(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7227127号
(P7227127)

(45)発行日　令和5年2月21日(2023.2.21)

(24)登録日　令和5年2月13日(2023.2.13)

(51)国際特許分類

Ａ０１Ｎ　37/04　(2006.01)		Ａ０１Ｎ	37/04
Ａ０１Ｐ　7/04　(2006.01)		Ａ０１Ｐ	7/04
Ａ０１Ｎ　37/38　(2006.01)		Ａ０１Ｎ	37/38
Ａ０１Ｎ　25/08　(2006.01)		Ａ０１Ｎ	25/08
Ａ０１Ｎ　37/06　(2006.01)		Ａ０１Ｎ	37/06

ＦＩ

請求項の数　17　（全64頁）

(21)出願番号　特願2019-511626(P2019-511626)
(86)(22)出願日　平成29年8月23日(2017.8.23)
(65)公表番号　特表2019-530653(P2019-530653A)
(43)公表日　令和1年10月24日(2019.10.24)
(86)国際出願番号　PCT/US2017/048293
(87)国際公開番号　WO2018/039393
(87)国際公開日　平成30年3月1日(2018.3.1)
審査請求日　令和2年8月24日(2020.8.24)
(31)優先権主張番号　62/378,541
(32)優先日　平成28年8月23日(2016.8.23)
(33)優先権主張国・地域又は機関
米国(US)

(73)特許権者　518018953
キットリッチ コーポレーション
ＫＩＴＴＲＩＣＨ ＣＯＲＰＯＲＡＴＩＯＮ
アメリカ合衆国 カリフォルニア州 ９１７６６ ポモナ ウェスト ミッション ブールヴァード １５８５
１５８５ Ｗ Ｍｉｓｓｉｏｎ Ｂｌｖｄ.
Ｐｏｍｏｎａ， ＣＡ ９１７６６ ＵＳＡ

(73)特許権者　591158276
アイオア・ステート・ユニバーシティー・リサーチ・ファンデーション・インコーポレーテッド
ＩＯＷＡ ＳＴＡＴＥ ＵＮＩＶＥＲＳＩＴＹ ＲＥＳＥＡＲＣＨ ＦＯＵＮＤＡＴ

最終頁に続く

(54)【発明の名称】　モノテルペノイド／フェニルプロパノイド含有化合物およびそれらの製造方法および殺虫餌（ｉｎｓｅｃｔｉｃｉｄａｌ ｂａｉｔ）としての使用

(57)【特許請求の範囲】

【請求項１】

担体または餌マトリックスと、有効量の式（Ｉ）：

【化１】

$$(R_1)_m - L$$

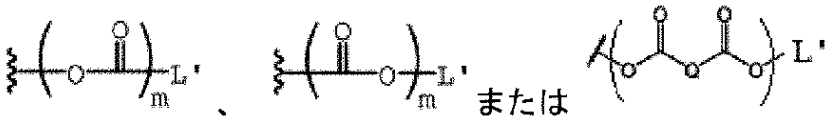
(I)

（式中、

R_1は、各々独立してフェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、

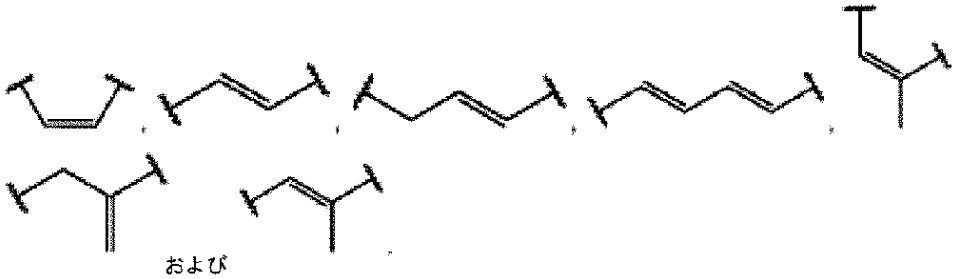
Ｌは、以下の構造を有するポリエステル含有連結部分であり、

【化２】

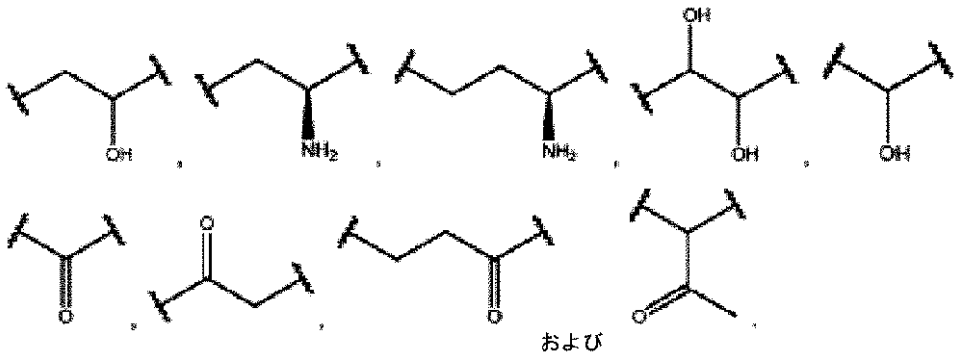


ここでR_1は、当該ポリエステル含有連結部分の一端に結合しており、Ｌ’は当該ポリエステル含有連結部分の他端に結合しており、

ここで、Ｌ’は、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のアルキルまたはシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、トリカルボン酸およびポリカルボン酸の部分からなる群から選択され、
ここで、ｍは２～６であり、
Ｑは、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のＣ$_0$～Ｃ$_4$アルキル、分岐状もしくは非分岐状のＣ$_0$～Ｃ$_4$ケトンおよび分岐状もしくは非分岐状のＣ$_0$～Ｃ$_4$アミンからなる群から選択される）
の化合物との殺虫餌製剤に対して昆虫または節足動物の害虫を曝露させる工程を備える昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法。
【請求項２】
請求項１に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｑが－（ＣＨ$_2$）$_n$－であり、ｎが０～４である、方法。
【請求項３】
請求項１に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｑが、
【化３】

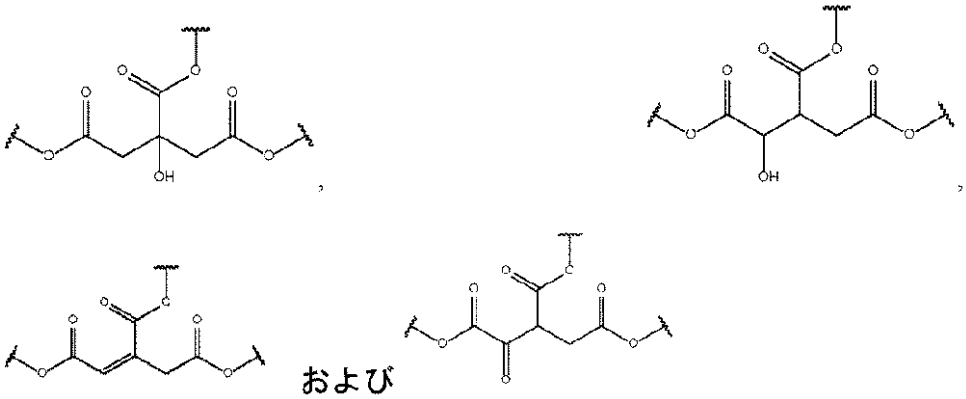


からなる群から選択される、方法。
【請求項４】
請求項１に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｑが、
【化４】



からなる群から選択される、方法。
【請求項５】
請求項１に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｌ’がトリカルボン酸部分であり、ｍが３である、方法。
【請求項６】
請求項５に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｌ’が、

【化５】



からなる群から選択されるトリカルボン酸部分である、方法。

【請求項７】

請求項１に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｌ’が、ポリカルボン酸部分であり、カルボン酸部分の数がｍより大きい数であり、それにより１つまたは複数のカルボン酸部分が非エステル化型である、方法。

【請求項８】

請求項７に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、非エステル化カルボン酸がプロトン化されているか、またはカルボン酸塩である、方法。

【請求項９】

請求項８に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、非エステル化カルボン酸が、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、鉄、亜鉛、銅またはアミン対イオンとのカルボン酸塩である、方法。

【請求項１０】

請求項９に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、非エステル化カルボン酸が、アンモニア、ジエチルアミン、トリエチルアミンおよびメチルアミンからなる群から選択されるアミンとのカルボン酸塩である、方法。

【請求項１１】

請求項７に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｌ’が、少なくとも４つのカルボン酸基を有するポリカルボン酸部分である、方法。

【請求項１２】

請求項７に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、ｍが４～６である、方法。

【請求項１３】

請求項１に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｌ’はポリカルボン酸部分であり、当該カルボン酸部分の数はｍの数よりも大きく、１つまたは複数のカルボン酸部分が非エステル化されており、当該非エステル化カルボン酸部分がカルボン酸塩である、方法。

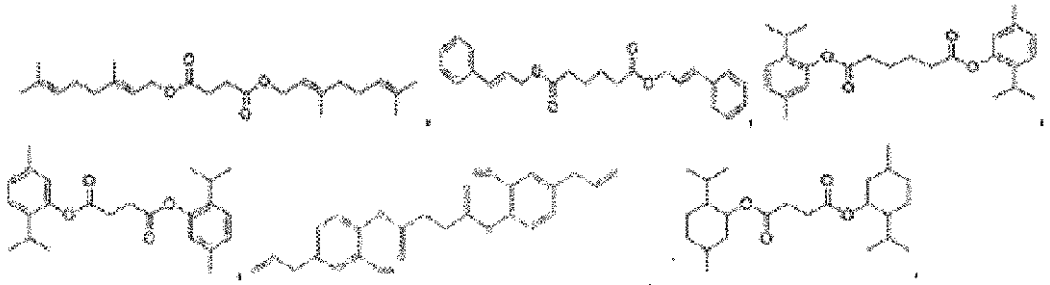
【請求項１４】

請求項１３に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、カルボン酸塩が、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、鉄、亜鉛、銅またはアミン対イオンである、方法。

【請求項１５】

請求項１に記載の通りの昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、当該化合物が、

【化６】



および

からなる群から選択される構造を有する、方法。

【請求項１６】

担体または餌マトリックスと、

エチレンジシトロネレート、エチレンジシンナメート、ヘキサシトロネリルイノシトール、トリシンナモイルグリセロール、ジシトロネリルヒドロキイノン、ヘキサシンナモイルイノシトール、オイゲニルオキシ酢酸、チミルオキシ酢酸、メチルオイゲニルオキシアセテート、ゲラニルチミルオキシアセテート、チミルチミルオキシアセテート、カルバクリルオイゲニルオキシアセテート、チミルシンナメート、チミルヒドロゲンスクシネート、シンナミルミリステート、アジピン酸ジシンナミル、ジオイゲニルスクシネート、ジゲラニルスクシネート、アジピン酸ジチミル、ジチミルスクシネート、ジメンチルスクシネート、トリシトロネロイルグリセロールおよび１，３－ジシトロネロイルグリセロールからなる群から選択される化合物と

を含む殺虫剤組成物。

【請求項１７】

担体または餌マトリックスと、

エチレンジシトロネレート、エチレンジシンナメート、ヘキサシトロネリルイノシトール、トリシンナモイルグリセロール、ジシトロネリルヒドロキイノン、ヘキサシンナモイルイノシトール、オイゲニルオキシ酢酸、チミルオキシ酢酸、メチルオイゲニルオキシアセテート、ゲラニルチミルオキシアセテート、チミルチミルオキシアセテート、カルバクリルオイゲニルオキシアセテート、チミルシンナメート、チミルヒドロゲンスクシネート、シンナミルミリステート、アジピン酸ジシンナミル、ジオイゲニルスクシネート、ジゲラニルスクシネート、アジピン酸ジチミル、ジチミルスクシネート、ジメンチルスクシネート、トリシトロネロイルグリセロールおよび１，３－ジシトロネロイルグリセロールからなる群から選択される有効量の殺虫性の化合物と

を含む殺虫餌製剤に暴露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【０００１】

関連出願の相互参照

[0001]本特許出願は、２０１６年８月２３日に出願の米国仮特許出願第６２／３７８，５４１号の優先権を主張する。上記の先行する仮特許出願の全開示内容、および該仮特許出願の優先権を主張する他のすべての並行して出願された非仮特許出願は、参照により本明細書に組み込む。

【０００２】

[0002]開示される実施形態は、モノテルペノイドおよび／またはフェニルプロパノイド部分を有する化合物、ならびにそれらの製造方法および使用に関する。

【背景技術】

【０００３】

[0003]多くの植物精油は、モノテルペンまたはモノテルペノイド化合物を含有し、それらのいくつかは殺虫性を有する。それらの効力は、従来の合成殺虫剤のそれよりも典型的

に低いが、充分な用量で害虫に送達されたとき、ほぼ同等の昆虫の死亡または制御をもたらす効果を発揮する。いくつかのモノテルペノイドは、防虫特性を有することが実証されている。

【０００４】

[0004]防虫物質としてのモノテルペノイドは、主にこれらの揮発性化合物の強烈な臭いのため、餌としては効果的でない。場合によっては、かかる化合物は揮発性であり、急速に生分解されやすく、それにより実質的に殺虫性のない残留物となる。残留物が生じないことは、多くの用途シナリオにおいて好ましい特徴であるが、ある特定の状況では、いくつかの持続的または徐放機構が、これらのモノテルペノイドをより有用なものとし、また新しい市場機会を開拓する。これらの新しい市場機会のいくつかの例としては、限定されないが、本願明細書において開示される化合物の、殺虫餌製剤としての、および将来の製品としての使用が挙げられる。

【０００５】

[0005]例えば、ビス－エステル、トリス－エステル、テトラキス－エステル、ペンタキス－エステルおよびヘキサキス－エステルなどの「複合」分子としての低揮発性エステルの例示的実施形態の開発は、殺虫性化合物の昆虫摂取、および昆虫の腸内におけるその後の殺虫性モノマーの代謝的放出を可能にした。

【０００６】

[0006]開示される実施形態は、従来技術における１つまたは複数の欠点を克服すると考えられる。

【発明の概要】

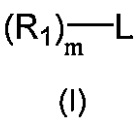
【課題を解決するための手段】

【０００７】

[0007]開示される実施形態の一態様は、式（Ｉ）：

【０００８】

【化１】



(I)

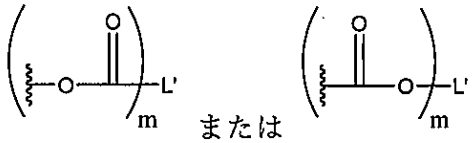
（式中、

R_1は、各々独立してフェニルプロペノイドまたはモノテルペノイド部分であり、

Ｌは、

【０００９】

【化２】



の構造を有するポリエステル含有連結部分であり、

Ｌ’は、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のアルキルまたはシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され、

ｍは、２～６である）

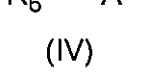
の化合物に関する。

【００１０】

[0008]開示される実施形態の別の態様は、式（ＩＶ）：

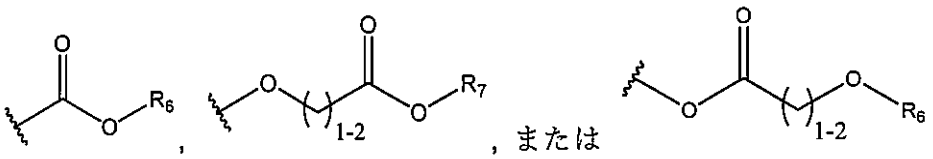
【００１１】

【化３】

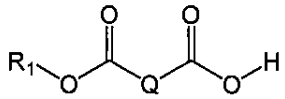


(IV)

（式中、
Ａは、－Ｏ－Ｒ７、
【００１２】
【化４】



であり、
Ｒ６は、フェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、
Ｒ７は、フェニルプロパノイドもしくはモノテルペノイド部分であるか、または、Ｈ、Ｍ、置換もしくは非置換のＣ３～Ｃ７非分岐状もしくは分岐状のアルキル、置換もしくは非置換のＣ２～Ｃ７非分岐状もしくは分岐状のアルケニル、置換もしくは非置換のＣ３～Ｃ７非分岐状もしくは分岐状のアルキニル、置換もしくは非置換のＣ３～Ｃ７非分岐状もしくは分岐状のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアリールおよび置換もしくは非置換のＣ３～Ｃ７非分岐状もしくは分岐状のシクロアルケニルからなる群から選択され、
Ｍは、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、鉄、亜鉛、銅およびアミンからなる群から選択される対イオンである）
の化合物に関する。
【００１３】
[0009]開示される実施形態のさらなる態様は、式（Ｖ）：
【００１４】
【化５】

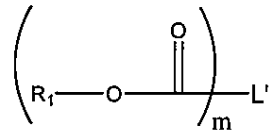


(V)

.

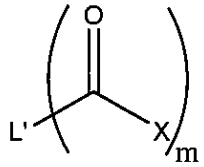
（式中、
Ｒ１は、フェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、
Ｑは、分岐状または非分岐状の飽和または不飽和のＣ０～Ｃ４アルキル、分岐状または非分岐状のＣ０～Ｃ４ケトンおよび分岐状または非分岐状のＣ０～Ｃ４アミンからなる群から選択される）
の化合物に関する。
【００１５】
[0010]開示される実施形態の別の態様は、式（ＩＩ）：
【００１６】

【化６】

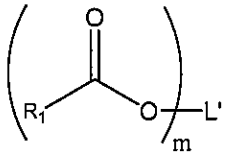


(II)

の構造を有する化合物を製造する方法に関する。この方法は、
R_1－ＯＨをＬ’－（ＣＯＯＨ）$_m$と、または
R_1－ＯＨを
【００１７】
【化７】

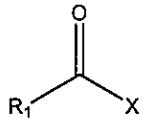


と、式（ＩＩ）の構造を有する化合物を形成するのに効果的な条件下で反応させることを含み、ここで、
R_1は、モノテルペノイドまたはフェニルプロペンノイド部分であり、
Ｌ’は、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のアルキルまたはシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され、
Ｘは、ハロゲンであり、
ｍは、２～６である。
【００１８】
[0011]開示される実施形態のさらなる態様は、以下の式（ＩＩＩ）：
【００１９】
【化８】



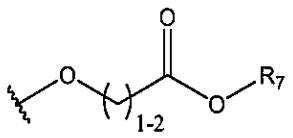
(III)

の構造を有する化合物を製造する方法に関する。
この方法は、
R_1－ＣＯＯＨをＬ’－（ＯＨ）$_m$と、または
【００２０】
【化９】



をＬ’－（ＯＨ）$_m$と、式（ＩＩＩ）の化合物を形成するのに効果的な条件下で反応させることを含み、ここで、
R_1は、各々独立してフェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、

Ｌ’は、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のアルキルまたはシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され、
Ｘは、ハロゲンであり、
ｍは、２～６である。
【００２１】
[0012]開示される実施形態のさらなる態様は、式（ＩＶ）の化合物であって、
Ａが
【００２２】
【化１０】



（式中、Ａ中の括弧内の炭素は１個であり、
R_7はＨである）
である化合物と、担体とを含む組成物に関する。
【００２３】
[0013]開示される実施形態の別の態様は、式（Ｉ）、（ＩＶ）または（Ｖ）の化合物と、担体とを含む殺虫剤組成物に関する。
【００２４】
[0014]さらに別の態様は、本願明細書において開示される殺虫性化合物を含む殺虫餌に関する。
【００２５】
[0015]開示される実施形態の別の態様は、昆虫を死滅させる方法に関する。この方法は、開示される殺虫剤組成物をある位置に提供して、昆虫などの無脊椎動物を誘引することを含む。その昆虫は、餌に誘引され、餌を消費し、その消費された殺虫剤組成物により死滅する。
【００２６】
[0016]開示される実施形態は、生物学的起源から得られるモノテルペノイドからの、種々な節足動物種に対する毒性餌製剤として提供される殺虫性化合物として使用するためのオリゴエステルの合成に関する。
【００２７】
[0017]例示の実施形態によれば、用いられる主なモノテルペノイドおよびフェニルプロパノイド分子は、シトロネル酸、桂皮酸、チモール、オイゲノール、ゲラニオール、メントールおよびカルバクロールである。ポリエステルは、モノテルペノイド酸またはモノテルペノイドアルコールまたはフェノールから直接に合成することができる。偽二量体および偽三量体は、エチレングリコール、プロピレングリコールまたはグリセロールを、シトロネル酸、桂皮酸またはゲラン酸でエステル化することにより合成されていた。２つのケイ皮酸、２つのシトロネル酸または２つのゲラン酸分子が、１つのグリコールによりエステル化されるとき（または、それらの３つがグリセロールによりエステル化されるとき）、得られたジエステル（トリエステル、ポリエステル）は、モノテルペノイド分子より非常に低い揮発性および高い安定性を有する。開示され、また開示される実施形態に従い合成される化合物の範囲には、逆エステルも含まれ、それは単純な有機ジカルボン酸（例えばシュウ酸、コハク酸、フマル酸、マレイン酸、アジピン酸）と、モノテルペノイドアルコールまたはフェノールの分子から設計された。例えば、アルコールとしては、シンナミルアルコール、リナロオール、ゲラニオール、メントールなどが含まれ、一方フェノールとしてはカルバクロール、チモールまたはオイゲノールが含まれうる。
【００２８】
[0018]本願明細書において開示されるある特定の例示的実施形態により、節足動物、例

えばハエ、ゴキブリおよび蚊などの昆虫による、摂取に対する天然モノテルペノイド殺虫剤の改善された餌受容が達成される。一実施形態では、これらの害虫による化合物の摂取により、昆虫の中腸においてエステルが加水分解され、個々のモノテルペノイド殺虫剤が放出され、その後に害虫に対する毒性がもたらされる。

【００２９】

[0019]例示的実施形態の成分部分はいずれも、天然物であるか、または天然物から誘導されたものであってもよく、そのいくつかは、米国環境保護庁のＥｘｅｍｐｔ Ｌｉｓｔ ２５ｂおよび／または米国食品医薬品局のＧｅｎｅｒａｌｌｙ Ｒｅｃｏｇｎｉｚｅｄ Ａｓ Ｓａｆｅ（ＧＲＡＳ）リストに含まれ、そこには、食品、風味剤、香味料および化粧品の産業において広く使用され、消費者の使用に安全であると考えられている油脂および化合物が含まれる。

【００３０】

[0020]例示的実施形態としては、ビス－、トリス－、テトラ－、ペンタ－およびヘキサキスエステルが挙げられるが、これらに限定されない。開示される実施形態は、少なくともイエバエ、チャバネゴキブリおよび蚊に対する餌として用いた際、毒性を示す。開示される１つまたは複数の化合物を用いて、殺虫餌とすることができる。

【図面の簡単な説明】

【００３１】

【図１】[0021]３週間連続で、３．７５重量％のエチレンジシトロネートを有する食餌を曝露したチャバネゴキブリの死虫率％を示すグラフである。エステル型モノテルペノイドを与えた群の死虫率％は、対照群と比較し、すべての時点で顕著により高い死虫率％を示した。

【図２】[0022]食餌の重量あたり３．７５重量％の化合物に曝露したチャバネゴキブリの、２週目における死虫率を示すグラフである。この食物中濃度では、多数の化合物が、対照（α＝０．０５）と比較し顕著な死虫率を示すことができた。

【図３】[0023]メーソンジャーへの導入後２週間における、１５重量％化合物／食物重量を含有する食餌に曝露したチャバネゴキブリの死虫率％を示すグラフである。この濃度でスクリーニングした１２種の化合物のうち、１０種の化合物において、対照と比較し統計的に有意な死虫率を生じることができた。

【００３２】

[0024]図３は、１５重量％化合物／食物重量を含んだ食餌を与えたチャバネゴキブリの死虫率％を示すグラフである。複数のモノテルペノイド誘導体は、試験アリーナへのゴキブリの導入後、様々な時点において、対照と比較し顕著な死虫率を生じることができた。

【図４】[0025]５重量％モノテルペノイド誘導体／食物重量を含有する食餌に曝露したイエバエの死虫率％を実証するグラフである。多数のテルペノイド誘導体により、対照処理（化合物なし）と比較し、５日目において顕著な死虫率が示された。

【図５】[0026]０．５％のＺ－９－トリコセン（Ｍｕｓｃａｌｕｒｅ（商標））と共に、ジシンナミルアジパート（モノテルペノイド誘導体）を５重量％化合物餌料重量を組み込んだ場合の、毒性の増大を実証するグラフである。Ｍｕｓｃａｌｕｒｅは、ハエの性フェロモンとして作用し、イエバエが餌に近づいて摂食する意志を顕著に増大する化合物である。アセトン対照（Ａｃｅｔｏｎｅ）においては、アセトンを塗布し、蒸発させた。

【図６】[0027]選択アッセイにおける、イエバエに対する様々な化合物の毒性を実証するグラフである。このアッセイには、処理食物および未処理食物の両方が含まれる。このアッセイは、これらの化合物の多くが、未処理の食物源の存在下で毒性も嗜好性も有することを実証するものである。

【図７】[0028]試験チャンバーへの導入後、２４時間間隔で、エマルジョンとして調製した、チミルオキシ酢酸（ｔｈｙｍｙｌｏｘｙａｃｅｔｉｃ ａｃｉｄ）および他の活性成分に曝露したイエバエの死虫率％を示すグラフである。チミルオキシ酢酸は、観察したすべての時点において、ホウ酸と同様に比較した。さらに、ホウ酸およびチミルオキシ酢酸の両方は、導入後１２０時間において、１００％の死虫率を生じることができた。このデ

ータは、スクロースおよび乳化剤を含有する液体製剤として提供したときに、イエバエに対する殺虫餌として選択された新規な生物学的物質の可能性を実証する。
【図８】[0029]試験チャンバーへの導入後、２４時間の間隔で、エマルジョンとして製剤化した、０．１％のチミルオキシ酢酸および他の活性成分に曝露したアカイエカの死虫率％を示すグラフである。チミルオキシ酢酸およびホウ酸を、６つの時点で比較した。この実験では、チミルオキシ酢酸は、導入後９６、１２０および１４４時間において、ホウ酸より高い死虫率％の値を生じた。このデータは、スクロースおよび乳化剤を含有する液体製剤として提供したときに、蚊の種に対する殺虫餌として選択された新規な生物学的物質の可能性を実証する。
【図９】[0030]０．１％の、様々な異なるハロゲン化された毒性餌化合物に曝露したアカイエカの死虫率％を示すグラフである。この実験は、これらの置換型分子もまた殺虫餌化合物として有効であることを実証する。
【発明を実施するための形態】
【００３３】
[0031]開示される実施形態は、モノテルペノイドおよび／またはフェニルプロパノイド部分を有する化合物、ならびにそれらの製造方法および使用方法に関する。具体的には、開示される実施形態は、生物学的供給源に由来するモノテルペノイドおよびフェニルプロパノイド化合物に関する。以下でさらに詳述するように、本明細書において開示される実施形態のモノテルペノイドおよびフェニルプロパノイド誘導体化合物は、殺虫餌などの殺有害生物剤としての使用に特に適する。
【００３４】
[0032]本開示の全体を通じて、明確化のため、以下の用語を提供する。
【００３５】
[0033]本明細書における用語「モノテルペノイド」は、モノテルペン様物質を指し、モノテルペノイド誘導体ならびにモノテルペノイド類似体を集合的に指すために用いる。モノテルペンとは、非直鎖状の分岐を有する炭素数１０の骨格を有する化合物を意味する。モノテルペンとは、技術的には、頭部および尾部で接続される様式で、２つのイソプレン単位を有する化合物を意味する。したがって、モノテルペノイドには、モノテルペン類、アルコール類、ケトン類、アルデヒド類、エステル類、エーテル類、酸類、酸素官能基のない炭化水素類などが含まれうる。ある特定のフェノール化合物（例えばオイゲノール、チモールおよびカルバクロール）は、それらの機能がモノテルペノイドと本質的に同様であるため、一般にモノテルペノイドと称される。しかしながら、それらは同じイソプレン生合成経路により合成されず、むしろチロシンからのフェノールにより生成するため、これらの化合物は技術的に「モノテルペノイド」（または「モノテルペン」）ではない。しかしながら、本明細書では一般的な慣行に従う。
【００３６】
[0034]用語「モノテルペノイドアルコール」は、天然に存在するいかなるモノテルペノイドまたはフェニルプロパノイドアルコールまたはフェノールを意味し、例えば、限定されないが、以下のものが含まれる：シトロネロール、リナロオール、ゲラニオール、ネロールおよびラバンジュロールを含む非環式不飽和モノテルペノイド、カルベオール、ピノカルベオール、ミルセノール、ミルテノール、α－テルピネオール、４－テルペニオール、ベルベノールおよびペリリルアルコールを含む単環式または二環式不飽和モノテルペノイド、メントール、フェンコール、ボルネオール、イソボルネオールおよびミルタノールを含む単環式または多環式飽和モノテルペノイド、チモール、カルバクロールまたは４－イソプロピル－３－メチルフェノールを含むイソプロピルクレゾール、いずれかの異性体ツヤプリシンなどのシクロヘプタトリエノロン、オイゲノール、イソオイゲノール、シンナミルアルコール、コニフェリルアルコール、ジンゲロン、ウンベリフェロン、クマリルアルコールおよびカビコールを含むフェニルプロパノイドアルコールまたはフェノール、または、バニリン、エチルバニリン、ピペロニルアルコールまたはシリングアルデヒドを含む、フェニルプロパノイドの天然の植物代謝により産生されるアルコールまたはフェノ

ール。
【００３７】
[0035]さらに、Ｏ－アルキル化およびＯ－アシル化モノテルペノイド、例えば、限定されないが、カルボン酸部分またはエステル部分を含有するエーテル化モノテルペノイド、ならびにカルボン酸部分を含有するモノテルペノイドのオリゴエステルは、本明細書においてモノテルペノイド誘導体と称される。
【００３８】
[0036]用語「フェニルプロパノイド」は、アミノ酸であるフェニルアラニンから植物により合成される様々なグループの有機化合物を意味する。それらの名称は、炭素数６の芳香族フェニル基、および桂皮酸の炭素３のプロペン尾部に由来し、それはフェニルプロパノイド生合成の第１の段階においてフェニルアラニンから合成される。フェニルプロパノイドは植物界全体にわたって見出され、それらは多くの構成的ポリマーの必須成分として機能し、紫外線からの保護をもたらし、草食動物および病原体に対する防御を行い、また花の色素および臭気化合物として、植物－花粉媒介昆虫間の相互作用を仲介する。
【００３９】
[0037]一実施形態によれば、開示される実施形態に係る化合物の、モノテルペノイドおよび／またはフェニルプロパノイド部分は、生物学的な供給源、例えば葉組織、茎組織、塊根組織またはそれらの混合物から得られる、植物性揮発性物質または植物精油の構成成分に由来する。
【００４０】
[0038]本明細書で用いる「アルキル」という用語は、直鎖状または分岐状であってもよい、脂肪族炭化水素基を意味する。特に断りのない限り、該用語は２～７個の炭素のアルキル基を指す。例示的なアルキル基としては、限定されないが、例えば、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ｎ－ブチル、ｔ－ブチル、ｎ－ペンチル、３－ペンチル基などが挙げられる。
【００４１】
[0039]用語「アルケニル」は、炭素－炭素間二重結合を含有する脂肪族炭化水素基を意味し、それは鎖中に炭素原子２～約７個の直鎖状または分岐鎖状の基であってもよい。非限定的な、例示的なアルケニル基のとしては、エテニル、プロペニル、ｎ－ブテニル、イソプレンおよびｉ－ブテニルが挙げられる。「アルケニル」の用語は、少なくとも１つの二重結合と少なくとも１つの三重結合とを含有する、炭素２～７個の炭化水素鎖を指す場合もある。
【００４２】
[0040]用語「アルキニル」は、炭素－炭素間三重結合を含有する脂肪族炭化水素基を意味し、それは鎖中に炭素原子約３～約７個の直鎖状または分岐鎖状の基であってもよい。非限定的な、例示的なアルキニル基としては、プロピニル、ｎ－ブチニル、２－ブチニル、３－メチルブチニル、プロパルギルおよびｎ－ペンチニルが挙げられる。
【００４３】
[0041]用語「シクロアルキル」は、非芳香族の、飽和または不飽和の、炭素原子約３～約７個の単環または多環式の環系を意味する。例示的なシクロアルキル基としては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルおよびシクロヘプチルが挙げられるが、これらに限定されない。
【００４４】
[0042]用語「シクロアルケニル」は、約３～約７個の炭素原子の、非芳香族の、不飽和の、単環または多環式の環系を意味する。例示的なシクロアルケニル基としては、シクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニルおよびシクロヘプテニルが挙げられるが、これらに限定されない。
【００４５】
[0043]用語「ヘテロアリール」は、約５～約１９個の環原子、または約５～約１０個の環原子を有する、芳香族の単環式または多環式の環系を意味し、該環系中の原子の１個ま

たは複数が、炭素以外の、例えば窒素、酸素または硫黄などの元素である。多環式の環系の場合、「ヘテロアリール」として定義される環系のためには、１つの環のみが芳香族であればよい。具体的には、ヘテロアリールは約５～６個の環原子を含有する。ヘテロアリールの前に接頭辞「アザ」、「オキサ」、「チア」または「チオ」が付されるときは、それぞれ、少なくとも１個の窒素、酸素または硫黄原子が環原子として存在することを意味する。ヘテロアリール環の窒素、炭素または硫黄原子は、任意に酸化されてもよく、窒素は、任意に四級化されてもよい。適切なヘテロアリールとしては、ピリジル、２－オキソ－ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、トリアジニル、フラニル、ピロリル、チオフェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、インドリル、イソインドリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、インドリニル、２－オキソインドリニル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロベンゾチオフェニル、インダゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾ［１，３］ジオキソリル、キノリニル、イソキノリニル、キナゾリニル、シンノリニル、フタラジニル、キノキサリニル、２，３－ジヒドロ－ベンゾ［１，４］ジオキシニル、ベンゾ［１，２，３］トリアジニル、ベンゾ［１，２，４］トリアジニル、４Ｈ－クロメニル、インドリジニル、キノリジニル、６ａＨ－チエノ［２，３－ｄ］イミダゾリル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｂ］フラニル、チエノ［２，３－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［２，３－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｄ］ピリミジニル、フロ［３，２－ｄ］ピリミジニル、チエノ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、５，６，７，８－テトラヒドロイミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、６，７－ジヒドロ－４Ｈ－ピラゾロ［５，１－ｃ］［１，４］オキサジニル、２－オキソ－２，３－ジヒドロベンゾ［ｄ］オキサゾリル、３，３－ジメチル－２－オキソインドリニル、２－オキソ－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、ベンゾ［ｃ］［１，２，５］オキサジアゾリル、ベンゾ［ｃ］［１，２，５］チアジアゾリル、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ベンゾ［ｂ］［１，４］オキサジニル、５，６，７，８－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピラジニル、３－オキソ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－２（３Ｈ）－イルなどが挙げられるが、これらに限定されない。

【００４６】

[0044]本明細書において使用する「単環式」という用語は、一個の環を有する分子構造を示す。

【００４７】

[0045]本明細書において使用する「多環式（ｐｏｌｙｃｙｃｌｉｃ）」または「多環式（ｍｕｌｔｉ－ｃｙｃｌｉｃ）」という用語は、限定されないが、２個以上の環が融合した、架橋された、またはスピロ構造を有する分子構造を示す。

【００４８】

[0046]本明細書で用いられる用語「ハロゲン」には、フッ素、臭素、塩素およびヨウ素が含まれるものとし、一方、用語「ハロゲン化物」には、フッ化物、臭化物、塩化物およびヨウ化物アニオンが含まれるものとする。

【００４９】

[0047]用語「置換された」をいうときは、具体的には、従来技術において一般的な１つまたは複数の置換が想定され、許容される。しかしながら、当該置換基が、化合物の有用な特徴に悪影響を及ぼさず、またはその機能を妨げないように選択されなければならないことは、当業者により一般的に理解されることである。例えば、適切な置換基としては、以下のものが挙げられうる：ハロゲン基、ペルフルオロアルキル基、パーフルオロアルコ

キシ群、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、ヒドロキシ基、オキソ基、メルカプト基、アルキルチオ基、アルコキシ基、アリールまたはヘテロアリール基、アリールオキシまたはヘテロアリールオキシ基、アラルキルまたはヘテロアラルキル基、アラルコキシまたはヘテロアラルコキシ基、アミノ基、アルキル－およびジアルキルアミノ基、カルバモイル基、アルキルカルボニル基、カルボキシル基、アルコキシカルボニル基、アルキルアミノカルボニル基、ジアルキルアミノカルボニル基、アリールカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、アルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、シクロアルキル基、シアノ基、Ｃ１～Ｃ６アルキルチオ基、アリールチオ基、ニトロ基、ケト基、アシル基、ボロナートまたはボロニル基、ホスフェートまたはホスホニル基、スルファニル基、スルホニル基、スルフィニル基、およびそれらの組合せ。置換した組合せ（例えば「置換アリールアルキル」）の場合、１つまたは複数の置換基により、アリールまたはアルキル基が置換される場合も、またはアリールおよびアルキル基の両方が置換される場合もある。さらに、場合によっては、当業者に公知の適切な置換基を組み合わせて１つまたは複数の環を形成させてもよい。

【００５０】

[0048]一実施形態によれば、化合物が置換されるということは、ある基が、基内の置換可能な原子において置換基を有してもよい（単一の原子上に複数の置換基を有することを含む）ことを意味するが、ただし、指定された原子の通常の価数を超えることはなく、また各置換基と他のものとの同一性は問わない。例えば、各残基内の最大３つの水素原子が、例えばアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシ、カルボアルコキシ（またアルコキシカルボニルと称される）、カルボキサミド（またアルキルアミノカルボニルとも称される）、シアノ、カルボニル、ニトロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、メルカプト、アルキルチオ、スルホキシド、スルホン、アシルアミノ、アミジノ、フェニル、ベンジル、ヘテロアリール、フェノキシ、ベンジルオキシまたはヘテロアリールオキシなどの置換基で置き換えられる。置換基がケト（すなわち＝Ｏ）である場合は、次いで、原子上の２つの水素が置き換えられる。置換基および／または変動基の組合せは、かかる組合せが安定な化合物をもたらす場合にのみ許容され、ここで「安定な化合物」とは、反応混合物の状態から適切な純度の状態にまで化合物を単離し、適切に使用できる薬剤にまで製剤化する際に、十分に堅牢で維持される化合物を意味する。

【００５１】

[0049]ある特定の実施態様によれば、化合物は非置換型である。「非置換の」原子は、それらの価数によって該当する個数の水素原子を担持する。

【００５２】

[0050]用語「化合物」およびそれと同等の表現は、本明細書において記載される化合物を包含することを意味する。また、文脈から許容される限り、化合物の塩、酸化物、溶媒和物（例えば水和物）および包接錯体、ならびにあらゆる立体異性体の形態、または任意の比率によるその化合物の任意のそのような形態の混合物も包含される。包接錯体は、Ｒｅｍｉｎｇｔｏｎ、Ｔｈｅ Ｓｃｉｅｎｃｅ ａｎｄ Ｐｒａｃｔｉｃｅ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｙ、第１９版 １：１７６～１７７ページ（１９９５）に記載され、参照によりその全体を本明細書に組み込む。最も一般的に用いられる包接錯体は、シクロデキストリンによるものであり、すべてのシクロデキストリン錯体は、天然物および合成物を問わず、本明細書に開示される化合物に具体的に包含される。

【００５３】

[0051]本明細書において記載される化合物は、１つまたは複数の不斉中心を含む場合があり、ゆえにエナンチオマー、ジアステレオマーおよび他の立体異性体を生じうる。各キラル中心は、（Ｒ）－または（Ｓ）－として、その絶対立体配置が定義されうる。これは、すべてのそのような可能な異性体が、それらのラセミ混合物、および光学的に純粋な形態で含まれることを意味する。光学的に活性な（Ｒ）－および（Ｓ）－、（－）－および（＋）－、または（Ｄ）－および（Ｌ）－異性体は、キラルシントンまたはキラル試薬を

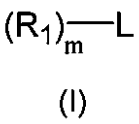
使用して調製することができ、または従来公知の技術を使用して分割することができる。本明細書において記載される化合物が、オレフィン二重結合、または他の幾何学的に非対称の中心を含有するとき、特に明記しない限り、該化合物がＥおよびＺ体の幾何異性体の両方をすることを意味するものとする。同様に、すべての互変異性型も含まれることを意味するものとする。

【００５４】

[0052]開示される実施形態の第１の態様は、式（Ｉ）：

【００５５】

【化１１】



(I)

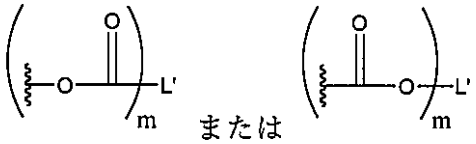
（式中、

R_1は、各々独立にフェニルプロペノイドまたはモノテルペノイド部分であり、

Ｌは、

【００５６】

【化１２】



の構造を有するポリエステル含有連結部分であり、

Ｌ’は、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のアルキルまたはシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され、

ｍは、２～６である）

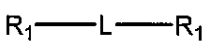
の化合物に関する。

【００５７】

[0053]当業者であれば、ｍが２である場合、式（Ｉ）の化合物は、以下の構造

【００５８】

【化１３】

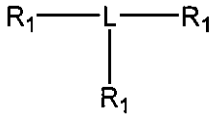


を有し、

ｍが３である場合、式（Ｉ）の化合物は、以下の構造

【００５９】

【化１４】



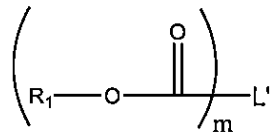
を有することを理解するであろう。

【００６０】

[0054]この態様の一実施形態によれば、化合物は、式（ＩＩ）：

【００６１】

【化１５】



(II)

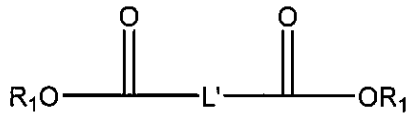
（式中、
R_1は、各々独立してフェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、
Ｌ’は、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のアルキルまたはシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され、
ｍは、２～６である）
の構造を有する。

【００６２】

[0055]当業者であれば、ｍが２である場合、式（ＩＩ）の化合物は、以下の構造

【００６３】

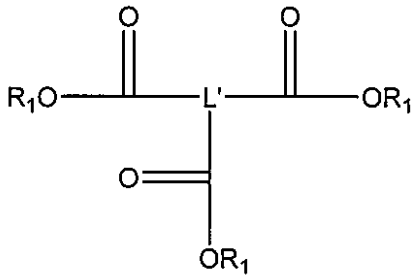
【化１６】



を有し、
ｍが３である場合、式（ＩＩ）の化合物は、以下の構造

【００６４】

【化１７】



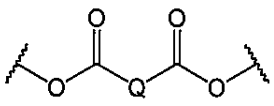
を有することを理解するであろう。

【００６５】

[0056]具体的実施形態では、Ｌ’は、それが結合しているエステルと一緒になって、

【００６６】

【化１８】



（式中、
Ｑは、分岐状または非分岐状の飽和または不飽和のC_0～C_4アルキル、分岐状または非分岐状のC_0～C_4ケトン、および分岐状または非分岐状のC_0～C_4アミンからなる群から選択される）
である。

【００６７】

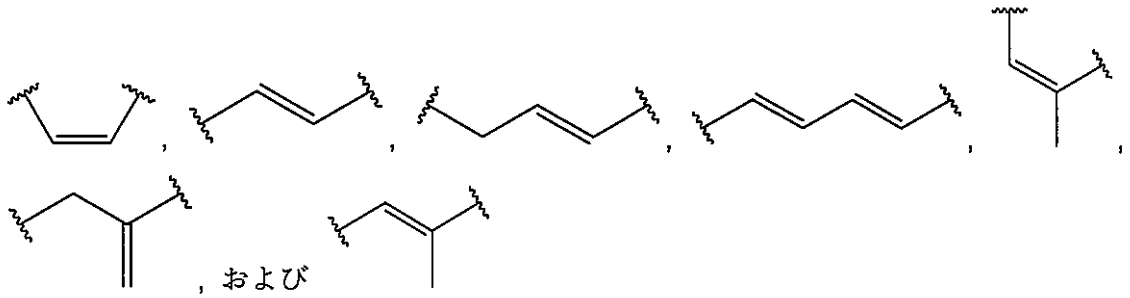
[0057]より具体的な実施形態では、Ｑは－（ＣＨ$_2$）$_n$－であり、ｎは０～４である。

【００６８】

[0058]さらに別の特定の実施態様において、Ｑは、

【００６９】

【化１９】



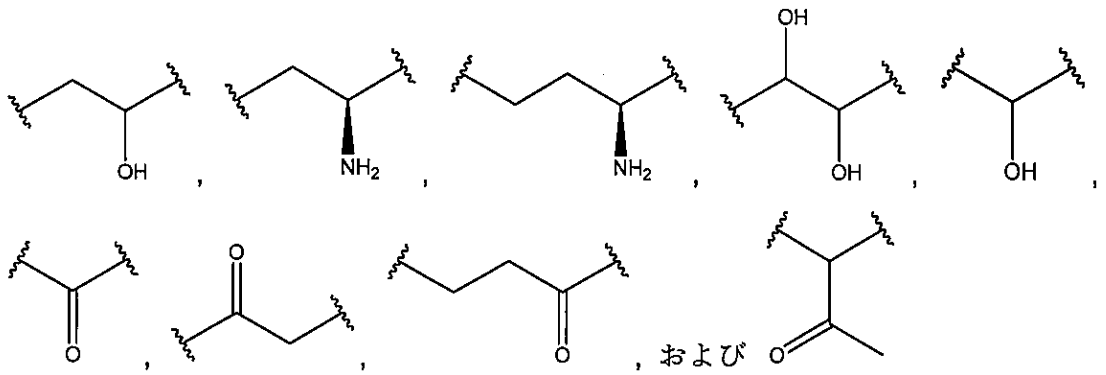
からなる群から選択される。

【００７０】

[0059]さらに別の具体的実施態様において、Ｑは、

【００７１】

【化２０】



からなる群から選択される。

【００７２】

[0060]式（ＩＩ）の化合物の一実施形態によれば、少なくとも１つのＲ$_1$は、フェニルプロパノイド部分である。

【００７３】

[0061]式（ＩＩ）の化合物の別の実施形態によれば、少なくとも１つのＲ$_1$は、モノテルペノイド部分である。

【００７４】

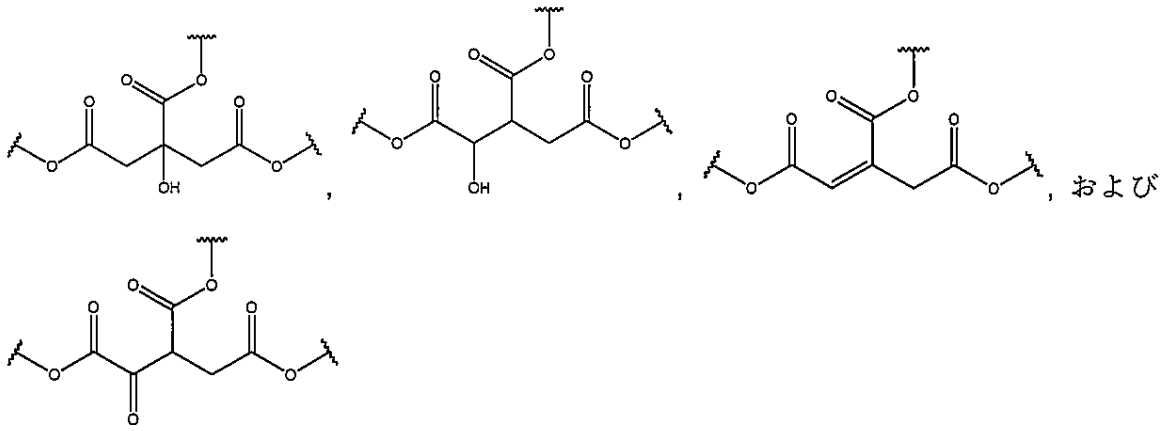
[0062]具体的な一実施形態では、Ｌ’はトリカルボン酸部分であり、ｍは３である。

【００７５】

[0063]別の具体的実施形態では、Ｌ’は、それが結合しているエステルと一緒になって、

【００７６】

【化２１】



からなる群から選択されるトリカルボン酸部分である。

【００７７】

[0064]式（ＩＩ）の化合物の一実施形態によると、Ｌ’は、それが結合しているエステルと一緒になって、ポリカルボン酸部分であり、カルボン酸部分の数は、ｍの数より大きく、それにより、１つまたは複数のカルボン酸部分は非エステル化型である。

【００７８】

[0065]具体的な一実施態様において、ｍは２であり、Ｌ’はトリカルボン酸部分であり、非エステル型のカルボン酸は、プロトン化されているか、またはカルボン酸塩である。適切な非エステル型のカルボン酸としては、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、鉄、亜鉛、銅またはアミン対イオンを有するカルボン酸塩が挙げられるが、これらに限定されない。非エステル型のカルボン酸は、アンモニア、ジエチルアミン、トリエチルアミンおよびメチルアミンからなる群から選択されるアミンを有するカルボン酸塩であってもよい。

【００７９】

[0066]別の具体的実施形態では、Ｌ’は、それが結合しているエステルと一緒になって、少なくとも４つのカルボン酸基を有するカルボン酸部分である。

【００８０】

[0067]さらに別の具体的実施形態では、ｍは４～６である。

【００８１】

[0068]一実施形態では、１つまたは複数の非エステル型のカルボン酸部分は、カルボン酸塩である。適切なカルボン酸塩としては、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、鉄、亜鉛、銅またはアミン対イオンが挙げられるが、これらに限定されない。

【００８２】

[0069]式（ＩＩ）の化合物の一実施形態では、ｍは４～６である。

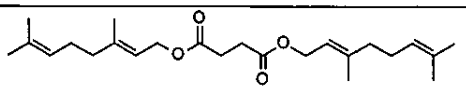
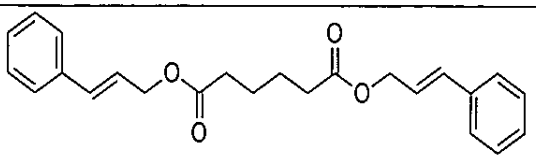
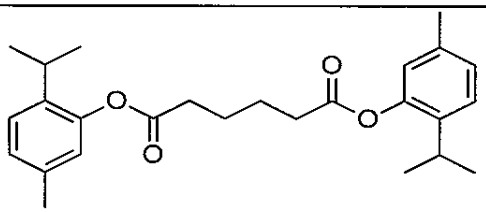
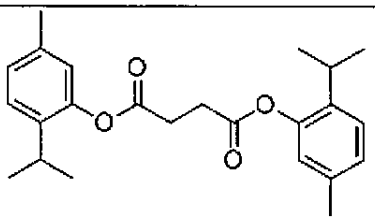
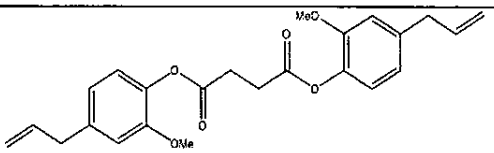
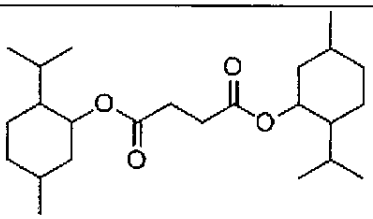
【００８３】

[0070]式（ＩＩ）の化合物としては、以下の表１に記載される具体的化合物が挙げられるが、これらに限定されない。

【００８４】

【表１】

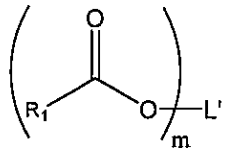
表１．式（ＩＩ）の例示的化合物

化合物名		化合物構造
2028	ジゲラニルスクシネート	
1029	ジシンナミルアジペート	
1031	ジチミルアジペート	
1049A	ジチミルスクシネート	
1051A	ジオイゲニルスクシネート	
1049B	ジメンチルスクシネート	

[0071]この態様の別の実施形態によれば、化合物は、式（ＩＩＩ）：

【００８５】

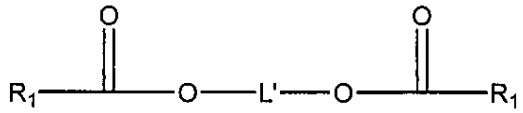
【化２２】



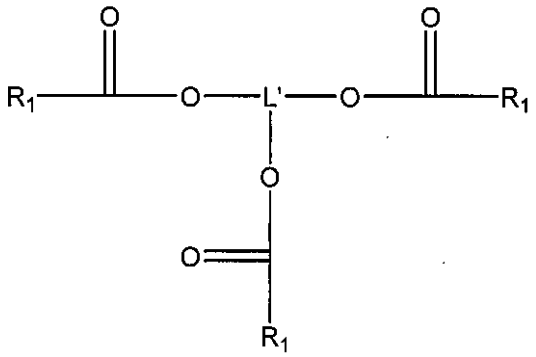
(III)

（式中、
R_1は、各々独立してフェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、
Ｌ’は、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のアルキルまたはシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され、
ｍは、２～６である）

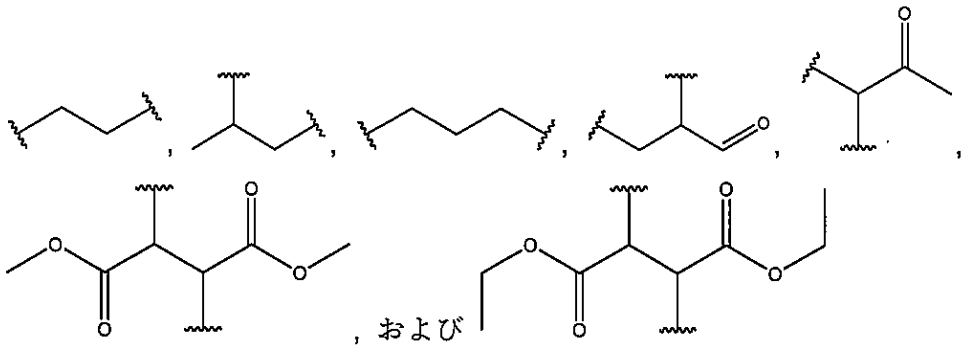
の構造を有する。
【００８６】
[0072]式（ＩＩＩ）の化合物の具体的実施形態では、ｍは２である。
【００８７】
[0073]当業者であれば、ｍが２である場合、式（ＩＩＩ）の化合物が
【００８８】
【化２３】



の構造を有し、
ｍが３である場合、式（ＩＩＩ）の化合物が
【００８９】
【化２４】



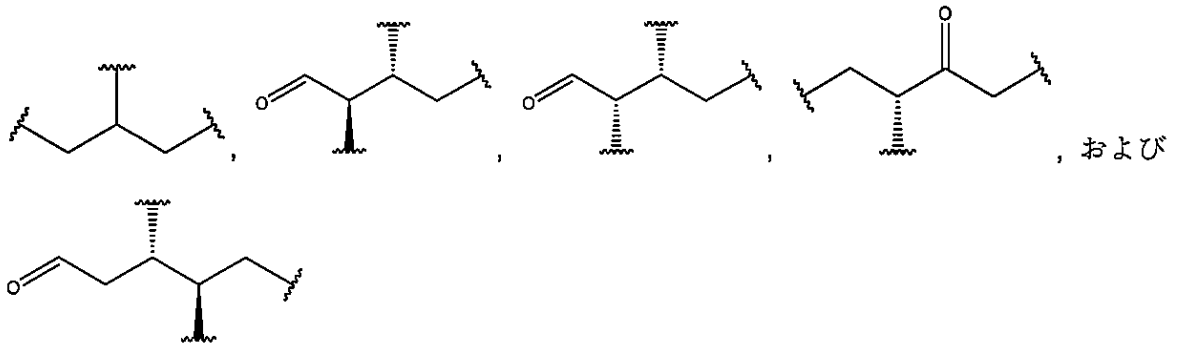
の構造を有することを理解するであろう。
【００９０】
[0074]式（ＩＩＩ）の化合物のより具体的な実施形態では、Ｌ’は、
【００９１】
【化２５】



，および

からなる群から選択される。
【００９２】
[0075]式（ＩＩＩ）の化合物の別の具体的実施形態では、ｍは３である。
【００９３】
[0076]より具体的な実施形態では、Ｌ’は、
【００９４】

【化２６】



からなる群から選択される。

【００９５】

[0077]式（ＩＩＩ）の化合物のさらに別の具体的実施形態では、Ｌ’は単糖部分であり、Ｒ１とエステルを形成する該単糖部分の２つ以上のヒドロキシル基は、Ｌ’の部分ではない。

【００９６】

[0078]より具体的な実施形態では、単糖部分は、アラビノース、リキソース、リボース、キシロース、リブロースおよびキシルロースからなる群から選択されるペントースである。

【００９７】

[0079]さらに別の具体的実施形態では、単糖部分は、アロース、アルトロース、グルコース、マンノース、グロース、タロース、イドース、ソルボース、フラクトース、プシコースおよびタガトースからなる群から選択されるヘキソースである。

【００９８】

[0080]式（ＩＩＩ）の化合物の別の具体的実施形態では、Ｌ’は二糖部分であり、Ｒ１とエステルを形成する二糖部分のヒドロキシル基は、Ｌ’の部分ではない。

【００９９】

[0081]より具体的な実施形態では、二糖部分は、スクロース、マルトースおよびラクトースからなる群から選択される。

【０１００】

[0082]式（ＩＩＩ）の化合物の具体的実施形態では、Ｌ’は糖アルコール部分であり、Ｒ１とエステルを形成する糖アルコール部分のヒドロキシル基は、Ｌ’の部分ではない。

【０１０１】

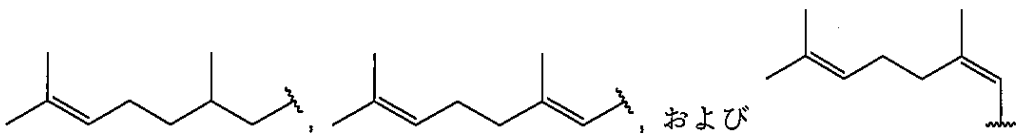
[0083]より具体的な実施形態では、糖アルコールは、ソルビトール、イノシトール、エリトリトール、リビトール、トレイトール、アラビトールおよびキシリトールからなる群から選択される。

【０１０２】

[0084]式（ＩＩＩ）の化合物の具体的実施形態では、少なくとも１つのＲ１は、

【０１０３】

【化２７】

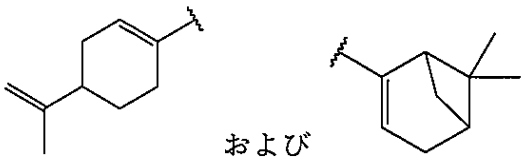


からなる群から選択される非環式モノテルペノイド部分である。

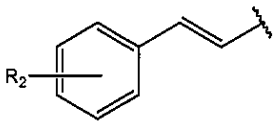
【０１０４】

[0085]式（ＩＩＩ）の化合物の具体的実施形態では、少なくとも１つのR_1は、

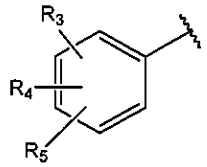
【０１０５】
【化２８】



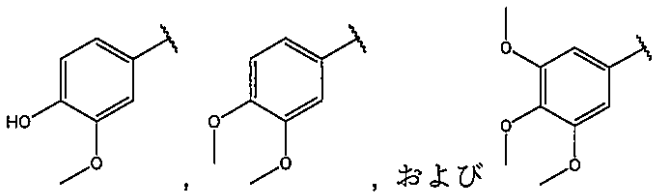
からなる群から選択される単環式または二環式モノテルペノイド部分である。
【０１０６】
[0086]式（ＩＩＩ）の化合物の具体的実施形態では、少なくとも１つのR_1は、以下の構造：
【０１０７】
【化２９】



（式中、R_2は、Ｈ、ＯＨ、ＯＭｅまたはＯＥｔである）を有する。
【０１０８】
[0087]式（ＩＩＩ）の化合物の具体的実施形態では、少なくとも１つのR_1は、以下の構造：
【０１０９】
【化３０】



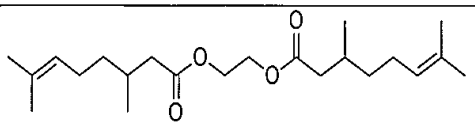
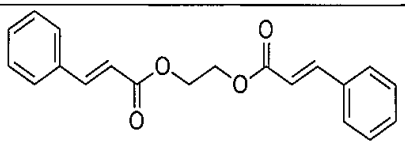
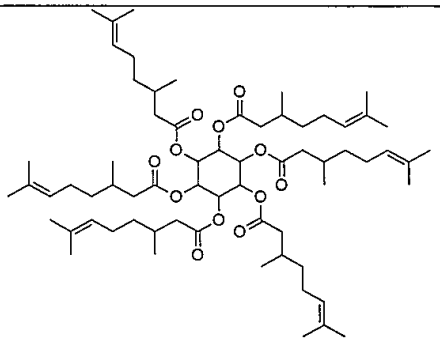
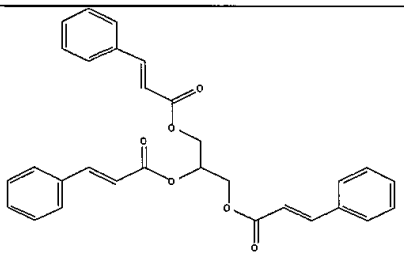
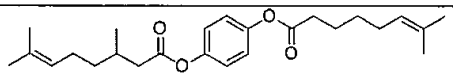
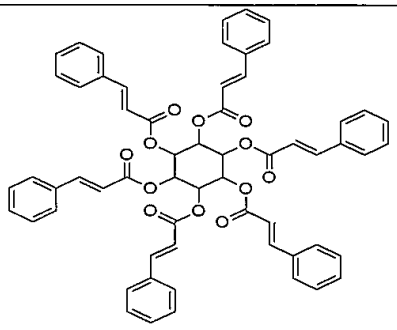
（式中、
R_3は、ＯＨ、ＯＭｅまたはＯＥｔであり、
R_4は、Ｈ、ＯＨまたはＯＭｅであり、
R_5は、Ｈ、ＯＨまたはＯＭｅである）を有する。
【０１１０】
[0088]より具体的な実施形態では、少なくとも１つのR_1は、
【０１１１】
【化３１】



からなる群から選択される。
【０１１２】
[0089]式（ＩＩＩ）の化合物の具体的化合物を以下の表２に記載するが、これらに限定されるものではない。

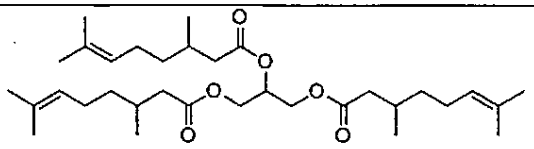
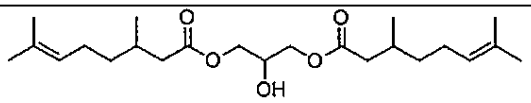
【０１１３】
【表２－１】

表２．式（ＩＩＩ）の例示的化合物

化合物名		化合物構造
1025	エチレンジシトロネレート	
1026	エチレンジシンナメート	
1027	ヘキサシトロネロイルイノシトール	
1032A	トリシンナモイルグリセロール	
1063A	ジシトロネロイルヒドロキノン	
1032B	ヘキサシンナモイルイノシトール	

【０１１４】

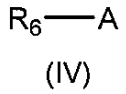
【表２－２】

化合物名	化合物構造
1044F1　トリシトロネロイルグリセロール	
1044F2　ジシトロネロイルグリセロール	

[0090]開示される実施形態の別の態様は、式（ＩＶ）：

【０１１５】

【化３２】



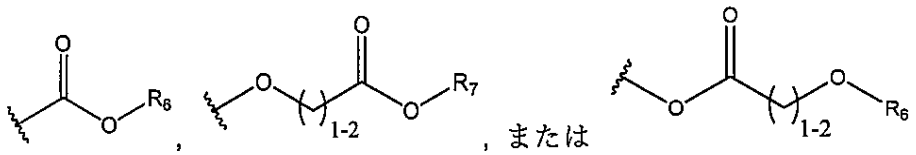
(IV)

（式中、

Ａは、－Ｏ－Ｒ$_7$、

【０１１６】

【化３３】



であり、

Ｒ$_6$は、フェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、

Ｒ$_7$は、フェニルプロパノイドもしくはモノテルペノイド部分、または、Ｈ、Ｍ、置換もしくは非置換のＣ$_3$～Ｃ$_7$非分岐状もしくは分岐状のアルキル、置換もしくは非置換のＣ$_2$～Ｃ$_7$非分岐状もしくは分岐状のアルケニル、置換もしくは非置換のＣ$_3$～Ｃ$_7$非分岐状もしくは分岐状のアルキニル、置換もしくは非置換のＣ$_3$～Ｃ$_7$非分岐状もしくは分岐状のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアリールおよび置換もしくは非置換のＣ$_3$～Ｃ$_7$非分岐状もしくは分岐状のシクロアルケニルからなる群から選択され、

Ｍは、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、鉄、亜鉛、銅およびアミンからなる群から選択される対イオンである）

の化合物に関する。

【０１１７】

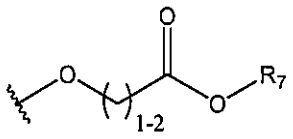
[0091]式（ＩＶ）の化合物の一実施形態では、Ｒ$_7$はＨである。

【０１１８】

[0092]式（ＩＶ）の化合物の別の実施形態では、Ａは

【０１１９】

【化３４】



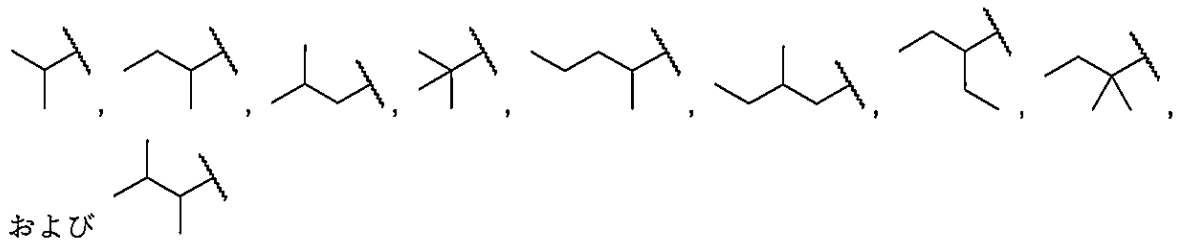
であり、括弧内の炭素は１であり、Ｒ$_7$はＨである。

【０１２０】

[0093]式（ＩＶ）の化合物のさらに別の実施態様では、Ｒ$_7$は、

【０１２１】

【化３５】



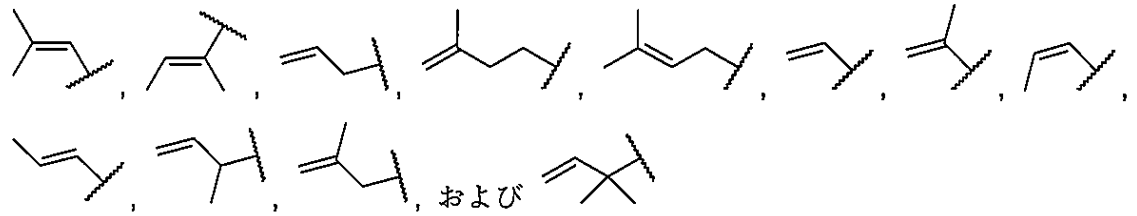
からなる群から選択されるＣ$_3$～Ｃ$_7$分岐アルキルである。

【０１２２】

[0094]式（ＩＶ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ$_7$は、

【０１２３】

【化３６】



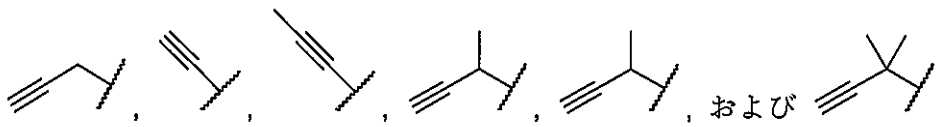
からなる群から選択されるＣ$_2$～Ｃ$_7$非分岐状または分岐状のアルケニルである。

【０１２４】

[0095]式（ＩＶ）の化合物の別の実施形態において、Ｒ$_7$は、

【０１２５】

【化３７】



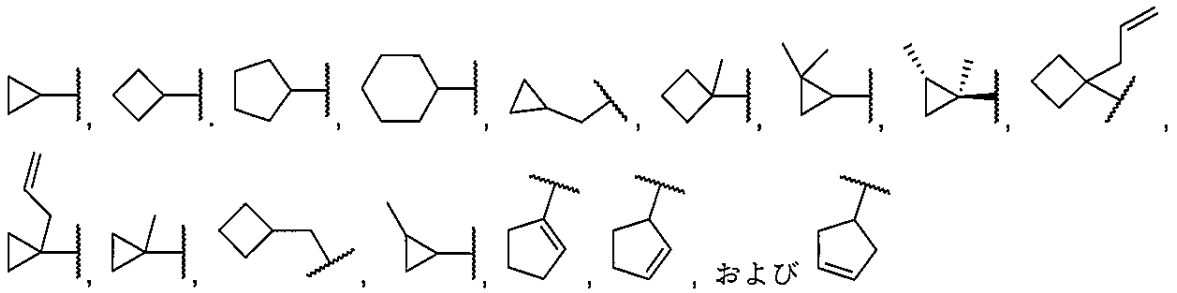
からなる群から選択されるＣ$_3$～Ｃ$_7$非分岐状もしくは分岐状のアルキニルである。

【０１２６】

[0096]式（ＩＶ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ$_7$は、

【０１２７】

【化３８】



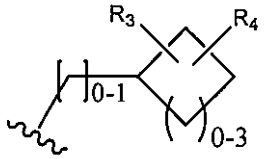
からなる群から選択されるＣ$_3$～Ｃ$_7$非分岐状または分岐状のシクロアルキルである。

【０１２８】

[0097]式（ＩＶ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ$_7$は、

【０１２９】

【化３９】



（式中、Ｒ$_3$およびＲ$_4$は、Ｈ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ビニル、アリルおよびプロパルギルからなる群から独立して選択される）

である。

【０１３０】

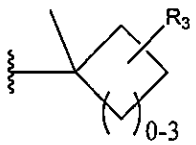
[0098]より具体的実施形態では、Ｒ$_3$およびＲ$_4$はいずれもＨである、Ｒ$_3$およびＲ$_4$はいずれもＣＨ$_3$である、Ｒ$_3$はＣＨ$_3$であり、Ｒ$_4$はＨである、または、Ｒ$_3$はアリルであり、Ｒ$_4$はＨである。

【０１３１】

[0099]式（ＩＶ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ$_7$は、

【０１３２】

【化４０】



（式中、Ｒ$_3$は、Ｈ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ビニル、アリルおよびプロパルギルからなる群から選択される）

である。

【０１３３】

[00100]式（ＩＶ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ$_6$はフェニルプロパノイド部分である。

【０１３４】

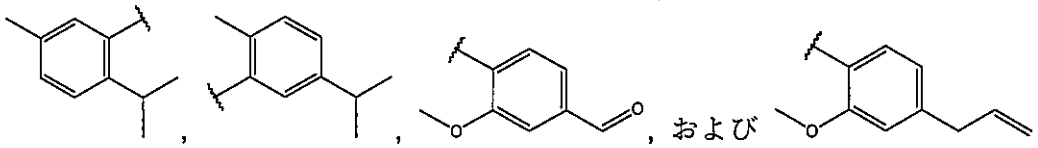
[00101]式（ＩＶ）の化合物のさらに別の実施態様において、Ｒ$_6$はモノテルペノイド部分である。

【０１３５】

[00102]より具体的な実施形態では、モノテルペノイド部分は、

【０１３６】

【化４１】



からなる群から選択される。

【０１３７】

[00103]式（ＩＶ）の化合物の別の実施形態では、R_7は、メチル、エチル、イソプロピル、プロピル、イソブチル、ブチルおよびｔｅｒｔ－ブチルからなる群から選択される。

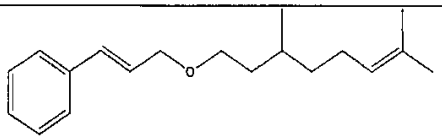
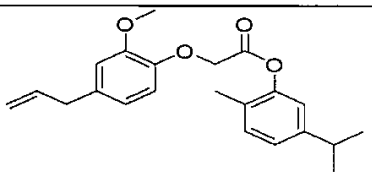
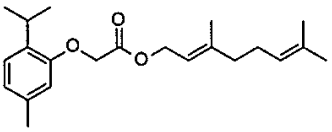
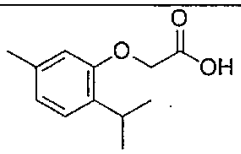
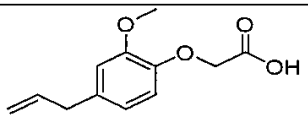
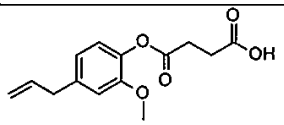
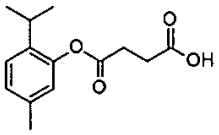
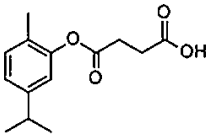
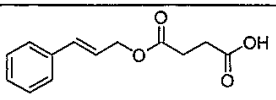
【０１３８】

[00104]式（ＩＶ）の化合物には、以下の表３に記載する具体的化合物が挙げられるが、これらに限定されるものではない。

【０１３９】

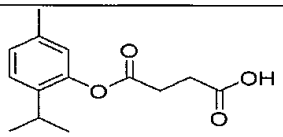
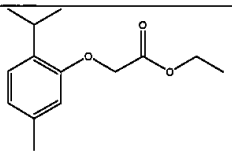
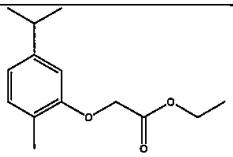
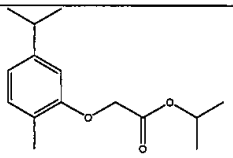
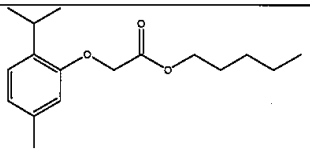
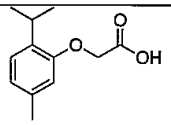
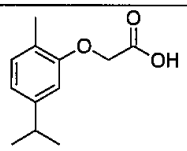
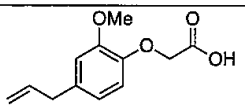
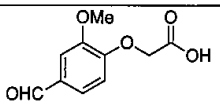
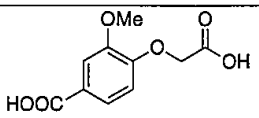
【表３－１】

表３．式（ＩＶ）の例示的化合物

化合物名		化合物構造
1087	シンナミルシトロネリルエーテル	
123B	カルバクロールオイゲニルオキシアセテート	
2016	ゲラニルチミルオキシアセテート	
106	チミルオキシ酢酸	
109	オイゲニルオキシ酢酸	
2284	オイゲニルヒドロゲンスクシネート	
2285	チミルヒドロゲンスクシネート	
2286	カルバクリルヒドロゲンスクシネート	
1097	シンナミルヒドロゲンスクシネート	

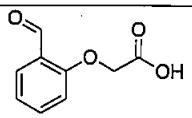
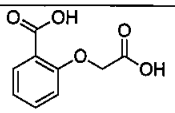
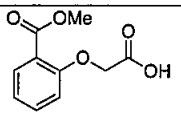
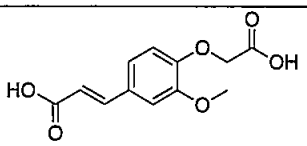
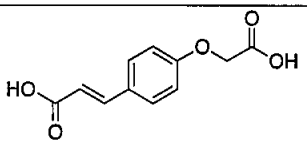
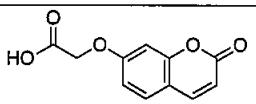
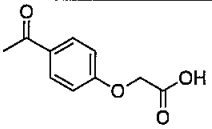
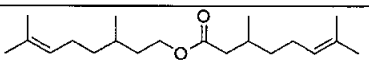
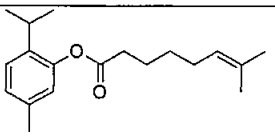
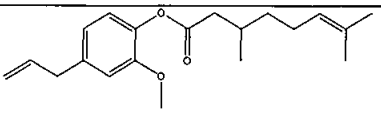
【０１４０】

【表３－２】

化合物名	化合物構造
1098B　チミルヒドロゲンスクシネート	
2283　エチルチミルオキシアセテート	
2283　エチルカルバクリルオキシアセテート	
2288A　イソプロピルカルバクリルオキシアセテート	
2289　アミルチミルオキシアセテート	
チミルオキシ酢酸（２－（２－イソプロピル－５－メチルフェノキシ）酢酸）	
カルバクリルオキシ酢酸（２－（５－イソプロピル－２－メチルフェノキシ）酢酸）	
オイゲニルオキシ酢酸（２－（４－アリル－２－メトキシフェノキシ）酢酸）	
バニリルオキシ酢酸（２－（４－フォルミル－２－メトキシフェノキシ）酢酸）	
カルボキシメチルバニリン酸（４－（カルボキシメトキシ）－３－メトキシ安息香酸）（バニリン酸由来）	

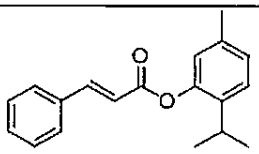
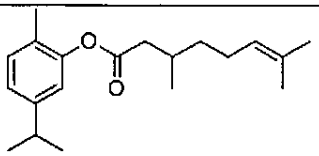
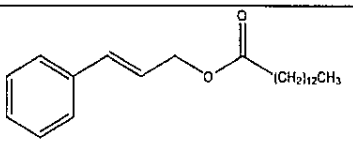
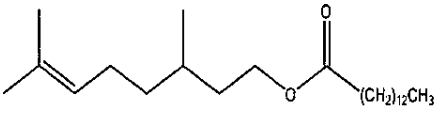
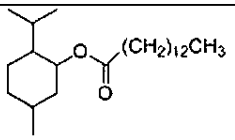
【０１４１】

【表３－３】

化合物名	化合物構造
サリチルオキシ酢酸（２－（２－ホリミルフェノキシ）酢酸）	
カルボキシメチルサリチル酸（２－（カルボキシメトキシ）安息香酸）（サリチル酸由来）	
２－（２－（メトキシカルボニル）フェノキシ）酢酸（サリチル酸メチル由来）	
３－（４－（カルボキシメトキシ）－３－メトキシフェニル）アクリル酸（フェルラ酸由来）	
３－（４－（カルボキシメトキシ）フェニル）アクリル酸（ｐ－クマル酸由来）	
クマリン－７－オキシ酢酸（２－（２－オキソ－２Ｈ－クロメン－７－イル）オキシ）酢酸）（ウンベリフェロン由来）	
２－（４－アセチルフェノキシ）酢酸（パイスオール／４’－ヒドロキシアセトフェノン由来）	
1055C　シトロネリルシトロネレート	
1053　ピペロニルシトロネレート	
1060A　チミルシトロネレート	
1062A　オイゲニルシトロネレート	

【０１４２】

【表３－４】

化合物名		化合物構造
1077A	チミルシンナメート	
1079B	カルバクリルシトロネレート	
1085A	シトロネリルミリステート	
1085B	シトロネリルミリステート	
1085C	メンチルミリステート	

[00105]一実施形態によれば、遊離カルボン酸を有する化合物（ＩＶ）は、各々エステル化される酸を有することができ、または該カルボン酸は、カルボン酸塩を形成させるために使用することもできる。

【０１４３】

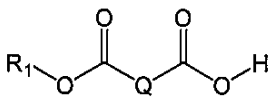
[00106]一実施形態では、式（ＩＶ）の化合物は、チミルオキシ酢酸、カルバクリルオキシ酢酸およびオイゲニルオキシ酢酸以外の、表３において同定された具体的構造を含む。

【０１４４】

[00107]開示される実施形態の別の態様は、式（Ｖ）：

【０１４５】

【化４２】



(V)

（式中、
R_1は、フェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、
Ｑは、分岐状または非分岐状の飽和または不飽和のC_0～C_4アルキル、分岐状または非分岐状のC_0～C_4ケトンおよび分岐状または非分岐状のC_0～C_4アミンからなる群から選択される）
の化合物に関する。

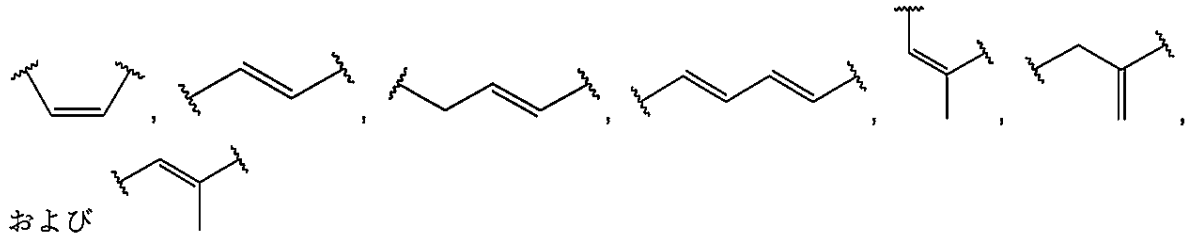
【０１４６】

[00108]一実施形態では、Ｑは－（CH_2）$_n$－であり、ｎは０～４である。

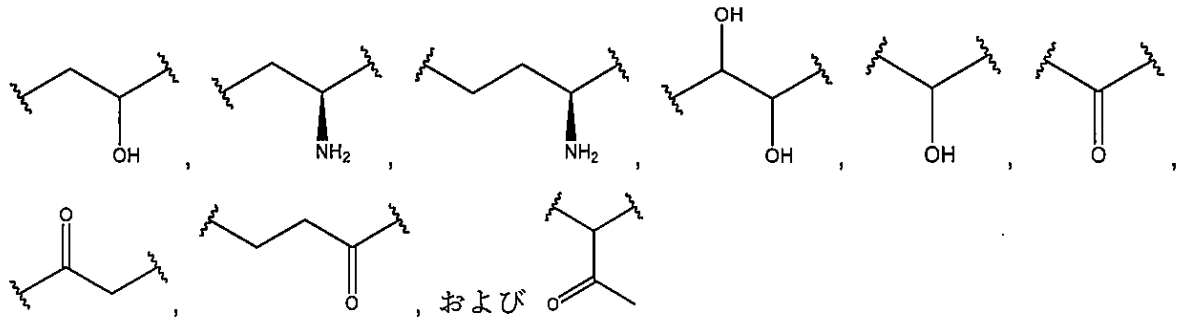
【０１４７】

[00109]別の実施形態では、Ｑは、

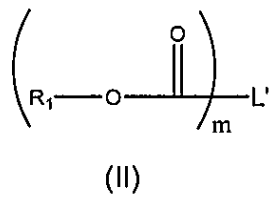
【０１４８】
【化４３】



からなる群から選択される。
【０１４９】
[00110]また別の実施形態では、Ｑは、
【０１５０】
【化４４】

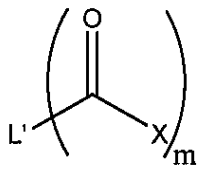


からなる群から選択される。
【０１５１】
[00111]開示される実施形態のさらなる態様は、以下の式（ＩＩ）：
【０１５２】
【化４５】



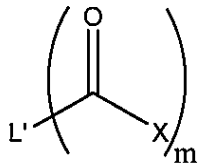
(II)

の構造を有する化合物の製造する方法に関する。
この方法は、Ｒ１－ＯＨとＬ’－（ＣＯＯＨ）mとを、または
Ｒ１－ＯＨと
【０１５３】
【化４６】

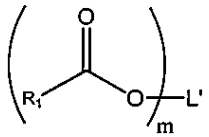


とを、式（ＩＩ）の構造を有する化合物を形成するのに効果的な条件下で反応させることを含み、ここで、

Ｒ１は、各々独立してモノテルペノイドまたはフェニルプロペノイド部分であり、
Ｌ’は、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のアルキルまたはシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され、
Ｘは、ハロゲンであり、
ｍは、２～６である。
【０１５４】
[00112]一実施形態では、この方法は、２当量以上のＲ１－ＯＨと、Ｌ’－（ＣＯＯＨ）ｍまたは２当量以上の
【０１５５】
【化４７】

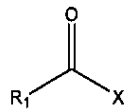


とを、式（ＩＩ）の構造を有する化合物を形成するのに効果的な条件下で反応させることを含む。
【０１５６】
[00113]開示される実施形態の別の態様は、式（ＩＩＩ）：
【０１５７】
【化４８】

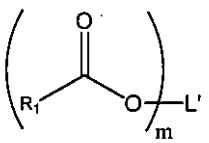


(III)

の構造を有する化合物の製造する方法に関する。
この方法は、Ｒ１－ＣＯＯＨとＬ’－（ＯＨ）ｍとを、または
【０１５８】
【化４９】

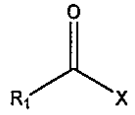


とＬ’－（ＯＨ）ｍとを、
【０１５９】
【化５０】

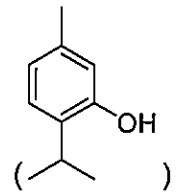


の構造を有する化合物を形成するのに効果的な条件下で反応させることを含み、
ここで、
Ｒ１は、各々独立してフェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、
Ｌ’は、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のアルキルまたはシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され、

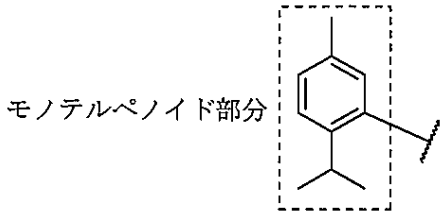
mは、２～６である。
【０１６０】
[00114]一実施形態では、この方法は、２当量以上のＲ$_1$－ＣＯＯＨとＬ’－（ＯＨ）$_m$とを、または２当量以上の
【０１６１】
【化５１】



とＬ’－（ＯＨ）$_m$とを、式（ＩＩＩ）の構造を有する化合物を形成するのに効果的な条件下で反応させることを含む。
【０１６２】
[00115]上記のように、ある特定の例示的化合物は、生物学的な供給源、例えば植物揮発性物質、葉組織、茎組織、塊根組織またはそれらの混合物などから得られる植物精油の構成成分などから誘導できる。
【０１６３】
[00116]別の実施形態では、より高い分子量、より高い極性または低い揮発性の物質を得るための合成に使用されるモノテルペノイドは、合成供給源から得られる。
【０１６４】
[00117]上記のように、ある特定の化合物は、モノテルペノイドまたはフェニルプロパノイドの誘導体である。非限定的な例として、本開示に係る化合物は、アルコール含有モノテルペノイドまたはフェニルプロパノイド（例えばチモールなど）
【０１６５】
【化５２】



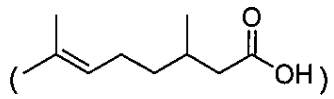
の誘導体であってもよい。
例示的な一実施形態では、チモール誘導体は以下の構造
【０１６６】
【化５３】



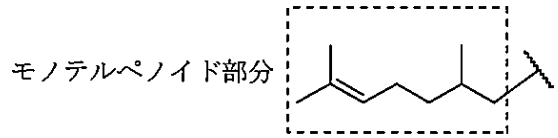
[00118]（式中、チモールの炭素数１０の骨格はモノテルペノイドまたはモノテルペノイド部分を構成し（例えば式（Ｉ）のＲ$_1$）、波線
【０１６７】
【化５４】



は残りの分子（例えば式（Ｉ）のＬ）との連結を表す）
を有する。
【０１６８】
[00119]別の非限定的な例として、化合物は、カルボン酸含有モノテルペノイドまたはフェニルプロパノイド（例えばシトロネル酸）の誘導体であってもよい。
【０１６９】
【化５５】



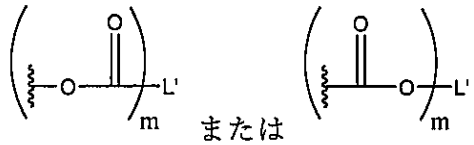
別の例示的実施形態では、シトロネル酸誘導体は、
【０１７０】
【化５６】



（式中、シトロネル酸の炭素数９の骨格（カルボン酸の炭素を除く）はモノテルペノイドまたはモノテルペノイド部分を構成し、波線
【０１７１】
【化５７】



は残りの分子（例えば式（Ｉ）のＬ）との連結を表す）の構造を有する。したがって、エステルの方向（すなわちＬは
【０１７２】
【化５８】

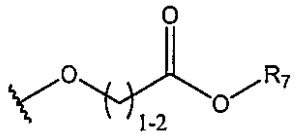


である）は、本明細書において使用するモノテルペノイドまたはフェニルプロパノイド前駆体（例えばチモールまたはシトロネル酸である）によって指示される。
【０１７３】
[00120]したがって、例示的化合物は、モノテルペノイドアルコール（すなわちヒドロキシル基含有モノテルペノイド）から、またはモノテルペノイドカルボン酸（すなわちカルボン酸含有モノテルペノイド）から誘導されうる。あるいは、化合物は、フェニルプロパノイドアルコール（すなわちヒドロキシル基含有フェニルプロパノイド）から、またはフェニルプロパノイドカルボン酸（すなわちカルボン酸含有フェニルプロパノイド）から誘導されうる。
【０１７４】
[00121]開示される実施形態のさらなる態様は、式（ＩＶ）の化合物と、担体とを含む殺虫性組成物に関する。一実施形態では、組成物は、式（ＩＶ）の化合物のサブセクトと、担体とを含む。例えば、限定されないが、組成物は式（ＩＶ）の化合物を含み、式中、

Ａは

【０１７５】

【化５９】



であり、括弧内の炭素は１であり、Ｒ$_7$はＨである。

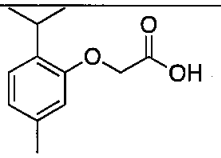
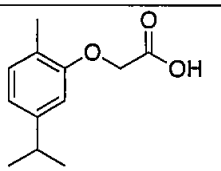
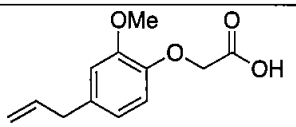
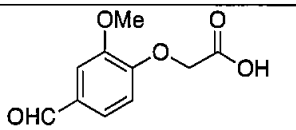
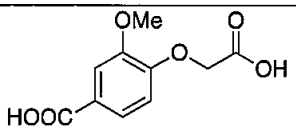
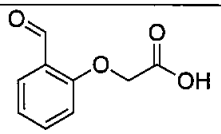
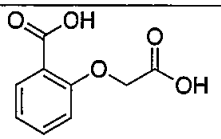
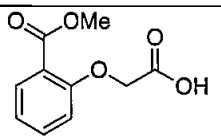
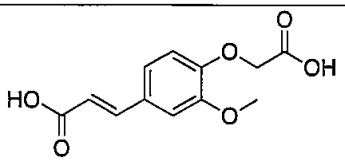
【０１７６】

[00122]より具体的な実施形態では、殺虫餌組成物において有用な化合物としては、表４に記載される例示的化合物のうちの任意の１つまたは複数が挙げられるが、これらに限定されない。

【０１７７】

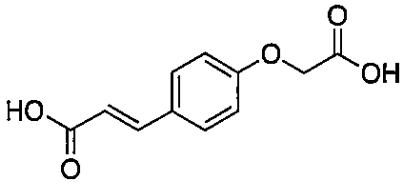
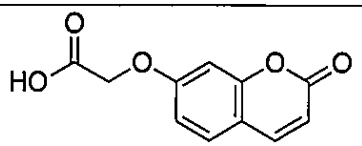
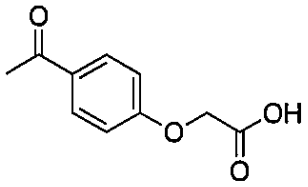
【表４－１】

表４．殺虫性化合物

化合物名	化合物構造
チミルオキシ酢酸（２－（２－イソプロピル－５－メチルフェノキシ）酢酸）	
カルバクリルオキシ酢酸（２－（５－イソプロピル－２－メチルフェノキシ）酢酸）	
オイゲニルオキシ酢酸（２－（４－アリル－２－メトキシフェノキシ）酢酸）	
バニリルオキシ酢酸（２－（４－フォルミル－２－メトキシフェノキシ）酢酸）	
カルボキシメチルバニリン酸（４－（カルボキシメトキシ）－３－メトキシ安息香酸）（バニリン酸由来）	
サリチルオキシ酢酸（２－（２－ホルミルフェノキシ）酢酸）	
カルボキシメチルサリチル酸（２－（カルボキシメトキシ）安息香酸）（サリチル酸由来）	
２－（２－（カルボメトキシル）フェノキシ）酢酸（サリチル酸メチル由来）	
３－（４－（カルボキシメトキシ）－３－メトキシフェニル）アクリル酸（フェルラ酸由来）	

【０１７８】

【表４－２】

化合物名	化合物構造
３－（４－（カルボキシメトキシ）フェニル）アクリル酸（ｐ－クマル酸由来）	
クマリン－７－オキシ酢酸（２－（２－オキソ－２Ｈ－クロメン－７－イル）オキシ）酢酸）（ウンベリフェロン由来）	
２－（４－アセチルフェノキシ）酢酸（パイスオール／４’－ヒドロキシアセトフェノン由来）	

[00123]表４において同定された化合物は、遊離カルボン酸として示す。しかしながら、各酸はエステル化することができ、またはカルボン酸塩の形成に使用することができる。

【０１７９】

[00124]具体的実施形態では、適切なエステルとしては、限定されないが、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、ｓｅｃ－ブチル、ｔｅｒｔ－ブチル、アミルエステルが挙げられる。

【０１８０】

[00125]別の具体的実施形態では、適切なカルボン酸塩としては、限定されないが、ナトリウム、カリウム、カルシウムおよびマグネシウムを含む金属塩が挙げられる。

【０１８１】

[00126]さらに別の具体的実施形態では、表４において同定された化合物のうち適切なものは二酸であり、ジエステルおよび二価のアニオン塩が含まれる。

【０１８２】

[00127]開示される実施形態の別の態様は、式（Ｉ）、（ＩＶ）または（Ｖ）の化合物と、担体とを含む殺虫剤組成物に関する。

【０１８３】

[00128]さらに別の態様は、例示的実施形態に係る殺虫性化合物および／または組成物を含む殺虫餌に関する。

【０１８４】

[00129]開示される実施形態の別の態様は、昆虫を死滅させる方法に関する。この方法は、殺虫剤組成物をある位置に提供して昆虫を誘引することを含む。昆虫が、餌に誘引され、餌を消費し、消費された殺虫剤組成物によって死滅する。

【０１８５】

[00130]多くのモノテルペノイドは、昆虫に対して局所適用した場合、注入した場合、または昆虫が接触する表面に塗布した場合に毒性であることが確認されている。残念なことに、これらの化合物の多くは忌避性が非常に高く、誘引性の餌に含有させることができない。これらの比較的揮発性の高い化合物を、合成化学プロセスにより分子量または極性を増加させてこれらの分子を低揮発性とすることにより、これらの化合物の忌避性を低下させ、各種の害虫昆虫による摂取を促進することができる。摂取された後、これらの化合物（一実施形態では、エステル結合を加水分解したもの）は毒性である。これらの化合物は、現在市販されている、主に合成殺虫剤を含有する多くの毒性餌製剤に対する生物学的

代替物となる。

【０１８６】

[00131]開示される実施形態に係るモノテルペノイド誘導体化合物は、増加した分子量、より高い極性を有し、または、市販の天然物由来／合成された、実験室試験で各種の昆虫用食餌と組み合わせたときに殺虫性を示すことが実証されているモノテルペノイド化合物よりも、揮発性が減少している。これらの新規なモノテルペノイド誘導体化合物は、製剤化された誘引性餌として提示される場合、または毒性食物代替物として提示される場合、昆虫害虫を効果的に死滅させることができる。

【０１８７】

[00132]これらの誘引性の毒性餌製剤は、問題となっている昆虫害虫に関係する、様々な住居および商業施設の環境中、例えば、限定されないが、居住、住家、レストラン、業務用ビルディング、温室、ガレージ、穀物貯蔵庫、バラック、農場、納屋、ならびに、昆虫害虫が害虫集団を防除するための毒性誘引性餌を摂食すると考えられる他の場所および条件において存在する昆虫に対して給餌されうる。

【０１８８】

[00133]一実施形態において、組成物は、適切な餌中に組み込まれる殺虫性化合物を含む。本明細書において用語「担体」とは餌を含むものとする。

【０１８９】

[00134]本明細書において、用語「餌」は、任意の生理的機構によって殺虫剤組成物を摂取させるために、昆虫を誘引し、誘導し、強要し、またはそれ以外の作用を発揮する、あらゆる物質のことを意味する。したがって、味覚、嗅覚、視覚または触感の感覚に訴えかけて殺虫剤組成物を摂食するよう昆虫を誘引し、誘導し、強要し、またはそれ以外の作用を発揮するいかなる物質も、殺虫剤組成物の意味および意図の範囲内である。これは、昆虫害虫が摂食を奨励されるマトリックス中に殺虫性化合物を組み込むことを含む。さらに、これらの化合物は、嗜好性が高い化合物を表し、また昆虫に対してそのまま提供できるものである。これは、餌としても機能する。

【０１９０】

[00135]適切な餌としては、限定されないが、アルファルファミール、牛脂肪、血粉、ベーコン、牛肉ブイヨン、コーンミール、カゼイン、トウモロコシ、綿実ミール、チキンフィード、ドッグフード、乾燥リンゴ、卵、魚粉、小麦粉、蜂蜜、肉、オート麦、ピーナッツ、ピーナッツバター、ピーナッツミール、レーズン、ソーセージ、おがくず、砂糖、ダイズミール、タンクかす、小麦、ふすま、ホエイ、キャトルフィード、パン、クラッカー、Ｓｔ．Ｊｏｈｎブレッド、チョコレート、犬用ビスケット、包装した家庭廃棄物、穀物、シード、バター、ベーコンドリッピング、コーン油、ソフトドリンク用シロップ、綿実油、ラード、チョコレートシロップ、モラセス、シュガーシロップ、落花生油、植物性油、トウモロコシタンパク質加水分解物、スープおよびブイヨン、マヨネーズ、牛乳、クリームおよび天然香油等が挙げられる。

【０１９１】

[00136]餌の選択は、知りうる範囲において、標的とされる特定の害虫に依存しうる。例えば、一般家庭におけるアリを防除するためには、この性質から、天然の砂糖および他の糖含有材料が好まれうる。他方で、ゴキブリは比較的雑食性であり、上記で列挙される餌のほとんどに対し誘引されることが可能であるため、餌の選択は特に問題となりえない。

【０１９２】

[00137]昆虫（１種または複数）の同定が不明である場合、例えば、標的とされる害虫種の選択が特定されるまで、いくつかの異なる餌の混合物を用い、その後、標的害虫により適切に向けた餌を用いることができる。

【０１９３】

[00138]殺虫剤組成物において、毒性化合物の濃度は、組成物中の約０．０１％（ｗ／ｗ）の量から、１％、２％、３％、４％、５％、１０％、１５％、２０％、３０％、４０％または約５０％（ｗ／ｗ）、またはそれ以上の量まで、ならびにそれらの間のすべての

中間範囲の量で、組成物中に含有させることができる。
【０１９４】
[00139]昆虫を死滅させる方法を実行する際、昆虫に応じて、標的とする領域に餌を小量ずつ分配することにより、組成物を分配することができる。
【０１９５】
[00140]昆虫を死滅させる方法を実行する際、昆虫を誘引する位置としては、例えば居住用および事業用の建築物および施設（農場を含む）、収納棚、コンテナ、住宅、草地、庭などの標的領域が挙げられる。したがって、標的領域には、該標的領域の付近の物体、限定されないが、例えば植物、衣料品、構築物、テント、枕、ベッドネット、ブランケット、自動車などが含まれうる。
【０１９６】
[00141]殺虫剤組成物により死滅させる標的害虫としては、限定されないが、吸血害虫、刺咬昆虫、ゴキブリ、蚊、ブユ、ノミ、イエバエ、納屋ハエ、イエハエ（ｆａｃｅ　ｆｌｙ）、茂みハエ（ｂｕｓｈ　ｆｌｙ）、アブ（ｄｅｅｒ　ｆｌｙ）、アブ（ｈｏｒｓｅ　ｆｌｙ）、ブヨ、カブトムシ、ビールバグ、シラミ、ナンキンムシ、シロアリ、ハサミムシ、アリ、アブラムシ、トウヒ材芽虫、アワノメイガ、ハマトビムシ、ツェツェバエ、サシガメ、サシバエ、スナバエ、貯蔵穀物の害虫（例えば、コクゾウムシ、赤コクヌストモドキ、クワガタ、インドミールモス）、イガ、マダニ、ダニ（ｍｉｔｅｓ）、クモ、植食性害虫、吸血性害虫および他の節足動物害虫などが挙げられる。
【０１９７】
[00142]「昆虫」とは、頭部、胸郭および腹部を含む３部分にはっきりと分かれた体節を有し、３対の脚のみ、時には翅を有する、例えばカブトムシ、バグ、ミツバチ、ハエ、蚊などの小型の無脊椎動物、という古典的な定義のみならず、そのメンバーが、翅を有さず、通常６本の脚より多いまたは少ない本数の脚を有する、例えば、クモ、マダニ、ダニ、ムカデ、ワラジムシ、ネマトーダなどの節足動物または他の無脊椎動物の害虫の他の同類のクラスをも包含する意味で用いる。
【０１９８】
[00143]開示される実施形態のこの態様に係る組成物は、いかなる適切な形態に製剤化してもよく、限定されないが、液剤、エマルジョン剤、乳剤、懸濁剤、発泡剤、ペースト剤、エアゾール剤、サスポエマルジョン（ｓｕｓｐｏｅｍｕｌｓｉｏｎ）濃縮物またはスラリー剤などが挙げられる。適切な組成物には、ＨＶ、ＬＶおよびＵＬＶ噴霧用、およびＵＬＶ冷噴霧および高温噴霧用の製剤のものが含まれる。具体的な一実施形態では、組成物は、大規模または小規模な農業および園芸用途に適する様式で製剤化される。例えばケーキ、粉末またはダストなどの固体状の組成物も適切な形態である。
【０１９９】
[00144]これらの製剤は、例えば、液体組成物を増量剤（すなわち液体溶媒）、圧力下で液化させたガスおよび／または固体担体と混合することにより、公知の様式で製造される。湿潤剤および／または界面活性剤、すなわち乳化剤および／または分散剤、金属イオンキレート剤、可塑剤、光沢剤、流動剤、融合助剤、ワックス剤、充填剤、ポリマー剤、凍結防止薬剤、殺生物剤、増粘剤、粘着剤、および／または発泡剤および消泡剤を、当業者に一般に知られている様式で使用することもできる。使用する増量剤が水である場合、例えば補助溶媒として有機溶剤を用いることも可能である。他の考えられる添加剤としては、鉱物油および植物油、着色剤（例えば無機顔料）および微量栄養素である。
【０２００】
[00145]例示的な実施形態として、本明細書において開示される化合物をカプセル封入した殺虫性製剤が含まれる。本明細書において、「カプセル封入した」、または「カプセル封入」、またはそれらのあらゆる活用形は、本明細書において開示される１つまたは複数の化合物を保持できる、あらゆる形状およびサイズの顆粒を指す。かかるカプセル封入の１つの非限定的な例は、マイクロカプセル封入である。適切なマイクロカプセル剤は、本願明細書において開示される化合物を、その重量の３０～９８％またはそれ以上有し、

例えば、イソシアネートまたは他の適切な封入材料の界面重合により調製され、マイクロカプセル封入シェルとすることができる。かかるマイクロカプセルは、０．１～１，０００ミクロンの平均サイズを有しうる。

【０２０１】

[00146]かかる添加剤の性質および作用は、液状製剤の当業者にとり周知である。添加剤は、製剤に含まれる化合物または他のいかなる生物活性成分にも悪影響を与えない。

【０２０２】

[00147]一実施形態において、製剤中の活性化合物含量は、約０．００００００１～２０重量％、または約０．０００１～１５重量％の活性化合物の濃度である。

【０２０３】

[00148]殺虫性化合物は、餌マトリックスに組み込まれてもよく、また餌ステーション（ｂａｉｔ　ｓｔａｔｉｏｎ）に配置してもよい。これらのステーションは、殺虫性化合物および餌マトリックスを容器に収容して、それらを環境から保護することを含む。昆虫は、この餌ステーションに誘引され、殺虫餌を摂食することができる。これらの餌ステーションは、様々な誘引物質源を利用して、害虫昆虫による摂食を誘引することができる。これらの誘引物質源としては、例えばフェロモン、CO_2または木が挙げられ、害虫昆虫が殺虫餌を摂取する前段階として餌ステーションに近づくことを誘導する。いかなる物理的または化学的誘引物質も、この餌ステーション法で利用できる。

【０２０４】

[00149]様々な殺真菌剤を、これらの殺虫餌製剤の防腐剤として使用することができる。例えば、全開示内容を参照により本願明細書に組み込む、Ｆｕｎｇｉｃｉｄｅ　Ｒｅｓｉｓｔａｎｃｅ　Ａｃｔｉｏｎ　Ｃｏｍｍｉｔｔｅｅ（ＦＲＡＣ）、ＦＲＡＣ　ＣＯＤＥ　ＬＩＳＴ　１（ＦＲＡＣ　Ｃｏｄｅにより整理）、２００６年、１２月により分類され、リスト化された殺真菌剤が挙げられる。このリストの要約には、以下が含まれる：メチルベンゾイミダゾールカルバメート（ＭＢＣ）：例えばベンズイミダゾールおよびチオファナート；ジカルボキシイミド；脱メチル阻害剤（ＤＭＩ）（ＳＢＩ：クラスＩ）：例えばイミダゾール、ピペラジン、ピリジン、ピリミジンおよびトリアゾール；フェニルアミド（ＰＡ）：例えばアシルアラニン、オキサゾリジノンエステルおよびブチロラクトン；アミン（ＳＢＩ：クラスＩＩ）：例えばモルホリン、ピペリジンおよびスピロケトアルアミン；ホスホロ－チオレートおよびジチオラン；カルボキサミド：例えばベンズアミド、フランカルボキサミド、オキサチインカルボキサミド、チアゾールカルボキサミド、ピラゾールカルボキサミドおよびピリジンカルボキサミド；ヒドロキシ－（２－アミノ）ピリミジン；アニリノ－ピリミジン（ＡＰ）；Ｎ－フェニルカルバメート；キノンアウトサイド阻害剤（ＱｏＩ）：例えばメトキシアクリル酸塩、メトキシカルバミン酸塩、オキシイミノアセテート、オキシイミノ－アセトアミド、オキサゾリジンジオン、ジヒドロ－ジオキサジン、イミダゾリノンおよびベンジル－カルバミメート；フェニルピロール；キノリン；芳香族炭化水素（ＡＨ）およびヘテロ芳香族Ｉ：例えば１，２，４－チアジアゾール；ケイ皮酸；メラニン生合成阻害剤－レダクターゼ（ＭＢＩ－Ｒ）：例えばイソベンゾフラノン、ピロロキノリノンおよびトリアゾロベンゾ－チアゾール；メラニン生合成阻害剤－デヒドラターゼ（ＭＢＩ－Ｄ）：例えばサイクロプロペイン－カルボキサミド、カルボキサミドおよびプロピオンアミド；ヒドロキシアニリド（ＳＢＩ：クラスＩＩＩ）；ヒドロキシアニリド（ＳＢＩ：クラスＩＶ）：例えばチオカルバミン酸塩およびアリルアミン；ポリオキシン：例えばペプチジルピリミジンヌクレオシド；フェニルウレア；キノンインサイド阻害剤（ＱｉＩ）：例えばシアノイミダゾールおよびスルファモイル－トリアゾール；ベンズアミド：例えばトルアミド；抗生物質：例えばエノピランウロン酸、ヘキソピラノシル、ストレプトマイシンおよびバリダマイシン；シアノアセトアミド－オキシム；カルバミン酸塩、ジニトロフェニルクロトン酸塩；ピリミジノン－ヒドラゾン；２，６－ジニトロアニリン；有機スズ化合物：例えば、トリフェニルスズ化合物；カルボン酸；複素環式芳香族化合物ＩＩ：例えばイソオキサゾールおよびイソチアゾロン；ホスホン酸塩：例えばエチルホスホン酸塩および亜リン酸および塩；フタルアミド酸；ベンゾトリアジン

；ベンゼンスルホンアミド；ピリダジノン；チオフェン－カルボキサミド；ピリミジンアミド；ＣＡＡ－殺真菌剤（カルボン酸アミド）：例えば、ケイ皮酸アミド、バリンアミドカルバメートおよびマンデル酸アミド；テトラサイクリン；チオカルバン酸塩；ベンズアミド：例えばアシルピコリド；宿主植物防御インデューサー：例えばベンゾチアジアゾールＢＴＨ、ベンズイソチアゾールおよびチアジアゾール－カルボキサミド；分類困難な物質：例えばチアゾールカルボキサミド、フェニルアセトアミド、キナゾリノンおよびベンゾフェノン；複数部位接触物質：例えば銅塩、硫黄、ジチオカルバメートおよびその関連物質、フタルイミド、塩化ニトリル（フタロニトリル）、スルファミド、グアニジン、トリアジンおよびキノン（アントラキノン）；非分類物質：例えば鉱物油、有機油、重炭酸カリウムおよび生物系物質。当業者であれば、本明細書において開示される様々な例示的実施形態に従い、他の殺真菌剤が製剤化し、または共投与できることを認識するであろう。

【０２０５】

[00150]一実施形態では、組成物を、ポリマー性物質中にマイクロカプセル封入する。好適なマイクロカプセル封入材料の例としては、代表的なメンバーとして、以下のクラスの材料が提供される。当業者であれば、ポリマー特性を有する他のクラスの材料を使用でき、また各所与ノクラス内の他の材料、および他のクラスのポリマーをマイクロカプセル封入に使用できることは自明である。本明細書において、マイクロカプセル封入とは、ナノカプセル封入のための方法および材料を含むものとする。限定されないが、例として以下が挙げられる：ゴムおよび天然巨大分子：例えばアラビアゴム、寒天、アルギン酸ナトリウム、カラギーナンおよびゼラチン；炭水化物：例えばデンプン、デキストラン、スクロース、コーンシロップおよびβ－シクロデキストリン；セルロースおよび半合成巨大分子：例えばカルボキシメチルセルロース、メチルセルロース、エチルセルロース、ニトロセルロース、アセチルセルロース、セルロースアセテート－フタレート、セルロースアセテート－ブチレート－フタレート、エポキシおよびポリエステル；脂質：例えばワックス、パラフィン、ステアリン酸、モノグリセリド、リン脂質、ジグリセリド、蜜蝋、油、脂肪、硬化油およびレシチン；無機材料：例えば硫酸カルシウム、シリケートおよび粘土；タンパク質：例えばグルテン、カゼイン、ゼラチンおよびアルブミン；生物学的物質、例えばパン酵母および他の微生物などの生物ならびに他のかつては生きていた細胞組織に由来する無効にされた細胞（ｖｏｉｄｅｄ　ｃｅｌｌ）。さらに、これらの材料は単独で使用してもよく、またはマイクロもしくはナノカプセル封入の工程中で他の材料と混合してもよい。

【０２０６】

[00151]本願明細書において記載され、後記の特許請求の範囲に記載される例示的実施形態は、その特徴、要素または工程が本明細書において具体的に開示されているか否かを問わず、最適に実施できることを、本明細書のすべての読者により理解されるであろう。例えば、本願明細書における「一実施形態」、「ある実施形態」、「例示的実施形態」などの記載は、記載される実施形態中に、特定の性質、構造または特徴が含まれうるが、すべての実施形態が、これらの特定の性質、構造または特徴を必ずしも含むわけではないことを指すものである。さらに、かかる語句は、必ずしも同じ実施形態を指すわけではない。さらに、特定の性質、構造または特徴がある実施形態に関連して記載されるとき、かかる性質、構造または特徴が他の実施形態に影響を及ぼすことは、それが明記されているか否かを問わず、当業者の技術的知識の範囲内であると考えられる。

【０２０７】

[00152]「背景技術」のセクションなどに記載の、本明細書に引用されるすべての刊行物および参考文献は、それらの全内容を参照により本明細書に組み込む。しかしながら、援用された刊行または参考文献に存在するいかなる類似または同一の用語と、本明細書において明確に提示、または定義されるそれらとの間で相違がある場合、本明細書において定義された、または明確に提示された用語の意味を優先させるものとする。さらに、本明細書で先行技術を引用することは、決して、かかる先行技術がいずれかの国における一般的知識の一部をなすことを承認または示唆するものではなく、またそのように認識すべき

でない。
【実施例】
【０２０８】
[00153]以下の実施例は、実施形態を例示するために提供されるものであり、それらの範囲に何ら限定するものではない。
【０２０９】
実施例１
化学的合成（代表例）
ジエステル、エチレングリコールリンカー
[00154]エチレングリコール（１０ｍｍｏｌ）を５０ｍＬのＤＭＦに溶解させ、ＤＭＡＰ（１２２ｍｇ、０．１ｅｑ）およびＤＣＣ（４．５４ｇ、２．２ｅｑ）を添加した。次に、カルボン酸（２５ｍｍｏｌ）は、０℃において５分間にわたり、クロロホルム中（２５ｍＬ）溶液として添加した。反応物を加温して室温に戻し、３時間撹拌した。次に、水（５０ｍＬ）およびヘキサン（５０ｍＬ）を添加し、次に、二相混合物を濾過し、大部分のＤＣＵを除去した。次に、混合物を有機層および水層に分離させ、ヘキサンを用いて水層をさらに２回抽出した。有機層を合わせて、水で数回洗浄してすべてのＤＭＦを除去し、次に、１Ｍの塩酸、次に１Ｍの水酸化ナトリウム、次にブラインで洗浄し、次に硫酸マグネシウムで脱水した。回転蒸発による溶媒の除去後、化合物をカラムクロマトグラフィーまたは再結晶により精製した。７０～９０％の収率であった。
エチレンジシンナメート
[00155]ケイ皮酸を用いた。粗製物をイソプロパノールから再結晶させ、ふわふわした白色固体（２．８８ｇ、８９％）を得た。
【０２１０】
【数１】

^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.73 (d, J = 16.0 Hz, 1H), 7.50 (m, 2H), 7.39 (p, J = 3.3, 2.8 Hz, 4H), 6.49 (d, J = 16.0 Hz, 1H), 4.50 (s, 2H).

ジエステル、ジカルボン酸リンカー
ジゲラニルスクシネート
[00156]コハク酸（０．５９０ｇ、５ｍｍｏｌ）を２０ｍＬのＤＭＦに溶解させ、ＤＭＡＰ（１２２ｍｇ、１ｍｍｏｌ）およびアルコール（１．６２ｇ、１０．５ｍｍｏｌ）を添加し、溶液を０℃に冷却した。ＤＣＣ（２．１７ｇ、２．１ｅｑ）をクロロホルム（１０ｍＬ）に溶解させ、次に、この溶液を５分間にわたり反応混合物に添加した。反応物を加温して室温に戻し、３時間撹拌した。次に、水（５０ｍＬ）およびヘキサン（５０ｍＬ）を添加し、次に、二相混合物を濾過し、大部分のＤＣＵを除去した。次に、混合物を有機層および水層に分離させ、ヘキサンを用いて水層を２回以上抽出した。有機層を合わせて、水で数回洗浄してすべてのＤＭＦを除去し、次に、１Ｍの塩酸、次に１Ｍの水酸化ナトリウム、次にブラインで洗浄し、次に硫酸マグネシウムで脱水した。回転蒸発による溶媒の除去後、化合物をカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色の油状物を得た。（０．９８５ｇ、５０％）。
【０２１１】
【数２】

^{1}HNMR (400 MHz, CDC13) δ 5.33 (t, 1H), 5.07 (t, 1H), 4.61 (d, 2H), 2.62 (s, 4H), 2.12-2.02 (多重線, 4H), 1.69 (s, 3H), 1.68 (s, 3H), 1.60 (t, 3H). ^{13}CNMR (101 MHz, CDC13) δ 172.31, 142.33, 131.81, 123.70, 118.11, 61.62, 39.51, 29.21, 26.27, 25.66, 17.67, 16.45.

ジオイゲニルスクシネート

[00157]オイゲノール（３．４５ｇ、２１ｍｍｏｌ）をジクロロメタン（４０ｍＬ）に溶解させ、０℃に冷却した。ピリジン（２．３７ｇ、３０ｍｍｏｌ）を添加し、続いて塩化サクシニル（１．５５ｇ、１０ｍｍｏｌ）を滴下して添加した。添加終了後、反応物を室温に加温し、１５分間撹拌し、次に反応物をヘキサン（１００ｍＬ）で希釈し、水（３０ｍＬ）を添加した。水層を除去し、有機層を水で洗浄し、次に３Ｍの塩酸および２Ｍの水酸化ナトリウム溶液で数回洗浄し、有機層から大部分の色を除去した。有機溶液を硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下で除去した。９５％のエタノールから粗製の固体を再結晶させ、淡黄色固体を得た。

【０２１２】

【数３】

^{1}HNMR (400 MHz, CDC13) δ 6.96 (dd, 2H), 6.79 (d, 2H), 6.76 (d, 2H), 5.96 (ddt, 2H), 5.12 (dq, 2H), 5.08 (ddt, 2H), 3.80 (s, 61H), 3.38 (d, 4H), 3.04 (s, 4H). ^{13}CNMR (101 MHz, CDC13) δ 170.39, 150.79, 139.03, 137.89, 137.03, 122.51, 120.64, 116.14, 112.69, 55.81, 40.08, 29.12.

ポリオールのオリゴエステル、一般的手順

[00158]ポリオール（５ｍｍｏｌ）をＤＭＦ（５０ｍＬ）に溶解させ、ＤＣＣ（ヒドロキシル基当たり１．１当量）およびＤＭＡＰ（ヒドロキシル基当たり０．１当量）を添加した。溶液を０℃に冷却し、カルボン酸（ヒドロキシル基当たり１．１５当量）を１０分間にわたり添加した。次に、水（５０ｍＬ）およびヘキサン（５０ｍＬ）を添加し、次に二相混合物を濾過し、大部分のＤＣＵを除去した。次に、混合物を有機層および水層に分離させ、水層をヘキサンで２回以上抽出した。有機層を合わせて、水で数回洗浄してすべてのＤＭＦを除去し、次に、１Ｍの塩酸、次に１Ｍの水酸化ナトリウム、次にブラインで洗浄し、次に硫酸マグネシウムで脱水した。回転蒸発により溶媒を除去した後、化合物をカラムクロマトグラフィーまたは再結晶により精製した。グリセロールの場合、トリグリセリドは１，３－ジグリセリドをしばしば伴うが、それは容易に分離できる。この傾向は、より多くのアルコール基を有する場合でも見られ、さらに、糖をコアとして使用されるとき、糖の異なるアノマーが生じる。

トリシトロネロイルグリセロール

[00159]グリセロールおよびシトロネル酸を用いる、一般的手順。無色油状物（１．８９ｇ、６９％）。

【０２１３】

【数４】

^{1}HNMR (400 MHz, CDCl3) δ 5.21 (p, J = 4.6 Hz, 1H), 5.01 (重複しているt, 3H), 4.24 (dtd, J = 11.6, 4.6, 2.0 Hz, 2H), 4.08 (dtd, J = 11.6, 4.6, 2.0 Hz, 2H), 2.26 (重複しているq, 3H), 2.06 (重複しているq, 3H), 2.00-1.83 (多重線, 12H), 1.61 (s, 9H), 1.53 (s, 9H), 1.34-1.10 (重複しているm, 6H), 0.88 (d, 3H), 0.87 (d, 6H).

１，３－ジシトロネロイルグリセロール

[00160]トリシトロネロイルグリセロール合成からジアシルグリセロールを単離。無色の油状物を白色固体（１．８９ｇ、６９％）に固化。

【０２１４】

【数５】

^{1}HNMR (400 MHz, CDCl3) δ 6.95 (広幅なs, 1H), 5.09 (t, 2H), 4.30-4.11 (m, 1H), 3.97-3.88 (m, 2H), (3.73-3.63) (m, 2H), 2.41 (dd, 2H), 2.20 (dd, 2H), 2.10-1.71 (多重線, 8H), 1.67 (s, 6H), 1.59 (s, 6H), 1.40-1.12 (m, 4H), 0.94 (d, 6H).

エーテル化テルペノイド

オイゲニルオキシ酢酸

[00161]２００ｍＬの水酸化ナトリウム水溶液（１６．８ｇ、４２０ｍｍｏｌ）に、オイゲノール（３２．８ｇ、２００ｍｍｏｌ）およびクロロ酢酸（１９．４ｇ、２０５ｍｍｏｌ）を添加した。次に透明な茶色の溶液を３時間還流加熱し、次に、反応物を冷却し、混合物が強酸性となるまで沸騰塩酸を添加し、油状物としてオイゲニルオキシ酢酸を分離し、さらに固化させた。濾過により不純化合物を単離し、さらにトルエンから再結晶させ、灰白色の結晶（２８．９８ｇ、６５％）を得た。

【０２１５】

【数６】

^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 12.94 (s, 1H), 6.80 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.77 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 6.65 (dd, J = 8.2, 2.0 Hz, 1H), 5.93 (ddt, J = 16.8, 10.0, 6.7 Hz, 1H), 5.07 (dq, J = 16.8, 2.0 Hz 1H), 5.02 (ddt, J = 10.0, 2.0, 1.3 Hz, 1H), 4.60 (s, 2H), 3.75 (s, 3H), 3.29 (dt, J = 6.7, 1.3 Hz, 2H). ^{13}C NMR (101 MHz, DMSO-d_6) δ 170.38, 148.82, 145.53, 137.95, 133.05, 120.08, 115.60, 113.42, 112.69, 65.18, 55.50, 40.15, 39.31.

メチルオイゲニルオキシアセテート

[00162]２５０ｍＬの丸底フラスコ中でオイゲニルオキシ酢酸（２２．２２ｇ、１００ｍｍｏｌ）をメタノール（１００ｍＬ）に溶解させた。濃硫酸（１ｍＬ）を添加し、反応物を２時間還流加熱した。次に反応物を冷却し、水（１００ｍＬ）を添加した。メチルオ

イゲニルオキシ酢酸を水層からヘキサンで抽出した。合わせた有機層、水、次に１Ｍの水酸化ナトリウム、次にブラインで洗浄し、硫酸マグネシウムで脱水し、減圧下で濃縮した。

【０２１６】

【数７】

^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 6.77 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.74 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 6.69 (dd, J = 8.1, 1.9 Hz, 1H), 5.95 (ddt, J = 16.9, 9.9, 6.7 Hz, 1H), 5.09 (dq, J = 16.9, 1.5 Hz, 1H), 5.06 (ddt, J = 9.9, 1.9, 1.5 Hz, 1H), 4.68 (s, 3H), 3.87 (s, 4H), 3.79 (s, 3H), 3.34 (dt, J = 6.7, 1.5 Hz, 2H). ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 169.63, 149.50, 145.48, 137.40, 134.55, 120.36, 115.81, 114.40, 112.45, 66.64, 55.82, 52.19, 39.83.

ゲラニルチミルオキシアセテート：

[00163]ゲラニオール（０．７７１ｇ、５ｍｍｏｌ）およびチミルオキシ酢酸（１．１５ｇ、５．５ｍｍｏｌ）を、ＤＭＡＰ（６１ｍｇ）のクロロホルム（２５ｍｌ）中溶液に添加した。１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド（ＥＤＣＩ）（１．０５ｇ、１．１当量）を０℃で一度に添加し、反応物を室温で４時間撹拌した。溶液を次に１００ｍＬのヘキサンで希釈し、最初に水で、次に１Ｍの塩酸、１Ｍの水酸化ナトリウム、および最後にブラインにより洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで脱水し、次に溶媒を減圧下で除去した。粗製物をカラムで精製（ＥｔＯＡｃ：ヘキサン＝１：９）し、無色の油状物（１．０１ｇ、５９％）を得た。

【０２１７】

【数８】

^{1}HNMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.11 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 6.53 (s, 1H), 5.36 (t, 1H), 5.08 (t, 1H), 4.72 (d, 2H), 4.63 (s, 2H), 3.37 (七重線, 1H), 2.29 (2, 3H), 2.13-2.02 (多重線, 4H), 1.70 (s, 3H), 1.68 (s, 3H), 1.60 (s, 3H), 1.22 (d, 6H).

^{13}CNMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 169.4, 155.16, 136.4, 134.7, 132.1, 126.4, 123.8, 122.4, 117.8, 112.5, 65.9, 62.1, 39.7, 26.7, 26.4, 25.8, 22.9, 21.4, 17.8, 16.7.

チミルチミルオキシアセテート

[00164]ゲラニオールの代わりにチモールを用いる、上記と同じ手順。無色油状物（０．８７２ｇ、５１％）。

【０２１８】

【数９】

^{1}HNMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.32 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.07 (d, 1H), 6.89 (s, 1H), 6.86 (d, 1H), 6.71 (d, 1H), 4.94 (s, 2H), 3.45 (七重線, 1H), 2.93 (七重線, 1H), 2.37 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.27 (d, 6H), 1.17 (d, 6H). ^{13}CNMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 168.3, 155.0, 147.4, 137.1, 136.8, 136.4, 134.7, 127.6, 126.6, 126.5, 122.6, 122.5, 112.2, 65.7, 27.1, 26.7, 23.2, 22.9, 21.4, 20.9.

カルバクリルオイゲニルオキシアセテート：

[00165]カルバクロールおよびオイゲニルオキシ酢酸を用いる、同じ手順。クリーム色のフレーク状物。

【０２１９】

【数１０】

^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.13 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 6.91 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.76 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.73 (dd, J = 8.2, 2.0 Hz, 1H), 5.96 (ddt, J = 16.9, 8.6, 6.8 Hz, 1H), 5.10 (dq, J = 8.6, 1.7 Hz, 1H), 5.06 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 4.94 (s, 2H), 3.89 (s, 3H), 3.35 (dt, J = 6.8, 1.5 Hz, 2H), 2.85 (七重線, J=7.2 Hz, 1H), 2.09 (s, 3H), 1.21 (dd, J = 6.9, 1.5 Hz, 6H). ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 167.61, 149.67, 148.67, 148.10, 145.53, 137.39, 134.81, 130.93, 127.02, 124.38, 120.43, 119.54, 115.81, 114.96, 112.67, 66.77, 55.88, 39.82, 33.51, 23.99, 23.85, 15.77.

実施例２

チャバネゴキブリへの給餌

材料および方法

チャバネゴキブリ

[00166]成体の雄および雌のチャバネゴキブリ（Ｂｌａｔｔｅｌｌａ ｇｅｒｍａｎｉｃａ）を、アイオワ州立大学（Ａｍｅｓ、ＩＡ）の昆虫学部門・殺虫毒性研究室（Ｄｅｐａｒｔｍｅｎｔ ｏｆ Ｅｎｔｏｍｏｌｏｇｙ’ｓ Ｐｅｓｔｉｃｉｄｅ Ｔｏｘｉｃｏｌｏｇｙ Ｌａｂｏｒａｔｏｒｙ）において確立されたコロニーから得た。昆虫を１２：１２時間の一定の明：暗サイクルで維持し、ドライキャットフード（Ｐｕｒｉｎａ（登録商標）Ｃａｔ Ｃｈｏｗ Ｃｏｍｐｌｅｔｅ（登録商標）、ｒｏｌｌｅｄ ｏａｔｓ （ＨｙＶＥＥ（登録商標）Ｏｌｄ Ｆａｓｈｉｏｎｅｄ Ｏａｔｓ）およびＦｌｕｋｅｒ（登録商標）Ｃｒｉｃｋｅｔ Ｑｕｅｎｃｈｅｒの食餌を与えた。

給餌アッセイ

[00167]ゴキブリ逃走防止用の鋼製メッシュを上部に有するメイソン型ジャーに、５匹の成体チャバネゴキブリ（Ｂｌａｔｔｅｌｌａ ｇｅｒｍａｎｉｃａ）を導入した。破砕した２６６．６ｍｇのＣｈｅｅｒｉｏｓ（商標）（約２個のｃｈｅｅｒｉｏｓ）を、食物重量あたりの濃度を変化させた化合物と混合した。材料が固体である場合、乳鉢と乳棒を

用いて、破砕したＣｈｅｅｒｉｏｓと化合物とを均一にした。材料が液体である場合、それをアセトンに溶解させ、食物重量当たりの化合物の所望の濃度が達成されるまでゆっくりと食物に秤量添加した。アセトンを実験の全体にわたり担体として使用する場合、アセトンが食物中に存在しないよう、食物を繰り返し慎重に撹拌し、確実に蒸発させた。これは、処理された食物中に存在する溶媒による死虫の可能性を排除するために行った。対照は、アセトン約１ｍＬのみで処理した食物からなった。すべての処理においてアセトンは蒸発させたので、溶媒による死虫の可能性への寄与はなかった。死虫率の評価に用いた濃度は、食物重量に対し３．７５％および１５重量％の化合物とした。すべての死虫率は、異なる化合物で処理した食物を有する個々のメイソン型ジャーにゴキブリを導入した後、２週目において評価した。

データ解析

[00168]平均値の標準誤差（ＳＥＭ）付きの平均死虫率％としてデータを示す。最低３回の反復試験を化合物毎に実施し、事後Ｓｔｕｄｅｎｔ　Ｎｅｗｍａｎ－Ｋｕｅｌｓ試験によるＡＮＯＶＡを行い、対照と個々の処理との比較（α＝０．０５）を行った。アスタリスクは、対照から統計的に有意に高い死虫率％を表す。

結果

[00169]試験した大部分の化合物は、２週目において対照より高い死虫率％を生じた。図１は、数週間にわたり３．７５重量％化合物／食物重量の濃度の様々な化合物で曝露したチャバネゴキブリの死虫率％を示す。エチレンジシトロネレートは、処理した食物にゴキブリを曝露し、１、２および３週後において、対照と比較し顕著に高い死虫率％を生じることができた。逆に、対照（アセトンのみ）では、ゴキブリの導入後、２週目において、６０％濃度で２３．３％の死虫率を示した。２週間にわたり３．７５重量％化合物／食物重量でさらに多くの化合物をスクリーニング（単一時点）したとき、２つの化合物において、対照と比較し統計的に有意な死虫率％を生じた（α＝０．０５）（図２）。これらの化合物は、エチレンジシトロネレートおよびジシトロネロイルグリセロールである。他のいくつかの化合物も、やや低い率ではあったが、対照よりも数値的に高い死虫率を示した。

【０２２０】

[00170]より高濃度でのチャバネゴキブリに対する各種餌化合物の有効性を評価するため、１５％化合物／食物重量による第２の一連の実験を実施した。前回実験から同定された最も有効な化合物をスクリーニングした。図３は、１５％ｗ／ｗで食物中に組み込んだときの、大量の各種化合物のチャバネゴキブリに対する有効性を示す。この濃度では、スクリーニングした各化合物においてより高い死虫率％が観察された。１５重量％／食物重量で試験したこれらの化合物の中の多くが、対照において観察されたものより顕著に高い死虫率をもたらした。さらに、これらのうちの２つの化合物では、１５％ｗ／ｗ食物の濃度でそれらをゴキブリ食物に添加した後、２週目において１００％の死虫率を示した。これらの化合物は、エチレンジシトロネレートおよびヘキサシトロネリルイノシトールを含んだ。この濃度では、スクリーニングしたすべての化合物は、対照の処理より数値的に高い死虫率％を示した。

【０２２１】

実施例３

イエバエへの給餌（固体食物）

材料および方法

昆虫

[00171]アイオワ州立大学（Ａｍｅｓ、ＩＡ）の殺虫毒性研究室・昆虫学部門（Ｐｅｓｔｉｃｉｄｅ　Ｔｏｘｉｃｏｌｏｇｙ　Ｌａｂｏｒａｔｏｒｙ　Ｄｅｐａｒｔｍｅｎｔ　ｏｆ　Ｅｎｔｏｍｏｌｏｇｙ’ｓ）によって維持される、確立されたコロニーから、イエバエ（Ｍｕｓｃａ　ｄｏｍｅｓｔｉｃａ）を得た。標準的な実験室プロトコールに従いハエを維持した。イエバエに対し、綿芯により水を、また砂糖および粉ミルク（１：１で混合）の固体支持体を、自由に摂取させた。試験前に、ハエを２４±２℃の温度、３０％±１０

％の相対湿度、および１２：１２時間の明：暗周期に維持した。ハエを、様々な日数で、３つの別々のＢｉｏｑｕｉｐ　ＢｕｇＤｏｒｍ（登録商標）ケージのうちの１つからランダムに選択し、生命力に関する潜在的バイアスを排除した。

給餌アッセイ（非選択アッセイ）

[00172]脱イオン水で満たしたフレンチスクエア（Ｆｒｅｎｃｈ　ｓｑｕａｒｅ）を有する実験槽（２．５ガロン）に、約２０～３０匹の成体イエバエ（Ｍｕｓｃａ　ｄｏｍｅｓｔｉｃａ）を導入した。歯科用の綿芯を用いて水を吸収させ、フレンチスクエアの上部に置いてハエに与えた。化合物を異なる濃度で、乾燥粉乳およびスクロース＝１：１の混合物中に導入した。食物重量に対する重量を変えて化合物を組み込んだ、２ｇの食物をハエに与えた。材料が固体である場合、乳鉢および乳棒を用いて、破砕した乾燥粉乳、スクロースおよび化合物を均一にした。材料が液体である場合、それをアセトンに溶解させ、食物重量当たりの化合物の所望の濃度が達成されるまでゆっくりと食物に秤量添加した。実験にわたって、アセトンを担体として使用する場合、アセトンが食物中に存在しないよう、食物を繰り返し慎重に撹拌し、確実に蒸発させた。死虫率を評価するため、食物重量に対する５重量％化合物の濃度を使用した。異なる化合物で処理した食物を有する個々のメイソン型ジャーに、イエバエを導入した後、５日目の全死虫率を評価した。強力なイエバエ性フェロモンであり、ハエの毒性餌およびトラップに一般的に添加されているＺ－９－トリコセン（Ｍｕｓｃａｌｕｒｅ（登録商標））を有する餌の有効性を評価するため、追加実験を実施した。

給餌アッセイ（選択アッセイ）

[00173]このアッセイは、非選択給餌アッセイと同様に実施したが、多くの重要な変更点を有する。選択アッセイでは、乾燥粉乳およびスクロースを１：１で含む１個の未処理の食物源と、同一材料で構成されるが処理（毒性を有する生物学的化合物を含有）を行った食物源とを用いた。さらに、毒性の殺虫餌化合物を、１５％ｗ／ｗ食物の濃度で、食物混合物中に組み込んだ。処理および未処理の食物源が共存することに起因する、予想される低い死虫率％の存在を考慮し、敢えて高いこの毒性の殺虫餌の濃度を選択した。死虫率の記録は、曝露の５日後に行った。

データ解析

[00174]平均値の標準誤差（ＳＥＭ）付きの平均死虫率％としてデータを提示する。この数は、各反復試験における、各実験槽に導入したハエの総数との比較して、死虫率％を算出した。最低３回の反復試験を各化合物において実施した。

結果

[00175]スクリーニングした多くの化合物では、５重量％／食物重量でイエバエ食物に導入したとき、対照より高い死虫率％を示した。図４は、可能性のあるハエの殺虫餌として試験した多くの化合物の有効性を実証する。対照の処理では、約２２％の死虫率であり、このアッセイは、化合物が殺虫餌として作用しうるか否かをロバストに判断できることを実証するものである。化合物のうち、エチレンジシトロネレート、チミルケイ皮酸、チミルヒドロゲンスクシネート、メチルオイゲニルオキシアセテート、ゲラニルチミルオキシアセテートおよびオイゲニルオキシ酢酸では、５０％を超える死虫率％を生じた。チミルヒドロゲンスクシネート、シンナミルミリスチン酸、ジシンナミルアジパートおよびヘキサシンナモイルイノシトールは、死虫率が４０％超であった。これらの化合物を５重量％／食物重量で用いたときの有効性が広範にわたるということは、餌として提供したときにこれらの化合物がイエバエに対して毒性である可能性を実証する。さらに、このセット内のいくつかの化合物では殺虫性が認められず、すなわち、固有かつ異なる毒性機構が、この一連の化学品中の各分子に存在しうることを示すものである。

【０２２２】

[00176]イエバエ食餌の一部としてこれらの化合物を提供したときの殺虫特性をさらに試験するため、Ｚ－９－トリコセンを混合物に添加し、ハエによるこの毒性混合物の摂食を促進した。Ｚ－９－トリコセンは、雄のイエバエが雌のイエバエを特定するために使用する強力な性フェロモンである。この化合物は、多くの市販のハエ餌の成分であり、より

多くのハエをこれらの毒性餌に誘引させることによりそれらの有効性を増加させる。この実験では、０．５重量％／食物重量で化合物およびＺ－９－トリコセンの両方を含有させた処理においてより高い死虫率％が観察された（図５）。ここではまた、ジシンナミルアジパートを５重量％／食物重量の濃度で食餌に添加した。この実験でもまた、ジシンナミルアジペート（以前の実験においてより毒性の化合物の１つとして同定される）の毒性が実証され、またこれらの化合物が市販の毒性ハエ餌を模倣する製剤として使用できる可能性があることが示唆される。

【０２２３】

[00177]最後に、選択アッセイにおいてイエバエに食物を与え、未処理の食物源の存在下でこれらの各種の殺虫性化合物の摂食誘引性およびそれらの有効性を評価した。これにより、ハエに対して複数の食料源が提供されうる天然環境を模倣できる。この試験においては、様々なオキシ酢酸のメチルエステルが、最も成功した嗜好性が高い餌であった。さらに、チミルオキシ酢酸のイソプロピル、アミル、シトロネリルおよびゲラニルエステルはいずれも、この選択アッセイで顕著な毒性レベルを生み出しし、それらがいずれも、将来有望な殺虫餌として摂食誘引性および有用性を示すことを示唆しうるものであった。

【０２２４】

[00178]これらのデータをまとめると、それらの化合物が新規な昆虫餌組成物を表すものでありうることが示唆される。異なる餌媒体中の様々な濃度の有効性は、それらの殺虫剤としての利用可能性を明確に示すものである。

【０２２５】

実施例４

イエバエに対する給餌（水ベースの殺虫性スクロース餌）

材料および方法

昆虫

[00179]アイオワ州立大学（Ａｍｅｓ、ＩＡ）の昆虫学部門・殺虫毒性研究室によって維持される、確立されたコロニーから、イエバエ（Ｍｕｓｃａ　ｄｏｍｅｓｔｉｃａ）を得た。標準的な実験室プロトコールに従いハエを維持した。イエバエに対し、綿芯により水を、また砂糖および粉ミルク（１：１で混合）の固体支持体を、自由に摂取させた。試験前に、ハエを２４±２℃の温度、３０％±１０％の相対湿度、および１２：１２時間の明：暗周期に維持した。ハエを、様々な日数で、３つの別々のＢｉｏｑｕｉｐ　ＢｕｇＤｏｒｍ（登録商標）ケージのうちの１つからランダムに選択し、健康に関する潜在的バイアスを排除した。

給餌アッセイ

[00180]この試験では、０．５％（ｖ／ｖ）の２００プルーフのエチルアルコールおよび乳化剤である０．５％（ｖ／ｖ）のＴＷＥＥＮ　８０（ポリオキシエチレン）を、品質保証を受けたＡＣＳ結晶性スクロースおよび脱イオン水の１０％（ｗ／ｗ）混合物と合わせて、スクロース餌製剤を調製した。これらの成分はすべて、Ｆｉｓｈｅｒ　Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ　ｃｏｍｐａｎｙ（Ｆａｉｒ　Ｌａｗｎ、ＮＪ）から得た。１０ｍＬ容のメスフラスコ中、１０ｍＬの量でスクロース餌製剤を創出した。次に、５ｍＬの製剤を２つの２ドラム型ガラスバイアルに入れた。化合物を０．１％（ｗ／ｗ）製剤の濃度で溶解させた。１０匹のイエバエ（両性を含む）を８ｏｚのデリカップに入れ、各処理について最低２回の反復試験を行った。綿芯をバイアルに導入し、スクロース製剤をハエに与えた。Ｐａｒａｆｉｌｍ（登録商標）で各バイアルをラップし、綿芯の場所を適切に維持し、混合物の流出／蒸発を止めた。チュールをカップの上部に固定し、ハエが試験アリーナから逃避できないことを確実にした。実験の際、併せて、ハエにスクロースまたは食物を与えなかった陰性対照（絶食）を設け、ハエが餌を摂食したか否かを明らかにした。給餌されなかったハエは、試験アリーナへの導入の２４時間以内に絶命した。このバイオアッセイにおいて、他の市販の殺虫餌において使用される毒性成分の有効性を実証ため、ホウ酸を用いた陽性対照を用いた。ホウ酸は、市販品において利用が確立されている餌であり、このアッセイでも高い死虫率を示している。試験チャンバーへの導入後５日間にわたりイエバエ

をモニタリングし、２４時間間隔で死虫率を毎日記録した。死虫率％は、全反復試験に関連する、特定の処理における平均死虫率％±平均値の標準誤差として算出した。事後Ｓｔｕｄｅｎｔ　Ｎｅｗｍａｎ－Ｋｕｅｌｓ平均比較試験による一元配置ＡＮＯＶＡ（α＝０．０５）を用い、様々な時点における、処理の間での統計的有意性を判定した。

結果

[00181]このバイオアッセイにおいて、試験したチモール誘導体は、スクロース、Ｔｗｅｅｎ　８０、エタノール中のエマルジョンにおいて、イエバエに対して顕著な死虫率％を生じた（図７）。絶食対照では、適用後、２４時間目において他のすべての処理と比較し統計的に有意な死虫率％を示し、すなわち給餌されないハエの場合の死虫率を示すものである。これを１０％スクロースのみの対照と比較すると、この実験区では実験間隔全体にわたり非常に低い死虫率％であった。１０％スクロースのみの対照に関連した最大の死虫率は、ハエを試験アリーナに導入した後１２０時間における、１５±３．５３％であった。このデータは、このバイオアッセイが、殺虫餌として提供される選択された生物学的物質の毒性効果をロバストに検出できることを証明するものである。

【０２２６】

[00182]ハエを試験アリーナに導入した後、０．１％のチミルオキシ酢酸を含有する水性製剤を与えたイエバエでは、４８、７２、９６および１２０時間目において、それぞれ２６．７％、８０％、９３．３％および１００％の死虫率であり、スクロースのみの対照と比較し有意な死虫率％を示した。このバイオアッセイにおけるチミルオキシ酢酸の遅延型の死虫率は、これらの餌をハエに連続的に給餌し、高い毒性が発揮されることを示唆するものである。試験アリーナへの導入後４８、７２および９６時間目に、チミルオキシ酢酸およびホウ酸を用いて同様に試験を行ったところ、両処理間の統計的有意差は見られなかった。さらに、チミルオキシ酢酸およびホウ酸の両方は、ハエを試験アリーナに導入した後、１２０時間目において１００％の死虫率を生じた。これを、試験昆虫の導入後１２０時間目に見られるチモールの死虫率％（２５±１０．７％）と比較した。

【０２２７】

[00183]この一連のデータは、選択された生物学的物質の合成誘導体が、イエバエに対する殺虫餌として非常に有効であり、市販されている他の製品と同等であることを証明する。さらに、チモール単独と比較したより高い死虫率％は、これらの生物学的化合物が、それらの合成において使用される親モノテルペノイドよりも毒性が高いことを示唆する。

実施例５

蚊の給餌アッセイ（水性殺虫性スクロース餌）

材料および方法

蚊：

[00184]アイオワ州立大学（Ｉｏｗａ　Ｓｔａｔｅ　Ｕｎｉｖｅｒｓｉｔｙ　ｏｆ　Ｓｃｉｅｎｃｅ　ａｎｄ　Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｙ）（Ａｍｅｓ、ＩＡ）の昆虫学部門のＭｅｄｉｃａｌ　Ｅｎｔｏｍｏｌｏｇｙ　Ｌａｂｏｒａｔｏｒｙにおいて確立されたコロニーから、アカイエカ（Ｃｕｌｅｘ　ｐｉｐｉｅｎｓ）（アメリカ北東部における、西ナイルウイルスの主な宿主）を得た。Ｍｅｄｉｃａｌ　Ｅｎｔｏｍｏｌｏｇｙ　Ｌａｂｏｒａｔｏｒｙにより確立されたプロトコールに従い、蚊を生育させた。羽化後５～７日の成体の雌の蚊を用い、忌避性バイオアッセイを実施した。羽化後～試験前において、成体の蚊に対し、１０％スクロース溶液を浸漬した綿芯を自由に与えた。試験に用いる蚊には血粉を与えなかった。試験の前に、２７℃、８０％の相対湿度、１６：８時間の明：暗周期の条件で蚊を維持した。

給餌アッセイ

[00185]この試験では、０．５％（ｖ／ｖ）の２００プルーフのエチルアルコールおよび乳化剤である０．５％（ｖ／ｖ）のＴＷＥＥＮ　８０（ポリオキシエチレン）を、品質保証を受けたＡＣＳ結晶性スクロースおよび脱イオン水の１０％（ｗ／ｗ）混合物と合わせて、スクロース餌製剤を調製した。これらの成分はすべて、Ｆｉｓｈｅｒ　Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ　ｃｏｍｐａｎｙ（Ｆａｉｒ　Ｌａｗｎ、ＮＪ）から得た。１０ｍＬ容量のメス

フラスコ中、１０ｍＬの量でスクロース餌製剤を創出した。次に、５ｍＬの製剤を２つの２ドラム型ガラスバイアルに入れた。試験化合物を０．１％ｗ／ｗ製剤の濃度で溶解させた。１０匹の雌のアカイエカを８－ｏｚのデリカップに入れ、各処理について最低２回の反復試験を行った。綿芯をバイアルに導入し、スクロース製剤を蚊に与えた。パラフィルムで各バイアルをラップし、綿芯の場所を適切に維持し、混合物の流出／蒸発を止めた。チュールをカップの上部に固定し、蚊が試験アリーナから逃避できないことを確実にした。実験の際、併せて、蚊にスクロースまたは食物を与えなかった陰性対照（絶食）を設け、蚊が餌を摂食したか否かを明らかにした。給餌されなかった蚊は、試験アリーナ中で導入の７２時間以内に絶命した。このバイオアッセイにおいて、他の市販の殺虫餌において使用される毒性成分の有効性を実証するため、ホウ酸を用いた陽性対照を用いた。試験チャンバーへの導入後６日間にわたりアカイエカをモニターし、２４時間間隔で死虫率を毎日記録した。死虫率％は、全反復試験に関連する、特定の処理における平均死虫率％±平均値の標準誤差として算出した。事後Ｓｔｕｄｅｎｔ　Ｎｅｗｍａｎ－Ｋｕｅｌｓ平均比較試験による一元配置ＡＮＯＶＡ（α＝０．０５）を用い、様々な時点における、処理の間での統計的有意性を判定した。

結果

[00186]このバイオアッセイにおいて、試験したチモール誘導体は、バイオアッセイ終了時に、他の処理より高い死虫率％を示した（図８）。さらに、スクロースのみの対照による死虫率％は、試験アッセイ全体にわたり低いままであり、１５±１０．６％の最大値であった。また、絶食対照では、導入後７２時間およびそれ以降の実験設定に、顕著な死虫率％を示した。このことは、各種の殺虫餌の昆虫による摂食性およびそれらの各毒性を判定する際、このバイオアッセイが有用であることを実証するものである。

【０２２８】

[00187]アカイエカを導入した後、０．１％のチミルオキシ酢酸を含有する水性製剤を与えた蚊では、９６、１２０および１４４時間目において、スクロースのみの対照と比較し有意な死虫率％を示した。０．１％のチミルオキシ酢酸とホウ酸をすべての時点において同様に試験したところ、観察したすべての時点において、これらの２つの処理間で統計的有意差が見られなかった。絶食対照と比較した、０．１％のチミルオキシ酢酸およびホウ酸両方の遅延型の毒性効果は、アカイエカが水性製剤化餌を摂食することができ、またこのバイオアッセイにおいてこれらの製剤により顕著な毒性が生じたことを実証するものである。チミルオキシ酢酸は、導入後１２０および１４４時間目において、ホウ酸と比較し非常に高い数値で死虫率％を生じた。このバイオアッセイにおいて、この化合物により生じた最大死虫率％は、導入後１４４時間目における９５±３．５３％であった。

【０２２９】

[00188]このデータは、選択された新規な生物学的化合物が、高い死虫率％をアカイエカに対して示すことができ、また現在市販されている他の殺虫餌製品と同程度の有効性を示しうることを実証するものである（図９）。このデータは、本特許出願において開示されるチミルオキシ酢酸および他の新規な生物学的物質が、誘因性毒性砂糖餌の現行の製品、および他の市販の水性製剤の蚊防除製品よりも、蚊種に対する有効性であることを示唆するものである。

【０２３０】

[00189]文言的なサポートを提供するのに必要な範囲で、あらゆる添付の特許請求の範囲に記載の主題および／または文言が、そのすべてが参照により本願明細書に組み込まれるものと理解される。

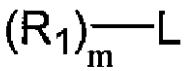
【０２３１】

[00190]本明細書において記載される例示的実施形態は、あらゆる記載される特徴、要素または工程が本願明細書において具体的に開示されているか否かを問わず、最適に実施できるものとして、本明細書のすべての読者により理解されるであろう。

以下に、本願発明の実施態様を付記する。

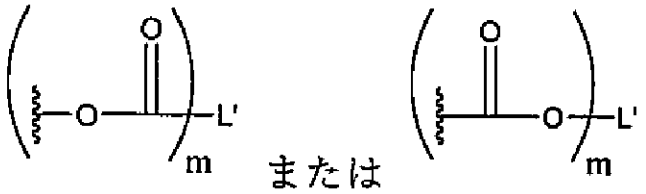
［１］　担体または餌マトリックスと、有効量の式（Ｉ）：

【化１】

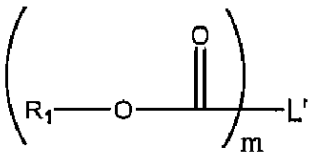


(I)

（式中、
R_1は、各々独立してフェニルプロペノイドまたはモノテルペノイド部分であり、
Ｌは、以下の構造を有するポリエステル含有連結部分であり、
【化２】

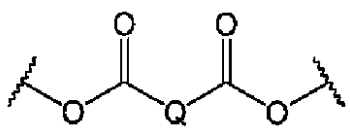


Ｌ’は、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のアルキルまたはシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され、
ｍは２～６である）
の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法。
［２］　担体または餌マトリックスと、式（ＩＩ）：
【化３】



(II)

（式中、
R_1は、各々独立してフェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、
Ｌ’は、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のアルキルまたはシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され、
ｍは、２～６である）
の特定の化学的組成を有する前記［１］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法。
［３］　担体または餌マトリックスと、前記［２］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｌ’が、それが結合しているエステルと一緒になって、
【化４】

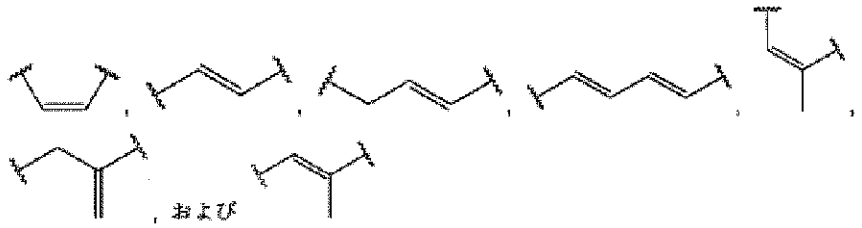


（式中、
Ｑは、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のC_0～C_4アルキル、分岐状もしくは非分岐状のC_0～C_4ケトンおよび分岐状もしくは非分岐状のC_0～C_4アミンからなる群から選択される）
である、方法。

［４］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［３］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｑが－（ＣＨ$_2$）$_n$－であり、ｎが０～４である、方法。

［５］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［３］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｑが、

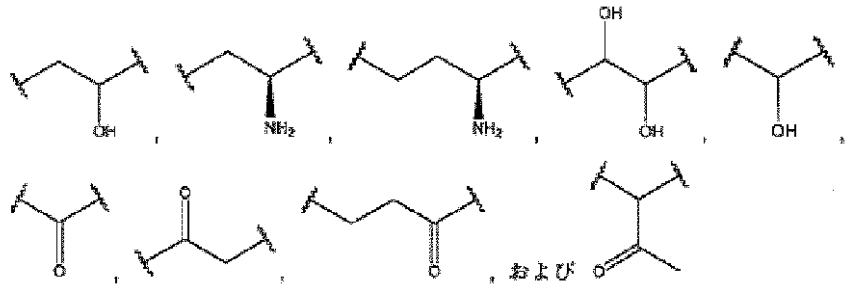
【化５】



からなる群から選択される、方法。

［６］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［３］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｑが、

【化６】



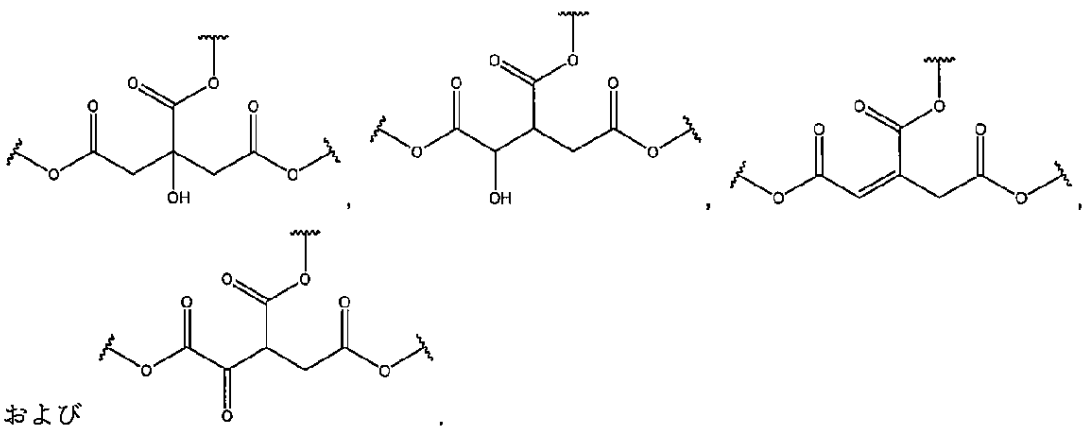
からなる群から選択される、方法。

［７］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、少なくとも１つのＲ１がモノテルペノイド部分である、方法。

［８］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［７］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｌ’がトリカルボン酸部分であり、ｍが３である、方法。

［９］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［８］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｌ’が、それが結合しているエステルと一緒になって、

【化７】



からなる群から選択されるトリカルボン酸部分である、方法。

［１０］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｌ’が、それが結合しているエステルと一緒になって、ポリカルボン酸部分であり、カルボン酸部分の数がｍより大きい数であり、それにより１つまたは複数のカルボン酸部分が非エステル化型である、方法。

［１１］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［１０］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、

ｍが２であり、

Ｌ’がトリカルボン酸部分であり、

非エステル化カルボン酸がプロトン化されているか、またはカルボン酸塩である方法。

［１２］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［１１］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、非エステル化カルボン酸が、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、鉄、亜鉛、銅またはアミン対イオンとのカルボン酸塩である、方法。

［１３］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［１２］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、非エステル化カルボン酸が、アンモニア、ジエチルアミン、トリエチルアミンおよびメチルアミンからなる群から選択されるアミンとのカルボン酸塩である、方法。

［１４］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［１０］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｌ’が、それが結合しているエステルと一緒になって、少なくとも４つのカルボン酸基を有するカルボン酸部分である、方法。

［１５］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［１０］に記載の化合物とを含む殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、ｍが４～６である、方法。

［１６］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、ｍが４～６である、方法。

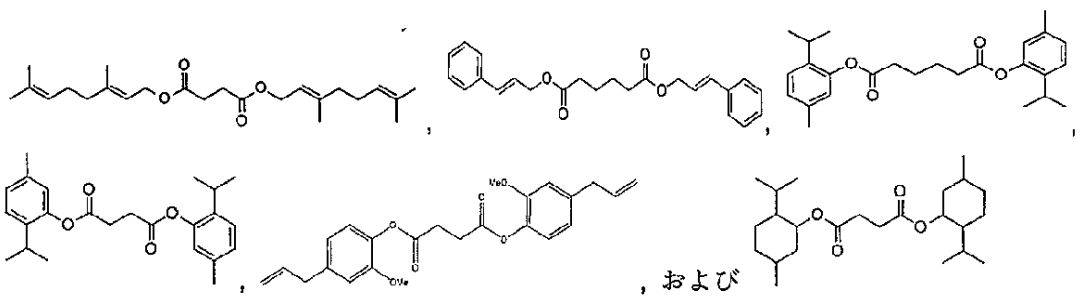
［１７］

担体または餌マトリックスと、有効量の前記［１６］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、１つまたは複数の非エステル化カルボン酸部分がカルボン酸塩である、方法。

［１８］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［１７］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、カルボン酸塩が、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、鉄、亜鉛、銅またはアミン対イオンである、方法。

［１９］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、化合物が、

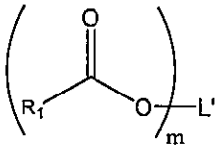
【化８】



からなる群から選択される構造を有する、方法。

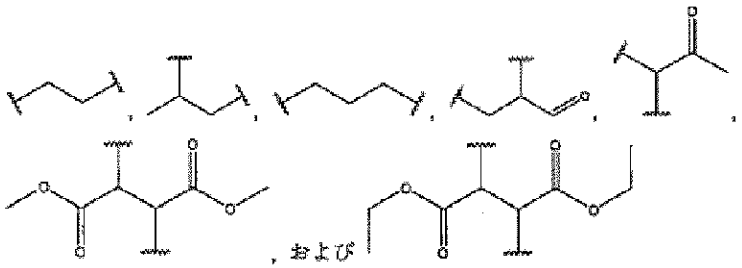
［２０］　担体または餌マトリックスと、式（ＩＩＩ）：

【化９】

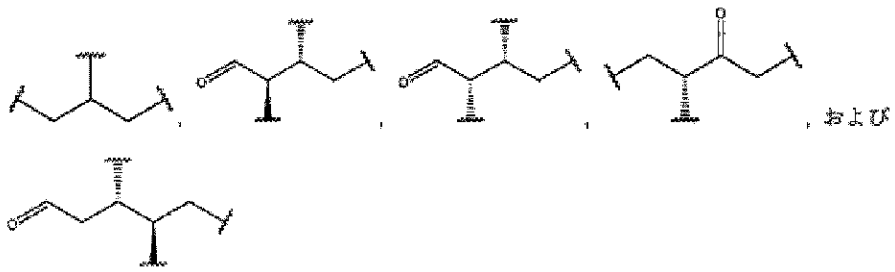


(III)

（式中、
R_1は、各々独立してフェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり
Ｌ’は、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のアルキルまたはシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され、
ｍは、２～６である）
の構造を有する、有効量の前記［１］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法。
［２１］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２０］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、ｍが２である、方法。
［２２］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２１］に記載の化合物とを含む殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｌ’が、
【化１０】

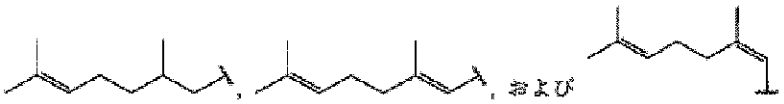


からなる群から選択される、方法。
［２３］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２０］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、ｍが３である、方法。
［２４］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２３］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｌ’が、
【化１１】

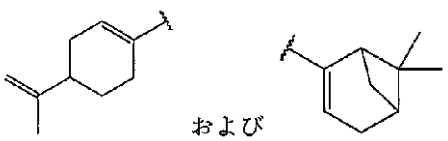


からなる群から選択される、方法。
［２５］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２０］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、
Ｌ’が単糖部分であり、
R_1と共にエステルを形成する前記単糖部分の２個以上のヒドロキシル基が、Ｌ’の部分ではない、方法。

［２６］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２５］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、単糖部分が、アラビノース、リキソース、リボース、キシロース、リブロースおよびキシルロースからなる群から選択されるペントースである、方法。
［２７］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２５］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、単糖部分が、アロース、アルトロース、グルコース、マンノース、グロース、タロース、イドース、ソルボース、フルクトース、プシコースおよびタガトースからなる群から選択されるヘキソースである、方法。
［２８］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２０］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、
Ｌ’が二糖部分であり、R_1と共にエステルを形成する二糖部分のヒドロキシル基が、Ｌ’の部分ではない、方法。
［２９］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２８］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、二糖部分が、スクロース、マルトースまたはラクトースからなる群から選択される、方法。
［３０］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２０］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、
Ｌ’が糖アルコール部分であり、
Ｒ１と共にエステルを形成する糖アルコール部分のヒドロキシル基が、Ｌ’の部分ではない、方法。
［３１］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［３０］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、糖アルコールが、ソルビトール、イノシトール、エリスリトール、リビトール、トレイトール、アラビトールおよびキシリトールからなる群から選択される、方法。
［３２］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２０］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、少なくとも１つのＲ１が、
【化１２】

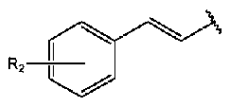


からなる群から選択される非環状モノテルペノイド部分である、方法。
［３３］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２０］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、少なくとも１つのR_1が、
【化１３】

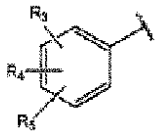


からなる群から選択される単環式または二環式モノテルペノイド部分である、方法。
［３４］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２０］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、少なくとも１つのR_1が、
以下の構造：

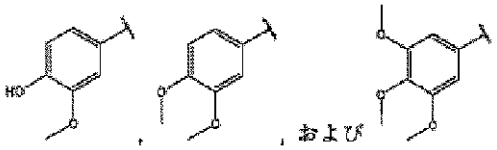
【化１４】



を有し、
R_2が、Ｈ、ＯＨ、ＯＭｅまたはＯＥｔである、方法。
［３５］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２０］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、少なくとも１つのR_1が、
以下の構造：
【化１５】

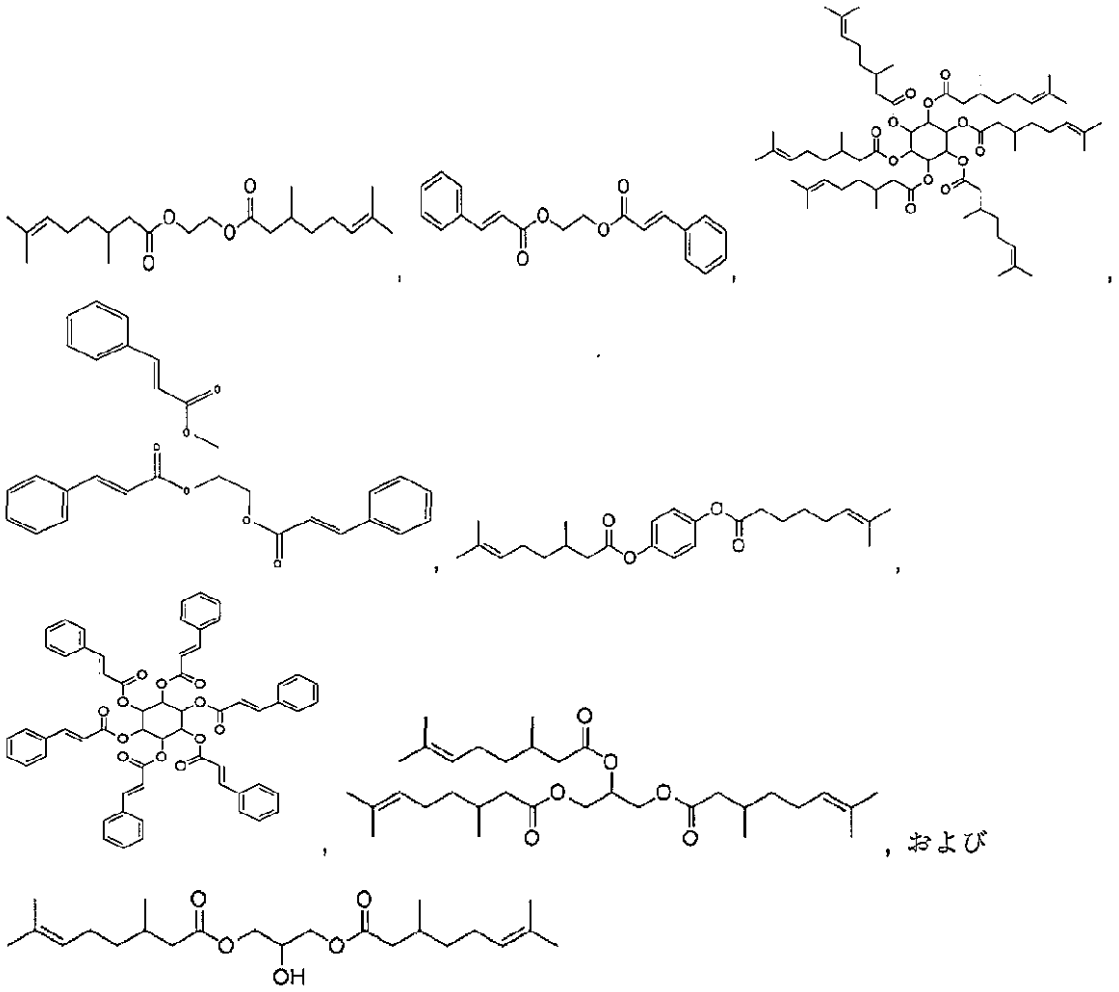


（式中、
R_3は、ＯＨ、ＯＭｅまたはＯＥｔであり、
R_4は、Ｈ、ＯＨまたはＯＭｅであり、
R_5は、Ｈ、ＯＨまたはＯＭｅである）
を有する、方法。
［３６］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［３５］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、少なくとも１つのR_1が、
【化１６】



からなる群から選択される、方法。
［３７］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［２０］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、化合物が、

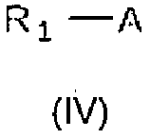
【化１７】



からなる群から選択される構造を有する、方法。

［３８］　担体または餌マトリックスと、有効量の式（ＩＶ）：

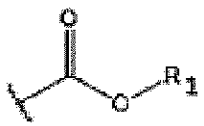
【化１８】



（式中、

Ａは、－Ｏ－Ｒ$_2$、

【化１９】

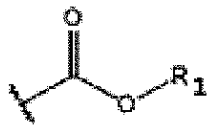


であり、

Ｒ$_1$は、フェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、

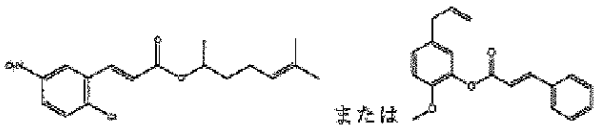
Ｒ$_2$は、フェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、Ａが

【化２０】



である場合、化合物が

【化２１】

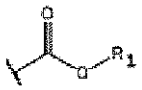


ではない）

の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法。

［３９］　担体または餌マトリックスと、有効量の式（ＩＶ）の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ａが、

【化２２】



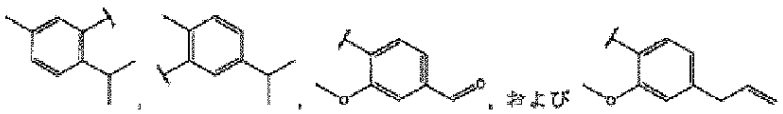
であり、

R_1が、置換もしくは非置換のC_7～C_{15}非分岐状もしくは分岐状のアルキル、置換もしくは非置換のC_7～C_{15}非分岐状もしくは分岐状のアルケニル、置換もしくは非置換のC_7～C_{15}非分岐状もしくは分岐状のアルキニル、置換もしくは非置換のC_7～C_{15}非分岐状もしくは分岐状のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアリール、および置換もしくは非置換のC_7～C_{15}非分岐状もしくは分岐状のシクロアルケニルからなる群から選択される、方法。

［４０］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［３８］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、R_1がモノテルペノイド部分である、方法。

［４１］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［４７］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、モノテルペノイド部分が、

【化２３】

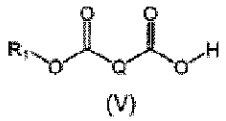


からなる群から選択される、方法。

［４２］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［３８］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｒ１が、メチル、エチル、イソプロピル、プロピル、イソブチル、ブチルおよびｔｅｒｔ－ブチルからなる群から選択される、方法。

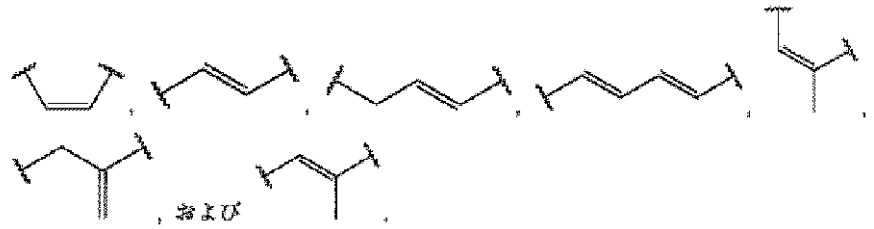
［４３］　担体または餌マトリックスと、有効量の式（Ｖ）：

【化２４】

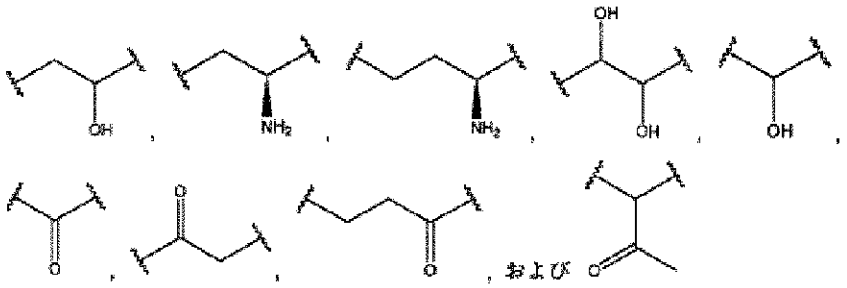


(V)

（式中、
R_1は、フェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、
Ｑは、分岐状もしくは非分岐状の飽和もしくは不飽和のC_0～C_4アルキル、分岐状もしくは非分岐状のＣ０～Ｃ４ケトンおよび分岐状もしくは非分岐状のC_0～C_4アミンからなる群から選択される）
の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法。
［４４］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［４３］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｑが－（CH_2）$_n$－であり、ｎが$_0$～$_4$である、方法。
［４４］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［４３］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｑが、
【化２５】



からなる群から選択される、方法。
［４５］　担体または餌マトリックスと、有効量の前記［４３］に記載の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法であって、Ｑが、
【化２６】

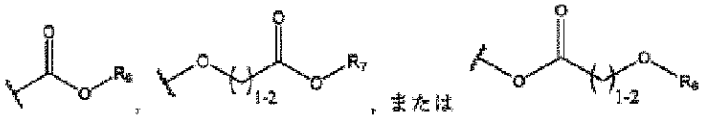


からなる群から選択される、方法。
［４６］　担体または餌マトリックスと、有効量の式（ＶＩ）：
【化２７】



(VI)

（式中、
Ａは、－Ｏ－R_7、
【化２８】



であり、
R_6は、置換もしくは非置換のフェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であり、
R_7は、置換もしくは非置換のフェニルプロパノイドまたはモノテルペノイド部分であるか、あるいはＨ、Ｍ、置換もしくは非置換のC_3～C_7非分岐状もしくは分岐状のアルキル、置換もしくは非置換のC_2～C_7非分岐状もしくは分岐状のアルケニル、置換もしくは非置換のC_3～C_7非分岐状もしくは分岐状のアルキニル、置換もしくは非置換のC_3～C_7非分岐状もしくは分岐状のシクロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロアリールおよび置換もしくは非置換のC_3～C_7非分岐状もしくは分岐状のシクロアルケニルからなる群から選択され、
Ｍは、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、鉄、亜鉛、銅およびアミンからなる群から選択される対イオンである）
の化合物との殺虫餌製剤に曝露した昆虫または節足動物の害虫を死滅させる方法。
［４６］　式Ｉ、ＩＩ、ＩＩＩ、ＩＶ、ＶおよびＶＩの構造を有する化合物を製造する方法。
［４７］　担体と、式Ｉ、ＩＩ、ＩＩＩ、ＩＶ、ＶまたはＶＩの構造を有する化合物とから構成され、これらの様々な餌化合物を摂食することができる昆虫に毒性成分を提示するように設計されたデバイスに適用される組成物。
［４９］　担体と、式Ｉ、ＩＩ、ＩＩＩ、ＩＶ、ＶまたはＶＩの構造を有する化合物とから構成される殺虫剤組成物。
［５１］　担体と、式Ｉ、ＩＩ、ＩＩＩ、ＩＶ、ＶまたはＶＩの構造を有する化合物との組成物を提供することを含む、昆虫を死滅させる方法。
［５２］　担体と、式Ｉ、ＩＩ、ＩＩＩ、ＩＶ、ＶまたはＶＩの構造を有する化合物とから構成される組成物であって、嗜好性が高い餌として作用し、それにより他の処理された食物源の存在下であっても昆虫による摂食を可能にする組成物。
［５３］　実質的に上記の明細書、特許請求の範囲および添付の図／図面において記載される例示的実施形態。
【図面】
【図１】

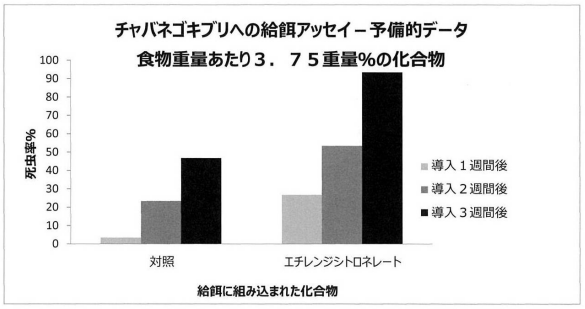


FIG. 1

【図２】

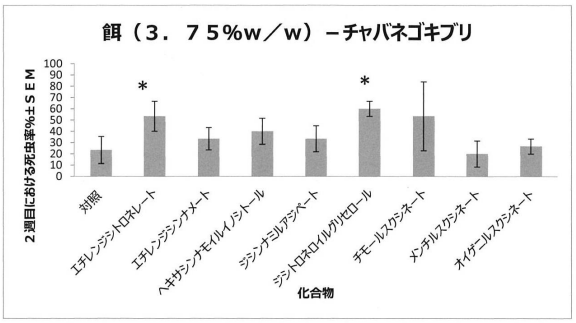


FIG. 2

【図３】

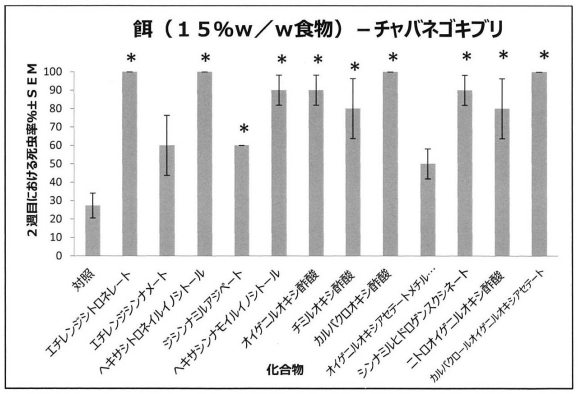


FIG. 3

【図４】

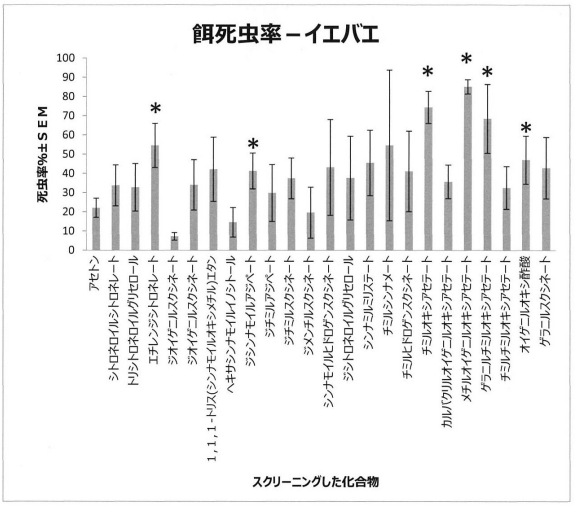


FIG. 4

【図５】

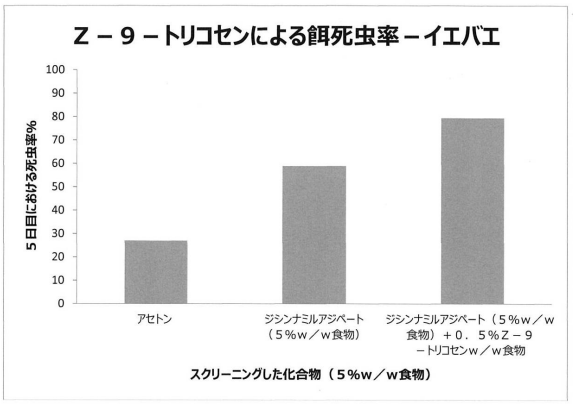


FIG 5.

【図６】

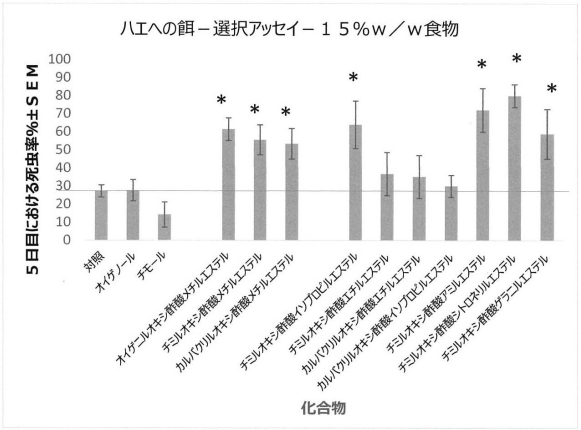


FIG. 6

【図７】

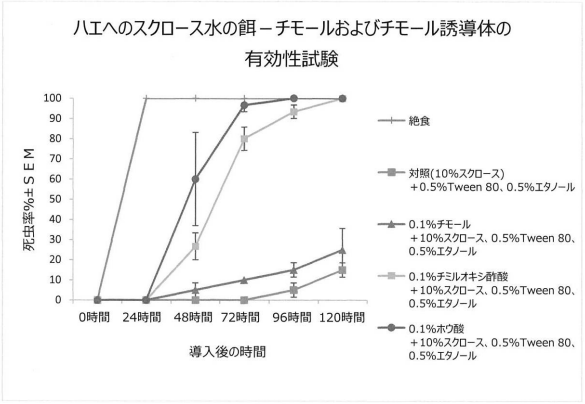


FIG. 7

【図８】

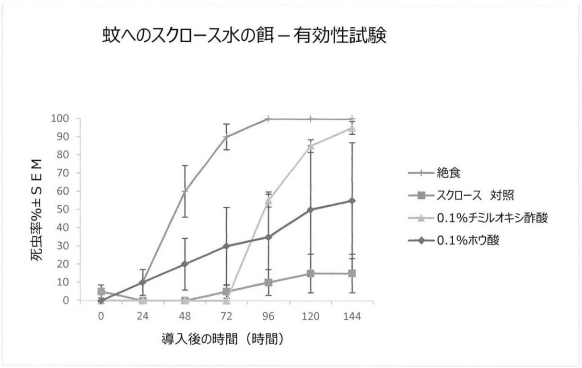


FIG. 8

【図９】

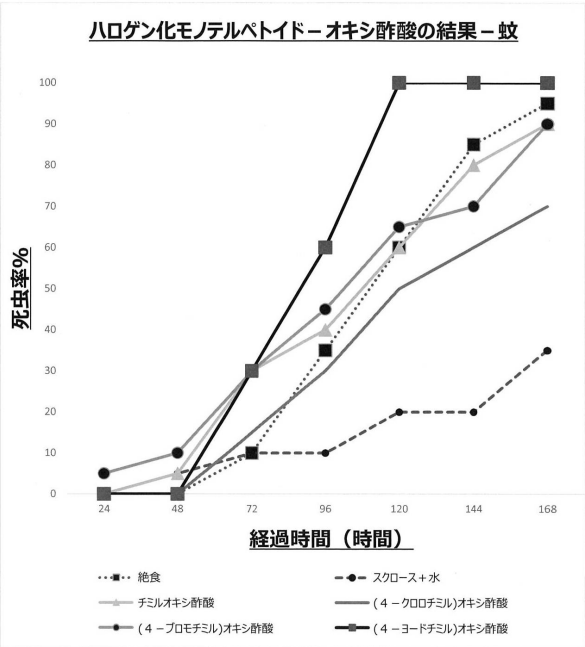


FIG. 9

フロントページの続き

ＩＯＮ ＩＮＣＯＲＰＯＲＡＴＥＤ
アメリカ合衆国アイオワ州５００１０，エイムズ，コラボレーション・プレイス １８０５，スウィート ２１００
(74)代理人 110001737
弁理士法人スズエ国際特許事務所
(74)代理人 100118902
弁理士 山本 修
(74)代理人 100106208
弁理士 宮前 徹
(74)代理人 100120112
中西 基晴
(74)代理人 100106080
弁理士 山口 晶子
(72)発明者 コーツ，ジョエル・アール
アメリカ合衆国アイオワ州５００１０，エイムズ，コラボレーション・プレイス １８０５，スウィート ２１００，ケア・オブ・アイオア・ステート・ユニバーシティー・リサーチ・ファンデーション・インコーポレーテッド
(72)発明者 クリマヴィックズ，ジェームズ・エス
アメリカ合衆国アイオワ州５００１０，エイムズ，コラボレーション・プレイス １８０５，スウィート ２１００，ケア・オブ・アイオア・ステート・ユニバーシティー・リサーチ・ファンデーション・インコーポレーテッド
(72)発明者 ノリス，エドモンド・ジェイ
アメリカ合衆国アイオワ州５００１０，エイムズ，コラボレーション・プレイス １８０５，スウィート ２１００，ケア・オブ・アイオア・ステート・ユニバーシティー・リサーチ・ファンデーション・インコーポレーテッド
(72)発明者 ベセット，スティーヴン・エム
アメリカ合衆国カリフォルニア州９１７６６，パモナ，ウェスト・ミッション・ブールバード １５８５，ケア・オブ・キットリッチ・コーポレーション
(72)発明者 リンジィ，エイ・デイヴィッド
アメリカ合衆国カリフォルニア州９１７６６，パモナ，ウェスト・ミッション・ブールバード １５８５，ケア・オブ・キットリッチ・コーポレーション
審査官 奥谷 暢子

(56)参考文献 KUMBHAR P.P et al.，Journal of Scientific & Industrial Research，2001年，vol.60，pp645-648
MORE H.D. et al，Russian Journal of General Chemistry，2004年，vol.74,No.2，pp217-218
LEE S. et al.，Doctoral Thesis, Iowa State University，1998年，51,64-65
NARKHEDE.P.H et al.，Synthetic Communications，2008年，38，2413-2418

(58)調査した分野 (Int.Cl.，ＤＢ名)
Ａ０１Ｎ
Ａ０１Ｐ