이트, 올레에이트, 리놀레에이트, 리놀레네이트, 올레에이트, 몬타네이트, 미리스테이트, 팔미테이트, 스테아레이트, 팔미트올레에이트, 리시놀레에이트 또는 우리데실레네이트

[0437] - 글리콜 옥타노에이트

[0438] - 수소화 레시틴

[0439] - 수소화 팜 글리세리드

[0440] - 히드록시세틸 포스페이트

[0441] - 히드록시에틸 글리세릴 올레에이트 및/또는 스테아레이트

[0442] - 라놀린

[0443] - 라우르트리모늄 클로라이드

[0444] - 라우릴 포스페이트

[0445] - 레시틴

[0446] - 만니탄 라우레이트 또는 올레에이트

[0447] - 미리스토일 메틸알라닌

[0448] - 팔미트산

[0449] - 옥트옥시글리세릴 베헤네이트 또는 팔미테이트

[0450] - 펠아르곤산

[0451] - 펜타에리트리틸 스테아레이트

[0452] - 포스파티딜콜린

[0453] - 칼륨 라우레이트, 미리스테이트, 올레에이트, 라우릴 히드록시프로필 술포네이트, 세틸 포스페이트, 라우릴 술페이트, 팔메이트, 팔미테이트, 리시놀레에이트 또는 스테아레이트

[0454] - 나트륨 팔메이트, 팔미테이트, 프탈레이트 스테아릴 아미드, 리시놀레에이트, 스테아레이트, 스테아릴 술페이트, 트리데세트 술페이트, 트리데실 술페이트, 운데실레네이트, 라우로일 락틸레이트, 라우릴 포스페이트, 미리스테이트, 올레에이트, 올레오일 락틸레이트, 베헤노일 락틸레이트, 카프로일 락틸레이트, 카프릴레이트, 이소스테아로일 락틸레이트 또는 라우레이트

[0455] - 프로필렌 글리콜 베헤네이트, 카프릴레이트, 히드록시스테아레이트, 이소스테아레이트, 라우레이트, 리놀레에

이트, 우놀레네이트, 미리스테이트, 올레에이트, 리시놀레에이트 또는 스테아레이트

[0456] - 소르비탄 카프릴레이트, 디이소스테아레이트, 디올레에이트, 디스테아레이트, 이소스테아레이트, 라우레이트, 올레에이트, 팔미테이트, 세스퀴이소스테아레이트, 세스퀴올레에이트, 세스퀴스테아레이트, 스테아레이트, 트리이소스테아레이트, 트리올레에이트 또는 트리스테아레이트

[0457] - 라피노스 올레에이트

[0458] - 스테아르산

[0459] - 스테아로일 락틸산

[0460] - 스테아릴 알코올

[0461] - 수크로스 디라우레이트, 디스테아레이트, 라우레이트, 미리스테이트, 올레에이트, 팔미테이트, 폴리라우레이트, 폴리리놀레에이트, 폴리올레에이트, 폴리팔메이트 또는 폴리스테아레이트

[0462] - 베헤닐 알코올의 C32-C82 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0463] - 세틸 알코올의 C20-C106 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0464] - 세틸 또는 올레일 알코올의 C28-C80 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0465] - 세틸 및/또는 스테아릴 알코올의 C20-C70 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0466] - 콜레스테롤의 C20-C80 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0467] - 데실 알코올의 C16-C24 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0468] - 디히드로콜레스테롤의 C40-C80 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0469] - 이소세틸 알코올의 C20-C60 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0470] - 이소데실 알코올의 C18-C30 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0471] - 이소라우릴 알코올의 C18-C40 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0472] - 이소스테아릴 알코올의 C20-C120 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0473] - 글리세릴 카프레이트, 카프릴레이트, 라우레이트, 미리스테이트, 올레에이트, 팔미테이트 또는 스테아레이트의 C12-C120 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0474] - 라우릴 알코올의 C14-C100 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0475] - 미리스틸 알코올의 C16-C24 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0476] - 올레일 알코올의 C20-C70 폴리에틸렌 글리콜 에테르

[0477] - 부틸 알코올의 C10-C100 폴리에틸렌/폴리프로필렌 글리콜 에테르

[0478] - 세틸 알코올의 C20-C106 폴리에틸렌/폴리프로필렌 글리콜 에테르

[0479] - 데실 알코올의 C20-C100 폴리에틸렌/폴리프로필렌 글리콜 에테르

[0480] - 라우릴 알코올의 C14-C100 폴리에틸렌/폴리프로필렌 글리콜 에테르

[0481] - 이소스테아릴 알코올의 C20-C120 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 카르복실산 에스테르

[0482] - 라우릴 알코올의 C14-C100 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 카르복실산 에스테르

[0483] - 미리스틸 알코올의 C16-C24 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 카르복실산 에스테르

[0484] - 라우릴 알코올의 C14-C100 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 시트르산 디에스테르

[0485] - 이소프로필 라우레이트, 미리스테이트, 팔미테이트 또는 스테아레이트

[0486] - 소르비톨의 C30-C120 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 라우르산 에스테르

[0487] - 옥틸, 라우릴, 미리스틸, 팔미토일 또는 스테아릴 살리실레이트

[0488] - 세틸 알코올의 C20-C106 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 인산 에스테르

[0489] - 이소스테아릴 알코올의 C20-C120 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 인산 에스테르

[0490] - 라우릴 알코올의 C14-C100 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 인산 디에스테르

[0491] - 올레일 알코올의 C20-C70 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 인산 에스테르 및/또는 디에스테르

[0492] - 글리세린의 C15-C30 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 스테아르산 에스테르

[0493] - 이소세틸 알코올의 C20-C60 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 스테아르산 에스테르

[0494] - 이소스테아릴 알코올의 C20-C120 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 스테아르산 에스테르

[0495] - 세틸 알코올의 C20-C106 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 인산 에스테르의 디에탄올아민 염

[0496] - 세틸 및/또는 스테아릴 알코올의 C20-C70 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 인산 에스테르의 디에탄올아민 염

[0497] - 올레일 알코올의 C20-C70 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 인산 에스테르의 디에탄올아민 염

[0498] - 라우릴 알코올의 C14-C100 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 시트르산 에스테르의 이나트륨 염

[0499] - 라우릴 알코올의 C14-C100 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 인산 에스테르의 이나트륨 염

[0500] - 올레일 알코올의 C20-C70 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 인산 에스테르의 이나트륨 염

[0501] - 세틸 및/또는 스테아릴 알코올의 C20-C70 폴리에틸렌 글리콜 에테르의 인산 에스테르의 모노에탄올아민 염

[0502] - 베헨산, 카프르산, 카프릴산, 라우르산, 올레산, 옥탄산, 팔미트산 또는 스테아르산의 C12-C120 폴리에틸렌 글리콜 디에스테르

[0503] - C6-C40 폴리글리세린 및 베헨산, 카프르산, 카프릴산, 라우르산, 올레산, 옥탄산, 팔미트산 또는 스테아르산의 폴리에스테르

[0504] 본 발명의 조성물은 또한, 자외선에 의해 화학적 또는 물리적으로 악화되는 것으로부터 조성물로부터 만들어진 제품을 보호하기 위하여 자외선 흡수제로서 작용할 수 있는 하나 이상의 물질들을 포함할 수 있다. 자외선 흡수제는 태양광차단제와 같이, 입사 자외선 방사선을 덜 해로운 적외선 방사선(열)으로 전환시키는 능력을 갖는다. 자외선 흡수제로서 작용할 수 있는 적합한 물질들에는 다음 물질들 중 하나 이상이 포함된다:

[0505] - 아세트아미노살올

[0506] - 3-벤질리덴 캄포르

[0507] - 스틸베네디술포네이트

[0508] - 알란토인 PABA

[0509] - 이나트륨 디스티릴비페닐 디술포네이트

[0510] - 벤잘프탈리드

[0511] - 술폰아미드

[0512] - 드로메트리졸

[0513] - 벤조페논

[0514] - 벤질리덴 캄포르 술폰산

[0515] - 에틸 디히드록시프로필 PABA

[0516] - 히드록실, 알콕시, 알킬, 할로겐 및 술포네이트로부터 선택된 하나 이상의 기로 치환된 벤조페논

[0517] - 벤질 살리실레이트

[0518] - 에틸 디이소프로필신나메이트, 메톡시신나메이트 또는 우로카네이트

[0519] - 부메트리졸

[0520] - 에틸 PABA

[0521] - 부틸 메톡시디벤조일메탄

[0522] - 부틸 PABA

[0523] - 에토크릴렌

[0524] - 시녹세이트

[0525] - 페룰산

[0526] - 글리세릴 옥타노에이트 디메톡시신나메이트

[0527] - 디-t-부틸 히드록시벤질리덴 캄포르

[0528] - 글리세릴 PABA

[0529] - 디갈로일 트리올레에이트

[0530] - 글리콜 살리실레이트

[0531] - 디이소프로필 메틸 신나메이트

[0532] - 이소아밀 p-메톡시신나메이트

[0533] - 이나트륨 비스에틸페닐 트리아미노트리아진

[0534] - 이소프로필벤질 살리실레이트

[0535] - 이소프로필 디벤조일메탄

[0536] - 옥틸 트리아존

[0537] - 나트륨 우로카네이트

[0538] - 이소프로필 메톡시신나메이트

[0539] - PABA

[0540] - 멘틸 안트라닐레이트 또는 살리실레이트

[0541] - 펜틸 디메틸 PABA

[0542] - 테레프타일리덴 디캄포르 술폰산

[0543] - 4-메틸벤질리덴 캄포르

[0544] - 페닐벤지미다졸 술폰산

[0545] - 이산화티탄

[0546] - 옥토크릴렌

[0547] - 폴리아크릴아미도메틸 벤질리덴 캄포르

[0548] - 트리PABA 판테놀

[0549] - 옥트리졸

[0550] - 칼륨 메톡시신나메이트

[0551] - 우로칸산

[0552] - 옥틸 디메틸 PABA

[0553] - 칼륨 페닐벤지미다졸 술포네이트

[0554] - 옥틸 메톡시신나메이트 또는 살리실레이트

[0555] - 나트륨 페닐벤지미다졸 술포네이트

[0556] 하나 이상의 담체, 보조제 및/또는 첨가제로 된 배합된 혼합물은 상기 설명된 리스트 중에 포함된 군들의 일원들로부터 선택될 수 있다. 이들은 또한, 상기 리스트에서 설명된 바와 같은 전체 군들로부터 임의의 하나 이상의 일원들을 생략함으로써 형성된 상기 리스트의 일원들로 된 하위군으로부터 선택될 수 있다. 결과적으로, 담체, 보조제 및/또는 첨가제로 된 혼합물은 그러한 경우, 상기 리스트에 설명된 바와 같은 전체 군들로부터 개개 일원들의 다양한 상이한 조합들 모두에 의해 형성될 수 있는 임의 크기의 임의의 하위군으로부터 선택되는 하나 이상의 일원들로부터 제조될 수 있을 뿐 아니라, 전체 군들로부터 생략되어 하위군을 형성하는 일원들의 부재 중에도 제조될 수 있다. 또한, 상기 리스트의 전체 군으로부터 다양한 일원들을 생략함으로써 형성되는 하위군은 전체 군의 개개 일원일 수 있음으로써, 담체, 보조제 및/또는 첨가제가 선택된 개개 일원을 제외하고는 전체 군들의 다른 모든 일원들의 부재 중에 제공된다.

[0557] 디히드로네페타락톤은 본 발명에서, 개별적으로 또는 임의 비율로 조합되어 사용될 수 있다. 당업계에서 통상적인 바와 같이, 방충 특성을 갖는 소정의 곤충 취약성 물품에 첨가될 방충제 조성물의 바람직한 양은 제품의 성질 및 기타 요인들에 의해 결정된다. 이들 요인들에는 비용 및 방충제 조성물 또는 방충 물품 중의 다른 성분들의 성질, 이들의 양, 및 원하는 방충 효과 모두를 고려하는 것이 포함된다. 일반적으로, 방충제 조성물은 연장된 시간 동안(바람직하게는, 적어도 몇 시간 동안) 숙주로부터 곤충을 퇴치하는데 효능을 보이는 충분량의 활성 방충제 물질을 함유해야 한다.

[0558] 상기 설명된 바와 같은 담체, 보조제 및/또는 첨가제 중 하나 이상을 함유하는 방충제 조성물 또는 방충 물품 중 화학식 I의 디히드로네페타락톤 각각 또는 이들의 혼합물의 양은 일반적으로, 최종 제품의 중량을 기준으로 약 80 중량%를 초과하지 않을 것이지만, 보다 많은 양이 특정 적용분야에 이용될 수 있으며, 이 양은 제한되지 않는다. 보다 바람직하게는, 디히드로네페타락톤의 적합량은 조성물 또는 물품의 중량을 기준으로, 약 0.001 중량% 이상, 바람직하게는 약 0.01 중량% 내지 약 50 중량%; 보다 바람직하게는 약 0.01 중량% 내지 약 20 중량%일 것이다. 구체적인 조성은 의도된 용도에 달려 있을 것이다.

[0559] 본 발명의 디히드로네페타락톤 방충제 조성물은 담체 없이 배합될 수 있으며, 효과적일 수 있다. 하지만, 보다 흔하게는, 방충제 조성물은 담체를 포함하고, 약 0.001-50 중량%의 개시된 화합물을 함유할 것이며, 그러한 화합물은 보통 담체와의 균일 혼합물로 존재하여 흔한 해충, 예를 들어 살을 무는 곤충, 나무를 파는 곤충, 해충, 가정 내 해충 등을 퇴치하기 위한 위치에 활성 물질을 전달할 것이다.

[0560] 본 발명의 조성물은 바람직한 사용 방법에 따라서 제품이 다양한 형태, 예컨대 용액, 현탁액, 크림, 연고 겔, 필름 또는 분무제 형태로 전달되도록 배합 및 포장될 수 있다. 담체는 압축 기체에 의해 공기 중으로 디히드로네페타락톤을 분산시키는데 적합한 에어로졸 형태일 수 있다.

[0561] 국소용 방충 물품의 바람직한 성질들은 저 독성, 물로의 침지 또는 발한에 의한 손실에 대한 저항성, 약하거나 없는 냄새 또는 적어도 좋은 냄새, 사용 용이성, 및 건조한 무점성 표면 필름이 숙주의 피부에서 신속하게 형성되는 것들을 포함한다. 이러한 성질들을 달성하기 위해서, 국소용 방충제 제품 배합은 곤충 감염 동물 (예를 들어, 벼룩에 감염된 개, 이에 감염된 가금류, 진드기에 감염된 소 및 인간)을 본 발명에 따른 방충제 조성물로, 상기 동물의 피부, 털 또는 깃털을 동물 숙주로부터 곤충을 퇴치하기 위한 유효량의 방충 제품과 접촉시키는 것에 의해, 처리할 수 있도록 해야 한다. 그러므로, 제품을 공기 중에 분산하거나 조성물을 액체 미스트 또는 미세한 더스트로서 분산하는 것에 의해 방충제 조성물이 원하는 숙주 표면으로 떨어지게 될 것이다. 마찬가지로, 액체/반-고체/고체 방충제 제품을 숙주에 직접 분무하는 것은 숙주 표면을 유효량의 방충제 조성물과 접촉시키는 효과적인 방법이다.

[0562] 국소용 방충 물품으로서 사용될 수 있는 본 발명의 실시태양에는 콜론, 로션, 분무제, 크림, 겔, 연고, 목욕 및 샤워 겔, 기포 제품 (예를 들어 면도 크림), 메이크업, 방취제, 샴푸, 헤어스프레이/모발 세정제, 및 개인 비누 조성물 (예를 들어, 손 비누 및 목욕/샤워 비누)이 포함된다(다만, 이것으로 제한되는 것은 아님).

[0563] 본 발명은 또한, 곤충에 의한 공격에 취약한 다양한 물품 중 방충제로서의 디히드로네페타락톤 혼합물의 용도에 관한 것이다. 이러한 실외 소모성 제품들은 일반적으로 본 발명의 방충제 조성물을 포함할 것이지만, 반드시 그러한 것은 아니며, 유효량의 디히드로네페타락톤을 함유할 것이다. 디히드로네페타락톤 및 그의 혼합물의 사용에 의해 개선될 수 있는 전형적인 물품들에는 공기청정제, 양초, 다양한 방향 제품, 섬유, 시트, 천[예를 들어, 의류, 망(모기망), 및 다른 직물], 종이, 페인트, 잉크, 점토, 목재, 가구 (예를 들어 파티오(patio) 및 책상), 카페트, 생리대, 플라스틱, 중합체 등이 포함되지만 이것으로 제한되는 것은 아니다.

[0564] 본 발명의 디히드로네페타락톤 조성물은 중합체와 블렌딩될 수 있으며, 이는 조절 방출 시스템을 또한 수반할

수 있다. 적합한 중합체는 생분해성일 수 있거나, 아닐 수 있다. 예시적인 중합체로는 고밀도 폴리에틸렌 또는 저밀도 폴리에틸렌, 생분해성 열가소성 폴리우레탄, 생분해성 에틸렌 중합체, 및 폴리(엡실론 카프로락톤) 단일중합체 및 상기한 것들을 포함하는 조성물, 및 미국 특허 제 4,496,467 호, 미국 특허 제 4,469,613 호 및 미국 특허 제 4,548,764 호에 개시된 것들이 있지만, 이것으로 제한되는 것은 아니다.

[0565] 디히드로네페타락톤은 다양한 이유로 본 발명의 제조물 중 방충제 물질로서 사용하기에 특히 유리하다.

[0566] 첫째, 본 화합물은 효과적인 방충제를 선택할 때 중요한 소비자 고려 사항인 제조 비용 면에서 효과적이다. 많은 상업적으로 입수가능한 방충제 제품들은 비교적 농축된 형태, 예를 들어 전체 중량을 기준으로 담체 중 5-30% (이상)의 방충제 형태로만 효과적이다. 예를 들어, 맥거번 등에게 허여된 US 4,416,881은 담체 중 6.25-25%의 방충제 농도를 개시하고 있다.

[0567] 둘째로, 본 화합물은 공지된 천연 화합물이어서, 방충제 조성물 중 주된 활성 성분으로서 DEET와 같은 합성 화학물질에 대해 제기된 우려를 극복할 수 있다.

[0568] 마지막으로, 그렇게 제조된 디히드로네페타락톤 혼합물의 천연 방충 특성 뿐 아니라, 본 조성물은 또한 독특하고 상쾌한 향기를 갖는다. 주제가 되는 화합물의 방향 성분은, 예를 들어 조성물 중 하나 이상의 다른 성분들에 의한 후각 반응을 이용하거나 완화시킴으로써, 방충제 조성물 또는 물품의 전체적인 후각 성분을 부여하거나, 변경하거나, 증대시키거나 증강시키는데 있어 그 화합물을 유용하게 한다. 구체적으로, 본 발명의 디히드로네페타락톤 또는 그의 혼합물은 최종 방충제 조성물 또는 물품의 제형화에 있어 다른 성분들이 기여하는 냄새를 차단하거나 변형시키는데 이용될 수 있고/있거나, 특징적인 향기 또는 방향을 부여함으로써 제품에 대한 소비자 호감도를 향상시킬 수 있다. 디히드로네페타락톤의 상쾌한 향기는 다른 방충제 화합물, 특히 DEET보다 소비자에게 더 깊은 호감을 줄 것이라고 예상된다.

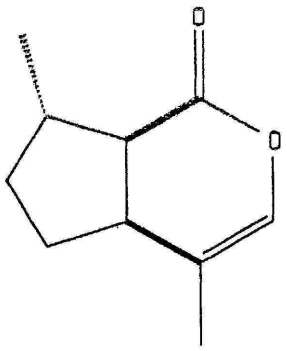
[0569] 디히드로네페타락톤 및 그의 용도는 또한, 2003년 1월 23일에 출원된 US SN 10/349,865에 설명되어 있으며, 이는 모든 목적을 위하여 본원의 일부로서 전체로 인용되고 있다.

[0570] 본 발명의 조성물이 특정 성분을 포함하는(comprising), 포함하는(including), 함유하는, 갖는, 이루어지는 또는 구성되는 것으로 서술되거나 설명되는 경우, 그 서술 또는 설명이 명백하게 다르게 표시하지 않는 한, 명시된 것들 뿐 아니라, 하나 이상의 성분들이 조성물에 존재할 수 있다고 이해되어야 한다. 하지만, 다른 실시태양에서는, 본 발명의 조성물이 특정 성분들로 본질적으로 이루어지는 것으로 서술되거나 설명될 수 있으며, 그러한 실시태양에서는 조성물의 작동 원리 또는 구별되는 특징을 실질적으로 변경하는 성분들이 그 안에 존재하지 않는다. 추가적인 다른 실시태양에서는, 본 발명의 조성물이 특정 성분들로 이루어지는 것으로 서술되거나 설명될 수 있으며, 그러한 실시태양에서는 불순물을 제외한 다른 성분들이 그 안에 존재하지 않는다.

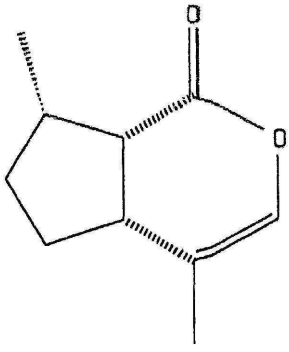
[0571] 부정관사 "하나(a)" 또는 "하나(an)"가 본 발명의 조성물 중 어떤 성분의 존재를 서술하거나 설명하는 것과 관련되어 사용되는 경우, 그 서술 또는 설명이 명백히 다르게 표시하지 않는한, 그러한 부정관사의 사용은 개수에 있어 그 조성물 중 성분의 존재를 하나로 한정하지 않는 것으로 이해되어야 한다.

도면

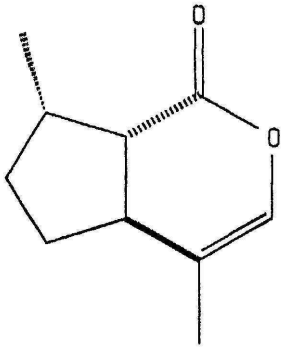
도면1



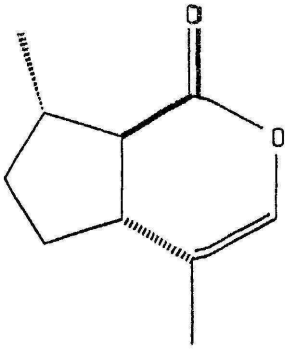
(4a,7S,7aR) 네페타락톤
(시스,트랜스-네페타락톤)



(4a,7S,7aR) 네페타락톤
(시스,트랜스-네페타락톤)



(4a,7S,7aR) 네페타락톤
(시스,트랜스-네페타락톤)



(4a,7S,7aR) 네페타락톤
(시스,트랜스-네페타락톤)