

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(51) Int. Cl. ⁶ A01N 47/02 A01N 43/56	(45) 공고일자 (11) 등록번호 (24) 등록일자	2004년04월30일 10-0417883 2004년01월28일
(21) 출원번호 (22) 출원일자 번역문제출일자 (86) 국제출원번호 (86) 국제출원일자 (81) 지정국	10-1997-0706973 1997년10월02일 1997년10월02일 PCT/EP1996/001335 1996년03월27일 국내특허 : 아일랜드 알바니아 오스트레일리아 바베이도스 불가리아 브라질 캐나다 중국 체코 에스토니아 그루지야 헝가리 아이슬란드 일본 대한민국 스리랑카 라이베리아 리투아니아 라트비아 마다가스카르 마케도니아 몽고 멕시코 노르웨이 뉴질랜드 슬로베니아 AP ARIPO특허 : 케냐 레소토 말라위 수단 스와질랜드 EA 유라시아특허 : 아르메니아 몰도바 EP 유럽특허 : 오스트리아 벨기에 스위스 독일 덴마크 스페인 프랑스 영국 그리스 이탈리아 룩셈부르크 모나코 네덜란드 포르투갈 스웨덴	(65) 공개번호 (43) 공개일자 (87) 국제공개번호 (87) 국제공개일자
(30) 우선권 주장	9507073.6 1995년04월05일 영국(GB)	
(73) 특허권자	통-빨랑 아그리컬처 리미티드	
(72) 발명자	영국 씨엠5 오에이취더블유 에섹스 온가 피필드 로드 트윈 데이비드	
(74) 대리인	영국 씨엠5 오에이취더블유 에섹스 온가 피필드 로오드리서치 스테이션 오브 통빨랑 아그리컬처 특허법인코리아나	

심사관 : 신동환

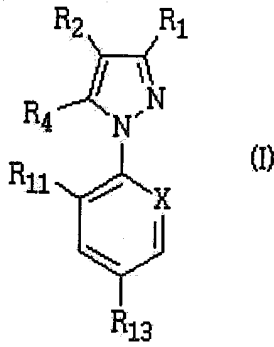
(54) 새로운곤충억제방법

명세서

발명의 상세한 설명

- <1> 본 발명은 공중 보건과 관련된 장소에서, 즉 사람들이 빈번하게 출입하는 개인용 또는 공공 장소에서 바퀴벌레 또는 개미와 같은 곤충을 억제하는 새로운 방법에 관한 것이다.
- <2> 많은 살충 활성 화합물들이 공지되어 있는데, 예를 들면 국제 특허 공보 WO 87/03781, WO 93/06089 및 WO 94/21606호 뿐만 아니라 유럽 특허 공보 제 0295117, 0403300, 0385809, 및 0679650호, 독일 특허 공보 제 19511269 호 및 미합중국 특허 5,232,940 및 5,236,938호에 기술된 살충성 피라졸이 있다. 이러한 화합물을 바퀴벌레 또는 개미를 죽이기 위해 사용하는 것은 이미 의도되어 왔지만, 이러한 사용은 곤충이 먹을 것으로 예상되는 미끼 또는 섭취물질 또는 음식과 필수적으로 관련되거나, 또는 전술한 곤충에 대한 직접 접촉 적용에 관련되어 있다.
- <3> 미끼의 사용은 그 미끼를 바퀴벌레가 올 것으로 예상되는 적절한 장소에 위치시켜야 할 필요성이 있기 때문에 문제점이 있다. 게다가 미끼는 어린이에게 안전상 위험이 될 수 있으므로, 바라지 않는 상황이 될 수 있다.
- <4> 본 발명의 목적은 미끼 또는 섭취물질의 사용을 피하면서 바퀴벌레 또는 개미를 억제하는 방법을 제공하는 것이다.
- <5> 본 발명의 목적은 예를 들어 미끼를 사용하는 것처럼 활성물질을 곤충 자체에 대해 직접 적용하는 것을 피하면서 바퀴벌레 또는 개미를 억제하는 방법을 제공하는 것이다.
- <6> 본 발명의 목적은 바퀴벌레 또는 개미를 억제하는 간단하고 효과적인 방법을 제공하는 것이다.
- <7> 따라서, 본 발명은 바퀴벌레 또는 개미, 바람직하게는 바퀴벌레, 또는 바퀴벌레의 개체수를 억제하는 방법에 관련되는데, 여기서 1-페닐피라졸 유도체인 활성성분의 유효량을 곤충이 접촉 또는 활동하게 되거나 또는 활동 중이거나 활동할 것으로 기대되는 표면에 도포한다.
- <8> 본 발명에서 사용될 수 있는 1-페닐피라졸 유도체는 하기 화학식 (1)의 화합물이다:

<9> [화학식 1]



<11> 상기식에서:

<12> R_1 은 CN 또는 메틸일 수 있으며;

<13> R_2 는 $S(O)_nR_3$ 일 수 있으며;

<14> R_3 는 알킬 또는 할로알킬일 수 있으며;

<15> R_4 는 수소 또는 할로겐 원자이거나; 또는 NR_5R_6 , $S(O)_mR_7$, 또는 $C(O)O-R_7$, 알킬, 할로알킬 또는 OR_8 라디칼이거나; 또는 $-H=C(R_9)(R_{10})$ 라디칼을 나타내며;

<16> R_5 및 R_6 은 독립적으로 수소원자 또는 알킬, 할로알킬, $C(O)$ 알킬 또는 $S(O)_rCF_3$ 라디칼일 수 있거나; 또는 R_5 및 R_6 은 함께 산소 또는 황과 같은 2가 헤테로원자 하나 이상이 포함될 수도 있는 2가 알킬렌 라디칼을 형성할 수도 있고;

<17> R_7 은 알킬 또는 할로알킬 라디칼일 수 있으며;

<18> R_8 은 알킬 또는 할로알킬 라디칼이거나, 또는 수소원자일 수 있으며;

<19> R_9 는 수소원자 또는 알킬 라디칼일 수 있으며;

<20> R_{10} 은 하나 이상의 할로겐 원자 또는 OH, -O-알킬, -S-알킬, 시아노, 또는 알킬과 같은 기로 치환될 수 있는 페닐 또는 헤테로아릴기일 수 있고;

<21> R_{11} 및 R_{12} 는 독립적으로 수소 또는 할로겐 원자를 나타내며;

<22> R_{13} 은 할로겐 원자 또는 할로알킬, 할로알콕시, $S(O)_qCF_3$ 또는 SF_5 기를 나타내며;

<23> m, n, q, r 은 독립적으로 0, 1 또는 2의 정수일 수 있으며;

<24> X는 3가 질소원자 또는 $C-R_{12}$ (여기서, 탄소원자의 나머지 3개의 자유 결합은 방향족 고리의 일부임) 라디칼을 나타내며;

<25> 단, R_1 이 메틸이면, R_3 은 할로알킬이고, R_4 는 NH_2 이고, R_{11} 은 Cl이고, R_{13} 은 CF_3 이고, 그리고 X는 N이다.

<26> 화학식 (1)의 알킬 또는 아실기는 바람직하게는 저급 알킬 또는 아실로서, 즉 탄소원자수 1 내지 4를 갖는 라디칼이다.

<27> 화학식 (1)의 화합물 중에서 바람직한 부류는 식중에서 R_1 은 CN이고, 및/또는 R_3 은 할로알킬이고, 및/또는 R_4 는 NH_2 이고, 및/또는 R_{11} 및 R_{12} 는 독립적으로 할로겐 원자이고, 및 R_{13} 은 할로알킬인 화학식 (1)의 화합물들이다.

<28> 본 발명에서 사용할 수 있는 더욱 바람직한 활성 성분은 식중에서 R_{11} 및 R_{12} 가 염소이고; R_3 및 R_{13} 이 트리플루오로메틸이고; R_5 가 아미노인 화학식 (1)의 화합물이다.

<29> 이와 같은 가장 바람직한 살충제는 5-아미노-3-시아노-1-(2,6-디클로로-4-트리플루오로메틸)페닐-4-트리플루오로메틸술폰피라졸 (이후, 화합물 A로 칭함), 5-아미노-3-시아노-1-(2,6-디클로로-4-트리플루오로메틸)페닐-4-트리플루오로메틸티오피라졸 (이후, 화합물 B로 칭함), 5-아미노-3-시아노-1-(2,6-디클로로-4-트리플루오로메틸)페닐-4-트리플루오로메틸술폰피라졸 (이후, 화합물 C로 칭함)이다.

<30> 본 발명에 있어서, 활성 성분은 박막 형태 또는 박막 내에 끼워넣어진 형태로 있다는 것과, 이 막을 곤충이 접촉하게 되거나 활동하고 있거나 돌아다니거나 돌아다니는 종이거나 또는 돌아다닐 것으로 기대 또는 예상되는 장소의 표면을 전체적으로 또는 부분적으로 덮게 된다는 것을 이해해야 한다. 상기 박막으로 인하여, 곤충은 화학식 (1)의 성분을 함유하는 임의 용량의 조성물을 붙잡거나 물거나 또는 직접 먹을 수는 없다.

<31> 본 발명의 또다른 양상에 따라서, 붙잡을 수 없는, 그러나 살충에 유효한, 활성성분의 양을 처리할 지역에 위치한 표면 상에 놓이게 함으로써, 공공 또는 개인용 건물 또는 빌딩 또는 집 또는 가정에서

돌아다니거나 이동할 수 있는 바퀴벌레 또는 개미의 개체수를 억제하는 방법이 제공된다.

- <32> 본 발명의 또다른 양상에 따라서, 바퀴벌레 또는 개미가 돌아다닐 것으로 예상되는 표면에 박막이 덮여 있는 것으로써, 공공 또는 개인용 건물 또는 빌딩 또는 집 또는 가정에서 돌아다니거나 이동할 수 있는 바퀴벌레 또는 개미의 개체수를 억제하는 방법이 제공된다.
- <33> 본 발명의 또다른 양상에 따라서, 바퀴벌레 또는 개미를 이들이 살충될 지역 내에 또는 가까이에 있는 표면을 덮고 있는 박막 위를 돌아다니게 되는 것으로써, 공공 또는 개인용 건물 또는 빌딩 또는 집 또는 가정에서 돌아다니거나 이동할 수 있는 바퀴벌레 또는 개미의 개체수를 억제하는 방법이 제공된다.
- <34> 바람직하고 가장 효과적인 구현에 따르면, 본 발명은 특별하게는 바퀴벌레에게 적용된다.
- <35> 본 발명의 방법은, 활성 성분들을, 바람직하게는 액형 제형물로 적절한 표면에 분무하여 적용하는 것이 매우 용이하기 때문에 특히 유리하다.
- <36> 본 발명에 따라 처리되는 표면은 평탄할 수도 있고 거칠 수도 있고 또는 울퉁불퉁할 수도 있다. 평탄한 표면이 더욱 효과적이다. 여러 가지 종류의 표면, 예를 들면 유리, 세라믹, 콘크리트; 비닐 플라스틱, 멜라민, 니블레움과 같은 플라스틱 표면; 가구와 같은 금속제 또는 목재 표면; 의복과 같은 직물에 사용할 수도 있다.
- <37> 본 발명에 따른 활성 성분의 증착 표면은 적용 직후에 적셔질 수도 있고, 또는 얼마 후에 건조될 수도 있거나 건조한 것일 수도 있다. 이러한 막의 생성은 모든 공지 도포 방법에 의하여, 예를 들면 도장 분무, 페인트, 침지액 (dip), 세척액, 침액 (soak), 래커, 포말, 분진, 분말, 수성 현탁액, 페이스트, 크림, 습윤 분말, 에어로졸, 유화성 농축물, 농축 현탁액, 유동성 현탁액, 수성 현탁액, 오일 현탁액, 오일 용액, 가압 팩, 또는 당업계 기술인들에게 공지인 다른 표준 제형물로서 만들어질 수도 있다.
- <38> 화학식 (1)의 활성성분을 포함하는 조성물, 특히 액형 조성물은 상기 언급된 선행 기술에서 이미 기술되어 있다.
- <39> 소위 미국 바퀴벌레 (페리플라네타 아메리카나 (*Periplaneta americana*)) 뿐만 아니라 독일 바퀴벌레 (블라텔라 게르마니카 (*Blattella germanica*))와 같은 다른 바퀴벌레의 억제를 위하여, 공공 건물 또는 빌딩에서의 공중 보건의 관점에서 바퀴벌레의 처리는 본 발명의 바람직한 특색이다.
- <40> 따라서 본 발명은 바퀴벌레 또는 개미가 접촉하거나 접촉하게 될 표면에 화학식 (1)의 화합물을 적용하는 것을 포함하는 바퀴벌레 또는 개미의 억제 방법을 제공한다. 화합물은 바람직하게는 박막으로서 적용된다.
- <41> 화학식 (1)의 화합물의 제조는 상기 언급된 특허 출원에 기술된 임의의 방법, 또는 화학 합성 분야의 기술인의 지식에 따른 다른 공정에 따라서 수행될 수도 있다.
- <42> 본 발명에서 사용될 수도 있는 유효 조성물은 다른 양으로 제공되거나 또는 존재할 수도 있다. 대개로는, 화학식 (1)의 화합물을 100 평방 미터 당 0.0001 g 내지 20 g, 바람직하게는 0.01 g 내지 10 g/100 m²의 양으로 포함하는 활성 조성물을 제공하는 것이 유리하다.
- <43> 본 발명에서 유용한 (그리고 바퀴벌레 또는 개미를 억제하기 위해 표면에 살포되는) 조성물은 일반적으로 0.0001 내지 15% w/w, 바람직하게는 0.1 내지 6% w/w의 활성 성분을 포함한다. 그들은 적용 전에는 액체의 형태로, 특별하게는 유화성 농축물, 수성 유제, 농축 현탁액 또는 유동성 현탁액의 형태로 있을 수도 있다. 그러나 액체의 건조 후에는 박막의 형태로 있다.
- <44> 살충 조성물은 또한 모든 종류의 상용성 표면 활성제 및/또는 운반체를 함유할 수도 있다. 보조제를 또한 사용할 수도 있는데, 예를 들면 점착제, 염료 또는 필름형성제 등이다. 운반체 그 자체는 고형 또는 액형일 수도 있다.
- <45> 화학식 (1)의 화합물은 연속적으로 또는 혼합물로서, 특히 다른 구충제(pesticide), 예를 들면 살충제, 살비제 또는 살균제들과의 혼합물로서 사용될 수도 있다.
- <46> 조성물은 구성 성분들을 혼합함으로써 제조될 수도 있다.

실시예

- <47> 본 발명은 하기 실시예에 의하여 묘사되며, 이들은 본 발명을 제한하거나 한정하는 것으로 고려되어서는 안된다.
- <48> 실시예 1
- <49> 화합물 A 및 B를 아세톤/물 혼합물에 용해시키고 유리 위에 증착시키고 하룻밤 방치하여 건조시켰다. 하기 결과들을 관찰하였다:

화합물	투여량 수준 mg/100m ²	바퀴벌레 투입	
		90분 후의 사충률%	18시간 후의 사충률%
B	125	100	100
B	31	100	100
B	10	0	91
A	125	100	100
A	31	100	100
A	10	5	100

<51> 실시예 2

<52> 화합물 A를 12.5 g/l 액형 제제로서 다음 3가지 조성물로 제형화하였다: (i) 유화성 농축물 (EC-습윤제 및 유기 용매); (ii) 수성 유제 (EW-습윤제 더하기 물 더하기 유기 용매); 및 (iii) 농축 현탁액 (SC-분산제 및 물). 각각의 제형물을 물에 용해시키고 페인트된 시멘트 및 플라스틱 바닥의 시료 위에 증착시켜(참고 문헌: Méthode C.E.B. 제 159번, 제11장 섹션 1, "Methode d'essai d'efficacite pratique de specialites insecticides destinees a la destruction des blattes dans les locaux Novembre 1992", paragraph 2.6.), 125 mg/100m², 500 mg/100m², 및 1250 mg/100m²의 증착물을 제공하였다. 2 내지 15일령 블라텔라 게르마니카 (독일 바퀴벌레)를 그 표면 위에 4시간 동안 있게 한 후 옮겨서, 비처리된 단지 (jar)에 넣고 노출 시작부터 96시간 후에 관찰하였다. 각각의 처리법을 3 회 반복하였다. 하기의 결과들을 관찰하였다. 사충률을 생존 개체 중의 치사 곤충의 백분율로서 기록하였다.

제형/투여량	플라스틱 상의		시멘트 상의	
	사충률 %		사충률 %	
EC/ 125 mg/100m ²	10.2		100	
EC/ 500 mg/100m ²	100		100	
EC/ 1250 mg/100m ²	100		100	
EW/ 125 mg/100m ²	93.3		100	
EW/ 500 mg/100m ²	88		95.7	
EW/ 1250 mg/100m ²	100		100	
SC/ 125 mg/100m ²	93.3		100	
SC/ 500 mg/100m ²	67.7		100	
SC/ 1250 mg/100m ²	100		100	

<54> 실시예 3

<55> 실시예 2의 플라스틱 바닥 및 시멘트의 시료를 25°C에서 어둠 속에 24시간동안 방치하였다. 실시예 2의 처리 및 관찰을 반복하였다. 하기 결과를 관찰하였다:

제형/투여량	플라스틱 상의	시멘트 상의
	사충률 %	사충률 %
EC/ 125 mg/100m ²	14	100
EC/ 500 mg/100m ²	100	100
EC/ 1250 mg/100m ²	100	100
EW/ 125 mg/100m ²	49	100
EW/ 500 mg/100m ²	74	100
EW/ 1250 mg/100m ²	100	100
SC/ 125 mg/100m ²	43	100
SC/ 500 mg/100m ²	100	100
SC/ 1250 mg/100m ²	100	100

<57> 실시예 4

<58> 실시예 2의 플라스틱 바닥 및 시멘트의 시료를 25℃에서 어둠 속에 14일 동안 방치하였다. 실시예 2의 처리 및 관찰을 반복하였다. 하기 결과를 관찰하였다:

제형/투여량	플라스틱 상의	시멘트 상의
	사충률 %	사충률 %
EC/ 125 mg/100m ²	13.6	100
EC/ 500 mg/100m ²	100	100
EC/ 1250 mg/100m ²	100	100
EW/ 125 mg/100m ²	37.7	100
EW/ 500 mg/100m ²	77.7	100
EW/ 1250 mg/100m ²	100	100
SC/ 125 mg/100m ²	44.3	100
SC/ 500 mg/100m ²	100	100
SC/ 1250 mg/100m ²	100	100

<60> 실시예 5

<61> 실시예 2의 플라스틱 바닥 및 시멘트의 시료를 25℃에서 어둠 속에 30일 동안 방치하였다. 실시예 2의 처리 및 관찰을 반복하였다. 하기 결과를 관찰하였다:

제형/투여량	플라스틱 상의	시멘트 상의
	사충률 %	사충률 %
EC/ 125 mg/100m ²	6.7	72.3
EC/ 500 mg/100m ²	100	100
EC/ 1250 mg/100m ²	100	100
EW/ 125 mg/100m ²	53.3	100
EW/ 500 mg/100m ²	82.3	100
EW/ 1250 mg/100m ²	100	100
SC/ 125 mg/100m ²	51	100
SC/ 500 mg/100m ²	100	100
SC/ 1250 mg/100m ²	100	100

<63> 실시예 6

<64> 실시예 2의 플라스틱 바닥 및 시멘트의 시료를 25℃에서 어둠 속에 90일 동안 방치하였다. 실시예 2의 처리 및 관찰을 반복하였다. 하기 결과를 관찰하였다:

제형/투여량	플라스틱 상의	시멘트 상의
	사충률 %	사충률 %
EC/ 125 mg/100m ²	8.9	24.3
EC/ 500 mg/100m ²	95.7	100
EC/ 1250 mg/100m ²	100	100
EW/ 125 mg/100m ²	69	100
EW/ 500 mg/100m ²	95.7	100
EW/ 1250 mg/100m ²	100	100
SC/ 125 mg/100m ²	84.3	100
SC/ 500 mg/100m ²	100	100
SC/ 1250 mg/100m ²	100	100

<66> 실시예 7

<67> 실시예 2의 플라스틱 바닥 및 시멘트의 시료를 25℃에서 어둠 속에 120일동안 방치하였다. 실시예 2의 처리 및 관찰을 반복하였다. 하기 결과를 관찰하였다:

제형/투여량	플라스틱 상의	시멘트 상의
	사충률 %	사충률 %
EC/ 125 mg/100m ²	4.3	8.8
EC/ 500 mg/100m ²	95.7	97.7
EC/ 1250 mg/100m ²	100	100
EW/ 125 mg/100m ²	69	100
EW/ 500 mg/100m ²	88.7	100
EW/ 1250 mg/100m ²	100	100
SC/ 125 mg/100m ²	86.7	100
SC/ 500 mg/100m ²	100	100
SC/ 1250 mg/100m ²	100	100

<69> 실시예 8

<70> 실시예 2의 플라스틱 바닥 및 시멘트의 시료를 25℃에서 어둠 속에 180일동안 방치하였다. 실시예 2의 처리 및 관찰을 반복하였다. 하기 결과를 관찰하였다:

제형/투여량	플라스틱 상의	시멘트 상의
	사충률 %	사충률 %
EC/ 125 mg/100m ²	0	0
EC/ 500 mg/100m ²	100	100
EC/ 1250 mg/100m ²	100	100
EW/ 125 mg/100m ²	60	100
EW/ 500 mg/100m ²	93.3	100
EW/ 1250 mg/100m ²	100	100
SC/ 125 mg/100m ²	24.4	75.5
SC/ 500 mg/100m ²	100	100
SC/ 1250 mg/100m ²	100	100

<72> 실시예 9

<73> 다공성 콘크리트를 화합물 B의 20 ppm 용액 아세톤/물 용액으로 함침시키고 바퀴벌레 (블라델라 게르마니카)를 그 표면 위를 돌아다니게 하였다. 처리 하루 후에, 곤충들을 관찰하였다. 곤충들의 50%가 죽었다.

(57) 청구의 범위

청구항 1

1-페닐피라졸린 활성 성분을 곤충이 활동 중이거나 활동할 것으로 기대되는 표면에 100 평방 미터 당 0.01 g 내지 10 g 의 양으로 적용하여, 바퀴벌레 또는 개미를 억제하거나 또는 바퀴벌레 또는 개미의 개체수를 억제하는 방법으로서, 상기 활성 성분은 건조 박막 형태 또는 건조 박막에 끼워넣어진 형태로 있으며, 이를 곤충이 붙잡거나 물거나 또는 직접 먹을 수는 없으며, 상기 1-페닐피라졸 유도체는 5-아미노-3-시아노-1-(2,6-디클로로-4-트리플루오로메틸)페닐-4-트리플루오로메틸술폰피라졸, 5-아미노-3-시아노-1-(2,6-디클로로-4-트리플루오로메틸)페닐-4-트리플루오로메틸티오피라졸 또는 5-아미노-3-시아노-1-(2,6-디클로로-4-트리플루오로메틸)페닐-4-트리플루오로메틸술폰피라졸인 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 2

제 1 항에 있어서, 공공 또는 개인용 건물 또는 빌딩 또는 집 또는 가정에서 돌아다니거나 이동

하는 바퀴벌레 또는 개미의 개체수를 억제하는 방법.

청구항 3

제 1 항 또는 제 2 항에 있어서, 공공 또는 개인용 건물 또는 빌딩 또는 집 또는 가정에서 돌아다니거나 이동하는 바퀴벌레 또는 개미의 개체수를 억제하는 방법으로서, 전술한 바퀴벌레 또는 개미를 이들이 살충될 지역 내에 또는 가까이에 있는 표면을 덮고 있는 박막 위를 돌아다니게 함을 특징으로 하는 억제 방법.

청구항 4

제 1 항 또는 제 2 항에 있어서, 바퀴벌레에게 적용됨을 특징으로 하는 방법.

청구항 5

제 1 항 또는 제 2 항에 있어서, 살충 조성물이 0.0001 내지 15% w/w의 활성 성분을 포함함을 특징으로 하는 방법.

청구항 6

제 5 항에 있어서, 살충 조성물이 0.1 내지 6% w/w의 활성 성분을 포함함을 특징으로 하는 방법.

요약

바퀴벌레 또는 개미를 억제하기 위한 표면 처리용 1-페닐 피라졸 유도체의 용도.