



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2008년08월04일
(11) 등록번호 10-0850252
(24) 등록일자 2008년07월29일

(51) Int. Cl.

A61K 31/275 (2006.01)

(21) 출원번호 10-2003-7007242

(22) 출원일자 2003년05월29일

심사청구일자 2006년12월15일

번역문제출일자 2003년05월29일

(65) 공개번호 10-2003-0061414

(43) 공개일자 2003년07월18일

(86) 국제출원번호 PCT/EP2001/014926

국제출원일자 2001년12월18일

(87) 국제공개번호 WO 2002/49641

국제공개일자 2002년06월27일

(30) 우선권주장

2489/00 2000년12월20일 스위스(CH)

(56) 선행기술조사문헌

FR 1520925 A

EP 0953565 A

전체 청구항 수 : 총 3 항

(73) 특허권자

노파르티스 아게

스위스 체하-4056 바젤 리히트스트라쎄 35

(72) 발명자

두크레이피에르

프랑스에프-68300세인트-루이스루테허닝15에이

보비에르야쿠스

스위스체하-2000뉴체텔루테스팍스2

(74) 대리인

이은선, 최규팔

심사관 : 김용

(54) 유기 화합물

(57) 요약

본 발명은 상기 화학식 (I)의 아미노아세토니트릴 화합물(여기서, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₉, A, m 및 n은 청구항 제 1항의 정의와 같다)의 온혈 다산 가축류 및 가축에서 내부기생충, 특히 윤충의 구제를 위한 용도에 관한 것이다.

(81) 지정국

국내특허 : 아랍에미리트, 안티구와바부다, 알바니아, 아르메니아, 오스트리아, 오스트레일리아, 아제르바이잔, 보스니아 헤르체고비나, 바베이도스, 불가리아, 브라질, 벨라루스, 벨리즈, 캐나다, 스위스, 중국, 콜롬비아, 코스타리카, 쿠바, 체코, 독일, 덴마크, 도미니카, 알제리, 에쿠아도르, 에스토니아, 스페인, 핀란드, 영국, 그라나다, 그루지야, 가나, 크로아티아, 인도네시아, 이스라엘, 인도, 아이슬란드, 일본, 케냐, 키르기즈스탄, 북한, 대한민국, 카자흐스탄, 세인트루시아, 스리랑카, 리투아니아, 룩셈부르크, 라트비아, 모로코, 몰도바, 마케도니아공화국, 몽고, 멕시코, 노르웨이, 뉴질랜드, 폴란드, 포르투갈, 루마니아, 러시아, 스웨덴, 싱가포르, 슬로베니아, 슬로바키아, 타지키스탄, 투르크멘, 터키, 트리니다드토바고, 우크라이나, 우즈베키스탄, 베트남, 세르비아 앤 몬테네그로, 남아프리카, 짐바브웨, 헝가리, 필리핀, 미국, 오만, 잠비아

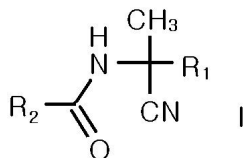
EA 유라시아특허 : 아르메니아, 아제르바이잔, 벨라루스, 키르기즈스탄, 카자흐스탄, 몰도바, 러시아, 타지키스탄, 투르크멘

EP 유럽특허 : 오스트리아, 벨기에, 스위스, 사이프러스, 독일, 덴마크, 스페인, 핀란드, 프랑스, 영국, 그리스, 아일랜드, 이탈리아, 룩셈부르크, 모나코, 네덜란드, 포르투갈, 스웨덴, 터키

특허청구의 범위

청구항 1

생리학적으로 허용되는 담체 또는 분산제에 부가해서, 유효량의 하기 화학식 I의 화합물 및 그의 임의의 에난티오머를 포함하는 온혈 다산 가축류 및 가축에서의 내부기생성 해충의 구제를 위한 조성물:



상기식에서,

R₂는 비치환된 페닐 또는 R₅에 의해 모노- 또는 디-치환된 페닐이고;

R₁은 차례로 비치환되거나 또는 R₅에 의해 모노- 또는 디-치환된 페녹시에 의해 치환된 메틸이고, 여기에서 상기 치환체의 수가 2라면, 치환체는 서로 같거나 다를 수 있으며,

R₅은 C₁-C₄-알킬, C₁-C₂-알콕시, 페녹시, C₁-C₂-알콕시카보닐, 할로젠-C₁-C₂-알킬, 할로젠-C₁-C₂-알콕시, 할로젠-C₁-C₂-알킬티오, 할로젠-C₁-C₂-알킬카보닐, 할로젠 또는 시아노이다.

청구항 2

제1항에 있어서, R₅은 메틸, 트리플루오로메틸, 메톡시, 트리플루오로메톡시, 트리플루오로메틸티오, 염소, 불소 또는 시아노인 조성물.

청구항 3

해충을 구제하기 위한 유효량의 제1항 또는 제2항에 따른 화학식 I의 화합물을 해충에 적용하여 온혈 다산 가축류 및 가축에서의 내부기생성 해충을 구제하는 방법.

청구항 4

삭제

청구항 5

삭제

청구항 6

삭제

청구항 7

삭제

청구항 8

삭제

청구항 9

삭제

청구항 10

삭제

청구항 11

삭제

청구항 12

삭제

청구항 13

삭제

청구항 14

삭제

청구항 15

삭제

청구항 16

삭제

청구항 17

삭제

청구항 18

삭제

청구항 19

삭제

청구항 20

삭제

청구항 21

삭제

청구항 22

삭제

청구항 23

삭제

청구항 24

삭제

청구항 25

삭제

청구항 26

삭제

청구항 27

삭제

청구항 28

삭제

청구항 29

삭제

청구항 30

삭제

청구항 31

삭제

청구항 32

삭제

청구항 33

삭제

청구항 34

삭제

청구항 35

삭제

명세서

기술분야

<1> 본 발명은 공지의 아미노아세토니트릴 화합물의 온혈 다산 가축류 및 가축에서의 내부기생충, 특히 윤충(helminths)의 구제를 위한 용도에 관한 것이다.

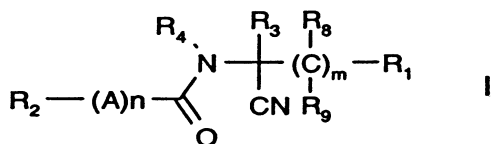
배경기술

<2> 포유동물 및 가금에 심각한 질병의 원인이 될 수 있는 내부기생충 선충인, 윤충의 구제가 활성 성분의 소수 종류, 예컨대, 밀베마이신(milbemycins)을 사용함에 의해 시도되고 있다. 그러나, 현재까지 문헌상 개시된 활성 성분은 역가 및 활성 스펙트럼에 대한 필요를 모두 충족시키지 못하고 있다. 그러므로 구충 특성을 개선한 활성 성분이 필요하다. 본 명세서에서 아미노아세토니트릴 화합물은 내부기생충에 대해 현저한 특성을 갖는 것으로 발견되었다.

발명의 상세한 설명

<3> EP 0 953 565 A2의 실시예에는 식물의 보호를 위한 농약, 특히 살충 활성을 갖는 아미노아세토니트릴 화합물을 기술하고 있다. 놀랍게도 하기의 선택된 화학식 I의 화합물이 온혈 동물의 내부기생충에 대해 예외적으로 우수한 활성을 갖고, 숙주에 의해 매우 잘 견딜 수 있는 것을 발견하였다.

<4> 상기 화학물은 하기 화학식 I의 화합물 및 그의 임의의 에난티오머에 상응한다:



<5>

<6> 여기서,

<7> R₁은 치환된 C₁-C₄-알킬렌이고, 여기서, 상기 치환체는 비치환된 아릴옥시 또는 R₅에 의해 1- 내지 5- 치환된 아릴옥시 및 비치환된 피리딜옥시 또는 R₅에 의해 1- 내지 4- 치환된 피리딜옥시를 포함하는 군에서 선택되고, 여기서, 상기 치환체의 수가 1보다 크다면 치환체는 서로 같거나 다를 수 있으며,

<8> R₂는 비치환된 페닐 또는 R₅에 의해 1- 내지 5- 치환된 페닐, 또는 비치환된 피리딜 또는 R₅에 의해 1- 내지 4- 치환된 피리딜이고;

<9> R₃ 및 R₈은 독립적으로 수소, C₁-C₆-알킬 또는 할로젠-C₁-C₆-알킬을 나타내거나; 함께 C₂-C₆-알킬렌이고;

<10> R₄은 수소, C₁-C₆-알킬 또는 할로젠-C₁-C₆-알킬이고 ;

<11> R₅은 C₁-C₆-알킬, C₁-C₆-알콕시, 할로젠-C₁-C₆-알킬, 할로젠-C₁-C₆-알콕시, C₂-C₆-알케닐, 할로젠-C₂-C₆-알케닐, C₂-C₆-알키닐, 할로젠-C₂-C₆-알키닐, C₃-C₈-사이클로알킬, C₁-C₆-알킬카보닐, 할로젠-C₁-C₆-알킬카보닐, C₁-C₆-알콕시카보닐, 할로젠-C₁-C₆-알콕시카보닐, C₁-C₆-알킬설포닐, C₁-C₆-알킬설피닐, C₁-C₆-알킬티오, 할로젠-C₁-C₆-알킬티오, 페닐, 페녹시, 할로젠, 시아노 또는 니트로이고;

<12> A는 C(R₆)(R₇), CH=CH 또는 C≡C이고 ;

<13> R₆ 및 R₇는 독립적으로 수소, 할로젠, C₁-C₆-알킬, C₁-C₆-알콕시, 할로젠-C₁-C₆-알킬, 할로젠-C₁-C₆-알콕시 또는 C₃-C₆-사이클로알킬을 나타내거나; 함께 C₂-C₆-알킬렌을 나타내고 ;

<14> R₉는 수소 또는 CC₁-C₆-알킬을 나타내고 ;

<15> m 및 n은 독립적으로 0 또는 1이다.

<16> 알킬-그것 자체의 그룹으로서 및 다른 그룹 및 할로젠-알킬, 알콕시, 및 알킬티오와 같은 화합물의 구조적 요소로서-은 그룹중의 특정 탄소원자수 또는 문제의 화합물을 각각의 경우에 고려하여, 직쇄, 즉, 메틸, 에틸, 프로필, 부틸, 펜틸, 헥실, 펩틸 또는 옥틸, 또는 분지쇄, 예컨대, 이소프로필, 이소부틸, sec.-부틸, tert.-부틸, 이소펜틸, 네오펀틸 또는 이소헥실이다.

<17> 사이클로알킬-그것 자체의 그룹으로서 및 다른 그룹 및 할로사이클로알킬, 사이클로알콕시 및 사이클로알킬티오와 같은 화합물의 구조적 요소-은, 그룹중의 특정 탄소원자수 또는 문제의 화합물을 각각의 경우에 고려하여, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸, 사이클로헥실, 사이클로헵틸 또는 사이클로옥틸이다.

<18> 알케닐-그것 자체의 그룹으로서 및 다른 그룹 및 화합물의 구조적 요소로서-은, 그룹중의 특정 탄소원자수 또는 문제의 화합물 및 공액화되거나 분리된 이중 결합을 각각의 경우에 고려하여, 직쇄, 예컨대 아틸, 2-부테닐, 3-펜테닐, 1-헥세닐, 1-헵테닐, 1,3-헥사디에닐 또는 1,3-옥타디에닐, 또는 분지쇄, 예컨대 이소프로페닐, 이소부테닐, 이소프레닐, tert.-펜테닐, 이소헥세닐, 이소헵테닐 또는 이소옥테닐이다.

<19> 알키닐-그것 자체의 그룹으로서 및 다른 그룹 및 화합물의 구조적 요소로서-은, 그룹중의 특정 탄소원자수 또는 문제의 화합물 및 공액화되거나 분리된 이중 결합을 각각의 경우에 고려하여, 직쇄, 예컨대 프로파질, 2-부티닐, 3-펜티닐, 1-헥시닐, 1-헵티닐, 3-헥센-1-이닐 또는 1,5-헵타디엔-3-이닐, 또는 분지쇄, 예컨대 3-메틸부트-1-이닐, 4-에틸펜트-1-이닐, 4-메틸헥스-2-이닐 또는 2-메틸헵트-3-이닐이다.

<20> 아릴옥시는 페닐옥시 또는 1- 또는 2-나프틸옥시이다.

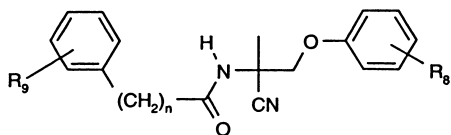
<21> 규칙으로서, 할로젠은 불소, 염소, 브롬 또는 요오드이다. 할로젠알킬 또는 할로젠페닐과 같은 다른 요소와의 조합에서의 할로젠에서 동일하다.

- <22> 할로젠-치환된 탄소 함유 그룹 및 화합물은 부분적으로 할로젠화되거나 퍼할로젠화될 수 있고, 여기서, 다수의 할로젠화의 경우, 할로젠 치환체는 동일하거나 다를 수 있다. 할로젠-알킬의 예는-그것 자체의 그룹으로서 및 다른 그룹 및 할로젠-알콕시 또는 할로젠-알킬티오와 같은 화합물의 구조적 요소로서-, 불소, 염소 및/또는 브롬에 의해 1- 내지 3- 치환된 메틸, 에틸, CHF_2 또는 CF_3 ; 불소, 염소 및/또는 브롬에 의해 1- 내지 5- 치환된 에틸, 에틸, CH_2CF_3 , CF_2CF_3 , CF_2CCl_3 , CF_2CHCl_2 , CF_2CHF_2 , CF_2CFCl_2 , CF_2CHBr_2 , CF_2CHClF , CF_2CHBrF 또는 CClFCHClF ; 불소, 염소 및/또는 브롬에 의해 1- 내지 7- 치환된 프로필 또는 이소프로필, 에틸, $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2\text{CHFCH}_2\text{Br}$, $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 또는 $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$; 불소, 염소 및/또는 브롬에 의해 1- 내지 9번치환된 부틸 또는 그의 하나의 이성질체, 에틸, $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHFCF}_3$ 또는 $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$; 불소, 염소 및/또는 브롬에 의해 1 내지 11- 치환된 펜틸 또는 그의 하나의 이성질체, 에틸, $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ 또는 $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$; 및 불소, 염소 및/또는 브롬에 의해 1 내지 13- 치환된 헥실 또는 그의 하나의 이성질체, 에틸, $(\text{CH}_2)_4\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2(\text{CHF})_4\text{CF}_3$, $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_4\text{CF}_3$ 또는 $\text{C}(\text{CF}_3)_2(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ 이다.
- <23> 알콕시 그룹은 바람직하게는 1 내지 6개의 탄소원자의 체인 길이를 갖는다. 알콕시는 에틸, 메톡시, 에톡시, 프로톡시, 이소프로톡시, n-부톡시, 이소부톡시, sec.-부톡시 및 tert.-부톡시, 뿐만 아니라 펜틸옥시 및 헥실 옥시 이성질체; 바람직하게는 메톡시 및 에톡시이다. 할로젠알콕시 그룹은 바람직하게는 1 내지 6개의 탄소원자의 체인 길이를 갖는다. 할로젠알콕시는 에틸 플루오로메톡시, 디플루오로메톡시, 트리플루오로메톡시, 2,2,2-트리플루오로에톡시, 1,1,2,2-테트라플루오로에톡시, 2-플루오로에톡시, 2-클로로에톡시, 2,2-디플루오로에톡시 및 2,2,2-트리클로로에톡시; 바람직하게는 디플루오로메톡시, 2-클로로에톡시 및 트리플루오로메톡시이다.
- <24> 본 발명의 범위에 속하는 바람직한 구체에는:
- <25> (1) 화학식 1의 화합물, 여기서, R_1 은 치환된 C_1 - C_4 -알킬렌이고, 여기서 상기 치환체는 비치환된 페닐옥시 또는 R_5 에 의해 1- 내지 3- 치환된 페닐옥시를 포함하는 군에서 선택되고, 여기서, 상기 치환체의 수가 1보다 크다면 치환체는 서로 같거나 다를 수 있으며; 특히 치환된 C_1 - C_2 -알킬렌이고, 여기서 상기 치환체는 비치환된 페닐옥시 또는 R_5 에 의해 1- 내지 3- 치환된 페닐옥시를 포함하는 군에서 선택되고, 여기서, 상기 치환체의 수가 1보다 크다면 치환체는 서로 같거나 다를 수 있으며; 보다 특히 치환된 메틸렌이고, 여기서 상기 치환체는 비치환된 페닐옥시 또는 R_5 에 의해 1- 내지 2- 치환된 페닐옥시를 포함하는 군에서 선택되고, 여기서, 상기 치환체의 수가 1보다 크다면 치환체는 서로 같거나 다를 수 있다;
- <26> (2) 화학식 1의 화합물, 여기서, R_2 는 비치환된 페닐 또는 R_5 에 의해 1- 내지 5- 치환된 페닐; 특히 R_5 에 의해 1- 내지 3- 치환된 페닐; 보다 특히 R_5 에 의해 1- 내지 2- 치환된 페닐이다;
- <27> (3) 화학식 1의 화합물, 여기서, R_3 은 수소, C_1 - C_6 -알킬; 특히 수소 또는 C_1 - C_4 -알킬; 보다 특히 메틸이다;
- <28> (4) 화학식 1의 화합물, 여기서, R_4 은 수소, C_1 - C_6 -알킬; 특히 수소 또는 C_1 - C_2 -알킬; 보다 특히 수소이다;
- <29> (5) 화학식 1의 화합물, 여기서, R_5 은 C_1 - C_6 -알킬, C_1 - C_6 -알콕시, 할로젠- C_1 - C_6 -알킬, 할로젠- C_1 - C_6 -알콕시, C_2 - C_6 -알케닐, 할로젠- C_2 - C_6 -알케닐, C_2 - C_6 -알키닐, 할로젠- C_2 - C_6 -알키닐, C_3 - C_8 -사이클로알킬, C_1 - C_6 -알킬카보닐, 할로젠- C_1 - C_6 -알킬카보닐, C_1 - C_6 -알콕시카보닐, 할로젠- C_1 - C_6 -알콕시카보닐, C_1 - C_6 -알킬설폰일, 할로젠- C_1 - C_6 -알킬설폰일, 할로젠, 시아노 또는 니트로; 보다 바람직하게는 C_1 - C_2 -알킬, 할로젠- C_1 - C_2 -알킬, 할로젠, 시아노 또는 니트로; 특히 할로젠- C_1 - C_2 -알킬 또는 할로젠이다;
- <30> (6) 화학식 1의 화합물, 여기서, A는 $\text{C}(\text{R}_6)(\text{R}_7)$, $\text{CH}=\text{CH}$ 또는 $\text{C}\equiv\text{C}$; 특히 $\text{C}(\text{R}_6)(\text{R}_7)$ 이다;
- <31> (7) 화학식 1의 화합물, 여기서, R_6 및 R_7 는 독립적으로 수소, 할로젠, C_1 - C_6 -알킬, C_1 - C_6 -알콕시, 할로젠- C_1 - C_6 -알킬, 할로젠- C_1 - C_6 -알콕시 또는 C_3 - C_6 -사이클로알킬을 나타내거나; 함께 C_2 - C_6 -알킬렌; 특히 독립적으로 수소 또는 C_1 - C_2 -알킬; 보다 특히 수소이다.

- <32> (8) 화학식 1의 화합물, 여기서, R_8 는 수소 또는 C_1-C_6 -알킬; 특히 수소 또는 C_1-C_4 -알킬; 보다 특히 수소이다;
- <33> (9) 화학식 1의 화합물, 여기서, R_9 는 수소 또는 C_1-C_4 -알킬; 특히 수소 또는 C_1-C_2 -알킬; 보다 특히 수소이다;
- <34> (10) 화학식 1의 화합물, 여기서, m 은 0 이다;
- <35> (11) 화학식 1의 화합물, 여기서, n 은 1이다;
- <36> (12) 화학식 1의 화합물, 여기서, R_1 은 치환된 C_1-C_4 -알킬렌이고, 여기서 상기 치환체는 비치환된 페닐옥시 또는 R_5 에 의해 1- 내지 3- 치환된 페닐옥시를 포함하는 군에서 선택되고, 여기서, 상기 치환체의 수가 1보다 크다면 치환체는 서로 같거나 다를 수 있으며; R_2 는 비치환된 페닐 또는 R_5 에 의해 1- 내지 5- 치환된 페닐이고; R_3 은 수소, C_1-C_6 -알킬이고; R_4 은 수소, C_1-C_6 -알킬이고; R_5 은 C_1-C_6 -알킬, C_1-C_6 -알콕시, 할로젠- C_1-C_6 -알킬, 할로젠- C_1-C_6 -알콕시, 할로젠, 시아노 또는 니트로이고; A는 $C(R_6)(R_7)$, $CH=CH$ 또는 $C\equiv C$ 이고; R_6 및 R_7 는 독립적으로 수소, 할로젠, C_1-C_6 -알킬, C_1-C_6 -알콕시, 할로젠- C_1-C_6 -알킬, 할로젠- C_1-C_6 -알콕시 또는 C_3-C_6 -사이클로알킬을 나타내거나; 함께 C_2-C_6 -알킬렌이고; R_8 는 수소 또는 C_1-C_6 -알킬이고; m 은 0 이고, n 은 1이다;
- <37> (13) 화학식 1의 화합물, 여기서, R_1 은 치환된 C_1-C_2 -알킬렌이고, 여기서 상기 치환체는 비치환된 페닐옥시 또는 R_5 에 의해 1- 내지 3- 치환된 페닐옥시를 포함하는 군에서 선택되고, 여기서, 상기 치환체의 수가 1보다 크다면 치환체는 서로 같거나 다를 수 있으며; R_2 는 R_5 에 의해 1- 내지 3- 치환된 페닐이고; R_3 은 수소 또는 C_1-C_4 -알킬이고; R_4 은 수소 또는 C_1-C_2 -알킬이고; R_5 은 C_1-C_2 -알킬, 할로젠- C_1-C_2 -알킬, 할로젠, 시아노 또는 니트로이고; A는 $C(R_6)(R_7)$ 이고; R_6 및 R_7 는 독립적으로 수소 또는 C_1-C_2 -알킬이고; R_8 는 수소 또는 C_1-C_6 -알킬이고; m 은 0 이고, n 은 1이다;
- <38> (14) 화학식 1의 화합물, 여기서, R_1 은 치환된 메틸렌이고, 여기서 상기 치환체는 비치환된 페닐옥시 또는 R_5 에 의해 1- 내지 2- 치환된 페닐옥시를 포함하는 군에서 선택되고, 여기서, 상기 치환체의 수가 1보다 크다면 치환체는 서로 같거나 다를 수 있고; R_2 는 R_5 에 의해 1- 내지 2- 치환된 페닐이고; R_3 은 메틸이고; R_4 은 수소이고; R_5 은 할로젠- C_1-C_2 -알킬 또는 할로젠이고; A는 $C(R_6)(R_7)$ 이고; R_6 , R_7 , R_8 는 수소이고, m 은 0 이고, n 은 1이다.
- <39> 하기 표 1에 명명된 화학식 I의 화합물이 특히 바람직하다.
- <40> 화합물 I은 가능한 이성질체의 하나 또는 그의 혼합물의 형태로 존재할 수 있고, 예컨대 순수 이성질체로서 비대칭 탄소 원자의 절대 및 상대 배위, 수에 의존하여, 예컨대, 안티포드(antipode) 및/또는 디아스테레오이성질체, 또는 이성질체성 혼합물로서, 예컨대, 에난티오머성 혼합물, 예컨대 라세메이트, 디아스테레오이성질체성 혼합물 또는 라세믹성 혼합물로 존재할 수 있다; 본 발명은 순수 이성질체 및 모든 가능한 이성질체성 혼합물 양자에 관한 것이고, 각각의 경우에 입체화학적 상세를 언급하지 않아도 상기 및 하기에서 이해할 수 있을 것이다.
- <41> 상기 화합물의 합성은 예컨대, EP 0 953 565 A2에 기술되어 있다.

<42>

표 1



번호	n	R ₈	R ₉	물성 데이터
1.1	0	2-Cl	2-Cl	
1.2	0	2-Cl	3-Cl	
1.3	0	2-Cl	4-Cl	m.p. 137-9°
1.4	0	2-Cl	2,3-Cl ₂	
1.5	0	2-Cl	2,4-Cl ₂	
1.6	0	2-Cl	2,5-Cl ₂	
1.7	0	2-Cl	2,6-Cl ₂	m.p. 178-80°
1.8	0	2-Cl	3,4-Cl ₂	
1.9	0	2-Cl	3,5-Cl ₂	
1.10	0	2-Cl	2-CF ₃	m.p. 47-49°
1.11	0	2-Cl	3-CF ₃	
1.12	0	2-Cl	4-CF ₃	m.p. 131-3°
1.13	0	3-Cl	2-Cl	
1.14	0	3-Cl	3-Cl	
1.15	0	3-Cl	4-Cl	
1.16	0	3-Cl	2,3-Cl ₂	
1.17	0	3-Cl	2,4-Cl ₂	
1.18	0	3-Cl	2,5-Cl ₂	
1.19	0	3-Cl	2,6-Cl ₂	
1.20	0	3-Cl	3,4-Cl ₂	
1.21	0	3-Cl	3,5-Cl ₂	
1.22	0	3-Cl	2-CF ₃	
1.23	0	3-Cl	3-CF ₃	
1.24	0	3-Cl	4-CF ₃	
1.25	0	4-Cl	2-Cl	
1.26	0	4-Cl	3-Cl	

<43>

1.27	0	4-Cl	4-Cl	
1.28	0	4-Cl	2,3-Cl ₂	
1.29	0	4-Cl	2,4-Cl ₂	
1.30	0	4-Cl	2,5-Cl ₂	
1.31	0	4-Cl	2,6-Cl ₂	
1.32	0	4-Cl	3,4-Cl ₂	
1.33	0	4-Cl	3,5-Cl ₂	
1.34	0	4-Cl	2-CF ₃	
1.35	0	4-Cl	3-CF ₃	
1.36	0	4-Cl	4-CF ₃	
1.37	0	2,3-Cl ₂	2-Cl	
1.38	0	2,3-Cl ₂	3-Cl	
1.39	0	2,3-Cl ₂	4-Cl	m.p. 190-2°
1.40	0	2,3-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.41	0	2,3-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.42	0	2,3-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.43	0	2,3-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.44	0	2,3-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.45	0	2,3-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.46	0	2,3-Cl ₂	2-CF ₃	
1.47	0	2,3-Cl ₂	3-CF ₃	
1.48	0	2,3-Cl ₂	4-CF ₃	m.p. 155-7°
1.49	0	2,4-Cl ₂	2-Cl	
1.50	0	2,4-Cl ₂	3-Cl	m.p. 122-3°
1.51	0	2,4-Cl ₂	4-Cl	m.p. 143-5°
1.52	0	2,4-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.53	0	2,4-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.54	0	2,4-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.55	0	2,4-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.56	0	2,4-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.57	0	2,4-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.58	0	2,4-Cl ₂	2-CF ₃	
1.59	0	2,4-Cl ₂	3-CF ₃	

<44>

1.60	0	2,4-Cl ₂	4-CF ₃	m.p. 99-102°
1.61	0	2,5-Cl ₂	2-Cl	
1.62	0	2,5-Cl ₂	3-Cl	
1.63	0	2,5-Cl ₂	4-Cl	
1.64	0	2,5-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.65	0	2,5-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.66	0	2,5-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.67	0	2,5-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.68	0	2,5-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.69	0	2,5-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.70	0	2,5-Cl ₂	2-CF ₃	
1.71	0	2,5-Cl ₂	3-CF ₃	
1.72	0	2,5-Cl ₂	4-CF ₃	
1.73	0	2,6-Cl ₂	2-Cl	
1.74	0	2,6-Cl ₂	3-Cl	
1.75	0	2,6-Cl ₂	4-Cl	
1.76	0	2,6-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.77	0	2,6-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.78	0	2,6-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.79	0	2,6-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.80	0	2,6-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.81	0	2,6-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.82	0	2,6-Cl ₂	2-CF ₃	
1.83	0	2,6-Cl ₂	3-CF ₃	
1.84	0	2,6-Cl ₂	4-CF ₃	
1.85	0	3,4-Cl ₂	2-Cl	
1.86	0	3,4-Cl ₂	3-Cl	
1.87	0	3,4-Cl ₂	4-Cl	
1.88	0	3,4-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.89	0	3,4-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.90	0	3,4-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.91	0	3,4-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.92	0	3,4-Cl ₂	3,4-Cl ₂	

<45>

1.93	0	3,4-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.94	0	3,4-Cl ₂	2-CF ₃	
1.95	0	3,4-Cl ₂	3-CF ₃	
1.96	0	3,4-Cl ₂	4-CF ₃	m.p. 93-5°
1.97	0	3,5-Cl ₂	2-Cl	
1.98	0	3,5-Cl ₂	3-Cl	
1.99	0	3,5-Cl ₂	4-Cl	
1.100	0	3,5-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.101	0	3,5-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.102	0	3,5-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.103	0	3,5-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.104	0	3,5-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.105	0	3,5-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.106	0	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	
1.107	0	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	
1.108	0	3,5-Cl ₂	4-CF ₃	
1.109	0	2-CF ₃	2-Cl	
1.110	0	2-CF ₃	3-Cl	
1.111	0	2-CF ₃	4-Cl	
1.112	0	2-CF ₃	2,3-Cl ₂	
1.113	0	2-CF ₃	2,4-Cl ₂	
1.114	0	2-CF ₃	2,5-Cl ₂	
1.115	0	2-CF ₃	2,6-Cl ₂	m.p. 168-70°
1.116	0	2-CF ₃	3,4-Cl ₂	
1.117	0	2-CF ₃	3,5-Cl ₂	
1.118	0	2-CF ₃	2-CF ₃	
1.119	0	2-CF ₃	3-CF ₃	
1.120	0	2-CF ₃	4-CF ₃	m.p. 148.5°
1.121	0	3-CF ₃	2-Cl	
1.122	0	3-CF ₃	3-Cl	
1.123	0	3-CF ₃	4-Cl	
1.124	0	3-CF ₃	2,3-Cl ₂	
1.125	0	3-CF ₃	2,4-Cl ₂	

1.126	0	3-CF ₃	2,5-Cl ₂	
1.127	0	3-CF ₃	2,6-Cl ₂	
1.128	0	3-CF ₃	3,4-Cl ₂	
1.129	0	3-CF ₃	3,5-Cl ₂	
1.130	0	3-CF ₃	2-CF ₃	
1.131	0	3-CF ₃	3-CF ₃	
1.132	0	3-CF ₃	4-CF ₃	
1.133	0	4-CF ₃	2-Cl	
1.134	0	4-CF ₃	3-Cl	m.p. 160-2°
1.135	0	4-CF ₃	4-Cl	m.p. 147-9°
1.136	0	4-CF ₃	2,3-Cl ₂	
1.137	0	4-CF ₃	2,4-Cl ₂	
1.138	0	4-CF ₃	2,5-Cl ₂	
1.139	0	4-CF ₃	2,6-Cl ₂	
1.140	0	4-CF ₃	3,4-Cl ₂	
1.141	0	4-CF ₃	3,5-Cl ₂	
1.142	0	4-CF ₃	2-CF ₃	
1.143	0	4-CF ₃	3-CF ₃	
1.144	0	4-CF ₃	4-CF ₃	m.p. 140-3°
1.145	1	2-Cl	2-Cl	
1.146	1	2-Cl	3-Cl	
1.147	1	2-Cl	4-Cl	
1.148	1	2-Cl	2,3-Cl ₂	
1.149	1	2-Cl	2,4-Cl ₂	
1.150	1	2-Cl	2,5-Cl ₂	
1.151	1	2-Cl	2,6-Cl ₂	
1.152	1	2-Cl	3,4-Cl ₂	
1.153	1	2-Cl	3,5-Cl ₂	
1.154	1	2-Cl	2-CF ₃	
1.155	1	2-Cl	3-CF ₃	
1.156	1	2-Cl	4-CF ₃	
1.157	1	3-Cl	2-Cl	
1.158	1	3-Cl	3-Cl	

<47>

1.159	1	3-Cl	4-Cl
1.160	1	3-Cl	2,3-Cl ₂
1.161	1	3-Cl	2,4-Cl ₂
1.162	1	3-Cl	2,5-Cl ₂
1.163	1	3-Cl	2,6-Cl ₂
1.164	1	3-Cl	3,4-Cl ₂
1.165	1	3-Cl	3,5-Cl ₂
1.166	1	3-Cl	2-CF ₃
1.167	1	3-Cl	3-CF ₃
1.168	1	3-Cl	4-CF ₃
1.169	1	4-Cl	2-Cl
1.170	1	4-Cl	3-Cl
1.171	1	4-Cl	4-Cl
1.172	1	4-Cl	2,3-Cl ₂
1.173	1	4-Cl	2,4-Cl ₂
1.174	1	4-Cl	2,5-Cl ₂
1.175	1	4-Cl	2,6-Cl ₂
1.176	1	4-Cl	3,4-Cl ₂
1.177	1	4-Cl	3,5-Cl ₂
1.178	1	4-Cl	2-CF ₃
1.179	1	4-Cl	3-CF ₃
1.180	1	4-Cl	4-CF ₃
1.181	1	2,3-Cl ₂	2-Cl
1.182	1	2,3-Cl ₂	3-Cl
1.183	1	2,3-Cl ₂	4-Cl
1.184	1	2,3-Cl ₂	2,3-Cl ₂
1.185	1	2,3-Cl ₂	2,4-Cl ₂
1.186	1	2,3-Cl ₂	2,5-Cl ₂
1.187	1	2,3-Cl ₂	2,6-Cl ₂
1.188	1	2,3-Cl ₂	3,4-Cl ₂
1.189	1	2,3-Cl ₂	3,5-Cl ₂
1.190	1	2,3-Cl ₂	2-CF ₃
1.191	1	2,3-Cl ₂	3-CF ₃

<48>

1.192	1	2,3-Cl ₂	4-CF ₃	
1.193	1	2,4-Cl ₂	2-Cl	
1.194	1	2,4-Cl ₂	3-Cl	m.p. 151-3°
1.195	1	2,4-Cl ₂	4-Cl	m.p. 102-4°
1.196	1	2,4-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.197	1	2,4-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.198	1	2,4-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.199	1	2,4-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.200	1	2,4-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.201	1	2,4-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.202	1	2,4-Cl ₂	2-CF ₃	
1.203	1	2,4-Cl ₂	3-CF ₃	
1.204	1	2,4-Cl ₂	4-CF ₃	m.p. 94-6°
1.205	1	2,5-Cl ₂	2-Cl	
1.206	1	2,5-Cl ₂	3-Cl	
1.207	1	2,5-Cl ₂	4-Cl	
1.208	1	2,5-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.209	1	2,5-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.210	1	2,5-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.211	1	2,5-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.212	1	2,5-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.213	1	2,5-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.214	1	2,5-Cl ₂	2-CF ₃	
1.215	1	2,5-Cl ₂	3-CF ₃	
1.216	1	2,5-Cl ₂	4-CF ₃	
1.217	1	2,6-Cl ₂	2-Cl	
1.218	1	2,6-Cl ₂	3-Cl	
1.219	1	2,6-Cl ₂	4-Cl	
1.220	1	2,6-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.221	1	2,6-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.222	1	2,6-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.223	1	2,6-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.224	1	2,6-Cl ₂	3,4-Cl ₂	

1.225	1	2,6-Cl ₂	3,5-Cl ₂
1.226	1	2,6-Cl ₂	2-CF ₃
1.227	1	2,6-Cl ₂	3-CF ₃
1.228	1	2,6-Cl ₂	4-CF ₃
1.229	1	3,4-Cl ₂	2-Cl
1.230	1	3,4-Cl ₂	3-Cl
1.231	1	3,4-Cl ₂	4-Cl
1.232	1	3,4-Cl ₂	2,3-Cl ₂
1.233	1	3,4-Cl ₂	2,4-Cl ₂
1.234	1	3,4-Cl ₂	2,5-Cl ₂
1.235	1	3,4-Cl ₂	2,6-Cl ₂
1.236	1	3,4-Cl ₂	3,4-Cl ₂
1.237	1	3,4-Cl ₂	3,5-Cl ₂
1.238	1	3,4-Cl ₂	2-CF ₃
1.239	1	3,4-Cl ₂	3-CF ₃
1.240	1	3,4-Cl ₂	4-CF ₃
1.241	1	3,5-Cl ₂	2-Cl
1.242	1	3,5-Cl ₂	3-Cl
1.243	1	3,5-Cl ₂	4-Cl
1.244	1	3,5-Cl ₂	2,3-Cl ₂
1.245	1	3,5-Cl ₂	2,4-Cl ₂
1.246	1	3,5-Cl ₂	2,5-Cl ₂
1.247	1	3,5-Cl ₂	2,6-Cl ₂
1.248	1	3,5-Cl ₂	3,4-Cl ₂
1.249	1	3,5-Cl ₂	3,5-Cl ₂
1.250	1	3,5-Cl ₂	2-CF ₃
1.251	1	3,5-Cl ₂	3-CF ₃
1.252	1	3,5-Cl ₂	4-CF ₃
1.253	1	2-CF ₃	2-Cl
1.254	1	2-CF ₃	3-Cl
1.255	1	2-CF ₃	4-Cl
1.256	1	2-CF ₃	2,3-Cl ₂
1.257	1	2-CF ₃	2,4-Cl ₂

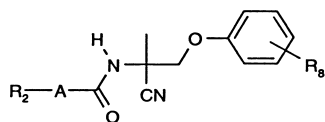
<50>

1.258	1	2-CF ₃	2,5-Cl ₂	
1.259	1	2-CF ₃	2,6-Cl ₂	
1.260	1	2-CF ₃	3,4-Cl ₂	
1.261	1	2-CF ₃	3,5-Cl ₂	
1.262	1	2-CF ₃	2-CF ₃	
1.263	1	2-CF ₃	3-CF ₃	
1.264	1	2-CF ₃	4-CF ₃	
1.265	1	3-CF ₃	2-Cl	
1.266	1	3-CF ₃	3-Cl	
1.267	1	3-CF ₃	4-Cl	
1.268	1	3-CF ₃	2,3-Cl ₂	
1.269	1	3-CF ₃	2,4-Cl ₂	
1.270	1	3-CF ₃	2,5-Cl ₂	
1.271	1	3-CF ₃	2,6-Cl ₂	
1.272	1	3-CF ₃	3,4-Cl ₂	
1.273	1	3-CF ₃	3,5-Cl ₂	
1.274	1	3-CF ₃	2-CF ₃	
1.275	1	3-CF ₃	3-CF ₃	
1.276	1	3-CF ₃	4-CF ₃	
1.277	1	4-CF ₃	2-Cl	
1.278	1	4-CF ₃	3-Cl	m.p. 136-8°
1.279	1	4-CF ₃	4-Cl	m.p. 133-5°
1.280	1	4-CF ₃	2,3-Cl ₂	
1.281	1	4-CF ₃	2,4-Cl ₂	
1.282	1	4-CF ₃	2,5-Cl ₂	
1.283	1	4-CF ₃	2,6-Cl ₂	
1.284	1	4-CF ₃	3,4-Cl ₂	
1.285	1	4-CF ₃	3,5-Cl ₂	
1.286	1	4-CF ₃	2-CF ₃	
1.287	1	4-CF ₃	3-CF ₃	
1.288	1	4-CF ₃	4-CF ₃	m.p. 126-8°

<51>

<52>

표 2



번호	A	R ₈	R ₂	물성 데이터
2.1	-	H	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 137°
2.2	-	2-F	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p.155°
2.3	-	2-Cl	C ₆ H ₄ -2-F	
2.4	-	2-Cl	C ₆ H ₄ -4-F	
2.5	-	2-Cl	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	
2.6	-	2-Cl	C ₆ H ₄ -4-C(O)CH ₃	m.p. 135-7°
2.7	-	2-Cl	C ₆ H ₃ -2,6-F ₂	m.p. 108-11°
2.8	-	2-Cl	C ₆ H ₃ -2-F-4-CF ₃	
2.9	-	2-CF ₃	C ₆ H ₃ -2,6-F ₂	m.p. 40-4°
2.10	-	2-CF ₃	C ₆ H ₄ -4-CH ₃	m.p. 147-50°
2.11	-	2-CF ₃	C ₆ H ₄ -4-t-C ₄ H ₉	m.p. 160-3°
2.12	-	2-CF ₃	C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	m.p. 180-2°
2.13	-	2-CF ₃	C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₅	m.p. 45-9°
2.14	-	2-CF ₃	C ₆ H ₄ -4-SCF ₃	m.p. 78-82°
2.15	-	2-CF ₃	C ₆ H ₄ -4-C(O)OCH ₃	m.p. 144-6°
2.16	-	2-CF ₃	C ₆ H ₄ -4-C(O)CF ₃	m.p. 52-6°
2.17	-	2-CF ₃	C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₅	m.p. 137-40°
2.18	-	2-CF ₃	C ₆ H ₃ -2,4-(CF ₃) ₂	m.p. 49-52°
2.19	-	2-CF ₃	C ₆ H ₃ -2-F-4-CF ₃	
2.20	-	2-CF ₃	C ₆ H ₃ -3-F-4-CF ₃	m.p. 149-50°
2.21	-	2-CF ₃	3-C ₅ H ₃ N-6-Cl	m.p. 138-40°
2.22	-	2-OCH ₃	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 86°
2.23	-	2-OCF ₃	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 105°
2.24	-	4-S(O ₂)CH ₃	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	
2.25	-	2-C(O)OCH ₃	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 118°
2.26	-	2,4-F ₂	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 130°
2.27	-	2,5-F ₂	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 125°
2.28	-	2,5-Cl ₂	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 140°
2.29	-	2-Cl, 4-CH ₃	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 133°
2.30	-	2-Cl, 5-CH ₃	C ₆ H ₄ -4-C(O)CF ₃	m.p. 46-50°
2.31	-	2-Cl, 5-CH ₃	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 141°
2.32	-	2-Cl, 4-CF ₃	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 146°
2.33	-	2-Cl, 4-OCH ₃	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 122°
2.34	-	2,5-(CH ₃) ₂	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 71°
2.35	-	2-F, 5-CH ₃	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 133°
2.36	-	2-F, 5-CF ₃	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 127°
2.37	-	2,3,6-F ₃	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	m.p. 150-1°
2.38	CH ₂ CH ₂	2-Cl	C ₆ H ₅	m.p. 120-2°
2.39	CH ₂ CH ₂	2-CF ₃	C ₆ H ₃ -2,3-Cl ₂	m.p. 128-30°
2.40	CH=CH	2-Cl	C ₆ H ₄ -4-CF ₃	
2.41	CH=CH	2-CF ₃	C ₆ H ₄ -2-CF ₃	m.p. 102-4°
2.42	1,1-사이클로부틸	2-Cl	C ₆ H ₄ -4-Cl	m.p. 104-7°
2.43	CH ₂ CH ₂ CH ₂	2-CF ₃	C ₆ H ₅	m.p. 99-103°

<53>

<54>

<55>

본 발명에 따른 화합물 I은 그의 넓은 활성 스펙트럼에 의해 주목할 만하고, 동물에서 특히 내부기생충, 특히 윤충의 구제를 포함하는 해충 구제의 분야에서 활성 성분으로 가치가 있고, 온혈 동물, 물고기 및 식물에 의해 잘 견딜 수 있다. 이것은 포유동물 및 가금 예컨대 양, 돼지, 염소, 소, 말, 당나귀, 개, 고양이, 기니 피그 및 외래의 조류에서 심각한 질환을 유발할 수 있는 내부기생성 선충을 포함한다. 이러한 처방의 일반적인 선충은:

해모쿠스(*Haemonchus*), 트리코스트롱지러스 (*Trichostrongylus*), 오스테르타지아(*Ostertagia*), 네마토디러스(*Nematodirus*), 코오페리아(*Cooperia*), 아스카리스(*Ascaris*), 부노스토눔(*Bunostomum*), 오소파고스토눔(*Oesophagostomum*), 차르베르티아(*Charbertia*), 트리추리스(*Trichuris*), 스트롱지러스(*Strongylus*), 트리코네마(*Trichonema*), 디티오키루스(*Dictyocaulus*), 카필라리아(*Capillaria*), 헤테라키스(*Heterakis*), 톡소카라(*Toxocara*), 아스카리디아 (*Ascaridia*), 옥시유리스(*Oxyuris*), 안실로스토마(*Ancylostoma*), 운시마리아(*Uncinaria*), 톡사스칼리스(*Toxascaris*) 및 파라스칼리스(*Parascaris*)이다. 화학식 I의 화합물의 특히 이점은 벤즈이미다졸에 기초한 활성 성분에 내성인 상기 기생충에 대한 이들의 효력이다.

<56> 네마토디러스(*Nematodirus*), 코오페리아(*Cooperia*) 및 오소파고스토눔 (*Oesophagostomum*)의 속의 어떤 해충은 숙주 동물의 내장관을 공격하고, 해모쿠스(*Haemonchus*) 및 오스테르타지아(*Ostertagia*)의 다른 속은 위장에 기생하고, 디티오키루스(*Dictyocaulus*)의 속은 폐 조직에 기생한다. 필라리아테(*Filariidae*) 및 세타리아테(*Setariidae*) 과의 기생충은 내부 세포 조직 및 기관, 예컨대, 심장, 혈관, 림프관 및 피하 조직에서 발견할 수 있다. 특히 주목할 만한 기생충은 개의 개사상충인, 디로필라리아 이미티스(*Dirofilaria immitis*)이다. 화학식 I의 화합물은 이러한 기생충에 대하여 매우 효과적이다.

<57> 또한 화학식 I의 화합물은 인간에 병원성인 기생충의 구제에 적합한다. 물론 소화관에 나타나는 통상의 대표적인 것들은 안실로스토마(*Ancylostoma*), 네카토(*Necator*), 아스카리스(*Ascaris*), 스트롱지로이데스(*Strongyloides*), 트리키넬라(*Trichinella*), 카필라리아(*Capillaria*), 트리추리스(*Trichuris*) 및 엔테로비우스(*Enterobius*) 속이다. 본 발명의 화합물은 또한 혈관, 조직, 다양한 기관에 나타나는 위체레리아(*Wuchereria*), 브루지아(*Brugia*), 온코세카(*Onchocerca*) 속의 기생충 및 필라리아테(*Filariidae*) 과로부터의 로아(*Loa*) 기생충에 효과적이고, 특히 위장관을 공격하는 스트롱지로이데스(*Strongyloides*) 및 트리치넬라(*Trichinella*) 의 기생충에 대해 효과적이다.

<58> 화학식 I의 화합물의 우수한 살충 활성은 언급된 해충의 적어도 50-60%의 치사율에 상응한다. 특히 화학식 I의 화합물은 예외적인 장기간의 효능에 주목할만하다.

<59> 화학식 I의 화합물은 바람직하게는 변형되지 않은 형태로 사용되거나 바람직하게는 통상의 제제에 편리하게 사용되는 부형제와 함께 사용될 수 있고, 따라서, 공지의 방법에 의해 예컨대, 에멀전화가능한 농축물, 직접 희석 가능한 용액, 희석 에멀전, 용해성 분말, 과립 또는 폴리머성 물질내의 마이크로캡슐로 제조될 수 있다. 조성물에 있어, 적용방법은 의도한 목적 및 우수한 상황에 따라 선택할 수 있다.

<60> 제제, 즉 화학식 1의 활성 성분을 포함하는 시약, 제조물 또는 조성물 또는 이 활성성분과 다른 활성 성분 및 임의의 고체 또는 액체 부형제와의 조합은 그것 자체의 공지의 방법에 의해 제조될 수 있고, 예컨대, 밀접히 혼합 및/또는 예컨대, 용매, 고체 담체 및 임의의 표면 활성 화합물(계면활성제)을 사용하여 활성 성분을 분쇄하여 조성물을 분산한다.

<61> 목적하는 용매는: 알콜, 예컨대, 에탄올, 프로판올 또는 부탄올, 및 글리콜 및 그의 에테르 및 에스테르, 예컨대, 프로필렌 글리콜, 디프로필렌 글리콜 에테르, 에틸렌 글리콜, 에틸렌 글리콜 모노메틸 또는 -에틸 에테르, 케톤, 예컨대, 사이클로헥산, 이소프로판 또는 디아세타놀 알콜, 강 극성 용매, 예컨대, N-메틸-2-피롤리돈, 디메틸 설펍사이드 또는 디메틸포름아미드, 또는 물, 식물성 오일, 예컨대, 포도(rape), 캐스터, 코코넛 또는 대두유 및 또는 필요하다면 실리콘 오일이다.

<62> 온혈동물에서 윤충을 구제하기에 사용하기 위한 바람직한 적용 형태는 용액제, 에멀전제, 현탁제(드렌치스), 식품 첨가제, 분말, 기포성 정제를 포함하는 정제, 환제, 캡슐, 마이크로캡슐 및 푸어온(pour-on) 제제를 포함하고, 상기 제제 부형제의 생리적 적합성이 고려되어야만 한다.

<63> 정제 및 환제를 위한 결합제는 물 또는 알콜에 용해가능한 화학적으로 변형된 중합체성 천연물질일 수 있고, 예컨대, 전분, 셀룰로스 또는 단백질 유도체(예컨대 메틸 셀룰로스, 카복시메틸 셀룰로스, 에틸하이드록시에틸 셀룰로스, 단백질 예컨대, 제인(zein), 젤라틴 등), 뿐만 아니라 합성 중합체, 예컨대, 폴리비닐 알콜, 폴리비닐 피롤리돈 등을 포함한다. 정제는 또한 충전제를 포함할 수 있고 (예컨대, 전분, 미세결정성 셀룰로스, 당, 락토오스 등), 활택제 및 봉해제를 포함할 수 있다.

<64> 만일 구충제가 먹이 농축물의 형태로 존재한다면, 사용된 담체는 예컨대 수행 먹이, 먹이 곡물 또는 단백질 농축물일 수 있다. 이와 같은 먹이 농축물 또는 조성물은 또는 활성 성분과는 별개로, 첨가제, 비타민, 향생체, 화학요법제 또는 다른 살충제, 1차 살정제, 항진균제, 항콕시듐제 또는 통상의 호르몬 제제, 동화작용을 갖는 물질 또는 도살을 위한 동물의 고지의 질에 영향을 주거나 기관에 유익한 성장을 촉진하는 물질을 포함한다. 만

일 조성물 또는 이들에 포함된 화학식 I의 활성 성분은 직접 먹이에 첨가하거나 또는 여물통에 첨가할 수 있고, 또한 활성성분을 포함하는 먹이 또는 음료로 제제화할 수 있고, 바람직하게는 약 0.0005 내지 0.02 중량%(5-200 ppm)를 포함한다.

<65> 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물은 단독으로 또는 다른 살생제와 조합으로 사용할 수 있다. 예컨대 활성을 증가하기 위해 같은 범위의 활성을 갖는 살충제와 혼합하여 사용할 수 있고, 예컨대 활성의 범위를 넓히기 위해 다른 범위의 활성을 갖는 물질과 혼합하여 사용할 수 있다. 소위 리펠런트(repellent)를 첨가하는 것은 또한 분별이 있을 수 있다. 만일 활성 범위가 내부기생충, 예컨대 해충에 한정된다면, 화학식 I의 화합물 내부기생충구제 특성을 갖는 물질과 조합하는 것이 바람직하다. 물론 이들은 또한 항생제 조성물과 조합하여 사용할 수 있다. 화학식 I의 화합물이 살충제이기 때문에, 즉 이들은 특히 표적 기생충의 성체 단계에 대해 특히 유효하기 때문에, 기생충의 미숙 단계를 공격하는 살충제의 첨가가 유리할 수 있다. 이와같은 방법으로, 커다란 경제적 손상을 유발하는 이같은 기생충의 거의 대부분을 커버할 수 있다. 또한 이러한 행위는 실질적으로 내성의 형성을 피하는 것을 기여한다. 많은 조합이 상승적 효과를 유도할 수 있고, 즉 활성 성분의 전체 양을 감소할 수 있고, 경제적 목적에 바람직할 수 있다. 조합의 파트너의 바람직한 그룹 및 특히 바람직한 조합 파트너는 하기에 명명되고, 조합은 화학식 I의 화합물을 첨가한 하나 이상의 이들 파트너의 조합이다.

<66> 혼합물중의 적절한 파트너는 다양한 작용기전을 갖는 살생제, 예컨대 하기에 명명되는 살충제 및 살진드기제이고, 당업자에게 오랫동안 공지되어 왔고, 예컨대 키틴 합성 저해제, 성장 조절제; 미숙 호르몬으로 작용하는 활성 성분; 살충제로서 작용하는 활성 성분 ; 넓은 밴드의 살충제, 넓은 밴드의 살진균제 및 살선충제; 및 공지의 구충제 및 곤충- 및/또는 진드기를 막는 물질, 소위 리펠런트(repellent) 또는 디태칭(detachers)이다.

<67> 적합한 살충제 및 살진드기제의 비제한적인 예는 하기와 같다:

1. 아바멕틴(Abamectin)	18. 벤푸라카프(Benfuracarb)	35. 클로르에톡시포스
2. AC 303 630	19. 벤선탭(Bensultap)	36. 클로르페나피르(Chlorfenapyr)
3. 아세팻(Acephat)	20. β -시폴루트린	37. 클로르플루아주론
4. 아크리나트린(Acrinathrin)	21. 비펜트린(Bifenthrin)	38. 클로메포스(Chlormephos)
5. 알라니카프(Alanycarb)	22. BPMC	39. 클로르피리포스
6. 알디카프(Aldicarb)	23. 브로펜프록스(Brofenprox)	40. Cis-레스메트린
7. α -시페메트린	24. 브로모포스 A	41. 클로시트린(Clocythrln)
8. 알파메트린(Alphamethrin)	25. 부펜카프(Bufencarb)	42. 클로펜테진(Clofentezin)
9. 아미트라즈(Amitraz)	26. 부프로페진(Buprofezin)	43. 시아노포스(Cyanophos)
10. 아버멕틴(Avermectin) B ₁	27. 부톡카복신(Butocarboxin)	44. 사이클로프로트린
11. AZ 60541	28. 부틸피리다벤 (Buthylpyridaben)	45. 시폴루트린(Cyfluthrin)
12. 아진포스(Azinphos) A	29. 카두사포스(Cadusafos)	46. 시헥사틴(Cyhexatin)
13. 아진포스 M	30. 카바릴(Carbaryl)	47. D 2341
14. 아진포스-메틸	31. 카보푸란(Carbofuran)	48. 델타메트린(Deltamethrin)
15. 아조시클로틴 (Azocyclotin)	32. 카보펜티온 (Carbophenthion)	49. 메메톤(Demeton) M
16. <i>Bacillus subtil.</i> 독소	33. 카르타프(Cartap)	50. 메메톤 S
17. 벤디오카프(Bendiocarb)	34. 클로에토카프(Chloethocarb)	51. 메메톤-S-메틸

52. 디부틸아미노티오	84. 플루아주론	114. 메티오카프
53. 디클로펜티온	85. 플루시클로주론 (Flucycloxuron)	115. 메토밀
54. 디클리포스	86. 플루시트리넷(Flucythrlnat)	116. 메토프렌
55. 디에티온	87. 플루펜록수론	117. 메톨카프
56. 디플루벤주론 (Diflubenzuron)	88. 플루펜프록스	118. 메빈포스
57. 디메토우트(Dimethoat)	89. 페노포스	119. 밀베멕틴

58. 디메틸빈포스	90. 포르모티온	120. 목시택틴
59. 디옥사티온	91. 포스티아젯	121. 날레드
60. DPX-MP062	92. 푸브펜프록스	122. NC 184
61. 에디펜포스	93. HCH	123. NI-25, 아세트아미프리트
62. 에마멕틴	94. 헵테노포스	124. 니텐피람
63. 엔도설판	95. 헥사플루무론	125. 오메토우트(Omethoat)
64. 에스펜발레랫(Esfenvalerat)	96. 헥시티아죽스	126. 옥사밀
65. 에티오펜캡	97. 하이드로프렌	127. 옥시데메톤 M
66. 에티온	98. 이미다클로프리트	128. 옥시데프로포스
67. 에토펜프록스	99. 인섹텐-악티브 필제(Pilze)	129. 파라티온
68. 에토프로포스	100. 인섹텐-악티브 네마토덴	130. 파라티온-메틸
69. 에트림포스		131. 퍼메트린
70. 페나미포스	101. 인섹텐-악티브 비렌	132. 펜토우트
71. 페나자퀸(Fenazaquin)		133. 포랫(Phorat)

<70>

72. 펜부타티녹시드	102. 이프로벤포스	134. 포살론
73. 페니트로티온	103. 이소펜포스	135. 포스맷
74. 페노부캡	104. 이소프로캡	136. 폭심
75. 페노티오캡	105. 이속사티온	137. 피리미캡
76. 페녹시캡	106. 이버멕틴	138. 피리미포스 A
77. 펜프로파트린	107. λ-시할로트린	139. 피리미포스 M
78. 펜피라드	108. 루페누론	140. 프로메캡
79. 펜피록시메이트	109. 말라티온	141. 프로파포스
80. 펜티온	110. 메카르밤	142. 프로폭수르(Propoxur)
81. 펜발레레이트	111. 메셀펜포스	143. 프로티오포스
82. 피프로닐	112. 메트알데히드	144. 프로토우트
83. 플루아지남	113. 메타미도포스	145. 피라클로포스

<71>

146. 피라다펜티온	161. 테부펜피라드	176. 트리아자메이트
147. 피레스메트린	162. 테부피림포스	177. 트리아조포스
148. 피레트룸	163. 테플루벤주론	178. 트리아주론
149. 피리다벤	164. 테플루트린	179. 트리클로르폰
150. 피리미디펜	165. 테메포스	180. 트리플루무론
151. 피리프록시펜	166. 테밤(Terbam)	181. 프리메타캡
152. RH 5992	167. 테부포스(Terbufos)	182. 바미도티온
153. RH-2485	168. 테트라클로르빈포스	183. XMC(3,5-자일릴메틸-카바멧)
154. 실리티온	169. 티아페녹스	
155. 세부포스	170. 티오디캡	184. 자일릴캡
156. 실라플루오펜	171. 티오파녹스	185. Y1 5301/5302
157. 스피노사드	172. 티오나진	186. ζ-시퍼메트린
158. 설포텡	173. 터링진신(Thuringiensin)	187. 제타메트린
159. 설피로포스	174. 트랄로메트린	
160. 테부페노지드	175. 트리아텐	

<72>

적합한 구충제의 비제한적인 예는 하기와 같이 명명되고, 소수의 약물은 구충활성에 추가적으로 살충 및 진드기 구제 활성을 갖고 상기 표에 부분적으로 나타난다.

<73>

(A1) 프라지퀀텔(Praziquantel) = 2-사이클로헥실카보닐-4-옥소-1, 2,3,6,7,11b-헥사하이드로-4H-피라지노 [2,1- a] 이소퀴놀린

<74>

(A2) 클로산텔(Closantel) = 3,5-디요오도-N-[5-클로로-2-메틸-4-(a-시아노-4-클로로벤질)페닐]살리실아미드

- <75> (A3) 트리클라벤다졸(Triclabendazole) = 5-클로로-6-(2,3-디클로로페녹시)-2-메틸티오-1H-벤즈이미다졸
- <76> (A4) 레바미솔(Levamisol) = L-(-)-2,3,5,6-테트라하이드로-6-페닐이미다조[2,1b]티아졸
- <77> (A5) 메벤다졸(Mebendazole) = (5-벤조일-1H-벤즈이미다졸-2-일)카바민산 메틸에스테르
- <78> (A6) 옴팔로틴(Omphalotin) = WO 97/20857에 개시된 *Omphalotus olearius* 곰팡이의 대환식 발효산물
- <79> (A7) 아바멕틴(Abamectin) = 아버멕틴 B1
- <80> (A8) 이버멕틴(Ivermectin) = 22,23-디하이드로아버멕틴 B1
- <81> (A9) 모시텍틴(Moxidectin) = 5-0-데메틸-28-테옥시-25-(1,3-디메틸-1-부테닐)-6,28-에폭시-23-(메톡시이미노)-밀베마이신 B
- <82> (A10) 도라멕틴(Doramectin) = 25-사이클로헥실-5-0-데메틸-25-데(1-메틸프로필)-아버멕틴 A1a
- <83> (A11) 밀베멕틴(Milbemectin) = 밀베마이신 A3 및 밀베마이신 A4의 혼합물
- <84> (A12) 밀베마이신녹심(Milbemycinoxim) = 밀베마이신의 5-옥심
- <85> 적합한 리펠런트(repellent) 및 디태처(detacher)의 비제한적인 예는 :
- <86> (R1) DEET (N,N-디에틸-m-톨루아미드)
- <87> (R2) KBR 3023 N-부틸-2-옥시카보닐-(2-하이드록시)-피페리딘
- <88> (R3) 시미아졸(Cymiazole) = N-2,3-디하이드로-3-메틸-1,3-티아졸-2-일리텐-2,4-자일리텐
- <89> 혼합물중의 상기 파트너는 당 분야의 당업자에게는 매우 잘 알려져 있다. 대부분은 농약 매뉴얼의 다양한 판본에 개시되어 있고, The British Crop Protection Council, London, 및 Merck 인텍스의 각종 편집판(Merck & Co., Inc., Rahway, New Jersey, USA) 또는 특허 문헌에 개시되어 있다. 따라서, 하기 기재는 예로서 발견될 수 있는 소수의 곳에 제한된다.
- <90> (I) 2-메틸-2-(메틸티오)프로피온알데히드-0-메틸카바모일옥심(Aldicarb), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 26;
- <91> (II) S-(3,4-디하이드로-4-옥소벤조[d]-[1,2,3]-트리아진-3-일메틸)0,0-디메틸-포스포로디티오에이트(Azinphos-methyl), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 67;
- <92> (III) 에틸-N-[2,3-디하이드로-2,2-디메틸벤조푸란-7-일옥시카보닐-(메틸)아미노티오]-N-이소프로필-β-알라니네이트(Benfuracarb), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 96;
- <93> (IV) 2-메틸비페닐-3-일메틸-(Z)-(1RS)-시스-3-(2-클로로-3,3,3-트리플루오로프로프-1-에닐)-2,2-디메틸사이클로프로판카복실레이트(Bifenthrin), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 118;
- <94> (V) 2-tert-부틸이미노-3-이소프로필-5-페닐-1,3,5-티아다지안-4-온 (Buprofezin), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 157;
- <95> (VI) 2,3-디하이드로-2,2-디메틸벤조푸란-7-일-메틸카바메이트 (Carbofuran), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 186;
- <96> (VII) 2,3-디하이드로-2,2-디메틸벤조푸란-7-일-(디부틸아미노티오) 메틸카바메이트 (Carbosulfan), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 188;
- <97> (VIII) S,S'-(2-디메틸아미노트리메틸렌)-bis-(티오카바메이트) (Cartap), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 193;

- <98> (IX) 1-[3,5-디클로로-4-(3-클로로-5-트리플루오로메틸-2-피리딜옥시) 페닐]-3-(2,6-디플루오로-벤조일)-유레아 (Chlorfluazuron), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 213;
- <99> (X) 0,0-디에틸-0-3,5,6-트리클로로-2-피리딜-포스포로티오에이트 (Chlorpyrifos), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 235;
- <100> (XI) (RS)- α -시아노-4-플루오로-3-페녹시벤질-(1RS,3RS;1RS,3RS)-3-(2,2-디클로로비닐)-2,2-디-메틸사이클로 프로판카복실레이트 (Cyfluthrin), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 293;
- <101> (XII) (S)- α -시아노-3-페녹시벤질-(Z)-(1R,3R)-3-(2-클로로-3,3,3-트리플루오로프로페닐)-2,2-디메틸사이클로 프로판카복실레이트 및 (R)- α -시아노-3-페녹시벤질-(Z)-(1R,3R)-3-(2-클로로-3,3,3-트리플루오로프로페닐)-2,2-디메틸사이클로프로판카복실레이트의 혼합물 (Lambda-Cyhalothrin), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 300;
- <102> (XIII) (S)- α -시아노-3-페녹시벤질-(Z)-(1R,3R)-3-(2,2-디클로로비닐)-2,2-디메틸사이클로프로판카복실레이트 및 (R)- α -시아노-3-페녹시벤질(1S,3S)-3-(2,2-디클로로비닐)-2,2-디메틸사이클로프로판카복실레이트 (Alpha-cypermethrin)로 구성된 라세메이트, The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 308;
- <103> (XIV) (S)- α -시아노-3-페녹시벤질(1RS, 3RS,1RS,3RS)-3-(2,2-디클로로비닐)-2,2-디메틸사이클로프로판카복실 레이트의 입체이성질체의 혼합물 (zeta-Cypermethrin), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 314;
- <104> (XV) (S)- α -시아노-3-페녹시벤질-(1R,3R)-3-(2,2-디브로모비닐)-2,2-디메틸사이클로프로판카복실레이트 (Deltamethrin), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 344;
- <105> (XVI) (4-클로로페닐)-3-(2,6-디플루오로벤조일)유레아 (Diflubenzuron), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 395;
- <106> (XVII) (1,4,5,6,7,7-헥사클로로-8,9,10-트리노본-5-엔-2,3-일렌비스메틸렌)-설파이트 (Endosulfan), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 459;
- <107> (XVIII) α -에틸티오-o-톨릴-메틸카바메이트 (Ethiofencarb), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 479;
- <108> (XIX) 0,0-디메틸-0-4-니트로-m-톨릴-포스포로티오에이트 (Fenitrothion), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 514;
- <109> (XX) 2-sec-부틸페닐-메틸카바메이트 (Fenobucarb), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 516;
- <110> (XXI) (RS)- α -시아노-3-페녹시벤질-(RS)-2-(4-클로로페닐)-3-메틸부티레이트 (Fenvalerate), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 539;
- <111> (XXII) S-[포밀(메틸)카바모일메틸]-0,0-디메틸-포스포로디티오에이트 (Formothion), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 625;
- <112> (XXIII) 4-메틸티오-3,5-자일릴-메틸카바메이트 (Methiocarb), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 813;
- <113> (XXIV) 7-클로로비사이클로[3.2.0]헵타-2,6-디엔-6-일-디메틸포스페이트 (Heptenophos), The Pesticide

Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 670;

- <114> (XXV) 1-(6-클로로-3-피리딜메틸)-N-니트로이미다졸리딘-2-일리텐아민 (Imidacloprid), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 706;
- <115> (XXVI) 2-이소프로필페닐-메틸카바메이트 (Isoprocab), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 729;
- <116> (XXVII) 0,S-디메틸-포스포르아미도티오에이트 (Methamidophos), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 808;
- <117> (XXVIII) S-메틸-N-(메틸카바모일옥시)티오아세트이미데이트 (Methomyl), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 815;
- <118> (XXIX) 메틸-3-(디메톡시포스포노일옥시)부트-2-에노에이트 (Mevinphos), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 844;
- <119> (XXX) 0,0-디에틸-0-4-니트로페닐-포스포로티오에이트 (Parathion), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 926;
- <120> (XXXI) 0,0-디메틸-0-4-니트로페닐-포스포로티오에이트 (Parathion-메틸), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 928;
- <121> (XXXII) S-6-클로로-2,3-디하이드로-2-옥소-1,3-벤즈옥사졸-3-일메틸-0,0-디에틸-포스포르-디티오에이트 (Phosalone), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 963;
- <122> (XXXIII) 2-디메틸아미노-5,6-디메틸피리미딘-4-일-디메틸카바메이트 (Pirimicarb), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 985;
- <123> (XXXIV) 2-이소프로폭시페닐-메틸카바메이트 (Propoxur), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1036;
- <124> (XXXV) 1-(3,5-디클로로-2,4-디플루오로페닐)-3-(2,6-디플루오로벤조일) 유레아 (Teflubenzuron), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1158;
- <125> (XXXVI) S-tert-부틸티오메틸-0,0-디메틸-포스포로디티오에이트 (Terbufos), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1165;
- <126> (XXXVII) 에틸-(3-tert.-부틸-1-디메틸카바모일-1H-1,2,4-트리아졸-5-일-티오)-아세테이트, (Triazamate), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1224;
- <127> (XXXVIII) 아바멕틴(Abamectin), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 3;
- <128> (XXXIX) 2-sec-부틸페닐-메틸카바메이트 (Fenobucarb), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 516;
- <129> (XL) N-tert.-부틸-N'-(4-에틸벤조일)-3,5-디메틸벤조히드라자이드 (Tebufenozide), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1147;
- <130> (XLI) (±)-5-아미노-1-(2,6-디클로로-α, α, α-트리플루오로-p-톨릴)-4-트리플루오로메틸-설퍼닐피라졸-3-카보니트릴 (Fipronil), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 545;

- <131> (XLII) (RS)- α -시아노-4-플루오로-3-페녹시벤질(1RS,3RS:1RS,3RS)-3-(2,2-디클로로-비닐)-2,2-디메틸사이클로 프로판카복실레이트 (beta-Cyfluthrin), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 295;
- <132> (XLIII) (4-에톡시페닐)-[3-(4-플루오로-3-페녹시페닐)프로필](디메틸) 실란 (Silaflofen), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1105;
- <133> (XLIV) tert.-부틸 (E)- α -(1,3-디메틸-5-페녹시피라졸-4-일-메틸렌아미노-옥시)-p-톨루에이트 (Fenpyroximate), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 530;
- <134> (XLV) 2-tert.-부틸-5-(4-tert.-부틸벤질티오)-4-클로로피리다진-3(2H)-온 (Pyridaben), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1161;
- <135> (XLVI) 4-[[4-(1,1-디메틸페닐)페닐]에톡시]-퀴나졸린 (Fenazaquin), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 507;
- <136> (XLVII) 4-페녹시페닐-(RS)-2-(피리딜옥시)프로필-에테르(Pyriproxyfen), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1073 ;
- <137> (XLVIII) 5-클로로-N-{2-[4-(2-에톡시에틸)-2,3-디메틸페녹시]에틸}-6-에틸피리미딘-4-아민(Pyrimidifen), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1070;
- <138> (XLIX) (E)-N-(6-클로로-3-피리딜메틸)-N-에틸-N'-메틸-2-니트로비닐리덴디아민 (Nitenpyram), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 880;
- <139> (L) (E)-N¹-[(6-클로로-3-피리딜)메틸]-N²-시아노-N¹-메틸아세트아미딘 (N1-25, Acetamiprid), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 9;
- <140> (LI) 아버멕틴(Avermectin) B₁, The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 3;
- <141> (LII) 식물로부터의 곤충-활성 추출물, 특히 (2R,6aS,12aS)-1,2,6,6a, 12,12a-헥사하이드로-2-이소프로페닐-8,9-디메톡시-크로메노[3,4-b]푸로[2,3-h]크로멘-6-온 (Rotenone), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1097; 및 *Azadirachta indica*의 추출물, 특히 아자디라치 틴(azadirachtin), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 59; 및
- <142> (LIII) 곤충-활성 네마토드, 바람직하게는 *Heterorhabditis bacteriophora* 및 *Heterorhabditis megidis*를 포함 하는 제조물, The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 671; *Steinemema feltiae*, The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1115 및 *Steinemema scapterisci*, The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1116;
- <143> (LIV) *Bacillus subtilis*로부터 얻어질 수 있는 제조물, The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 72; 또는 GC91 또는 NCTC11821로부터 분리된 화합물을 제외하고 *Bacillus thuringiensis*주로부터의 제조물 ; The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 73;
- <144> (LV) 곤충 활성 곰팡이를 포함하는 제조물, 바람직하게는 *Verticillium lecanii*, The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1266; *Beauveria brogniartii*, The

Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 85 및 Beauveria bassina, The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 83;

<145> (LVI) 곤충활성 바이러스를 포함하는 제조물, 바람직하게는 *Neodipridon Sertifer* NPV, The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1342; Mamestra brassicae NPV, The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 759 및 *Cydia pomonella granulosus* virus, The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 291;

<146> (CLXXXI) 7-클로로-2,3,4a,5-테트라하이드로-2-[메톡시카보닐(4-트리플루오로메톡시페닐)-카바모일]인돌[1,2e] 옥자졸린-4a-카복실레이트(DPX-MP062, Indoxycarb), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 453;

<147> (CLXXXII) N-tert.-부틸-N'-(3,5-디메틸벤조일)-3-메톡시-2-메틸벤조히드라지드(RH2485, methoxyfenozide), The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, page 1094; 및

<148> (CLXXXIII) (N'-[4-메톡시-비페닐-3-일]-히드라진카복실산 이소프로필에스테르 (D 2341), Brighton Crop Protection Conference, 1996, 487-493;

(R2) Book of Abstracts, 212th ACS National Meeting Orlando, FL, August 25-29 (1996), AGRO-020. Publisher: American Chemical Society, Washington, D. C. CONEN: 63BFAF.

<149> 상기 설명의 결과로서, 본 발명의 추가적인 면은 온혈 동물에서 기생충의 구제를 위한 조합 제제에 관한 것으로, 이들은 화학식 1의 화합물에 추가적으로 적어도 하나의 같거나 다른 범위의 활성을 갖는 추가적 활성성 분 및 적어도 하나의 생리적으로 허용되는 담체를 포함하는 것을 특징으로 한다. 본 발명은 2배 조합으로 제한되지 않는다.

<150> 규칙으로서, 상기 본 발명에 따른 구충제 조성물은 0.1 내지 99 중량%, 특히 0.1 내지 95 중량%의 화학식 I, Ia 또는 그의 혼합물의 활성 성분, 99.9 내지 1 중량%, 특히 99.8 내지 5 중량%의 고체 또는 액체 혼합물을 포함하고, 0 내지 25 중량%, 특히 0.1 내지 25 중량%의 계면활성제를 포함한다.

<151> 본 발명에 따른 조성물의 치료될 동물에의 적용은 국소적, 경구, 비경구 또는 피하일 수 있고, 조성물은 액제, 에멀전제, 현탁제(드렌치스), 분말제, 정제, 환제, 캡슐제 및 푸어온 제제의 형태로 존재할 수 있다.

<152> 푸어온(pour-on) 또는 스팟온(spot-on) 방법은 화학식 I의 화합물을 피부 또는 피막의 특정 부위, 바람직하게는 동물의 목 또는 등에 적용하는 것으로 구성된다. 이것은 상대적으로 적은 피막의 부위에 푸어온 또는 스팟온 제제를 칠하거나 분무하여 적용할 수 있고, 여기서 활성물질은 조성물내의 성분의 퍼지는 성질 및 동물의 운동에 의한 도움에 의해 자연적으로 넓은 범위에 걸쳐 분산된다.

<153> 푸어온 또는 스팟온 제제는 바람직하게는 피부 표면 또는 숙주 동물의 피막상에 빠른 분산을 촉진하기 위한 담체를 포함하고 일반적으로 확산 오일이라 한다. 적합한 담체는 예컨대 오일성 용액; 알콜성 및 이소프로판올성 용액 예컨대, 2-옥틸도데카놀 또는 올레일 알콜의 용액; 모노카복시산의 에스테르내의 용액, 예컨대, 이소프로필 미리스테이트, 이소프로필 팔미테이트, 라우르산 옥살레이트, 올레산 올레일 에스테르, 올레산 데실 에스테르, 헥실 라우레이트, 올레일 올레에이트, 데실 올레에이트, C₁₂-C₁₈의 포화 지방 알콜의 카프릭산 에스테르; 디카복실산의 에스테르의 용액, 예컨대, 디부틸 프탈레이트, 디이소프로필 이소프탈레이트, 아디프산 디이소프로필 에스테르, 디-n-부틸 아디페이트 또는 지방족산의 에스테르의 용액, 예컨대 글리콜이다. 바람직하게는 분산제가 추가적으로 존재할 수 있고, 예컨대, 약제 산업 또는 화장품 산업에서의 공지의 물질이다. 이들의 예는 2-(N-알킬)피롤리돈, 아세톤, 폴리에틸렌 글리콜 및 그의 에테르 및 에스테르, 프로필렌 글리콜 또는 합성 트리글리세라이드이다.

<154> 오일성 용액은 예컨대 식물성 오일 예컨대, 올리브 오일, 땅콩유, 참기름, 송유, 아마인유 또는 피마자유이다. 식물 오일은 또한 에폭사이드화 형태로 존재할 수 있다. 파라핀 및 실리콘 오일 또한 사용할 수 있다.

<155> 푸어온 또는 스팟온 제제는 일반적으로 1 내지 20 중량%의 화학식 1의 화합물, 0.1 내지 50 중량%의 분산제 및

45 내지 98.9 중량%의 용매를 포함한다.

- <156> 푸어온 또는 스팟온 방법은 특히 모든 동물을 치료하기 위해 경구 또는 주사가 어렵거나 시간이 걸리는 소, 말, 양 또는 돼지와 같은 무리 동물에 사용하는 것이 바람직하다. 이 방법의 단순함때문에, 이 방법은 물론 모든 다른 동물, 가축동물 또는 애완동물에 사용할 수 있고, 동물의 돌보는 사람에게 특히 선호되며, 수의사의 존재 없이 때때로 수행할 수 있다.
- <157> 상업적인 생산품의 제형화하기 위해 농축물이 선호되며, 최종 사용자는 일반적으로 희석 제제로 사용할 것이다.
- <158> 이와 같은 조성물은 특정 효과를 달성하기 위해 또한 추가적으로 첨가제, 예컨대, 안정화제, 항거품제, 점도 조절제, 결합제 또는 활택제 뿐만 아니라 다른 활성 성분을 포함할 수 있다.
- <159> 최종 사용자에 의해 사용되는 이러한 형태의 구충제 조성물은 본 발명의 성분과 유사하게 형성된다.
- <160> 해충을 구제하기 위한 본 발명에 따른 방법의 각각에서 또는 본 발명에 따른 해충 구제 조성물의 각각에서, 화학식 I의 활성 성분은 그의 모든 입체 배위 또는 그의 혼합물을 사용할 수 있다.
- <161> 본 발명은 또한 온혈 동물, 특히 다산 가축류, 가축동물 및 애완동물을 기생성 윤충에 대해 예방적으로 보호하는 방법을 포함하며, 화학식 I의 활성 성분 또는 이들로부터 제조된 활성 성분 제제는 먹이 또는 음료에 액체 또는 고체의 형태로 첨가하여 동물에 투여하거나, 경구 또는 비경구에 의해 투여한다. 본 발명은 또한 상기 방법의 하나에서 사용하기 위한 본 발명에 따른 화학식 I의 화합물을 포함한다.
- <162> 하기의 실시예 단지 본 발명을 제한 없이 설명하는 것으로, 용어 활성 성분 은 표 1 내지 3에 기재된 물질로 나타난다.

<163> 특히, 바람직한 제제를 하기와 같이 제조한다: (% = 중량%)

<164> 제제 실시예

<165> 1. 과립	a)	b)
<166> 표 1 및 2로부터의 활성 성분	5 %	10 %
<167> 카올린	94%	-
<168> 고 분산된 실릭산(silicic acid)	1%	-
<169> 아타풀가이트(attapulgate)	-	90 %

<170> 상기 활성 성분을 메틸렌 클로라이드에 용해하고, 담체상에서 스프레이하고 용매를 감압하에 증발에 의해 용매를 계속하여 농축하였다. 이같은 과립은 동물 먹이에 섞을 수 있다.

<171> 2. 과립

<172> 표 1 및 2로부터의 활성 성분	3 %
<173> 폴리에틸렌 글리콜(mw 200)	3 %
<174> 카올린	94 %
<175> (mw =분자량)	

<176> 미세하게 같은 활성 성분을 폴리에틸렌 글리콜과 함께 축축하게 한 카올린에 혼합기에서 고르게 적용하였다. 이와 같은 방법으로 먼지 없는 코팅된 과립을 얻었다.

<177> 3. 정제 또는 환(boli)

<178> I	
<179> 표 1 및 2로부터의 활성 성분	33.00 %
<180> 메틸셀룰로스	0.80 %
<181> 고분산된 실릭산	0.80 %

<182>	옥수수 전분	8.40 %
<183>	II	
<184>	결정성 락토오즈	22.50 %
<185>	옥수수 전분	17.00 %
<186>	미세결정성 셀룰로스	16.50 %
<187>	마그네슘 스테아레이트	1.00 %
<188>	I. 메틸 셀룰로스를 물에 교반하였다. 물질이 부푼 후에, 실리산을 교반하고, 혼합물을 균질하게 현탁화하였다. 활성 성분 및 옥수수 전분을 혼합하였다. 수성 현탁액을 상기 혼합물에 적용하고, 반죽덩어리로 반죽하였다. 생성된 덩어리를 12 M 체를 통해 과립화하고 건조하였다.	
<189>	II. 모든 4개의 부형제를 완전히 혼합하였다.	
<190>	III. I과 II에 따라 얻어진 예비 혼합물을 혼합하고, 정제 또는 환으로 압축하였다.	
<191>	<u>4. 주사제</u>	
<192>	A. <u>오일성 비히클 (서방)</u>	
<193>	1. 표 1 및 2로부터의 활성 성분	0.1-1.0 g
<194>	땅콩유	100 ml까지
<195>	2. 표 1 및 2로부터의 활성 성분	0.1-1.0 g
<196>	참깨유	100 ml까지
<197>	제조: 활성 성분을 교반하면서 일부의 오일에 용해하고, 만일 필요하다면, 약간 가열하고, 그후 냉각 후에 원하는 부피로 만들고, 0.22 mm의 구멍크기를 갖는 적합한 막 필터를 통해 멸균-여과하였다.	
<198>	B. <u>수-미셀성 용매 (평균 유리 속도)</u>	
<199>	표 1 및 2로부터의 활성 성분	0.1-1.0 g
<200>	4-하이드록시메틸-1,3-디옥솔란 (글리세롤 포말)	40 g
<201>	1,2-프로판디올	100 ml 까지
<202>	표 1로부터의 활성 성분	0.1-1.0 g
<203>	글리세롤 디메틸 케탈	40 g
<204>	1,2-프로판디올	100 ml 까지
<205>	제조: 활성 성분을 교반하면서 일부의 오일에 용해하고, 원하는 부피로 만들고, 0.22 mm의 구멍크기를 갖는 적합한 막 필터를 통해 멸균-여과하였다.	
<206>	C. <u>수성 솔루빌리제이트(solubilisate) (빠른 방출성)</u>	
<207>	1. 표 1 및 2로부터의 활성 성분	0.1-1.0 g
<208>	폴리에톡시화 피마자유 (40 에틸렌 옥사이드 유니트)	10 g
<209>	1,2-프로판디올	20 g
<210>	벤질 알콜	1 g
<211>	주사용수	100 ml 까지
<212>	2. 표 1 및 2로부터의 활성 성분	0.1-1.0 g
<213>	폴리에톡시화 소비탄 모노올레에이트	8 g
<214>	(20 에틸렌 옥사이드 유니트)	

- <215> 4-하이드록시메틸-1,3-디옥솔란 (글리세롤 포말) 20 g
- <216> 주사용수 100 ml 까지
- <217> 제조: 활성 성분을 용매와 계면활성제에 용해하고, 물로 원하는 부피로 만들었다. 0.22 mm의 구멍크기를 갖는 적합한 막 필터를 통해 멸균-여과하였다.
- <218> 5. 푸어온제
- <219> A.
- <220> 표 1 및 2로부터의 활성 성분 5 g
- <221> 이소프로필 미리스테이트 10 g
- <222> 이소프로판올 100 ml 까지
- <223> B
- <224> 표 1 및 2로부터의 활성 성분 2 g
- <225> 헥실 라우레이트 5 g
- <226> 매질-체인화된 트리글리세라이드 15 g
- <227> 에탄올 100 ml 까지
- <228> C.
- <229> 표 1 및 2로부터의 활성 성분 2 g
- <230> 올레일 올레에이트 5 g
- <231> N-메틸피롤리돈 40 g
- <232> 이소프로판올 100 ml 까지
- <233> 수성 시스템은 또한 바람직하게는 경구 및/또는 루민내(intraruminal) 적용을 할 수 있다.
- <234> 상기 조성물은 또한 추가적으로 첨가제를 포함할 수 있고, 예컨대, 안정화제, 예컨대 적합하게 에폭시화된 식물 오일(에폭시화된 코코넛 오일, 평지씨 오일, 또는 대두유) ; 향거품제, 예컨대 실리콘 오일, 보전제, 점성 조절제, 결합제, 및 점착 부여제, 뿐만 아니라 퍼틸라이저(fertiliser) 또는 특정 효과를 달성하기 위한 다른 활성 성분을 포함할 수 있다.
- <235> 또한 화학식 I의 화합물에 대해 증성이고 치료될 숙주 동물에 전해 해가 없는 생물학적 활성 물질 또는 첨가제 뿐만 아니라 미네랄 염 또는 비타민을 상기 조성물에 첨가할 수 있다.
- <236> 생물학적 실시예 :
- <237> 1. 경구 적용을 사용하여 몽고 게르빌루스 쥐(*Meriones unguiculatus*)에 대한 트리코스트롱지리스 콜루브리포미스(*Trichostrongylus colubriiformis*) 및 해몬추스 콘토투스(*Haemonchus contortus*) 에 대한 인비보 테스트
- <238> 6 내지 8주령의 몽고 게르빌루스 쥐를 T. 콜루브리포미스 및 H. 콘토투스의 각각의 2000마리의 제3령 유충으로 인공적으로 감염시켰다. 감염후 6일후에, 게르빌루스 쥐를 N₂O로 가볍게 마취하고, 2부의 DMSO 및 1부의 폴리에틸렌 글리콜(PEG 300)의 혼합물에 용해한 시험 화합물을 100, 32 및 10-0.1 mg/kg의 양으로 경구적으로 투여하였다. 9일 (치료후 3일)에, 계속 존재하는 대부분의 H. 콘토투스가 낮은 제4령 유충이고, 대부분의 T. 콜루브리포미스가 미성숙 성체일 때, 게르빌루스 쥐를 해충을 계수하기 위해 치사하였다. 효과를 8마리의 감염되고 비처리된 게르빌루스 쥐로부터의 해충의 수의 기하적 평균과 비교하여, 각각의 게르빌루스 쥐에서 해충의 수의 %감소로서 계산하였다. 상기 테스트에서, 선충 감염의 큰 감소가 화학식 I의 화합물을 사용하여 얻어졌다.