[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl.
A01N 37/10 (2006.01)
A01N 31/02 (2006.01)
A01P 17/00 (2006.01)

[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 02815694.3

[45] 授权公告日 2007 年 4 月 18 日

[11] 授权公告号 CN 1310583C

[22] 申请日 2002.7.23 [21] 申请号 02815694.3
[30] 优先权
[32] 2001.8.11 [33] GB [31] 0119660.9
[86] 国际申请 PCT/GB2002/003369 2002.7.23
[87] 国际公布 WO2003/013243 英 2003.2.20
[85] 进入国家阶段日期 2004.2.10
[73] 专利权人 探索国际股份有限公司
地址 荷兰纳尔登
[72] 发明人 R·A·伯奇 H·赫尔维格
[56] 参考文献
JP53-86021A 1978.7.29
EP0619363A 1994.10.12
WO00/27197A 2000.5.18
审查员 徐 利

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司
代理人 卢新华 谭明胜

权利要求书 2 页 说明书 9 页 附图 1 页

[54] 发明名称

驱虫剂

[57] 摘要

本发明提供一种驱虫剂香料，它含有：(a)按驱虫剂香料的重量计至少 10％的香叶醇；(b)按驱虫剂香料的重量计至少 10％的邻苯二甲酸二乙酯；(c)选自芳樟醇、芋烯、香茅醛、萜品油烯和醋酸对位叔丁基环己基酯当中的一种或多种香料；其中驱虫剂香料含有按驱虫剂香料总重量计算至少 60％的(a)、(b)和(c)。 这种驱虫剂香料令人惊奇地被证实具有驱虫性，特别是对蟑螂，更具体地是对德国和美国蟑螂这两者。

1. 一种能够驱除德国蟑螂和美国蟑螂的驱虫剂香料，它含有：

(a) 按驱虫剂香料的重量计算，至少 10%的香叶醇；

(b) 按驱虫剂香料的重量计算，至少 10%的邻苯二甲酸二乙酯；和

(c) 芳樟醇、苧烯、香茅醛、萜品油烯和醋酸对位叔丁基环己基酯当中的至少一种或多种；

其中驱虫剂香料含有按照驱虫剂香料总重量计算至少 60%的(a)、(b)和(c)。

2. 权利要求 1 的驱虫剂香料，其中的香料含有芳樟醇、苧烯、香茅醛、萜品油烯和醋酸对位叔丁基环己基酯中的至少两种。

3. 权利要求 1 或 2 中的驱虫剂香料，其中的香料含有芳樟醇、苧烯、香茅醛、萜品油烯和醋酸对位叔丁基环己基酯中的至少三种。

4. 权利要求 1 或 2 中的驱虫剂香料，其中这种香料含有按驱虫剂香料的重量计算至少 1%的芳樟醇。

5. 权利要求 1 或 2 中的驱虫剂香料，其中这种香料含有按驱虫剂香料的重量计算至少 2%的苧烯。

6. 权利要求 1 或 2 中的驱虫剂香料，其中这种香料含有按驱虫剂香料的重量计算至少 2%的香茅醛。

7. 权利要求 1 或 2 中的驱虫剂香料，其中这种香料含有按驱虫剂香料的重量计算至少 2%的萜品油烯。

8. 权利要求 1 或 2 中的驱虫剂香料，其中这种香料含有按驱虫剂香料的重量计算至少 3%的醋酸对位叔丁基环己基酯。

9. 一种含有权利要求 1-8 之任意一项的驱虫剂香料的产品。

10. 权利要求 9 的产品，其中该产品是硬表面清洗剂、抛光剂或浆料。

11. 权利要求 10 的产品，其中该产品是地板抛光剂。

12. 芳樟醇、苧烯、香茅醛、萜品油烯、醋酸对位叔丁基环己基酯当中的至少一种或多种以及香叶醇和邻苯二甲酸二乙酯在能够驱除德国蟑螂和美国蟑螂的产品中的用途，其中该产品中含有：

(a) 按产品重量计至少 0.025%的香叶醇；

(b) 按产品重量计至少 0.025%的邻苯二甲酸二乙酯；和

(c) 芳樟醇、苧烯、香茅醛、萜品油烯、醋酸对位叔丁基环己基酯当中的至少一种或多种；其中该产品是硬表面清洗剂、抛光剂或浆料；以及

其中的产品含有按产品总重量计算至少 0.15%的(a)、(b)和(c)。

13. 权利要求 12 的用途，其中该产品是地板抛光剂。

14. 一种从表面驱除德国蟑螂和美国蟑螂的方法，它包括往表面施用有效剂量的权利要求 1 至 8 中任意一项中的驱虫剂香料的步骤。

15. 权利要求 1 至 8 中任意一项中的驱虫剂香料在驱除德国蟑螂和美国蟑螂中的用途。

驱虫剂

发明领域

本发明涉及香料，特别是驱虫剂香料，涉及含有这类香料的产品并涉及驱虫的方法。

发明背景

长期以来就知道一些昆虫对人类是讨厌的，某些种类的昆虫则是对健康有害的。

许多普通类型的出现於住宅内的昆虫诸如蟑螂，例如美国蟑螂[学名美国蜚蠊(periplaneta americana)]和德国蟑螂[学名德国小蠊(blattella germanica)]被分类为害虫，并已经做出了很大的努力来控制或消灭它们。已经发现有各种化合物，例如 N,N-二乙基-间甲苯甲酰胺，在驱除蟑螂方面是有效验的。这类化合物在住宅内使用通过施敷和喷雾到墙壁、地板、橱柜、小地毯、室内装璜物、地毯等的表面以及这些昆虫潜在的巢穴，诸如内墙和地板间隙中。有一些化合物已经和硬表面清洁剂在一起（EP-A-0619363）以及地板蜡抛光剂一起（US-A-3018217）使用。

在本领域中已知一些精油类和合成的香料组份（也称为香料）能驱虫。进一步，从对人类存在较低毒性来看，使用这些组份比起使用化合物来说也是有益的。WO 96/08147 描述了一种驱虫组合物，其中包含至少一种活性组份是选自 1，2，3a，4，5，5a，6，7，8，9，9a，9b 十二氢-3a，6，6，9a-四甲基萘并[2,1-b]呋喃（AMBERLYN™）；4-（三环[5,2,1,$0^{2,6}$]亚癸基-8）丁醛（DUPICAL™）；1-乙氧基-1-（2'-苯乙氧基）乙烷（EFETAAL™）；乙酰基雪松烯（LIXITONE™）；以及亚丙基-2-苯并[c]呋喃酮。这些组合物被描述为优先用於驱除叮咬类昆虫，诸如蚊子，和特别是伊蚊属的一些成员。

对美国蟑螂[美国蜚蠊(periplaneta americana)]具有驱虫性，例如公开于 WO 00/19822 和 Ngoh S.P.等人在 Pestic.Sci., 1998,54 卷第 261 页上发表的文章中的香料物质或香料，或对德国蟑螂[德国小蠊(blattella germanica)]具有驱虫性，例如公开于 JP 2207004 中的香料物质或香料是已知的。然而，一般很难配制出一种完全的香料，它能有效地驱除

蟑螂，特别是德国蟑螂，并更特别是能驱除德国和美国蟑螂两者并可能还能一起驱除其它爬行昆虫例如蚂蚁。

发明概述

一方面，本发明提供一种驱虫性香料，它含有：

(a) 按驱虫性香料重量计至少 10%的香叶醇；

(b) 按驱虫性香料重量计至少 10%的邻苯二甲酸二乙酯；和

(c) 芳樟醇、苧烯、香茅醛、萜品油烯、和醋酸对叔丁基环己基酯当中的至少一种或多种；

其中这种驱虫性香料包含按驱虫剂香料总重量计算至少 60%的(a)、(b)和(c)。

本发明是基于这样的认识，即本发明的驱虫性香料证实对蟑螂、特别是德国蟑螂[德国小蠊(blattella germanica)]和更特别对德国和美国蟑螂[德国小蠊(battella germauica)和美国蜚蠊(periplaneta americana)]两者都具有令人惊奇的有效驱虫性。

“驱虫性香料”一词，像这里所使用的那样，是意指一种包含一些特定香料组份的香料，它一般（但并不是必然）具有被认为是令人愉快和吸引人的气味，同时它具有驱虫效力。可试验并测量驱虫效力的一种方便的操作程序是把驱虫性香料并入液体抛光剂中，即用 3.0 毫升液体抛光剂均匀地施敷到总面积为 600 毫米×600 毫米的乙烯地板试验表面的一半面积上（300 毫米×600 毫米），然后再把它分成 9 个槽（30 毫米×600 毫米），从而使每个槽的一半（30 毫米×600 毫米）被香料处理过，而另外一半则没有被处理；液体抛光剂被允许干燥近 1 小时，然后把至少五只昆虫引入每个槽区中并让它们适应环境条件约 10 分钟，此后，即在 t=0 小时起始，用视频记录器监测昆虫的活动。驱虫性香料在最初，即 t=1 小时，优选能从处理过的面积驱除至少 60%的昆虫，更优选至少 65%，最优选至少 70%的昆虫。

术语“昆虫”像这里使用的那样，是打算用来包括普通的爬行昆虫，例如蟑螂类，如德国蟑螂[德国小蠊(blattella germanica)]和美国蟑螂[美国蜚蠊(periplaneta americana)]以及蚁类，例如黄土蚁(lasius flavus)、普通黑蚁(lasius niger)和厨蚁(monomorium pharoanis)。最好是，本发明的香料是被用来驱除蟑螂，特别是德国蟑螂，更特别是德国蟑螂和美国蟑螂两者。

典型地，驱虫性香料中会含有芳樟醇、苧烯、香茅醛、萜品油烯和醋酸对位叔丁基环己基酯（PtBCHA）中的至少一种式多种，优选至少两种、更优选至少三种、甚至更优选至少四种这些香料组份。方便地，当存在时，像这里定义的这类驱虫性香料中应含有按驱虫性香料的重量计算至少 1%的芳樟醇、至少 2%的苧烯、至少 2%并优选大于3%的香茅醛、至少 2%并优选大于 3%的萜品油烯、以及至少 3%的醋酸对位叔丁基环己基酯。

这种驱虫性香料可供选择地进一步和一些赋形剂诸如一种或多种进一步的香料组份混合在一起以便获得一种具有有效的驱虫活性又有总体来说令人愉快的香气的产品，也可以和稀释剂、定香剂、和进一步的溶剂或它们的混合物混合在一起。

在本发明的驱虫性香料中可以有益地存在的其它赋形剂有：醛 C11（十一碳醛）；醛异 C11（GIV）；药椒油；丙酸烯丙基环己基酯；水杨酸戊酯；戊基肉桂醛；茴香脑；茴香醇；茴香醛；Applinal Q (Applinal 是一种商标)；月桂叶油；醋酸苄酯；苯甲酸苄酯；肉桂酸苄酯；丙酸苄酯；水杨酸苄酯；Bourgeonal (Q) (Bourgeonal 是一种商标)；brahmanol；合成的樟脑粉；弗吉尼亚雪松；雪松烯醇；醋酸柏木酯；Celestolide (IFF) (Celestolide 是一种商标)；桉树脑；肉桂醇；肉桂醛；肉桂叶油；醋酸肉桂基酯；顺式-3-己烯醇；柠檬醛；香茅油；香茅醇；醋酸香茅基酯；香茅基含氧乙醛；丁子香油；芫荽油；香豆素；枯茗醛；仙客来醛；癸醛；9-癸烯-1-醇；二苄基醚；邻苯二甲酸二丁酯；二氢月桂烯醇；N-甲基-邻氨基苯甲酸甲酯；邻苯二甲酸二甲酯；Dimycretol (IFF) (Dimycretol 是一种商标)；二苯甲烷；二苯醚；醋酸二甲基苄基原酯；十二碳醇；十二碳醛；榄香脂油；草莓醛；肉桂酸乙酯；Ethyl Safranate (Q) (Ethyl Safranate 是一种商标)；乙基香兰素；丁子香酚；常绿植物油（松油等）；γ-壬内酯；γ-十一碳内酯；波旁香叶油；牻牛儿醇醋酸酯；牻牛儿醇甲酸酯；安息香胶；胡椒醛；Hercolyn D (HER) (Hercolyn D 是一种商标)；苯甲酸己酯；己基肉桂醛；水杨酸己酯；氢化阿托醛二甲缩醛；羟基香茅醛；羟基香茅醛二甲缩醛；吲哚；醋酸异冰片酯；肉豆蔻酸异丙酯；异环柠檬醛（GIV，IFF）；jasmacyclene；茉莉油；杂熏衣草 abrialis；熏衣草油；Lilial (GIV) (Lilial 是一种商标)；芳樟醇醋酸酯；左旋薄荷醇；邻氨基苯甲酸甲酯；甲基

柏木基酮；二氢茉莉酮酸甲酯；甲基紫罗兰酮；肉豆蔻酸甲酯；甲基萘基酮；水杨酸甲酯；苔纹树苔；麝香酮；橙花醇；β-萘甲醚和萘乙醚的混合物；α-乙氧基萘；橙花醇醋酸酯；壬醛；橡苔净油；辛醛；乳香树脂；苯乙酸对位甲酚酯；对位甲氧基苯乙酮；广藿香油；薄荷油；橙叶油；2-苯氧基乙醇；异丁酸苯氧乙基酯；醋酸苯乙基酯；苯乙醇；丁酸苯乙基酯；苯乙酸苯乙基酯；多香果油；α-蒎烯；泰国安息香树脂；玫瑰油；迷迭香油；檀香油；萜品醇；四氢芳樟醇；四氢别罗勒烯醇（IFF）；百里香红；十一碳醛；香草醛；马鞭草油；波旁岩兰草；β-萘甲醚和衣兰衣兰浸膏。

这些化合物是从下面指定的供应商处获得的：对于标有（Q）的—从 Quest International 公司；标有“IFF”的，从 International Flavours & Fragrances, Inc.；标有“GIV”的，从 Givaudan 公司；标有“(HER)”的，从 Hercules B.V.公司。

这种驱虫性香料中供选择地还可包括其它驱虫剂，和最好是已知的驱虫性香料组份。

这里使用的合适的已知驱虫剂包括 N,N-二乙基间甲苯甲酰胺（DEET）；N,N-二乙基苯甲酰胺；香茅；吐鲁香脂；秘鲁香脂；桉树油；水松油；樟脑；柏木油；古蓬香脂；邻苯二甲酸二丁酯；邻苯二甲酸二甲酯；1,2,3a,4,5,5a,6,7,8,9,9a,9b-十二氢-3a,6,6,9a-四甲基萘并[2,1-b]呋喃；4-（三环[5.2.1.$0^{2,6}$]亚癸基-8-）丁醛；1-乙氧基-1-（2'-苯乙氧基）乙烷；乙酰基柏木烯；亚丙基-2-苯并[c]呋喃酮；柠檬醛二乙缩醛（它可以商标名称“CITRATHAL”买到）；三环癸烯基烯丙基醚（它可以商标名称“FLEUROXENE”买到）；2-（2-甲基丙基）-4-羟基-4-甲基四氢吡喃（它可以商标名称“FLOROSA”买到）；N-甲基-N-苯基-2-甲基-丁酰胺（它可以商标名称“GARDAMIDE”买到）；4-异丁酸酯-3-甲氧基苯甲醛（它可以商标名称“ISOBUTAVAN”买到）；1-羟基-2-甲氧基-4-丙烯基苯；2,2,7,7-四甲基三环[6.2.1.$0^{1,6}$]十一碳烷-5-酮（它可以商标名称“ISOLONGIFOLANONE”买到）；7-甲酰基-5-异丙基-2-甲基-双环[2.2.2]辛-2-烯（它可以商标名称“MACEAL”买到）；3-甲基-5-苯基戊醛（它可以商标名称“MEFRANAL”买到）；α-异甲基紫罗兰酮；醋酸月桂烯酯（它可以商标名称“NEOBERGAMATE”买到）；10-异丙基-2,7-二甲基氧杂螺

[4,5]3.6-癸二烯（它可以商标名称“NEOCASPIRENE”买到）；三环[5.2.1.$0^{2,6}$]癸-4-烯-8-基-2,2-二甲基丙酸酯（它可以商标名称“PIVACYCLENE”买到）；新戊酸 2-苯乙基酯（它可以商标名称“PIVAROSE”买到）；以及 2,4-二甲基-4-苯基四氢呋喃（它可以商标名称“RHUBAFURAN”买到）。

本发明的驱虫性香料最好是并入施用于表面的产品中，例如施用于地板、墙壁、柜台、洗涤槽、碗碟橱、家具或门等等表面的产品中。这样，本发明进一步的方面是提供一种含有本发明驱虫性香料的产品。

合适并优选的产品包括例如，硬表面清洗剂，浆料和抛光剂，例如家具抛光剂、地板抛光剂、地板浆料，以上这些产品典型地是液体或例如蜡状形式的固体。特别优选的一种产品是地板抛光剂。

最好是，在这里定义的上述产品中含有按产品重量计算 0.01%至20%之间、更优选 0.1%至 10%之间的本发明的驱虫性香料。

更进一步的方面中，本发明提供一种含有驱虫性香料的产品，其中这种产品中包含:

(a) 按产品重量计至少 0.025%的香叶醇;

(b) 按产品重量计至少 0.025%的邻苯二甲酸二乙酯；以及

(c) 芳樟醇、苧烯、香茅醛、萜品油烯、和醋酸对叔丁基环己基酯当中的至少一种或数种；并且

其中这种产品含有按产品总重量计至少 0.15%的(a)、(b)和(c)。

这种产物将典型地进一步包含一些适合于产品性质的辅助剂。合适的辅助剂可包括蜡，例如石蜡、巴西棕榈蜡、地蜡等；树脂，增塑剂，水，表面活性剂，例如阴离子、阳离子、非离子、两性的表面活性剂化合物，增效助剂，荧光增白剂，抗静电剂，杀菌剂，杀真菌剂，发泡沫剂，抗泡沫剂，流动促进剂，悬浮剂，以及抗胶凝剂。

本发明的驱虫性香料可以其最简单的作为香料的形式，或作为产品的一部份，被施用到表面上，这包括地板、家具、墙壁等，施用方法可通过喷雾，例如作为气溶胶的形式，或通过泵的作用；也可通过刷擦、揩拭、例如用浸渍过产品的抹布或用施敷器、浇注等将产品施敷到要被处理的表面上。

这样，还要进一步的方面是，本发明提供了一种从表面驱除昆虫

的方法，它包括把一种驱虫性香料从有效剂量、典型地是 0.001 至 1.000 克/米^2，施敷到表面上的步骤；该驱虫性香料优选是一种产品，其中含有按产品重量计 0.01%至 20%的本发明的驱虫性香料。

本发明的还进一步的方面是提供应用本发明的驱虫性香料来驱除蟑螂，特别是德国蟑螂[德国小蠊(blattella germanica)]和/或美国蟑螂[美国蜚蠊（periplaneta americana）]。

参照所附的图，本发明将借助于以下非限制性的实施例来加以说明，其中：

图 1 是用来测定香料对感兴趣的昆虫的驱虫性的试验区域的排布的代表，试验区域被分成九个相等的槽，其中占总面积的一半面积已用香料处理过（图中用斑点状阴影显示）而另一半则未经处理。

实施例

本发明香料的驱虫性，特别是对德国蟑螂[德国小蠊（blattela germanica）]和美国蟑螂[美国蜚蠊(periplaneta Americana)]的驱虫性，可用以下描述的方法来证实。为了比较，也制备了不属本发明的香料，并用同样的方案试验。

按下面表中所指示的比例制备了本发明的香料 1 至香料 4，以及供比较的香料 5 至香料 7。所有百分比均为按重量计。

组份	香料1	香料2	香料3	香料4	香料5	香料6	香料7
香茅醛	4	6	12		2		
香叶醇	24	36	12	12			
蓠品油烯	4	6	12			2	
邻苯二甲酸二乙酯	20	16	16	20	20	20	20
醋酸苄酯	5	5	5	5	6	5	5
水杨酸己酯	5	3	3	3	3	3	3
杂熏衣草油	10	10	10	6	9	6	6
芳樟醇	5	5	5	4	4	5	4
二氢茉莉酮酸甲酯	3	3	5	2	2	3	2
蓠品醇	5	4	6	5	5	5	5
醋酸异冰片酯	4	3	5	9	9	11	12
苧烯	5	3	5	15	15	16	18
弗吉尼亚雪松油	1			4	5	4	5
醋酸对叔丁基环己基酯	3		3	10	15	15	15
二苯甲烷	2		1	5	5	5	5
总计	100	100	100	100	100	100	100

然后把制备的香料并入自发光的液体地板抛光剂中，即这样一种地板抛光剂，它用发光的表面涂层干燥并且一般不需要抛光，其配方如下表所示：

组份	% w/w
Hoescht-Wachs (Hoescht)	10.20
软化水（煮沸的）	20.40
软化水（室温）	63.70
Licomer A53 conc. (Hoescht) （丙烯酸酯聚合物）	4.50
Bronidox L (Henkel) (5-溴-5-硝基-1, 3-二噁烷)	0.20
Lutensol ON70 (BASF) (用7摩尔环氧乙烷单位合成的C10羰基合成醇)	0.50
香料1至7	0.50

LICOMER, BRONIDOX 和 LUTENSOL 均为商标。

按照以下方案对每种含有香料 1 至香料 7 的自发光液体地板抛光剂试验其排斥德国蟑螂[德国小蠊(blattella germanica)]和美国蟑螂[美国蜚蠊(periplaneta americana)]的能力。

每种香料对每个蟑螂物种进行试验，每次试验用一个蟑螂物种。

试验面积为总面积 600 毫米×600 毫米的乙烯树脂地板，它被分成九个面积大小相等的槽，每个槽尺寸为 30 毫米×600 毫米，如图 1 中所表示的那样。通过注射器往试验表面施用 3.0 毫升抛光剂并且涂布器这样均匀地分配抛光剂，使得总试验表面积中的一半（300 毫米×600 毫米）被抛光剂处理过，如图 1 中带斑点的面积所代表的那样，而总试验表面积的另外一半则未被处理。抛光剂被留下干燥大约一小时。五只蟑螂，可以是美国蜚蠊(periplameta americana)或德国小蠊(blattella germanica)，具有不同虫龄和性别，被放入每只槽中并通过视频记录器监测它们的行为。视频记录器在往槽中引入蟑螂 10 分钟以后开始工作并在记录一小时后停止。然后除去蟑螂。24 小时以后，五只蟑螂重新回到每个槽中并重复上述视频记录过程。视频记录内容被回放，并每隔 5 分钟停止，于是在一小时内获得一组十二个读数。每五分钟间隔计数在处理过的区域内蟑螂出现的数目。九个槽中驱虫性按下式计算:

可能观察到的蟑螂总数=540（12 次，9 个槽，每槽五只蟑螂）

如果驱虫剂无效时在处理区域内应观察到的蟑螂数=540/2=270

在处理过的区域内观察到的蟑螂数目=N（总共观察12次，9个槽）

这样，驱虫性能（%）=（270-N）/270×100

结果如下表所显示那样，其中的数字代表对特定种类的蟑螂由处理过的区域被驱除的百分数。

香料		时间=1小时	时间=24小时
1	美国蜚蠊	88	63
	德国小蠊	94	52
2	美国蜚蠊	71	69
	德国小蠊	64	68
3	美国蜚蠊	84	69
	德国小蠊	79	86
4	美国蜚蠊	85	74
	德国小蠊	72	85
5	美国蜚蠊	94	87
（供比较的香料）	德国小蠊	57	61
6	美国蜚蠊	97	78
（供比较的香料）	德国小蠊	32	58
7	美国蜚蠊	81	-15
（供比较的香料）	德国小蠊	59	2

结果显示只有香料1、2、3和4对两种蟑螂（即美国蜚蠊和德国小蠊）最初具有至少60%的驱虫性。虽然供比较的香料5和6证实对美国蜚蠊物种这种蟑螂具有有效的驱虫性，但它们对德国小蠊物种的驱虫性则较差。供比较的香料7则未能证实在24小时之后对两种蟑螂物种具有有效的驱虫性。

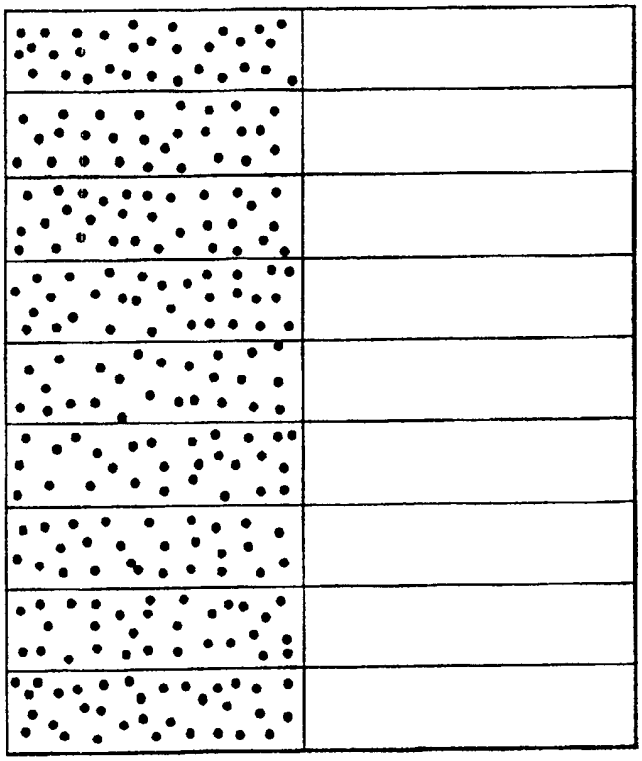


图 1