

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2016 年 9 月 1 日(01.09.2016)



(10) 国際公開番号

WO 2016/136736 A1

- (51) 国際特許分類:
A01N 31/04 (2006.01) A01N 37/08 (2006.01)
A01N 35/02 (2006.01) A01N 37/10 (2006.01)
A01N 37/02 (2006.01) A01N 43/78 (2006.01)
A01N 37/06 (2006.01) A01P 17/00 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2016/055257
- (22) 国際出願日: 2016 年 2 月 23 日(23.02.2016)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2015-036217 2015 年 2 月 26 日(26.02.2015) JP
特願 2015-055178 2015 年 3 月 18 日(18.03.2015) JP
- (71) 出願人: 花王株式会社(KAO CORPORATION)
[JP/JP]; 〒1038210 東京都中央区日本橋茅場町一丁目 1 4 番 1 0 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者: 仲川 喬雄(NAKAGAWA, Takao); 10330
バンコク パスワン ランビニ, ラジャムリ
ロード 1 6 1 ナンタワン ビルディング 1
2 階, カオウコンシューマ プロダクツ (サ
ウスイーストアジア) シーオー, エル
ティーディー. 内 Bangkok (TH).
- (74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所(THE
PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT

OFFICE); 〒1030013 東京都中央区日本橋人形町
1 丁目 3 番 8 号 沢の鶴人形町ビル Tokyo (JP).

- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

(54) Title: MOSQUITO REPELLENT

(54) 発明の名称: 蚊忌避剤

(57) Abstract: Provided is a mosquito repellent having excellent repellent activity and high safety. The mosquito repellent comprises, as an active ingredient, at least one selected from 2-isopropyl-4-methylthiazole, o-tert-butylcyclohexyl acetate, 2-methyl butyrate, benzyl propionate, isobutyric acid 2-phenylethyl, 3-phenylpropanal and 2-methyl-4-phenylbutane-2-ol.

(57) 要約: 優れた忌避活性を有し且つ安全性の高い、蚊忌避剤の提供。 2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸 2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び 2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる 1 種以上を有効成分とする蚊忌避剤。



WO 2016/136736 A1

明 細 書

発明の名称：蚊忌避剤

技術分野

[0001] 本発明は蚊に対して忌避活性を有する蚊忌避剤に関する。

背景技術

[0002] 蚊に吸血されるとかゆみを覚えたり、吸血部位に発疹や皮膚炎を引き起こす。特に、一部の蚊は、デング熱、ジカ熱、黄熱病、脳炎、マラリアなどの病原体を媒介することから、衛生学的に非常に有害な昆虫であるとされている。

[0003] 蚊のような吸血昆虫は、動物の体温を感知する温熱センサー、味を感知する味覚受容体、体臭などの揮発性物質を感知する嗅覚受容体、高揮発性物質である二酸化炭素を感知する二酸化炭素受容体等の優れた化学受容システムを保有し、多様な行動をとっている。例えば、メス蚊は、産卵前に血を求めて、動物が呼吸によって吐き出す二酸化炭素や体臭を辿って動物に近づき、温熱センサーによって体温を感知して目標の動物を探知し、吸血することが知られている。

[0004] 近年、斯かる昆虫が有する化学受容システムに変化を与えて昆虫の認知感覚を無力化することにより、当該昆虫を忌避する手段が考案され、N，N－ジエチルー3－メチルベンズアミド（DEET）や、p－メンタン－3，8－ジオール（PMD）といった嗅覚受容体に作用する物質が忌避剤として用いられている。

しかし、DEETには不愉快なおいがあり、また皮膚浸透力が高いことから幼児や敏感性皮膚の人に対しては使用が制限され、また持続時間も2～3時間であると言う問題がある。

[0005] また、レモンユーカリ油、レモングラス油、オレンジ油、カシア油等の天然精油に飛翔昆虫忌避効果があること（例えば特許文献1）等が報告されているが、それらの忌避効果は必ずしも十分であるとはいえず、その実用性に

問題がある。

[0006] [特許文献1] 特開2002-173407号公報

発明の概要

[0007] 本発明は、以下の1)～6)に係るものである。

1) 2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上を有効成分とする蚊忌避剤。

2) 2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上を哺乳動物の皮膚に塗布する蚊忌避方法。

3) 2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上を皮膚に直接又は間接的に接触するアパレル物品に付着又は保持させる蚊忌避方法。

4) 2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上を一定の空間に散布する蚊忌避方法。

5) 蚊忌避剤を製造するための、2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種

以上の使用。

6) 蚊を忌避するための、2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、*o*-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上の化合物の使用。

発明の詳細な説明

[0008] 本発明は、蚊に対して優れた忌避効果を有し且つ安全性の高い、蚊忌避剤を提供することに関する。

[0009] 本発明者は、蚊の二酸化炭素刺激に対する神経応答や熱受容応答を抑制する素材を探索した結果、特定の香料化合物に優れた二酸化炭素応答抑制作用及び／又は熱受容抑制作用があり、これらが蚊忌避剤として有用であることを見出した。

[0010] 本発明によれば、DEETやPMDといった汎用されている忌避剤とはメカニズムが異なる、安全性の高い蚊忌避剤を提供することができる。

[0011] 本発明の2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、*o*-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オール（以下「本発明の化合物」とも称する）は、何れも香料として知られている化合物であり、以下のとおり市販されている。

- ・ *o*-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート：花王社
- ・ 2-メチル酪酸：東京化成工業社
- ・ プロピオン酸ベンジル：東京化成工業社
- ・ イソ酪酸2-フェニルエチル：東京化成工業社
- ・ 3-フェニルプロパナール：東京化成工業社
- ・ 2-メチル-4-フェニルブタン-2-オール：東京化成工業社
- ・ 2-イソプロピル-4-メチルチアゾール：シグマアルドリッチ (SIGMA)

-ALDRICH) 社

本発明において、斯かる化合物は、単独で用いてもよく、2種以上を混合して用いてもよい。

[0012] この内、2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸及びプロピオン酸ベンジルは、二酸化炭素応答に対してより優れた抑制作用を示し、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールは、熱受容応答に対してより優れた抑制作用を示す。

[0013] 本発明において、対象となる蚊としては、二酸化炭素受容応答システムや熱受容システムを備えたものであれば特に限定されず、オス、メスの何れでもよい。例えば、アカイエカ、コガタアカイエカ、ネッタイシマカ、ヒトスジシマカ、シナハマダラカ等が挙げられ、このうち、ネッタイシマカ、ヒトスジシマカが好ましい。

[0014] 後記実施例に示すように、本発明の化合物は、少なくともヒトスジシマカの二酸化炭素応答を神経レベルで抑制するか、或いは熱受容システムを抑制し、蚊の人体への誘引行動を抑制する。したがって、本発明の化合物は、蚊忌避剤となり得、また、蚊忌避剤を製造するために使用することができる。すなわち、本発明の化合物は、蚊忌避のために使用することができる。

ここで、「蚊忌避」とは、蚊を対象物へ寄せ付けないこと、或いは蚊が対象物へ寄り付かないことを意味し、昆虫に対して殺虫力を有し、昆虫を駆除するものとは異なる。

また、「二酸化炭素応答抑制」とは、蚊が有する二酸化炭素受容応答を無力化又は低減化して、二酸化炭素に対する認知感覚を制御し、二酸化炭素源への誘引行動を抑制することを意味する。また、「熱受容応答抑制」或いは「熱受容抑制」とは、蚊が有する熱受容応答を無力化又は低減化して、熱源に対する認知感覚を抑制し、熱源への誘引行動を抑制することを意味する。

尚、昆虫の二酸化炭素応答は、公知の単一感覚毛記録法 (Nature 461, 277-281 (10 September 2009)) を用いて、電極を感覚毛に刺入後、二酸化炭素

刺激に対する神経発火パターンを確認することにより測定することができる。また、熱受容はプレートヒーターのような熱源を配置したケージの中に蚊を放ち、熱源へ誘引された蚊の数を計測することにより測定することができる。

[0015] 本発明の蚊忌避剤は、人を始めとする哺乳動物の皮膚に塗布する、当該皮膚に直接又は間接的に接触する服、付随品等のアパレル物品に付着又は保持させる、あるいは室内、車内等の一定の空間に散布（蒸散又は揮散させる場合を含む）する等の手段によって、蚊を忌避することが可能であり、使用態様に応じて、適宜溶剤や各種製剤添加物等の他の成分を配合し、組成物として製剤化することができる。また、本発明の蚊忌避剤は、皮膚外用剤、洗浄剤、皮膚化粧料、毛髪化粧料、繊維用柔軟剤、布帛処理剤等に蚊忌避活性を付与するための素材として使用するものであってもよい。

[0016] 上記組成物における本発明化合物の配合量は、製剤形態によっても異なるが、組成物全量に対して、好ましくは0.001質量%以上、より好ましくは0.01質量%以上、さらに好ましくは0.1質量%以上であり、且つ好ましくは80質量%以下、より好ましくは40質量%以下、さらに好ましくは10質量%以下であるか、又は好ましくは0.001～80質量%、より好ましくは0.01～40質量%、より好ましくは0.01～10質量%、さらに好ましくは0.1～10質量%である。

[0017] 溶剤や添加物の種類は、蚊忌避剤の使用形態や使用目的に応じて適宜選択できるが、溶剤としては、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール等の低級アルコールや水等が挙げられる。

また、添加物としては、種々の化成品、化粧品等に一般に用いられる添加物が挙げられ、具体的には、界面活性剤、有機溶媒、油性成分、保湿剤、粉体、可溶化剤、増粘剤、樹脂、洗浄剤、防腐剤、紫外線吸収剤、無機物、香料、色素、消臭剤、精油、薬剤、植物抽出物、その他の忌避剤等が挙げられる。

[0018] 本発明の蚊忌避剤の製剤形態は、使用態様に応じて適宜設定すればよく、

液体、クリーム、ローション、乳液、ゲル、軟膏剤、粉末、顆粒、噴霧若しくはエアゾールスプレー等のいずれであってもよい。

[0019] 本発明の蚊忌避剤を一定の空間に散布する場合には、好適には蚊忌避剤を担体に保持又は溶剤に溶解させて吸液芯を有する容器に充填し加熱又は送風蒸散させること、又は蚊忌避剤を担体に保持させ、空間に常温蒸散させる手段を採用できる。この場合、蚊忌避剤を担持させる担体材料としては、例えば、パルプ、綿、羊毛、麻、絹等の天然繊維；ポリプロピレン、ポリエチレン、ポリアミド、ポリエチレンテレフタレート、ポリブチレンテレフタレート、ポリサルフォン、レーヨン、メタアクリル酸樹脂、ガラス繊維等の合成繊維；ゼオライト、タルク、ホワイต์カーボン、珪藻土、石灰、シリカゲル、活性炭等の多孔質が挙げられる。

[0020] また、本発明の蚊忌避剤をアパレル物品に付着又は保持させる方法としては、蚊忌避剤を対象物品に塗布する他、蚊忌避剤を繊維用柔軟剤に配合し、柔軟剤処理時に付着又は保持させること、或いは各種布帛基材を蚊忌避剤で予め処理し、蚊忌避活性が付与された当該布帛基材を使用して対象物品を製造すること等が挙げられる。

[0021] 上述した実施形態に関し、本発明においては以下の態様が開示される。

＜1＞2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上を有効成分とする蚊忌避剤。

＜2＞蚊の二酸化炭素応答及び／又は熱受容応答を抑制することにより蚊を忌避する＜1＞の蚊忌避剤。

＜3＞2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上を哺乳動物の皮膚に塗

布する蚊忌避方法。

[0022] <4>蚊忌避剤を製造するための、2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上の使用。

<5>蚊を忌避するための、2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上の化合物の使用。

<6>組成物中における前記有効成分の含有量が、好ましくは0.001質量%以上、より好ましくは0.01質量%以上、さらに好ましくは0.1質量%以上であり、且つ好ましくは80質量%以下、より好ましくは40質量%以下、さらに好ましくは10質量%以下であるか、又は好ましくは0.001~80質量%、より好ましくは0.01~40質量%、より好ましくは0.01~10質量%、さらに好ましくは0.1~10質量%である、<1>又は<2>の蚊忌避剤。

<7>2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上を皮膚に直接又は間接的に接触するアパレル物品に付着又は保持させる、蚊忌避方法。

<8>2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上を室内、車内等の一定の空間に散布する、蚊忌避方法。

<9> 2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、2-メチル酪酸、及びプロピオン酸ベンジルから選ばれる1種以上を有効成分とする蚊の二酸化炭素応答抑制剤。

<10> イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパノール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上を有効成分とする蚊の熱受容抑制剤。

実施例

[0023] 実施例1 二酸化炭素応答抑制効果の評価

(1) ヒトスジシマカの準備

ヒトスジシマカは、住友テクノサービス株式会社より購入した卵を成長させたものを使用した。透明なプラスチックパンに水を1cm程度張り、卵が産み付けられているろ紙を入れた。毎日、幼虫用餌として、熱帯魚用エサ（テトラミン）を与えた。約1週間後、蛹をスポイトで回収し、20mL用プラスチックカップに移し、網を張ったケージに移した。成虫用の餌として、10質量%スクロースを25mLプラスチックチューブに入れたものを与えた。羽化後、5日間オスとメスを同じケージで飼育することで交尾を行わせた。飼育5日後、成虫を吸虫管を用いて集め、氷上で5分間麻酔後に、目視下でオスとメスを分け、メスのみを回収した。メス蚊は麻酔下で、羽・肢を取り除き、スライドガラス上に貼り付けた両面テープに背中部を押し付けることで固定し、電極がアクセスしやすい位置に触角・小顎髭を配置した。

[0024] (2) 神経応答記録用電極の準備

1mol/L水酸化カリウム水溶液を50mLシリンジに注入し、シリンジをクランプでマグネットスタンドに水平に固定した。電極ホルダーに固定したタングステンワイヤーを水平方向からシリンジの中へと挿入し、顕微鏡下で観察しながら電気分解により、研磨を行なった。交流電源からワニ口クリップで、電極ホルダー、シリンジへと電流を供給した。

[0025] (3) 神経応答記録

スライドガラス上に準備したヒトスジシマカを顕微鏡下に置き、×10対

物レンズで触角が視野の中心部に来るように位置を調節した。基準電極を昆虫の目に刺入した。匂い刺激用のピペットを小顎髭の近くに設置し、対物レンズを×100へと変換した。記録電極を感覚毛に近づけ、微動マニピレーターを用いて慎重に感覚毛に刺入した。ヒトスジシマカの二酸化炭素感受性の感覚毛は、ペグ状の形状を持つことが顕微鏡下で確認できる。電極を感覚毛に刺入後、自発的な神経発火パターンを確認した。神経発火は、挿入した電極を10x ACプローブ(SYNTECH)に接続し、IDAC-4アンプ(SYNTECH)につなぎ計測した。0.1%濃度に調整した二酸化炭素をシリコンチューブで匂い刺激装置につなぎ、小顎髭を1秒間刺激し、二酸化炭素応答を確認した。

[0026] (4) 二酸化炭素応答抑制効果の評価

試料は、表1に示す香料を、パラフィンオイルを用いて濃度1体積%に調整したものを使用した。試料をフィルターペーパー(3mm×50mm)上に15μL滴下し、パスツールピペット内に挿入した。ビニールチューブを用いて、パスツールピペットと刺激装置を接続し、空気中の二酸化炭素への応答をモニターしながら、1秒間の匂い刺激を行い、二酸化炭素への応答抑制効果の評価した。応答抑制効果は、溶媒であるパラフィンオイルで刺激後1秒間の神経の発火数、それぞれの試料で刺激後1秒間の神経の発火数を計測し、その比率による評価を行った(N=1)。

(数1)

抑制率(%)=100×([パラフィンオイル刺激後の発火数-試料刺激後の発火数]/[パラフィンオイル刺激後の発火数])

結果を表2に示す。本発明の化合物(2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、*o*-tert-ブチルシクロヘキシルアセテート、2-メチル酪酸及びプロピオン酸ベンジル)は、ヒトスジシマカの二酸化炭素応答を神経レベルで抑制した。

[0027]

[表1]

o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート	花王
2-メチル酪酸	東京化成工業社
プロピオン酸ベンジル	東京化成工業社
イソ酪酸2-フェニルエチル	東京化成工業社
3-フェニルプロパナール	東京化成工業社
2-メチル-4-フェニルブタン-2-オール	東京化成工業社
2-イソプロピル-4-メチルチアゾール	SIGMA-ALDRICH社

[0028] 実施例2 熱受容抑制効果の評価

(1) ヒトスジシマカの準備

ヒトスジシマカは、住友テクノサービス株式会社より購入した卵を成長させたものを使用した。透明なプラスチックパンに水を1cm程度張り、卵が産み付けられているろ紙を入れた。毎日、幼虫用餌として、熱帯魚用エサ（テトラミン）を与えた。約1週間後、蛹をスポイトで回収し、20mL用プラスチックカップに移し、網を張ったケージに移した。成虫用の餌として、10質量%スクロースを25mLプラスチックチューブに入れたものを与えた。羽化後、5日間オスとメスを同じケージで飼育することで交尾を行わせた。飼育5日後、成虫を吸虫管を用いて集め、氷上で5分間麻酔後に、目視下でオスとメスを分け、メスのみを回収した。

[0029] (2) 熱源への誘引行動抑制効果の評価

約150-200匹のメスヒトスジシマカをプラスチックケージ（30×30×30cm）に移した。メス蚊の行動をケージの上部からモニターするため、プラスチックケージの上面を透明なアクリル板に取り換えた。また、熱源となるプレートヒーター（小動物用マルチパネルヒーター16W ビバリア製）はケージの一隅に5×3cm露出するように、メッシュの外側から配置した。上面から熱源が撮影できるように上部にビデオカメラ（ソニー製）を配置し、実験を行った。熱源に両面テープを用いて、試料塗布用のシートを固定した。

表1に示す香料をエタノールを用いて濃度0.1体積%に調整したものを試料とし、当該試料あるいは溶媒エタノール50μL投与して実験を行った

。メス蚊の活性化のため、二酸化炭素 1 体積%を上部から 1 秒間投与し、その後、熱源をケージに接触させた。30 秒間接触後の熱源を写真に撮り、誘引された蚊の数を数えた。アッセイが一度終了するたびに熱源に使用したシートは廃棄し、新たなシートを使用した。また、蚊への試料の影響を考え、一つのケージで行う評価は最大で（7 試料 + 1 コントロール）とした。抑制効果は、同じアッセイ（7 試料 + 1 コントロール）内でエタノール溶媒のみを塗布した場合の降着数と比較して、下記式により抑制率を計算した。

（数 2）

$$\text{抑制率(\%)} = 100 \times (1 - [\text{試料塗布時の降着数}] / [\text{エタノール塗布時の降着数}])$$

[0030] 結果を表 2 に示す。本発明の化合物（イソ酪酸 2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び 2-メチル-4-フェニルブタン-2-オール）は、ヒトスジシマカの熱源への誘引行動を抑制し、熱受容応答を抑制すると考えられる。

[0031]

[表2]

試料	二酸化炭素応答抑制率 (%)	熱源への誘引抑制率 (%)
o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート	86.6%	—
2-メチル酪酸	75.0%	—
プロピオン酸ベンジル	96.6%	—
イソ酪酸2-フェニルエチル	—	81.1%
3-フェニルプロパナール	—	87.0%
2-メチル-4-フェニルブタン-2-オール	—	85.5%
2-イソプロピル-4-メチルチアゾール	71.0%	—

請求の範囲

- [請求項1] 2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上を有効成分とする蚊忌避剤。
- [請求項2] 蚊の二酸化炭素応答及び／又は熱受容応答を抑制することによって蚊を忌避する、請求項1記載の蚊忌避剤。
- [請求項3] 2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上を哺乳動物の皮膚に塗布する蚊忌避方法。
- [請求項4] 2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上を皮膚に直接又は間接的に接触するアパレル物品に付着又は保持させる蚊忌避方法。
- [請求項5] 2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールから選ばれる1種以上を一定の空間に散布する蚊忌避方法。
- [請求項6] 蚊忌避剤を製造するための、2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オ

ールから選ばれる1種以上の使用。

[請求項7]

蚊を忌避するための、2-イソプロピル-4-メチルチアゾール、
o-tert-ブチルシクロヘキシル アセテート、2-メチル酪酸
、プロピオン酸ベンジル、イソ酪酸2-フェニルエチル、3-フェニ
ルプロパナール及び2-メチル-4-フェニルブタン-2-オールか
ら選ばれる1種以上の化合物の使用。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2016/055257

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

A01N31/04(2006.01)i, A01N35/02(2006.01)i, A01N37/02(2006.01)i, A01N37/06(2006.01)i, A01N37/08(2006.01)i, A01N37/10(2006.01)i, A01N43/78(2006.01)i, A01P17/00(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A01N31/04, A01N35/02, A01N37/02, A01N37/06, A01N37/08, A01N37/10, A01N43/78, A01P17/00

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho	1922-1996	Jitsuyo Shinan Toroku Koho	1996-2016
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2016	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2016

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAplus/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 2013-040132 A (Dainihon Jochugiku Co., Ltd.), 28 February 2013 (28.02.2013), claims; paragraph [0005]; examples (Family: none)	1-7
X	JP 2013-230990 A (Dainihon Jochugiku Co., Ltd.), 14 November 2013 (14.11.2013), claims; paragraphs [0005], [0015] to [0017]; examples (Family: none)	1-7

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
10 May 2016 (10.05.16)

Date of mailing of the international search report
17 May 2016 (17.05.16)

Name and mailing address of the ISA/
Japan Patent Office
3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku,
Tokyo 100-8915, Japan

Authorized officer

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2016/055257

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 96/08147 A2 (QUEST INTERNATIONAL B.V.), 21 March 1996 (21.03.1996), claims; page 6, lines 24 to 26; page 7, lines 1 to 6; page 7, line 17 to page 9, line 5; examples; particularly, perfume IV & JP 10-505605 A & EP 781091 A2 & DE 69511708 C & AU 3567395 A & ZA 9507640 A	1-7
X	JP 2014-100693 A (Toray Industries, Inc.), 05 June 2014 (05.06.2014), claims; paragraph [0011]; examples (Family: none)	1-7
X	WO 2013/059364 A2 (THE REGENTS OF THE UNIVERSITY OF CALIFORNIA), 25 April 2013 (25.04.2013), claims; paragraph [0002]; example 1, tables 1, 2; example 3 & US 2015/0126437 A1 & EP 2775839 A2 & CN 103987258 A & MX 2014004702 A & HK 1201027 A	1-7

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. A01N31/04(2006.01)i, A01N35/02(2006.01)i, A01N37/02(2006.01)i, A01N37/06(2006.01)i,
A01N37/08(2006.01)i, A01N37/10(2006.01)i, A01N43/78(2006.01)i, A01P17/00(2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. A01N31/04, A01N35/02, A01N37/02, A01N37/06, A01N37/08, A01N37/10, A01N43/78, A01P17/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1922-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2016年
日本国実用新案登録公報	1996-2016年
日本国登録実用新案公報	1994-2016年

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CPlus/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
X	JP 2013-040132 A (大日本除蟲菊株式会社) 2013.02.28, 特許請求の範囲、[0005]、実施例 (ファミリーなし)	1-7
X	JP 2013-230990 A (大日本除蟲菊株式会社) 2013.11.14, 特許請求の範囲、[0005]、[0015]-[0017]、実施例 (ファミリーなし)	1-7

☑ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

10.05.2016

国際調査報告の発送日

17.05.2016

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)
郵便番号 100-8915
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

井上 千弥子

電話番号 03-3581-1101 内線 3443

4H

5809

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
X	WO 96/08147 A2 (QUEST INTERNATIONAL B.V.) 1996.03.21, 特許請求の範囲、第6頁第24-26行、第7頁第1-6行、同頁第17行-第9頁第5行、実施例、特に香料 IV & JP 10-505605 A & EP 781091 A2 & DE 69511708 C & AU 3567395 A & ZA 9507640 A	1-7
X	JP 2014-100693 A (東レ株式会社) 2014.06.05, 特許請求の範囲、[0011]、実施例 (ファミリーなし)	1-7
X	WO 2013/059364 A2 (THE REGENTS OF THE UNIVERSITY OF CALIFORNIA) 2013.04.25, 特許請求の範囲、[0002]、実施例1の表1、2、実施例3 & US 2015/0126437 A1 & EP 2775839 A2 & CN 103987258 A & MX 2014004702 A & HK 1201027 A	1-7