



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 118555909 A

(43) 申请公布日 2024. 08. 27

(21) 申请号 202380017463.6

(22) 申请日 2023.01.17

(30) 优先权数据

22152053.9 2022.01.18 EP

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2024.07.16

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2023/050965 2023.01.17

(87) PCT国际申请的公布数据

W02023/139051 EN 2023.07.27

(71) 申请人 弗门尼舍有限公司

地址 瑞士萨蒂尼

(72) 发明人 V·哈拉卡 E·哈塔诺

(74) 专利代理机构 北京三幸商标专利事务所

(普通合伙) 11216

专利代理师 刘卓然

(51) Int.Cl.

A01N 35/02 (2006.01)

A01P 17/00 (2006.01)

权利要求书3页 说明书12页

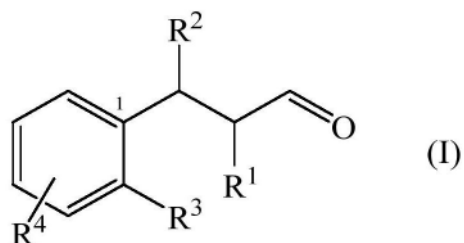
(54) 发明名称

节肢动物防治组合物

(57) 摘要

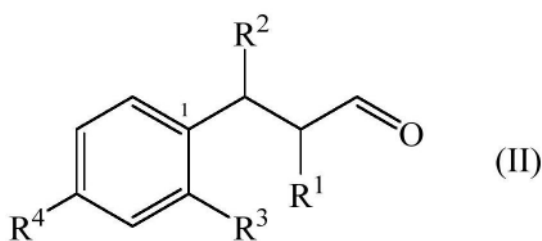
本发明涉及节肢动物防治组合物、防治节肢动物的方法和用途以及包含该组合物的节肢动物防治物品。

1. 一种节肢动物优选昆虫防治组合物, 包含式 (I) 化合物:



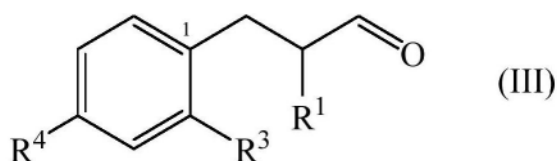
该化合物为其立体异构体中任何一种或它们的混合物的形式; 其中 R^1 、 R^2 和 R^3 各自独立地代表氢原子或 C_{1-3} 烷基; R^4 代表 C_{1-3} 烷氧基或 C_{1-6} 烷基, 其上可选地取代有羟基或 C_{1-3} 烷氧基; 所述 R^4 相对于1位为芳香环的间位、对位取代基; 条件是排除3-(4-异丙基苯基)-2-甲基丙醛。

2. 根据权利要求1所述的节肢动物防治组合物, 其中化合物是式 (II) 的化合物:



该化合物为其立体异构体中任何一种或它们的混合物的形式; 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^5 具有与权利要求1中定义相同的含义。

3. 根据权利要求1所述的节肢动物防治组合物, 其中化合物是式 (III) 的化合物:



该化合物为其立体异构体中任何一种或它们的混合物的形式; 其中 R^1 、 R^3 和 R^4 具有与如上定义相同的含义。

4. 根据权利要求1所述的节肢动物防治组合物, 其中该化合物从由如下构成的列表中选出: 3-[4-(2-甲氧基-2-丙烷基)-2-甲基苯基]丙醛、3-[4-(2-羟基-2-甲基丙基)苯基]丙醛、3-(4-叔丁基-2-甲基苯基)丙醛、3-(4-叔丁基苯基)丙醛、3-(3-丙烷-2-基苯基)丁醛和3-(4-甲氧基苯基)-2-甲基丙醛以及它们的混合物。

5. 根据权利要求1所述的节肢动物防治组合物, 其中该化合物从由如下构成的列表中选出: 3-[4-(2-羟基-2-甲基丙基)苯基]丙醛、3-(4-叔丁基-2-甲基苯基)丙醛、3-(4-叔丁基苯基)丙醛、3-(3-丙烷-2-基苯基)丁醛和3-(4-甲氧基苯基)-2-甲基丙醛以及它们的混合物。

6. 根据前述权利要求中任一项所述的节肢动物防治组合物, 其中该节肢动物是昆虫, 优选是蚊子。

7. 根据权利要求1至6中任一项所述的节肢动物防治组合物, 还包含从由如下构成的群组中选出的节肢动物防治助成分: N,N-二乙基-3-甲基苯甲酰胺 (DEET)、丁基乙酰氨基丙酸乙酯 (IR3535); 对薄荷烷-3,8-二醇 (PMD); 1-(1-甲基丙氧基羰基)-2-(2-羟乙基)哌啶 (派

卡瑞丁);中国雪松油、德克萨斯雪松油、弗吉尼亚雪松油、肉桂油、香茅油、玉米薄荷油、枫茅油分馏水合环化物、癸酸、柠檬桉油、柠檬桉油水合环化物、丁香酚、大蒜油、香叶醇、天竺葵油、薰衣草、杂薰衣草提取物、醒目薰衣草油、柠檬油、柠檬香茅油、苦楝树提取物、甲氧苄氟菊酯、顺式和反式对薄荷烷-3,8二醇的混合物、N,N-二乙基-间甲苯甲酰胺、壬酸、迷迭香油、百里香油、鹿蹄草油、2,3,4,5-双(丁基-2-烯)四氢糠醛(MGK Repellent 11)、桉树脑、肉桂醛、香茅醛、香茅醇、香豆素、邻苯二甲酸二丁酯、邻苯二甲酸二乙酯、邻氨基苯甲酸二甲酯、邻苯二甲酸二甲酯、乙基香兰素、桉树油、 δ -辛内酯、 δ -壬内酯、 δ -癸内酯、 δ -十一内酯、 δ -十二内酯、 γ -辛内酯、 γ -壬内酯、 γ -癸内酯、 γ -十一内酯、 γ -十二内酯、羟基香茅醛、酸橙油、柠檬烯、芳樟醇、邻氨基苯甲酸甲酯、薄荷油、月桂烯、苦楝油、桉烯、 β -石竹烯、(1H-吡啶-2-基)乙酸、茴香脑、茴香油、罗勒油、月桂叶油、樟脑、水杨酸乙酯、常绿油(松油)、2,2-二甲基-3-(2-甲基丙-1-烯基)环丙烷甲酸(1,3,4,5,6,7-六氢-1,3-二氧代-2H-异吡啶-2-基)甲酯(d-胺菊酯)、3-烯丙基-2-甲基-4-氧代环戊-2-烯基-2,2-二甲基-3-(2-甲基丙-1-烯基)-环丙烷甲酸酯(d-丙烯除虫菊)、3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基环丙烷甲酸 α -氰基-3-苯氧基苄基酯(氯氰菊酯)、2,2-二甲基-3-(2-甲基丙-1-烯基)环丙烷甲酸2-甲基-4-氧代-3-(丙-2-炔基)环戊-2-烯-1-基酯(炔丙菊酯)、啉虫脒、印楝素、恶虫威、联苯菊酯、硼酸、毒死蜱、溴氰菊酯、二嗪磷、敌敌畏、丁香酚、氟虫腈、吡虫啉、芳樟醇、马拉硫磷、麦芽糊精、甲氧苄氟菊酯、尼古丁、氯菊酯、除虫菊酯、拟除虫菊酯、鱼藤酮、二氧化硅(硅藻土)、S-烯虫酯、多杀菌素(多杀霉素A)、多杀霉素D、胺菊酯、四氟苯菊酯、1-(2,6,6-三甲基环己-2-烯-1-基)丁-2-烯-1-酮、3-丁亚基-2-苯并呋喃-1-酮、4-乙炔基-2-甲氧基苯酚、天然康乃克油、岩玫瑰提取物(岩蔷薇属)、5-戊基氧杂环戊烷-2-酮、苯并吡喃-2-酮、3,7-二甲基辛-2,6-二烯醛、4-羟基-3-甲氧基苯甲醛、2-甲基-5-丙-1-烯-2-基环己-2-烯-1-酮、留兰香油、6-己基氧杂环己烷-2-酮、5-甲基-2-丙烷-2-基环己基]乙酸酯、黑种草油、2-苯基乙醇、6-戊基氧杂环己烷-2-酮、乙酸(4-甲氧基苯基)甲酯、丁香油、3,4,4a,5,6,7,8,8a-八氢苯并吡喃-2-酮、3,7,7-三甲基双环[4.1.0]庚-3-烯、2-甲基丙酸2-苯基乙酯、2-(3-氧代-2-戊-2-烯基环戊基)乙酸甲酯、4-(2-甲氧基丙烷-2-基)-1-甲基环己烯、胡椒薄荷油、2-甲氧基-4-[丙-1-烯基]苯酚、2-甲基-3-(4-丙烷-2-基苯基)丙醛、(4-甲氧基苯基)甲醇以及它们的混合物。

8. 一种用于节肢动物优选昆虫防治的方法,其包括使昆虫与权利要求1至7中定义的组合物直接接触或与权利要求1至7中定义的组合物的蒸气接触。

9. 权利要求1至7中任一项所定义的组合物用于防治节肢动物优选昆虫的用途。

10. 一种节肢动物优选昆虫防治物品,其包含根据权利要求1至7中任一项所述的节肢动物优选昆虫防治组合物。

11. 根据权利要求10所述的节肢动物防治物品,其中该物品是消费品。

12. 根据权利要求10和11中任一项的节肢动物防治物品,其中该物品是织物护理产品,例如液体或固体洗涤剂,织物柔软剂,液体或固体香味增强剂,织物清新剂,熨烫水,纸张,漂白剂,地毯清洁剂,窗帘护理产品;身体护理产品,例如头发护理产品(例如洗发液、着色制剂或头发喷雾剂,颜色护理产品,头发定型产品,牙齿护理产品),消毒剂,私处护理产品;化妆品制剂(例如护肤霜或护肤液、雪花膏或体香剂或止汗剂(例如喷雾或走珠),脱毛剂,美黑剂、防晒或晒后产品,美甲产品,皮肤清洁剂,化妆品);皮肤护理产品(例如肥皂,沐浴

或盆浴用摩丝、浴油或沐浴露,或卫生用品或足部/手部护理产品);空气护理产品,例如空气清新剂或“即用型”粉末空气清新剂,其可用于家庭空间(房间、冰箱、橱柜、鞋或车)和/或公共空间(大厅、酒店、商场等);或家居护理产品,例如去霉剂,家具护理产品,擦拭巾,餐具洗涤剂或硬表面(例如地板、浴室、洁具或窗户清洁)洗涤剂;皮革护理产品;汽车护理产品,例如上光剂、蜡或塑料清洁剂;蜡烛;喷雾剂;线圈,电扩散器,压电扩散器,液体电扩散器,扩散器,橡胶隔膜,腕带,贴片,项圈,耳贴,衣物,织物,纸张,生物炭,纸板,纤维素垫,蚊帐,屏风,窗帘,清漆或涂料。

13. 根据权利要求11所述的节肢动物防治物品,其中该物品是电扩散器。

节肢动物防治组合物

技术领域

[0001] 本发明涉及节肢动物防治(control)组合物、防治节肢动物的方法和用途以及包含该组合物的节肢动物防治物品。

背景技术

[0002] 许多哺乳动物,包括人类,都受到节肢动物的侵害。一些节肢动物例如蚊子和蜱虫对于脊椎动物,例如哺乳动物,尤其是人类对象来说是不希望的,因为它们会叮咬对象,因此会引起瘙痒、疾病和/或细菌的传播,或者可能是其他疾病和/或病症的原因。同样,其他害虫通过食用、寄生或破坏用作食物、饲料或原材料的植物材料间接影响人类活动或社会。还有一些害虫会破坏或削弱人类使用或建造的家具或结构。这些损害可能直接归因于节肢动物,也可能归因于它们传播导致这些问题的细菌的能力。

[0003] 节肢动物防治组合物包括活性物质,当施用于皮肤、衣服或其他表面时,它们可能会阻止节肢动物在该表面上降落或攀爬。节肢动物防治剂有助于预防和防治节肢动物传播疾病如疟疾等的爆发。

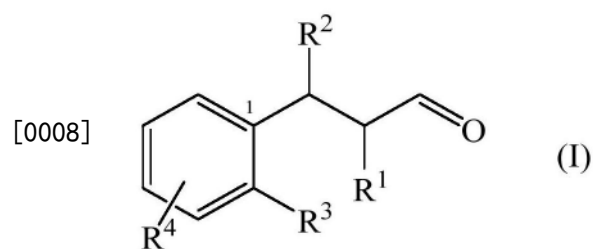
[0004] 然而,一些已知的节肢动物防治剂和组合物具有某些缺点,因为它们可能具有负面影响,即负面的嗅觉特性,例如没有气味或难闻的气味,或者反过来只有弱的节肢动物防治,特别是节肢动物驱避特性。

[0005] 需要提供既具有良好的嗅觉特性(即良好的快感效果),又具有良好的节肢动物防治特性(特别是节肢动物驱避特性)的节肢动物防治组合物。

[0006] 现有技术没有公开也没有暗示根据本发明的节肢动物防治组合物。

发明内容

[0007] 本发明提供了节肢动物优选昆虫防治组合物,其包含式(I)化合物:



[0009] 该化合物为其立体异构体中任何一种或它们的混合物的形式;

[0010] 其中, R^1 、 R^2 和 R^3 各自独立地代表氢原子或 C_{1-3} 烷基; R^4 代表 C_{1-3} 烷氧基或 C_{1-6} 烷基,其上可选地取代有羟基或 C_{1-3} 烷氧基;所述 R^4 相对于1位为芳香环的间位、对位取代基;条件是排除3-(4-异丙基苯基)-2-甲基丙醛。

[0011] 为了清楚起见,表述“其立体异构体中任何一种或它们的混合物”或类似表述是指本领域技术人员所理解的通常含义,即式(I)化合物可以是纯的对映异构体或非对映异构体。换句话说,式(I)化合物可以具有一个或多个立体中心,并且每个所述立体中心可以具有两种不同的立体化学(例如R或S)。式(I)化合物甚至可以是纯对映异构体的形式或多种

对映异构体或非对映异构体的混合物的形式。式(I)化合物可以是外消旋形式或非外消旋(scalemic)形式。因此,式(I)化合物可以是一种立体异构体,或为包含各种立体异构体或由各种立体异构体组成的物质组合物的形式。

[0012] 术语“烷基”应理解为包括支链烷基和直链烷基。

[0013] 术语“可选地/任选地/视情况(optionally)”应理解为将被可选地取代的某个基团可以或不可以取代有某个官能团。

[0014] 根据本发明的上述任一实施方案, R^1 可以为氢原子,或者甲基或乙基,特别地, R^1 可以为氢原子,或者甲基。

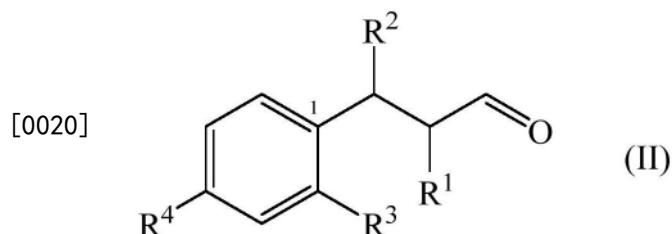
[0015] 根据本发明的上述任一实施方案, R^2 可以为氢原子,或者甲基或乙基,特别地, R^2 可以为氢原子,或者甲基,甚至更特别地, R^2 可以为氢原子。

[0016] 根据本发明的上述任一实施方案, R^3 可以为氢原子,或者甲基或乙基,特别地, R^3 可以为氢原子,或者甲基。

[0017] 根据本发明的上述任一实施方案, R^1 、 R^2 和 R^3 中的一个基团可以是氢原子或 C_{1-3} 烷基,并且另外两个基团可以是氢原子。 R^1 、 R^2 和 R^3 中的一个基团可以是氢原子或甲基,而其他两个基团可以是氢原子。甚至更特别地, R^1 可以是氢原子或甲基,而 R^2 和 R^3 可以是氢原子,或者 R^3 可以是氢原子或甲基,而 R^2 和 R^3 可以是氢原子。

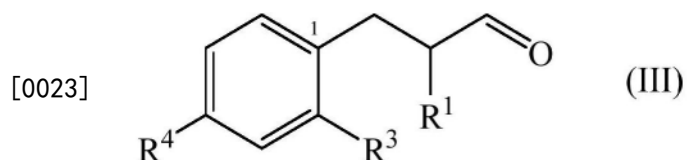
[0018] 根据本发明的上述任一实施方案, R^4 可以为甲氧基或 C_{1-4} 烷基,其上可选地取代有羟基或 C_{1-3} 烷氧基。特别地, R^4 可以为甲氧基或 C_{3-4} 烷基,其上可选地取代有羟基或甲氧基。特别地, R^4 可以为甲氧基或 C_{3-4} 支链烷基,其上可选地取代有甲氧基。

[0019] 根据本发明的上述任一实施方案, R^4 可为芳环的对位取代基。换言之,式(I)化合物可以为式(II)化合物:



[0021] 该化合物为其立体异构体中任何一种或它们的混合物的形式;其中 R^1 、 R^2 、 R^3 和 R^4 具有与如上定义相同的含义。

[0022] 根据本发明的上述任一实施方案,式(II)化合物可以为式(III)化合物:



[0024] 该化合物为其立体异构体中任何一种或它们的混合物的形式;其中 R^1 、 R^3 和 R^4 具有与如上定义相同的含义。

[0025] 根据本发明的上述任一实施方案,式(I)化合物可以从由如下构成的群组中选出: 3-[4-(2-甲氧基-2-丙烷基)-2-甲基苯基]丙醛[2637928-74-4]、3-[4-(2-羟基-2-甲基丙基)苯基]丙醛[1896908-71-6]、3-(4-叔丁基-2-甲基苯基)丙醛[160782-57-0]、3-(4-叔丁基苯基)丙醛[18127-01-0]、3-(3-丙烷-2-基苯基)丁醛[125109-85-5]和3-(4-甲氧基苯

基)-2-甲基丙醛[5462-06-6]。

[0026] 特别地,式(I)化合物可以从由如下构成的群组中选出:3-[4-(2-羟基-2-甲基丙基)苯基]丙醛[1896908-71-6]、3-(4-叔丁基-2-甲基苯基)丙醛[160782-57-0]、3-(4-叔丁基苯基)丙醛[18127-01-0]、3-(3-丙烷-2-基苯基)丁醛[125109-85-5]和3-(4-甲氧基苯基)-2-甲基丙醛[5462-06-6]。

[0027] 可以理解的是,本文提供的本发明的每种实施方案可能不构成本发明组合物的100%。在这种情况下,可以使用额外的组分,例如,以进一步改善快感特征或使快感特征适应组合物消费者的特定应用,使用溶剂以帮助递送本发明的组合物,使用稳定剂和防腐剂以改善组合物的完整性和保存性,这可能是消费者预期使用所需要的。其他组分包括如下提供的额外的节肢动物防治助成分。

[0028] 在本发明的一种优选的实施方案中,节肢动物防治组合物具有良好的快感特征。

[0029] 本发明人已经充分认识到,节肢动物防治组合物具有可接受的快感特征可能是理想的。这是因为组合物可能在靠近消费者的地方使用,并且可以理解,任何不愉快的快感特征都可能抑制该组合物的使用。

[0030] 术语“节肢动物”具有本领域技术人员的正常含义。节肢动物包括无脊椎动物,例如昆虫、蛛形纲动物和甲壳类动物,它们具有分节的身體和关节附肢。节肢动物通常具有间隔蜕皮的几丁质外骨骼,以及连接到神经节腹侧链的背侧前脑。

[0031] 在本发明的理解中,节肢动物涉及不期望的节肢动物,这意味着不期望它们存在于空气中、物品表面上、植物表面上或脊椎动物(例如人类受试者或其他哺乳动物,优选人类受试者)的表面上。优选地,不期望的节肢动物是影响植物和动物的有害节肢动物,例如蓟马、蚜虫、甲虫、蛾、粉蚧、蚧壳虫(scale)等,更优选影响动物的有害节肢动物,例如蚂蚁、白蚁、蟑螂、苍蝇等,甚至更优选影响脊椎动物的吸血节肢动物,例如咬蝇、臭虫、猎蝽(kissing bug)、跳蚤、虱子、蚊子和蜱虫,甚至更优选蚊子和蜱虫。

[0032] 不希望存在节肢动物的原因可能是节肢动物在空气中的存在对受试者是不愉快的,节肢动物接触物品会传播疾病和/或病菌,或者节肢动物咬伤生物体并引起瘙痒、疾病和/或病菌的传播,或者节肢动物的摄食可能是其他疾病和/或病症的原因。

[0033] 在一种特定的实施方案中,节肢动物是昆虫或蛛形纲动物,优选昆虫。

[0034] 术语“昆虫”具有技术领域技术人员的通常理解。昆虫被描述为明确的头部、胸部和腹部,只有三对腿,通常有一对或两对翅膀。

[0035] 在一种特定的实施方案中,昆虫是蚊子、咬蝇、臭虫、猎蝽、跳蚤、虱子、蚂蚁、白蚁、蟑螂、苍蝇、蚜虫、甲虫、蓟马、蛾、粉蚧或蚧壳虫害虫,更优选蚊子。

[0036] 术语“蛛形纲动物”具有技术领域技术人员的通常理解。蛛形纲动物被描述为具有分成两个区域的分段身体,其中前部有四对腿但没有触角。

[0037] 在一种特定的实施方案中,蛛形纲动物是蜱虫、螨、恙螨或蜘蛛,更优选蜱虫。

[0038] 表述“防治”、“节肢动物防治”、“昆虫防治”或“蛛形纲动物防治”等对于本技术领域的技术人员具有通常的含义。

[0039] 在本发明的语境中,“防治(controlling)”定义了根据本发明的节肢动物防治组合物吸引、阻止、杀灭或驱避节肢动物,优选阻止或驱避节肢动物,甚至更优选驱避节肢动物的能力。

[0040] 根据本发明的“吸引 (attracting)”定义了根据本发明的节肢动物引诱剂组合物增加或促进节肢动物在节肢动物引诱剂源处的接触或存在的能力,例如在空气中,在物品表面上或在脊椎动物例如人受试者或其他哺乳动物,优选物品例如诱捕装置的表面上,节肢动物引诱剂化合物或组合物已经施用到其上。

[0041] 根据本发明的“驱避性 (repellency)”定义了根据本发明的节肢动物驱避组合物最小化、减少、遏制或防止节肢动物接近或存在于节肢动物驱避剂源处的能力,例如在空气中,在物品表面上或在脊椎动物例如人类受试者或其他哺乳动物,优选人类受试者的表面上,节肢动物驱避剂化合物或组合物已经施用到其上。

[0042] 根据本发明的“阻止 (detering)”定义了根据本发明的节肢动物阻止组合物最小化、减少、遏制或防止节肢动物在节肢动物阻止源处的接触或存在的能力,例如在空气中,在物品表面上或在脊椎动物例如人受试者或其他哺乳动物,优选人类受试者的表面上,节肢动物阻止化合物或组合物已经施用到其上。通常,在最初品尝节肢动物阻止化合物或组合物后,当用作摄食阻止物时显示阻止作用,阻碍了害虫随后的食物摄入或产卵。

[0043] 根据本发明的“空间驱避性”定义了根据本发明的节肢动物驱避组合物最小化、减少、遏制或防止节肢动物接近或存在于节肢动物驱避源处的能力,例如在空气中,在物品表面上或在脊椎动物例如人受试者或其他哺乳动物,优选人类受试者的表面上,节肢动物驱避化合物或组合物已经施用到其上。通常,当在空气或液体中释放、喷洒、散布或扩散的空间驱避化合物或组合物阻碍害虫进入空间驱避化合物或组合物存在的区域时,显示空间驱避效果。因此,驱避作用是从远处发生的,害虫不一定与要保护的经处理的物品或生物体直接接触。

[0044] 根据本发明的“杀灭 (killing)”定义了根据本发明的节肢动物杀灭组合物在节肢动物杀灭源处杀灭节肢动物的能力,例如在空气中,在物品表面上或在脊椎动物例如人类受试者或其他哺乳动物,优选人类受试者的表面上,节肢动物杀灭化合物或组合物已经施用到其上。当将节肢动物杀灭组合物施用于植物、动物或人类受试者时,其以杀灭节肢动物但不杀灭受试者的量施用。

[0045] 在一种特定的实施方案中,节肢动物防治组合物是节肢动物驱避组合物,优选昆虫驱避组合物,更优选驱蚊组合物。

[0046] 在一种特定的实施方案中,节肢动物防治源是物品的表面和/或附近的空气,优选为蜡烛、线圈、电扩散器、腕带、贴片、项圈、耳贴、衣服、织物、纸张、生物炭、纸板、纤维素垫、蚊帐、屏风、窗帘、家具、墙壁、地面或涂料,或受试者的表面,优选脊椎动物的表面,例如人类受试者或其他哺乳动物,优选人类受试者,即,用喷雾剂、气雾剂、乳霜、走珠、腕带、乳液、肥皂、洗发液、防晒霜或贴剂等产品处理过皮肤的人类受试者,或用洗衣粉、液体洗涤剂、喷雾剂、乳液、粉末等产品处理过的衣物。

[0047] 根据本发明的节肢动物防治效果是使用 Kröber T, Kessler S, Frei J, Bourquin M, Guerin PM. An in vitro assay for testing mosquito controlling compounds employing a warm body and carbon dioxide as a behavioral activator. J Am Mosq Control Assoc. 2010; 26: 381-386 中所定义的温体实验 (经调整) 对蚊子进行测定的。所附实施例中提供了进一步的信息。

[0048] 根据本发明的防治效果、驱避性和空间驱避性是通过测试针对黄热病蚊子 (埃及

伊蚊 (*Aedes aegypti*) 洛克菲勒株) 的温体实验来确定。埃及伊蚊是用于防治测试的模式生物, 并且是世界卫生组织 (WHO) 推荐的模式生物之一, 因为它是一种非常具攻击性的亲人蚊子物种, 其通常对节肢动物防治化合物显示出低敏感性。对如上文提及的出版物中所提及选择的5至10日龄的相同日龄的寻求宿主的雌性进行防治功效的观察。所测试的饥饿雌性可获得10%糖溶液, 但不进食血液。所附实施例中提供了进一步的信息。

[0049] 所公布的方案已被调整为不手动计数落身的蚊子, 而是使用自动计数软件自动计数, 从冈比亚按蚊 (*Anopheles gambiae*) 切换到埃及伊蚊 (*A. aegypti*) 导致放置在测试笼中的蚊子数量减少, 这是由于规模差异 (例如30只蚊子而不是50只), 并且由于埃及伊蚊是昼夜蚊子而导致照明增加 (即150勒克斯而不是4勒克斯)。所附实施例中提供了进一步的信息。

[0050] 根据本发明的防治效果、驱避性和空间驱避性也是根据笼中手臂方法确定的, 该方法改编自WHO《人体皮肤驱蚊剂功效测试指南》(WHO/CDS/NTD/WHOPES/2009.4)。通过将未经处理的手臂与经过处理的手臂插入笼子 (40×40×40cm) 中30秒 (阴性对照) 三次的结果进行比较, 可以评估100只饥饿雌性埃及伊蚊对测试物质的准备程度。所附实施例中提供了进一步的信息。

[0051] 使用 *Kröber* T, Bourquin M, Guerin PM, 2013. A standardized in vivo and in vitro test method for evaluating tick repellents., *Pestic. Biochem. Phys.* 107(2): 160-168中定义的体外温板测定法的方案评估用于驱避蜱虫等蛛形纲动物的物质的活性。

[0052] 在一种特定的实施方案中, 物质的量和选择以其有助于、增强或改善组合物的节肢动物防治活性和快感特性二者的方式进行。

[0053] 在一种实施方案中, 节肢动物防治组合物还可包含节肢动物防治助成分。通过“节肢动物防治助成分”, 理解为这样一种成分, 其能够赋予本文所述组合物的节肢动物防治效果额外的节肢动物防治益处。

[0054] 在一种实施方案中, 本文描述的物质能够例如通过减少组合物中节肢动物防治助成分的量来修饰、增强或改善节肢动物防治助成分的节肢动物防治效果。这在节肢动物防治助成分在一定剂量下对人类受试者有害的情况下或在节肢动物防治助成分在一定剂量下具有负面嗅觉特性的情况下可能是特别有益的。

[0055] 根据一种特定的实施方案, 本文所述的物质与节肢动物防治助成分的组合产生协同的节肢动物防治效果。

[0056] 根据一种特定的实施方案, 与单一成分相比, 本文所述的物质与节肢动物防治助成分的组合导致整个组合物的经修饰的、令人愉悦的、增强的或改善的嗅觉印象。

[0057] 根据一种实施方案, 节肢动物防治助成分从由如下构成的群组中选出: N,N-二乙基-3-甲基苯甲酰胺 (DEET)、丁基乙酰氨基丙酸乙酯 (IR3535); 对薄荷烷-3,8-二醇 (PMD); 1-(1-甲基丙氧基羰基)-2-(2-羟乙基) 哌啶 (派卡瑞丁); 中国雪松油、德克萨斯雪松油、弗吉尼亚雪松油、肉桂油、香茅油、玉米薄荷油、枫茅油 (*Cymbopogon winterianus*) 分馏水合环化物、癸酸、柠檬桉 (*Eucalyptus citriodora*) 油、柠檬桉油水合环化物、丁香酚、大蒜油、香叶醇、天竺葵油、薰衣草 (*Lavender*)、杂薰衣草 (*Lavandula hybrida*) 提取物、醒目薰衣草 (*Lavandin*) 油、柠檬油、柠檬香茅 (*Lemongrass*) 油、苦楝树 (*Margosa*) 提取物、甲氧苄氟菊酯 (*Metofluthrin*)、顺式和反式对薄荷烷-3,8-二醇混合物、N,N-二乙基-间甲苯甲酰胺、壬酸、

迷迭香油、百里香油、鹿蹄草 (Wintergreen) 油、2,3,4,5-双(丁基-2-烯)四氢糠醛 (MGK Repellent 11)、桉树脑、肉桂醛、香茅醛、香茅醇、香豆素、邻苯二甲酸二丁酯、邻苯二甲酸二乙酯、邻氨基苯甲酸二甲酯、邻苯二甲酸二甲酯、乙基香兰素、桉树油、 δ -辛内酯、 δ -壬内酯、 δ -癸内酯、 δ -十一内酯、 δ -十二内酯、 γ -辛内酯、 γ -壬内酯、 γ -癸内酯、 γ -十一内酯、 γ -十二内酯、羟基香茅醛、酸橙油、柠檬烯、芳樟醇、邻氨基苯甲酸甲酯、薄荷油、月桂烯、苦楝油、桉烯、 β -石竹烯、(1H-吡啶-2-基)乙酸、茴香脑、茴香油、罗勒油、月桂叶油、樟脑、水杨酸乙酯、常绿油(松油)、2,2-二甲基-3-(2-甲基丙-1-烯基)环丙烷甲酸(1,3,4,5,6,7-六氢-1,3-二氧化-2H-异吡啶-2-基)甲酯(d-胺菊酯(d-Tetramethrin))、3-烯丙基-2-甲基-4-氧代环戊-2-烯基-2,2-二甲基-3-(2-甲基丙-1-烯基)-环丙烷甲酸酯(d-丙烯除虫菊(d-Allethrin))、3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基环丙烷甲酸 α -氰基-3-苯氧基苄基酯(氯氰菊酯(Cypermethrin))、2,2-二甲基-3-(2-甲基丙-1-烯基)环丙烷甲酸2-甲基-4-氧代-3-(丙-2-炔基)环戊-2-烯-1-基酯(炔丙菊酯(Prallethrin))、啉虫脒(Acetamiprid)、印楝素(Azadirachtin)、恶虫威(Bendiocarb)、联苯菊酯(Bifenthrin)、硼酸、毒死蜱(Chlorpyrifos)、溴氰菊酯(Deltamethrin)、二嗪磷(Diazinon)、敌敌畏(Dichlorvos)、丁香酚、氟虫腈(Fipronil)、吡虫啉(Imidacloprid)、芳樟醇、马拉硫磷(Malathion)、麦芽糊精、甲氧苄氟菊酯(Metofluthrin)、尼古丁、氯菊酯(Permethrin)、除虫菊酯和拟除虫菊酯、鱼藤酮(Rotenone)、二氧化硅(硅藻土)、S-烯虫酯(s-Methoprene)、多杀菌素(Spinosad)(多杀菌素A(Spinosyn A))、多杀菌素D、胺菊酯(Tetramethrin)、四氟苯菊酯(Transfluthrin)、1-(2,6,6-三甲基环己-2-烯-1-基)丁-2-烯-1-酮、3-丁亚基-2-苯并呋喃-1-酮、4-乙烯基-2-甲氧基苯酚、天然康乃克油(Cognac oil green)、岩玫瑰(Labdanum)提取物(岩蔷薇属(Cistus spp.))、5-戊基氧杂环戊烷-2-酮、苯并吡喃-2-酮、3,7-二甲基辛-2,6-二烯醛、4-羟基-3-甲氧基苯甲醛、2-甲基-5-丙-1-烯-2-基环己-2-烯-1-酮、留兰香(Mentha spicata)油、6-己基氧杂环己烷-2-酮、5-甲基-2-丙烷-2-基环己基]乙酸酯、黑种草(Nigella damascena)油、2-苯基乙醇、6-戊基氧杂环己烷-2-酮、乙酸(4-甲氧基苯基)甲酯、丁香(Syzygium aromaticum)油、3,4,4a,5,6,7,8,8a-八氢苯并吡喃-2-酮、3,7,7-三甲基双环[4.1.0]庚-3-烯-2-甲基丙酸2-苯基乙酯、2-(3-氧代-2-戊-2-烯基环戊基)乙酸甲酯、4-(2-甲氧基丙烷-2-基)-1-甲基环己烯、胡椒薄荷(Mentha piperita)油、2-甲氧基-4-[丙-1-烯基]苯酚、2-甲基-3-(4-丙烷-2-基苯基)丙醛和(4-甲氧基苯基)甲醇以及它们的混合物。

[0058] 在一种特定的实施方案中,基于组合物的总重量,节肢动物防治助成分的含量为0.02至80重量%,更优选为0.05至70重量%,甚至更优选为0.1至60重量%。因此,应当理解,基于组合物的总重量,该组合物所包含的节肢动物防治助成分的最小量为至少0.2重量%、至少0.05重量%或至少0.1重量%,最大量为不超过80重量%、不超过70重量%或不超过60重量%。

[0059] 在一种特定的实施方案中,在如上所述的组合物中物质的量的限制内,本发明的组合物中的物质和节肢动物防治助成分以90:10至10:90的重量范围,优选80:20至20:80的重量范围,更优选65:35至35:65的重量范围,最优选60:40至40:60的重量范围包含在该组合物中。在本文中还应理解,物质和节肢动物防治助成分可以如上文所述的任何重量范围组合,例如90:10至20:80优选35:65且更优选40:60,80:20至10:90优选35:65且更优选40:

60,65:35至10:90优选20:80且更优选40:60,或40:60至10:90优选20:80且更优选35:65包含在该组合物中。

[0060] 在一种实施方案中,节肢动物防治组合物还可包含香料成分。香料成分被理解为有助于、修饰、增强或改善组合物的嗅觉特征,但不有助于、增强或改善组合物的节肢动物防治效果。提供此类快感效果且适合用于本发明组合物的香料成分是本领域已知的,并且本领域技术人员可以容易地识别。

[0061] 节肢动物防治组合物还可包含载体。通过“载体”,应理解为这样一种材料,活性化合物与该材料混合或配制以促进其在待处理场所或其他对象的应用,或其储存、运输和/或处理。所述载体可以是无机的或有机的或合成的天然来源。所述载体可以是液体或固体。

[0062] 作为液体载体,可以列举作为非限制性例子的乳化体系,即溶剂和表面活性剂体系,或通常用于香料中的溶剂。溶剂的性质和类型的详细描述通常不能详尽无遗。然而,可以列举作为非限制性例子的溶剂,如丁二醇或丙二醇、甘油、二丙二醇及其单醚、三乙酸1,2,3-丙三酯、戊二酸二甲酯、己二酸二甲酯、乙酸1,3-二乙酰氧基丙-2-基酯、邻苯二甲酸二乙酯、肉豆蔻酸异丙酯、苯甲酸苄酯、苄醇、2-(2-乙氧基乙氧基)-1-乙醇、柠檬酸三乙酯、2-甲基丙-1-烯和2-(2-乙氧基乙氧基)乙醇或它们的混合物,特别合适的是二丙二醇、2-甲基丙-1-烯和2-(2-乙氧基乙氧基)乙醇以及它们的混合物。

[0063] 对于同时包含载体的组合物,除先前详细说明的载体外,其他合适的载体也可以是乙醇,水/乙醇混合物,柠檬烯或其他萜烯,异链烷烃,如以商标 **Isopar**[®] 公知的那些(来源:Exxon Chemical),或二醇醚和二醇醚酯,如以商标 **Dowanol**[®] 公知的那些(来源:Dow Chemical Company),如Dowanol[™] DPMA(乙二醇醚乙酸酯)或**Augeo**[®] Clean Multi(异丙基甘油;来源:Solvay)或氢化蓖麻油,如以商标 **Cremophor**[®] RH 40公知的那些(来源:BASF)。

[0064] 固体载体是指这样一种材料,节肢动物防治组合物或节肢动物防治组合物的某些元素可以化学地或物理地与其结合。通常,使用这样的固体载体来稳定组合物,或控制组合物或某些成分的蒸发速率。固体载体是目前在本领域中使用的,并且本领域技术人员知道如何达到期望的效果。然而,作为固体载体的非限定性例子,可以列举吸收胶或聚合物或无机材料,例如多孔聚合物、环糊精、木基材料、有机或无机凝胶、粘土、石膏、滑石或沸石。

[0065] 作为固体载体的其他非限制性例子,可以列举包封材料。这种材料的例子可包括成壁材料和增塑材料,例如单糖、二糖或三糖,天然或改性淀粉,水胶体,纤维素衍生物,聚乙酸乙烯酯,聚乙烯醇,蛋白质或果胶,或其它此类材料。包封是本领域技术人员熟知的方法,并且可以通过例如使用诸如喷雾干燥、附聚或挤出的技术进行;或由包括凝聚和复合凝聚技术的涂层包封组成。

[0066] 作为固体载体的非限制性例子,可以特别列举核-壳胶囊,其使用氨基塑料、聚酰胺、聚酯、聚脲或聚氨酯类型的树脂或它们的混合物(所有所述树脂都是本领域技术人员公知的),通过使用聚合、界面聚合、凝聚等技术或这些技术一起(所有所述技术已经在现有技术中描述)引发的相分离方法,并且可选地在聚合物稳定剂或阳离子共聚物的存在下进行。

[0067] 树脂可以通过醛(例如甲醛、2,2-二甲氧基乙醛、乙二醛、乙醛酸或羟乙醛及它们的混合物)与胺例如脲、苯并胍胺、甘脲基、三聚氰胺、羟甲基三聚氰胺、甲基化羟甲基三聚氰胺、胍唑等以及它们的混合物缩聚产生。或者,可以使用预先形成的树脂烷基化

(alkylolated) 多胺,例如以商标 **Urac**[®] (来源: Cytec Technology Corp.)、**Cymel**[®] (来源: Cytec Technology Corp.)、**Urecoll**[®] 或 **Luracoll**[®] (来源: BASF) 可商购的那些。

[0068] 其他树脂是通过多元醇如甘油与多异氰酸酯如六亚甲基二异氰酸酯的三聚体、异佛尔酮二异氰酸酯或苯二甲基二异氰酸酯的三聚体或六亚甲基二异氰酸酯的缩二脲、或苯二甲基二异氰酸酯与三羟甲基丙烷的三聚体 (以商品名 **Takenate**[®] 已知, 来源: Mitsui Chemicals) 的缩聚产生的那些, 其中优选苯二甲基二异氰酸酯与三羟甲基丙烷的三聚体和六亚甲基二异氰酸酯的缩二脲。

[0069] 已经发表了许多与氨基树脂即三聚氰胺基树脂与醛类缩聚而包封有关的文章。这些文章已经描述了影响这种核-壳微胶囊制备的各种参数。这些文献是本领域技术人员已知的, 其中的内容可用于本发明的领域。

[0070] 本发明还涉及节肢动物 (优选昆虫) 防治的方法, 该方法包括使节肢动物 (优选昆虫) 与上述组合物直接接触或与上述组合物的蒸气接触。

[0071] 为清楚起见, 本发明的节肢动物防治组合物可通过本领域已知的常规方法例如喷涂、涂抹、佩戴 (wearing) 或扩散而施用于空气, 物品表面, 物品表面附近的空气, 或受试者表面。

[0072] 在一种特定的实施方案中, 将根据本发明的节肢动物防治组合物施用于物品的表面、物品表面附近的空气或施用于动物或受试者表面。

[0073] 在一种特定的实施方案中, 物品可以是如下文所述的节肢动物防治物品, 并且具体可以是蜡烛、线圈、电扩散器、腕带、贴片、项圈、耳贴、衣服、织物、纸张、生物炭、纸板、纤维素垫、蚊帐、屏风、窗帘、家具、涂料、墙壁、地面、喷雾剂、气雾剂、乳霜、走珠、腕带、乳液、肥皂、洗发剂、防晒霜、洗衣粉、液体洗涤剂、喷雾剂、乳液、粉末。

[0074] 在一种特定的实施方案中, 受试者的表面是人类或动物受试者的表面, 优选地, 该表面是人类受试者, 即人类受试者的皮肤。

[0075] 本发明还涉及如上文定义的组合物用于防治节肢动物优选昆虫的用途。

[0076] 本发明还涉及包含如上文所述的节肢动物防治组合物的节肢动物防治物品。

[0077] 通过“节肢动物防治物品”, 应理解为代指一种消费品, 其至少向其应用的表面或空间 (例如皮肤、头发、纺织品或家居表面) 提供节肢动物防治效果。换言之, 根据本发明的节肢动物防治物品是这样一种消费品, 其包含对应于所需消费品的功能制剂以及可选的附加益处剂, 以及节肢动物防治量的至少一种物质。为了清楚起见, 所述消费品是不可食用的产品。

[0078] 消费品的成分的性质和类型不保证在此进行更详细的描述, 在任何情况下都不是详尽无遗的, 技术人员能够基于其常识并根据所述产品的特性及期望的效果对它们进行选择。

[0079] 合适的消费品的非限制性例子包括香水, 例如精细香水 (fine perfume)、涂抹式香水 (splash) 或淡香精 (eau de parfum)、古龙水或剃须水或须后水; 织物护理产品, 例如液体或固体洗涤剂、洗衣粉、织物柔软剂、液体或固体香味增强剂、织物清新剂、熨烫水、纸张、漂白剂、地毯清洁剂、窗帘护理产品; 身体护理产品, 例如头发护理产品 (例如洗发液、着色制剂或头发喷雾剂, 颜色护理产品, 头发定型产品, 牙齿护理产品), 消毒剂, 私处护理产

品;化妆品制剂(例如护肤霜或护肤液、雪花膏或体香剂或止汗剂(例如喷雾或走珠),脱毛剂,美黑剂、防晒或晒后产品,美甲产品,皮肤清洁剂,化妆品);皮肤护理产品(例如肥皂,沐浴或盆浴用摩丝、浴油或沐浴露,或卫生用品或足部/手部护理产品);空气护理产品,例如空气清新剂或“即用型”粉末空气清新剂,其可用于家庭空间(房间、冰箱、橱柜、鞋或车)和/或公共空间(大厅、酒店、商场等);或家居护理产品,例如去霉剂,家具护理产品,擦拭巾,餐具洗涤剂或硬表面(例如地板、浴室、洁具或窗户清洁)洗涤剂;皮革护理产品;汽车护理产品,例如上光剂、蜡或塑料清洁剂;蜡烛;喷雾剂;线圈,空气护理产品,压电扩散器,液体电扩散器,扩散器,橡胶隔膜,腕带,贴片,项圈,耳贴,衣物,织物,纸张,生物炭,纸板,纤维素垫,蚊帐,屏风,窗帘,清漆或涂料,更优选蜡烛,喷雾器,线圈,电扩散器,压电扩散器,液体电扩散器,扩散器,橡胶隔膜,腕带,贴片,项圈,耳贴,衣物,织物,纸张,生物炭,纸板,纤维素垫,蚊帐,屏风,窗帘,清漆或涂料。

[0080] 在本发明的一种优选的实施方案中,消费品是电扩散器。在本发明的此实施方案中,节肢动物(优选昆虫)防治组合物中的该物质以一定量存在。

[0081] 一些上述消费品可能对物质成员来说是一种侵蚀性介质,因此可能需要保护其免于过早分解,例如通过包封或通过将其化学结合到另一种在受到合适的外部刺激,如酶、光、热或pH变化时适于释放本发明成分的化学物质。

[0082] 本发明将通过以下非限制性实施例进一步详细描述。

具体实施方式

[0083] 实施例

[0084] 1. 本文使用的实验方案和方法

[0085] 温体(Warm Body)测定法是一种小规模试验,用于筛选T0时3~15种浓度下对蚊子的驱避功效。

[0086] 埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)是一种用于防治测试的模式生物,也是世界卫生组织(WHO)推荐的模式生物之一,因为它是一种非常具有攻击性、嗜人血的蚊子物种,对节肢动物防治化合物的敏感性通常较低。冈比亚按蚊(*Anopheles gambiae*)也是一种模型生物,因为它具有亲人性并传播疟疾。

[0087] 使用 *Kröber* T, Bourquin M, Guerin PM, 2010. J Am Mosq Control Assoc. 26: 381-386中定义的温体试验(经调整)评估根据本发明的组合物的防治效果。在此体外试验中,测量了落在温体上的蚊子数量,模拟了用测试刺激物处理的有吸引力的宿主,以评估驱避效果。

[0088] 所公布的方案已被调整,因为从冈比亚按蚊切换到埃及伊蚊导致放置在测试笼中的蚊子数量减少,这是由于规模差异(即30只蚊子而不是50只),并且由于埃及伊蚊是昼夜蚊子而导致照明增加(即150勒克斯而不是4勒克斯)。

[0089] 双实验箱(Chamber)测定法是一种小规模试验,用于筛选某一浓度在0至40分钟之间对蚊子的空间驱避功效。

[0090] 该试验的目的是以较小的规模重现WHO(2013; ISBN 978 92 4150502 4)中描述的空间驱避验证测试。

[0091] 该试验包括一个覆盖着白纸的透明笼子(1200×755×700mm;约0.63m³)。笼子被

一个塑料纸壁分成两个大小相同的实验箱,纸壁中间有一个方形开口(200×200mm)。实验开始时,将大约40只两周龄的雌性埃及伊蚊放在右边的实验箱里。一旦蚊子在这个实验箱里安顿下来(>5分钟),就会打开两个实验箱之间的门。然后,刺激物通过放置在右侧有机玻璃(Plexiglas)壁中间的L形特氟隆管(40mm)引入到蚊子实验箱内。刺激物通过强制蒸发系统(Chappuis et al.,2015,DOI:10.1021/acs.est.5b00692)分配,速率为0.1mL/min,氮气流量为1L/min,与9L/min的湿空气流混合,然后被输送到L形特氟隆管。在两个实验箱(100mm Ø)之间的壁开口上方放置一个空气抽吸系统(约150L/min),防止未处理实验箱被刺激物污染并限制刺激物在经处理实验箱中的积聚。因此,未处理实验箱为逃离经处理实验箱种刺激物的蚊子提供了“避难所”。在开始注射刺激物10、20、30和40分钟后,已移动到未处理实验箱的蚊子数量进行手动计数。

[0092] 笼中手臂测试是一种大规模测试,用于评估人类志愿者对蚊子的驱避功效。

[0093] 笼中手臂方法改编自WHO《人体皮肤驱蚊剂功效测试指南》(WHO/CDS/NTD/WHOPES/2009.4)。通过将未经处理的手臂与经过处理的手臂插入笼子(40×40×40cm)中30秒(阴性对照)三次的结果进行比较,可以评估100只饥饿雌性埃及伊蚊对测试物质的准备程度,以确定探测活动。然后,将产品施用到人类志愿者的前臂皮肤上(1ml/600cm²),5分钟后,将该手臂插入笼中并暴露3分钟。该测定在温度(27±2℃)和湿度(80±10%RH)经过了调节的室中对三名不同的志愿者进行。

[0094] 温板测定法是一种小规模测试,用于筛选T0时不同浓度对蜱虫的驱避功效。

[0095] 评估了不同化合物对蓖子硬蜱(*Ixodes ricinus* L)的驱避功效,蓖子硬蜱可以传播细菌和病毒病原体。蓖子硬蜱是《欧洲生物制品法规指南》(Guidance on the European Biological Products Regulation) [Vol II, Efficacy-Assessment&Evaluation (Parts B +C), v.3.0, April 2018]中提到的推荐模型生物之一。对最后阶段的若虫进行了驱避功效的观察。

[0096] 使用Kröber T, Bourquin M, Guerin PM, 2013. Pestic. Biochem. Phys. 107 (2) : 160-168中定义的体外温板测定法的方案评估了驱避功效。

[0097] 2. 对节肢动物的阻止和空间驱避效果的结果

[0098] 温体测定法

[0099] 在覆盖温体的喷砂玻璃培养皿(28.3cm²)上,加入用乙醇稀释成不同浓度的100μL组合物。对每种刺激物计数落在温体上的蚊子数量,并以纯乙醇(溶剂)作为对照。

[0100] 所有测试的刺激物均引起驱避效果的明显增加,且与所用剂量增加相关(表1、表2和表3)。这确实证明了不同产品对蚊子行为的生物驱避效果。

[0101] 表1:用不同浓度的不同刺激物诱引埃及伊蚊落在温体上的驱避百分比。所测试的十种刺激物是3-(4-甲氧基苯基)-2-甲基丙醛(251)、3-(3-丙烷-2-基苯基)丁醛(1389)、3-[4-(2-甲氧基-2-丙基)苯基]丙醛(681)、3-[4-(2-甲氧基-2-丙基)-2-甲基苯基]丙醛(875)、3-(4-叔丁基苯基)丙醛(294)、3-[2-甲基-4-(2-甲基-2-丙基)苯基]丙醛(859)、3-[4-(2-羟基-2-甲基丙基)苯基]丙醛(867)。对每种刺激物评估了3至15种浓度,缺失数据点记为n.d.。仅使用溶剂(0mg/mL)时蚊子落身的平均次数为两分钟内63±12.6次落身。

[0102]

	0.0032 mg/mL	0.0071 mg/mL	0.016 mg/mL	0.0357 mg/mL	0.053 mg/mL	0.08 mg/mL	0.119 mg/mL	0.178 mg/mL	0.267 mg/mL	0.4 mg/mL	0.598 mg/mL	0.89 mg/mL	2 mg/mL	4.47 mg/mL	10 mg/mL
251	0%	0%	0%	61%	54%	40%	52%	71%	97%	79%	93%	99%	96%	97%	89%
1389	11%	n.d.	0%	8%	74%	53%	n.d.	30%	n.d.	81%	n.d.	88%	87%	84%	90%
681	0%	n.d.	0%	n.d.	n.d.	31%	n.d.	n.d.	n.d.	49%	n.d.	n.d.	89%	n.d.	92%
875	39%	n.d.	60%	n.d.	n.d.	24%	n.d.	n.d.	n.d.	81%	n.d.	n.d.	81%	n.d.	96%
294	n.d.	n.d.	57%	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	54%	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	96%
859	n.d.	n.d.	21%	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	65%	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	98%
867	n.d.	n.d.	13%	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	27%	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	81%

[0103] 如表1所示,尽管测量结果存在一些差异,但所有十种化合物均显示出由于浓度不同而导致的蚊子落身次数的相应减少。从剂量为0.0016%起,3-[4-(2-甲氧基-2-丙烷基)-2-甲基苯基]丙醛和3-(4-叔丁基苯基)丙醛成功地将蚊子落身次数减少了一半(表1)。在中间剂量0.04%时,3-(4-甲氧基苯基)-2-甲基丙醛、3-(3-丙烷-2-基苯基)丁醛和3-[4-(2-甲氧基-2-丙烷基)-2-甲基苯基]丙醛均能产生>75%的驱避效果(表1)。对于所有十种刺激物,在所有高于0.0598%的测试浓度时,驱避百分比均为>80%(表1)。因此,在所测试的最高剂量(即1%)下,每分钟落在诱饵引诱性刺激物上的蚊子数量从未超过5只,而未经处理时,每分钟落身的蚊子数量超过31只(表1)。

[0104] 表2.用不同浓度的不同刺激物诱引冈比亚按蚊落在温体上的驱避百分比。五种刺激物在两到五种浓度下进行了测试,n.d.表示没有数据。仅使用溶剂(0mg/mL)时蚊子落身的平均次数等于两分钟内 46 ± 5.7 次落身。

[0105]

	0.178 mg/mL	0.267 mg/mL	0.4 mg/mL	4.47 mg/mL	10 mg/mL
3-(4-叔丁基苯基)丙醛	42%	14%	55%	96%	96%
3-(3-丙烷-2-基苯基)丁醛	n.d.	n.d.	n.d.	58%	96%
3-(4-甲氧基苯基)-2-甲基丙醛	n.d.	n.d.	n.d.	100%	96%
3-[4-(2-甲氧基-2-丙基)-2-甲基苯基]丙醛	69%	66%	93%	97%	100%

[0106] 从最低测试浓度0.0178%起,3-[4-(2-甲氧基-2-丙烷基)-2-甲基苯基]丙醛可驱避>60%的蚊子(表2)。在0.447%的中间剂量下,四种刺激物中的三种,即3-(4-叔丁基苯基)丙醛、3-(4-甲氧基苯基)-2-甲基丙醛和3-[4-(2-甲氧基-2-丙烷基)-2-甲基苯基]丙醛可驱避>95%的蚊子(表2)。这些高度相关的结果在最高测试剂量(即1%)下得到证实,所有五种刺激物均达到>95%的驱避率(表2),这意味着使用处理组每分钟落身的蚊子不到4只,而对照组每分钟落身的蚊子为23只。

[0107] 表3:手臂用20%的3-(4-甲氧基苯基)-2-甲基丙醛处理后随时间推移的笼中手臂结果。每个时间点值代表三位不同的人类志愿者与未处理手臂相比的驱避百分比的平均值 $\pm$ SD。未处理手臂收到336到534只蚊子3分钟测试期间埃及伊蚊落身情况。

[0108]

	施用后的时间								
	5 分钟	1 小时	2 小时	3 小时	4 小时	5 小时	6 小时	7 小时	8 小时
3-(4-甲氧基苯基)-2-甲基丙醛	100% ±0%	99.84% ±0.1%	98.82% ±1.4%	95.59% ±4.5%	87.3% ±7.5%	81.02% ±8.2%	73.75% ±3.0%	65.56% ±1.4%	64.04% ±4.9%

[0109] 2对蜉蝣等节肢动物进行温板测定法的结果。

[0110] 表4. 在以四种不同浓度的刺激物作为引诱物的温板上,对蜉蝣子硬蜉的驱避百分比。

[0111]		0	0.08	0.4	2	10
		mg/mL	mg/mL	mg/mL	mg/mL	mg/mL
	3-[4-(2-甲氧基-2-丙基)苯基]丙醛	2.6%	0.0%	13.3%	92.3%	92.0%

[0112] 如表4所示,3-[4-(2-甲氧基-2-丙基)苯基]丙醛以剂量响应的方式驱避蜉蝣子硬蜉,在施加0.2%和1%的刺激物时,总驱避率达到大于90%。